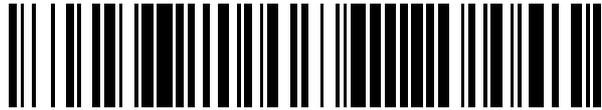


19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 546 417**

51 Int. Cl.:

**C07D 261/04** (2006.01)

**A01N 43/80** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **28.01.2011 E 11701145 (2)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **22.07.2015 EP 2531493**

54 Título: **Compuestos de isoxazolina cetónica sustituidos y derivados para combatir plagas animales**

30 Prioridad:

**01.02.2010 EP 10152316**

**01.02.2010 US 300060 P**

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:  
**23.09.2015**

73 Titular/es:

**BASF SE (100.0%)  
67056 Ludwigshafen, DE**

72 Inventor/es:

**KÖRBER, KARSTEN;  
KAISER, FLORIAN;  
VON DEYN, WOLFGANG;  
GROSS, STEFFEN;  
DICKHAUT, JOACHIM;  
DESHMUKH, PRASHANT;  
BANDUR, NINA GERTRUD;  
NARINE, ARUN;  
CULBERTSON, DEBORAH L.;  
ANSPAUGH, DOUGLAS D. y  
BRAUN, FRANZ JOSEF**

74 Agente/Representante:

**CARVAJAL Y URQUIJO, Isabel**

**ES 2 546 417 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

Compuestos de isoxazolina cetónica sustituidos y derivados para combatir plagas animales

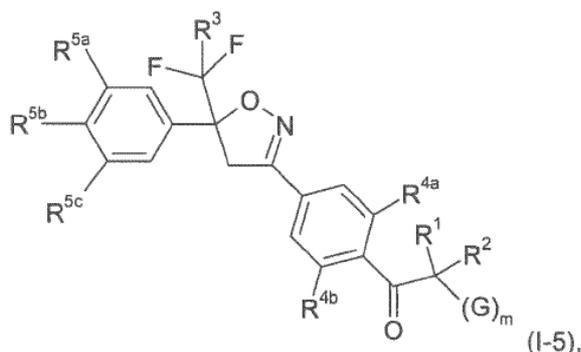
5 La presente invención se relaciona con compuestos de isoxazolina cetónica sustituidos, con los enantiómeros, diastereómeros, derivados y sales de los mismos y con composiciones que comprenden tales compuestos. La invención también se relaciona con el uso de los compuestos cetónicos de isoxazolina sustituidos, de sus sales o de composiciones que los comprenden para combatir plagas animales. Adicionalmente, la invención se relaciona también con métodos de aplicación de tales compuestos.

10 Las plagas animales destruyen los cultivos en crecimiento y recolectados y atacan construcciones de madera y estructuras comerciales, produciendo grandes pérdidas económicas en el suministro de alimentos y la propiedad. Aunque se conoce un gran número de agentes pesticidas, debido a la capacidad de las plagas objetivo para desarrollar resistencia a dichos agentes, hay una necesidad permanente por nuevos agentes para combatir plagas animales. En particular, son difíciles de ser controlados efectivamente plagas animales tales como insectos y ácaros.

Por lo tanto es un objetivo de la presente invención proveer compuestos que tengan una buena actividad pesticida, especialmente contra insectos y ácaros difíciles de controlar.

15 Se ha encontrado que estos objetivos se resuelven mediante derivados de isoxazolina cetónica sustituida de la fórmula general (I-5):

Compuestos de isoxazolina cetónica sustituidos de la fórmula general (I-5)



en donde

20 m es 0 o 1;

G es seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, nitro, ciano, -SCN, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalcoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalquiltio, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-cicloalquilo, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-halocicloalquilo, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alqueno, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-haloalqueno, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alquino, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> haloalquino, en donde los átomos de carbono de los radicales alifáticos y ciclo-alifáticos antes mencionados pueden ser opcionalmente sustituidos con uno o más R<sup>6</sup>, los cuales se seleccionan independientemente uno de otro;

25 NR<sup>9a</sup>R<sup>9b</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>7</sup>, -S(O)<sub>n</sub>NR<sup>9a</sup>R<sup>9b</sup>, C(=O)R<sup>6</sup>, C(=O)OR<sup>7</sup>, C(=O)NR<sup>9a</sup>R<sup>9b</sup>, C(=S)R<sup>6</sup>, C(=S)SR<sup>7</sup>, C(=S)NR<sup>9a</sup>R<sup>9b</sup>, C(=NR<sup>8</sup>)R<sup>6</sup>;

30 fenilo, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes R<sup>10</sup>, los cuales se seleccionan independientemente uno de otro, un anillo heterocíclico aromático de 3-, 4-, 5-, 6- o 7- miembros saturado, parcialmente saturado o insaturado que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre, opcionalmente sustituidos con k sustituyentes R<sup>10</sup>, seleccionados independientemente uno de otro, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden ser opcionalmente oxidados;

35 R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> son seleccionados independientemente uno de otro del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno, ciano, azido, nitro, -SCN, SF<sub>5</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalcoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilsulfinilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilsulfonilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalquiltio, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-cicloalquilo, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-halocicloalquilo, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alqueno, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-haloalqueno, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alquino, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> haloalquino, en donde los átomos de carbono de los radicales alifáticos y ciclo-alifáticos antes mencionados pueden ser opcionalmente sustituidos con uno o más R<sup>6</sup>, los cuales se seleccionan independientemente uno de otro;

Si(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>R<sup>12</sup>, OR<sup>7</sup>, OSO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>7</sup>, S(O)<sub>n</sub>NR<sup>9a</sup>R<sup>9b</sup>, NR<sup>9a</sup>R<sup>9b</sup>, C(=O)NR<sup>9a</sup>R<sup>9b</sup>, C(=S)NR<sup>9a</sup>R<sup>9b</sup>, C(=O)OR<sup>7</sup>,

fenilo, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes  $R^{10}$ , los cuales se seleccionan independientemente uno de otro;

5 un anillo heterocíclico aromático de 3-, 4-, 5-, 6- o 7- miembros saturado, parcialmente saturado o insaturado que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre, opcionalmente sustituidos con k sustituyentes  $R^{10}$ , seleccionados independientemente uno de otro, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden ser opcionalmente oxidados,

o

$R^1$  y  $R^2$  pueden formar juntos  $=O$ ,  $=CR^{13}R^{14}$ ;

$=CR^{13}NR^{17a}R^{17b}$ ,  $=S(O)_nR^{16}$ ;

10  $=S(O)_nNR^{17a}R^{17b}$ ,  $=NR^{17a}$ ,  $=NOR^{16}$ ;

$=NNR^{17a}$ ;

o

15  $R^1$  y  $R^2$  pueden formar junto con los átomos de carbono a los cuales  $R^1$  y  $R^2$  están enlazados a un anillo de 3-, 4-, 5-, 6-, 7- u 8- miembros saturado, parcial o completamente insaturado, o carboxílico o heterocíclico aromático que comprende opcionalmente 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre y/o opcionalmente sustituidos con k sustituyentes  $R^{10}$ , seleccionados independientemente uno de otro, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden ser opcionalmente oxidados;

$R^3$  es seleccionado del grupo que consiste de halógeno;

20  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$  son seleccionados independientemente uno de otro del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno, ciano, azido, nitro, -SCN,  $SF_5$ ,  $C_1$ - $C_6$ -alquilo,  $C_3$ - $C_8$ -cicloalquilo, en donde los átomos de carbono de los dos últimos radicales alifáticos y ciclo-alifáticos pueden ser opcionalmente sustituidos con uno o más  $R^6$ , los cuales se seleccionan independientemente uno de otro,  $OR^7$ ,  $-OS(O)_nR^7$ ,  $S(O)_nR^7$ ,  $NR^{9a}R^{9b}$ ,  $N(R^{9a})C(=O)R^6$ ,  $CHO$ ,  $C(=O)R^6$ ,  $-C(=O)OR^7$ ,  $C(=NR^{9a})R^6$ ,  $C(=S)R^6$ ,

25 fenilo, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de  $R^{10}$ , los cuales se seleccionan independientemente uno de otro, y

un anillo heterocíclico aromático de 3-, 4-, 5-, 6- o 7- miembros saturado, parcialmente saturado o insaturado;

30  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son seleccionados independientemente uno de otro del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, SCN,  $SF_5$ ,  $C_1$ - $C_6$ -alquilo,  $C_3$ - $C_8$ -cicloalquilo, en donde los átomos de carbono de los últimos dos radicales alifáticos y ciclo-alifáticos pueden ser opcionalmente sustituidos con uno o más  $R^6$ , seleccionados independientemente uno de otro,  $OR^7$ ,  $S(O)_nR^7$ ,  $NR^{9a}R^{9b}$ ,  $C(=O)R^6$ ,  $-C(=O)OR^7$ ,  $C(=NR^8)R^6$ , y  $C(=S)NR^6$ ;

y

35  $R^{5b}$  es seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, -SCN,  $SF_5$ ,  $C_1$ - $C_6$ -alquilo,  $C_1$ - $C_6$ -alquilo,  $C_3$ - $C_8$ -cicloalquilo,  $C_2$ - $C_6$ -alquenoilo,  $C_2$ - $C_6$ -alquinoilo, en donde las cadenas alifáticas de los cinco últimos radicales pueden ser opcionalmente sustituidos con uno o más  $R^6$ , seleccionados independientemente uno de otro,  $Si(R^{11})_2R^{12}$ ,  $OR^7$ ,  $OS(O)_nR^7$ ,  $S(O)_nR^7$ ,  $NR^{9a}R^{9b}$ ,  $N(R^{9a})C(=O)R^6$ ,  $C(=O)R^6$ ,  $C(=O)OR^7$ ,  $C(=NR^{9a})R^6$ ,  $C(=S)NR^6$ ,

40 fenilo, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes  $R^{10}$ , los cuales se seleccionan independientemente uno de otro; y un anillo heterocíclico aromático de 3-, 4-, 5-, 6- o 7- miembros saturado, parcialmente saturado o insaturado que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre, opcionalmente sustituidos con k sustituyentes  $R^{10}$ , seleccionados independientemente uno de otro, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden ser opcionalmente oxidados;

45  $R^6$  es seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno, ciano, azido, nitro, -SCN,  $SF_5$ ,  $C_1$ - $C_6$ -alquilo,  $C_1$ - $C_6$ -haloalquilo,  $C_1$ - $C_6$ -alkoxi,  $C_1$ - $C_6$ -haloalcoxi,  $C_1$ - $C_6$ -alquilitio,  $C_1$ - $C_6$ -alquilsulfinilo,  $C_1$ - $C_6$ -alquilsulfonilo,  $C_1$ - $C_6$ -haloalquilitio,  $C_3$ - $C_8$ -cicloalquilo,  $C_3$ - $C_8$ -halocicloalquilo,  $C_2$ - $C_6$ -alquenoilo,  $C_2$ - $C_6$ -haloalquenoilo,  $C_2$ - $C_6$ -alquinoilo,  $C_2$ - $C_6$ -haloalquinoilo,  $Si(R^{11})_2R^{12}$ ,  $OR^{16}$ ,  $OSO_2R^{16}$ ,  $S(O)_nR^{16}$ ,  $S(O)_nNR^{17a}R^{17b}$ ,  $2, NR^{17a}R^{17b}$ ,  $NR^{17a}C(=O)R^{16}$ ,  $C(=O)NR^{17a}R^{17b}$ ,  $C(=S)NR^{17a}R^{17b}$ ,  $C(=O)OR^{16}$ ,

fenilo, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes  $R^{18}$ , los cuales se seleccionan independientemente uno de otro;

- un anillo heterocíclico aromático de 3-, 4-, 5-, 6- o 7- miembros saturado, parcialmente saturado o insaturado que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre, opcionalmente sustituidos con k sustituyentes  $R^{18}$ , seleccionados independientemente uno de otro, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden ser opcionalmente oxidados;
- 5 o
- dos  $R^6$  presentes en un átomo de carbono pueden formar juntos  $=O$ ,  $=CR^{13}R^{14}$ ,  $=S(O)_nR^{16}$ ,  $=S(O)_nNR^{17a}R^{17b}$ ,  $=NR^{17a}$ ,  $=NOR^{16}$ ,  $=NNR^{17a}R^{17b}$ ;
- o
- 10 dos  $R^6$  pueden formar un anillo de 3-, 4-, 5-, 6-, 7- u 8 miembros saturado o parcialmente insaturado carbocíclico o heterocíclico junto con los átomos de carbono a los que los dos  $R^6$  están enlazados a
- $R^7$  es, independientemente uno de otro, seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, ciano,  $C_1$ - $C_6$ -alquilo,  $C_1$ - $C_6$ -haloalquilo,  $C_1$ - $C_6$ -alkoxi,  $C_1$ - $C_6$ -haloalcoxi,  $C_1$ - $C_6$ -alquiltio,  $C_1$ - $C_6$ -alquilsulfinilo,  $C_1$ - $C_6$ -alquilsulfonilo,  $C_1$ - $C_6$ -haloalquiltio,  $C_3$ - $C_8$ -cicloalquilo,  $C_4$ - $C_8$ -alquilocicloalquilo,  $C_3$ - $C_8$ -halocicloalquilo,  $C_2$ - $C_6$ -alqueno,  $C_2$ - $C_6$ -haloalqueno,  $C_2$ - $C_6$ -alquinilo,  $C_2$ - $C_6$  haloalquinilo,  $-Si(R^{11})_2R^{12}$ ,  $S(O)_nR^{16}$ ,  $-S(O)_nNR^{17a}R^{17b}$ ,  $NR^{17a}R^{17b}$ ,  $-N=CR^{13}R^{14}$ ,  $-C(=O)R^{16}$ ,  $C(=O)NR^{17a}R^{17b}$ ,  $C(=S)NR^{17a}R^{17b}$ ,  $C(=O)OR^{16}$ ,
- 15  $C(=O)NR^{17a}R^{17b}$ ,  $C(=S)NR^{17a}R^{17b}$ ,  $C(=O)OR^{16}$ , fenilo, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes  $R^{18}$ , los cuales se seleccionan independientemente uno de otro;
- un anillo heterocíclico aromático de 3-, 4-, 5-, 6- o 7- miembros saturado, parcialmente saturado o insaturado que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre, opcionalmente sustituidos con k sustituyentes  $R^{18}$ , seleccionados independientemente uno de otro, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden ser opcionalmente oxidados;
- 20  $R^8$  es seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, nitro, ciano,  $C_1$ - $C_{10}$ -alquilo,  $C_3$ - $C_8$ -cicloalquilo,  $C_2$ - $C_{10}$ -alqueno,  $C_2$ - $C_{10}$ -alquinilo, en donde los átomos de carbono de los radicales alifáticos y cicloalifáticos anteriormente mencionados pueden ser opcionalmente sustituidos con uno o más  $R^{15}$ , los cuales se seleccionan independientemente uno de otro;
- 25  $NR^{17a}R^{17b}$ ,  $Si(R^{11})_2R^{12}$ ,  $OR^{16}$ ,  $S(O)_nR^{16}$ ,  $S(O)_nNR^{17a}R^{17b}$ ,  $C(=O)R^{15}$ ,  $-C(=O)OR^{16}$ ,  $C(=O)NR^{17a}R^{17b}$ ,  $C(=S)R^{15}$ ,  $C(=S)SR^{16}$ ,  $C(=S)NR^{17a}R^{17b}$ ,  $C(=NR^{17a})R^{15}$ ;
- fenilo, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes  $R^{18}$ , los cuales se seleccionan independientemente uno de otro; un anillo heterocíclico aromático de 3-, 4-, 5-, 6- o 7- miembros saturado, parcialmente saturado o insaturado que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre, opcionalmente sustituidos con k sustituyentes  $R^{18}$ , seleccionados independientemente uno de otro, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden ser opcionalmente oxidados;
- 30  $R^{9a}$ ,  $R^{9b}$  son seleccionados independientemente uno de otro del grupo que consiste de hidrógeno,  $C_1$ - $C_6$ -alquilo, opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes  $R^{10}$ ;
- 35  $C_1$ - $C_6$ -haloalquilo,  $C_1$ - $C_6$ -alkoxi,  $C_1$ - $C_6$ -haloalcoxi,  $C_1$ - $C_6$ -alquiltio,  $C_1$ - $C_6$ -haloalquiltio,  $C_3$ - $C_8$ -halocicloalquilo,  $C_2$ - $C_6$ -alqueno,  $C_2$ - $C_6$ -haloalqueno,  $C_2$ - $C_6$ -alquinilo,  $C_2$ - $C_6$  haloalquinilo,  $S(O)_nR^{16}$ ,  $-S(O)_nNR^{17a}R^{17b}$ ,  $C(=O)R^{15}$ ,  $C(=O)OR^{16}$ ,  $C(=O)NR^{17a}R^{17b}$ ,  $C(=S)R^{15}$ ,  $C(=S)SR^{16}$ ,  $C(=S)NR^{17a}R^{17b}$ ,  $C(=NR^{17a})R^{15}$ , fenilo, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes  $R^{18}$ , los cuales se seleccionan independientemente uno de otro;
- 40 un anillo heterocíclico aromático de 3-, 4-, 5-, 6- o 7- miembros saturado, parcialmente saturado o insaturado que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre, opcionalmente sustituidos con k sustituyentes  $R^{18}$ , seleccionados independientemente uno de otro, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden ser opcionalmente oxidados;
- o,
- 45  $R^{9a}$  y  $R^{9b}$  son juntos una cadena a  $C_2$ - $C_7$  alqueno y forman un anillo aromático de 3-, 4-, 5-, 6-, 7- u 8- miembros saturado, parcialmente saturado o insaturado junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, en donde la cadena de alqueno puede contener uno o dos heteroátomos seleccionados de oxígeno, azufre o nitrógeno, y pueden ser opcionalmente sustituidos con halógeno,  $C_1$ - $C_6$ -alquilo,  $C_1$ - $C_6$ -haloalquilo,  $C_1$ - $C_6$ -alkoxi,  $C_1$ - $C_6$ -haloalcoxi,  $C_1$ - $C_6$ -alquiltio,  $C_1$ - $C_6$ -haloalquiltio,  $C_3$ - $C_8$ -cicloalquilo,  $C_3$ - $C_8$ -halocicloalquilo,  $C_2$ - $C_6$ -alqueno,  $C_2$ - $C_6$ -haloalqueno,
- 50  $C_2$ - $C_6$ -alquinilo,  $C_2$ - $C_6$  haloalquinilo;

fenilo, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes  $R^{18}$ ; los cuales se seleccionan independientemente uno de otro;

5 un anillo heterocíclico aromático de 3-, 4-, 5-, 6- o 7- miembros saturado, parcialmente saturado o insaturado que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre, opcionalmente sustituidos con k sustituyentes  $R^{18}$ , seleccionados independientemente uno de otro, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden ser opcionalmente oxidados;

10  $R^{10}$  es seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno, ciano, azido, nitro, SCN,  $SF_5$ ,  $C_1-C_{10}$ -alquilo,  $C_3-C_8$ -cicloalquilo,  $C_2-C_{10}$ -alqueno,  $C_2-C_{10}$ -alquino, en donde los átomos de carbono de los radicales alifáticos y cicloalifáticos anteriormente mencionados pueden ser opcionalmente sustituidos con uno o más  $R^{15}$ , los cuales se seleccionan independientemente uno de otro;  $Si(R^{11})_2R^{12}$ ,  $OR^{16}$ ,  $OS(O)_nR^{16}$ ,  $-S(O)_nR^{16}$ ,  $S(O)_nNR^{17a}R^{17b}$ ,  $NR^{17a}R^{17b}$ ,  $C(=O)R^{15}$ ,  $C(=O)OR^{16}$ ,  $-C(=NR^{17a})R^{15}$ ,  $C(=O)NR^{17a}R^{17b}$ ,  $C(=S)NR^{17a}R^{17b}$ , fenilo, opcionalmente sustituido con halógeno, ciano, nitro,  $C_1-C_6$ -alquilo,  $C_1-C_6$ -haloalquilo,  $C_1-C_6$ -alcoxi o  $C_1-C_6$ -haloalcoxi;

15 un anillo heterocíclico aromático de 3-, 4-, 5-, 6- o 7- miembros saturado, parcialmente saturado o insaturado que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre, opcionalmente sustituidos con k sustituyentes seleccionados independientemente uno de otro de halógeno, ciano,  $NO_2$ ,  $C_1-C_6$ -alquilo,  $C_1-C_6$ -haloalquilo,  $C_1-C_6$ -alcoxi o  $C_1-C_6$ -haloalcoxi, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden ser opcionalmente oxidados; o dos  $R^{10}$  presentes juntos en un átomo de un heterocíclico parcialmente saturado pueden ser  $=O$ ,  $=CR^{13}R^{14}$ ,  $=S(O)_nR^{16}$ ,  $=S(O)_nNR^{17a}R^{17b}$ ,  $=NR^{17a}$ ,  $=NOR^{16}$  o  $=NNR^{17a}$ , o, dos  $R^{10}$  en átomos de carbono adyacentes pueden ser un puente seleccionado de  $CH_2CH_2CH_2CH_2$ ,  $CH=CH-CH=CH$ ,  $N=CH-CH=CH$ ,  $CH=N-CH=CH$ ,  $N=CH-N=CH$ ,  $OCH_2CH_2CH_2$ ,  $OCH=CHCH_2$ ,  $CH_2OCH_2CH_2$ ,  $OCH_2CH_2O$ ,  $OCH_2OCH_2$ ,  $CH_2CH_2CH_2$ ,  $CH=CHCH_2$ ,  $CH_2CH_2O$ ,  $CH=CHO$ ,  $CH_2OCH_2$ ,  $CH_2C(=O)O$ ,  $C(=O)OCH_2$ ,  $O(CH_2)O$ ,  $SCH_2CH_2CH_2$ ,  $SCH=CHCH_2$ ,  $CH_2SCH_2CH_2$ ,  $SCH_2CH_2S$ ,  $SCH_2SCH_2$ ,  $CH_2CH_2S$ ,  $CH=CHS$ ,  $CH_2SCH_2$ ,  $CH_2C(=S)S$ ,  $C(=S)SCH_2$ ,  $S(CH_2)S$ ,  $CH_2CH_2NR^{9a}$ ,  $CH_2CH=N$ ,  $CH=CHNR^{9a}$ ,  $OCH=N$ ,  $SCH=N$  y forman junto con los átomos de carbono a los cuales los dos  $R^{10}$  están enlazados a un anillo carboxílico o heterocíclico aromático de 5- miembros o de 6- miembros

