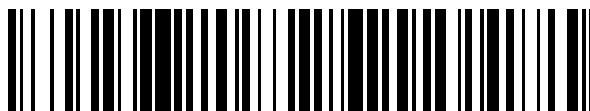


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 535 276**

51 Int. Cl.:

C07D 401/14 (2006.01)

C07D 405/14 (2006.01)

A01N 43/713 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **09.12.2009** **E 12159076 (4)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **21.01.2015** **EP 2484676**

54 Título: **Amidas del ácido antranílico sustituidas con tetrazol como plaguicidas**

30 Prioridad:

18.12.2008 EP 08172205

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:
07.05.2015

73 Titular/es:

BAYER CROPSCIENCE AG (100.0%)
Gebäude 6100 Alfred-Nobel-Strasse 50
40789 Monheim, DE

72 Inventor/es:

FISCHER, RÜDIGER;
FUNKE, CHRISTIAN;
GEISING, ERNST RUDOLF;
GRONDAL, CHRISTOPH;
HENSE, ACHIM;
BECKER, ANGELA;
FRANKEN, EVA-MARIA;
MALSAM, OLGA;
VOERSTE, ARNDT;
GÖRGENS, ULRICH y
WROBLOWSKY, HEINZ-JÜRGEN

74 Agente/Representante:

CARPINTERO LÓPEZ, Mario

ES 2 535 276 T3

Aviso: En el plazo de nueve meses a contar desde la fecha de publicación en el Boletín europeo de patentes, de la mención de concesión de la patente europea, cualquier persona podrá oponerse ante la Oficina Europea de Patentes a la patente concedida. La oposición deberá formularse por escrito y estar motivada; sólo se considerará como formulada una vez que se haya realizado el pago de la tasa de oposición (art. 99.1 del Convenio sobre concesión de Patentes Europeas).

DESCRIPCIÓN

Amidas del ácido antranílico sustituidas con tetrazol como plaguicidas

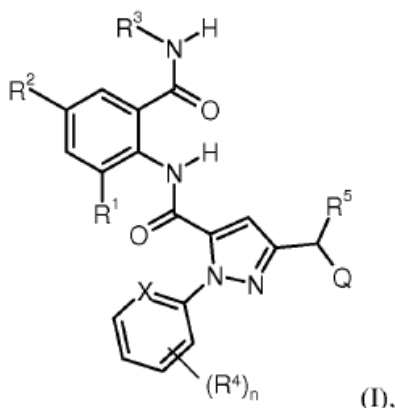
La presente invención se refiere a amidas del ácido antranílico sustituidas con tetrazol, a varios procedimientos para su preparación y a su uso como principios activos también en combinación con otros agentes para aumentar la actividad, particularmente a su uso como agentes para combatir plagas.

Se ha descrito ya en la bibliografía que determinadas amidas del ácido antranílico (por ejemplo, en los documentos WO 01/70671, WO 03/015519, WO 03/016284, WO 03/015518, WO 03/024222, WO 03/016282, WO 03/016283, WO 03/062226, WO 03/027099, WO 04/027042, WO 04/033468, WO 2004/046129, WO 2004/067528, WO 2005/118552, WO 2005/077934, WO 2005/085234, WO 2006/023783, WO 2006/000336, WO 2006/040113, WO 2006/111341, WO 2007/006670, WO 2007/024833, WO2007/020877 y WO 07/144100) poseen propiedades insecticidas.

Se ha descrito igualmente ya en la bibliografía que el efecto de distintos principios activos puede aumentarse mediante la adición de otros agentes, entre otros, sales de amonio. Sin embargo, se trata a este respecto de sales de acción detergente (por ejemplo, documento WO 95/017817) o sales con sustituyentes alquilo y/o arilo largos, que actúan permeabilizando o elevando la solubilidad del principio activo (por ejemplo, documentos EP-A 0 453 086, EP-A 0 664 081, FR-A 2 600 494, US 4 844 734, US 5 462 912, US 5 538 937, US-A 03/0224939, US-A 05/0009880, US-A 05/0096386). Además, el estado de la técnica describe el efecto solo de determinados principios activos y/o determinadas aplicaciones de los correspondientes agentes. En otros casos, se trata de sales de ácidos sulfónicos, en las que los ácidos actúan por sí mismos como paralizadores de insectos (documento US 2 842 476). Se describe un aumento del efecto, por ejemplo mediante sulfato de amonio, para los herbicidas glifosato y fosfinotricina (documentos US 6 645 914 y EP-A2 0 036 106). El uso de sulfato de amonio como coadyuvante de formulación se describe igualmente para determinados principios activos y aplicaciones (documento WO 92/16108), pero sirve allí para la estabilización de la formulación, no para el aumento del efecto. Además, se describen combinaciones de sales de amonio con principios activos insecticidas en los documentos WO 07/068356, WO 07/068428, WO 07/068355, WO 07/068357 y WO 07/068350. Se hace referencia expresa en la presente a estas publicaciones.

Se ha encontrado ahora que las nuevas amidas del ácido antranílico que contienen tetrazol presentan ventajas frente al estado de la técnica, por ejemplo, por mejores propiedades biológicas o ecológicas. Como otras ventajas, se citan por ejemplo procedimientos de aplicación más amplios, un mejor efecto insecticida y acaricida, así como una buena tolerancia frente a plantas útiles. Las amidas del ácido antranílico que contienen tetrazol pueden usarse en combinación con otros agentes para la mejora de la actividad, particularmente frente a insectos difíciles de combatir.

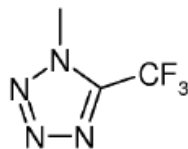
Son objeto de la presente invención amidas del ácido antranílico sustituidas con tetrazol de fórmula general (I)



en la que

- R^1 representa metilo o cloro,
 R^2 representa halógeno, ciano, metilo o alquil C₁-C₄-sulfonilo,
 R^3 representa hidrógeno o alquilo C₁-C₆, alcoxilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₁₂, cicloalquil C₃-C₁₂-alquilo C₁-C₆ respectivamente sustituidos dado el caso una o varias veces de forma igual o distinta, pudiendo seleccionarse los sustituyentes independientemente entre sí de halógeno, amino, ciano, nitro, hidroxilo, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxilo C₁-C₄, haloalcoxilo C₁-C₄, alquil C₁-C₄-tio, alcoxi C₂-C₆-carbonilo, alquil C₂-C₆-carbonilo, cicloalquil C₃-C₆-amino o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros,
 n representa 1, 2, 3 o 4,
 X representa N, CH, CF, CCl, CBr,
 R^4 representa independientemente entre sí hidrógeno, ciano, haloalquilo C₁-C₆, halógeno o haloalcoxilo C₁-C₄,
 R^5 representa H o alquilo C₁-C₆,

Q representa el resto de tetrazol Q-6 monosustituido,



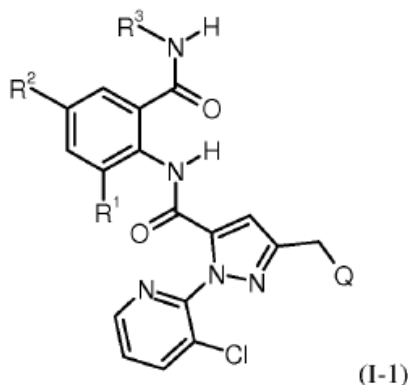
Q-6

así como sales de los compuestos de fórmula (I).

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

Las amidas del ácido antranílico sustituidas con tetrazol según la invención se definen por la fórmula general (I). Las definiciones de restos preferidas de las fórmulas citadas anterior y posteriormente se dan a continuación. Estas definiciones son válidas para los productos finales de fórmula (I) así como igualmente para todos los productos intermedios.

Se prefieren según la invención compuestos de fórmula (I-1)



(I-1)

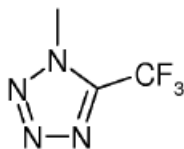
en la que

R¹ representa metilo o cloro,

R² representa halógeno, ciano o metilo,

R³ representa hidrógeno o alquilo C₁-C₆, alcoxilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₁₂, cicloalquil C₃-C₁₂-alquilo C₁-C₆ respectivamente sustituidos dado el caso una o varias veces de forma igual o distinta, pudiendo seleccionarse los sustituyentes independientemente entre sí de halógeno, amino, ciano, nitro, hidroxilo, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxilo C₁-C₄, haloalcoxilo C₁-C₄, alquil C₁-C₄-tio, alcoxi C₂-C₆-carbonilo, alquil C₂-C₆-carbonilo, cicloalquil C₃-C₆-amino o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros,

Q representa el resto de tetrazol Q-6 monosustituido,

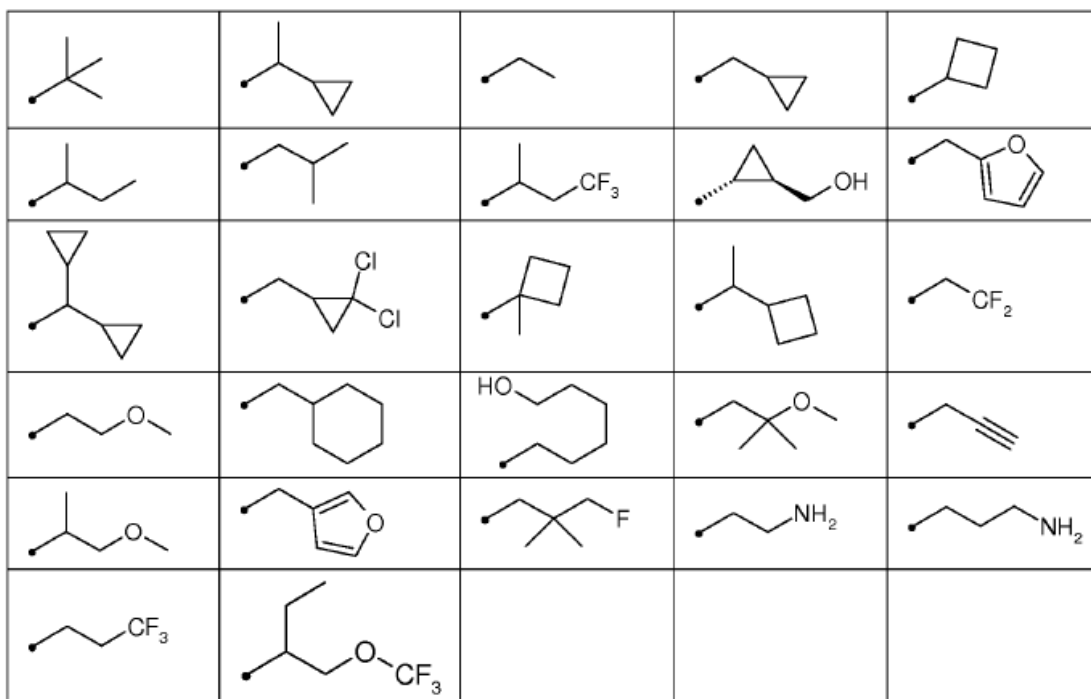
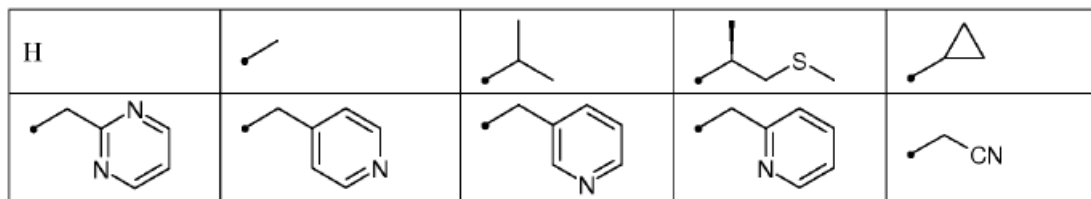


Q-6

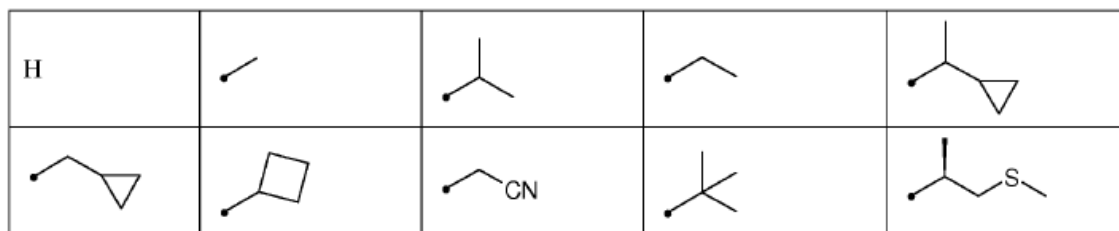
así como sales de los compuestos de fórmula (I-1).

Son preferidos, especialmente preferidos y muy especialmente preferidos los compuestos de fórmula general (I-1) en la que

- R^1 representa preferiblemente y con especial preferencia metilo,
 R^2 representa preferiblemente halógeno, ciano o metilo,
 R^2 representa con especial preferencia cloro y ciano,
 R^2 representa igualmente con especial preferencia bromo, flúor, yodo o metilo,
 5 R^3 representa preferiblemente hidrógeno o alquilo C_1-C_6 , alcoxilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquil C_3-C_6 -alquilo C_1-C_6 respectivamente sustituidos dado el caso una o varias veces de forma igual o distinta, pudiendo seleccionarse los sustituyentes independientemente entre sí de halógeno, ciano, amino, hidroxilo, alquilo C_1-C_6 , alcoxilo C_1-C_4 , haloalcoxilo C_1-C_4 , alquil C_1-C_4 -tio, cicloalquilo C_3-C_6 o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros que contiene 1-2 heteroátomos del grupo de N, O, S, no siendo adyacentes en el anillo dos átomos de oxígeno,
 10 R^3 representa con especial preferencia uno de los siguientes restos,



- R^3 representa con muy especial preferencia uno de los siguientes restos



- Q representa preferiblemente Q-6,
 Q representa con especial preferencia Q-6,

Se prefieren igualmente según la invención compuestos de fórmula (I), en la que los restos R^1 , R^1 , R^3 y Q presentan los significados dados anteriormente como preferidos, especialmente preferidos y muy especialmente preferidos, y en la que

R^4 representa preferiblemente haloalquilo C_1-C_6 o halógeno, con especial preferencia cloro o bromo, con muy

especial preferencia cloro.

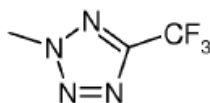
R⁵ representa preferiblemente hidrógeno, metilo, etilo, propilo o iso-propilo, con especial preferencia hidrógeno o metilo,

X representa preferiblemente N, CCl o CH, con especial preferencia N o CH,

- 5 n representa preferiblemente 1, 2 o 3, con especial preferencia 1 o 2, con muy especial preferencia 1.

Los compuestos de fórmulas (I) y (I-1) pueden presentarse en forma de distintos isómeros. Son por tanto objeto de la presente invención también los isómeros de los compuestos de fórmulas (I) y (I-1), así como mezclas de distintas formas isoméricas.

- 10 Los compuestos de fórmulas (I) y (I-1) pueden presentarse particularmente en forma de distintos regioisómeros. Por ejemplo, en forma de mezclas de compuestos con la definición Q2 o Q6.



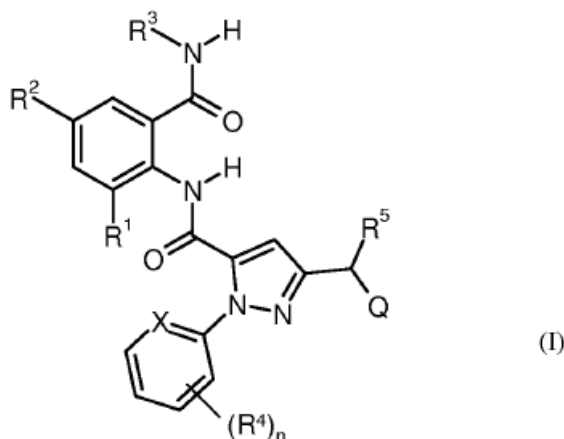
Q-2

- 15 Por tanto, mezclas de compuestos de fórmulas (I) y (I-1) en las que Q tiene los significados Q2 y Q6, pueden presentarse en distintas relaciones de mezcla. Se prefieren a este respecto relaciones de mezcla de compuestos de fórmulas (I) o (I-1) en las que el resto Q representa Q2 a compuestos de fórmula (I) o (I-1) en las que el resto Q representa Q6 de 60:40 a 99:1, con especial preferencia de 70:30 a 97:3, con muy especial preferencia de 80:20 a 95:5. Se prefieren particularmente las siguientes relaciones de mezcla de un compuesto de fórmulas (I) o (I-1) en las que Q tiene el significado Q2 a compuesto de fórmulas (I) o (I-1), en las que Q tiene el significado Q6: 80:20; 81:19; 82:18; 83:17; 84:16; 85:15; 86:14; 87:13; 88:12; 89:11; 90:10; 91:9; 92:8; 93:7; 96:6; 95:5.

Preparación de los compuestos según la invención de fórmula general (I)

- 20 Se obtienen antranilamidas de fórmula (I) según uno de los siguientes procedimientos.

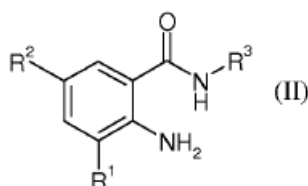
Se obtienen antranilamidas de fórmula (I)



(I)

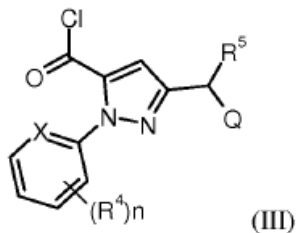
en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, n, X y Q tienen los significados anteriormente dados, haciendo reaccionar

- (A) anilinas de fórmula (II)



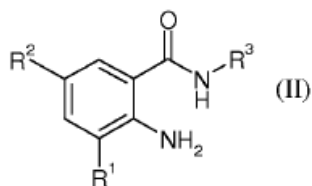
(II)

en la que R^1 , R^2 y R^3 tienen los significados anteriormente dados, con cloruros de ácido carboxílico de fórmula (III)

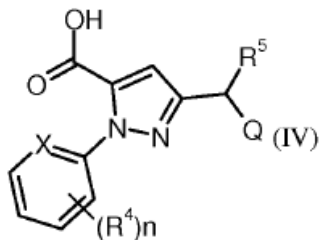


5 en la que X, Q, R^4 , R^5 y n tienen el significado anteriormente dado, en presencia de un aglutinante de ácido; haciendo reaccionar

(B) anilinas de fórmula (II)

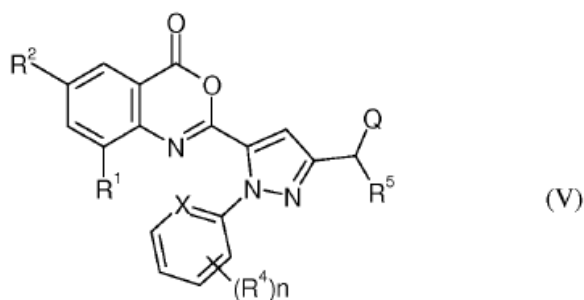


en la que R^1 , R^2 y R^3 tienen los significados anteriormente dados, con un ácido carboxílico de fórmula (IV)



10

en la que Q, R^4 , R^5 , n y X tienen el significado anteriormente dado, en presencia de un agente de condensación; o haciendo reaccionar (C) benzoxazinonas de fórmula (V)



15

en la que R^1 , R^2 , R^4 , R^5 , n, X y Q tienen los significados anteriormente dados, con una amina de fórmula (X)

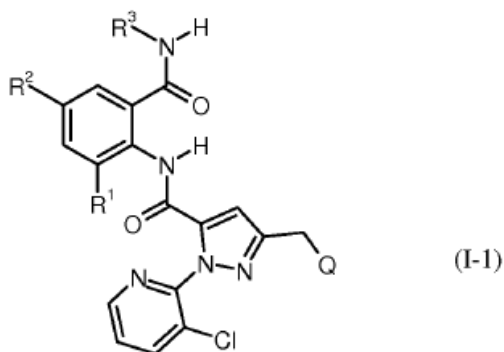


en la que R^3 tiene el significado anteriormente dado,

en presencia de un diluyente.

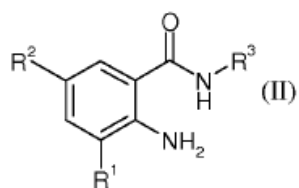
20 Se ha encontrado además que se obtienen antranilamidas de fórmula (I-1) según uno de los siguientes procedimientos.

Se obtienen antranilamidas de fórmula (I-1)

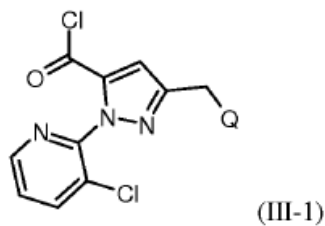


en la que R¹, R², R³ y Q tienen los significados anteriormente dados, haciendo reaccionar

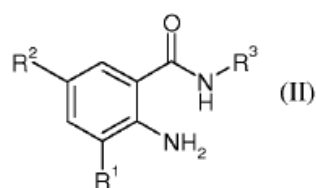
(A) anilinas de fórmula (II)



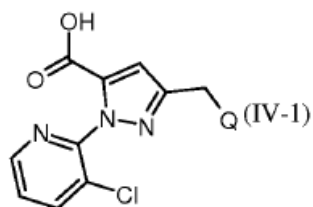
- 5 en la que R¹, R² y R³ tienen los significados anteriormente dados, con cloruros de ácido carboxílico de fórmula (III-1)



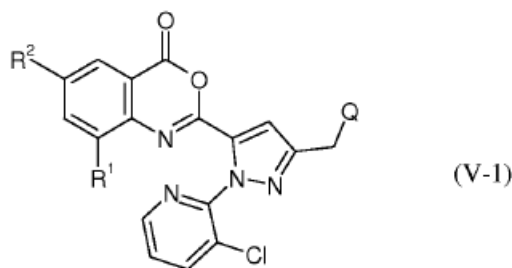
en la que Q tiene el significado anteriormente dado, en presencia de un aglutinante de ácido;
(B) anilinas de fórmula (II)



- 10 en la que R¹, R² y R³ tienen los significados anteriormente dados, con un ácido carboxílico de fórmula (IV-1)



- 15 en la que Q tiene el significado anteriormente dado, en presencia de un agente de condensación; o haciendo reaccionar
(C) benzoxazinonas de fórmula (V-1)



en la que R^1 , R^2 y Q tienen los significados anteriormente dados, con una amina de fórmula (X)



- 5 en la que R^3 tiene el significado anteriormente dado, en presencia de un diluyente.

Los principios activos según la invención son adecuados por su buena fitotolerancia, su favorable toxicidad para mamíferos y buena tolerancia medioambiental para la protección de plantas y órganos de plantas, para aumentar los rendimientos de cosecha, mejorar la calidad del producto de cosecha y para combatir plagas animales, particularmente insectos, arácnidos, helmintos, nematodos y moluscos que se presentan en agricultura, horticultura, cría de animales, silvicultura, jardines e instalaciones de ocio, en la protección de productos almacenados y materiales, así como en el sector de la higiene. Pueden usarse preferiblemente como agentes fitoprotectores. Son activos contra especies normales sensibles y resistentes, así como contra todos o algunos estados de desarrollo. Pertenecen a las plagas anteriormente mencionadas:

- 15 Del orden de los Anoplura (*Phthiraptera*), por ejemplo, *Damalinea spp.*, *Haematopinus spp.*, *Linognathus spp.*, *Pediculus spp.*, *Trichodectes spp.*.

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

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

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

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

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

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

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

- 40 Del orden de los Diptera, por ejemplo, *Aedes spp.*, *Anopheles spp.*, *Bibio hortulanus*, *Calliphora erythrocephala*, *Ceratitis capitata*, *Chrysomya spp.*, *Cochliomyia spp.*, *Cordylobia anthropophaga*, *Culex spp.*, *Cuterebra spp.*, *Dacus oleae*, *Dermatobia hominis*, *Drosophila spp.*, *Fannia spp.*, *Gastrophilus spp.*, *Hylemyia spp.*, *Hyppobosca spp.*,

Hypoderma spp., *Liriomyza* spp., *Lucilia* spp., *Musca* spp., *Nezara* spp., *Oestrus* spp., *Oscinella* frit, *Pegomyia hyoscyami*, *Phorbia* spp., *Stomoxys* spp., *Tabanus* spp., *Tannia* spp., *Tipula paludosa*, *Wohlfahrtia* spp.

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

- 5 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*, *Hyostromgulus* spp., *Loa Loa*, *Nematodirus* spp.,
10 *Oesophagostomum* spp., *Opisthorchis* spp., *Onchocerca volvulus*, *Ostertagia* spp., *Paragonimus* spp., *Schistosomen* spp., *Strongyloides fuelleborni*, *Strongyloides stercoralis*, *Strongyloides* spp., *Taenia saginata*, *Taenia solium*, *Trichinella spiralis*, *Trichinella nativa*, *Trichinella britovi*, *Trichinella nelsoni*, *Trichinella pseudospiralis*, *Trichostrongylus* spp., *Trichuris trichuria*, *Wuchereria bancrofti*.

Además, pueden combatirse protozoos como *Eimeria*.

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

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

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

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

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

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

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

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

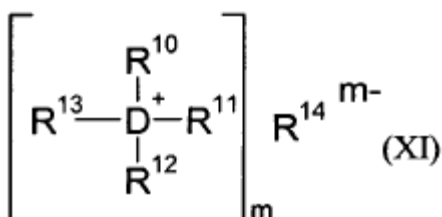
Del orden de los *Symphyla*, por ejemplo, *Scutigera immaculata*.

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

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

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

10 La actividad de los compuestos de fórmula (I) puede aumentarse mediante la adición de sales de amonio y fosfonio. Las sales de amonio y fosfonio se definen por la fórmula (XI)



en la que

- | | | |
|----|---|--|
| | D | representa nitrógeno o fósforo, |
| 15 | D | representa preferiblemente nitrógeno, |
| | R ¹⁰ , R ¹¹ , R ¹² y R ¹³ | representan independientemente entre sí hidrógeno o respectivamente alquilo C ₁ -C ₈ dado el caso sustituido o respectivamente alquilenos C ₁ -C ₈ insaturado dado el caso sustituido una o varias veces, pudiendo estar seleccionados los sustituyentes de halógeno, nitro y ciano, |
| 20 | R ¹⁰ , R ¹¹ , R ¹² y R ¹³ | representan preferiblemente independientemente entre sí hidrógeno o respectivamente alquilo C ₁ -C ₄ dado el caso sustituido, pudiendo estar seleccionados los sustituyentes de halógeno, nitro y ciano, |
| | R ¹⁰ , R ¹¹ , R ¹² y R ¹³ | representan con especial preferencia independientemente entre sí hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, n-butilo, i-butilo, s-butilo o t-butilo, |
| | R ¹⁰ , R ¹¹ , R ¹² y R ¹³ | representan con muy especial preferencia hidrógeno, |
| 25 | m | representa 1, 2, 3 o 4, |
| | m | representa preferiblemente 1 o 2, |
| | R ¹⁴ | representa un anión inorgánico u orgánico, |
| 30 | R ¹⁴ | representa preferiblemente hidrogenocarbonato, tetraborato, fluoruro, bromuro, yoduro, cloruro, monohidrogenofosfato, dihidrogenofosfato, hidrogenosulfato, tartrato, sulfato, nitrato, tiosulfato, tiocianato, formiato, lactato, acetato, propionato, butirato, pentanoato, citrato u oxalato, |
| | R ¹⁴ | representa con especial preferencia lactato, sulfato, monohidrogenofosfato, dihidrogenofosfato, nitrato, tiosulfato, tiocianato, citrato, oxalato o formiato, |
| | R ¹⁴ | representa con muy especial preferencia sulfato. |

35 Las sales de amonio y fosfonio de fórmula (XI) pueden usarse en un amplio intervalo de concentración para aumentar el efecto de los agentes fitoprotectores que contienen compuestos de fórmula (I). En general, se usan las sales de amonio o fosfonio en agentes fitoprotectores listos para aplicación a una concentración de 0,5 a 80 mmol/l, preferiblemente de 0,75 a 37,5 mmol/l, con especial preferencia de 1,5 a 25 mmol/l. En el caso de un producto formulado, se elige la concentración de sal de amonio y/o fosfonio en la formulación de modo que, después de diluir la formulación a la concentración de principio activo deseada, se encuentre en estos intervalos generales, preferidos o especialmente preferidos dados. La concentración de sal en la formulación asciende a este respecto

40 habitualmente a 1-50 % en peso.

En una realización preferida de la invención, se añade a los agentes fitoprotectores no solo una sal de amonio y/o fosfonio para aumentar el efecto, sino un potenciador de la penetración. Incluso en estos casos, se observa un aumento del efecto. Es igualmente objetivo de la presente invención el uso de un potenciador de la penetración, así como el uso de una combinación de potenciador de la penetración y sales de amonio y/o fosfonio para aumentar el efecto de los agentes fitoprotectores que contienen compuestos de acción acaricida/insecticida de fórmula (I) como principio activo. Es objetivo de la invención finalmente además el uso de este agente para combatir insectos dañinos.

Se tienen en consideración como potenciadores de la penetración en el presente contexto todas aquellas sustancias que se usan habitualmente para mejorar la introducción de principios activos agroquímicos en plantas. Los potenciadores de la penetración se definen en este contexto porque se introducen en la cutícula de plantas con líquidos de pulverización acuosos y/o depósitos de pulverización y así pueden elevar la movilidad de los principios activos en las cutículas. El procedimiento descrito en la bibliografía (Baur *et al.*, 1997, Pesticide Science 51, 131-152) puede usarse para la determinación de estas propiedades.

Se tienen en consideración como potenciadores de la penetración, por ejemplo, alcoxilatos de alcohol. Son potenciadores de la penetración según la invención alcoxilatos de alcohol de fórmula



en la que

R representa un alquilo de cadena lineal o ramificada de 4 a 20 átomos de carbono,

R' representa hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, n-butilo, i-butilo, t-butilo, n-pentilo o n-hexilo,

AO representa un resto de óxido de etileno, un resto de óxido de propileno, un resto de óxido de butileno o mezclas de restos de óxido de etileno y óxido de propileno u óxido de butileno y,

v representa los números de 2 a 30.

Son un grupo preferido de potenciadores de la penetración alcoxilatos de alcohol de fórmula



en la que

R tiene el significado anteriormente dado,

R' tiene el significado anteriormente dado,

EO representa $-CH_2-CH_2-O-$ y

n representa los números de 2 a 20.

Son un grupo preferido adicional de potenciadores de la penetración alcoxilatos de alcohol de fórmula

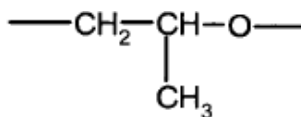


en la que

R tiene el significado anteriormente dado,

R' tiene el significado anteriormente dado,

EO representa $-CH_2-CH_2-O-$,

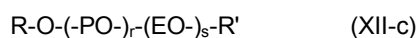


PO representa

p representa los números de 1 a 10 y

q representa los números de 1 a 10.

Son un grupo preferido adicional de potenciadores de la penetración alcoxilatos de alcohol de fórmula

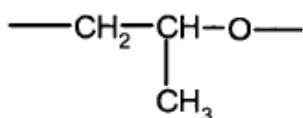


en la que

R tiene el significado anteriormente dado,

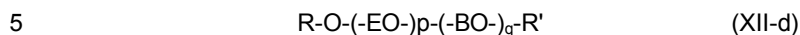
R' tiene el significado anteriormente dado,

EO representa $-CH_2-CH_2-O-$,



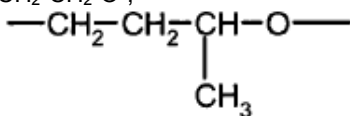
PO representa ,
r representa los números de 1 a 10 y
s representa los números de 1 a 10.

Son un grupo preferido adicional de potenciadores de la penetración alcoxilatos de alcohol de fórmula



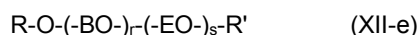
en la que

R y R' tienen los significados anteriormente dados,
EO representa $\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-O-}$,



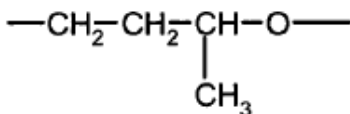
10 BO representa ,
p representa los números de 1 a 10 y
q representa los números de 1 a 10.

Son un grupo preferido adicional de potenciadores de la penetración alcoxilatos de alcohol de fórmula



en la que

15 R y R' tienen los significados anteriormente dados,



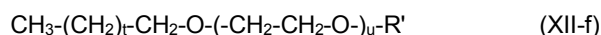
BO representa ,

EO representa $\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-O-}$,

r representa los números de 1 a 10 y

s representa los números de 1 a 10.

20 Son un grupo preferido adicional de potenciadores de la penetración alcoxilatos de alcohol de fórmula



en la que

R' tiene el significado anteriormente dado,

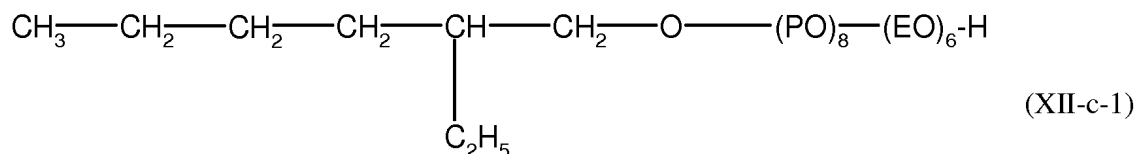
t representa los números de 8 a 13,

25 u representa los números de 6 a 17.

En las fórmulas anteriormente dadas,

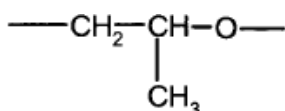
R representa preferiblemente butilo, i-butilo, n-pentilo, i-pentilo, neopentilo, n-hexilo, i-hexilo, n-octilo, i-octilo, 2-etil-hexilo, nonilo, i-nonilo, decilo, n-dodecilo, i-dodecilo, laurilo, miristilo, i-tridecilo, trimetilnonilo, palmitilo, estearilo o eicosilo.

30 Se cita como ejemplo de alcoxilato de alcohol de fórmula (XII-c) el alcoxilato de 2-etilhexilo de fórmula



en la que

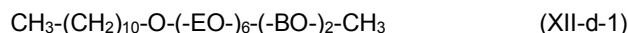
EO representa $\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-O-}$,



PO representa y

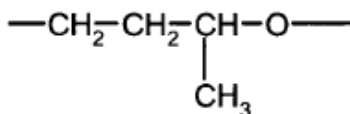
los números 8 y 6 representan valores medios.

Se cita como ejemplo de alcoxilato de alanol de fórmula (XII-d) el de fórmula



5 en la que

EO representa $\text{CH}_2\text{---CH}_2\text{---O---}$,



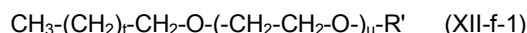
BO representa y

los números 10, 6 y 2 representan valores medios.

Son alcoxilatos de alanol especialmente preferidos de fórmula (XII-f) los compuestos de esta fórmula en los que

10 t representa los números de 9 a 12 y
u los números de 7 a 9.

Se cita como muy especialmente preferido el alcoxilato de alanol de fórmula (XII-f-1)



en la que

15 t representa el valor medio 10,5 y

u representa el valor medio 8,4.

Los alcoxilatos de alanol se definen por las fórmulas generales anteriores. En estas sustancias, se trata de mezclas de sustancias del tipo dado con distintas longitudes de cadena. Para los índices, se calculan por tanto los valores medios, que pueden desviarse también de números enteros.

20 Los alcoxilatos de alanol de las fórmulas dadas son conocidos y obtenibles comercialmente de forma parcial o pueden prepararse según procedimientos conocidos (véanse los documentos WO 98/35553, WO 00/35278 y EP-A 0.681.865).

25 Se tienen en consideración como potenciadores de la penetración, por ejemplo, también sustancias que potencian la solubilidad de los compuestos de fórmula (I) en el depósito de pulverización. Pertenecen a ellos, por ejemplo, aceites minerales o vegetales. Se tienen en cuenta como aceites todos los aceites minerales o vegetales, dado el caso modificados, que pueden usarse habitualmente en agentes agroquímicos. Se citan como ejemplos aceite de girasol, aceite de colza, aceite de oliva, aceite de ricino, aceite de colza, aceite de grano de maíz, aceite de semilla de algodón y aceite de judía de soja, o los ésteres de los aceites citados. Se prefieren aceite de colza, aceite de girasol y sus ésteres metílicos o etílicos.

30 La concentración de potenciador de la penetración puede variar en un amplio intervalo. En un agente fitoprotector formulado, se encuentra en general al 1 a 95 % en peso, preferiblemente al 1 a 55 % en peso, con especial preferencia al 15-40 % en peso. En los agentes listos para aplicación (líquidos de pulverización), la concentración se encuentra en general a entre 0,1 y 10 g/l, preferiblemente entre 0,5 y 5 g/l.

35 Las combinaciones destacadas según la invención de principio activo, sal y potenciador de la penetración se indican en la siguiente tabla. "Según el ensayo" significa a este respecto que cada compuesto es adecuado para funcionar como potenciador de la penetración en el ensayo para la penetración de cutícula (Baur *et al.*, 1997, Pesticide Science 51, 131-152):

Nº	Principio activo	Sal	Potenciador de la penetración
1	I	Sulfato de amonio	Según el ensayo
2	I	Lactato de amonio	Según el ensayo
3	I	Nitrato de amonio	Según el ensayo
4	I	Tiosulfato de amonio	Según el ensayo

5	I	Tiocianato de amonio	Según el ensayo
6	I	Citrato de amonio	Según el ensayo
7	I	Oxalato de amonio	Según el ensayo
8	I	Formiato de amonio	Según el ensayo
9	I	Hidrogenofosfato de amonio	Según el ensayo
10	I	Dihidrogenofosfato de amonio	Según el ensayo
11	I	Carbonato de amonio	Según el ensayo
12	I	Benzoato de amonio	Según el ensayo
13	I	Sulfito de amonio	Según el ensayo
14	I	Benzoato de amonio	Según el ensayo
15	I	Hidrogenooxalato de amonio	Según el ensayo
16	I	Hidrogenocitrato de amonio	Según el ensayo
17	I	Acetato de amonio	Según el ensayo
18	I	Sulfato de tetrametilamonio	Según el ensayo
19	I	Lactato de tetrametilamonio	Según el ensayo
20	I	Nitrato de tetrametilamonio	Según el ensayo
21	I	Tiosulfato de tetrametilamonio	Según el ensayo
22	I	Tiocianato de tetrametilamonio	Según el ensayo
23	I	Citrato de tetrametilamonio	Según el ensayo
24	I	Oxalato de tetrametilamonio	Según el ensayo
25	I	Formiato de tetrametilamonio	Según el ensayo
26	I	Hidrogenofosfato de tetrametilamonio	Según el ensayo
27	I	Dihidrogenofosfato de tetrametilamonio	Según el ensayo
28	I	Sulfato de tetraetilamonio	Según el ensayo
29	I	Lactato de tetraetilamonio	Según el ensayo
30	I	Nitrato de tetraetilamonio	Según el ensayo
31	I	Tiosulfato de tetraetilamonio	Según el ensayo
32	I	Tiocianato de tetraetilamonio	Según el ensayo
33	I	Citrato de tetraetilamonio	Según el ensayo
34	I	Oxalato de tetraetilamonio	Según el ensayo
35	I	Formiato de tetraetilamonio	Según el ensayo
36	I	Hidrogenofosfato de tetraetilamonio	Según el ensayo
37	I	Dihidrogenofosfato de tetraetilamonio	Según el ensayo

Los compuestos según la invención pueden usarse dado el caso a determinadas concentraciones o 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 viroides) o como agentes contra MLO (organismo similar a micoplasma) y RLO (organismo similar a Rickettsia). Pueden usarse igualmente también como productos intermedios o precursores para la síntesis de otros principios activos.

Los principios activos pueden transferirse a las formulaciones habituales, como soluciones, emulsiones, polvos para pulverización, suspensiones basadas en agua y aceite, polvos, productos para espolvorear, pastas, polvos solubles, gránulos solubles, gránulos dispersados, concentrados de suspensión-emulsión, sustancias naturales impregnadas con principio activo, sustancias sintéticas impregnadas con principio activo, fertilizantes, así como microencapsulaciones en sustancias poliméricas.

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

Como coadyuvantes pueden encontrar uso aquellas sustancias que sean adecuadas para conferir propiedades especiales al agente mismo y/o a preparados derivados del mismo (por ejemplo líquidos de pulverización, desinfectantes de semilla), como determinadas propiedades técnicas y/o también propiedades biológicas especiales. Como coadyuvantes típicos se tienen en cuenta: diluyentes, disolventes y vehículos.

Como diluyentes son adecuados, por ejemplo, agua, líquidos químico-orgánicos polares y no polares, por ejemplo, de las clases de hidrocarburos aromáticos y no aromáticos (como parafinas, alquilbencenos, alquilnaftalenos, clorobencenos), de alcoholes y polioles (que pueden estar también dado el caso sustituidos, eterificados y/o esterificados), de cetonas (como acetona, ciclohexanona), ésteres (también grasas y aceites) y (poli)éteres, de aminas sencillas y sustituidas, amidas, lactamas (como *N*-alquilpirrolidonas) y lactonas, de sulfonas y sulfóxidos (como dimetilsulfóxido).

En el caso de uso de agua como diluyente, pueden usarse también, por ejemplo, disolventes orgánicos como

disolventes auxiliares. Como disolventes líquidos se tienen esencialmente en cuenta: compuestos aromáticos como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, compuestos aromáticos clorados e hidrocarburos alifáticos clorados como clorobenzenos, cloroetilenos o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos como ciclohexano o parafinas, por ejemplo, fracciones de petróleo, aceites minerales y vegetales, alcoholes como butanol o glicol, así como sus éteres y ésteres, cetonas como acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona o ciclohexanona, disolventes polares fuertes como dimetilsulfóxido, así como agua.

Como vehículos sólidos se tienen en cuenta:

por ejemplo, sales de amonio y polvos de rocas naturales como caolines, arcillas, talco, creta, cuarzo, atapulgita, montmorillonita o tierra de diatomeas y polvos de rocas sintéticos como sílice de alta dispersión, óxido de aluminio y silicatos, como vehículos sólidos para gránulos se tienen en cuenta: por ejemplo, rocas naturales rotas y fraccionadas como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita, así como gránulos sintéticos de polvos inorgánicos y orgánicos, así como gránulos de material orgánico como papel, serrín, cáscaras de coco, mazorcas de maíz y tallos de tabaco; como agentes emulsionantes y/o espumantes se tienen en cuenta: por ejemplo, agentes emulsionantes no ionogénicos y aniónicos como polioxietileno-éster de ácido graso, polioxietileno-éteres de alcohol graso, por ejemplo, alquilarilpoli-glicoléteres, sulfonatos de alquilo, sulfatos de alquilo, sulfonatos de arilo, así como hidrolizados de proteína; como agentes de dispersión se tienen en cuenta sustancias no iónicas y/o iónicas, por ejemplo, de las clases de aductos de alcohol-POE- y/o POP-éter, ácido- y/o POP-POE-éster, alquil-aril- y/o POP-POE-éter, grasa- y/o POP-POE, derivados de POE- y/o POP-poliol, aductos de POE- y/o POP-sorbitán o -azúcar, sulfatos, sulfonatos y fosfatos de alquilo o arilo, o los correspondientes aductos de PO-éter. Además, oligómeros o polímeros adecuados, por ejemplo, a partir de monómeros vinílicos, de ácido acrílico, de EO y/o de PO solos o junto con, por ejemplo, (poli)alcoholes o (poli)aminas. Además, pueden encontrar uso lignina y sus derivados de ácido sulfónico, celulosas sencillas y modificadas, ácidos sulfónicos aromáticos y/o alifáticos, así como sus aductos con formaldehído.

Pueden usarse en las formulaciones adhesivos como carboximetilcelulosa, polímeros naturales y sintéticos en forma de polvo, grano o látex, como goma arábica, poli(alcohol vinílico), poli(acetato de vinilo), así como fosfolípidos naturales como cefalinas y lecitinas y fosfolípidos sintéticos.

Pueden usarse colorantes como pigmentos inorgánicos, por ejemplo, óxido de hierro, óxido de titanio, azul de ferrocianuro y colorantes orgánicos como colorantes de alizarina, azoicos y de ftalocianina metálica y oligonutrientes como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc.

Pueden ser aditivos adicionales aromatizantes, aceites minerales o vegetales dado el caso modificados, ceras y nutrientes (también oligonutrientes) como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc.

Además, pueden contener estabilizadores como estabilizadores del frío, conservantes, protectores de oxidación, fotoprotectores u otros agentes mejoradores de la estabilidad química y/o física.

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

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

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

Los principios activos según la invención pueden presentarse además en el uso como insecticidas en sus formulaciones comerciales, así como en las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones, mezclados con sinergizadores. Los sinergizadores son compuestos mediante los que se controla el efecto de los principios activos, sin que el sinergizador añadido deba ser activo eficaz por sí mismo.

Los principios activos según la invención pueden presentarse además en el uso como insecticidas en sus formulaciones comerciales, así como en las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones, en mezclas con sustancias inhibidoras que reducen la degradación del principio activo después de la aplicación en el entorno de las plantas, sobre la superficie de las partes de la planta o en los tejidos de la planta.

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

La aplicación se efectúa en una de las formas de aplicación adaptadas de modo habitual.

Según la invención, pueden tratarse todas las plantas y partes de planta. Por plantas se entiende, en este sentido,

todas las plantas y poblaciones de plantas como plantas silvestres deseadas y no deseadas o plantas de cultivo (incluyendo plantas de cultivo de aparición natural). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que pueden obtenerse mediante procedimientos de cultivo y optimización convencionales o mediante procedimientos biotecnológicos y de ingeniería genética o combinaciones de estos procedimientos, incluyendo las plantas transgénicas e incluyendo las variedades de plantas protegibles por el derecho de protección de variedades o las variedades de plantas no protegibles. Por partes de planta debe entenderse todas las partes y órganos de la planta aéreos y subterráneos, como brote, hoja, flor y raíz, indicándose por ejemplo hojas, agujas, tallos, troncos, flores, cuerpos frutales, frutos y semillas, así como raíces, tubérculos y rizomas. Pertenecen a las partes de planta también productos de cosecha, así como material de multiplicación vegetativa y generativa, por ejemplo, esquejes, tubérculos, rizomas, acodos y semillas.

El tratamiento según la invención de plantas y partes de planta con los principios activos se realiza directamente o mediante acción sobre su entorno, hábitat o espacio de almacenamiento según procedimientos de tratamiento habituales, por ejemplo, mediante inmersión, pulverización, vaporización, nebulización, dispersión, extensión, inyección y en material de multiplicación, particularmente en semillas, además mediante envolturas de una o varias capas.

Como ya se ha mencionado anteriormente, pueden tratarse según la invención todas las plantas y sus partes. En una realización preferida, se tratan especies de plantas y variedades de plantas de origen silvestre u obtenidas mediante procedimientos de cultivo biológico convencional, como cruzamiento o fusión de protoplastos, así como sus partes. En una realización preferida adicional, se tratan plantas transgénicas y variedades de plantas que se han obtenido mediante procedimientos de ingeniería genética dado el caso en combinación con procedimientos convencionales (organismos modificados genéticamente) y sus partes. Los términos "partes" o "partes de plantas" o "partes de planta" se han ilustrado anteriormente.

De forma especialmente preferida, se tratan plantas según la invención de las variedades de plantas respectivamente comerciales o que se encuentran en uso. Por variedades de planta se entiende plantas con nuevas propiedades ("rasgos") que se cultivan tanto mediante cultivo convencional, mediante mutagénesis o mediante técnicas de ADN recombinante. Estas pueden ser variedades, biotipos y genotipos.

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

Pertenecen a las plantas o variedades de plantas transgénicas preferidas según la invención para tratar (obtenidas por ingeniería genética) todas las plantas que mediante la modificación por ingeniería genética han recibido material genético que confiere a estas plantas propiedades valiosas especialmente ventajosas ("rasgos"). Son ejemplos de dichas propiedades mejor crecimiento de planta, tolerancia elevada frente a temperaturas altas o bajas, tolerancia aumentada frente a la sequía o frente al contenido de sales de agua o suelo, rendimiento de floración elevado, recolección facilitada, aceleramiento de la maduración, mayores rendimientos de cosecha, mayor calidad y/o mayor valor nutritivo de los productos de cosecha, mayor capacidad de almacenamiento y/o procesabilidad de los productos de cosecha. Son ejemplos adicionales y especialmente destacados de dichas propiedades una defensa elevada de las plantas frente a plagas animales y microbianas, como frente a insectos, ácaros, hongos, bacterias y/o virus fitopatógenos, así como una tolerancia elevada de las plantas frente a determinados principios activos herbicidas. Como ejemplos de plantas transgénicas, se mencionan las plantas de cultivo importantes como cereales (trigo, arroz), maíz, soja, patata, remolacha azucarera, tomates, guisantes y otras variedades de hortalizas, algodón, tabaco, colza, así como plantas frutales (con los frutos manzanas, peras, frutos cítricos y uvas), siendo especialmente destacadas maíz, soja, patata, algodón, tabaco y colza. Como propiedades ("rasgos"), se destacan especialmente la defensa elevada de las plantas frente a insectos, arácnidos, nematodos y caracoles mediante toxinas generadas en las plantas, particularmente aquellas que se producen en las plantas mediante el material genético de *Bacillus thuringiensis* (por ejemplo, mediante los genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb y CryIF, así como sus combinaciones) (en adelante, "plantas Bt"). Como propiedades ("rasgos"), se destacan también especialmente la defensa elevada de las plantas frente a hongos, bacterias y virus mediante resistencia sistémica adquirida (SAR), sistemina, fitoalexinas, desencadenantes, así como genes de resistencia y las correspondientes proteínas y toxinas expresadas. Como propiedades ("rasgos"), se destacan también especialmente la tolerancia elevada de las plantas frente a determinados principios activos herbicidas, por ejemplo, imidazolinonas, sulfonilureas, glifosato o fosfinotricina (por ejemplo, gen "PAT"). Los genes que confieren las propiedades respectivamente deseadas ("rasgos") pueden aparecer también en combinaciones entre sí en las plantas transgénicas. Como ejemplos de "plantas Bt", se citan variedades de maíz, variedades de algodón, variedades de soja y variedades de patata, que se comercializan con las denominaciones comerciales YIELD GARD® (por ejemplo, maíz, algodón, soja), KnockOut® (por ejemplo, maíz), StarLink® (por ejemplo, maíz),

- Bollgard® (algodón), Nucotr® (algodón) y NewLeaf® (patata). Como ejemplos de plantas tolerantes a herbicidas, se citan variedades de maíz, variedades de algodón y variedades de soja que se comercializan con las denominaciones comerciales Roundup Ready® (tolerancia frente a glifosato, por ejemplo, maíz, algodón, soja), Liberty Link® (tolerancia frente a fosfinotricina, por ejemplo, colza), IMI® (tolerancia frente a imidazolinonas) y STS® (tolerancia frente a sulfonilureas, por ejemplo, maíz). Como plantas resistentes a herbicidas (cultivadas convencionalmente con tolerancia a herbicidas), se mencionan también las variedades comercializadas con la referencia Clearfield® (por ejemplo, maíz). Por supuesto, estas indicaciones son válidas también para las especies de plantas desarrolladas en el futuro o presentes en el mercado futuro con estas u otras propiedades genéticas desarrolladas en el futuro ("rasgos").
- 10 Las plantas indicadas pueden tratarse de forma especialmente ventajosa según la invención con los compuestos de fórmula general I o las mezclas de principios activos según la invención. Los intervalos preferidos dados anteriormente en los principios activos o mezclas son también válidos para el tratamiento de estas plantas. Se destaca especialmente el tratamiento de plantas con los compuestos o mezclas indicados especialmente en el presente texto.
- 15 Los principios activos según la invención no solo funcionan contra plagas de plantas, contra la higiene y de productos almacenados, sino también en el sector de medicina veterinaria contra parásitos animales (ecto- y endoparásitos) como garrapatas duras, garrapatas blandas, ácaros de la sarna, ácaros chupadores, moscas (picadoras y chupadoras), larvas de moscas parásitas, piojos, malófagos de piel, malófagos de pluma y pulgas. Pertenecen a estos parásitos:
- 20 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.*
- 25 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.*
- 30 Del orden de los *Siphonapterida*, por ejemplo, *Pulex spp.*, *Ctenocephalides spp.*, *Xenopsylla spp.*, *Ceratophyllus spp.*
- Del orden de los *Heteropterida*, por ejemplo, *Cimex spp.*, *Triatoma spp.*, *Rhodnius spp.*, *Panstrongylus spp.*
- 35 Del orden de los *Blattarida*, por ejemplo, *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Blattella germanica*, *Supella spp.*
- De la subclase de los *Acari (Acarina)* y los subórdenes *Metastigmata* así como *Mesostigmata*, por ejemplo, *Argas spp.*, *Ornithodoros spp.*, *Otobius spp.*, *Ixodes spp.*, *Amblyomma spp.*, *Boophilus spp.*, *Dermacentor spp.*, *Haemophysalis spp.*, *Hyalomma spp.*, *Rhipicephalus spp.*, *Dermanyssus spp.*, *Raillietia spp.*, *Pneumonyssus spp.*, *Sternostoma spp.*, *Varroa spp.*
- 40 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.*
- 45 Los principios activos de fórmula (I) según la invención son también adecuados para combatir artrópodos que atacan a animales útiles agrícolas como, por ejemplo, vacas, ovejas, cabras, caballos, cerdos, asnos, camellos, búfalos, conejos, gallinas, pavos, patos, gansos, abejas, otras mascotas como, por ejemplo, perros, gatos, aves domésticas, peces de acuario, así como los denominados animales de ensayo como, por ejemplo, hamsters, conejillos de Indias, ratas y ratones. Mediante el combate de estos artrópodos, deben reducirse los fallecimientos y las
- 50 reducciones de rendimiento (de carne, leche, lana, pieles, huevos, miel, etc.), de modo que mediante el uso de los principios activos según la invención es posible una cría de animales más económica y sencilla.
- La aplicación de los principios activos según la invención se efectúa de modo conocido en el sector veterinario mediante administración entérica en forma de, por ejemplo, comprimidos, cápsulas, pociones, brebajes, gránulos, pastas, bolos, procedimiento con la alimentación, supositorios, mediante administración parenteral como, por
- 55 ejemplo, mediante inyecciones (intramuscular, subcutánea, intravenosa, intraperitoneal, entre otras), implantes, mediante administración nasal, mediante aplicación dérmica en forma, por ejemplo, de inmersión o baño

(empapado), pulverización (pulverizador), vertido (vertido dorsal y en la cruz), lavado, empolvado, así como con ayuda de cuerpos de moldeo que contienen principios activos como collares, marcas en la oreja, marcas en el rabo, brazaletes, ronzaletas, dispositivos de marcaje, etc.