25 parcialmente saturado o insaturado, en donde el anillo puede ser sustituido con uno o dos sustituyentes seleccionados de  $=O$ ,  $OH$ ,  $CH_3$ ,  $OCH_3$ , halógeno, halometilo o halometoxi;

$R^{11}$ ,  $R^{12}$  son seleccionados independientemente uno de otro del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno,  $C_1-C_6$  alquilo,  $C_1-C_6$  haloalquilo,  $C_1-C_6$  alcoxilquilo,  $C_2-C_6$  alqueno,  $C_2-C_6$  haloalqueno,  $C_2-C_6$  alquino,  $C_2-C_6$  haloalquino,  $C_3-C_8$  cicloalquilo,  $C_3-C_8$  halocicloalquilo,  $C_1-C_6$  alcoxilquilo,  $C_1-C_6$  haloalcoxilquilo,

30 fenilo, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes  $R^{18}$ ; los cuales se seleccionan independientemente uno de otro;

un anillo heterocíclico aromático de 3-, 4-, 5-, 6- a 7- miembros saturado, parcialmente saturado o insaturado que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre, opcionalmente sustituidos con k sustituyentes  $R^{18}$ , seleccionados independientemente uno de otro, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden ser opcionalmente oxidados;

35

$R^{13}$   $R^{14}$  son seleccionados independientemente uno de otro de hidrógeno,  $C_1-C_4$  alquilo,  $C_1-C_6$  cicloalquilo,  $C_1-C_4$  alcoxilquilo, fenilo o bencilo;

40  $R^{15}$  es seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno, ciano, azido, nitro,  $OH$ ,  $SH$ ,  $SCN$ ,  $SF_5$ ,  $C_1-C_6$ -alcoxi,  $C_1-C_6$ -haloalcoxi,  $C_1-C_6$ -alquiltio,  $C_1-C_6$ -alquilsulfino,  $C_1-C_6$ -alquilsulfonilo,  $C_1-C_6$ -haloalquiltio, trimetilsililo, trietilsililo, tertbutildimetilsililo, ( $C_1-C_6$ -alquil)amino o di-( $C_1-C_6$ -alquil)amino, ( $C_1-C_6$ -haloalquil)amino o di-( $C_1-C_6$ -haloalquil)amino,  $C_1-C_6$ -alquilo,  $C_2-C_6$ -alqueno,  $C_2-C_6$ -alquino,  $C_3-C_8$ -cicloalquilo, en donde los cuatro últimos radicales alifáticos y cicloalifáticos mencionados pueden ser no sustituidos, parcial o totalmente halogenados y/o oxigenados y/o pueden llevar 1 o 2 radicales seleccionados de  $C_1-C_4$  alcoxi;

45 fenilo, bencilo, piridilo, fenoxi, en donde los cuatro últimos radicales pueden ser no sustituidos, parcial o totalmente halogenados y/o llevar 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados de  $C_1-C_6$ -alquilo,  $C_1-C_6$ -haloalquilo,  $C_1-C_6$ -alcoxi,  $C_1-C_6$ -haloalcoxi, ( $C_1-C_6$ -alcoxi)carbonilo, ( $C_1-C_6$ -alquil)amino o di-( $C_1-C_6$ -alquil)amino;

o

dos  $R^{15}$  presentes en el mismo átomo de carbono pueden ser juntos  $=O$ ,  $=CH(C_1-C_4\text{-alquil})$ ,  $=C(C_1-C_4\text{-alquil})C_1-C_4\text{-alquilo}$ ,  $=N(C_1-C_6\text{-alquil})$  o  $=NO(C_1-C_6\text{-alquil})$ ;

50  $R^{16}$  es seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, ciano,  $C_1-C_6$ -alcoxi,  $C_1-C_6$ -haloalcoxi,  $C_1-C_6$ -alquiltio,  $C_1-C_6$ -alquilsulfino,  $C_1-C_6$ -alquilsulfonilo,  $C_1-C_6$ -haloalquiltio, trimetilsililo, trietilsililo, tertbutildimetilsililo,  $C_1-C_6$ -alquilo,  $C_2-C_6$ -alqueno,  $C_2-C_6$ -alquino,  $C_3-C_8$ -cicloalquilo, en donde los cuatro últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos, parcial o completamente halogenados y/o oxigenados y/o pueden llevar 1 o 2 radicales seleccionados de  $C_1-C_4$  alcoxi ciclopropilo o halociclopropilo;

fenilo, bencilo, piridilo, fenoxi, en donde los cuatro últimos radicales pueden ser no sustituidos, parcial o completamente halogenados y/o llevar 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados de C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalcoxi o (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alcoxi)carbonilo;

5 R<sup>17a</sup>, R<sup>17b</sup> es seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, ciano, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalcoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilsulfinilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilsulfonilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalquiltio, trimetilsililo, trietilsililo, tertbutildimetilsililo,

10 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alqueno, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alquino, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-cicloalquilo, en donde los cuatro últimos radicales alifáticos y ciclo-alifáticos mencionados pueden ser no sustituidos, parcial o completamente halogenados y/o oxigenados y/o pueden llevar 1 o 2 radicales seleccionados de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo, ciclopropilo, halociclopropilo o piridilo; fenilo, bencilo, piridilo, fenoxi, en donde los últimos cuatro radicales mencionados pueden ser no sustituidos, parcial o completamente halogenados y/o llevar 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados de C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalcoxi o (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alcoxi)carbonilo;

o,

15 R<sup>17a</sup> y R<sup>17b</sup> pueden ser juntos una cadena de C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alqueno que forman un anillo de 3 a 7 miembros saturado, parcialmente saturado o insaturado, junto con el átomo de nitrógeno R<sup>17a</sup> y R<sup>17b</sup> al que están unidos, en donde la cadena de alqueno puede contener 1 o 2 heteroátomos seleccionados de oxígeno, azufre o nitrógeno, y pueden ser sustituidos opcionalmente con halógeno, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxi o C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalcoxi, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden ser opcionalmente oxidados;

20 R<sup>18</sup> es seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, ciano, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalcoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilsulfinilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilsulfonilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalquiltio, trimetilsililo, trietilsililo, tertbutildimetilsililo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alqueno, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alquino, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-cicloalquilo, en donde los cuatro últimos radicales alifáticos y ciclo-alifáticos mencionados pueden ser no sustituidos, parcial o completamente halogenados y/o oxigenados y/o pueden llevar 1 o 2 radicales seleccionados de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> -alkoxi;

25 fenilo, bencilo, piridilo, fenoxi, en donde los últimos cuatro radicales mencionados pueden ser no sustituidos, parcial o completamente halogenados y/o llevar 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados de C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalcoxi, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alcoxi)carbonilo;

o

dos R<sup>18</sup> juntos presentes en un átomo de un átomo parcialmente saturado pueden ser =O, =N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquil), =NO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquil), =CH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquil) o =C(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquil)C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl;

o,

30 dos R<sup>18</sup> en dos átomos de carbono adyacentes pueden ser juntos una cadena de C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alqueno, que forman junto con el átomo de carbono al que están unidos a un aromático de 3, 4, 5, 6 ó 7 miembros saturado, parcialmente saturado o no saturado, en donde la cadena de alqueno puede contener 1 o 2 heteroátomos seleccionados de oxígeno, azufre o nitrógeno, y pueden ser sustituidos opcionalmente con halógeno, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxi o C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalcoxi, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden ser opcionalmente oxidados;

35 n es 0, 1 o 2;

k es un entero seleccionado de 0 a 10;

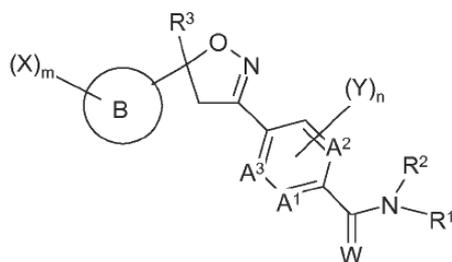
o un enantiómero, diaestereómero y sal del mismo,

con la condición de que los compuestos de isoxazolina cetónica sustituidos de fórmula (I-5) no representan

40 1-{4-[5-(3,5-Dicloro-fenil)-5-trifluorometil-4,5-dihidro-isoxazol-3-il]-2-metil-fenil}-etanona, 1-{4-[5-(3,5-Dicloro-fenil)-5-trifluorometil-4,5-dihidro-isoxazol-3-il]-2-metil-fenil}-3-metil-butan-1-ona o

metil éster del ácido {4-[5-(3,5-Dicloro-fenil)-5-trifluorometil-4,5-dihidro-isoxazol-3-il]-2-metil-fenil}-oxo-acético.

En general se han descrito anteriormente isoxazolinas arilo. Isoxazolinas arilo insecticidas de la siguiente fórmula



5 en donde, inter alia, cada uno de A1, A2 y A3 son, independientemente, carbono o nitrógeno, B es un anillo de benceno, y W definido como oxígeno o azufre, se divulgan en la WO 2005/085216 (US 20070066617 correspondiente). Una isoxazolinona arilo similar a aquellas utilizadas en mezclas de pesticidas se ha descrito en la JP 2009-108046 y las solicitudes internacionales WO2010/003923 y WO 0000061009. Estos documentos no divulgan isoxazolinonas que incorporen un grupo amidina arilo sustituido de acuerdo con la presente invención.

10 Se describen adicionalmente isoxazolinonas arilo insecticidas relacionadas en JP 2007-016017, WO 2007/026965, JP 2007-106756, WO 2007/070606, WO 2007/075459, WO 2007/079162, WO 2007/105814, WO 2007/125984, WO 2008/012027, WO 2008/019760, WO 2008/108448, JP 2008-239611, WO 2008/122375, WO 2008/130651, WO 2007/026965, WO 2009/126668, WO2009/051956, WO 2009/080250, WO 2009/002809, WO 2009/112275 y US 20080262057. Ninguno de estos documentos divulga isoxazolinonas que incorporen un grupo cetona arilo sustituido de acuerdo con la presente invención. Lo mismo se aplica a las solicitudes internacionales no publicadas PCT/EP2009/067037 y PCT/EP2009/067777. Isoxazolinona arilo con un patrón de sustitución diferente en la unidad estructural arilo de la molécula se ha descrito en la Solicitud Provisional de los Estados Unidos 61/287895.

15 Aril cetonas insecticidas se divulgan en la WO 2009/002809 y la WO 2009/112275. Estos documentos divulgan cetonas naftilo sustituidas con isoxazolinona como intermediarios (para la WO 2009/002809, véase la página 26, Tab. I.1) y cetonas cíclicas recogidas (WO 2009/112275) con 5 ejemplos preparados. Estos documentos no divulgan aril cetonas de acuerdo con la presente invención.

20 También se divulgan aril cetonas insecticidas en la WO 88/05046, WO 88/06583, US 4,863,947 y la JP 08217754. Estos documentos no divulgan aril cetonas que incorporen un grupo de isoxazolinona de acuerdo con la presente invención.

25 Se divulgan también aril cetonas insecticidas en la WO 2004/056735. Este documento no divulga aril cetonas que incorpore un grupo isoxazolinona que porte un átomo de carbono cuaternario en la posición 5 de la isoxazolinona de acuerdo con la presente invención. Se han descrito diversos compuestos 3-aril-2-isoxazolinonas para representar una novedosa serie de miméticos sLeX con actividad antiinflamatoria, y se divulgan en, por ejemplo, Journal of Medicinal Chemistry (2001), 44 (13), 2094-2107. Sin embargo, estos documentos no divulgan aril cetonas que incorporen un grupo isoxazolinona que porte un átomo de carbono cuaternario en la posición 5 de la isoxazolinona de acuerdo con la presente invención. Además, tampoco se divulga la utilidad de la misma como un pesticida.

30 Los compuestos de cetona sustituidos de la fórmula (I-5), y sus sales agrícolamente aceptables son altamente activos contra plagas animales, esto es artrópodos y nematodos perjudiciales, especialmente contra insectos y ácaros difíciles de controlar.

De acuerdo con lo anterior, la presente invención se relaciona con compuestos de cetona sustituidos de la fórmula general (I-5), con sus sales útiles desde el punto de vista agrícola o veterinario, sus enantiómeros o diastereómeros.

35 Los compuestos de isoxazolinona cetónicos sustituidos de la fórmula (I-5), y sus sales aceptables desde el punto de vista agrícola son altamente activos contra plagas animales, esto es artrópodos y nematodos perjudiciales, especialmente contra insectos y ácaros difíciles de controlar.

De acuerdo con lo anterior, la presente invención se relaciona con compuestos de isoxazolinona cetónicos sustituidos de la fórmula general (I-5), con sus sales útiles desde el punto de vista agrícola o veterinario, sus enantiómeros o diastereómeros.

40 Además, la presente invención se relaciona con e incluye las siguientes realizaciones

- composiciones agrícolas y veterinarias que comprenden una cantidad de al menos un compuesto de la fórmula (I-5) o un enantiómero, diastereómero o sal del mismo;

- el uso de un compuesto de fórmula (I-5) o un enantiómero, diastereómero o sal del mismo para combatir plagas animales;

- 5 - un método para combatir plagas animales que comprende poner en contacto las plagas animales, su hábitat, sus terrenos de crianza, sus suministros de alimento, plantas, semillas, suelo, áreas, materiales o ambiente en los cuales las plagas animales crecen o pueden crecer, o los materiales, plantas, semillas, suelos, superficies o espacios que van a ser protegidos de ataque o infestación de animales con una cantidad efectiva como pesticida de al menos un compuesto de la fórmula (I-5) o un enantiómero, diastereómero o sal del mismo;
- 10 - un método para proteger cultivos del ataque o infestación por plagas animales, que comprende poner en contacto un cultivo con una cantidad efectiva como pesticida de al menos un compuesto de la fórmula (I-5) o un enantiómero, diastereómero o sal del mismo;
- 10 - un método para la protección de propagación de plantas, especialmente semillas, de los insectos del suelo y de las raíces y brotes de las plantas de semillero del suelo y de los insectos foliares que comprende poner en contacto las semillas antes de la siembra y/o después de la pregerminación con al menos un compuesto de la fórmula (I-5), o los enantiómeros, diastereómeros o sales de los mismos;
- semillas que comprenden un compuesto de la fórmula (I-5) o un enantiómero, diastereómero o sal del mismo;
- 15 - el uso de compuestos de fórmula (I-5) o los enantiómeros, diastereómeros o sales aceptables desde el punto de vista veterinario de los mismos para combatir parásitos en y sobre animales.
- un método para tratar, controlar, prevenir o proteger animales contra la infestación o infección por parásitos que comprende la administración por vía oral, tópica o parenteral o la aplicación a los animales una cantidad parasiticida efectiva de un compuesto de fórmula (I-5) o los enantiómeros, diastereómeros y/o sales aceptables desde el punto de vista veterinario del mismo;
- 20 - un proceso para la preparación de una composición veterinaria para tratar, controlar, prevenir o proteger animales contra la infestación o infección por parásitos que comprende agregar una cantidad parasiticida efectiva de un compuesto de fórmula (I-5) o los enantiómeros, diastereómeros y/o sal del mismo aceptable desde el punto de vista veterinario para una composición de vehículo adecuado para uso veterinario;
- 25 - el uso de un compuesto de fórmula (I-5) o los enantiómeros, diastereómeros y/o sal veterinaria aceptable del mismo para la preparación de un medicamento para tratar, controlar, prevenir o proteger animales contra la infestación o infección por parásitos;
- La presente invención también se relaciona con materiales de propagación de plantas, en particular semillas, que comprende al menos un compuesto de fórmula (I-5) y/o una sal aceptable desde el punto de vista agrícola del mismo.
- 30 La presente invención se relaciona con todos los posibles estereoisómeros de los compuestos de fórmula (I-5), esto es, enantiómeros o diastereómeros individuales, así como a mezclas de los mismos.
- Los compuestos de la presente invención pueden ser amorfos o pueden existir en uno o más diferentes estados cristalinos (polimorfos) o modificaciones que pueden tener diferentes propiedades macroscópicas tales como la estabilidad o mostrar diferentes propiedades biológicas tales como las actividades. La presente invención incluye
- 35 ambos compuestos amorfos y cristalinos de la fórmula (I-5), mezclas de diferentes estados cristalinos o modificaciones del compuesto respectivo (I-5), así como sales amorfas o cristalinas de los mismos.
- Las sales de los compuestos de la fórmula (I-5) son preferiblemente sales aceptables desde el punto de vista agrícola y veterinario. Se pueden formar en un método habitual, por ejemplo, haciendo reaccionar el compuesto con un ácido del anión en cuestión si el compuesto de fórmula (I-5) tiene una funcionalidad básica o haciendo reaccionar
- 40 un compuesto ácido de fórmula I con una base adecuada.
- Sales útiles adecuadas desde el punto de vista agrícola o veterinario son especialmente las sales de aquellos cationes o las sales de adición ácida de aquellos ácidos cuyos cationes y aniones, respectivamente, no tienen ningún efecto adverso sobre la acción de los compuestos de acuerdo con la presente invención. Los cationes adecuados son en particular los iones de los metales alcalinos, preferiblemente litio, sodio y potasio, de los metales
- 45 alcalinotérreos, preferiblemente calcio, magnesio y bario, y de los metales de transición, preferiblemente manganeso, cobre, zinc y hierro, y también amonio ( $\text{NH}_4^+$ ) y amonio sustituido en el que uno a cuatro de los átomos de hidrógeno son reemplazados por  $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alquilo,  $\text{C}_1\text{-C}_4$ -hidroxialquilo,  $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alcoxi,  $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alcoxi- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alquilo, hidroxí- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alcoxi- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alquilo, fenilo o bencilo. Ejemplos de iones de amonio sustituidos comprenden metilamonio, isopropilamonio, dimetilamonio, diisopropilamonio, trimetilamonio, tetrametilamonio, tetraetilamonio,
- 50 tetrabutilamonio, 2-hidroxietilamonio, 2-(2-hidroxietoxi)etil-amonio, bis(2-hidroxietil)amonio, benciltrimetilamonio y benciltrietilamonio, adicionalmente iones de fosfonio, iones de sulfonio, preferiblemente tri(alquilo  $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alquil)sulfonio, y iones de sulfoxonio, preferiblemente tri( $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alquil)sulfoxonio.