- 5 En la aplicación para ganado, aves, mascotas, etc., pueden usarse los principios activos de fórmula (I) como formulaciones (por ejemplo, polvos, emulsiones, agentes fluidos) que contienen los principios activos a una concentración en una cantidad del 1 al 80 % en peso, directamente o después de dilución de 100 a 10.000 veces o se aplican como baño químico.

Además, se ha encontrado que los compuestos según la invención muestran un alto efecto insecticida frente a insectos que destruyen materiales técnicos.

- 10 Por ejemplo y preferiblemente, sin embargo sin limitación, se citan los siguientes insectos:

Escarabajos 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*;

- 15

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

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

- 20 Lepismas como *Lepisma saccharina*.

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

Los agentes listos para aplicación pueden contener dado el caso insecticidas adicionales y dado el caso uno o más fungicidas.

- 25 Con respecto a posibles componentes de mezcla adicionales, se remite a los insecticidas y fungicidas anteriormente citados.

Al mismo tiempo, los compuestos según la invención pueden usarse para la protección de la incrustación en objetos, particularmente en cascos de barcos, cedazos, redes, construcciones, muelles e instalaciones de señalización que están en contacto con agua de mar o salobre.

- 30 Además, los compuestos según la invención pueden usarse solos o en combinaciones con otros principios activos como agentes antiincrustación.

Los principios activos son adecuados también para combatir plagas animales en la protección doméstica, de higiene y productos almacenados, particularmente de insectos, arácnidos y ácaros, que aparecen en espacios cerrados como, por ejemplo, viviendas, fábricas, oficinas, cubículos de vehículos, entre otros. Pueden usarse para combatir estas plagas solos o en combinación con otros principios activos y coadyuvantes en productos insecticidas domésticos. Son eficaces frente a especies sensibles y resistentes, así como frente a todos los estados de desarrollo. Pertenecen a estas plagas:

- 35

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

- 40 Del orden de los *Acarina*, por ejemplo, *Argas persicus*, *Argas reflexus*, *Bryobia ssp.*, *Dermanyssus gallinae*, *Glyciphagus domesticus*, *Ornithodoros 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*.

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

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 orientalis*, *Blattella germanica*, *Blattella asahinai*, *Leucophaea maderae*, *Panchlora* spp., *Parcoblatta* spp., *Periplaneta australasiae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Supella longipalpa*.

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

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

Del orden de los *Isoptera*, por ejemplo, *Kaloterms* spp., *Reticuliterms* spp.

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

10 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*, *Chrysosoma pluvialis*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex pipiens*, *Culex tarsalis*, *Drosophila* spp., *Fannia canicularis*, *Musca domestica*, *Phlebotomus* spp., *Sarcophaga carnaria*, *Simulium* spp., *Stomoxys calcitrans*, *Tipula paludosa*.

15 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*.

20 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*.

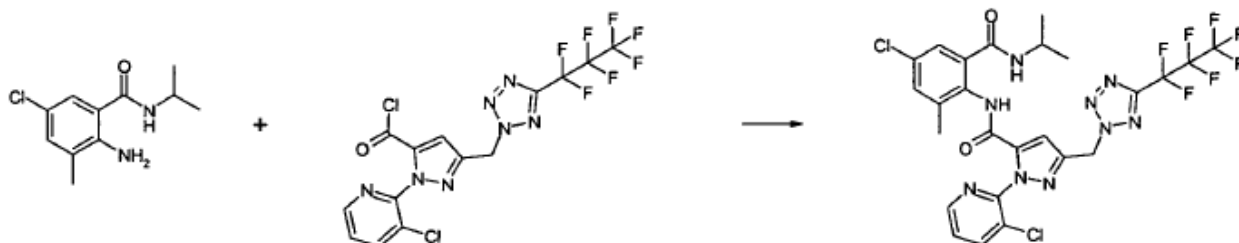
25 La aplicación en el campo de los insecticidas domésticos se realiza solo o en combinación con otros principios activos adecuados como ésteres de ácido fosfórico, carbamatos, piretroides, neonicotinoides, reguladores del crecimiento o principios activos de otras clases de insecticidas conocidas.

30 La aplicación se realiza en aerosoles, pulverizadores sin presión, por ejemplo, pulverizadores de bombeo y atomización, nebulizadores automáticos, nebulizadores, espumas, geles, productos de vaporización con placas vaporizadoras de celulosa o plástico, vaporizadores de líquido, vaporizadores de gel y membrana, vaporizadores con propulsores, sistemas de vaporización sin energía o pasivos, papeles antipolillas, saquitos antipolillas y geles antipolillas, en forma de gránulos o polvos, en cebos dispersados o trampas con cebo.

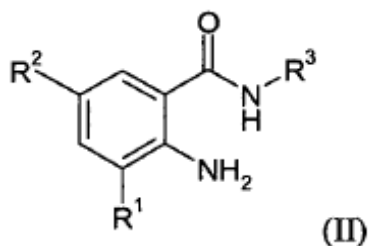
Explicación de los procedimientos y productos intermedios

Procedimiento (A)

35 Si se usan, por ejemplo, 2-amino-5-cloro-*N*-isopropil-3-metil-benzamida y cloruro del ácido 2-(3-cloro-piridin-2-il)-5-(5-heptafluoropropil-tetrazol-2-ilmetil)-2*H*-pirazol-3-carboxílico como sustancias de partida, entonces el desarrollo del procedimiento (A) puede ilustrarse mediante el siguiente esquema de fórmulas.



40 Las aminobenzamidas necesarias como sustancias de partida en la práctica del procedimiento (A) se definen en general mediante la fórmula (II).



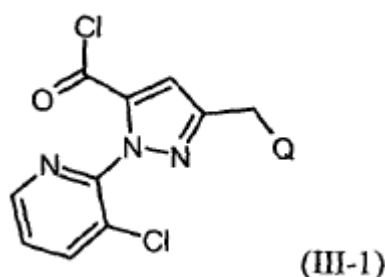
En esta fórmula (II), R¹, R² y R³ tienen el significado anteriormente dado.

El procedimiento (A) se lleva a cabo en presencia de un aglutinante de ácido. Son adecuados para ello todas las bases inorgánicas u orgánicas habituales para dichas reacciones de acoplamiento. Se pueden usar preferiblemente hidruros, hidróxidos, amiduros, alcoholatos, acetatos, carbonatos o hidrogenocarbonatos de metales alcalinotérreos o alcalinos como, por ejemplo, hidruro de sodio, amiduro de sodio, diisopropilamiduro de litio, metilato de sodio, etilato de sodio, *tert*-butilato de potasio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, acetato de sodio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, hidrogenocarbonato de potasio, hidrogenocarbonato de sodio o carbonato de amonio, así como aminas terciarias como trimetilamina, trietilamina, tributilamina, diisopropiletilamina, *N,N*-dimetilnilina, *N,N*-dimetilbencilamina, piridina, *N*-metilpiperidina, *N*-metilmorfolina, *N,N*-dimetilaminopiridina, diazabicyclooctano (DABCO), diazabicyclononeno (DBN) o diazabicycloundeceno (DBU). Igualmente pueden usarse dado el caso agentes aglutinantes de ácido soportados en polímero como, por ejemplo, diisopropilamina unida a polímero y dimetilaminopiridina unida a polímero

El procedimiento (A) puede llevarse a cabo dado el caso en presencia de un diluyente orgánico inerte habitual para dichas reacciones. Pertenecen preferiblemente a ellos hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos como, por ejemplo, éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benceno, tolueno, xileno o decalina; hidrocarburos halogenados como, por ejemplo, clorobenceno, diclorobenceno, diclorometano, cloroformo, tetraclorometano, dicloroetano o tricloroetano; éteres como dietiléter, diisopropiléter, metil-*tert*-butiléter, metil-*tert*-amiléter, dioxano, tetrahydrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano o anisol; cetonas como acetona, butanona, metilisobutilcetona o ciclohexanona; nitrilos como acetonitrilo, propionitrilo, *n*- o isobutironitrilo o benzonitrilo; amidas como *N,N*-dimetilformamida, *N,N*-dimetilacetamida, *N*-metilformanilida, *N*-metilpirrolidona o triamida del ácido hexametilfosfórico, sus mezclas con agua o agua pura.

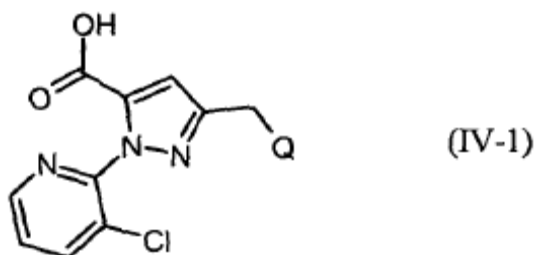
Las aminobenzamidas de fórmula (II) son conocidas o pueden prepararse según procedimientos conocidos (véanse, por ejemplo, M. J. Kornet, J. Heterocycl. Chem. 1992, 29, 103-105; G. P. Lahm *et al.*, Bioorg. Med. Chem. Letters 2005, 15, 4898-4906; WO 2003/016284, WO 2006/055922, WO 2006/062978, WO 2008/010897, WO 2008/070158).

Los cloruros de ácido pirazolcarboxílico necesarios como sustancia de partida en la práctica del procedimiento (A) se definen en general mediante la fórmula (III-1).



En esta fórmula (III-1), Q tiene el significado anteriormente dado.

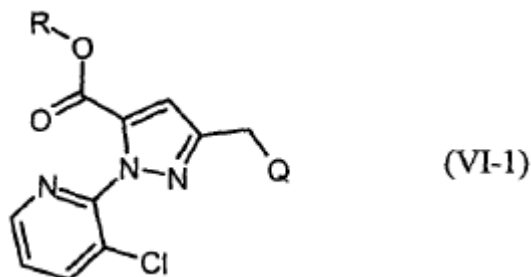
Los cloruros del ácido pirazolcarboxílico de fórmula (III-1) son nuevos. Pueden prepararse haciendo reaccionar derivados de ácido pirazolcarboxílico de fórmula (IV-1)



en la que Q tiene el significado anteriormente dado,

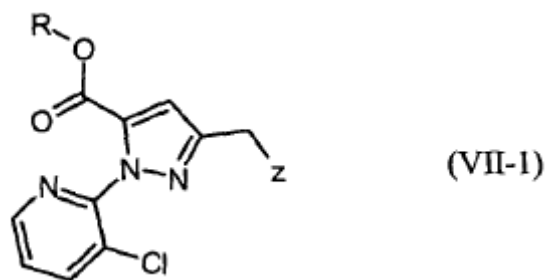
con un agente clorante (por ejemplo, cloruro de tionilo y cloruro de oxalilo) en presencia de un diluyente inerte (por ejemplo, tolueno y diclorometano) y en presencia de una cantidad catalítica de *N,N*-dimetilformamida.

- 5 Los derivados de ácido pirazolcarboxílico de fórmula (IV-1) son nuevos. Pueden prepararse haciendo reaccionar ésteres del ácido pirazolcarboxílico de fórmula (VI-1)



en la que Q tiene los significados anteriormente dados y R representa alquilo C₁-C₆, con un hidróxido de metal alcalino (por ejemplo, hidróxido de sodio o hidróxido de potasio) en presencia de un diluyente inerte (por ejemplo, dioxano/agua o etanol/agua).

- 10 Los ésteres del ácido pirazolcarboxílico de fórmula (VI) son nuevos. Pueden prepararse haciendo reaccionar derivados de éster de ácido pirazolcarboxílico de fórmula (VII-1)



- 15 en la que R tiene el significado anteriormente dado y Z representa cloro, bromo, yodo, metilsulfonilo y toluenosulfonilo, con un tetrazol de fórmula (VIII), en la que Q tiene el significado anteriormente dado, en presencia de una base (por ejemplo, hidróxido de sodio, carbonato de potasio, carbonato de sodio, carbonato de cesio, metilato de sodio, trietilamina o hidruro de sodio) y en presencia de un disolvente (por ejemplo, tetrahidrofurano, tolueno, acetona, acetonitrilo, metanol, dimetilformamida o dioxano).

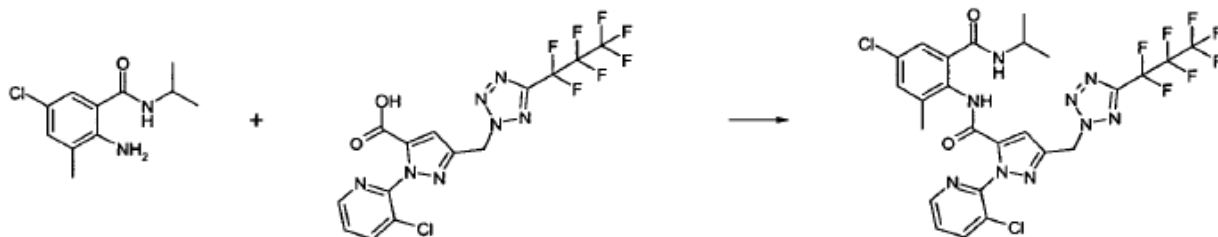


- 20 Los tetrazoles de fórmula (VIII) son conocidos, incluso comercialmente obtenibles en parte, o pueden obtenerse según procedimientos conocidos, (véanse, por ejemplo, el documento WO2004/020445; William P. Norris, J. Org. Chem., 1962, 27 (9), 3248-3251; Henry C. Brown, Robert J. Kassal, J. Org. Chem., 1967, 32 (6), 1871-1873; Dermis P. Curran, Sabine Hadida, Sun-Young Kim, Tetrahedron, 1999, 55 (29), 8997-9006; L.D. Hansen, E.J. Baca, P. Scheiner, Journal of Heterocyclic Chemistry, 1970, 7, 991-996).

- 25 Los derivados de éster del ácido pirazolcarboxílico de fórmula (VII) son conocidos o pueden obtenerse según procedimientos conocidos (véase, por ejemplo, el documento WO2007/144100)

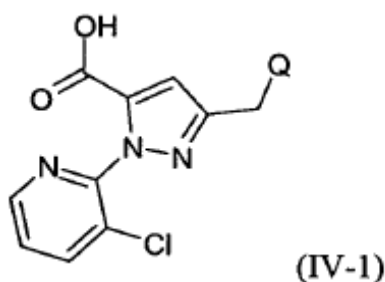
Procedimiento (B)

Si se usan, por ejemplo, 2-amino-5-cloro-*N*-isopropil-3-metil-benzamida y ácido 2-(3-cloro-piridin-2-il)-5-(5-heptafluoropropil-tetrazol-2-ilmetil)-2*H*-pirazol-3-carboxílico como sustancias de partida, entonces el desarrollo del procedimiento (B) puede ilustrarse mediante el siguiente esquema de fórmulas.



Las antranilamidas de fórmula (II) necesarias como sustancias de partida en la práctica del procedimiento (B) se han descrito ya con relación al procedimiento (A).

- 5 Los ácidos pirazolcarboxílicos necesarios además como sustancias de partida en la práctica del procedimiento (B) se definen en general por la fórmula (IV-1).



En esta fórmula (IV-1), Q tiene el significado anteriormente dado.

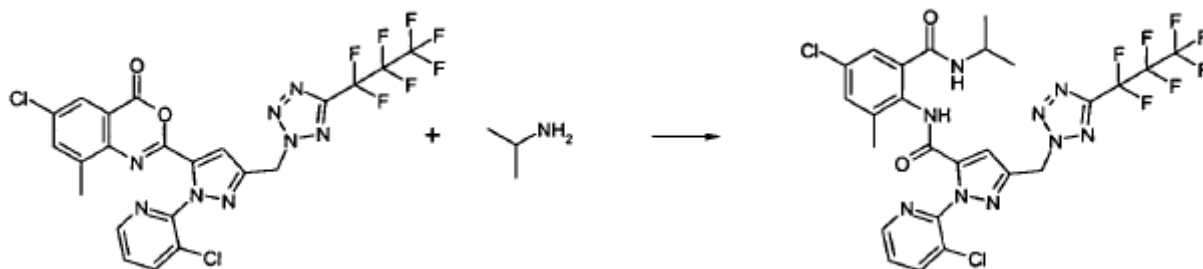
- El procedimiento (B) se lleva a cabo en presencia de un agente de condensación. Son adecuados para ellos todos los agentes habituales para dichas reacciones de acoplamiento. Se citan como ejemplos formadores de halogenuro de ácido como fosgeno, tribromuro de fósforo, tricloruro de fósforo, pentacloruro de fósforo, oxiclorigenuro de fósforo o cloruro de tionilo; formadores de anhídrido como éster etílico del ácido clorofórmico, éster metílico del ácido clorofórmico, éster isopropílico del ácido clorofórmico o cloruro de metanosulfonilo; carbodiimidas como *N,N'*-diciclohexilcarbodiimida (DCC) u otros agentes de condensación habituales como pentóxido de fósforo, ácido polifosfórico, 1,1'-carbonildiimidazol, 2-etoxi-*N*-etoxicarbonil-1,2-dihidroquinolina (EEDQ), triphenilfosfina/tetracloruro de carbono, hexafluorofosfato de bromotripiridilidionofosfonio, cloruro de bis-(2-oxo-3-oxazolidinil)fosfina o hexafluorofosfato de benzotriazol-1-iloxitris(dimetilamino)fosfonio. Pueden usarse igualmente reactivos soportados sobre polímero como, por ejemplo, ciclohexilcarbodiimida unida a polímero.

El procedimiento (B) se lleva a cabo dado el caso en presencia de un catalizador. Se citan como ejemplos 4-dimetilaminopiridina, 1-hidroxi-benzotriazol o dimetilformamida.

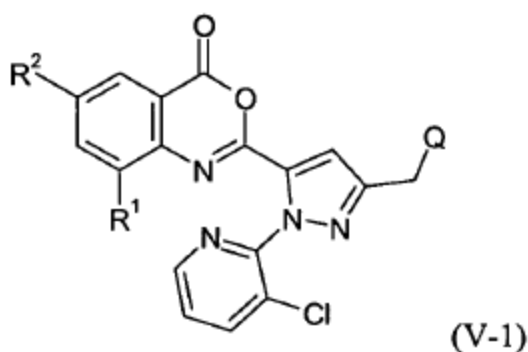
- El procedimiento (B) puede llevarse a cabo dado el caso en presencia de un diluyente orgánico inerte habitual para dichas reacciones. Pertenecen a ellos preferiblemente hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos como, por ejemplo, éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benceno, tolueno, xileno o decalina; hidrocarburos halogenados como, por ejemplo, clorobenceno, diclorobenceno, diclorometano, cloroformo, tetraclorometano, dicloroetano o tricloroetano; éteres como dietiléter, diisopropiléter, metil-*terc*-butiléter, metil-*terc*-amiléter, dioxano, tetrahydrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano o anisol; cetonas como acetona, butanona, metilisobutilcetona o ciclohexanona; nitrilos como acetonitrilo, propionitrilo, *n*- o isobutironitrilo o benzonitrilo; amidas como *N,N*-dimetilformamida, *N,N*-dimetilacetamida, *N*-metilformanilida, *N*-metilpirrolidona o triamida del ácido hexametilfosfórico, sus mezclas con agua o agua pura.

Procedimiento (C)

- 30 Si se usan 6-cloro-2-[2-(3-cloro-piridin-2-il)-5-(5-heptafluoropropil-tetrazol-2-ilmetil)-2*H*-pirazol-3-il]-8-metilbenzo[d][1,3]oxazin-4-ona e isopropilamina, puede ilustrarse entonces el desarrollo del procedimiento (C) mediante el siguiente esquema de fórmulas.

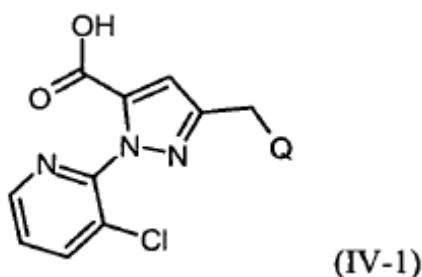


Las benzoxazinonas necesarias como sustancias de partida en la práctica del procedimiento (C) se definen en general por la fórmula (V-1).

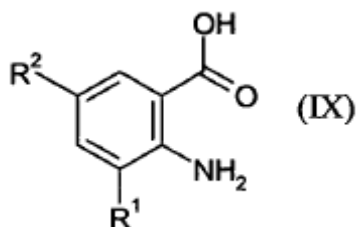


- 5 En esta fórmula (V-1), R^1 , R^2 y Q tienen el significado anteriormente dado.

Las benzoxazinonas de fórmula (V-1) son nuevas. Se obtienen, por ejemplo, haciendo reaccionar derivados del ácido pirazolcarboxílico de fórmula (IV-1)



- 10 en la que Q tiene el significado anteriormente dado,
con ácidos antranílicos de fórmula (IX)



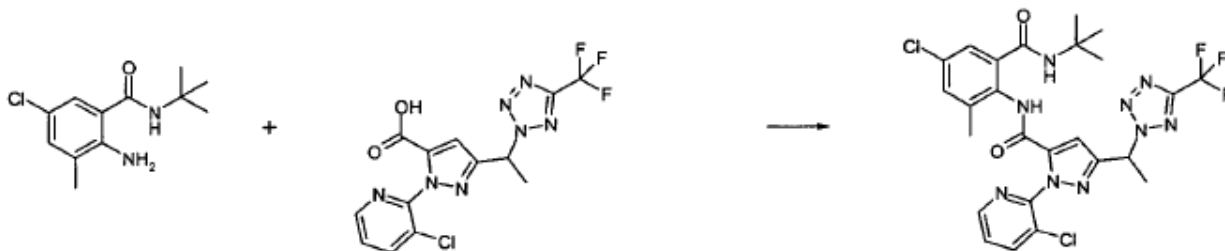
en la que R^1 y R^2 tienen los significados anteriormente dados, en presencia de una base (por ejemplo, trietilamina o piridina) y en presencia de un cloruro de ácido sulfónico (por ejemplo, cloruro del ácido metanosulfónico), así como dado el caso en presencia de un diluyente (por ejemplo, acetonitrilo).

- 15 Los derivados de ácido pirazolcarboxílico de fórmula (IV-1) necesarios como sustancias de partida en la práctica del procedimiento se han descrito ya con respecto al procedimiento (A).

Los ácidos antranílicos de fórmula (IX) son conocidos o pueden prepararse según procedimientos de síntesis generales (véanse, por ejemplo, Baker *et al.* J. Org. Chem. 1952, 149-153; G. Reissenweber *et al.*, Angew. Chem. 1981, 93, 914-915, P.J. Montoya-Pelaez, J. Org. Chem. 2006, 71, 5921-5929; F. E. Sheibley, J. Org. Chem. 1938, 5, 414-423, documento WO 2006023783).

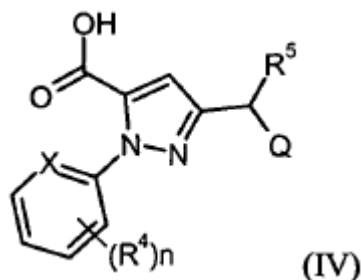
5 Procedimiento (D)

Si se usan, por ejemplo, 2-amino-*N*-*tert*-butil-5-cloro-3-metilbenzamida y ácido 1-(3-cloropiridin-2-il)-3-{1-[5-(trifluorometil)-2*H*-tetrazol-2-il]etil}-1*H*-pirazol-5-carboxílico como sustancia de partida, entonces puede ilustrarse el desarrollo del procedimiento (D) mediante el siguiente esquema de fórmulas.



- 10 Las antranilamidas de fórmula (II) necesarias como sustancias de partida en la práctica del procedimiento (D) se han descrito ya con relación al procedimiento (A).

Los ácidos pirazolcarboxílicos necesarios además como sustancias de partida en la práctica del procedimiento (D) se definen en general por la fórmula (IV).



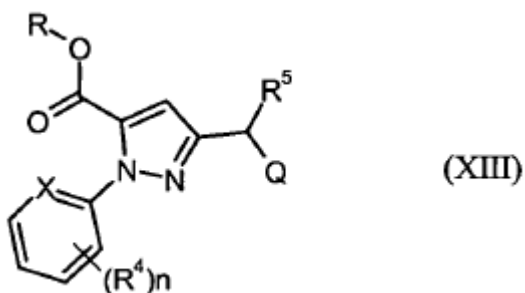
- 15 En esta fórmula (IV), X, Q, R⁴, R⁵ y n tienen el significado anteriormente dado.

El procedimiento (D) se lleva a cabo en presencia de un agente de condensación. Son adecuados para ello todos los agentes habituales para dichas reacciones de acoplamiento. Se citan como ejemplos formadores de halogenuro de ácido como fosgeno, tribromuro de fósforo, tricloruro de fósforo, pentacloruro de fósforo, oxiclورو de fósforo o cloruro de tionilo; formadores de anhídrido como éster etílico del ácido fórmico, éster metílico del ácido fórmico, éster isopropílico del ácido fórmico, éster isobutílico del ácido fórmico o cloruro de metanosulfonilo; carbodiimidas como *N,N*-diciclohexilcarbodiimida (DCC) u otros agentes de condensación habituales como pentóxido de fósforo, ácido polifosfórico, 1,1'-carbonildiimidazol, 2-etoxi-*N*-etoxicarbonil-1,2-dihidroquinolina (EEDQ), trifenilfosfina/tetracloruro de carbono, hexafluorofosfato de bromotripirrolidino fosfonio, cloruro de bis-(2-oxo-3-oxazolidinil)fosfina o hexafluorofosfato de benzotriazol-1-iloxitris(dimetilamino)fosfonio. Pueden usarse igualmente reactivos soportados por polímero como, por ejemplo, ciclohexilcarbodiimida unida a polímero.

El procedimiento (D) se lleva a cabo igualmente en presencia de un catalizador. Se citan como ejemplos 4-dimetilaminopiridina, 1-hidroxi-benzotriazol o dimetilformamida.

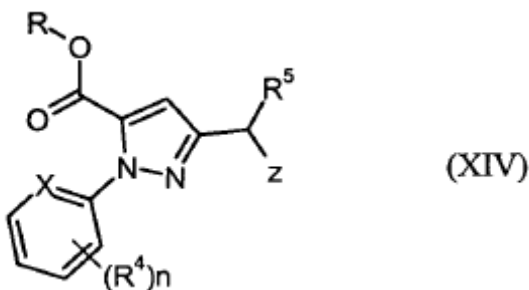
El procedimiento (D) puede llevarse a cabo dado el caso en presencia de un diluyente orgánico inerte habitual para dichas reacciones. Pertenecen a ellos preferiblemente hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos como, por ejemplo, éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benceno, tolueno, xileno o decalina; hidrocarburos halogenados como, por ejemplo, clorobenceno, diclorobenceno, diclorometano, cloroformo, tetraclorometano, dicloroetano o tricloroetano; éteres como dietiléter, diisopropiléter, metil-*tert*-butiléter, metil-*tert*-amiléter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano o anisol; cetonas como acetona, butanona, metilisobutilcetona o ciclohexanona; nitrilos como acetonitrilo, propionitrilo, *n*- o isobutironitrilo o benzonitrilo; amidas como *N,N*-dimetilformamida, *N,N*-dimetilacetamida, *N*-metilformanilida, *N*-metilpirrolidina o triamida del ácido hexametilfosfórico, sus mezclas con agua o agua pura.

Los ácidos pirazolcarboxílicos de fórmula (IV) son nuevos. Pueden prepararse, por ejemplo, haciendo reaccionar ésteres del ácido pirazolcarboxílico de fórmula (XIII)



en la que X, Q, R⁴, R⁵ y n tienen los significados anteriormente dados y R representa alquilo C₁-C₆, con un hidróxido de metal alcalino (por ejemplo, hidróxido de sodio o hidróxido de potasio) en presencia de un diluyente inerte (por ejemplo, dioxano/agua o etanol/agua).

- 5 Los ésteres del ácido pirazolcarboxílico de fórmula (XIII) son nuevos. Pueden prepararse, por ejemplo, haciendo reaccionar derivados de éster del ácido pirazolcarboxílico de fórmula (XIV)

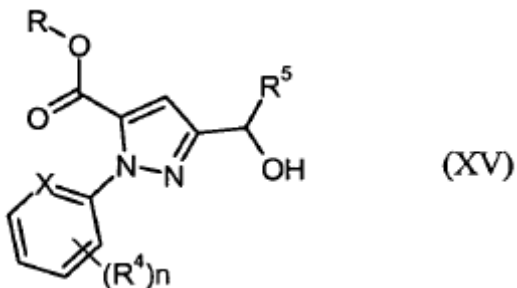


- 10 en la que X, Q, R, R⁴, R⁵ y n tienen el significado anteriormente dado y Z representa cloro, bromo, yodo, metilsulfonilo o toluenosulfonilo, con un tetrazol de fórmula (VIII), en el que Q tiene el significado anteriormente dado, en presencia de una base (por ejemplo, hidróxido de sodio, carbonato de potasio, carbonato de sodio, carbonato de cesio, metilato de sodio, trietilamina o hidruro de sodio) en presencia de un disolvente (por ejemplo, tetrahidrofurano, tolueno, acetona, acetonitrilo, metanol, dimetilformamida o dioxano).

Q-H (VIII)

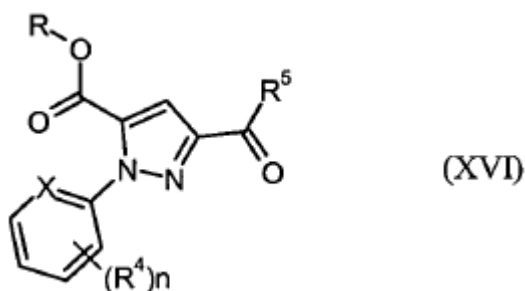
- 15 Los tetrazoles de fórmula (VIII) son conocidos, incluso obtenibles comercialmente en parte, o pueden obtenerse según procedimientos conocidos (véanse, por ejemplo, el documento WO2004/020445; William P. Norris, J. Org. Chem., 1962, 27 (9), 3248-3251; Henry C. Brown, Robert J. Kassal, J. Org. Chem., 1967, 32 (6), 1871-1873; Dennis P. Curran, Sabine Hadida, Sun-Young Kim, Tetrahedron, 1999, 55 (29), 8997-9006; L.D. Hansen, E.J. Baca, P. Scheiner, Journal of Heterocyclic Chemistry, 1970, 7, 991-996).

- 20 Los ésteres del ácido pirazolcarboxílico de fórmula (XIV) con nuevos. Pueden prepararse, por ejemplo, haciendo reaccionar derivados de alcohol de fórmula (XV)



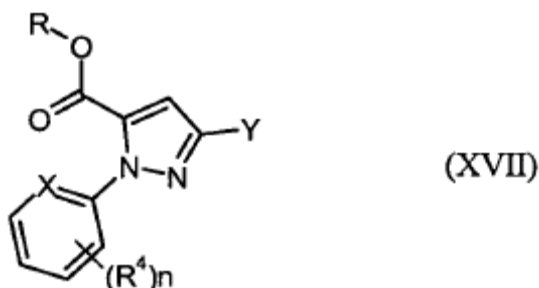
- 25 en la que X, R, R⁴, R⁵ y n tienen el significado anteriormente dado, con un cloruro de sulfonilo (por ejemplo, cloruro de metilsulfonilo o cloruro de toluenosulfonilo) o un agente de halogenación (por ejemplo, cloruro de tionilo) dado el caso en presencia de un disolvente (por ejemplo, diclorometano) y dado el caso en presencia de una base (por ejemplo, trietilamina o piridina).

Los derivados de alcohol de fórmula (XV) son nuevos. Pueden prepararse, por ejemplo, haciendo reaccionar derivados de cetona de fórmula (XVI)

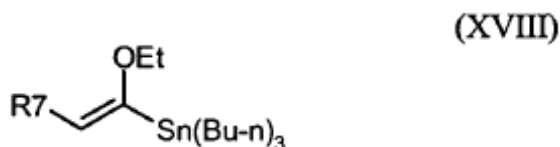


en la que X, R, R⁴, R⁵ y n tienen el significado anteriormente dado, con un agente de reducción adecuado (por ejemplo, borohidruro de sodio) en presencia de un disolvente (por ejemplo, etanol).

5 Los derivados de cetona de fórmula (XVI) son nuevos. Pueden prepararse, por ejemplo, haciendo reaccionar derivados de pirazol de fórmula (XVII)



10 en la que X, R, R⁴ y n tienen el significado anteriormente dado e Y representa cloro o bromo, con un derivado de estaño de fórmula (XVIII), en la que R⁷ representa H o alquilo C₁-C₃, en presencia de un metal de transición (por ejemplo, tetraquis(trifenilfosfina)paladio (0)) y una sal (por ejemplo, cloruro de litio) en presencia de un disolvente (por ejemplo, tetrahidrofurano).



Los derivados de estaño de fórmula (XVIII) son conocidos o comercialmente obtenibles.

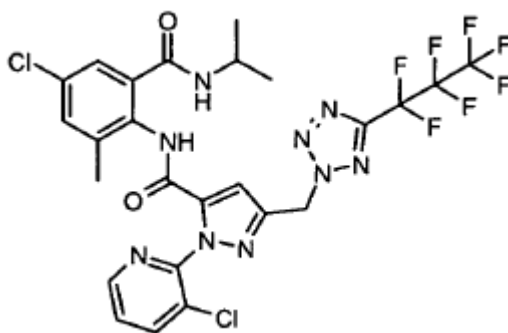
Los derivados de pirazol de fórmula (XVII) son conocidos o pueden obtenerse según procedimientos conocidos (véanse, por ejemplo, los documentos WO2004/033468, WO2003/015518, WO2003/016283).

15 Ejemplos de preparación

(Compuestos según la invención y compuestos de referencia)

Compuestos:

Síntesis de (4-cloro-2-isopropilcarbamoil-6-metil-fenil)-amida del ácido 2-(3-cloro-piridin-2-il)-5-(5-heptafluoropropil-tetrazol-2-ilmetil)-2H-pirazol-3-carboxílico (Ejemplo 1)



- 5 Se dispusieron 200 mg (0,3 mmol) de 6-cloro-2-[2-(3-cloro-piridin-2-il)-5-(5-heptafluoropropil-tetrazol-2-ilmetil)-2H-pirazol-3-il]-8-metilbenzo[d][1,3]oxazin-4-ona en 2 ml de tetrahidrofurano y se mezclaron con 0,08 ml (1 mmol) de isopropilamina. Se agitó la mezcla durante 1 h a 50 °C y se concentró después de enfriar. Después de purificar el residuo mediante cristalización o separación cromatográfica, pudo obtenerse el producto deseado (logP: 4,23, MH⁺: 682, RMN-¹H (400 MHz, DMSO, δ, ppm): 1,02 (d, 6H), 2,14 (s, 3H), 3,91 (m, 1H), 6,30 (s, 2H), 7,30 (m, 2H), 7,40 (d, 1H), 7,55 (dd, 1H), 7,77 (d, 1H), 8,08 (dd, 1H), 8,44 (dd, 1H), 10,07 (s, 1H)).

Los siguientes ejemplos pueden obtenerse de modo análogo:

- 10 Se dan a este respecto para el ejemplo número 1 las señales de RMN completas, para los demás ejemplos, una combinación de valor de logP, masa (MH⁺) y aquellas señales de RMN que se refieren a la parte de la molécula incorporada por último en el procedimiento.

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
1		4,23	682	DMSO: 1,02 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,91 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
2		3,75	654	DMSO: 2,67 (d, 3H, NHCH ₃)
3		3,49	640	DMSO: 7,40 (s ancho, 2H, NH ₂)
4		3,96	680	DMSO: 0,43 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,60 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,69 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
5		3,43	645	DMSO: 2,68 (d, 3H, NHCH ₃)

(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
6		3,82	673	DMSO: 1,04 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,92 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
7		3,17	631	DMSO: 7,43 (s ancho, 1H, NH ₂), 7,67 (s ancho, 1H, NH ₂)
8		3,65	679	DMSO: 4,15 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
9		3,50	580 (MH ⁺)	DMSO: 1,02 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,91 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
10		3,07	571 (MH ⁺)	DMSO: 1,04 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,92 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
11		3,05	552 (MH ⁺)	DMSO: 2,67 (d, 3H, NHCH ₃)
12		2,66	545	DMSO: 2,68 (d, 3H, NHCH ₃)
13		2,84	569 (MH ⁺)	CD ₃ CN: 0,53 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,72 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,77 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)

(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
14		3,28	617 (MH ⁺)	CD ₃ CN: 1,22 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,20 (s, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,61 (d, 2H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 4,16 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃)
15		3,40	585 (MH ⁺)	DMSO: 1,22 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
16		2,77	540	CD ₃ CN: 6,30 (s ancho, 2H, NH ₂)
17		2,45	531	CD ₃ CN: 6,33 (s ancho, 1H, NH ₂), 6,85 (s ancho, 1H, NH ₂)
18		2,61	570	CD ₃ CN: 4,16 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
19		2,93	579	CD ₃ CN: 4,14 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
20		3,33	599	DMSO: 0,11-0,38 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,84 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,06 (dd, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,34 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)

(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
21		2,85	559	DMSO: 1,01 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,17 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
22		3,27	619	DMSO: 1,10 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,20 (s, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,49 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,57 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 4,00 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃)
23		3,13	585	DMSO: 0,12 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,33 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,88 (m, 1H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 3,03 (t, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂)
24		3,18	585	DMSO: 1,61 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 1,95 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 2,15 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 4,22 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₃)
25		3,23	580	DMSO: 0,44 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,59 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,70 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
26		3,30	624	DMSO: 0,44 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,59 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,70 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
27		2,87	564	DMSO: 0,43 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,60 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,69 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
28		3,05	598	DMSO: 2,63 (d, 3H, NHCH ₃)

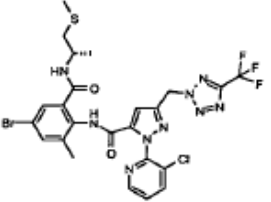
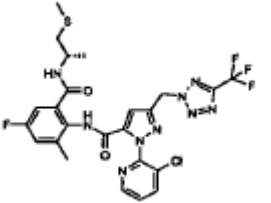
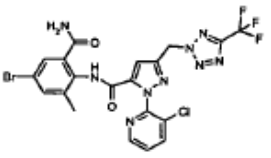
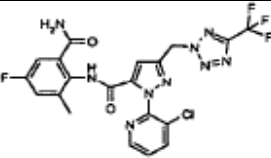
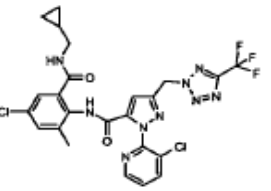
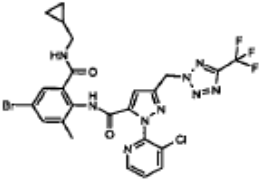
(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
29		2,66	538	DMSO: 2,67 (d, 3H, NHCH ₃)
30		3,79	608	DMSO: 0,09-0,37 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,82 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,05 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,33 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
31		3,89	652	DMSO: 0,09-0,37 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,81 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,05 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,32 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
32		3,41	592	DMSO: 0,08-0,36 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,83 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,05 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,33 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
33		3,23	568	DMSO: 1,00 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,15 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
34		3,32	612	DMSO: 1,00 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,14 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
35		2,88	552	DMSO: 1,00 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,15 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₃)

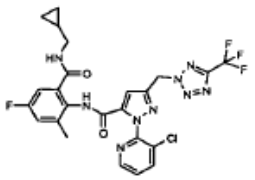
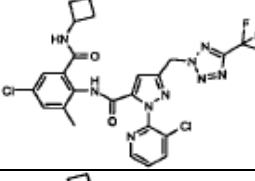
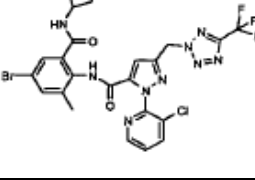
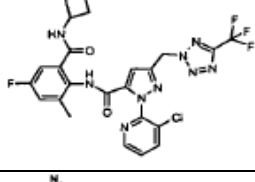
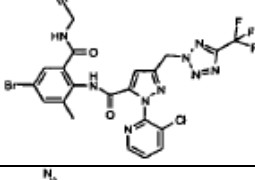
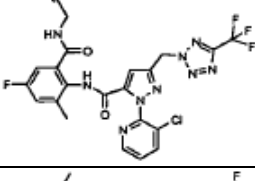
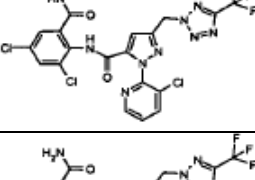
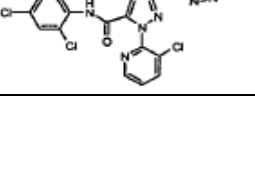
(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
36		3,74	596	DMSO: 0,75 (t, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃), 0,96 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃), 1,30-1,39 (m, 2H, NHCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃), 3,69-3,74 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃)
37		3,78	596	DMSO: 0,79 (d, 6H, NHCH ₂ CH(CH ₃) ₂), 1,67-1,76 (m, 1H, NHCH ₂ CH(CH ₃) ₂), 2,94-2,97 (dd, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₃) ₂)
38		3,37	587	DMSO: 0,81 (d, 6H, NHCH ₂ CH(CH ₃) ₂), 1,69-1,75 (m, 1H, NHCH ₂ CH(CH ₃) ₂), 2,95-2,97 (dd, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₃) ₂)
39		3,57	626	DMSO: 1,02 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,90 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
40		3,11	566	DMSO: 1,01 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,90 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
41		3,68	628	DMSO: 1,10 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,15 (s, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,47 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,54 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 3,98 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃)

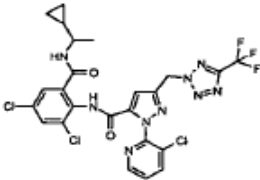
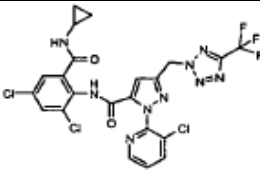
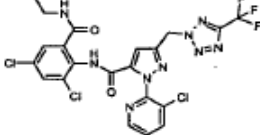
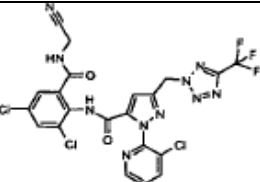
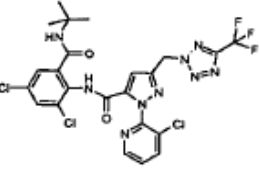
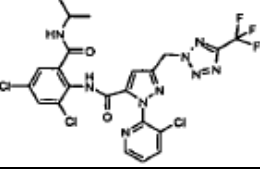
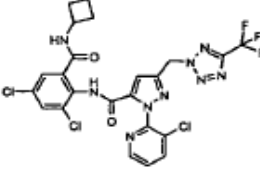
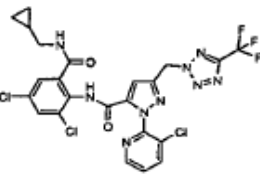
(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
42		3,77	672	DMSO: 1,10 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,15 (s, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,47 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,54 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 3,97 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃)
43		3,31	612	DMSO: 1,09 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,16 (s, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,44 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,54 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 3,98 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃)
44		2,81	584	DMSO: 7,32 (s ancho, 1H, NH ₂), 7,53 (s ancho, 1H, NH ₂)
45		2,46	524	DMSO: 7,37 (s ancho, 2H, NH ₂)
46		3,53	594	DMSO: 0,11 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,31 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,87 (m, 1H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 3,01 (t, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂)
47		3,88	638	DMSO: 0,10 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,31 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,88 (m, 1H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 3,01 (t, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂)

(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
48		3,18	578	DMSO: 0,11 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,30 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,88 (m, 1H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 3,02 (t, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂)
49		3,60	594	DMSO: 1,62 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 1,98 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 2,10 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 4,22 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₃)
50		3,71	638	DMSO: 1,62 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 1,90 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 2,10 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 4,21 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₃)
51		3,23	578	DMSO: 1,61 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 1,88 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 2,10 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 4,22 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₃)
52		3,02	623	DMSO: 4,14 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
53		2,67	563	DMSO: 4,15 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
54		2,93	575	DMSO: 2,68 (d, 3H, NHCH ₃)
55		2,72	560	DMSO: 7,42 (s ancho, 1H, NH ₂), 7,53 (s ancho, 1H, NH ₂)

(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
56		3,71	628	DMSO: 0,09-0,37 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,82 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,04 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,30 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
57		3,18	600	DMSO: 0,42 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,60 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,66 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
58		3,17	588	DMSO: 0,98 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,14 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
59		2,92	599	DMSO: .4,15 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
60		3,78	616	DMSO: 1,26 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
61		3,41	602	DMSO: 1,01 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,88 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
62		3,51	614	DMSO: 1,62 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 1,87 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 2,11 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 4,18 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₃)
63		3,47	614	DMSO: 0,11 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,30 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,85 (m, 1H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 2,99 (t, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂)

(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
64		3,62	648	DMSO: 1,09 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,00 (s, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,44 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,53 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 3,94 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃)
65		3,21	646	DMSO: 2,65 (d, 3H, NHCH ₃)
66		3,47	660	DMSO: 1,00 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,14 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
67		2,95	632	DMSO: 7,31 (s ancho, 1H, NH ₂), 7,51 (s ancho, 1H, NH ₂)
68		4,01	700	DMSO: 0,10-0,37 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,81 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,05 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,32 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
69		3,46	672	DMSO: 0,43 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,59 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,68 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
70		3,14	671	DMSO: 4,14 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
71		3,73	674	DMSO: 1,02 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,90 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)

(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
72		3,85	686	DMSO: 1,63 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 1,91 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 2,12 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 4,21 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₃)
73		3,78	686	DMSO: 0,12 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,31 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,88 (m, 1H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 3,01 (t, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂)
74		3,90	720	DMSO: 1,10 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,10 (s, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,49 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,55 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 3,97 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃)
75		3,38	641	DMSO: 1,11 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ CF ₃), 2,24-2,37 (m, 2H, NHCH(CH ₃)CH ₂ CF ₃), 4,12-4,17 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ CF ₃)
76		2,39	601	DMSO: 0,58-0,65 (m, 2H, NHCH(CH ₂)CHCH ₂ OH), 1,11-1,20 (m, 1H, NHCH(CH ₂)CHCH ₂ OH), 2,60-2,64 (m, 1H, NHCH(CH ₂)CHCH ₂ OH), 3,28-3,42 (m, 2H, NHCH(CH ₂)CHCH ₂ OH), 4,22 (t, 1H, NHCH(CH ₂)CHCH ₂ OH)
77		3,14	611	DMSO: 4,34 (d, 2H, NHCH ₂ C ₄ H ₉ O), 6,22 (1H, NHCH ₂ C ₄ H ₉ O), 6,31 (1H, NHCH ₂ CH ₃ O), 7,46 (1H, NHCH ₂ CH ₃ O)

(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
78		2,81	534	DMSO: 2,67 (d, 3H, NHCH ₃)
79		3,29	562	DMSO: 1,02 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,92 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
80		2,62	520	DMSO: 7,24 (s ancho, 2H, NH ₂)
81		3,06	548	DMSO: 1,10 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,15 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
82		3,59	588	DMSO: 0,08-0,36 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,81 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,05 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,34 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
83		3,35	574	DMSO: 0,11 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,30 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,87 (m, 1H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 3,02 (t, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂)
84		3,42	574	DMSO: 1,62 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 1,89 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 2,14 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 4,24 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₃)
85		2,83	559	DMSO: 4,14 (d, 2H, NHCH ₂ CN)

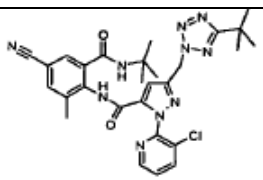
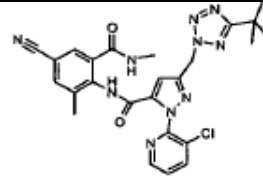
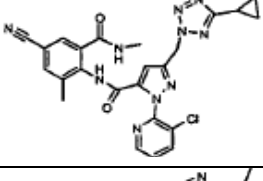
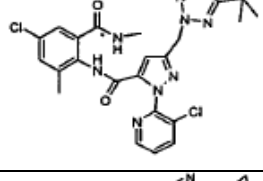
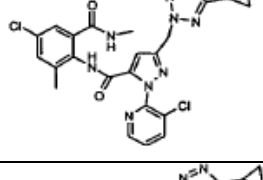
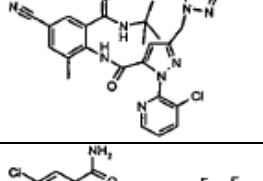
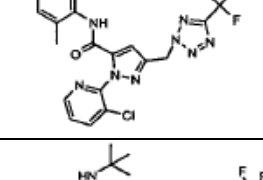
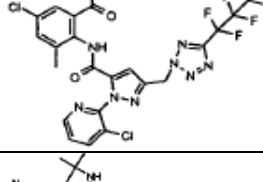
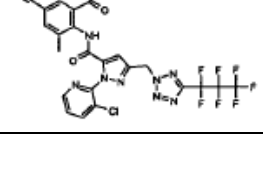
(continuación)

N° Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
86		3,50	608	DMSO: 1,10 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,36 (s, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,46 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,54 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 3,99 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃)
87		3,65	625	DMSO: 0,21 (m, 6H, NHCH(CH(CH ₂) ₂) ₂), 0,37, (m, 2H, NHCH(CH(CH ₂) ₂) ₂), 0,91 (m, 2H, NHCH(CH(CH ₂) ₂) ₂), 2,96 (q, 1H, NHCH(CH(CH ₂) ₂) ₂)
88		3,50	653	
89		3,46	599	
90		3,63	613	DMSO: 1,10 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₃), 1,72-2,01 (m, 6H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₃), 2,39 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₃), 3,06 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₃)
91		2,91	595	DMSO: 3,52 (m, 2H, NHCH ₂ CHF ₂), 5,88 (tt, 1H, NHCH ₂ CHF ₂)
92		2,73	589	DMSO: 3,18 (s, 3H, NHCH ₂ CH ₂ OCH ₃), 3,27-3,68 (m, 4H, NHCH ₂ CH ₂ OCH ₃)