- Los aniones de sales de adición ácida útiles son principalmente cloruro, bromuro, fluoruro, sulfato de hidrógeno, sulfato, fosfato dihidrógeno, fosfato de hidrógeno, fosfato, nitrato, carbonato de hidrógeno, carbonato, hexafluorosilicato, hexafluorofosfato, benzoato, y los aniones de ácidos C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alcanoicos, preferiblemente formiato, acetato, propionato y butirato. Se pueden formar haciendo reaccionar los compuestos de las fórmulas (I-5) con un ácido del anión correspondiente, preferiblemente de ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico o ácido nítrico.
- Las unidades estructurales orgánicas mencionadas en las anteriores definiciones de las variables son - como el término halógeno - términos colectivos para listados individuales de los miembros individuales del grupo. El prefijo C<sub>n</sub>-C<sub>m</sub> indica en cada caso el número posible de átomos de carbono en el grupo.
- "Halógeno" se tomará en el sentido significar flúor, cloro, bromo y yodo.
- El término "parcial o totalmente halogenado" se tomará el sentido de que 1 o más, por ejemplo, 1, 2, 3, 4 o 5 o todos los átomos de hidrógeno de un radical dado han sido reemplazados por un átomo de halógeno, en particular por flúor o cloro.
- El término "C<sub>n</sub>-C<sub>m</sub>-alquilo " tal como se usa aquí (y también en C<sub>n</sub>-C<sub>m</sub>-alquilamino, di-C<sub>n</sub>-C<sub>m</sub>-alquilamino, C<sub>n</sub>-C<sub>m</sub>-alquilaminocarbonilo, di-(C<sub>n</sub>-C<sub>m</sub>-alquilamino)carbonilo, C<sub>n</sub>-C<sub>m</sub>-alquiltio, C<sub>n</sub>-C<sub>m</sub>-alquilsulfino y C<sub>n</sub>-C<sub>m</sub>-alquilsulfonilo) se refiere a un grupo hidrocarburo saturado ramificado o no ramificado que tiene de n a m, por ejemplo de 1 a 10 átomos de carbono, preferiblemente de 1 a 6 átomos de carbono, por ejemplo metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, butilo, 1-metilpropilo, 2-metilpropilo, 1,1-dimetiletilo, pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-dimetilpropilo, 1-etilpropilo, hexilo, 1,1-dimetilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, 1-metilpentilo, 2-metilpentilo, 3-metilpentilo, 4-metilpentilo, 1,1-dimetilbutilo, 1,2-dimetilbutilo, 1,3-dimetilbutilo, 2,2-dimetilbutilo, 2,3-dimetilbutilo, 3,3-dimetilbutilo, 1-etilbutilo, 2-etilbutilo, 1,1,2-trimetilpropilo, 1,2,2- trimetilpropilo, 1-etil-1-metilpropilo, 1-etil-2-metilpropilo, heptilo, octilo, 2-etilhexilo, nonilo y decilo y sus isómeros. C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo significa por ejemplo metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, butilo, 1-metilpropilo, 2-metilpropilo o 1,1-dimetiletilo.
- El término "C<sub>n</sub>-C<sub>m</sub>-haloalquilo" tal como se usa aquí (y también en C<sub>n</sub>-C<sub>m</sub>-haloalquilsulfino y C<sub>n</sub>-C<sub>m</sub>-haloalquilsulfonilo) se refiere a un grupo alquilo de cadena recta o ramificada que tiene de n a m átomos de carbono, por ejemplo, de 1 a 10, en particular de 1 a 6 átomos de carbono (como se mencionó anteriormente), donde algunos o todos los átomos de hidrógeno en estos grupos pueden ser reemplazados por átomos de halógeno como se mencionó anteriormente, por ejemplo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalquilo, tal como clorometilo, bromometilo, diclorometilo, triclorometilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluoro-metilo, clorofluorometilo, diclorofluorometilo, clorodifluorometilo, 1-cloroetilo, 1-bromoetilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2-cloro-2-fluoroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 2,2-dicloro-2-fluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, pentafluoroetilo y similares. El término C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-haloalquilo en particular comprende C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-fluoroalquilo, que es sinónimo de metilo o etilo, en donde 1, 2, 3, 4 o 5 átomos de hidrógeno son sustituidos por átomos de flúor, tales como fluorometilo, difluorometilo, trifluoro-metilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo y penta-fluorometilo.
- De la misma forma, "C<sub>n</sub>-C<sub>m</sub>-alcoxi" y "C<sub>n</sub>-C<sub>m</sub>-alquiltio" (o C<sub>n</sub>-C<sub>m</sub>-alquilsulfeno, respectivamente) se refieren a grupos alquilo de cadena lineal o ramificadas que tienen n a m átomos de carbono, por ejemplo, 1 a 10, en particular 1 a 6 o de 1 a 4 átomos de carbono (como se mencionó anteriormente) unidos a través de enlaces de oxígeno o azufre, respectivamente, en cualquier unión en el grupo alquilo. Ejemplos incluyen C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alcoxi tal como metoxi, etoxi, propoxi, isopropoxi, butoxi, sec-butoxi, isobutoxi y tert-butoxi, además C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquiltio tal como metiltio, etiltio, propiltio, isopropiltio, y n-butiltio.
- De acuerdo con lo anterior, los términos "C<sub>n</sub>-C<sub>m</sub>-haloalcoxi" y "C<sub>n</sub>-C<sub>m</sub>-haloalquiltio" (o C<sub>n</sub>-C<sub>m</sub>-haloalquilsulfeno, respectivamente) se refieren a grupos alquilo de cadena lineal o ramificadas que tienen n a m átomos de carbono, por ejemplo, 1 a 10, en particular 1 a 6 o de 1 a 4 átomos de carbono (como se mencionó anteriormente) unido a través de enlaces de oxígeno o azufre, respectivamente, en cualquier unión en el grupo alquilo, donde algunos o todos los átomos de hidrógeno en estos grupos pueden ser reemplazado por átomos de halógeno como se mencionó anteriormente, por ejemplo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-haloalcoxi, tales como clorometoxi, bromometoxi, diclorometoxi, triclorometoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, clorofluorometoxi, diclorofluorometoxi, clorodifluorometoxi, 1-cloroetoxi, 1-bromoetoxi, 1-fluoroetoxi, 2-fluoroetoxi, 2,2-difluoroetoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2-fluoroetoxi, 2-cloro-2,2-difluoroetoxi, 2,2-dicloro-2-fluoroetoxi, 2,2,2-tricloroetoxi y pentafluoroetoxi, además C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-haloalquiltio, tal como clorometiltio, bromometiltio, dicloro-metiltio, triclorometiltio, fluorometiltio, difluorometiltio, trifluorometiltio, clorofluorometiltio, diclorofluorometiltio, clorodifluorometiltio, 1-cloroetiltio, 1-bromoetiltio, 1-fluoroetiltio, 2-fluoroetiltio, 2,2-difluoroetiltio, 2,2,2-trifluoroetiltio, 2-cloro- 2-fluoroetiltio, 2-cloro-2,2-difluoroetiltio, 2,2-dicloro-2-fluoroetiltio, 2,2,2-tricloroetiltio y pentafluoro- etiltio y similares. De la misma manera, los términos C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-fluoroalcoxi y C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-fluoroalquiltio se refieren a C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-fluoroalquilo el cual está unido al resto de la molécula mediante un átomo de oxígeno o un átomo de azufre, respectivamente.
- El término "C<sub>2</sub>-C<sub>m</sub>-alqueno" tal como se utiliza aquí da a entender un grupo hidrocarburo insaturado ramificado o no ramificado que tiene de 2 a m, por ejemplo, de 2 a 10 o de 2 a 6 átomos de carbono y un doble enlace en cualquier posición, tales como etenilo, 1-propenilo, 2- propenilo, 1-metil-etenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-1-

propenilo, 2-metil-1-propenilo, 1-metil-2-propenilo, 2-metil-2-propenilo, 1-pentenilo, 2-pentenilo, 3-pentenilo, 4-pentenilo, 1-metil-1-butenilo, 2-metil-1-butenilo, 3- metil-1-butenilo, 1-metil-2-butenilo, 2-metil-2-butenilo, 3-metil-2-butenilo, 1-metil-3-butenilo, 2-metil-3-butenilo, 3-metil-3-butenilo, 1,1-dimetil-2-propenilo, 1,2-dimetil-1-propenilo, 1,2-dimetil-2-propenilo, 1-etil-1-propenilo, 1- etil-2-propenilo, 1-hexenilo, 2-hexenilo, 3-hexenilo, 4-hexenilo, 5-hexenilo, 1-metil-1-pentenilo, 2-metil-1-pentenilo, 3- metil-1-pentenilo, 4-metil-1-pentenilo, 1-metil-2-pentenilo, 2-metil-2-pentenilo, 3-metil-2-pentenilo, 4-metil-2- pentenilo, 1-metil-3-pentenilo, 2-metil-3-pentenilo, 3-metil-3-pentenilo, 4-metil-3-pentenilo, 1-metil-4-pentenilo, 2- metil-4-pentenilo, 3-metil-4-pentenilo, 4-metil-4-pentenilo, 1,1-dimetil-2-butenilo, 1,1-dimetil-3-butenilo, 1,2-dimetil- 1-butenilo, 1,2-dimetil-2-butenilo, 1,2-dimetil-3-butenilo, 1,3-dimetil-1-butenilo, 1,3-dimetil-2-butenilo, 1,3-dimetil- 3-butenilo, 2,2-dimetil-3-butenilo, 2,3-dimetil-1-butenilo, 2,3-dimetil-2-butenilo, 2,3-dimetil-3-butenilo, 3,3-dimetil- 1-butenilo, 3,3-dimetil-2-butenilo, 1-etil-1-butenilo, 1-etil-2-butenilo, 1-etil-3-butenilo, 2-etil-1-butenilo, 2-etil- 2-butenilo, 2-etil-3-butenilo, 1,1,2-trimetil-2-propenilo, 1-etil-1-metil-2-propenilo, 1-etil-2-metil-1-propenilo y 1-etil-2-metil-2-propenilo.

El término " $C_2$ - $C_m$ -alquino" tal como se utiliza aquí se refiere a un grupo hidrocarburo insaturado ramificado o no ramificado que tiene de 2 a m, por ejemplo, 2 a 10 o de 2 a 6 átomos de carbono y que contiene al menos un enlace triple, tal como etinilo, propinilo, 1- butinilo, 2-butinilo, y similares.

El término " $C_1$ - $C_4$ -alcoxi- $C_1$ - $C_4$ -alquilo" tal como se utiliza aquí, se refiere a alquilo que tiene de 1 a 4 átomos de carbono, por ejemplo, ejemplos específicos similares mencionados anteriormente, en donde un átomo de hidrógeno del radical alquilo es reemplazado por un grupo  $C_1$ - $C_4$ -alcoxi.

El término " $C_3$ - $C_m$ -cicloalquilo" tal como se utiliza aquí se refiere a un radical monocíclico de 3 a m miembros cicloalifáticos saturados, por ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo, ciclooctilo y ciclodecilo.

El término "arilo" tal como se utiliza aquí se refiere a un radical hidrocarburo aromático tal como naftilo o en particular fenilo.

El término "anillo carbocíclico de 3 a 6 miembros" tal como se usa aquí se refiere a anillos de ciclopropano, ciclobutano, ciclopentano y de ciclohexano.

El término "anillo heterocíclico de 3-, 4-, 5-, 6- o 7 miembros saturado, parcialmente insaturado o aromático que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos" o "que contiene grupos de heteroátomo", en donde aquellos grupos de heteroátomos se seleccionan de N, O, S, NO, SO y  $SO_2$  y son miembros de anillo, tal como se usa aquí se refiere a radicales monocíclicos, siendo los radicales monocíclicos saturados, parcialmente insaturados o aromáticos. El radical heterocíclico puede estar unido al resto de la molécula a través de un miembro de anillo de carbono o a través de un miembro de anillo de nitrógeno.

Ejemplos de anillos de 3-, 4-, 5, 6 o 7 miembros saturados heterociclos o heterocíclicos o incluyen: Oxirano, aziridinilo, azetidino, 2 tetrahydrofuranilo, 3-tetrahydrofuranilo, 2 tetrahydrotienilo, 3 tetrahydrotienilo, 2-pirrolidinilo, 3-pirrolidinilo, 3 pirazolidinilo, 4 pirazolidinilo, 5-pirazolidinilo, 2 imidazolidinilo, 4 imidazolidinilo, 2-oxazolidinilo, 4-oxazolidinilo, 5 oxazolidinilo, 3-isoxazolidinilo, 4 isoxazolidinilo, 5 isoxazolidinilo, 2 tiazolidinilo, 4-tiazolidinilo, 5-tiazolidinilo, 3 isotiazolidinilo, 4-isotiazolidinilo, 5 isotiazolidinilo, 1,2,4-oxadiazolidin-3-ilo, 1,2,4 oxadiazolidin-5-ilo, 1,2,4-tiadiazolidin-3-ilo, 1,2,4 tiadiazolidin- 5-ilo, 1,2,4 triazolidin-3-ilo, 1,3,4-oxadiazolidin-2-ilo, 1,3,4 tiadiazolidin-2-ilo, 1,3,4 triazolidin-2-ilo, 2-tetrahidropirano, 4 tetrahidropirano, 1,3-dioxan-5-ilo, 1,4-dioxan-2-ilo, 2-piperidinilo, 3-piperidinilo, 4-piperidinilo, 3-hexahidropiridazinilo, 4 hexahidropiridazinilo, 2-hexahidropirimidinilo, 4-hexahidropirimidinilo, 5 hexahidropirimidinilo, 2-piperazinilo, 1,3,5-hexahidrotiazin-2-ilo y 1,2,4 hexahidrotiazin-3-ilo, 2-morfolinilo, 3-morfolinilo, 2-tiomorfolinilo, 3-tiomorfolinilo, 1-oxotiomorfolin-2-ilo, 1-oxotiomorfolin-3-ilo, 1,1-dioxotiomorfolin-2-ilo, 1,1-dioxotiomorfolin- 3-ilo, hexahidroazepin-1-, -2-, -3- o -4-ilo, hexahidrooxepinilo, hexahidro-1,3-diazepinilo, hexahidro-1,4-diazepinilo, hexahidro-1,3-oxazepinilo, hexahidro-1,4-oxazepinilo, hexahidro-1,3-dioxepinilo, hexahidro-1,4-dioxepinilo y similares.

Ejemplos de anillos de 3-, 4-, 5-, 6- o 7 miembros parcialmente insaturados heterociclos o heterocíclicos incluyen: 2,3- dihydrofur-2-ilo, 2,3-dihydrofur-3-ilo, 2,4-dihydrofur-2-ilo, 2,4-dihydrofur-3-ilo, 2,3-dihydrotien-2-ilo, 2,3 dihydrotien-3-ilo, 2,4 dihydrotien-2-ilo, 2,4-dihydrotien-3-ilo, 2-pirrolin-2-ilo, 3 pirrolin-3-ilo, 3 pirrolin-2-ilo, 3-pirrolin-3-ilo, 2-isoxazolin-3- ilo, 3-isoxazolin-3-ilo, 4 isoxazolin 3 ilo, 2-isoxazolin-4-ilo, 3-isoxazolin-4-ilo, 4-isoxazolin-4-ilo, 2 isoxazolin-5-ilo, 3-isoxazolin- 5-ilo, 4-isoxazolin-5-ilo, 2-isotiazolin-3-ilo, 3 isotiazolin-3-ilo, 4-isotiazolin-3-ilo, 2-isotiazolin-4-ilo, 3-isotiazolin-4-ilo, 4 isotiazolin-4-ilo, 2-isotiazolin-5-ilo, 3-isotiazolin-5-ilo, 4-isotiazolin-5-ilo, 2,3 dihidropirazol-1-ilo, 2,3-dihidropirazol- 2-ilo, 2,3-dihidropirazol-3-ilo, 2,3 dihidropirazol-4-ilo, 2,3-dihidropirazol-5-ilo, 3,4-dihidropirazol-1-ilo, 3,4 dihidropirazol- 3-ilo, 3,4-dihidropirazol-4-ilo, 3,4-dihidropirazol-5-ilo, 4,5 dihidropirazol-1-ilo, 4,5-dihidropirazol-3-ilo, 4,5-dihidropirazol- 4-ilo, 4,5 dihidropirazol-5-ilo, 2,3-dihidrooxazol-2-ilo, 2,3-dihidrooxazol-3-ilo, 2,3 dihidrooxazol-4-ilo, 2,3-dihidrooxazol- 5-ilo, 3,4-dihidrooxazol-2-ilo, 3,4 dihidrooxazol-3-ilo, 3,4-dihidrooxazol-4-ilo, 3,4-dihidrooxazol-5-ilo, 3,4 dihidrooxazol- 2-ilo, 3,4-dihidrooxazol-3-ilo, 3,4-dihidrooxazol-4-ilo, 2-, 3-, 4-, 5- o 6- di- o tetrahidropiridinilo, 3-di- o tetrahidropiridazinilo, 4 di- o tetrahidropiridazinilo, 2-di- o tetrahidropirimidinilo, 4-di- o tetrahidropirimidinilo, 5 di- o tetrahidropirimidinilo, di- o tetrahidropirazinilo, 1,3,5-di- o tetrahidrotiazin-2-ilo, 1,2,4-di- o tetrahidrotiazin-3-ilo, 2,3,4,5-tetrahidro[1H]azepin-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, 3,4,5,6-tetrahidro[2H]azepin-2-, -

3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, 2,3,4,7 tetrahidro[1H]azepin-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, 2,3,6,7 tetrahidro[1H]azepin-1-, -2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, tetrahydrooxepinilo, tal como 2,3,4,5-tetrahidro[1H]oxepin-2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, 2,3,4,7 tetrahidro[1H]oxepin-2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, 2,3,6,7 tetrahidro[1H]oxepin-2-, -3-, -4-, -5-, -6- o -7-ilo, tetrahidro-1,3-diazepinilo, tetrahidro-1,4-diazepinilo, tetrahidro-1,3-oxazepinilo, tetrahidro-1,4-oxazepinilo, tetrahidro-1,3-dioxepinilo y tetrahidro-1,4-dioxepinilo.

Ejemplos de anillos de 5 o 6 miembros aromático heterocíclico (hetero) o heteroaromáticos son: 2-furilo, 3-furilo, 2-tienilo, 3-tienilo, 2-pirrolilo, 3-pirrolilo, 3-pirazolilo, 4-pirazolilo, 5-pirazolilo, 2-oxazolilo, 4-oxazolilo, 5-oxazolilo, 2-tiazolilo, 4-tiazolilo, 5-tiazolilo, 2-imidazolilo, 4-imidazolilo, 1,3,4-triazol-2-ilo, 2-piridinilo, 3-piridinilo, 4-piridinilo, 3-piridazinilo, 4-piridazinilo, 2-pirimidinilo, 4-pirimidinilo, 5-pirimidinilo y 2-pirazinilo.

10 A "C<sub>2</sub>-C<sub>m</sub>-alquileo" es una cadena divalente ramificada o preferiblemente no ramificada saturada alifática que tiene de 2 a m, por ejemplo, 2 a 7 átomos de carbono, por ejemplo CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>, -CH(CH<sub>3</sub>)-, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>), CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>, y CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>.

Preferencias

Las realizaciones y los compuestos preferidos de la presente invención se describen en los siguientes párrafos.

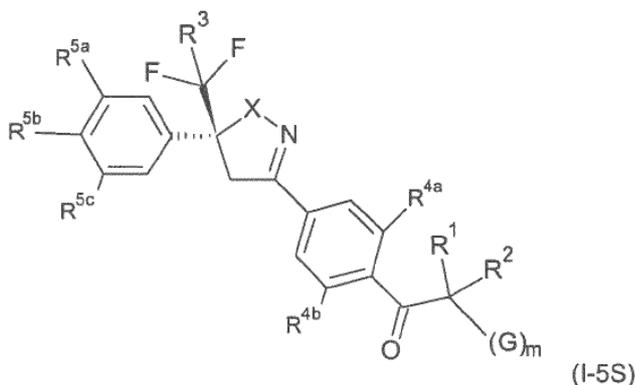
15 Las observaciones hechas a continuación en relación con las realizaciones preferidas de las variables de los compuestos de fórmula (I-5), especialmente con respecto a sus sustituyentes, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4a</sup>, R<sup>4b</sup>, R<sup>5a</sup>, R<sup>5b</sup>, R<sup>5c</sup>, G y M, las características del uso y el método de acuerdo con la invención y de la composición de la invención son válidos tanto en sí mismos y, en particular, en todas las combinaciones posibles una con otra.

20 R<sup>3</sup> se selecciona del grupo que consiste de halógeno, específicamente cloro, bromo y flúor y más específicamente flúor, en particular flúor.

25 Compuestos cetónicos sustituidos preferidos de fórmula (I-5) son aquellos, en donde R<sup>4a</sup>, R<sup>4b</sup> se seleccionan independientemente uno de otro del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, SCN, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-cicloalquilo, en donde los átomos de carbono de los dos últimos radicales alifáticos y cicloalifáticos pueden ser opcionalmente sustituidos con uno o más R<sup>6</sup>, que se seleccionan independientemente uno de otro, OR<sup>7</sup>, -OS(O)<sub>n</sub>R<sup>7</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>7</sup>, NR<sup>9a</sup>R<sup>9b</sup>, N(R<sup>9a</sup>)C(=O)R<sup>6</sup>, C(=O)R<sup>6</sup>, -C(=O)OR<sup>7</sup>, C(=NR<sup>9a</sup>)R<sup>6</sup>, C(=S)R<sup>6</sup>; R<sup>5a</sup> y R<sup>5c</sup> se seleccionan independientemente uno de otro del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno, ciano, OR<sup>7</sup>, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-cicloalquilo, en donde los átomos de carbono de los dos últimos radicales alifáticos y cicloalifáticos pueden ser opcionalmente sustituidos con uno o más R<sup>6</sup>, seleccionados independientemente uno de otro; y R<sup>5b</sup> se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno, ciano, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-cicloalquilo, en donde los cinco últimos radicales alifáticos y cicloalifático pueden ser opcionalmente sustituidos con uno o más R<sup>15</sup>, seleccionados independientemente uno de otro, Si(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>R<sup>12</sup>, OR<sup>7</sup>, OS(O)<sub>n</sub>R<sup>7</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>7</sup>, NR<sup>9a</sup>R<sup>9b</sup>, N(R<sup>9a</sup>)C(=O)R<sup>6</sup>, C(=O)R<sup>6</sup>, C(=O)OR<sup>7</sup>, C(=NR<sup>9a</sup>)R<sup>6</sup> y C(=S)R<sup>6</sup>.

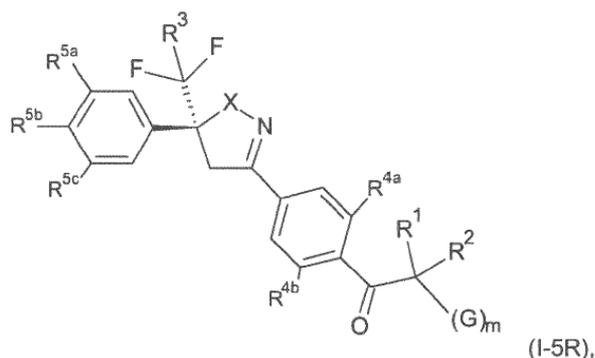
30

Se prefieren los enantiómeros configurados en S de los compuestos cetónicos sustituidos de fórmula (I-5S)



35 donde X es O, y en donde las variables corresponden a las definiciones que se dieron para la fórmula (I-5).