(continuación)

N° Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
93		3,96	627	DMSO: 0,82-1,63 (m, 11H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₅), 3,00 (t, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₅)
94		2,71	631	DMSO: 121-1,49 (m, 8H, NHCH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₂ OH), 3,19 (t, 1H, NHCH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₂ OH), 3,37 (m, 4H, NHCH ₂ (CH ₂) ₄ CH ₂ OH)
95		3,12	617	DMSO: 1,02 (s, 6H, NHCH ₂ C(CH ₃) ₂ OCH ₃), 3,04 (s, 3H, NHCH ₂ C(CH ₃) ₂ OCH ₃), 3,20 (d, 2H, NHCH ₂ C(CH ₃) ₂ OCH ₃)
96		2,90	569	DMSO: 2,94 (t, 1H, NHCH ₂ C≡CH), 3,94 (m, 2H, NHCH ₂ C≡CH)
97		3,32	587	DMSO: 0,78 (t, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃), 1,00 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃), 1,33-1,42 (m, 2H, NHCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃), 3,71-3,78 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃)
98		2,95	603	DMSO: 1,01 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃), 3,18 (s, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃), 3,27-3,30 (m 2H, NHCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃), 3,97-4,03 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃)
99		3,09	611	DMSO: 4,19 (d, 2H, NHCH ₂ C ₄ H ₃ O), 6,27 (1H, NHCH ₂ C ₄ H ₃ O), 6,37 (1H, NHCH ₂ C ₄ H ₃ O), 7,46 (1H, NHCH ₂ C ₄ H ₃ O)

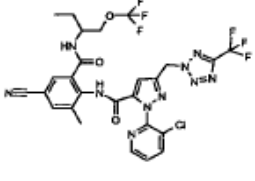
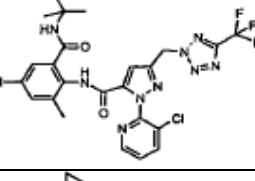
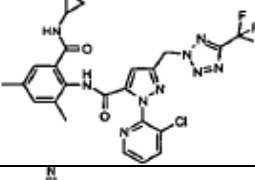
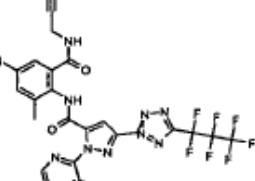
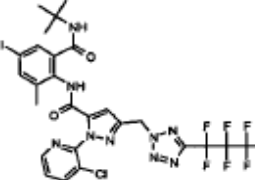
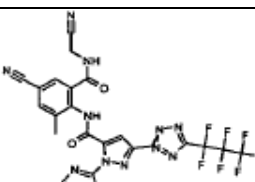
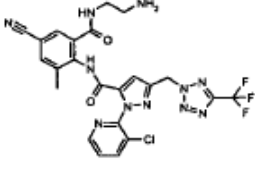
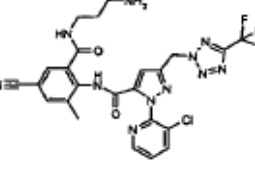
(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
100		3,44	575	DMSO: 1,21 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
101		2,62	533	DMSO: 2,63 (d, 3H, NHCH ₃)
102		2,15	517	DMSO: 2,66 (d, 3H, NHCH ₃)
103		3,02	542	DMSO: 2,66 (d, 3H, NHCH ₃)
104		2,52	526	DMSO: 2,68 (d, 3H, NHCH ₃)
105		2,93	559	DMSO: 1,24 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
106		2,76	540	CD ₃ CN: 6,30 (s ancho, 2H, NH ₂)
107		4,60	696	CD ₃ CN: 1,29 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
108		4,16	687	CD ₃ CN: 1,33 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)

(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
109		4,48	774	CD ₃ CN: 1,12 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 4,02 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
110		3,70	732	CD ₃ CN: 6,19 (s ancho, 1H, NH ₂), 6,72 (s ancho, 1H, NH ₂)
111		4,23	772	CD ₃ CN: 0,50 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,69 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,73 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
112		3,99	746	CD ₃ CN: 2,78 (d, 3H, NHCH ₃)
113		3,58	671	CD ₃ CN: 0,53 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,72 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,76 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
114		4,00	640	DMSO: 1,21 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
115		3,51	580	DMSO: 1,21 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
116		3,35	619	DMSO: 0,83 8s, 6H, NHCH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ F), 2,19 (s, 2H, NHCH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ F), 4,02 (s, 1H, NHCH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ F), 4,14 (s, 1H, NHCH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ F)

(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
117		3,74	671	DMSO: 0,81 (t, 3H, NHCH(CH ₂ CH ₃)CH ₂ OCF ₃), 1,39-1,58 (m, 2H, NHCH(CH ₂ CH ₃)CH ₂ OCF ₃), 3,92 (d, 2H, NHCH(CH ₂ CH ₃)CH ₂ OCF ₃), 4,03 (m, 1H, NHCH(CH ₂ CH ₃)CH ₂ OCF ₃)
118		4,12	688	DMSO: 1,21 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
119		3,04	560	DMSO: 0,42 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,59 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,69 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
120		3,86	771	CD ₃ CN: 4,13 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
121		4,86	788	CD ₃ CN: 1,29 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
122		3,33	670	CD ₃ CN: 4,16 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
123		1,63	574	
124		1,63	588	DMSO: 1,62 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₂ CH ₂ NH ₂), 2,69 (t, 2H, NHCH ₂ CH ₂ CH ₂ NH ₂), 3,23 (t, 2H, NHCH ₂ CH ₂ CH ₂ NH ₂)

(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
125		3,39	604	DMSO: 2,66 (d, 3H, NHCH ₃)
126		4,25	658	DMSO: 0,09-0,36 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,83 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,04 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,30 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
127		3,70	630	DMSO: 0,43 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,59 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,66 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
128		3,65	618	DMSO: 0,99 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,15 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
129		3,94	632	DMSO: 1,02 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,91 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
130		3,15	590	DMSO: 7,29-7,58 (s ancho, 2H, NH ₂)
131		3,93	644	DMSO: 0,11 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,29 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,88 (m, 1H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 3,00 (t, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂)
132		4,03	644	DMSO: 1,63 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 1,89 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 2,08 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 4,22 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₃)
133		3,32	629	DMSO: 4,15 (d, 2H, NHCH ₂ CN)

(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
134		3,84	649	DMSO: 0,09-0,38 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,84 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,07 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,34 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
135		3,55	623	DMSO: 1,03 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,91 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
136		3,86	637	DMSO: 1,22 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
137		2,83	581	DMSO: 7,44 (s ancho, 1H, NH ₂), 7,70 (s ancho, 1H, NH ₂)
138		3,56	635	DMSO: 0,12 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,31 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,78 (m, 1H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 2,90 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂)
139		3,61	635	DMSO: 1,64 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 1,93 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 2,13 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 4,22 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₃)
140		3,64	695	DMSO: 2,65 (d, 3H, NHCH ₃)
141		4,42	750	DMSO: 0,10-0,48 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,82 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,05 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,29 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)

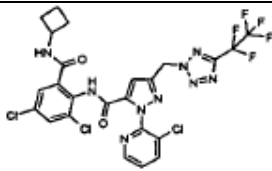
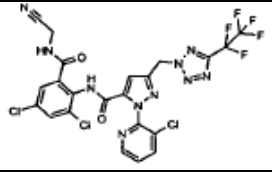
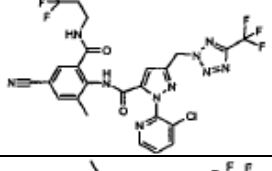
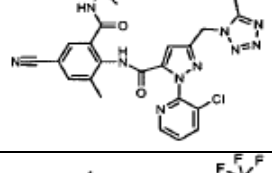
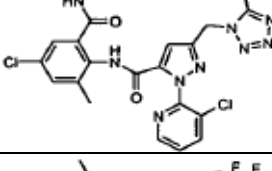
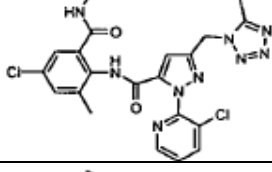
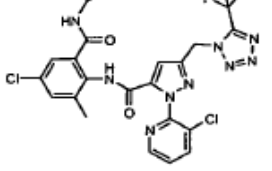
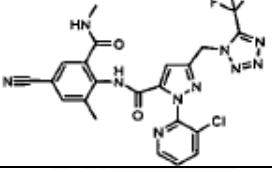
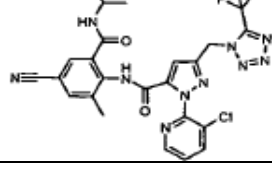
(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
142		4,19	723	DMSO: 1,01 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,90 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
143		3,50	647	DMSO: 2,66 (d, 3H, NHCH ₃)
144		4,29	702	DMSO: 0,10-0,48 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,81 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,05 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,33 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
145		3,74	674	DMSO: 0,42 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,59 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,68 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
146		3,95	676	DMSO: 1,01 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,90 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
147		3,09	588	DMSO: 2,66 (d, 3H, NHCH ₃)
148		3,80	642	DMSO: 0,10-0,35 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,80 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,03 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,31 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
149		3,59	616	DMSO: 1,01 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,90 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)

(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
150		4,12	678	DMSO: 0,10-0,36 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,80 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,05 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,29 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
151		3,57	650	DMSO: 0,41 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,61 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,66 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
152		357	638	DMSO: 0,97 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,18 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
153		3,81	652	DMSO: 1,01 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,88 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
154		4,02	698	DMSO: 1,07 (dd, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,01 (s, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,46 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,54 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 3,94 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃)
155		3,13	610	DMSO: 7,41 (s ancho, 1H, NH ₂), 7,51 (s ancho, 1H, NH ₂)
156		3,88	664	DMSO: 0,11 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,31 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,85 (m, 1H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 3,01 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂)

(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
157		3,92	664	DMSO: 1,62 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 1,90 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 2,12 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 4,18 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₃)
158		3,32	649	DMSO: 4,15 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
159		3,22	627	DMSO: 2,42 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₂ CF ₃), 3,33 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₂ CF ₃)
160		3,05	587	DMSO: 1,22 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
161		2,63	554	DMSO: 2,66 (d, 3H, NHCH ₃)
162		3,12	582	DMSO: 1,01 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,88 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
163		2,89	580	DMSO: 0,43 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,60 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,68 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
164		2,29	645	DMSO: 2,67 (d, 3H, NHCH ₃)
165		2,72	573	DMSO: 1,04 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,92 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)

(continuación)

N° Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
166		2,53	571	DMSO: 0,45 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,62 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,70 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
167		2,32	538	DMSO: 2,66 (d, 3H, NHCH ₃)
168		2,76	566	DMSO: 1,02 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,91 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
169		2,57	564	DMSO: 0,42 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,60 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,68 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
170		2,72	598	DMSO: 2,66 (d, 3H, NHCH ₃)
171		3,22	626	DMSO: 1,03 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,90 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
172		2,86	646	DMSO: 2,66 (d, 3H, NHCH ₃)
173		3,36	674	DMSO: 1,02 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,91 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)

(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
174		3,12	672	DMSO: 0,43 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,60 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,67 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
175		3,08	602	DMSO: 1,01 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,88 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
176		2,85	600	DMSO: 0,41 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,60 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,66 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
177		3,43	616	DMSO: 1,20 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
178		2,48	534	DMSO: 2,69 (d, 3H, NHCH ₃)
179		2,94	562	DMSO: 1,02 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,92 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
180		2,71	560	DMSO: 0,42 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,60 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,69 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
181		2,99	624	DMSO: 0,43 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,60 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,68 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)

(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
182		3,62	640	DMSO: 1,22 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
183		3,74	688	DMSO: 1,29 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
184		2,63	574	DMSO: 2,64 (d, 3H, NHCH ₃)
185		3,00	599	DMSO: 0,14-0,37 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,83 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,13 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,35 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
186		2,83	585	DMSO: 1,65 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 1,91 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 2,15 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 4,23 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₃)
187		2,48	569	DMSO: 2,94 (t, 1H, NHCH ₂ C≡CH), 3,94 (m, 2H, NHCH ₂ C≡CH)
188		2,88	627	DMSO: 2,40 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₂ CF ₃), 3,35 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₂ CF ₃)

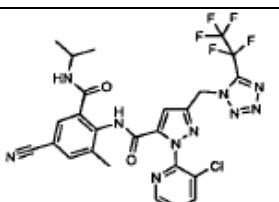
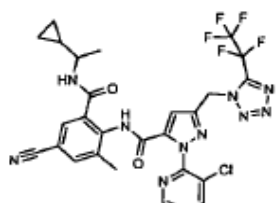
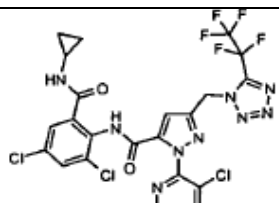
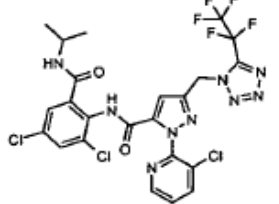
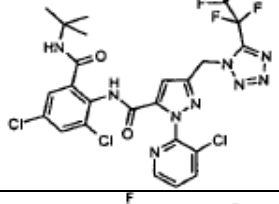
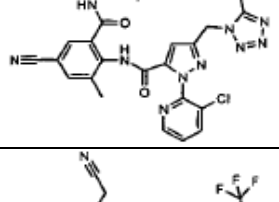
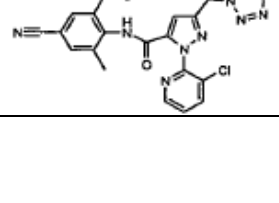
(continuación)

N° Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
189		2,74	617	DMSO: 1,02 (s, 6H, NHCH ₂ C(CH ₃) ₂ OCH ₃), 3,04 (s, 3H, NHCH ₂ C(CH ₃) ₂ OCH ₃), 3,22 (d, 2H, NHCH ₂ C(CH ₃) ₂ OCH ₃)
190		3,16	654	
191		2,50	559	DMSO: 1,02 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,16 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
192		2,12	531	DMSO: 7,45 (s ancho, 1H, NH ₂), 7,70 (s ancho, 1H, NH ₂)
193		2,92	619	DMSO: 1,13 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,18 (s, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,47 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,56 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 3,98 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃)
194		3,25	613	DMSO: 1,11 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₃), 1,72-2,01 (m, 6H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₃), 2,48 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₃), 3,10 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₃)

(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
195		3,26	628	DMSO: 1,05-1,81 (m, 11H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₅), 3,62 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₅)
196		3,28	625	DMSO: 0,18-0,41 (m, 8H, NHCH(CH(CH ₂) ₂) ₂), 0,92 (m, 2H, NHCH(CH(CH ₂) ₂) ₂), 3,02 (m, 1H, NHCH(CH(CH ₂) ₂) ₂)
197		3,47	596	CD ₃ CN: 1,30 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
198		3,10	604	DMSO: 2,66 (d, 3H, NHCH ₃)
199		3,88	658	DMSO: 0,11-0,37 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,82 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,06 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,33 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
200		3,32	630	DMSO: 0,42 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,60 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,68 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
201		3,59	632	DMSO: 1,02 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,91 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)

(continuación)

N° Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
202		3,14	623	DMSO: 1,04 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,91 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
203		3,48	649	DMSO: 0,11-0,38 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,84 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,07 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,91 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
204		3,24	650	DMSO: 0,41 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,61 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,66 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
205		3,52	652	DMSO: 1,06 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,88 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
206		3,88	666	DMSO: 1,20 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
207		2,57	595	DMSO: 3,52 (m, 2H, NHCH ₂ CHF ₂), 5,88 (tt, 1H, NHCH ₂ CHF ₂)
208		2,31	570	DMSO: 4,16 (d, 2H, NHCH ₂ CN)

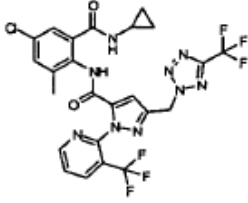
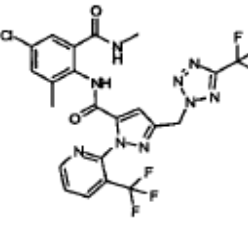
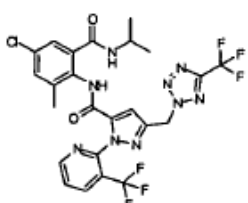
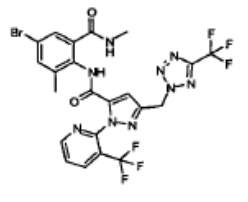
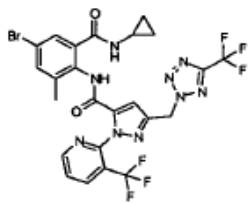
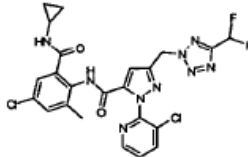
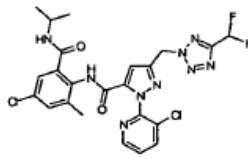
(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
209		2,40	589	DMSO: 3,18 (s, 3H, NHCH ₂ CH ₂ OCH ₃), 3,27-3,37 (m, 4H, NHCH ₂ CH ₂ OCH ₃)
210		3,01	620	DMSO: 4,16 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
211		2,99	603	DMSO: 1,05 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃), 3,27-3,40 (m, 6H, NHCH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃)
212		4,09	678	DMSO: 1,08 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,15 (s, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,47 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,51 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 3,98 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃)
213		3,05	595	DMSO: 2,68 (d, 3H, NHCH ₃)
214		3,26	621	DMSO: 0,46 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,60 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,71 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
215		3,24	609	DMSO: 1,02 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,16 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
216		3,68	669	DMSO: 1,10 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,21 (s, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,48 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,51 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 3,98 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃)

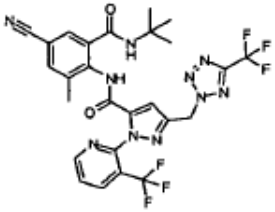
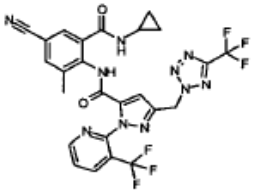
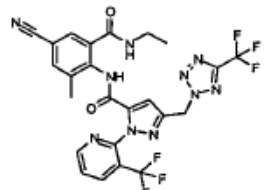
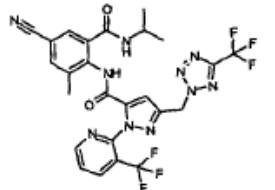
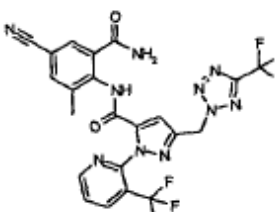
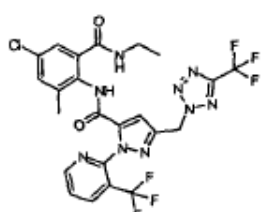
(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
217		(CH ₂) ₂ , 2,66 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)		DMSO: 0,43 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,59 (m, 2H, NHCH
218		4,50	738	DMSO: 1,21 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
219		4,36	690	DMSO: 1,28 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
220		3,30	614	DMSO: 0,42 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,59 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,66 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
221		3,88	630	DMSO: 1,21 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
222		3,34	624	DMSO: 2,65 (d, 3H, NHCH ₃)
223		4,16	666	DMSO: 1,20 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
224		4,00	630	DMSO: 1,20 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)

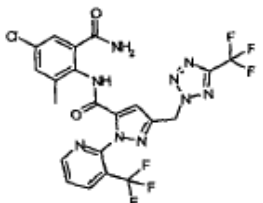
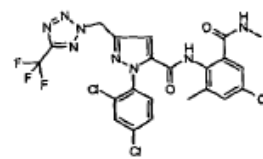
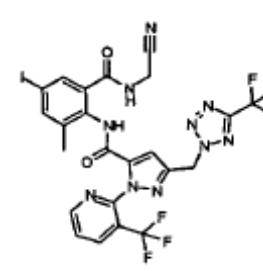
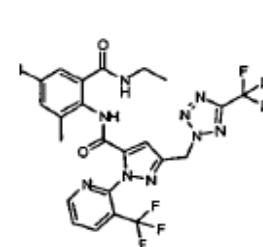
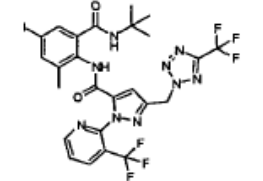
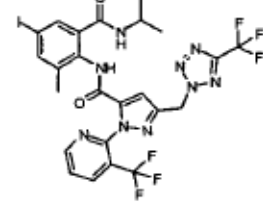
(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
225		3,39	614	DMSO: 0,40-0,44 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,55-0,61 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,62-2,67 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
226		3,16	588	DMSO: 2,64 (d, 3H, NHCH ₃)
227		3,64	616	DMSO: 0,99 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,92 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
228		3,28	632	DMSO: 2,64 (d, 3H, NHCH ₃)
229		3,52	658	DMSO: 0,37-0,42 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,55-0,60 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,62-2,67 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
230		2,72	562	DMSO: 0,41 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,59 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,66 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
231		2,95	564	DMSO: 1,00 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,87 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)

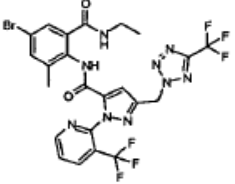
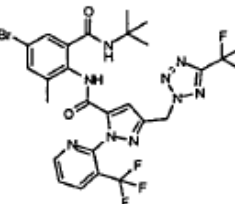
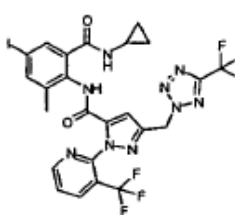
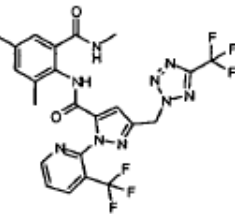
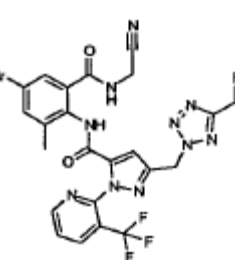
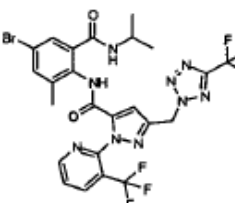
(continuación)

N° Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
232		3,59	621	DMSO: 1,21 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
233		3,07	605	DMSO: 0,39-0,43 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,57-0,62 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,65-2,69 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
234		3,07	593	DMSO: 0,98 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,13 (q, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
235		3,28	607	DMSO: 1,00 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,84-3,91 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
236		2,67	565	DMSO: 7,56 (s ancho, 1H, NH ₂), 7,85 (s ancho, 1H, NH ₂)
237		3,43	602	DMSO: 0,96 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,12 (q, 2H, NHCH ₂ CH ₃)

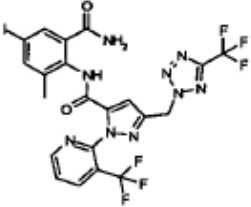
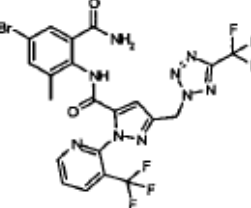
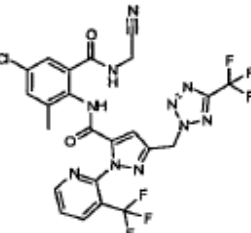
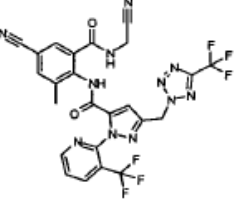
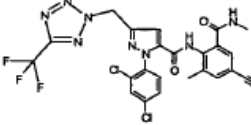
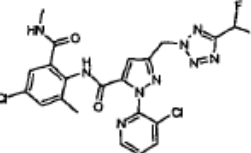
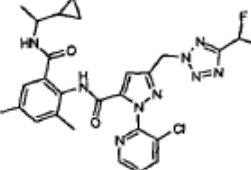
(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
238		2,97	574	DMSO: 7,46 (s ancho, 1H, NH ₂), 7,70 (s ancho, 1H, NH ₂)
239		3,97	588	DMSO: 2,65 (d, 3H, NHCH ₃)
240			705	DMSO: 4,13 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
241			694	DMSO: 0,99 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,14 (q, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
242		4,25	722	DMSO: 1,21 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
243		3,90	707	DMSO: 0,97 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,83-3,88 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)

(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
244		3,52	647	DMSO: 0,99 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,14 (q, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
245		4,13	675	DMSO: 1,22 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
246			706	DMSO: 0,40-0,46 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,57-0,61 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,65-2,70 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
247		3,40	680	DMSO: 2,65 (d, 3H, NHCH ₃)
248		3,21	657	DMSO: 4,14 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
249		3,76	660	0,99 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,83-3,90 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)

(continuación)

N° Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
250		3,16	666	DMSO: 7,33 (s ancho, 1H, NH ₂), 7,42 (s ancho, 1H, NH ₂)
251		3,04	619	DMSO: 7,31 (s ancho, 1H, NH ₂), 7,54 (s ancho, 1H, NH ₂)
252		3,28	613	DMSO: 4,14 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
253		2,81	604	DMSO: 4,15 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
254		3,60	579	DMSO: 2,67 (d, 3H, NHCH ₃)
255		2,46	536	DMSO: 2,67 (d, 3H, NHCH ₃)
256		3,24	590	DMSO: 0,10-0,37 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,83 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,07 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,33 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)

(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
257		2,69	550	DMSO: 1,00 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,15 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
258		3,32	578	DMSO: 1,21 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
259		3,04	576	DMSO: 0,12 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,32 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,90 (m, 1H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 3,01 (t, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂)
260		3,09	576	DMSO: 1,62 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 1,93 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 2,11 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 4,23 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₃)
261		2,50	561	DMSO: 4,15 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
262		2,17	527	DMSO: 2,68 (d, 3H, NHCH ₃)
263		2,86	581	DMSO: 0,12-0,38 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,84 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,07 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,39 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
264		2,39	553	DMSO: 0,42 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,58 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,67 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)

(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
265		2,36	541	DMSO: 1,01 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,16 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
266		2,58	555	DMSO: 1,04 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,92 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
267		2,88	569	DMSO: 1,23 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
268		2,77	601	DMSO: 1,10 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,21 (s, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,46 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,58 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 3,98 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃)
269		2,66	567	DMSO: 0,14 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,33 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,90 (m, 1H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 3,03 (t, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂)
270		2,70	567	DMSO: 1,63 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 1,94 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 2,13 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 4,22 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₃)
271		2,19	552	DMSO: 4,16 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
272		2,53	614	DMSO: 7,25-7,60 (s ancho, 2H, NH ₂)

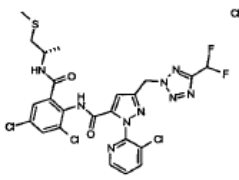
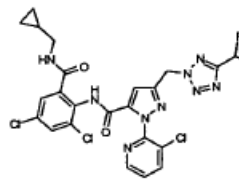
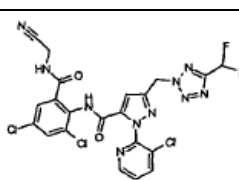
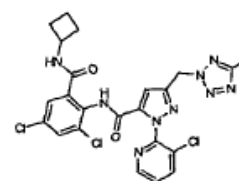
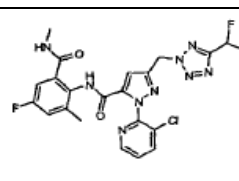
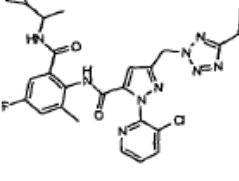
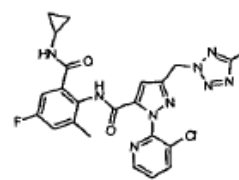
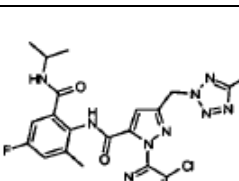
(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
273		2,73	628	DMSO: 2,69 (d, 3H, NHCH ₃)
274		3,52	682	DMSO: 0,09-0,41 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,81 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,05 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,32 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
275		2,96	654	DMSO: 0,44 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,60 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,69 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
276		2,98	642	DMSO: 1,01 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,12 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
277		3,20	656	DMSO: 1,07 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,91 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
278		3,41	702	DMSO: 1,11 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,12 (s, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,47 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,56 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 3,97 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃)
279		3,27	668	DMSO: 0,12 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,32 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,88 (m, 1H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 3,10 (t, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂)

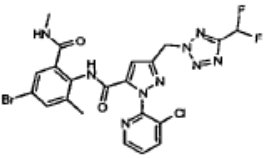
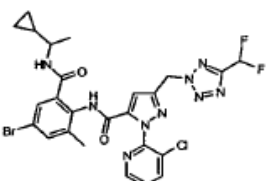
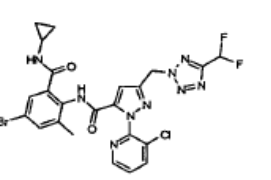
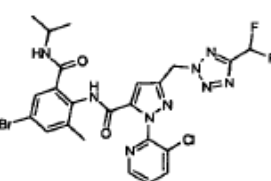
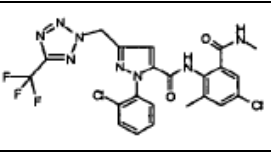
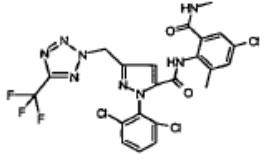
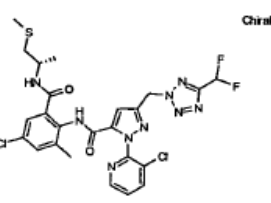
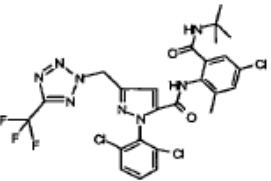
(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
280		3,34	668	DMSO: 1,59 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 1,90 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 2,13 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 4,22 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₃)
281		2,68	653	DMSO: 4,14 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
282		2,48	556	DMSO: 2,65 (d, 3H, NHCH ₃)
283		3,23	610	DMSO: 0,10-0,37 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,80 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,11 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,30 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
284		2,70	582	DMSO: 0,42 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,60 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,67 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
285		2,70	570	DMSO: 0,98 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,13 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
286		2,91	584	DMSO: 1,01 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,89 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
287		3,28	598	DMSO: 1,21 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)

(continuación)

N° Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
288		3,13	630	DMSO: 1,07 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,00 (s, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,45 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,55 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 3,94 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃)
289		3,01	596	DMSO: 0,10 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,30 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,85 (m, 1H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 2,99 (t, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂)
290		2,48	581	DMSO: 4,15 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
291		3,06	596	DMSO: 1,62 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 1,89 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 2,13 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₃), 4,20 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₃)
292		2,21	520	DMSO: 2,66 (d, 3H, NHCH ₃)
293		2,92	574	DMSO: 0,11-0,40 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,81 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,05 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,33 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
294		2,41	546	DMSO: 0,43 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,59 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,68 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
295		2,64	548	DMSO: 1,02 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,92 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)

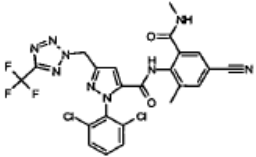
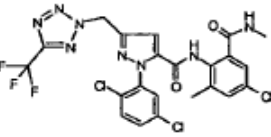
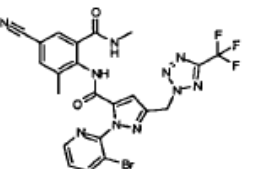
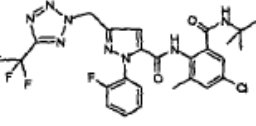
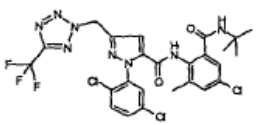
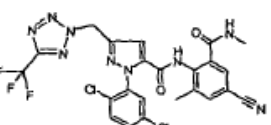
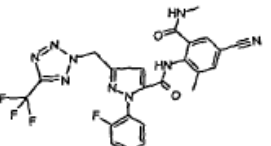
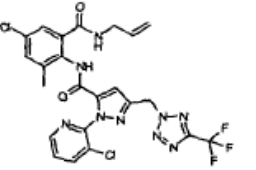
(continuación)

N° Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
296		2,61	580	DMSO: 2,66 (d, 3H, NHCH ₃)
297		3,36	634	DMSO: 0,11-0,37 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,83 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,05 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,33 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
298		2,85	606	DMSO: 0,43 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,59 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,68 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
299		3,08	608	DMSO: 1,02 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,91 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
300		3,47	554	DMSO: 2,66 (d, 3H, NHCH ₃)
301		3,32	588	DMSO: 2,64 (d, 3H, NHCH ₃)
302		3,18	610	DMSO: 1,11 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,15 (s, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,45 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,55 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 3,98 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃)
303		4,50	630	DMSO: 1,20 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)

(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
304		2,32	522	DMSO: 7,23-7,60 (s ancho, 2H, NH ₂)
305		2,31	542	DMSO: 7,34-7,60 (s ancho, 2H, NH ₂)
306		1,97	513	DMSO: 7,35-7,52 (s ancho, 1H, NH ₂), 7,60-7,80 (s ancho, 1H, NH ₂)
307		3,50	670	DMSO: 1,21 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
308		2,90	562	DMSO: 1,21 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
309		3,36	622	DMSO: 1,22 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
310		3,09	544	DMSO: 2,67 (d, 3H, NHCH ₃)
311		3,32	537	DMSO: 2,67 (d, 3H, NHCH ₃)

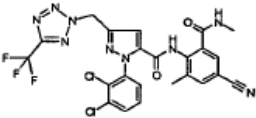
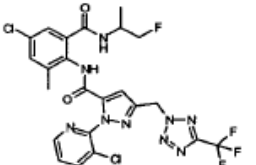
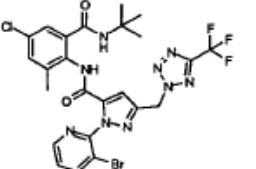
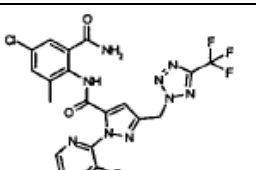
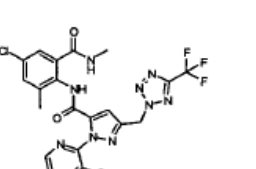
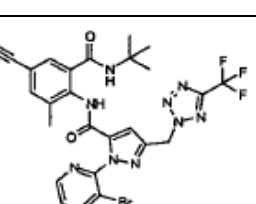
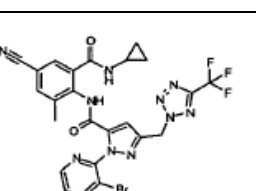
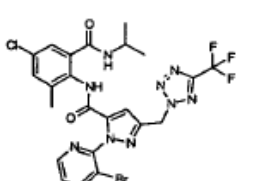
(continuación)

N° Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
312		3,28	579	DMSO: 2,66 (d, 3H, NHCH ₃)
313		3,93	588	DMSO: 2,66 (d, 3H, NHCH ₃)
314		2,58	589	DMSO: 2,79 (d, 3H, NHCH ₃)
315		4,17	588	DMSO: 1,21 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
316		4,77	630	DMSO: 1,21 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
317		3,48	579	DMSO: 2,67 (d, 3H, NHCH ₃)
318		2,92	528	DMSO: 2,68 (d, 3H, NHCH ₃)
319		3,34	581	DMSO: 4,99 (d, 2H, NHCH ₂ CH=CH ₂), 5,13 (d, 2H, NHCH ₂ CH=CH ₂), 5,71-5,79 (m, 1H, NHCH ₂ CH=CH ₂)

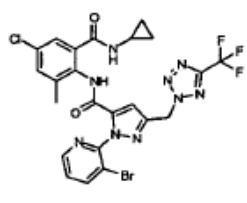
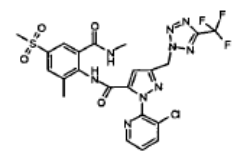
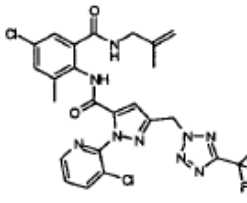
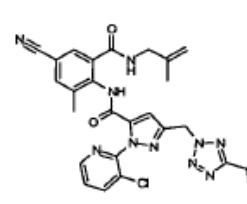
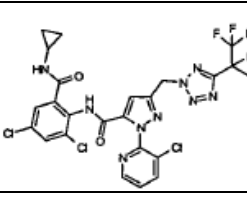
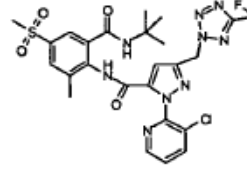
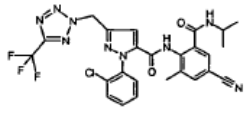
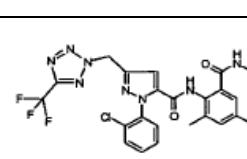
(continuación)

N° Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
320		2,97	572	DMSO: 5,01 (d, 2H, NHCH ₂ CH=CH ₂), 5,13 (d, 2H, NHCH ₂ CH=CH ₂), 5,71-5,80 (m, 1H, NHCH ₂ CH=CH ₂)
321		3,05	610	DMSO: 0,26-0,58 (m, 4H, NHCH(CN)CH(CH ₂) ₂), 1,26 (m, 1H, NHCH(CN)CH(CH ₂) ₂), 4,39 (m, 1H, NHCH(CN)CH(CH ₂) ₂),
322		2,88	603	DMSO: 1,01 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,15 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
323		3,10	617	DMSO: 1,04 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,89-3,95 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
324		2,46	575	DMSO: 7,45 (s ancho, 1H, NH ₂), 7,70 (s ancho, 1H, NH ₂)
325		2,72	623	DMSO: 4,15 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
326		2,76	584	DMSO: 1,37 (d, 3H, NHCH(CN)CH ₃), 4,78 (m, 1H, NHCH(CN)CH ₃)

(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
327		3,40	579	DMSO: 2,67 (d, 3H, NHCH ₃)
328		3,30	601	DMSO: 1,06 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ F), 4,06-4,36 (m, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ F)
329		3,88	640	DMSO: 1,22 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
330		2,76	584	DMSO: 7,30 (s ancho, 1H, NH ₂), 7,50 (s ancho, 1H, NH ₂)
331		3,01	598	DMSO: 2,67 (d, 3H, NHCH ₃)
332		3,43	631	DMSO: 1,21 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
333		2,85	616	DMSO: 0,40-0,44 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,57-0,62 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,64-2,70 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
334		3,49	626	DMSO: 1,02 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,88-3,94 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)

(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
335		3,25	624	DMSO: 0,43-0,46 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,56-0,61 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,65-2,72 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
336		2,36	598	DMSO: 2,69 (d, 3H, NHCH ₃)
337		3,62	595	DMSO: 1,63 (s, 3H, NHCH ₂ C(CH ₃)=CH ₂), 3,69 (d, 2H, NHCH ₂ C(CH ₃)=CH ₂), 4,74 (d, 2H, NHCH ₂ C(CH ₃)=CH ₂)
338		3,21	585	DMSO: 1,64 (s, 3H, NHCH ₂ C(CH ₃)=CH ₂), 3,70 (d, 2H, NHCH ₂ C(CH ₃)=CH ₂), 4,76 (d, 2H, NHCH ₂ C(CH ₃)=CH ₂)
339		3,89	700	DMSO: 0,42 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,59 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,66 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
340		3,00	640	DMSO: 1,24 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
341		3,60	572	DMSO: 1,03-1,04 (m, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,90-3,94 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
342		3,36	558	DMSO: 1,01-1,02 (m, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,17-3,19 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₃)

(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
343		3,92	586	DMSO: 1,23 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
344		3,60	658	DMSO: 1,11 (t, 3H, NHCH(CH ₂) ₄ CHOCH ₂ CH ₃), 1,40-1,55 (m, 8H, NHCH(CH ₂) ₄ CHOCH ₂ CH ₃), 1,72-1,76 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₄ CHOCH ₂ CH ₃), 3,42 (q, 2H, NHCH(CH ₂) ₄ CHOCH ₂ CH ₃), 3,65-3,70 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₄ CHOCH ₂ CH ₃)
345		3,50	598	DMSO: 2,66 (d, 3H, NHCH ₃)
346		3,23	613	DMSO: 1,00 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,14 (q, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
347		3,95	631	DMSO: 1,19 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
348		4,43	641	DMSO: 1,18 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
349		3,15	590	DMSO: 2,65 (d, 3H, NHCH ₃)
350		3,45	716	DMSO: 0,39-0,43 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,55-0,61 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,63-2,70 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)

(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
351		2,95	676	DMSO: 7,42 (s ancho, 1H, NH ₂), 7,70 (s ancho, 1H, NH ₂)
352		4,09	732	DMSO: 1,19 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
353		2,82	628	DMSO: 7,45 (s ancho, 1H, NH ₂), 7,72 (s ancho, 1H, NH ₂)
354		3,12	643	DMSO: 2,65 (d, 3H, NHCH ₃)
355		3,66	670	DMSO: 0,99 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,86-3,90 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
356		3,29	617	CD ₃ CN: 1,29 (s, 6H, NHC(CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃), 3,21 (s, 3H, , NHC(CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃), 3,38 (s, 2H, NHC(CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃)
357		3,72	654	DMSO: 2,66 (d, 3H, NHCH ₃)

(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
358		3,62	679	DMSO: 4,16 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
359		4,26	694	DMSO: 0,10 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,30 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,87 (m, 1H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 3,01 (t, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂)
360		3,46	640	CD ₃ CN: 6,20 (s ancho, 1H, NH ₂), 6,97 (s ancho, 1H, NH ₂)
361		4,39	728	DMSO: 1,11 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,15 (s, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,48 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,55 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 3,98 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃)
362		4,56	696	DMSO: 1,19 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
363		4,21	682	DMSO: 1,18 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,92 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
364		3,96	668	DMSO: 0,99 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,13 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
365		3,94	680	DMSO: 0,41 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,58 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,69 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)

(continuación)

N° Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
366		4,50	708	DMSO: 0,09-0,36 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,83 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,05 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,34 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
367		3,35	645	DMSO: 2,65 (d, 3H, NHCH ₃)
368		4,07	699	DMSO: 0,11-0,38 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,82 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,12 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,34 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
369		3,57	659	DMSO: 0,97 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,12 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
370		3,79	673	DMSO: 1,08 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,93 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
371		4,10	687	DMSO: 1,23 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
372		3,13	631	DMSO: 7,50-8,00 (s ancho, 2H, NH ₂)
373		3,84	685	DMSO: 0,13 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,33 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,90 (m, 1H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 3,03 (t, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂)

(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
374		3,29	670	DMSO: 4,17 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
375		3,57	695	DMSO: 3,50 (m, 2H, NHCH ₂ CHF ₂), 5,83 (tt, 1H, NHCH ₂ CHF ₂)
376		3,96	719	DMSO: 1,10 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,20 (s, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,46 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,51 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 3,98 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃)
377		3,94	746	DMSO: 2,65 (d, 3H, NHCH ₃)
378		4,74	800	DMSO: 0,09-0,37 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,83 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,05 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,32 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
379		4,18	772	DMSO: 0,40 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,58 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,64 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
380		4,20	760	DMSO: 0,99 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,13 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
381		4,44	774	DMSO: 1,80 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,91 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)

(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
382		3,67	732	DMSO: 7,20-7,60 (s ancho, 2H, NH ₂)
383		4,51	786	DMSO: 0,02 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,22 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,77 (m, 1H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 2,91 (t, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂)
384		3,82	771	DMSO: 4,14 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
385		4,63	820	DMSO: 1,09 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,15 (s, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,47 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,55 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 3,97 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃)
386		3,65	674	DMSO: 2,65 (d, 3H, NHCH ₃)
387		4,42	728	DMSO: 0,09-0,37 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,81 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,04 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,30 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
388		3,89	688	DMSO: 0,98 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,15 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
389		4,12	702	DMSO: 1,00 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,89 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)

(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
390		4,47	716	DMSO: 1,20 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
391		3,41	660	DMSO: 7,40 (s ancho, 1H, NH ₂), 7,77 (s ancho, 1H, NH ₂)
392		4,17	714	DMSO: 0,09 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,31 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,86 (m, 1H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 2,99 (t, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂)
393		3,59	699	DMSO: 4,15 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
394		4,30	748	DMSO: 1,04 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,07 (s, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,40 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 2,55 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃), 3,92 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃)
395		3,48	689	DMSO: 3,20 (s, 3H, NHCH ₂ CH ₂ OCH ₃), 3,28-3,40 (m, 4H, NHCH ₂ CH ₂ OCH ₃)
396		3,89	724	DMSO: 3,50 (m, 2H, NHCH ₂ CHF ₂), 5,86 (tt, 1H, NHCH ₂ CHF ₂)
397		2,96	601	DMSO: 0,23 (m, 2H, NHOCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,52 (m, 2H, NHOCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 1,07 (m, 1H, NHOCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 3,66 (d, 2H, NHOCH ₂ CH(CH ₂) ₂)

(continuación)

N° Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
398		2,88	589	DMSO: 1,16 (d, 6H, NHOCH(CH ₃) ₂), 4,08 (m, 1H, NHOCH(CH ₃) ₂)
399		3,37	599	DMSO: 1,34-1,77 (m, 8H, NHCH(CH ₂) ₄), 4,04 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₄)
400		3,63	613	DMSO: 1,04-1,80 (m, 10H, NHCH(CH ₂) ₅), 3,56 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₅)
401		3,84	598	DMSO: 1,40-1,77 (m, 8H, NHCH(CH ₂) ₄), 4,02-4,05 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₄)
402		3,78	603	DMSO: 2,65 (d, 3H, NHCH ₃)
403		4,14	561	DMSO: 1,24 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
404		3,19	519	DMSO: 2,72 (d, 3H, NHCH ₃)
405		2,46	529	DMSO: 2,67 (d, 3H, NHCH ₃)

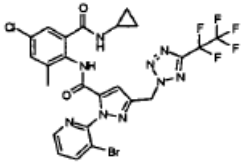
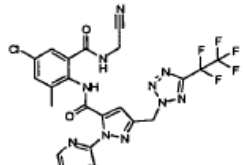
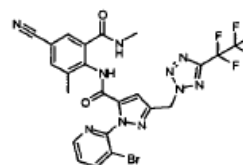
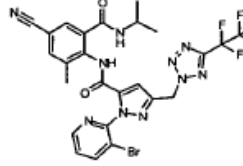
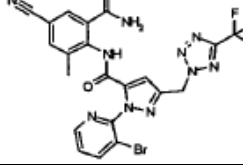
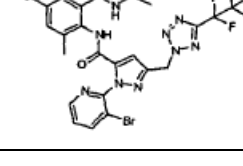
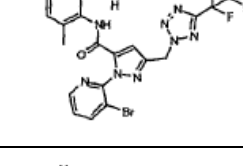
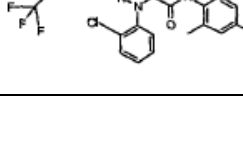
(continuación)

N° Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
406		2,88	557	DMSO: 1,01 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,86-3,91 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
407		3,20	571	DMSO: 1,21 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
408		3,51	704	DMSO: 0,97 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,12 (q, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
409		4,00	684	DMSO: 1,20 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
410		3,26	690	DMSO: 2,64 (d, 3H, NHCH ₃)
411		3,36	656	DMSO: 0,97 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,13 (q, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
412		3,16	716	DMSO: 4,15 (d, 2H, NHCH ₂ CN)

(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
413		3,77	718	DMSO: 1,00 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,86-3,91 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
414		3,92	727	DMSO: 2,49 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₂ CF ₃), 3,49 (m, 2H, NHCH ₂ CH ₂ CF ₃)
415		3,36	649	DMSO: 2,65 (d, 3H, NHCH ₃)
416		2,80	665	DMSO: 4,18 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
417		3,87	677	DMSO: 1,00 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,86-3,91 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
418		3,13	635	DMSO: 7,45 (s ancho, 1H, NH ₂), 7,71 (s ancho, 1H, NH ₂)
419		4,23	691	DMSO: 1,19 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)

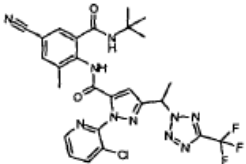
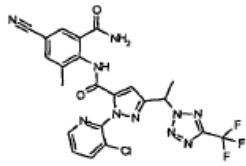
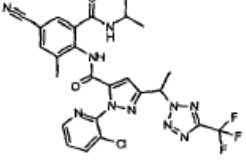
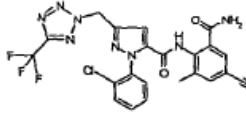
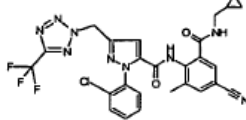
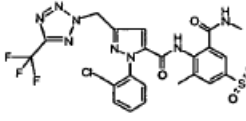
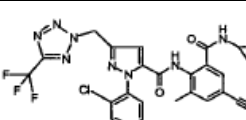
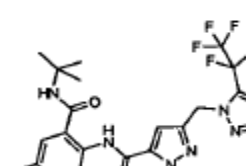
(continuación)

N° Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
420		3,62	677	DMSO: 0,39-0,43 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,55-0,61 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,64-2,70 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
421		3,31	674	DMSO: 4,16 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
422		3,03	640	DMSO: 2,65 (d, 3H, NHCH ₃)
423		3,46	668	DMSO: 1,01 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,86-3,92 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
424		2,80	626	DMSO: 7,55 (s ancho, 1H, NH ₂), 7,86 (s ancho, 1H, NH ₂)
425		3,78	682	DMSO: 1,21 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
426		3,23	654	DMSO: 0,98 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,14 (q, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
427		3,93	582	DMSO: 0,99-1,03 (m, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,86-3,91 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)

(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
428		3,72	552	DMSO: 1,25 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
429		3,11	574	DMSO: 0,98 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,13 (q, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
430		3,43	594	DMSO: 2,65 (d, 3H, NHCH ₃)
431		2,81	510	DMSO: 2,72 (d, 3H, NHCH ₃)
432		2,97	584	DMSO: 1,21 (d, 3H, NHCH(CH ₃)C≡CH), 3,12 (s, 1H, NHCH(CH ₃)C≡CH), 4,61-4,65 (m, 1H, NHCH(CH ₃)C≡CH)
433		3,25	628	DMSO: 1,13 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CF ₃), 4,52-4,58 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CF ₃)
434		4,25	636	DMSO: 1,20 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
435		3,18	588	DMSO: 2,20 (s, 3H, NH(CH ₂) ₂ OCH ₃), 3,26-3,30 (m, 4H, NH(CH ₂) ₂ OCH ₃)

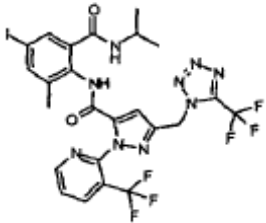
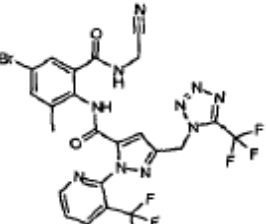
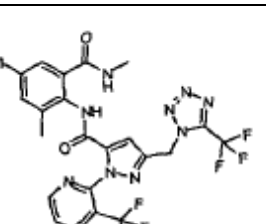
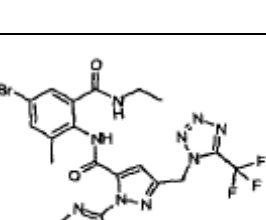
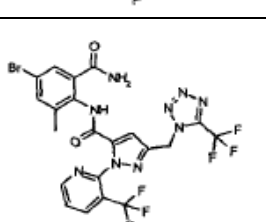
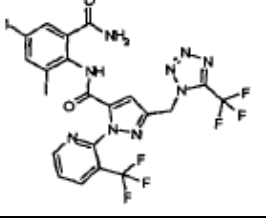
(continuación)

N° Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
436		3,70	601	DMSO: 1,20 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
437		2,66	545	DMSO: 7,55 (s ancho, 1H, NH ₂), 7,85 (s ancho, 1H, NH ₂)
438		3,35	587	DMSO: 1,01 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,84-3,93 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
439		2,82	530	DMSO: 7,81-7,89 (m, 2H, NH ₂)
440		3,61	584	DMSO: 0,04-0,11 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,27-0,31 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,80-0,84 (m, 1H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 2,97-2,99 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂)
441		2,73	597	DMSO: 2,68 (d, 3H, NHCH ₃)
442		3,29	570	DMSO: 0,40-0,43 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,60-0,62 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,66-2,67 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
443		3,92	646	DMSO: 1,30 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)

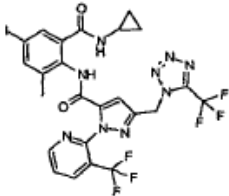
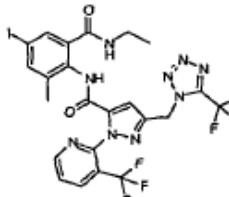
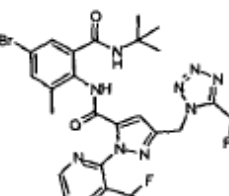
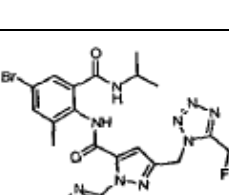
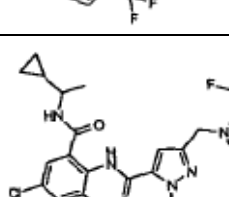
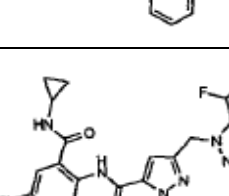
(continuación)

N° Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
444		2,73	595	CD ₃ CN: 2,79 (d, 3H, NHCH ₃)
445		2,95	621	DMSO: 0,48 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,62 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,65 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
446		3,47	637	DMSO: 1,32 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
447		3,03	624	DMSO: 2,74 (d, 3H, NHCH ₃)
448		3,81	678	DMSO: 0,10-0,37 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,81 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,04 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,29 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
449		3,64	589	DMSO: 2,66 (d, 3H, NHCH ₃)

(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
450		3,54	707	DMSO: 0,96 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,83-3,88 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
451		2,90	657	DMSO: 4,14 (d, 2H, NHCH ₂ CN)
452		3,07	680	DMSO: 2,65 (d, 3H, NHCH ₃)
453		3,17	648	DMSO: 0,94 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,10 (q, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
454		2,72	617	DMSO: 7,30 (s ancho, 1H, NH ₂), 7,50 (s ancho, 1H, NH ₂)
455		2,83	666	DMSO: 7,20 (s ancho, 1H, NH ₂), 7,28 (s ancho, 1H, NH ₂)

(continuación)

N° Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
456		3,31	706	DMSO: 0,41-0,46 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,57-0,61 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,65-2,70 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
457		3,30	694	DMSO: 0,99 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,14 (q, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
458		3,78	674	DMSO: 1,20 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
459		3,29	660	DMSO: 1,02 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,88-3,93 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
460		3,07	590	DMSO: 0,11-0,37 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,83 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,06 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,33 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
461		2,50	562	DMSO: 0,43 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,60 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,69 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)

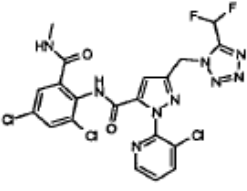
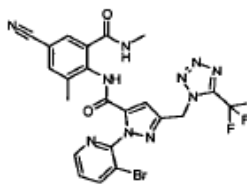
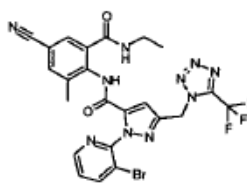
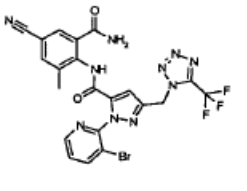
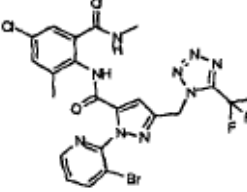
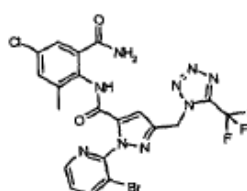
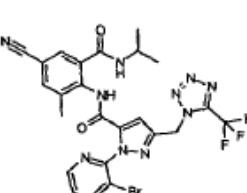
(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
462		2,75	564	DMSO: 1,03 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,92 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
463		2,36	555	DMSO: 1,08 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,93 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
464		2,59	569	DMSO: 1,36 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
465		3,02	610	DMSO: 0,11-0,37 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,80 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,04 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,30 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
466		2,71	584	DMSO: 1,01 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,89 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
467		2,58	581	DMSO: 0,12-0,39 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,85 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,07 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,34 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
468		2,12	553	DMSO: 0,50 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,62 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,70 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)

(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
469		2,44	582	DMSO: 0,42 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,58 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,66 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
470		2,26	536	CD ₃ CN: 2,75 (d, 3H, NHCH ₃)
471		3,05	598	DMSO: 1,27 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
472		1,97	527	CD ₃ CN: 2,78 (d, 3H, NHCH ₃)
473		3,52	589	DMSO: 2,67 (d, 3H, NHCH ₃)
474		2,94	537	DMSO: 2,67 (d, 3H, NHCH ₃)
475		3,09	578	CD ₃ CN: 1,30 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)

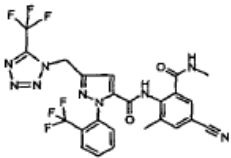
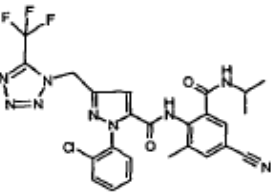
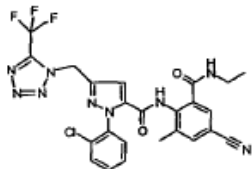
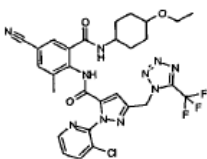
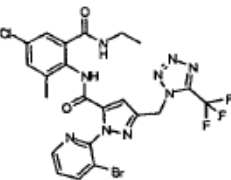
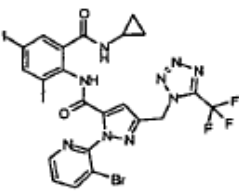
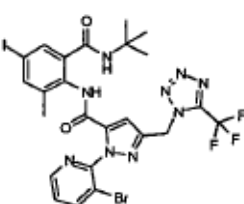
(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
476		2,22	556	DMSO: 2,65 (d, 3H, NHCH ₃)
477		2,47	589	
478		2,66	603	
479		2,28	575	
480		2,79	598	
481		2,43	584	
482		2,74	617	

(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
483		3,07	631	
484		3,52	640	
485		3,14	626	
486		2,64	623	
487		2,90	624	
488		3,58	620	DMSO: 1,23 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
489		3,52	586	DMSO: 1,23 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)

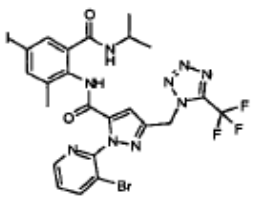
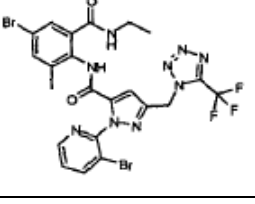
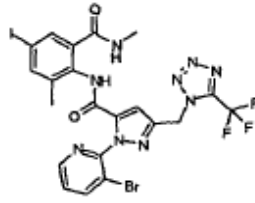
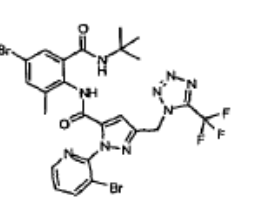
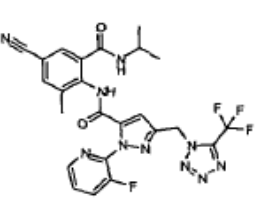
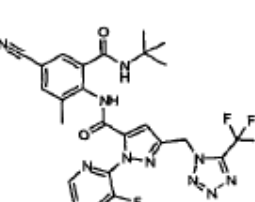
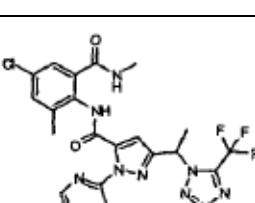
(continuación)

N° Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
490		2,91	578	DMSO: 2,66 (d, 3H, NHCH ₃)
491		3,25	572	DMSO: 1,02-1,04 (m, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,90-3,95 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
492		3,01	558	DMSO: 1,02 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,08 (q, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
493		3,37	657	
494		2,88	612	
495		3,11	716	DMSO: 0,39-0,43 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,56-0,61 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,63-2,67 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
496		3,73	732	DMSO: 1,20 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)

(continuación)

N° Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
497		2,63	676	DMSO: 7,43 (s ancho, 1H, NH ₂), 7,70 (s ancho, 1H, NH ₂)
498		2,51	628	DMSO: 7,49 (s ancho, 1H, NH ₂), 7,70 (s ancho, 1H, NH ₂)
499		3,80	699	DMSO: 0,12-0,48 (m, 4H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 0,85 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 1,06 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂), 3,36 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH(CH ₂) ₂)
500		3,50	673	DMSO: 1,04 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,92 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
501		3,27	671	DMSO: 1,01 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,86-3,91 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
502		2,84	519	DMSO: 2,72 (d, 3H, NHCH ₃)
503		3,16	704	DMSO: 0,98 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,12 (q, 2H, NHCH ₂ CH ₃)

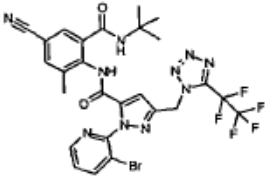
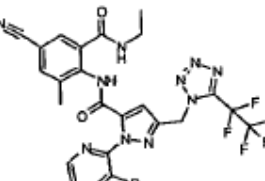
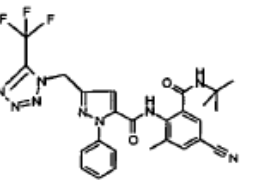
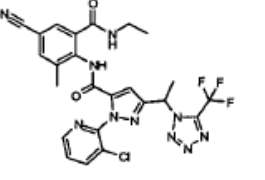
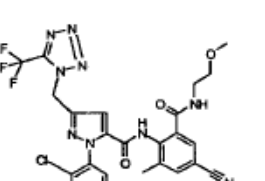
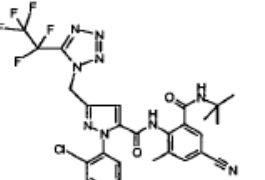
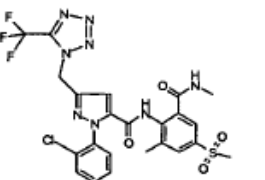
(continuación)

N° Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
504		3,41	718	DMSO: 1,00 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,86-3,91 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
505		3,02	656	DMSO: 0,98 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,13 (q, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
506		2,91	690	DMSO: 2,64 (d, 3H, NHCH ₃)
507		3,65	684	DMSO: 1,20 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
508		2,55	556	
509		2,92	570	
510		2,86	568	

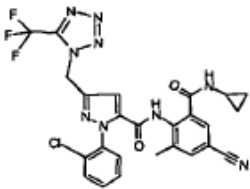
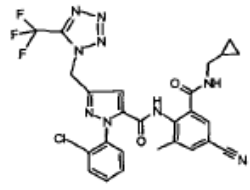
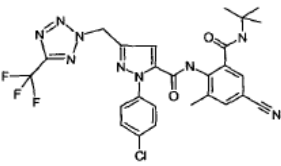
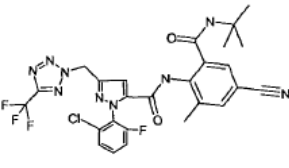
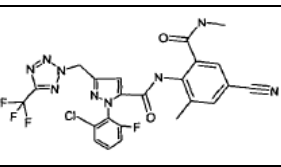
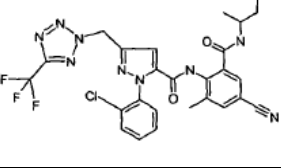
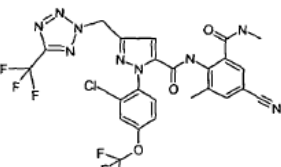
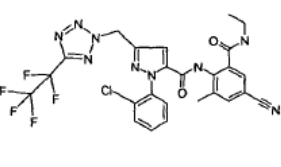
(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
511		3,75	610	
512		2,53	558	
513		3,54	677	DMSO: 1,01 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,85-3,93 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
514		3,91	691	DMSO: 1,20 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
515		3,29	675	DMSO: 0,39-0,43 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,56-0,61 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,63-2,69 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
516		2,72	640	DMSO: 2,66 (d, 3H, NHCH ₃)
517		2,53	626	DMSO: 7,56 (s ancho, 1H, NH ₂), 7,86 (s ancho, 1H, NH ₂)

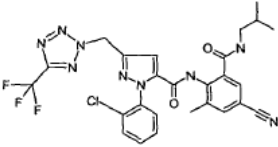
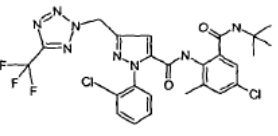
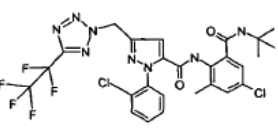
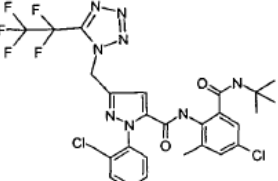
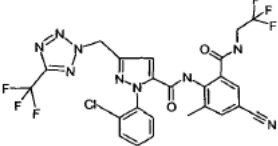
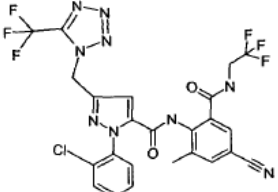
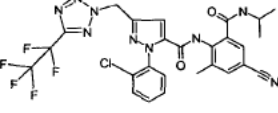
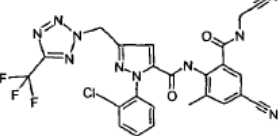
(continuación)

N° Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
518		3,47	682	DMSO: 1,21 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
519		2,94	654	DMSO: 0,99 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,14 (q, 2H, NHCH ₂ CH ₃)
520		3,35	552	DMSO: 1,25 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
521		2,74	572	
522		2,80	598	DMSO: 2,33 (s, 3H, NH(CH ₂) ₂ OCH ₃), 3,26-3,29 (m, 4H, NH(CH ₂) ₂ OCH ₃)
523		3,92	636	DMSO: 1,20 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
524		2,43	597	DMSO: 2,68 (d, 3H, NHCH ₃)

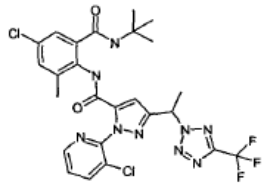
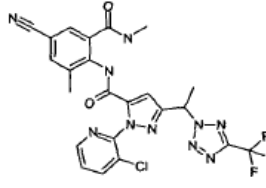
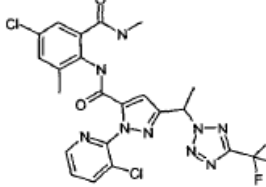
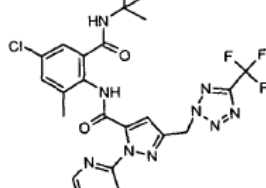
(continuación)

N° Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
525		2,95	570	DMSO: 0,39-0,46 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 0,60-0,63 (m, 2H, NHCH(CH ₂) ₂), 2,63-2,68 (m, 1H, NHCH(CH ₂) ₂)
526		3,25	584	DMSO: 0,28-0,31 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,38-0,39 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 0,84-0,91 (m, 1H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂), 2,97-3,00 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₂) ₂)
527		4,16	586	DMSO: 1,23 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
528		3,88	604	DMSO: 1,18 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
529		3,13	562	DMSO: 2,66 (d, 3H, NHCH ₃)
530		3,81	586	DMSO: 0,76 (t, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃), 0,97 (d, 3H, NHCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃), 1,33-1,42 (m, 2H, NHCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃), 3,71-3,75 (m, 1H, NHCH(CH ₃)CH ₂ CH ₃)
531		3,82	628	DMSO: 2,65 (d, 3H, NHCH ₃)
532		3,87	608	DMSO: 1,00 (t, 3H, NHCH ₂ CH ₃), 3,16 (q, 2H, NHCH ₂ CH ₃)

(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
533		3,84	586	DMSO: 0,81 (d, 6H, NHCH ₂ CH(CH ₃) ₂), 1,64-1,71 (m, 1H, NHCH ₂ CH(CH ₃) ₂), 2,91-2,94 (m, 2H, NHCH ₂ CH(CH ₃) ₂)
534		4,36	595	DMSO: 1,19 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
535		4,73	646	DMSO: 1,19 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
536		4,41	646	DMSO: 1,18 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
537		3,48	612	DMSO: 3,84-3,93 (m, 2H, NHCH ₂ CF ₃)
538		3,20	612	DMSO: 3,91-4,00 (m, 2H, NHCH ₂ CF ₃)
539		3,91	622	DMSO: 1,05 (d, 6H, NHCH(CH ₃) ₂), 3,86-3,91 (m, 1H, NHCH(CH ₃) ₂)
540		2,97	569	DMSO: 4,15 (d, 2H, NHCH ₂ CN)

(continuación)

Nº Ej.	Estructura	logP	MH ⁺	RMN
541		4,10	611	DMSO: 1,19 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)
542		2,86	559	DMSO: 2,65 (d, 3H, NHCH ₃)
543		3,26	569	DMSO: 2,64 (d, 3H, NHCH ₃)
544		3,85	595	DMSO: 1,22 (s, 9H, NHC(CH ₃) ₃)

Procedimientos analíticos:

Se realizó la determinación de los valores de logP dados en la tabla y el ejemplo de preparación precedentes según la directiva CEE 79/831 anexo V.A8 mediante HPLC.

- 5 Se realizó la calibración con alcanos-2-onas no ramificadas (de 3 a 16 átomos de carbono) cuyos valores de logP son conocidos (determinación de los valores de logP mediante los tiempos de retención mediante interpolación lineal entre dos alcanos consecutivos entre sí).

Se realizaron las medidas en un sistema de CL Agilent 1100 con una columna de 50*4,6 Zorbax Eclipse C18 1,8 µm (temperatura de estufa 55 °C, flujo 2,0 ml/min).

- 10 Se usaron los siguientes eluyentes:

Eluyente A: acetonitrilo + 1000 µl de ácido fórmico/l
Eluyente B: agua Millipore + 900 µl de ácido fórmico/l

Gradiente:

Tiempo/min	Eluyente A/%	Eluyente B/%
0	10	90
4,25	95	5
5,50	95	5
5,55	10	90
5,70	10	90

Se determinaron las señales de MH^+ con un sistema Agilent MSD con ESI e ionización positiva o negativa.

Se determinaron los espectros de RMN con un Bruker Avance 400 equipado con una cabeza de muestra de flujo (60 µl de volumen). Se usaron como disolvente CD_3CN o $DMSO-d_6$, usándose como referencia tetrametilsilano (0,00 ppm).

- 5 La división de las señales era según se describe a continuación: s (singlete), s a (singlete ancho), d (doblete), t (tripleto), c (cuartete), m (multiplete).

Ejemplos de aplicación

Ejemplo A

Ensayo de *Phaedon* (tratamiento por pulverización de PHAECO)

- 10 Disolvente: 78,0 partes en peso de acetona
1,5 partes en peso de dimetilformamida
Emulsionante: 0,5 partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

- 15 Para la preparación de un preparado de principio activo conveniente, se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades dadas de disolvente y emulsionante y se diluye el concentrado con agua que contiene emulsionante a la concentración deseada.

Se pulverizan trozos de hojas de col china (*Brassica pekinensis*) con un preparado de principio activo de la concentración deseada y, después de secar, se infesta con larvas de escarabajo de la mostaza (*Phaedon cochleariae*).

- 20 Después del tiempo deseado, se determina el efecto en porcentaje. A este respecto, 100 % significa que todas las larvas de escarabajo habían muerto, 0 % significa que ninguna larva de escarabajo había muerto.

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

Nº de ejemplo:

- 25 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 25, 26, 27, 28, 29, 30, 31, 32, 33, 34, 36, 37, 38, 39, 40, 41, 42, 43, 44, 45, 46, 47, 48, 49, 50, 52, 53, 54, , 55, 56, 57, 58, 59, 60, 61, 62, 63, 64, 65, 66, 67, 68, 69, 70, 71, 72, 73, 74, 75, 76, 77, 78, 84, 85, 86, 87, 88, 89, 91, 92, 93, 95, 96, 97, 98, 99, 100, 101, 102, 103, 104, 105, 106, 107, 108, 109, 110, 111, 112, 113, 114, 115, 116, 117, 119, 120, 121, 122, 124, 125, 126, 127, 128, 129, 130, 131, 132, 133, 134, 135, 136, 137, 138, 139, 140, 141, 142, 143, 144, 145, 146, 147, 148, 149, 150, 151, 152, 153, 154, 155, 156, 157, 158, 159, 160, 161, 162, 163, 164, 165, 166, 167, 168, 169, 170, 171, 172, 173, 174, 175, 176, 177, 178, 180, 181, 182, 183, 184, 185, 186, 187, 188, 189, 191, 192, 194, 195, 196, 197, 198, 199, 200, 201, 202, 203, 204, 205, 206, 207, 208, 210, 211, 212, 213, 214, 215, 216, 217, 218, 219, 220, 221, 222, 223, 224, 225, 226, 227, 228, 229, 230, 231, 232, 233, 234, 235, 236, 237, 238, 239, 240, 241, 242, 243, 244, 245, 246, 247, 248, 249, 250, 251, 252, 253, 254, 255, 256, 257, 258, 259, 260, 261, 262, 263, 264, 265, 266, 267, 269, 270, 271, 272, 273, 277, 279, 280, 281, 282, 284, 286, 287, 289, 35 290, 291, 295, 296, 297, 298, 300, 301, 302, 304, 305, 308, 309, 310, 311, 312, 313, 314, 315, 317, 318, 319, 320, 321, 322, 323, 325, 327, 328, 329, 330, 331, 332, 333, 334, 335, 336, 336, 337, 338, 339, 340, 341, 342, 343, 344, 345, 346, 347, 348, 349, 350, 351, 352, 353, 354, 355, 357, 358, 359, 360, 361, 362, 363, 364, 365, 366, 367, 368, 369, 370, 371, 372, 373, 374, 375, 376, 377, 378, 379, 380, 381, 382, 383, 384, 385, 386, 387, 388, 389, 390, 391, 392, 393, 394, 395, 396, 397, 398, 399, 400, 401, 402, 403, 404, 405, 406, 407, 408, 410, 40 411, 412, 413, 423, 424, 425, 426, 427, 428, 430, 431, 432, 433, 434, 435, 436, 437, 438, 440, 441, 442, 443, 444, 445, 446, 447, 448, 449, 450, 452, 453, 455, 456, 457, 459, 460, 461, 462, 463, 464, 465, 466, 467, 468, 469, 470, 471, 472, 473, 474, 475, 476, 477, 478, 479, 480, 481, 482, 483, 484, 485, 486, 487, 488, 490, 491, 492, 494, 495, 496, 497, 498, 499, 500, 501, 503, 504, 505, 506, 507, 508, 509, 510, 511, 512, 513, 514, 515, 516, 517, 518, 519, 520, 521, 525, 526, 527, 528, 529, 530, 531, 532, 533, 535, 537, 538, 539, 540, 541, 542, 45 543, 544

Ejemplo B

Ensayo de *Spodoptera frugiperda* (tratamiento de pulverización con SPODFR)

- 50 Disolvente: 78,0 partes en peso de acetona
1,5 partes en peso de dimetilformamida
Emulsionante: 0,5 partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

Para la preparación de un preparado de principio activo conveniente, se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades dadas de disolvente y emulsionante y se diluye el concentrado con agua que contiene emulsionante a la concentración deseada.

Se pulverizan trozos de hojas de maíz (*Zea mays*) con un preparado de principio activo de la concentración deseada y, después de secar, se infesta con orugas de gusano cogollero (*Spodoptera frugiperda*).

Después del tiempo deseado, se determina el efecto en porcentaje. A este respecto, 100 % significa que todas las orugas habían muerto, 0 % significa que ninguna oruga había muerto.