Se prefieren los enantiómeros configurados en S de los compuestos de isoxazolinona cetónica sustituidos de fórmula (I-5R)



donde X es O, y en donde las variables corresponden a las definiciones que se dieron para la fórmula

Se prefieren los compuestos de isoxazolina cetónica sustituidos como de fórmula (I-5), en donde G está presente en la fórmula respectiva, lo que significa que m es 1, y

- 5  $R^1$ ,  $R^2$  se seleccionan preferiblemente independiente uno de otro del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno, ciano, azido, nitro, -SCN,  $SF_5$ ,  $C_1-C_6$ -alquilo,  $C_1-C_6$ -haloalquilo,  $C_1-C_6$ -alcoxi,  $C_1-C_6$ -haloalcoxi,  $C_1-C_6$ -alquiltio,  $C_1-C_6$ -alquilsulfinilo,  $C_1-C_6$ -alquilsulfonilo,  $C_1-C_6$ -haloalquiltio,  $C_3-C_8$ -cicloalquilo,  $C_3-C_8$ -halocicloalquilo,  $C_2-C_6$ -alqueno,  $C_2-C_6$ -haloalqueno,  $C_2-C_6$ -alquino,  $C_2-C_6$  haloalquino, en donde los átomos de carbono de los radicales alifáticos y cicloalifáticos mencionados anteriormente puede ser opcionalmente sustituidos con uno o más  $R^6$ , que se seleccionan independientemente uno de otro,  $Si(R^{11})_2R^{12}$ ,  $OR^7$ ,  $OSO_2R^7$ ,  $S(O)_nR^7$ ,  $S(O)_nNR^{9a}R^{9b}$ ,  $NR^{9a}R^{9b}$ ,  $C(=O)NR^{9a}R^{9b}$ ,  $C(=S)NR^{9a}R^{9b}$ ,  $C(=O)OR^7$ , o fenilo, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes  $R^{10}$ , que se seleccionan independientemente uno del otro, o un anillo heterocíclico aromático de 3-, 4-, 5-, 6- o 7 miembros saturado, parcialmente saturado o insaturado que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre, opcionalmente sustituido con k sustituyentes  $R^{10}$ , seleccionados independientemente uno de otro, y en donde los átomos de nitrógeno y/o de azufre del anillo heterocíclico pueden ser opcionalmente oxidados.

Se prefieren también compuestos de isoxazolina cetónica sustituidos como de fórmula (I-5), en donde

- 20  $R^1$  y  $R^2$  desde juntos  $=O$ ,  $=CR^{13}R^{14}$ ,  $=CR^{13}NR^{17a}R^{17b}$ ,  $=S(O)_nR^{16}$ ,  $=S(O)_nNR^{17a}R^{17b}$ ,  $=NR^{17a}$ ,  $=NOR^{16}$ ,  $=NNR^{17a}$ ; o  $R^1$  y  $R^2$  desde junto con el átomo de carbono, al cual  $R^1$  y  $R^2$  están enlazados a, un anillo carbocíclico o heterocíclico de 3-, 4-, 5-, 6-, 7- u 8 miembros saturado, parcialmente insaturado que comprende opcionalmente 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre y/o opcionalmente sustituidos con k sustituyentes  $R^{10}$ , seleccionados independientemente uno del otro, y en donde los átomos de nitrógeno y/o de azufre del anillo heterocíclico puede ser opcionalmente oxidados; y

- 25 G se selecciona del grupo que consiste de hidrógeno, ciano, -SCN,  $C_1-C_6$ -alquilo,  $C_1-C_6$ -haloalquilo,  $C_1-C_6$ -alcoxi,  $C_1-C_6$ -haloalcoxi,  $C_1-C_6$ -alquiltio,  $C_1-C_6$ -haloalquiltio,  $C_3-C_8$ -cicloalquilo,  $C_3-C_8$ -halocicloalquilo,  $C_2-C_6$ -alqueno,  $C_2-C_6$ -haloalqueno,  $C_2-C_6$ -alquino,  $C_2-C_6$  haloalquino, en donde los átomos de carbono de los radicales alifáticos y cicloalifáticos antes mencionados puede ser opcionalmente sustituidos con uno o más  $R^6$ , que se seleccionan independientemente uno del otro, o

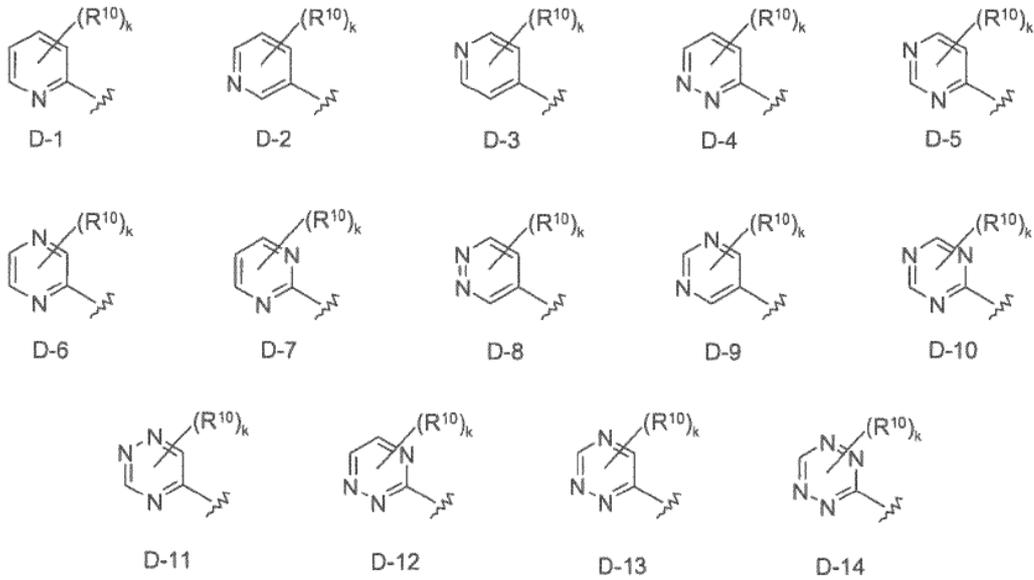
- 30  $NR^{9a}R^{9b}$ ,  $S(O)_nR^7$ ,  $-S(O)_nNR^{9a}R^{9b}$ ,  $C(=O)R^6$ ,  $C(=O)OR^7$ ,  $C(=O)NR^{9a}R^{9b}$ ,  $C(=NR^8)R^6$ , fenilo, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes  $R^{10}$ , seleccionados independientemente uno de otro, o un anillo heterocíclico de 3-, 4-, 5-, 6- o 7- miembros saturado, parcialmente saturado, parcialmente o totalmente insaturado, o aromático que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre, opcionalmente sustituidos con k sustituyentes  $R^{10}$ , seleccionados independientemente uno del otro, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden ser opcionalmente oxidados;

Se prefieren también compuestos de isoxazolina cetónica sustituidos como de fórmula (I-5), en donde

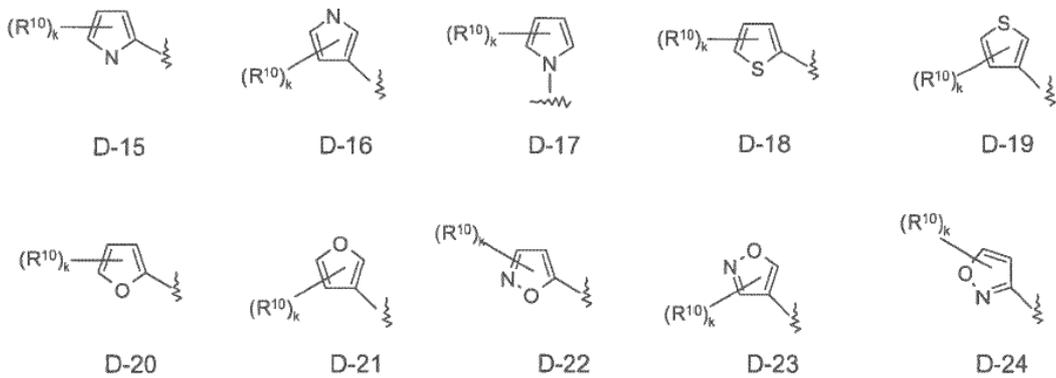
- 35 G no está presente en la fórmula (I-5), lo que significa que m es 0, y  $R^1$  y  $R^2$  forman junto con el átomo de carbono al que  $R^1$  y  $R^2$  están enlazados a un anillo de 5 o 6 miembros carboaromático o heteroaromático, que comprende opcionalmente 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre y/o opcionalmente sustituidos con k sustituyentes  $R^{10}$ , seleccionados independientemente uno de otro.

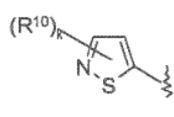
Como se anotó anteriormente, algunas de las variables de la fórmula (I-5) puede ser opcionalmente sustituidas además por un anillo heterocíclico insaturado (aromático), parcialmente saturado o saturado de 3-7 miembros, que arbitrariamente puede ser sustituido con k sustituyentes  $R^{10}$ , seleccionados independientemente del entero de k.

5 Ejemplos preferidos de un anillo heterocíclico de 6 miembros insaturado (aromático), opcionalmente sustituido con k sustituyentes  $R^{10}$ , seleccionados independientemente del entero de k, incluyen los anillos D-1 hasta D-14:

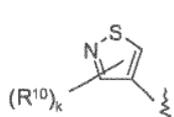


Ejemplos preferidos de un anillo heterocíclico de 5 miembros insaturado (aromático), opcionalmente sustituido con k sustituyentes  $R^{10}$ , seleccionados independientemente del entero de k, incluyen los anillos D-15 hasta D-24:

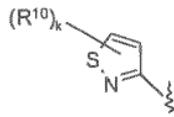




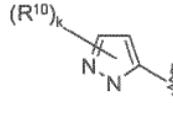
D-25



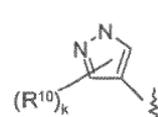
D-26



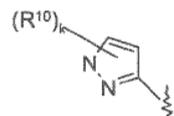
D-27



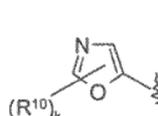
D-28



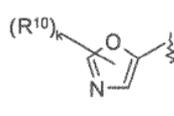
D-29



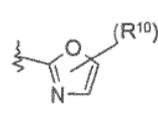
D-30



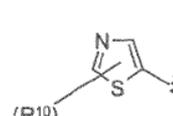
D-31



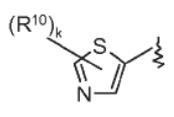
D-32



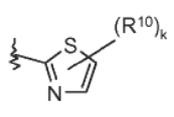
D-33



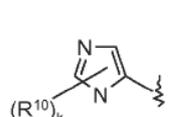
D-34



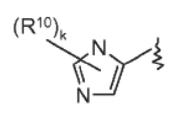
D-35



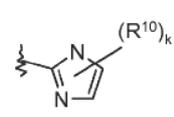
D-36



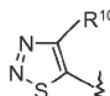
D-37



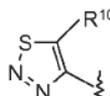
D-38



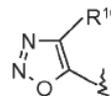
D-39



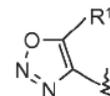
D-40



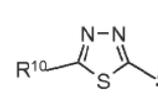
D-41



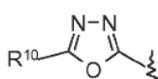
D-42



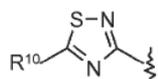
D-43



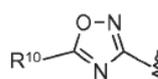
D-44



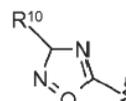
D-45



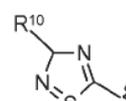
D-46



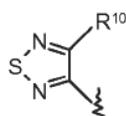
D-47



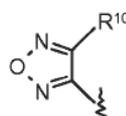
D-48



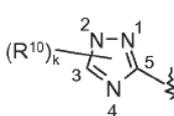
D-49



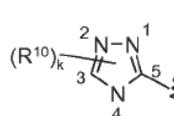
D-50



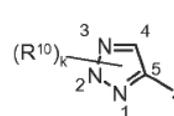
D-51



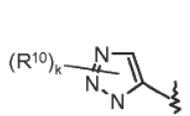
D-52



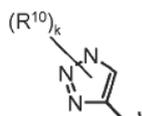
D-53



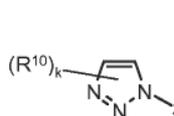
D-54



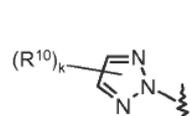
D-55



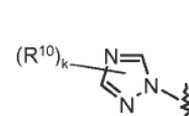
D-56



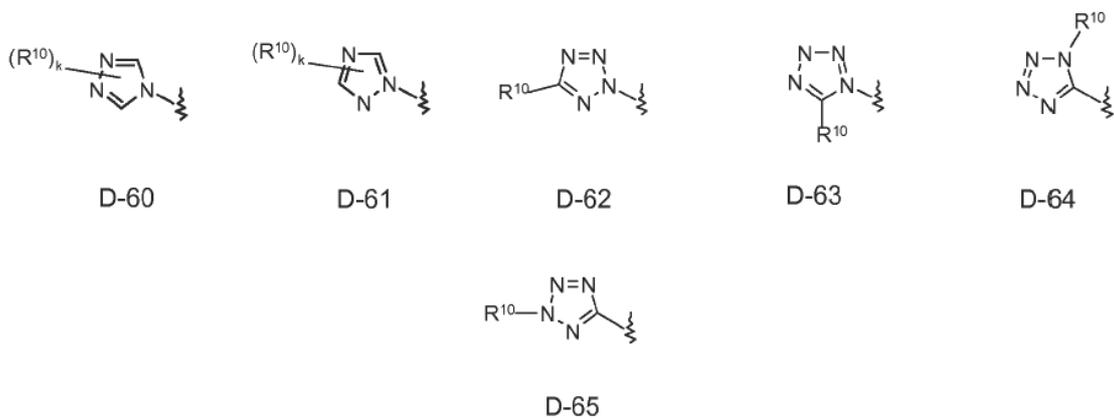
D-57



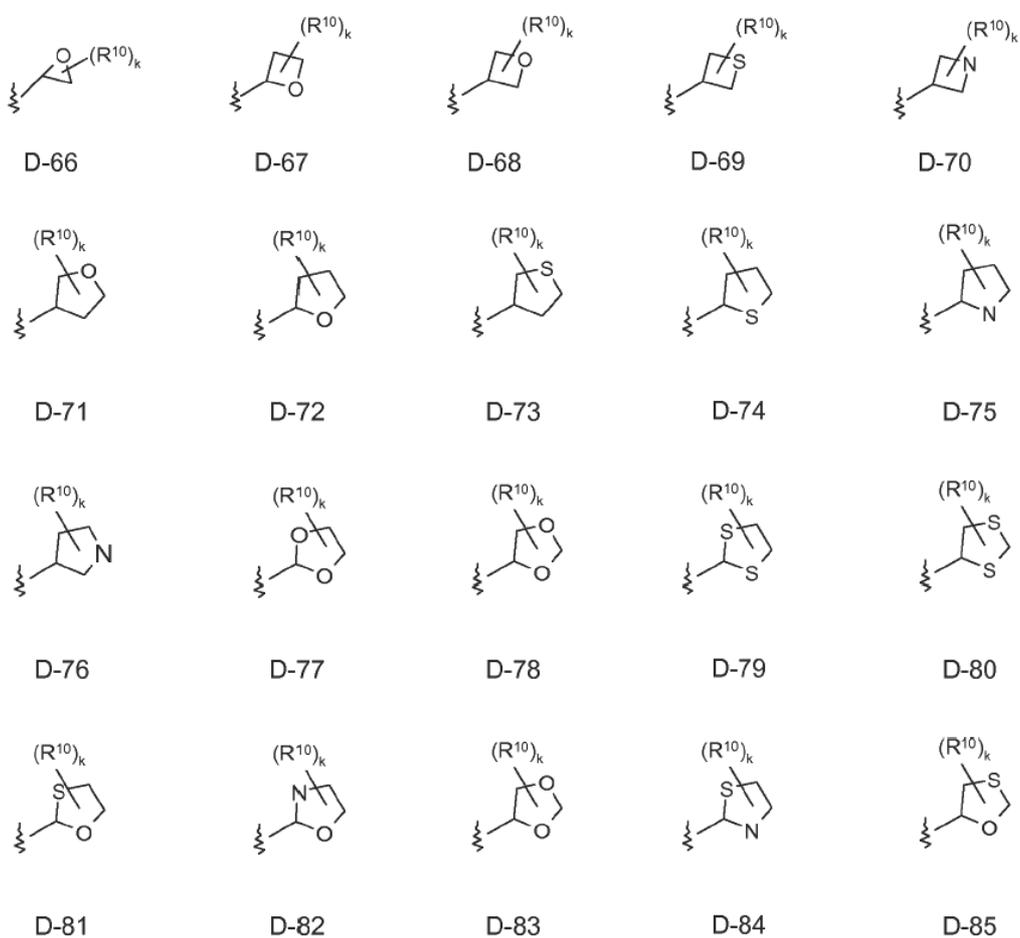
D-58

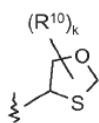


D-59

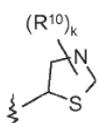


Ejemplos preferidos de un anillo heterocíclico de 3-7 miembros saturado, opcionalmente sustituido con k sustituyentes R<sup>10</sup>, seleccionados independientemente del entero de k, incluyen los anillos D-66 hasta D-120:

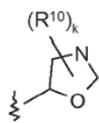




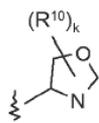
D-86



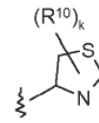
D-87



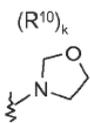
D-88



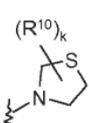
D-89



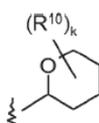
D-90



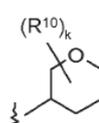
D-91



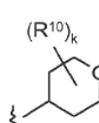
D-92



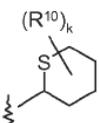
D-93



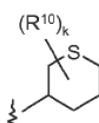
D-94



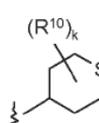
D-95



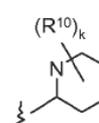
D-96



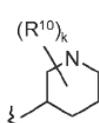
D-97



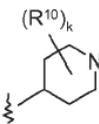
D-98



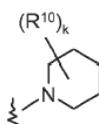
D-99



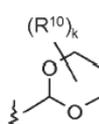
D-100



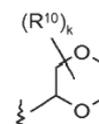
D-101



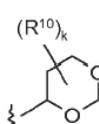
D-102



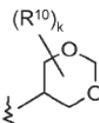
D-103



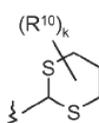
D-104



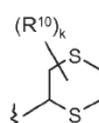
D-105



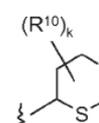
D-106



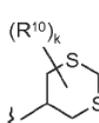
D-107



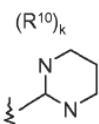
D-108



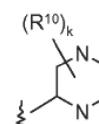
D-109



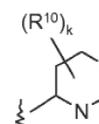
D-110



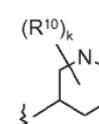
D-111



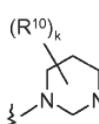
D-112



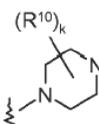
D-113



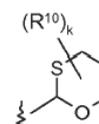
D-114



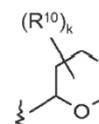
D-115



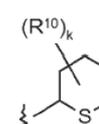
D-116



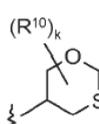
D-117



D-118

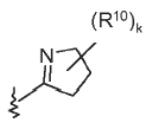


D-119

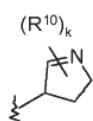


D-120

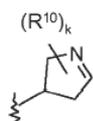
Ejemplos preferidos de un anillo heterocíclico de 5-7 miembros, parcialmente saturado, opcionalmente sustituidos con  $k$  sustituyentes  $R^{10}$ , seleccionados independientemente del entero de  $k$ , incluyen los anillos D-121 hasta D-169:



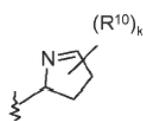
D-121



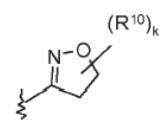
D-122



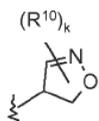
D-123



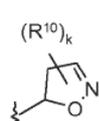
D-124



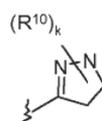
D-125



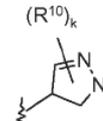
D-126



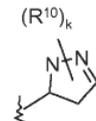
D-127



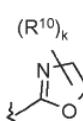
D-128



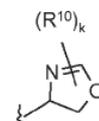
D-129



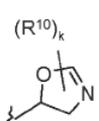
D-130



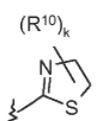
D-131



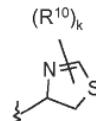
D-132



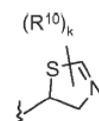
D-133



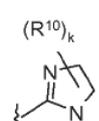
D-134



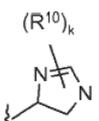
D-135



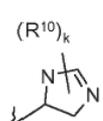
D-136



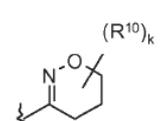
D-137



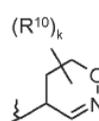
D-138



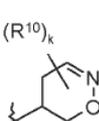
D-139



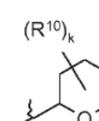
D-140



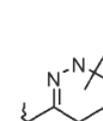
D-141



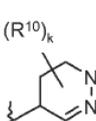
D-142



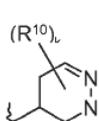
D-143



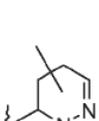
D-144



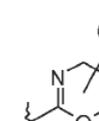
D-145



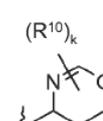
D-146



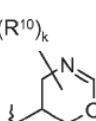
D-147



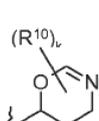
D-148



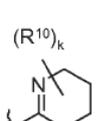
D-149



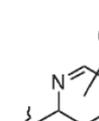
D-150



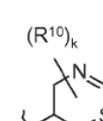
D-151



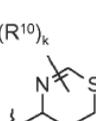
D-152



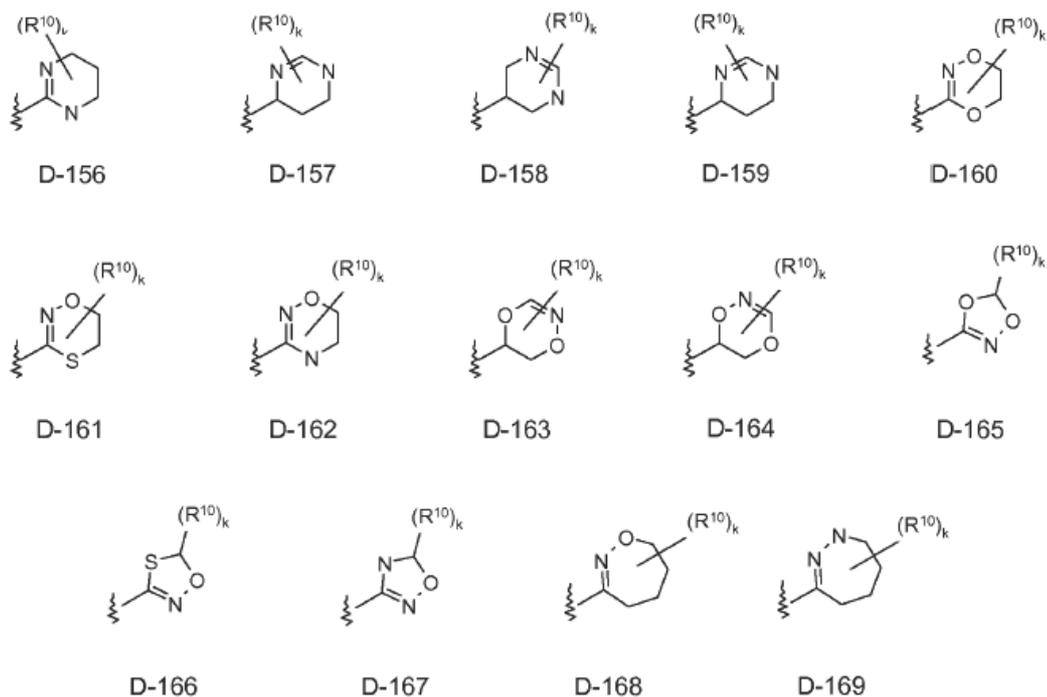
D-153



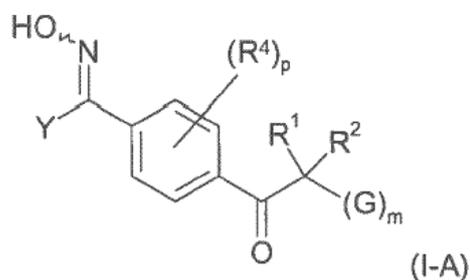
D-154



D-155



Otra realización de la presente invención también son intermedios de compuestos cetónicos sustituidos con 4-hidroxiiminometilo de la fórmula general (IA)



5 en donde

Y es hidrógeno o halógeno;

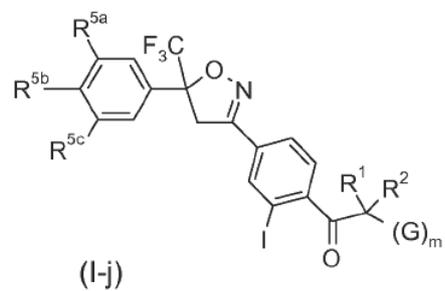
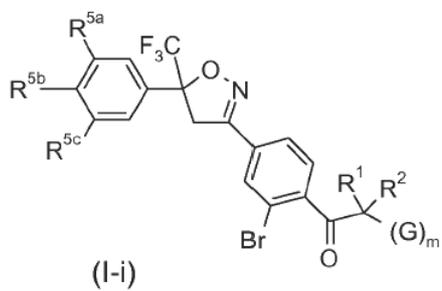
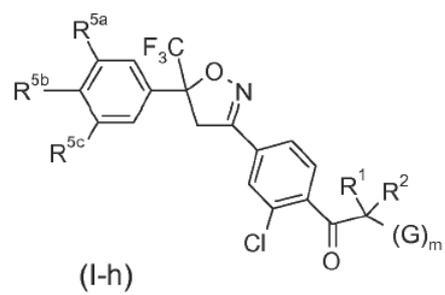
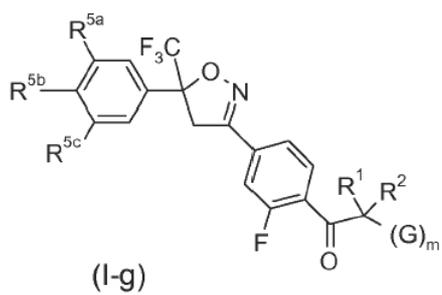
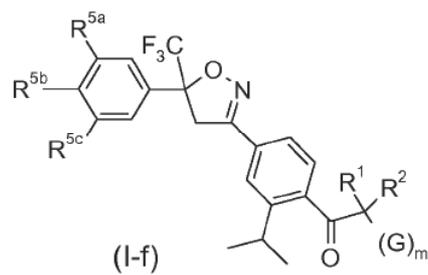
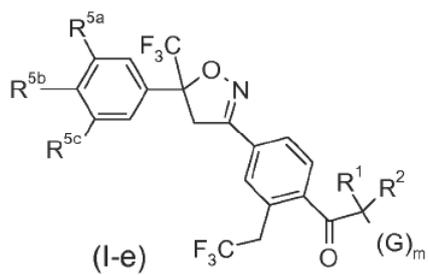
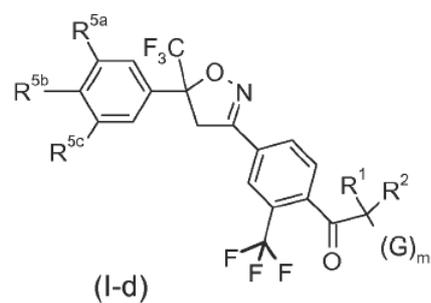
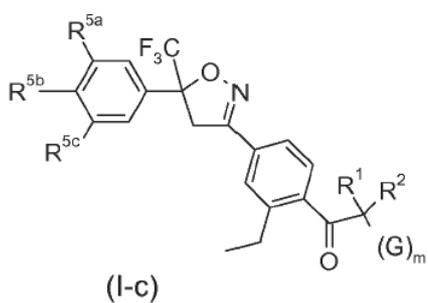
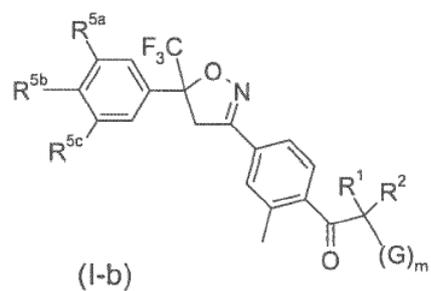
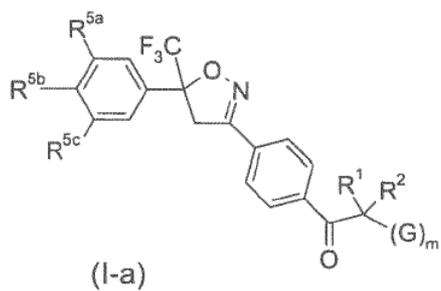
en  $(R^4)_p$ , p es 2 y uno de  $R^4$  está enlazado en la posición de  $R^{4a}$  y tiene uno de los significados dados anteriormente para  $R^{4a}$ , y el otro  $R^4$  está enlazado en la posición de  $R^{4b}$

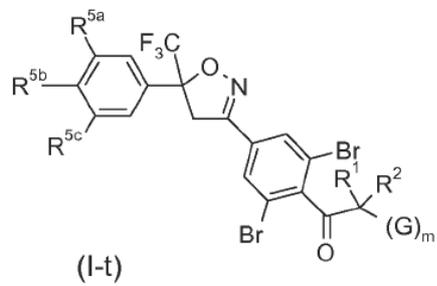
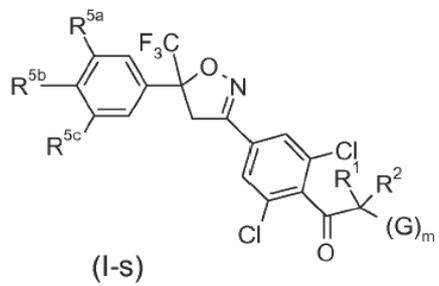
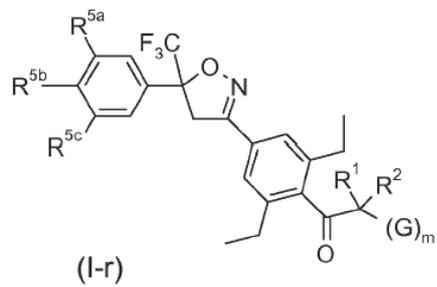
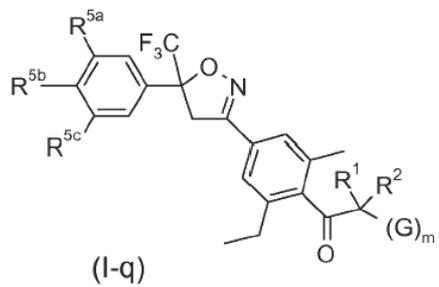
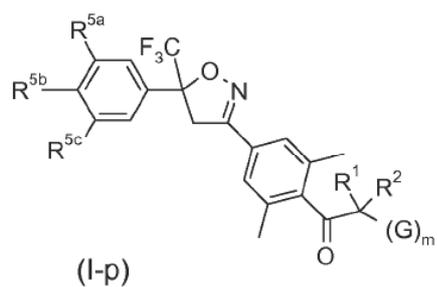
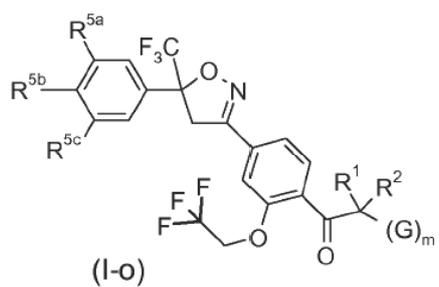
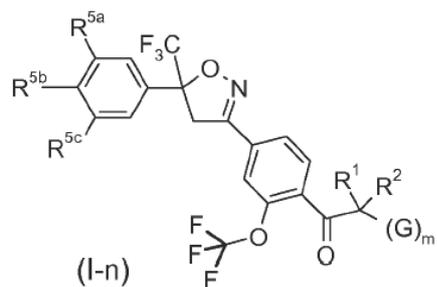
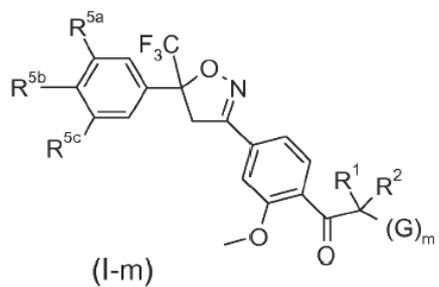
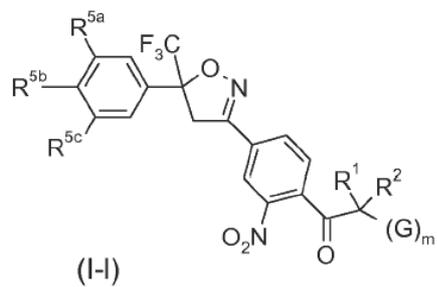
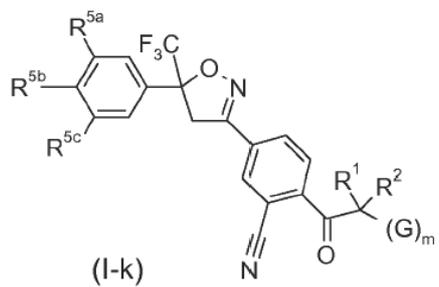
10 y tiene uno de los significados dados anteriormente para  $R^{4b}$ ; y en donde  $R^1$ ,  $R^2$ , G, y m se definen como para los compuestos de fórmula (I-5);

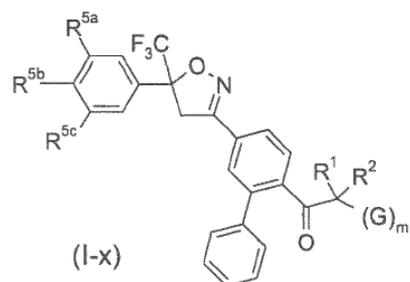
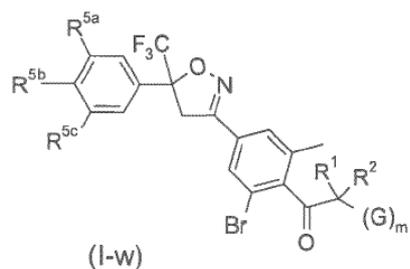
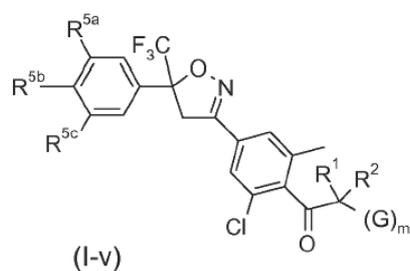
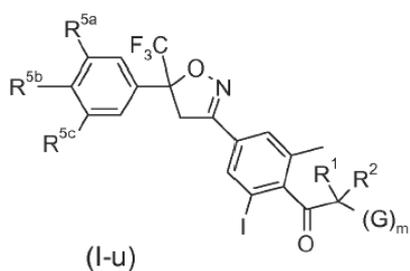
Ejemplos de compuestos preferidos

Ejemplos de compuestos preferidos de la presente invención se describen en lo siguiente sin imponer ninguna limitación a esta invención.

15 Se prefieren los compuestos de las siguientes fórmulas I-a a I-x, en donde las variables tienen uno de los significados generales o preferidos dados anteriormente.



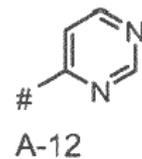
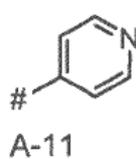
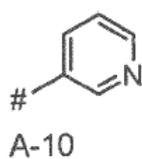
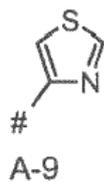
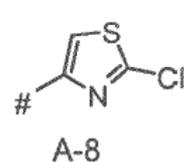
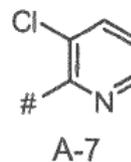
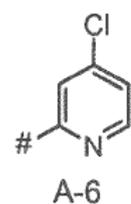
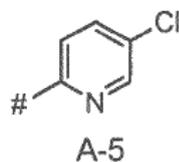
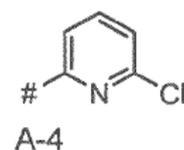
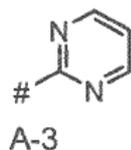
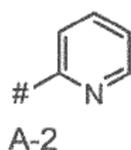
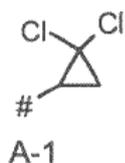


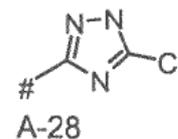
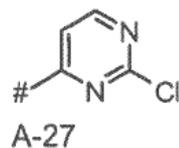
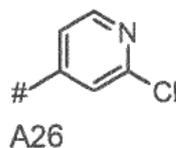
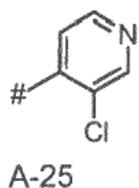
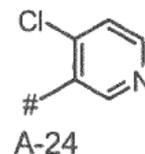
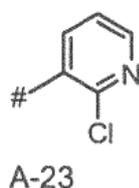
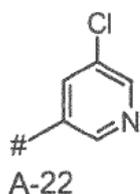
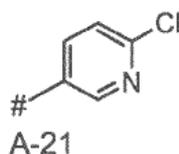
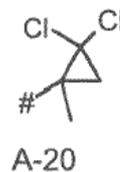
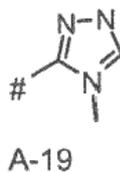
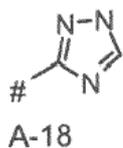
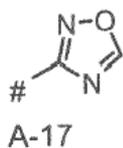
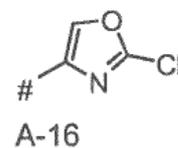
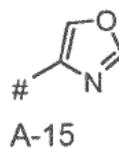
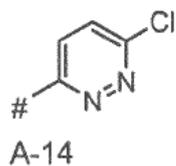
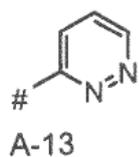


5 Ejemplos de compuestos más preferidos están representados por los siguientes compuestos individuales compilados en las tablas de aquí en adelante. El significado de las respectivas variables individuales  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  se definen en las mismas, y los radicales  $R^1$  y  $R^2$  solos, cuando  $m$  es 0, o en combinación con  $G$ , cuando  $m$  es 1, se identifican de forma individual como se indica en las tablas Q1, Q2 y Q3.

Por otra parte, los significados mencionados para las variables individuales en las tablas son *per se*, independientemente de la combinación en la que se mencionen, una realización particularmente preferida de los sustituyentes en cuestión.

10 Algunas variables individuales en las tablas se seleccionan de los siguientes sustituyentes A, en donde el "#" en las fórmulas de las variables A indican el enlace a las fórmulas:





Tablas 1-264 de compuestos preferidos:

Tabla 1

- 5 Compuestos de la fórmula I-a en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son cloro,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 2

Compuestos de la fórmula I-a en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son bromo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 3

- 10 Compuestos de la fórmula I-a en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son flúor,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 4

Compuestos de la fórmula I-a en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son metilo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

- 15 Tabla 5

Compuestos de la fórmula I-a en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 6

- 20 Compuestos de la fórmula I-a en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son cloro,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 7

## ES 2 546 417 T3

Compuestos de la fórmula I-a en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son metilo,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 8

5 Compuestos de la fórmula I-a en la que  $R^{5a}$  es  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 9

Compuestos de la fórmula I-a en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son cloro, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 10

10 Compuestos de la fórmula I-a en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son flúor, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 11

Compuestos de la fórmula I-a en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son metilo, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

15 Tabla 12

Compuestos de la fórmula I-b en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son cloro,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 13

20 Compuestos de la fórmula I-b en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son bromo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 14

Compuestos de la fórmula I-b en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son flúor,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 15

25 Compuestos de la fórmula I-b en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son metilo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 16

Compuestos de la fórmula I-b en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

30 Tabla 17

Compuestos de la fórmula I-b en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son cloro,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 18

35 Compuestos de la fórmula I-b en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son metilo,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 19

Compuestos de la fórmula I-b en la que  $R^{5a}$  es  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 20

40 Compuestos de la fórmula I-b en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son cloro, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

## ES 2 546 417 T3

### Tabla 21

Compuestos de la fórmula I-b en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son flúor, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 22

- 5 Compuestos de la fórmula I-b en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son metilo, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 23

Compuestos de la fórmula I-c en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son cloro,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

- 10 Tabla 24

Compuestos de la fórmula I-c en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son bromo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 25

- 15 Compuestos de la fórmula I-c en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son flúor,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 26

Compuestos de la fórmula I-c en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son metilo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 27

- 20 Compuestos de la fórmula I-c en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 28

Compuestos de la fórmula I-c en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son cloro,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

- 25 Tabla 29

Compuestos de la fórmula I-c en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son metilo,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 30

- 30 Compuestos de la fórmula I-c en la que  $R^{5a}$  es  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 31

Compuestos de la fórmula I-c en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son cloro, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 32

- 35 Compuestos de la fórmula I-c en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son flúor, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 33

Compuestos de la fórmula I-c en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son metilo, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

- 40 Tabla 34

## ES 2 546 417 T3

Compuestos de la fórmula I-d en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son cloro,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 35

5 Compuestos de la fórmula I-d en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son bromo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 36

Compuestos de la fórmula I-d en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son flúor,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 37

10 Compuestos de la fórmula I-d en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son metilo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 38

Compuestos de la fórmula I-d en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

15 Tabla 39

Compuestos de la fórmula I-d en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son cloro,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 40

20 Compuestos de la fórmula I-d en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son metilo,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 41

Compuestos de la fórmula I-d en la que  $R^{5a}$  es  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 42

25 Compuestos de la fórmula I-d en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son cloro, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 43

Compuestos de la fórmula I-d en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son flúor, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

30 Tabla 44

Compuestos de la fórmula I-d en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son metilo, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 45

35 Compuestos de la fórmula I-e en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son cloro,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 46

Compuestos de la fórmula I-e en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son bromo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 47

40 Compuestos de la fórmula I-e en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son flúor,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 48

Compuestos de la fórmula I-e en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son metilo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 49

- 5 Compuestos de la fórmula I-e en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 50

Compuestos de la fórmula I-e en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son cloro,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

- 10 Tabla 51

Compuestos de la fórmula I-e en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son metilo,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 52

- 15 Compuestos de la fórmula I-e en la que  $R^{5a}$  es  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 53

Compuestos de la fórmula I-e en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son cloro, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 54

- 20 Compuestos de la fórmula I-e en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son flúor, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 55

Compuestos de la fórmula I-e en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son metilo, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

- 25 Tabla 56

Compuestos de la fórmula I-f en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son cloro,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 57

- 30 Compuestos de la fórmula I-f en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son bromo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 58

Compuestos de la fórmula I-f en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son flúor,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 59

- 35 Compuestos de la fórmula I-f en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son metilo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 60

Compuestos de la fórmula I-f en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

- 40 Tabla 61

## ES 2 546 417 T3

Compuestos de la fórmula I-f en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son cloro,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 62

5 Compuestos de la fórmula I-f en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son metilo,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 63

Compuestos de la fórmula I-f en la que  $R^{5a}$  es  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 64

10 Compuestos de la fórmula I-f en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son cloro, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 65

Compuestos de la fórmula I-f en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son flúor, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

15 Tabla 66

Compuestos de la fórmula I-f en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son metilo, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 67