- 5 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran un efecto ≥ 80 % a una cantidad de aplicación de 100 g/ha:

Nº de ejemplo:

10	1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 25, 26, 27, 28, 29, 30, 31, 32, 33, 34, 35, 36, 37, 38, 39, 40, 41, 42, 43, 44, 45, 46, 47, 48, 49, 50, 51, 52, 53, 54, 55, 56, 57, 58, 59, 60, 61, 62, 63, 64, 65, 66, 67, 68, 69, 70, 71, 73, 74, 76, 77, 78, 79, 80, 81, 82, 83, 84, 85, 86, 87, 88, 89, 91, 92, 95, 96, 97, 98, 99, 100, 101, 102, 103, 104, 105, 106, 107, 108, 109, 110, 111, 112, 113, 114, 115, 116, 117, 118, 119, 120, 121, 122, 124, 125, 126, 127, 128, 129, 130, 131, 132, 133, 134, 135, 136, 137, 138, 139, 140, 141, 142, 143, 144, 145, 146, 147, 148, 149, 150, 151, 152, 153, 154, 155, 156, 157, 158, 159, 160, 161, 162, 163, 164, 165, 166, 167, 168, 169, 170, 171, 172, 173, 174, 175, 176, 177, 178, 179, 180, 181, 182, 183, 184, 185,
15	186, 187, 189, 190, 191, 192, 195, 196, 197, 198, 199, 200, 201, 202, 203, 204, 205, 206, 207, 208, 210, 211, 212, 213, 214, 215, 216, 217, 218, 219, 220, 221, 222, 223, 224, 225, 226, 227, 228, 229, 230, 231, 232, 233, 234, 235, 236, 237, 238, 239, 240, 241, 242, 243, 244, 245, 246, 247, 248, 249, 250, 251, 252, 253, 254, 255, 256, 257, 258, 259, 260, 261, 262, 263, 264, 265, 266, 267, 268, 269, 270, 271, 272, 273, 274, 275, 277, 278, 279, 280, 281, 282, 284, 285, 286, 287, 288, 289, 290, 291, 292, 293, 294, 295, 296, 297, 298, 299, 300, 301, 302, 303, 304, 305, 306, 307, 308, 309, 310, 311, 312, 313, 314, 315, 316, 317, 318, 319, 320, 321, 322, 323, 324, 325, 326, 327, 328, 329, 330, 331, 332, 333, 334, 335, 336, 337, 338, 339, 340, 341, 342, 343, 345, 346, 347, 348, 349, 350, 351, 352, 353, 354, 355, 357, 358, 359, 360, 361, 362, 363, 364, 365, 366, 367, 368, 369, 370, 371, 372, 373, 374, 375, 376, 377, 378, 379, 380, 381, 382, 383, 384, 385, 386, 387, 388, 389, 390, 391, 392, 393, 394, 395, 396, 397, 398, 399, 400, 401, 402, 403, 404, 405, 406, 407, 408, 410, 411, 412, 413, 423, 424, 425, 426, 427, 428, 430, 431, 432, 433, 434, 435, 436, 437, 438, 440, 441, 442, 443, 444, 445, 446, 447, 448, 449, 450, 452, 453, 455, 456, 457, 458, 459, 460, 461, 462, 463, 464, 465, 466, 467, 468, 469, 470, 471, 472, 473, 474, 475, 476, 477, 478, 479, 480, 481, 482, 483, 484, 485, 486, 487, 488, 489, 490, 491, 492, 494, 495, 496, 497, 498, 499, 500, 501, 502, 503, 504, 505, 506, 507, 508, 509, 510, 511, 513, 514, 515, 516, 518, 519, 520, 521, 522, 523, 525, 526, 527, 528, 529, 530, 531, 532, 533, 534, 535, 536, 537, 538, 539, 540, 541, 542, 543, 544
20	
25	
30	

Ejemplo C

Ensayo de *Myzus* (tratamiento de pulverización con MYZUPE)

35	Disolvente: 78 partes en peso de acetona 1,5 partes en peso de dimetilformamida
	Emulsionante: 0,5 partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

Para la preparación de un preparado de principio activo conveniente, se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades dadas de disolvente y se diluye el concentrado con agua que contiene emulsionante a la concentración deseada.

- 40 Se pulverizan trozos de hojas de col china (*Brassica pekinensis*), que se han infestado con todos los estados del pulgón verde del melocotonero (*Myzus persicae*), con un preparado de principio activo de la concentración deseada.

Después del tiempo deseado, se determina el efecto en porcentaje. A este respecto, 100 % significa que todos los pulgones habían muerto, 0 % significa que ningún pulgón había muerto.

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

45	Nº de ejemplo: 2, 5, 7, 8, 11, 13, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 26, 27, 29, 30, 31, 32, 41, 42, 43, 44, 45, 52, 53, 54, 55, 59, 60, 64, 65, 67, 70, 74, 76, 77, 78, 80, 81, 82, 86, 89, 91, 92, 95, 96, 98, 102, 104, 105, 113, 114, 129, 134, 136, 153, 154, 158, 159, 160, 161, 162, 163, 164, 165, 166, 167, 168, 169, 170, 171, 172, 173, 174, 175, 176, 177, 178, 179, 180, 181, 182, 183, 186, 188, 189, 191, 196, 200, 201, 203, 211, 214, 217, 219, 220, 221, 222, 223, 224, 236, 238, 240, 241, 242, 246, 255, 259, 263, 264, 265, 266, 269, 270, 271, 272, 273, 274, 280, 281, 284, 286, 289, 290, 295, 296, 298, 304, 305, 308, 309, 310, 312, 313, 314, 315, 316, 317, 318, 320, 322, 328, 330, 332, 333, 334, 335, 336, 337, 338, 339, 340, 340, 341, 342, 345, 346, 349, 351, 353, 354, 360, 361, 367, 372, 376, 377, 385, 391, 397, 398, 405, 406, 407, 410, 411, 412, 423, 424, 425, 426, 427, 428, 430, 432, 433, 434, 435, 437, 438, 440, 441, 442, 443, 444, 445, 446, 447, 448, 449, 450, 452, 455, 459, 462, 463, 464, 465, 466, 467, 470, 471, 472, 475, 476, 477, 478, 479, 480, 481, 483, 484, 485, 486, 487, 488, 491, 492, 494, 495, 497, 498, 500, 501, 503, 504, 505, 506, 507, 508, 509, 510, 511, 512, 513, 515, 516, 517, 518, 519, 521, 522, 525, 526, 528, 529, 530, 532, 533, 540, 542, 543, 544
50	
55	

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran un efecto $\geq 80\%$ a una cantidad de aplicación de 20 g/ha:

Nº de ejemplo: 97, 301, 329, 460, 461.

Ejemplo D

5 Ensayo de *Lucilia cuprina* (LUCICU)

Disolvente: dimetilsulfóxido

Para la preparación de un preparado de principio activo conveniente, se mezcla 1 parte en peso de principio activo con la cantidad dada de disolvente y se diluye el concentrado con agua a la concentración deseada.

10 Se infestan con larvas de *Lucilia cuprina* matraces que contienen carne de caballo que se ha tratado con el preparado de principio activo de la concentración deseada.

Después del tiempo deseado, se determina la mortalidad en porcentaje. A este respecto, 100 % significa que todas las larvas habían muerto, 0 % significa que ninguna larva había muerto.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran un efecto $\geq 80\%$ a una cantidad de aplicación de 100 g/ha:

15 Nº de ejemplo: 2, 3, 5, 6, 7, 10, 11, 13, 218, 220, 222, 223, 229, 295.

Ejemplo E

Ensayo de *Boophilus microplus* (inyección de BOOPMI)

Disolvente: dimetilsulfóxido

20 Para la preparación de un preparado de principio activo conveniente, se mezcla 1 parte en peso de principio activo con la cantidad dada de disolvente y se diluye el concentrado con agua a la concentración deseada.

Se inyecta la solución de principio activo en el abdomen de (*Boophilus microplus*), se transfieren los animales a portaobjetos y se mantienen en un espacio climatizado. El control de la actividad se realiza sobre la puesta de huevos fértiles.

25 Después del tiempo deseado, se determina el efecto en porcentaje. A este respecto, 100 % significa que ninguna garrapata ha depositado huevos fértiles.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran un efecto $\geq 80\%$ a una cantidad de aplicación de 20 µg/animal:

Nº ejemplo: 2, 3, 5, 6, 7, 10, 11, 13, 218, 220, 222, 223, 229, 295

Ejemplo F

30 Ensayo de *Musca domestica* (MUSCDO)

Disolvente: dimetilsulfóxido

Para la preparación de un preparado de principio activo conveniente, se mezcla 1 parte en peso de principio activo con la cantidad dada de disolvente y se diluye el concentrado con agua a la concentración deseada.

35 Se infestan con adultos de *Musca domestica* recipientes que contienen una esponja que se ha tratado con el preparado de principio activo de la concentración deseada.

Después del tiempo deseado, se determina la mortalidad en porcentaje. A este respecto, 100 % significa que todas las moscas habían muerto; 0 % significa que ninguna mosca había muerto.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran un efecto $\geq 80\%$ a una cantidad de aplicación de 100 ppm:

40 Nº ejemplo: 2, 3, 5, 7, 10, 11, 13, 133, 136, 137, 144, 151, 162, 175, 178, 218, 223.

Ejemplo G

Ensayo de *Phaedon* (tratamiento de pulverización con PHAECO)

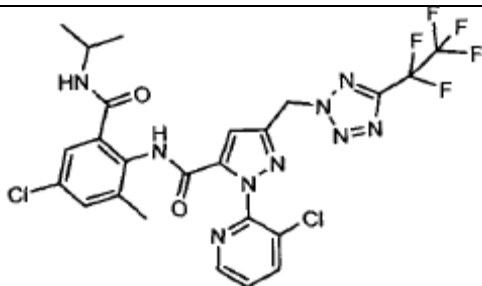
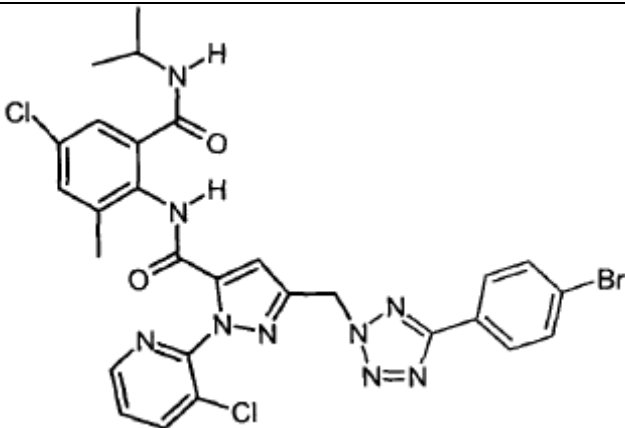
Disolvente: 78,0 partes en peso de acetona
1,5 partes en peso de dimetilformamida
Emulsionante: 0,5 partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

- 5 Para la preparación de un preparado de principio activo conveniente, se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades dadas de disolvente y emulsionante y se diluye el concentrado con agua que contiene emulsionante a la concentración deseada.

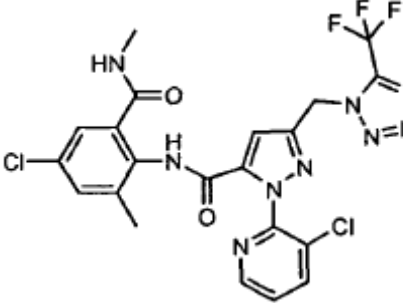
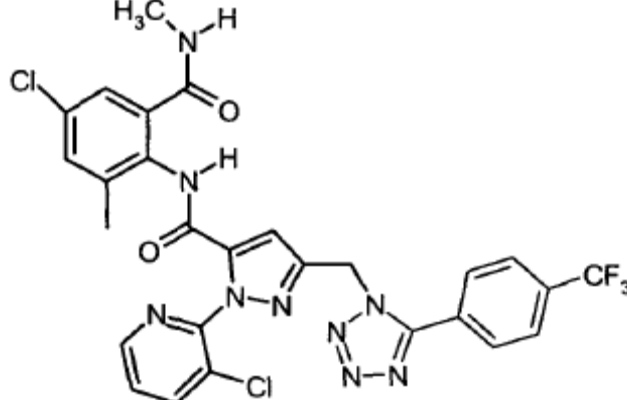
Se pulverizan trozos de hojas de col china (*Brassica pekinensis*) con un preparado de principio activo de la concentración deseada y, después de secar, se infestan con larvas de escarabajo de la mostaza (*Phaedon cochleariae*).

- 10 Después del tiempo deseado, se determina el efecto en porcentaje. A este respecto, 100 % significa que todas las larvas de escarabajo habían muerto, 0 % significa que ninguna larva de escarabajo había muerto.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia superior al estado de la técnica: véase la Tabla.

Principio activo	Concentración g/ha	Grado de mortalidad en % / 7 días
 según la invención	0,8	100
 conocido	0,8	0

(continuación)

Principio activo	Concentración g/ha	Grado de mortalidad en % / 7 días
 según la invención	4	67
 conocido	4	0

Ejemplo H

Ensayo de *Spodoptera frugiperda* (tratamiento de pulverización con SPODFR)

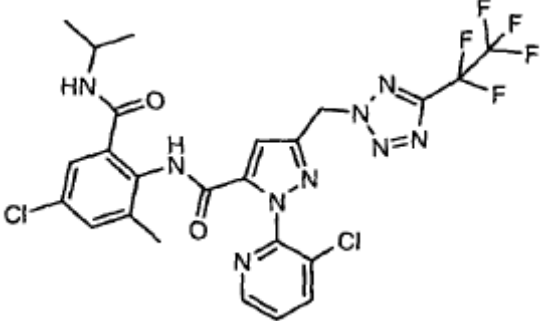
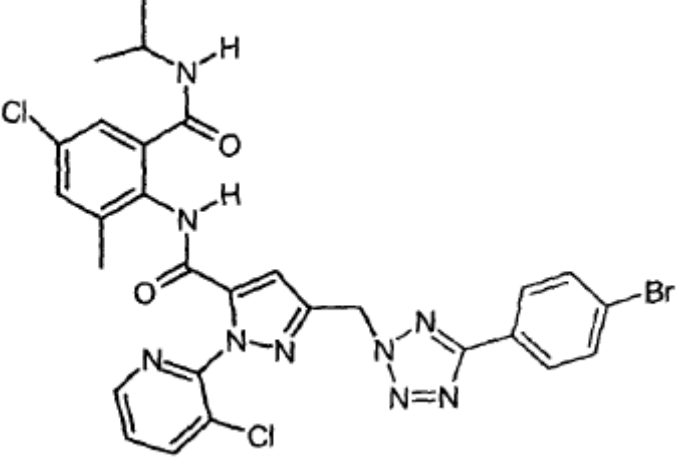
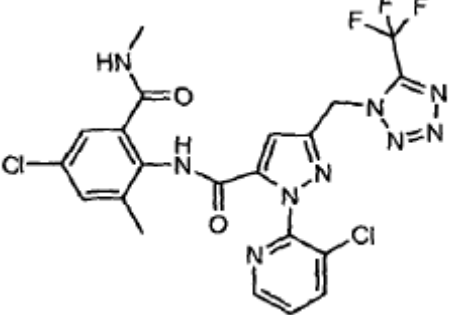
- | | | |
|---|---------------|--|
| 5 | Disolvente: | 78,0 partes en peso de acetona
1,5 partes en peso de dimetilformamida |
| | Emulsionante: | 0,5 partes en peso de alquilarilpoliglicoléter |

Para la preparación de un preparado de principio activo conveniente, se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades dadas de disolvente y emulsionante y se diluye el concentrado con agua que contiene emulsionante a la concentración deseada.

Se pulverizan trozos de hoja de maíz (*Zea mays*) con un preparado de principio activo de la concentración deseada y, después de secar, se infesta con orugas de gusano cogollero (*Spodoptera frugiperda*).

Después del tiempo deseado, se determina el efecto en porcentaje. A este respecto, 100 % significa que todas las orugas habían muerto, 0 % significa que ninguna oruga había muerto.

- 15 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia superior a la del estado de la técnica: véase la tabla:

Principio activo	Concentración g/ha	Grado de mortalidad en % / 7 días
 según la invención	0,8	100
 conocido	0,8	0
 según la invención	4	100

Ensayo de *Myzus* (tratamiento de pulverización con MYZUPE)

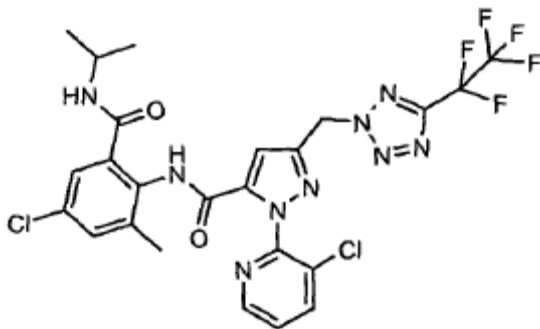
5	Disolvente:	78,0 partes en peso de acetona 1,5 partes en peso de dimetilformamida
	Emulsionante:	0,5 partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

Para la preparación de un preparado de principio activo conveniente, se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades dadas de disolvente y emulsionante y se diluye el concentrado con agua que contiene emulsionante a la concentración deseada.

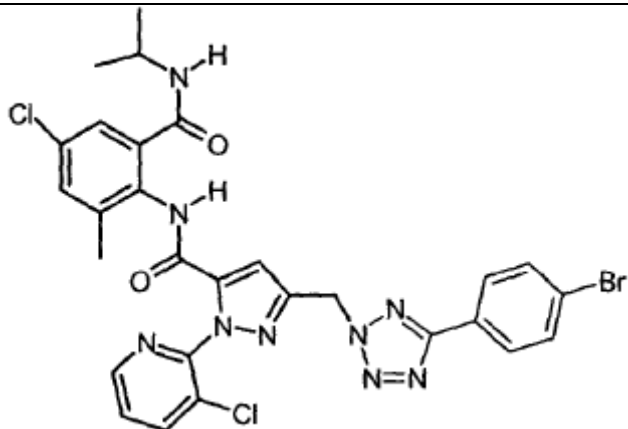
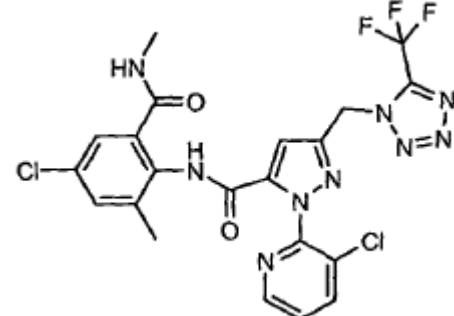
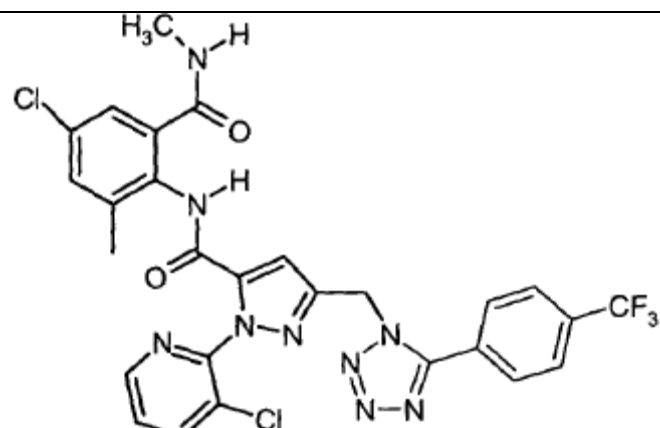
Se pulverizan trozos de hojas de col china (*Brassica pekinensis*), que se han infestado con todos los estados del pulgón verde del melocotonero (*Myzus persicae*), con un preparado de principio activo de la concentración deseada.

Después del tiempo deseado, se determina el efecto en porcentaje. A este respecto, 100 % significa que todos los pulgones habían muerto, 0 % significa que ningún pulgón había muerto.

15 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia superior al estado de la técnica: véase la tabla.

Principio activo	Concentración g/ha	Grado de mortalidad en % / 7 días
 compuesto de referencia	100	70

(continuación)

Principio activo	Concentración g/ha	Grado de mortalidad en % / 7 días
 conocido	100	0
 según la invención	100	100
 conocido	100	80

Ejemplo J**Ensayo de *Tetranychus* (resistente a OP / tratamiento por pulverización)**

5	Disolvente:	78,0 partes en peso de acetona 1,5 partes en peso de dimetilformamida
	Emulsionante:	0,5 partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

Para la preparación de un preparado de principio activo conveniente, se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades dadas de disolvente y emulsionante y se diluye el concentrado con agua que contiene emulsionante a la concentración deseada.

- 5 Se pulverizan judías (*Phaseolus vulgaris*), que están fuertemente infestadas con todas las etapas de la arañuela roja (*Tetranychus urticae*), con un preparado del principio activo a la concentración deseada.

Después del tiempo deseado, se determina el efecto en porcentaje. A este respecto, 100 % significa que todos los ácaros habían muerto; 0 % significa que ningún ácaro había muerto.

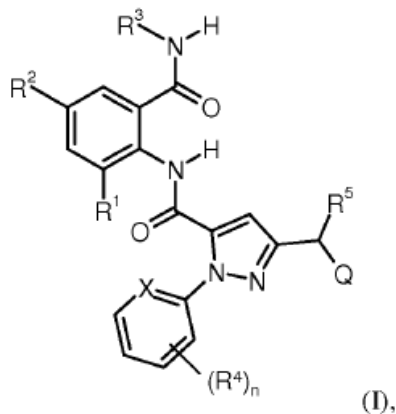
En este ensayo, la siguiente combinación de principios activos de acuerdo con la presente solicitud mostró una eficacia reforzada de forma sinérgica en comparación con los principios activos empleados individualmente:

- 10 Actividad de ≥ 80 % a una cantidad de aplicación de 20 g/ha:

Nº de ejemplo: 363, 449.

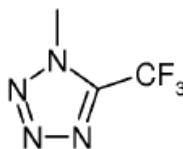
REIVINDICACIONES

1. Amidas del ácido antranílico sustituidas con tetrazol de fórmula (I)



en la que

- 5 R^1 representa metilo o cloro,
 R^2 representa halógeno, ciano, metilo o alquil C_1-C_4 -sulfonilo,
 R^3 representa hidrógeno o representa alquilo C_1-C_6 , alcoxilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 ,
 cicloalquilo C_3-C_{12} , cicloalquil C_3-C_{12} -alquilo C_1-C_6 respectivamente sustituidos dado el caso una o varias
 10 veces de forma igual o distinta, pudiendo seleccionarse los sustituyentes independientemente entre sí de
 halógeno, amino, ciano, nitro, hidroxilo, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxilo C_1-C_4 , haloalcoxilo C_1-C_4 ,
 alquil C_1-C_4 -tio, alcoxí C_2-C_6 -carbonilo, alquil C_2-C_6 -carbonilo, cicloalquil C_3-C_6 -amino o un anillo
 heteroaromático de 5 o 6 miembros,
 n representa 1, 2, 3 o 4,
 X representa N, CH, CF, CCl, CBr,
 15 R^4 representa independientemente entre sí hidrógeno, ciano, haloalquilo C_1-C_6 , halógeno o haloalcoxilo C_1-C_4 ,
 R^5 representa hidrógeno o alquilo C_1-C_6 ,
 Q representa el resto de tetrazol Q-6 monosustituido

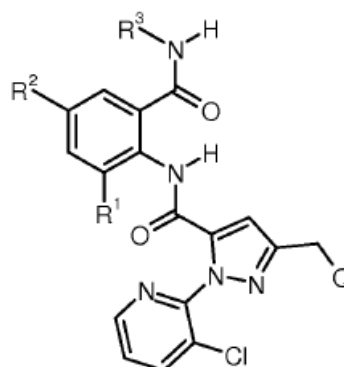


Q-6

20

así como sales de compuestos de fórmula (I).

2. Compuestos de fórmula (I-1) según la reivindicación 1



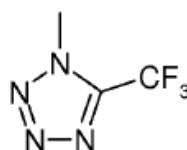
(I-1),

en la que

R¹ representa metilo o cloro,

R² representa halógeno, ciano o metilo,

R³ representa hidrógeno o alquilo C₁-C₆, alcoxilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₁₂, cicloalquil C₃-C₁₂-alquilo C₁-C₆ respectivamente sustituidos dado el caso una o varias veces de forma igual o distinta, pudiendo seleccionarse los sustituyentes independientemente entre sí de halógeno, amino, ciano, nitro, hidroxilo, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxilo C₁-C₄, haloalcoxilo C₁-C₄, alquil C₁-C₄-tio, alcoxi C₂-C₆-carbonilo, alquil C₂-C₆-carbonilo, cicloalquil C₃-C₆-amino o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, Q representa el resto de tetrazol Q-6 monosustituido,



Q-6

así como sales de compuestos de fórmula (I-1).

3. Compuestos de fórmula (I-1) según la reivindicación 2, en la que

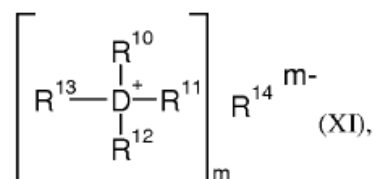
R¹ representa metilo,

R² representa halógeno, ciano o metilo,

R³ representa hidrógeno o alquilo C₁-C₆, alcoxilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₆ respectivamente sustituidos dado el caso una o varias veces de forma igual o distinta, pudiendo seleccionarse los sustituyentes independientemente entre sí de halógeno, ciano, amino, hidroxilo, alquilo C₁-C₆, alcoxilo C₁-C₄, haloalcoxilo C₁-C₄, alquil C₁-C₄-tio, cicloalquilo C₃-C₆ o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros que contiene 1-2 heteroátomos de la serie de N, O, S, no siendo adyacentes en el anillo dos átomos de oxígeno, Q representa el resto Q-6,

así como sales de los compuestos de fórmula (I).

4. Composición que contiene al menos un compuesto de fórmula (I) o de fórmula (I-1) según una de las reivindicaciones 1, 2 o 3, y al menos una sal de fórmula (XI)



en la que

D representa nitrógeno o fósforo,

R^{10} , R^{11} , R^{12} y R^{13} representan independientemente entre sí hidrógeno o respectivamente alquilo C_1-C_8 dado el caso sustituido o alquileo C_1-C_8 insaturado dado el caso sustituido una o varias veces, pudiendo estar seleccionados los sustituyentes de halógeno, nitro y ciano,
 m representa 1, 2, 3 o 4,
 R^{14} representa un anión inorgánico u orgánico.

5. Composición que contiene al menos un compuesto de fórmula (I) o de fórmula (I-1) según una de las reivindicaciones 1, 2 o 3, y al menos un potenciador de la penetración de fórmula (XII)



en la que

- 10 R representa alquilo de cadena lineal o ramificada de 4 a 20 átomos de carbono,
 R' representa hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, n-butilo, i-butilo, t-butilo, n-pentilo o n-hexilo,
 AO representa un resto de óxido de etileno, un resto de óxido de propileno, un resto de óxido de butileno o mezclas de restos de óxido de etileno y óxido de propileno o restos de óxido de butileno y,
 V representa números de 2 a 30.
- 15 6. Procedimiento para combatir plagas animales, a excepción del tratamiento terapéutico del cuerpo animal o humano, **caracterizado porque** se dejan actuar compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I-1) según una de las reivindicaciones 1, 2 o 3, o una composición según las reivindicaciones 4 o 5, sobre plagas animales y/o su hábitat y/o semillas y/o material multiplicativo vegetal y/o más tarde sobre partes de planta generadas a partir del material multiplicativo vegetal.
- 20 7. Procedimiento para la preparación de composiciones agroquímicas, **caracterizado porque** se mezclan compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I-1) según una de las reivindicaciones 1, 2 o 3, o una composición según las reivindicaciones 4 a 5, con diluyentes y/o sustancias tensioactivas.
- 25 8. Uso de compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I-1) según una de las reivindicaciones 1, 2 o 3, o de una composición según las reivindicaciones 4 a 5, para combatir plagas en la protección fitosanitaria, en la protección de materiales, en el sector de la higiene y/o en el sector de la medicina veterinaria, a excepción del tratamiento terapéutico del cuerpo animal o humano.