20 Compuestos de la fórmula I-g en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son cloro,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 68

Compuestos de la fórmula I-g en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son bromo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 69

25 Compuestos de la fórmula I-g en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son flúor,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 70

Compuestos de la fórmula I-g en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son metilo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

30 Tabla 71

Compuestos de la fórmula I-g en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 72

35 Compuestos de la fórmula I-g en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son cloro,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 73

Compuestos de la fórmula I-g en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son metilo,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 74

40 Compuestos de la fórmula I-g en la que  $R^{5a}$  es  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

## ES 2 546 417 T3

### Tabla 75

Compuestos de la fórmula I-g en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son cloro, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 76

- 5 Compuestos de la fórmula I-g en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son flúor, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 77

Compuestos de la fórmula I-g en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son metilo, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

- 10 Tabla 78

Compuestos de la fórmula I-h en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son cloro,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 79

- 15 Compuestos de la fórmula I-h en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son bromo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 80

Compuestos de la fórmula I-h en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son flúor,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 81

- 20 Compuestos de la fórmula I-h en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son metilo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 82

Compuestos de la fórmula I-h en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

- 25 Tabla 83

Compuestos de la fórmula I-h en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son cloro,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 84

- 30 Compuestos de la fórmula I-h en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son metilo,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 85

Compuestos de la fórmula I-h en la que  $R^{5a}$  es  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 86

- 35 Compuestos de la fórmula I-h en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son cloro, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 87

Compuestos de la fórmula I-h en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son flúor, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

- 40 Tabla 88

## ES 2 546 417 T3

Compuestos de la fórmula I-h en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son metilo, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 89

5 Compuestos de la fórmula I-i en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son cloro,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 90

Compuestos de la fórmula I-i en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son bromo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 91

10 Compuestos de la fórmula I-i en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son flúor,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 92

Compuestos de la fórmula I-i en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son metilo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

15 Tabla 93

Compuestos de la fórmula I-i en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 94

20 Compuestos de la fórmula I-i en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son cloro,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 95

Compuestos de la fórmula I-i en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son metilo,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 96

25 Compuestos de la fórmula I-i en la que  $R^{5a}$  es  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 97

Compuestos de la fórmula I-i en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son cloro, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

30 Tabla 98

Compuestos de la fórmula I-i en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son flúor, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 99

35 Compuestos de la fórmula I-i en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son metilo, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 100

Compuestos de la fórmula I-j en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son cloro,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 101

40 Compuestos de la fórmula I-j en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son bromo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

## ES 2 546 417 T3

### Tabla 102

Compuestos de la fórmula I-j en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son flúor,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 103

- 5 Compuestos de la fórmula I-j en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son metilo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 104

Compuestos de la fórmula I-j en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

- 10 Tabla 105

Compuestos de la fórmula I-j en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son cloro,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 106

- 15 Compuestos de la fórmula I-j en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son metilo,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 107

Compuestos de la fórmula I-j en la que  $R^{5a}$  es  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 108

- 20 Compuestos de la fórmula I-j en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son cloro, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 109

Compuestos de la fórmula I-j en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son flúor, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

- 25 Tabla 110

Compuestos de la fórmula I-j en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son metilo, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 111

- 30 Compuestos de la fórmula I-k en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son cloro,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 112

Compuestos de la fórmula I-k en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son bromo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 113

- 35 Compuestos de la fórmula I-k en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son flúor,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 114

Compuestos de la fórmula I-k en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son metilo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

- 40 Tabla 115

## ES 2 546 417 T3

Compuestos de la fórmula I-k en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 116

- 5 Compuestos de la fórmula I-k en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son cloro,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 117

Compuestos de la fórmula I-k en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son metilo,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 118

- 10 Compuestos de la fórmula I-k en la que  $R^{5a}$  es  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 119

Compuestos de la fórmula I-k en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son cloro, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

- 15 Tabla 120

Compuestos de la fórmula I-k en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son flúor, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 121

- 20 Compuestos de la fórmula I-k en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son metilo, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 122

Compuestos de la fórmula I-l en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son cloro,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 123

- 25 Compuestos de la fórmula I-l en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son bromo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 124

Compuestos de la fórmula I-l en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son flúor,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

- 30 Tabla 125

Compuestos de la fórmula I-l en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son metilo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 126

- 35 Compuestos de la fórmula I-l en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 127

Compuestos de la fórmula I-l en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son cloro,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 128

- 40 Compuestos de la fórmula I-l en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son metilo,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

## ES 2 546 417 T3

### Tabla 129

Compuestos de la fórmula I-I en la que  $R^{5a}$  es  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 130

- 5 Compuestos de la fórmula I-I en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son cloro, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 131

Compuestos de la fórmula I-I en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son flúor, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

- 10 Tabla 132

Compuestos de la fórmula I-I en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son metilo, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 133

- 15 Compuestos de la fórmula I-m en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son cloro,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 134

Compuestos de la fórmula I-m en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son bromo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 135

- 20 Compuestos de la fórmula I-m en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son flúor,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 136

Compuestos de la fórmula I-m en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son metilo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

- 25 Tabla 137

Compuestos de la fórmula I-m en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 138

- 30 Compuestos de la fórmula I-m en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son cloro,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 139

Compuestos de la fórmula I-m en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son metilo,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 140

- 35 Compuestos de la fórmula I-m en la que  $R^{5a}$  es  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 141

Compuestos de la fórmula I-m en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son cloro, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

- 40 Tabla 142

## ES 2 546 417 T3

Compuestos de la fórmula I-m en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son flúor, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 143

- 5 Compuestos de la fórmula I-m en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son metilo, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 144

Compuestos de la fórmula I-n en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son cloro,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 145

- 10 Compuestos de la fórmula I-n en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son bromo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 146

Compuestos de la fórmula I-n en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son flúor,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

- 15 Tabla 147

Compuestos de la fórmula I-n en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son metilo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 148

- 20 Compuestos de la fórmula I-n en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 149

Compuestos de la fórmula I-n en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son cloro,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 150

- 25 Compuestos de la fórmula I-n en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son metilo,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 151

Compuestos de la fórmula I-n en la que  $R^{5a}$  es  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

- 30 Tabla 152

Compuestos de la fórmula I-n en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son cloro, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 153

- 35 Compuestos de la fórmula I-n en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son flúor, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 154

Compuestos de la fórmula I-n en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son metilo, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 155

- 40 Compuestos de la fórmula I-o en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son cloro,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

## ES 2 546 417 T3

### Tabla 156

Compuestos de la fórmula I-o en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son bromo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 157

- 5 Compuestos de la fórmula I-o en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son flúor,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 158

Compuestos de la fórmula I-o en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son metilo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

- 10 Tabla 159

Compuestos de la fórmula I-o en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 160

- 15 Compuestos de la fórmula I-o en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son cloro,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 161

Compuestos de la fórmula I-o en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son metilo,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 162

- 20 Compuestos de la fórmula I-o en la que  $R^{5a}$  es  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 163

Compuestos de la fórmula I-o en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son cloro, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

- 25 Tabla 164

Compuestos de la fórmula I-o en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son flúor, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 165

- 30 Compuestos de la fórmula I-o en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son metilo, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 166

Compuestos de la fórmula I-p en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son cloro,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 167

- 35 Compuestos de la fórmula I-p en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son bromo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 168

Compuestos de la fórmula I-p en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son flúor,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

- 40 Tabla 169

## ES 2 546 417 T3

Compuestos de la fórmula I-p en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son metilo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 170

- 5 Compuestos de la fórmula I-p en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 171

Compuestos de la fórmula I-p en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son cloro,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 172

- 10 Compuestos de la fórmula I-p en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son metilo,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 173

Compuestos de la fórmula I-p en la que  $R^{5a}$  es  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

- 15 Tabla 174

Compuestos de la fórmula I-p en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son cloro, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 175

- 20 Compuestos de la fórmula I-p en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son flúor, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 176

Compuestos de la fórmula I-p en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son metilo, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 177

- 25 Compuestos de la fórmula I-q en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son cloro,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 178

Compuestos de la fórmula I-q en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son bromo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

- 30 Tabla 179

Compuestos de la fórmula I-q en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son flúor,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 180

- 35 Compuestos de la fórmula I-q en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son metilo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 181

Compuestos de la fórmula I-q en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 182

- 40 Compuestos de la fórmula I-q en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son cloro,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

## ES 2 546 417 T3

### Tabla 183

Compuestos de la fórmula I-q en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son metilo,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 184

- 5 Compuestos de la fórmula I-q en la que  $R^{5a}$  es  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 185

Compuestos de la fórmula I-q en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son cloro, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

- 10 Tabla 186

Compuestos de la fórmula I-q en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son flúor, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 187

- 15 Compuestos de la fórmula I-q en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son metilo, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 188

Compuestos de la fórmula I-r en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son cloro,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 189

- 20 Compuestos de la fórmula I-r en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son bromo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 190

Compuestos de la fórmula I-r en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son flúor,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

- 25 Tabla 191

Compuestos de la fórmula I-r en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son metilo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 192

- 30 Compuestos de la fórmula I-r en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 193

Compuestos de la fórmula I-r en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son cloro,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 194

- 35 Compuestos de la fórmula I-r en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son metilo,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

### Tabla 195

Compuestos de la fórmula I-r en la que  $R^{5a}$  es  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

- 40 Tabla 196

## ES 2 546 417 T3

Compuestos de la fórmula I-r en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son cloro, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 197

- 5 Compuestos de la fórmula I-r en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son flúor, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 198

Compuestos de la fórmula I-r en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son metilo, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 199

- 10 Compuestos de la fórmula I-s en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son cloro,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 200

Compuestos de la fórmula I-s en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son bromo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

- 15 Tabla 201

Compuestos de la fórmula I-s en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son flúor,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 202

- 20 Compuestos de la fórmula I-s en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son metilo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 203

Compuestos de la fórmula I-s en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 204

- 25 Compuestos de la fórmula I-s en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son cloro,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 205

Compuestos de la fórmula I-s en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son metilo,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

- 30 Tabla 206

Compuestos de la fórmula I-s en la que  $R^{5a}$  es  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 207

- 35 Compuestos de la fórmula I-s en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son cloro, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 208

Compuestos de la fórmula I-s en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son flúor, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 209

- 40 Compuestos de la fórmula I-s en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son metilo, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 210

Compuestos de la fórmula I-t en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son cloro,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 211

- 5 Compuestos de la fórmula I-t en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son bromo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 212

Compuestos de la fórmula I-t en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son flúor,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

10 Tabla 213

Compuestos de la fórmula I-t en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son metilo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 214

- 15 Compuestos de la fórmula I-t en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 215

Compuestos de la fórmula I-t en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son cloro,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 216

- 20 Compuestos de la fórmula I-t en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son metilo,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 217

Compuestos de la fórmula I-t en la que  $R^{5a}$  es  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

25 Tabla 218

Compuestos de la fórmula I-t en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son cloro, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 219

- 30 Compuestos de la fórmula I-t en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son flúor, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 220

Compuestos de la fórmula I-t en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son metilo, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 221

- 35 Compuestos de la fórmula I-u en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son cloro,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 222

Compuestos de la fórmula I-u en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son bromo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

40 Tabla 223

## ES 2 546 417 T3

Compuestos de la fórmula I-u en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son flúor,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 224

5 Compuestos de la fórmula I-u en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son metilo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 225

Compuestos de la fórmula I-u en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 226

10 Compuestos de la fórmula I-u en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son cloro,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 227

Compuestos de la fórmula I-u en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son metilo,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

15 Tabla 228

Compuestos de la fórmula I-u en la que  $R^{5a}$  es  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 229

20 Compuestos de la fórmula I-u en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son cloro, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 230

Compuestos de la fórmula I-u en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son flúor, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 231

25 Compuestos de la fórmula I-u en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son metilo, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 232

Compuestos de la fórmula I-v en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son cloro,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

30 Tabla 233

Compuestos de la fórmula I-v en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son bromo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 234

35 Compuestos de la fórmula I-v en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son flúor,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 235

Compuestos de la fórmula I-v en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son metilo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 236

40 Compuestos de la fórmula I-v en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

## Tabla 237

Compuestos de la fórmula I-v en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son cloro,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

## Tabla 238

- 5 Compuestos de la fórmula I-v en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son metilo,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

## Tabla 239

Compuestos de la fórmula I-v en la que  $R^{5a}$  es  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

## 10 Tabla 240

Compuestos de la fórmula I-v en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son cloro, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

## Tabla 241

- 15 Compuestos de la fórmula I-v en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son flúor, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

## Tabla 242

Compuestos de la fórmula I-v en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son metilo, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

## Tabla 243

- 20 Compuestos de la fórmula I-w en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son cloro,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

## Tabla 244

Compuestos de la fórmula I-w en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son bromo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

## 25 Tabla 245

Compuestos de la fórmula I-w en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son flúor,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

## Tabla 246

- 30 Compuestos de la fórmula I-w en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son metilo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

## Tabla 247

Compuestos de la fórmula I-w en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

## Tabla 248

- 35 Compuestos de la fórmula I-w en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son cloro,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

## Tabla 249

Compuestos de la fórmula I-w en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son metilo,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

## 40 Tabla 250

## ES 2 546 417 T3

Compuestos de la fórmula I-w en la que  $R^{5a}$  es  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 251

- 5 Compuestos de la fórmula I-w en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son cloro, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 252

Compuestos de la fórmula I-w en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son flúor, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 253

- 10 Compuestos de la fórmula I-w en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son metilo, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 254

Compuestos de la fórmula I-x en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son cloro,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

- 15 Tabla 255

Compuestos de la fórmula I-x en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son bromo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 256

- 20 Compuestos de la fórmula I-x en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son flúor,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 257

Compuestos de la fórmula I-x en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son metilo,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 258

- 25 Compuestos de la fórmula I-x en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5c}$  son  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 259

Compuestos de la fórmula I-x en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son cloro,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

- 30 Tabla 260

Compuestos de la fórmula I-x en la que  $R^{5a}$  y  $R^{5b}$  son metilo,  $R^{5c}$  es H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 261

- 35 Compuestos de la fórmula I-x en la que  $R^{5a}$  es  $CF_3$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son H, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 262

Compuestos de la fórmula I-x en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son cloro, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 263

- 40 Compuestos de la fórmula I-x en la que  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son flúor, y la combinación de  $R^1$  y  $R^2$  y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla 264

Compuestos de la fórmula I-x en la que R<sup>5a</sup>, R<sup>5b</sup> y R<sup>5c</sup> son metilo, y la combinación de R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> y G, si G está presente, para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q1.

Tabla Q1:

Compuesto No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G
Q1-1.	H	H	H
Q1-2.	H	H	F
Q1-3.	H	H	CH <sub>3</sub>
Q1-4.	H	H	OCH <sub>3</sub>
Q1-5.	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-6.	H	H	NHCH <sub>3</sub>
Q1-7.	H	H	NHCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-8.	H	H	NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-9.	H	H	NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-10.	H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-11.	H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-12.	H	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q1-13.	H	H	Ph
Q1-14.	H	H	CH <sub>2</sub> Ph
Q1-15.	H	H	2-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-16.	H	H	3-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-17.	H	H	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-18.	H	H	2-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-19.	H	H	3-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-20.	H	H	4-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-21.	H	H	2-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-22.	H	H	3-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-23.	H	H	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-24.	H	H	2-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-25.	H	H	3-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-26.	H	H	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-27.	H	H	2-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>

## ES 2 546 417 T3

Compuesto No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G
Q1-28.	H	H	3-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-29.	H	H	4-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-30.	H	H	-O-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>3</sub>
Q1-31.	H	H	A-2
Q1-32.	H	H	A-3
Q1-33.	H	H	A-4
Q1-34.	H	H	A-5
Q1-35.	H	H	A-6
Q1-36.	H	H	A-7
Q1-37.	H	H	A-8
Q1-38.	H	H	A-9
Q1-39.	H	H	A-10
Q1-40.	H	H	A-11
Q1-41.	H	H	A-12
Q1-42.	H	H	A-13
Q1-43.	H	H	A-14
Q1-44.	H	H	A-15
Q1-45.	H	H	A-16
Q1-46.	H	H	A-17
Q1-47.	H	H	A-18
Q1-48.	H	H	A-19
Q1-49.	H	H	A-21
Q1-50.	H	H	A-22
Q1-51.	H	H	A-23
Q1-52.	H	H	A-24
Q1-53.	H	H	A-25
Q1-54.	H	H	A-26
Q1-55.	H	H	A-27
Q1-56.	H	H	A-28
Q1-57.	H	H	-CH <sub>2</sub> -4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>

ES 2 546 417 T3

Compuesto No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G
Q1-58.	H	H	C(=O)OCH <sub>3</sub>
Q1-59.	H	H	C(=O)OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q1-60.	H	H	C(=O)NHCH <sub>3</sub>
Q1-61.	H	H	C(=O)NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q1-62.	H	H	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q1-63.	H	H	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-64.	H	H	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q1-65.	H	H	C(=O)NH-CH(CH <sub>3</sub> ) Ciclopropilo
Q1-66.	H	H	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q1-67.	H	H	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-68.	H	H	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-1)
Q1-69.	H	H	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-2)
Q1-70.	H	H	CH <sub>2</sub> C(=O)OCH <sub>3</sub>
Q1-71.	H	H	CH <sub>2</sub> C(=O)OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q1-72.	H	H	CH <sub>2</sub> C(=O)NHCH <sub>3</sub>
Q1-73.	H	H	CH <sub>2</sub> C(=O)NHC <sub>2</sub>
Q1-74.	H	H	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q1-75.	H	H	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-76.	H	H	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q1-77.	H	H	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH(CH <sub>3</sub> ) Ciclopropilo
Q1-78.	H	H	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q1-79.	H	H	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-80.	H	H	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-1)
Q1-81.	H	H	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-2)
Q1-82.	H	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)OCH <sub>3</sub>
Q1-83.	H	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q1-84.	H	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NHCH <sub>3</sub>
Q1-85.	H	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NHC <sub>2</sub>
Q1-86.	H	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q1-87.	H	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>

ES 2 546 417 T3

Compuesto No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G
Q1-88.	H	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q1-89.	H	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH(CH <sub>3</sub> ) Ciclopropilo
Q1-90.	H	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q1-91.	H	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-92.	H	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-1)
Q1-93.	H	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-2)
Q1-94.	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-95.	H	H	CF <sub>3</sub>
Q1-96.	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-97.	H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-98.	H	H	CH <sub>2</sub> CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q1-99.	H	H	CH <sub>2</sub> (CF <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-100.	CH <sub>3</sub>	H	H
Q1-101.	CH <sub>3</sub>	H	F
Q1-102.	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
Q1-103.	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>
Q1-104.	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-105.	CH <sub>3</sub>	H	NHCH <sub>3</sub>
Q1-106.	CH <sub>3</sub>	H	NHCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-107.	CH <sub>3</sub>	H	NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-108.	CH <sub>3</sub>	H	NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-109.	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-110.	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-111.	CH <sub>3</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q1-112.	CH <sub>3</sub>	H	Ph
Q1-113.	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> Ph
Q1-114.	CH <sub>3</sub>	H	2-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-115.	CH <sub>3</sub>	H	3-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-116.	CH <sub>3</sub>	H	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-117.	CH <sub>3</sub>	H	2-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>

## ES 2 546 417 T3

Compuesto No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G
Q1-118.	CH <sub>3</sub>	H	3-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-119.	CH <sub>3</sub>	H	4-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-120.	CH <sub>3</sub>	H	2-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-121.	CH <sub>3</sub>	H	3-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-122.	CH <sub>3</sub>	H	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-123.	CH <sub>3</sub>	H	2-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-124.	CH <sub>3</sub>	H	3-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-125.	CH <sub>3</sub>	H	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-126.	CH <sub>3</sub>	H	2-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-127.	CH <sub>3</sub>	H	3-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-128.	CH <sub>3</sub>	H	4-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-129.	CH <sub>3</sub>	H	-O-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>3</sub>
Q1-130.	CH <sub>3</sub>	H	A-2
Q1-131.	CH <sub>3</sub>	H	A-3
Q1-132.	CH <sub>3</sub>	H	A-4
Q1-133.	CH <sub>3</sub>	H	A-5
Q1-134.	CH <sub>3</sub>	H	A-6
Q1-135.	CH <sub>3</sub>	H	A-7
Q1-136.	CH <sub>3</sub>	H	A-8
Q1-137.	CH <sub>3</sub>	H	A-9
Q1-138.	CH <sub>3</sub>	H	A-10
Q1-139.	CH <sub>3</sub>	H	A-11
Q1-140.	CH <sub>3</sub>	H	A-12
Q1-141.	CH <sub>3</sub>	H	A-13
Q1-142.	CH <sub>3</sub>	H	A-14
Q1-143.	CH <sub>3</sub>	H	A-15
Q1-144.	CH <sub>3</sub>	H	A-16
Q1-145.	CH <sub>3</sub>	H	A-17
Q1-146.	CH <sub>3</sub>	H	A-18
Q1-147.	CH <sub>3</sub>	H	A-19

ES 2 546 417 T3

Compuesto No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G
Q1-148.	CH <sub>3</sub>	H	A-21
Q1-149.	CH <sub>3</sub>	H	A-22
Q1-150.	CH <sub>3</sub>	H	A-23
Q1-151.	CH <sub>3</sub>	H	A-24
Q1-152.	CH <sub>3</sub>	H	A-25
Q1-153.	CH <sub>3</sub>	H	A-26
Q1-154.	CH <sub>3</sub>	H	A-27
Q1-155.	CH <sub>3</sub>	H	A-28
Q1-156.	CH <sub>3</sub>	H	-CH <sub>2</sub> -4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-157.	CH <sub>3</sub>	H	C(=O)OCH <sub>3</sub>
Q1-158.	CH <sub>3</sub>	H	C(=O)OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q1-159.	CH <sub>3</sub>	H	C(=O)NHCH <sub>3</sub>
Q1-160.	CH <sub>3</sub>	H	C(=O)NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q1-161.	CH <sub>3</sub>	H	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q1-162.	CH <sub>3</sub>	H	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-163.	CH <sub>3</sub>	H	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q1-164.	CH <sub>3</sub>	H	C(=O)NH-CH(CH <sub>3</sub> ) Ciclopropilo
Q1-165.	CH <sub>3</sub>	H	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q1-166.	CH <sub>3</sub>	H	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-167.	CH <sub>3</sub>	H	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-1)
Q1-168.	CH <sub>3</sub>	H	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-2)
Q1-169.	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> C(=O)OCH <sub>3</sub>
Q1-170.	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> C(=O)OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q1-171.	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> C(=O)NHCH <sub>3</sub>
Q1-172.	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> C(=O)NHC <sub>2</sub>
Q1-173.	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q1-174.	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-175.	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q1-176.	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH(CH <sub>3</sub> ) Ciclopropilo
Q1-177.	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo

ES 2 546 417 T3

Compuesto No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G
Q1-178.	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-179.	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-1)
Q1-180.	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-2)
Q1-181.	CH <sub>3</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)OCH <sub>3</sub>
Q1-182.	CH <sub>3</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q1-183.	CH <sub>3</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NHCH <sub>3</sub>
Q1-184.	CH <sub>3</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q1-185.	CH <sub>3</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q1-186.	CH <sub>3</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-187.	CH <sub>3</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q1-188.	CH <sub>3</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH(CH <sub>3</sub> ) Ciclopropilo
Q1-189.	CH <sub>3</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q1-190.	CH <sub>3</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-191.	CH <sub>3</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-1)
Q1-192.	CH <sub>3</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-2)
Q1-193.	CH <sub>3</sub>	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-194.	CH <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>
Q1-195.	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-196.	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-197.	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q1-198.	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> (CF <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-199.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
Q1-200.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	F
Q1-201.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
Q1-202.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>
Q1-203.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-204.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>
Q1-205.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NHCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-206.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-207.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>

ES 2 546 417 T3

Compuesto No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G
Q1-208.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-209.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-210.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q1-211.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Ph
Q1-212.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> Ph
Q1-213.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	2-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-214.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	3-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-215.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-216.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	2-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-217.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-218.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-219.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	2-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-220.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	3-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-221.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-222.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	2-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-223.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	3-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-224.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-225.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	2-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-226.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	3-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-227.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-228.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-O-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>3</sub>
Q1-229.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-2
Q1-230.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-3
Q1-231.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-4
Q1-232.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-5
Q1-233.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-6
Q1-234.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-7
Q1-235.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-8
Q1-236.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-9
Q1-237.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-10

ES 2 546 417 T3

Compuesto No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G
Q1-238.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-11
Q1-239.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-12
Q1-240.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-13
Q1-241.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-14
Q1-242.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-15
Q1-243.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-16
Q1-244.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-17
Q1-245.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-18
Q1-246.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-19
Q1-247.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-21
Q1-248.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-22
Q1-249.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-23
Q1-250.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-24
Q1-251.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-25
Q1-252.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-26
Q1-253.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-27
Q1-254.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-28
Q1-255.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-256.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(=O)OCH <sub>3</sub>
Q1-257.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(=O)OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q1-258.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(=O)NHCH <sub>3</sub>
Q1-259.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(=O)NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q1-260.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q1-261.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-262.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q1-263.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(=O)NH-CH(CH <sub>3</sub> ) Ciclopropilo
Q1-264.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q1-265.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-266.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-1)
Q1-267.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-2)

ES 2 546 417 T3

Compuesto No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G
Q1-268.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C(=O)OCH <sub>3</sub>
Q1-269.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C(=O)OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q1-270.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C(=O)NHCH <sub>3</sub>
Q1-271.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C(=O)NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q1-272.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q1-273.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-274.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q1-275.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH(CH <sub>3</sub> ) Ciclopropilo
Q1-276.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q1-277.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-278.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-1)
Q1-279.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-2)
Q1-280.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)OCH <sub>3</sub>
Q1-281.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q1-282.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NHCH <sub>3</sub>
Q1-283.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NHC <sub>2</sub>
Q1-284.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q1-285.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-286.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q1-287.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH(CH <sub>3</sub> ) Ciclopropilo
Q1-288.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q1-289.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-290.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-1)
Q1-291.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-2)
Q1-292.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-293.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Q1-294.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-295.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-296.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q1-297.	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> (CF <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CF <sub>3</sub>

## ES 2 546 417 T3

Compuesto No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G
Q1-298.	CF <sub>3</sub>	H	H
Q1-299.	CF <sub>3</sub>	H	F
Q1-300.	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
Q1-301.	CF <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>
Q1-302.	CF <sub>3</sub>	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-303.	CF <sub>3</sub>	H	NHCH <sub>3</sub>
Q1-304.	CF <sub>3</sub>	H	NHCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-305.	CF <sub>3</sub>	H	NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-306.	CF <sub>3</sub>	H	NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-307.	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-308.	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-309.	CF <sub>3</sub>	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q1-310.	CF <sub>3</sub>	H	Ph
Q1-311.	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> Ph
Q1-312.	CF <sub>3</sub>	H	2-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-313.	CF <sub>3</sub>	H	3-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-314.	CF <sub>3</sub>	H	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-315.	CF <sub>3</sub>	H	2-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-316.	CF <sub>3</sub>	H	3-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-317.	CF <sub>3</sub>	H	4-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-318.	CF <sub>3</sub>	H	2-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-319.	CF <sub>3</sub>	H	3-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-320.	CF <sub>3</sub>	H	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-321.	CF <sub>3</sub>	H	2-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-322.	CF <sub>3</sub>	H	3-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-323.	CF <sub>3</sub>	H	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-324.	CF <sub>3</sub>	H	2-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-325.	CF <sub>3</sub>	H	3-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-326.	CF <sub>3</sub>	H	4-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-327.	CF <sub>3</sub>	H	-O-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>3</sub>

ES 2 546 417 T3

Compuesto No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G
Q1-328.	CF <sub>3</sub>	H	A-2
Q1-329.	CF <sub>3</sub>	H	A-3
Q1-330.	CF <sub>3</sub>	H	A-4
Q1-331.	CF <sub>3</sub>	H	A-5
Q1-332.	CF <sub>3</sub>	H	A-6
Q1-333.	CF <sub>3</sub>	H	A-7
Q1-334.	CF <sub>3</sub>	H	A-8
Q1-335.	CF <sub>3</sub>	H	A-9
Q1-336.	CF <sub>3</sub>	H	A-10
Q1-337.	CF <sub>3</sub>	H	A-11
Q1-338.	CF <sub>3</sub>	H	A-12
Q1-339.	CF <sub>3</sub>	H	A-13
Q1-340.	CF <sub>3</sub>	H	A-14
Q1-341.	CF <sub>3</sub>	H	A-15
Q1-342.	CF <sub>3</sub>	H	A-16
Q1-343.	CF <sub>3</sub>	H	A-17
Q1-344.	CF <sub>3</sub>	H	A-18
Q1-345.	CF <sub>3</sub>	H	A-19
Q1-346.	CF <sub>3</sub>	H	A-21
Q1-347.	CF <sub>3</sub>	H	A-22
Q1-348.	CF <sub>3</sub>	H	A-23
Q1-349.	CF <sub>3</sub>	H	A-24
Q1-350.	CF <sub>3</sub>	H	A-25
Q1-351.	CF <sub>3</sub>	H	A-26
Q1-352.	CF <sub>3</sub>	H	A-27
Q1-353.	CF <sub>3</sub>	H	A-28
Q1-354.	CF <sub>3</sub>	H	-CH <sub>2</sub> -4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-355.	CF <sub>3</sub>	H	C(=O)OCH <sub>3</sub>
Q1-356.	CF <sub>3</sub>	H	C(=O)OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q1-357.	CF <sub>3</sub>	H	C(=O)NHCH <sub>3</sub>

ES 2 546 417 T3

Compuesto No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G
Q1-358.	CF <sub>3</sub>	H	C(=O)NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q1-359.	CF <sub>3</sub>	H	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q1-360.	CF <sub>3</sub>	H	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-361.	CF <sub>3</sub>	H	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q1-362.	CF <sub>3</sub>	H	C(=O)NH-CH(CH <sub>3</sub> ) Ciclopropilo
Q1-363.	CF <sub>3</sub>	H	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q1-364.	CF <sub>3</sub>	H	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-365.	CF <sub>3</sub>	H	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-1)
Q1-366.	CF <sub>3</sub>	H	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-2)
Q1-367.	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> C(=O)OCH <sub>3</sub>
Q1-368.	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> C(=O)OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q1-369.	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> C(=O)NHCH <sub>3</sub>
Q1-370.	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> C(=O)NHC <sub>2</sub>
Q1-371.	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q1-372.	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-373.	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q1-374.	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH(CH <sub>3</sub> ) Ciclopropilo
Q1-375.	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q1-376.	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-377.	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-1)
Q1-378.	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-2)
Q1-379.	CF <sub>3</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)OCH <sub>3</sub>
Q1-380.	CF <sub>3</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q1-381.	CF <sub>3</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NHCH <sub>3</sub>
Q1-382.	CF <sub>3</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q1-383.	CF <sub>3</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q1-384.	CF <sub>3</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-385.	CF <sub>3</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q1-386.	CF <sub>3</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH(CH <sub>3</sub> ) Ciclopropilo
Q1-387.	CF <sub>3</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo

ES 2 546 417 T3

Compuesto No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G
Q1-388.	CF <sub>3</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-389.	CF <sub>3</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-1)
Q1-390.	CF <sub>3</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-2)
Q1-391.	CF <sub>3</sub>	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-392.	CF <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>
Q1-393.	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-394.	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-395.	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q1-396.	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> (CF <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-397.	F	H	H
Q1-398.	F	H	F
Q1-399.	F	H	CH <sub>3</sub>
Q1-400.	F	H	OCH <sub>3</sub>
Q1-401.	F	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-402.	F	H	NHCH <sub>3</sub>
Q1-403.	F	H	NHCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-404.	F	H	NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-405.	F	H	NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-406.	F	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-407.	F	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-408.	F	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q1-409.	F	H	Ph
Q1-410.	F	H	CH <sub>2</sub> Ph
Q1-411.	F	H	2-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-412.	F	H	3-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-413.	F	H	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-414.	F	H	2-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-415.	F	H	3-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-416.	F	H	4-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-417.	F	H	2-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>

## ES 2 546 417 T3

Compuesto No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G
Q1-418.	F	H	3-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-419.	F	H	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-420.	F	H	2-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-421.	F	H	3-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-422.	F	H	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-423.	F	H	2-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-424.	F	H	3-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-425.	F	H	4-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-426.	F	H	-O-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>3</sub>
Q1-427.	F	H	A-2
Q1-428.	F	H	A-3
Q1-429.	F	H	A-4
Q1-430.	F	H	A-5
Q1-431.	F	H	A-6
Q1-432.	F	H	A-7
Q1-433.	F	H	A-8
Q1-434.	F	H	A-9
Q1-435.	F	H	A-10
Q1-436.	F	H	A-11
Q1-437.	F	H	A-12
Q1-438.	F	H	A-13
Q1-439.	F	H	A-14
Q1-440.	F	H	A-15
Q1-441.	F	H	A-16
Q1-442.	F	H	A-17
Q1-443.	F	H	A-18
Q1-444.	F	H	A-19
Q1-445.	F	H	A-21
Q1-446.	F	H	A-22
Q1-447.	F	H	A-23

## ES 2 546 417 T3

Compuesto No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G
Q1-448.	F	H	A-24
Q1-449.	F	H	A-25
Q1-450.	F	H	A-26
Q1-451.	F	H	A-27
Q1-452.	F	H	A-28
Q1-453.	F	H	-CH <sub>2</sub> -4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-454.	F	H	C(=O)OCH <sub>3</sub>
Q1-455.	F	H	C(=O)OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q1-456.	F	H	C(=O)NHCH <sub>3</sub>
Q1-457.	F	H	C(=O)NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q1-458.	F	H	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q1-459.	F	H	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-460.	F	H	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q1-461.	F	H	C(=O)NH-CH(CH <sub>3</sub> ) Ciclopropilo
Q1-462.	F	H	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q1-463.	F	H	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-464.	F	H	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-1)
Q1-465.	F	H	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-2)
Q1-466.	F	H	CH <sub>2</sub> C(=O)OCH <sub>3</sub>
Q1-467.	F	H	CH <sub>2</sub> C(=O)OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q1-468.	F	H	CH <sub>2</sub> C(=O)NHCH <sub>3</sub>
Q1-469.	F	H	CH <sub>2</sub> C(=O)NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q1-470.	F	H	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q1-471.	F	H	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-472.	F	H	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q1-473.	F	H	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH(CH <sub>3</sub> ) Ciclopropilo
Q1-474.	F	H	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q1-475.	F	H	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-476.	F	H	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-1)
Q1-477.	F	H	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-2)

ES 2 546 417 T3

Compuesto No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G
Q1-478.	F	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)OCH <sub>3</sub>
Q1-479.	F	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q1-480.	F	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NHCH <sub>3</sub>
Q1-481.	F	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q1-482.	F	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q1-483.	F	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-484.	F	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q1-485.	F	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH(CH <sub>3</sub> ) Ciclopropilo
Q1-486.	F	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q1-487.	F	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-488.	F	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-1)
Q1-489.	F	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-2)
Q1-490.	F	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-491.	F	H	CF <sub>3</sub>
Q1-492.	F	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-493.	F	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-494.	F	H	CH <sub>2</sub> CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q1-495.	F	H	CH <sub>2</sub> (CF <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-496.	F	F	H
Q1-497.	F	F	F
Q1-498.	F	F	CH <sub>3</sub>
Q1-499.	F	F	OCH <sub>3</sub>
Q 1-500.	F	F	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-501.	F	F	NHCH <sub>3</sub>
Q1-502.	F	F	NHCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-503.	F	F	NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-504.	F	F	NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-505.	F	F	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-506.	F	F	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-507.	F	F	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>

## ES 2 546 417 T3

Compuesto No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G
Q1-508.	F	F	Ph
Q1-509.	F	F	CH <sub>2</sub> Ph
Q1-510.	F	F	2-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-511.	F	F	3-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-512.	F	F	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-513.	F	F	2-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-514.	F	F	3-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-515.	F	F	4-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-516.	F	F	2-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-517.	F	F	3-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-518.	F	F	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-519.	F	F	2-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-520.	F	F	3-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-521.	F	F	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-522.	F	F	2-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-523.	F	F	3-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-524.	F	F	4-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-525.	F	F	-O-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>3</sub>
Q1-526.	F	F	A-2
Q1-527.	F	F	A-3
Q1-528.	F	F	A-4
Q1-529.	F	F	A-5
Q1-530.	F	F	A-6
Q1-531.	F	F	A-7
Q1-532.	F	F	A-8
Q1-533.	F	F	A-9
Q1-534.	F	F	A-10
Q1-535.	F	F	A-11
Q1-536.	F	F	A-12
Q1-537.	F	F	A-13

ES 2 546 417 T3

Compuesto No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G
Q1-538.	F	F	A-14
Q1-539.	F	F	A-15
Q1-540.	F	F	A-16
Q1-541.	F	F	A-17
Q1-542.	F	F	A-18
Q1-543.	F	F	A-19
Q1-544.	F	F	A-21
Q1-545.	F	F	A-22
Q1-546.	F	F	A-23
Q1-547.	F	F	A-24
Q1-548.	F	F	A-25
Q1-549.	F	F	A-26
Q1-550.	F	F	A-27
Q1-551.	F	F	A-28
Q1-552.	F	F	-CH <sub>2</sub> -4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-553.	F	F	C(=O)OCH <sub>3</sub>
Q1-554.	F	F	C(=O)OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q1-555.	F	F	C(=O)NHCH <sub>3</sub>
Q1-556.	F	F	C(=O)NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q1-557.	F	F	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q1-558.	F	F	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-559.	F	F	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q1-560.	F	F	C(=O)NH-CH(CH <sub>3</sub> ) Ciclopropilo
Q1-561.	F	F	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q1-562.	F	F	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-563.	F	F	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-1)
Q1-564.	F	F	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-2)
Q1-565.	F	F	CH <sub>2</sub> C(=O)OCH <sub>3</sub>
Q1-566.	F	F	CH <sub>2</sub> C(=O)OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q1-567.	F	F	CH <sub>2</sub> C(=O)NHCH <sub>3</sub>

ES 2 546 417 T3

Compuesto No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G
Q1-568.	F	F	CH <sub>2</sub> C(=O)NHC <sub>2</sub>
Q1-569.	F	F	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q1-570.	F	F	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-571.	F	F	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q1-572.	F	F	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH(CH <sub>3</sub> ) Ciclopropilo
Q1-573.	F	F	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q1-574.	F	F	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>5</sub>
Q1-575.	F	F	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-1)
Q1-576.	F	F	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-2)
Q1-577.	F	F	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)OCH <sub>3</sub>
Q1-578.	F	F	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q1-579.	F	F	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NHCH <sub>3</sub>
Q1-580.	F	F	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q1-581.	F	F	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q 1-582.	F	F	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-583.	F	F	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q1-584.	F	F	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH(CH <sub>3</sub> ) Ciclopropilo
Q1-585.	F	F	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q1-586.	F	F	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-587.	F	F	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-1)
Q1-588.	F	F	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-2)
Q1-589.	F	F	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-590.	F	F	CF <sub>3</sub>
Q1-591.	F	F	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-592.	F	F	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-593.	F	F	CH <sub>2</sub> CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q1-594.	F	F	CH <sub>2</sub> (CF <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-595.	F	CH <sub>3</sub>	H
Q1-596.	F	CH <sub>3</sub>	F
Q1-597.	F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>

## ES 2 546 417 T3

Compuesto No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G
Q1-598.	F	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>
Q1-599.	F	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-600.	F	CH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>
Q1-601.	F	CH <sub>3</sub>	NHCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-602.	F	CH <sub>3</sub>	NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-603.	F	CH <sub>3</sub>	NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-604.	F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-605.	F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-606.	F	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q1-607.	F	CH <sub>3</sub>	Ph
Q1-608.	F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> Ph
Q1-609.	F	CH <sub>3</sub>	2-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-610.	F	CH <sub>3</sub>	3-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-611.	F	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-612.	F	CH <sub>3</sub>	2-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-613.	F	CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-614.	F	CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-615.	F	CH <sub>3</sub>	2-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-616.	F	CH <sub>3</sub>	3-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-617.	F	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-618.	F	CH <sub>3</sub>	2-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-619.	F	CH <sub>3</sub>	3-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-620.	F	CH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-621.	F	CH <sub>3</sub>	2-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-622.	F	CH <sub>3</sub>	3-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-623.	F	CH <sub>3</sub>	4-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-624.	F	CH <sub>3</sub>	-O-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>3</sub>
Q1-625.	F	CH <sub>3</sub>	A-2
Q1-626.	F	CH <sub>3</sub>	A-3
Q1-627.	F	CH <sub>3</sub>	A-4

ES 2 546 417 T3

Compuesto No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G
Q1-628.	F	CH <sub>3</sub>	A-5
Q1-629.	F	CH <sub>3</sub>	A-6
Q1-630.	F	CH <sub>3</sub>	A-7
Q1-631.	F	CH <sub>3</sub>	A-8
Q1-632.	F	CH <sub>3</sub>	A-9
Q1-633.	F	CH <sub>3</sub>	A-10
Q1-634.	F	CH <sub>3</sub>	A-11
Q1-635.	F	CH <sub>3</sub>	A-12
Q1-636.	F	CH <sub>3</sub>	A-13
Q1-637.	F	CH <sub>3</sub>	A-14
Q1-638.	F	CH <sub>3</sub>	A-15
Q1-639.	F	CH <sub>3</sub>	A-16
Q1-640.	F	CH <sub>3</sub>	A-17
Q1-641.	F	CH <sub>3</sub>	A-18
Q1-642.	F	CH <sub>3</sub>	A-19
Q1-643.	F	CH <sub>3</sub>	A-21
Q1-644.	F	CH <sub>3</sub>	A-22
Q1-645.	F	CH <sub>3</sub>	A-23
Q1-646.	F	CH <sub>3</sub>	A-24
Q1-647.	F	CH <sub>3</sub>	A-25
Q1-648.	F	CH <sub>3</sub>	A-26
Q1-649.	F	CH <sub>3</sub>	A-27
Q1-650.	F	CH <sub>3</sub>	A-28
Q1-651.	F	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q 1-652.	F	CH <sub>3</sub>	C(=O)OCH <sub>3</sub>
Q1-653.	F	CH <sub>3</sub>	C(=O)OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q 1-654.	F	CH <sub>3</sub>	C(=O)NHCH <sub>3</sub>
Q1-655.	F	CH <sub>3</sub>	C(=O)NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q1-656.	F	CH <sub>3</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q1-657.	F	CH <sub>3</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>

ES 2 546 417 T3

Compuesto No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G
Q1-658.	F	CH <sub>3</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q1-659.	F	CH <sub>3</sub>	C(=O)NH-CH(CH <sub>3</sub> ) Ciclopropilo
Q1-660.	F	CH <sub>3</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q1-661.	F	CH <sub>3</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-662.	F	CH <sub>3</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-1)
Q1-663.	F	CH <sub>3</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-2)
Q1-664.	F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C(=O)OCH <sub>3</sub>
Q1-665.	F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C(=O)OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q1-666.	F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C(=O)NHCH <sub>3</sub>
Q1-667.	F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C(=O)NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q1-668.	F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q1-669.	F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-670.	F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q1-671.	F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH(CH <sub>3</sub> ) Ciclopropilo
Q1-672.	F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q1-673.	F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-674.	F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-1)
Q1-675.	F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-2)
Q1-676.	F	CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)OCH <sub>3</sub>
Q1-677.	F	CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q1-678.	F	CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NHCH <sub>3</sub>
Q1-679.	F	CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NHC <sub>2</sub>
Q1-680.	F	CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q1-681.	F	CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-682.	F	CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q1-683.	F	CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH(CH <sub>3</sub> ) Ciclopropilo
Q1-684.	F	CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q1-685.	F	CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-686.	F	CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-1)
Q1-687.	F	CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-2)

ES 2 546 417 T3

Compuesto No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G
Q1-688.	F	CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-689.	F	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Q1-690.	F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-691.	F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-692.	F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q1-693.	F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> (CF <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-694.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
Q1-695.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	F
Q1-696.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
Q1-697.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>
Q1-698.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-699.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>
Q1-700.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NHCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-701.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-702.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-703.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-704.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-705.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q1-706.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Ph
Q1-707.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> Ph
Q1-708.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	2-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-709.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	3-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-710.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-711.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	2-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-712.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-713.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-714.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	2-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-715.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	3-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-716.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-717.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	2-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>

## ES 2 546 417 T3

Compuesto No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G
Q1-718.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	3-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-719.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-720.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	2-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-721.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	3-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-722.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-723.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-O-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>3</sub>
Q1-724.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-2
Q1-725.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-3
Q1-726.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-4
Q1-727.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-5
Q1-728.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-6
Q1-729.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-7
Q1-730.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-8
Q1-731.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-9
Q1-732.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-10
Q1-733.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-11
Q1-734.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-12
Q1-735.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-13
Q1-736.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-14
Q1-737.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-15
Q1-738.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-16
Q1-739.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-17
Q1-740.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-18
Q1-741.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-19
Q1-742.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-21
Q1-743.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-22
Q 1-744.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-23
Q1-745.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-24
Q1-746.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-25
Q1-747.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-26

ES 2 546 417 T3

Compuesto No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G
Q1-748.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-27
Q1-749.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	A-28
Q1-750.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q1-751.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(=O)OCH <sub>3</sub>
Q1-752.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(=O)OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q1-753.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(=O)NHCH <sub>3</sub>
Q1-754.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(=O)NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q1-755.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q1-756.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-757.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q1-758.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(=O)NH-CH (CH <sub>3</sub> ) Ciclopropilo
Q1-759.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q1-760.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-761.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-1)
Q1-762.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-2)
Q1-763.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C(=O)OCH <sub>3</sub>
Q1-764.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C(=O)OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q1-765.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C(=O)NHCH <sub>3</sub>
Q1-766.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C(=O)NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q1-767.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q1-768.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-769.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q1-770.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH(CH <sub>3</sub> ) Ciclopropilo
Q1-771.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q1-772.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-773.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-1)
Q1-774.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-2)
Q1-775.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)OCH <sub>3</sub>
Q1-776.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q1-777.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NHCH <sub>3</sub>

ES 2 546 417 T3

Compuesto No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G
Q1-778.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q1-779.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q1-780.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-781.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q1-782.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH(CH <sub>3</sub> ) Ciclopropilo
Q1-783.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q1-784.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-785.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-1)
Q1-786.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-2)
Q1-787.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q1-788.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Q1-789.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-790.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q1-791.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q1-792.	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> (CF <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CF <sub>3</sub>

Tabla 309 a tabla 618 de compuestos preferidos

Compuestos como se define en analogía con la tabla 1 a la tabla 264, pero en donde la combinación de R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> y G para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q2.

5

Tabla Q2:

Compuesto No.	R <sup>1</sup> y R <sup>2</sup>	G
Q2-1.	=NOH	C(=O)OCH <sub>3</sub>
Q2-2.	=NOH	C(=O)OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q2-3.	=NOH	C(=O)NHCH <sub>3</sub>
Q2-4.	=NOH	C(=O)NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q2-5.	=NOH	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q2-6.	=NOH	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q2-7.	=NOH	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q2-8.	=NOH	C(=O)NH-CH(CH <sub>3</sub> ) Ciclopropilo
Q2-9.	=NOH	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q2-10.	=NOH	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>

ES 2 546 417 T3

Compuesto No.	R <sup>1</sup> y R <sup>2</sup>	G
Q2-11.	=NOH	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-1)
Q2-12.	=NOH	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-2)
Q2-13.	=NOH	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q2-14.	=NOH	CF <sub>3</sub>
Q2-15.	=NOH	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q2-16.	=NOCH <sub>3</sub>	C(=O)OCH <sub>3</sub>
Q2-17.	=NOCH <sub>3</sub>	C(=O)OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q2-18.	=NOCH <sub>3</sub>	C(=O)NHCH <sub>3</sub>
Q2-19.	=NOCH <sub>3</sub>	C(=O)NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q2-20.	=NOCH <sub>3</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q2-21.	=NOCH <sub>3</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q2-22.	=NOCH <sub>3</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q2-23.	=NOCH <sub>3</sub>	C(=O)NH-CH(CH <sub>3</sub> ) Ciclopropilo
Q2-24.	=NOCH <sub>3</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q2-25.	=NOCH <sub>3</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>5</sub>
Q2-26.	=NOCH <sub>3</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-1)
Q2-27.	=NOCH <sub>3</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-2)
Q2-28.	=NOCH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q2-29.	=NOCH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
Q2-30.	=NOCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q2-31.	=NOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C(=O)OC
Q2-32.	=NOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C(=O)OC-2H <sub>5</sub>
Q2-33.	=NOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C(=O)NHCH <sub>3</sub>
Q2-34.	=NOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C(=O)NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q2-35.	=NOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q2-36.	=NOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q2-37.	=NOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q2-38.	=NOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C(=O)NH-CH(CH <sub>3</sub> ) Ciclopropilo
Q2-39.	=NOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q2-40.	=NOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>5</sub>

ES 2 546 417 T3

Compuesto No.	R <sup>1</sup> y R <sup>2</sup>	G
Q2-41.	=NOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-1)
Q2-42.	=NOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-2)
Q2-43.	=NOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q2-44.	=NOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>
Q2-45.	=NOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q2-46.	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H
Q2-47.	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CH <sub>3</sub>
Q2-48.	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q2-49.	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q2-50.	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q2-51.	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H
Q2-52.	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CH <sub>3</sub>
Q2-53.	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q2-54.	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q2-55.	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q2-56.	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H
Q2-57.	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CH <sub>3</sub>
Q2-58.	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q2-59.	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q2-60.	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q2-61.	=O	H
Q2-62.	=O	CH <sub>3</sub>
Q2-63.	=O	OCH <sub>3</sub>
Q2-64.	=O	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q2-65.	=O	NHCH <sub>3</sub>
Q2-66.	=O	NHCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q2-67.	=O	NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q2-68.	=O	NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q2-69.	=O	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q2-70.	=O	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>

ES 2 546 417 T3

Compuesto No.	R <sup>1</sup> y R <sup>2</sup>	G
Q2-71.	=O	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q2-72.	=CH <sub>2</sub>	H
Q2-73.	=CH <sub>2</sub>	F
Q2-74.	=CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
Q2-75.	=CH <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>
Q2-76.	=CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q2-77.	=CH <sub>2</sub>	NHCH <sub>3</sub>
Q2-78.	=CH <sub>2</sub>	NHCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q2-79.	=CH <sub>2</sub>	NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q2-80.	=CH <sub>2</sub>	NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q2-81.	=CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q2-82.	=CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q2-83.	=CH <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q2-84.	=CH <sub>2</sub>	Ph
Q2-85.	=CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> Ph
Q2-86.	=CH <sub>2</sub>	2-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q2-87.	=CH <sub>2</sub>	3-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q2-88.	=CH <sub>2</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q2-89.	=CH <sub>2</sub>	2-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q2-90.	=CH <sub>2</sub>	3-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q2-91.	=CH <sub>2</sub>	4-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q2-92.	=CH <sub>2</sub>	2-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q2-93.	=CH <sub>2</sub>	3-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q2-94.	=CH <sub>2</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q2-95.	=CH <sub>2</sub>	2-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q2-96.	=CH <sub>2</sub>	3-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q2-97.	=CH <sub>2</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q2-98.	=CH <sub>2</sub>	2-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q2-99.	=CH <sub>2</sub>	3-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q2-100.	=CH <sub>2</sub>	4-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>

ES 2 546 417 T3

Compuesto No.	R <sup>1</sup> y R <sup>2</sup>	G
Q2-101.	=CH <sub>2</sub>	-O-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>3</sub>
Q2-102.	=CH <sub>2</sub>	A-2
Q2-103.	=CH <sub>2</sub>	A-3
Q2-104.	=CH <sub>2</sub>	A-4
Q2-105.	=CH <sub>2</sub>	A-5
Q2-106.	=CH <sub>2</sub>	A-6
Q2-107.	=CH <sub>2</sub>	A-7
Q2-108.	=CH <sub>2</sub>	A-8
Q2-109.	=CH <sub>2</sub>	A-9
Q2-110.	=CH <sub>2</sub>	A-10
Q2-111.	=CH <sub>2</sub>	A-11
Q2-112.	=CH <sub>2</sub>	A-12
Q2-113.	=CH <sub>2</sub>	A-13
Q2-114.	=CH <sub>2</sub>	A-14
Q2-115.	=CH <sub>2</sub>	A-15
Q2-116.	=CH <sub>2</sub>	A-16
Q2-117.	=CH <sub>2</sub>	A-17
Q2-118.	=CH <sub>2</sub>	A-18
Q2-119.	=CH <sub>2</sub>	A-19
Q2-120.	=CH <sub>2</sub>	A-21
Q2-121.	=CH <sub>2</sub>	A-22
Q2-122.	=CH <sub>2</sub>	A-23
Q2-123.	=CH <sub>2</sub>	A-24
Q2-124.	=CH <sub>2</sub>	A-25
Q2-125.	=CH <sub>2</sub>	A-26
Q2-126.	=CH <sub>2</sub>	A-27
Q2-127.	=CH <sub>2</sub>	A-28
Q2-128.	=CH <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> -4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q2-129.	=CH <sub>2</sub>	C(=O)OCH <sub>3</sub>
Q2-130.	=CH <sub>2</sub>	C(=O)OC-,H5

ES 2 546 417 T3

Compuesto No.	R <sup>1</sup> y R <sup>2</sup>	G
Q2-131.	=CH <sub>2</sub>	C(=O)NHCH <sub>3</sub>
Q2-132.	=CH <sub>2</sub>	C(=O)NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q2-133.	=CH <sub>2</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q2-134.	=CH <sub>2</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q2-135.	=CH <sub>2</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q2-136.	=CH <sub>2</sub>	C(=O)NH-CH(CH <sub>3</sub> ) Ciclopropilo
Q2-137.	=CH <sub>2</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q2-138.	=CH <sub>2</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q2-139.	=CH <sub>2</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-1)
Q2-140.	=CH <sub>2</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-2)
Q2-141.	=CH <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q2-142.	=CH <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
Q2-143.	=CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q2-144.	=CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q2-145.	=CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q2-146.	=CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> (CF <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CF <sub>3</sub>
Q2-147.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
Q2-148.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	F
Q2-149.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
Q2-150.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>
Q2-151.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q2-152.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	NHCH <sub>3</sub>
Q2-153.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	NHCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q2-154.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q2-155.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q2-156.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q2-157.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q2-158.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q2-159.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Ph
Q2-160.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> Ph

## ES 2 546 417 T3

Compuesto No.	R <sup>1</sup> y R <sup>2</sup>	G
Q2-161.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q2-162.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	3-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q2-163.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q2-164.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q2-165.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	3-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q2-166.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q2-167.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q2-168.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	3-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q2-169.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q2-170.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q2-171.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	3-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q2-172.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q2-173.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	2-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q2-174.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	3-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q2-175.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q2-176.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-O-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>3</sub>
Q2-177.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	A-2
Q2-178.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	A-3
Q2-179.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	A-4
Q2-180.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	A-5
Q2-181.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	A-6
Q2-182.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	A-7
Q2-183.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	A-8
Q2-184.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	A-9
Q2-185.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	A-10
Q2-186.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	A-11
Q2-187.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	A-12
Q2-188.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	A-13
Q2-189.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	A-14
Q2-190.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	A-15

ES 2 546 417 T3

Compuesto No.	R <sup>1</sup> y R <sup>2</sup>	G
Q2-191.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	A-16
Q2-192.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	A-17
Q2-193.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	A-18
Q2-194.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	A-19
Q2-195.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	A-21
Q2-196.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	A-22
Q2-197.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	A-23
Q2-198.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	A-24
Q2-199.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	A-25
Q2-200.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	A-26
Q2-201.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	A-27
Q2-202.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	A-28
Q2-203.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> -4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q2-204.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	C(=O)OCH <sub>3</sub>
Q2-205.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	C(=O)OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q2-206.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	C(=O)NHCH <sub>3</sub>
Q2-207.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	C(=O)NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Q2-208.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Q2-209.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q2-210.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q2-211.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	C(=O)NH-CH(CH <sub>3</sub> ) Ciclopropilo
Q2-212.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> Ciclopropilo
Q2-213.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> C(=O)NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>5</sub>
Q2-214.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-1)
Q2-215.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	C(=O)NH-CH <sub>2</sub> (A-2)
Q2-216.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Q2-217.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>
Q2-218.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q2-219.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Q2-220.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>

ES 2 546 417 T3

Compuesto No.	R <sup>1</sup> y R <sup>2</sup>	G
Q2-221.	=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> (CF <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CF <sub>3</sub>

Tabla 619 a tabla 927 de compuestos preferidos

Los compuestos como se definen en analogía con la tabla 1 a la tabla 264, pero en donde la combinación de R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> para un compuesto corresponde en cada caso a una fila de la Tabla Q3, y en donde G no está presente (m = 0).

5

Tabla Q3:

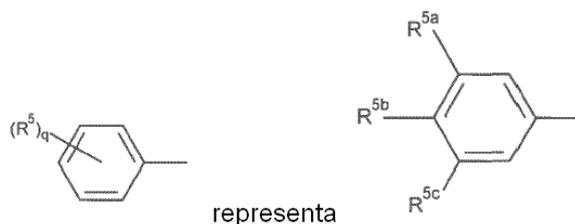
Compuesto No..	R <sup>1</sup> y R <sup>2</sup>
Q3-1.	C <sub>4</sub> H <sub>6</sub>
Q3-2.	2-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q3-3.	3-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q3-4.	4-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q3-5.	2-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q3-6.	3-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q3-7.	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q3-8.	2-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q3-9.	3-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q3-10.	4-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q3-11.	2-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q3-12.	3-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q3-13.	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q3-14.	2-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q3-15.	3-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q3-16.	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q3-17.	2-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q3-18.	3-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q3-19.	4-OCF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>
Q3-20.	A-2
Q3-21.	A-3
Q3-22.	A-4
Q3-23.	A-5
Q3-24.	A-6

Compuesto No..	R <sup>1</sup> y R <sup>2</sup>
Q3-25.	A-7
Q3-26.	A-8
Q3-27.	A-9
Q3-28.	A-10
Q3-29.	A-11
Q3-30.	A-12
Q3-31.	A-13
Q3-32.	A-14
Q3-33.	A-15
Q3-34.	A-16
Q3-35.	A-17
Q3-36.	A-18
Q3-37.	A-19
Q3-38.	A-21
Q3-39.	A-22
Q3-40.	A-23
Q3-41.	A-24
Q3-42.	A-25
Q3-43.	A-26
Q3-44.	A-27
Q3-45.	A-28

#### Métodos de preparación

Los métodos para la preparación de compuestos de isoxazolina cetónica sustituidos de fórmula (I-5)

5 Los compuestos de fórmula (I-5) se pueden preparar de acuerdo con los siguientes métodos y variaciones descritos en los esquemas 1-7 a continuación. R<sup>1</sup>-R<sup>3</sup>, G, y m se definen como anteriormente para la fórmula (I-5).



y



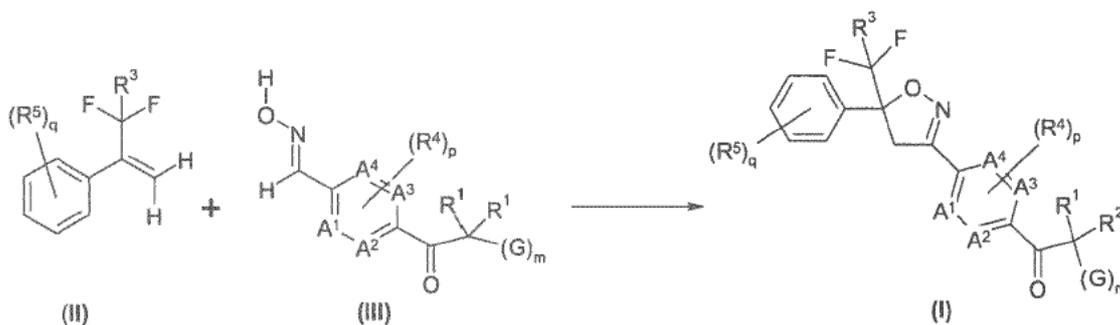
y donde  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{5a}$ ,  $R^{5b}$  y  $R^{5c}$  son como se definieron anteriormente.

En los siguientes esquemas y descripciones de reacción, los compuestos (I-5) se denominan compuestos I.

- 5 Los compuestos de fórmula I pueden, por ejemplo, ser preparados por cicloadición de compuestos de estireno de la fórmula II con óxidos de nitrilo derivados de oximas de fórmula III como se indica en el esquema 1. La reacción tiene lugar típicamente a través de la intermediación de un halogenuro de ácido hidroxámico generado in situ, normalmente un cloruro, por reacción con un agente de halogenación como el cloro, hipocloruro, N-succinimida, o cloramina-T. El agente de halogenación se combina con la oxima antes de la adición, o en la presencia del estireno II. Dependiendo de las condiciones, pueden ser necesarias bases de amina tales como piridina o trietilamina. La reacción se puede ejecutar en una amplia variedad de solventes incluyendo DMF, tolueno, diclorometano, clorobenceno, acetonitrilo, tetrahidrofurano, dietiléter, acetato de etilo o similares.

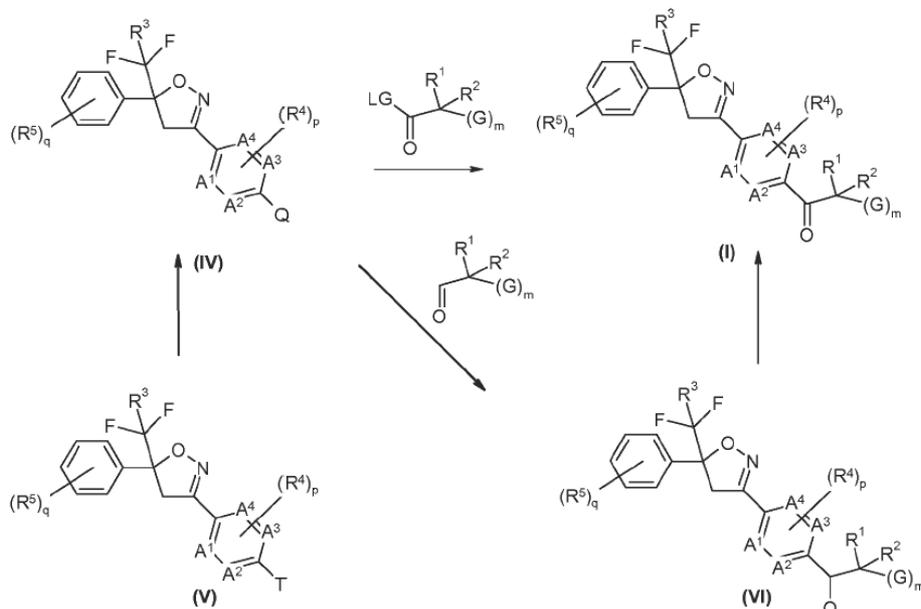
Los compuestos de estireno correspondientes de fórmula II se pueden preparar como se describen por ejemplo, en el documento WO 2005/085216 o WO 2007/094313, o más preferiblemente como se describe en la solicitud EP 09159246.9.

- 15 Esquema 1:



- Los compuestos de fórmula I, también se pueden preparar como se indica en el esquema 2 haciendo reaccionar un compuesto organometálico de fórmula IV con un derivado de ácido carboxílico. En el esquema 2 Q puede ser un metal tal como por ejemplo  $ZnT_2$ ,  $MgT_2$ , Li, Na, K,  $SnT_3$ , con T siendo un halógeno; con LG siendo un grupo saliente tal como halógeno o OR o  $S(O)_nR$ , en donde R es  $C_1-C_6$ -alquilo,  $C_1-C_6$ -haloalquilo, un fenilo sustituido, tal como por ejemplo, tosilo y n es 0-2; como se describe, por ejemplo, en el documento WO 2008/156721 o por Dieter et al, Tetrahedron (2003), 59 (7), 1083-1094. Los compuestos de fórmula I también se pueden preparar a partir de alcoholes secundarios del compuesto VI por oxidación, como por ejemplo se describe en el documento US 2007265321. Los compuestos de fórmula VI se pueden preparar haciendo reaccionar compuestos de fórmula IV con un aldehído, como por ejemplo se describe por Yamagishi et al, Journal of Organic Chemistry (2009), 74(16), 6350-6353.

Esquema 2:

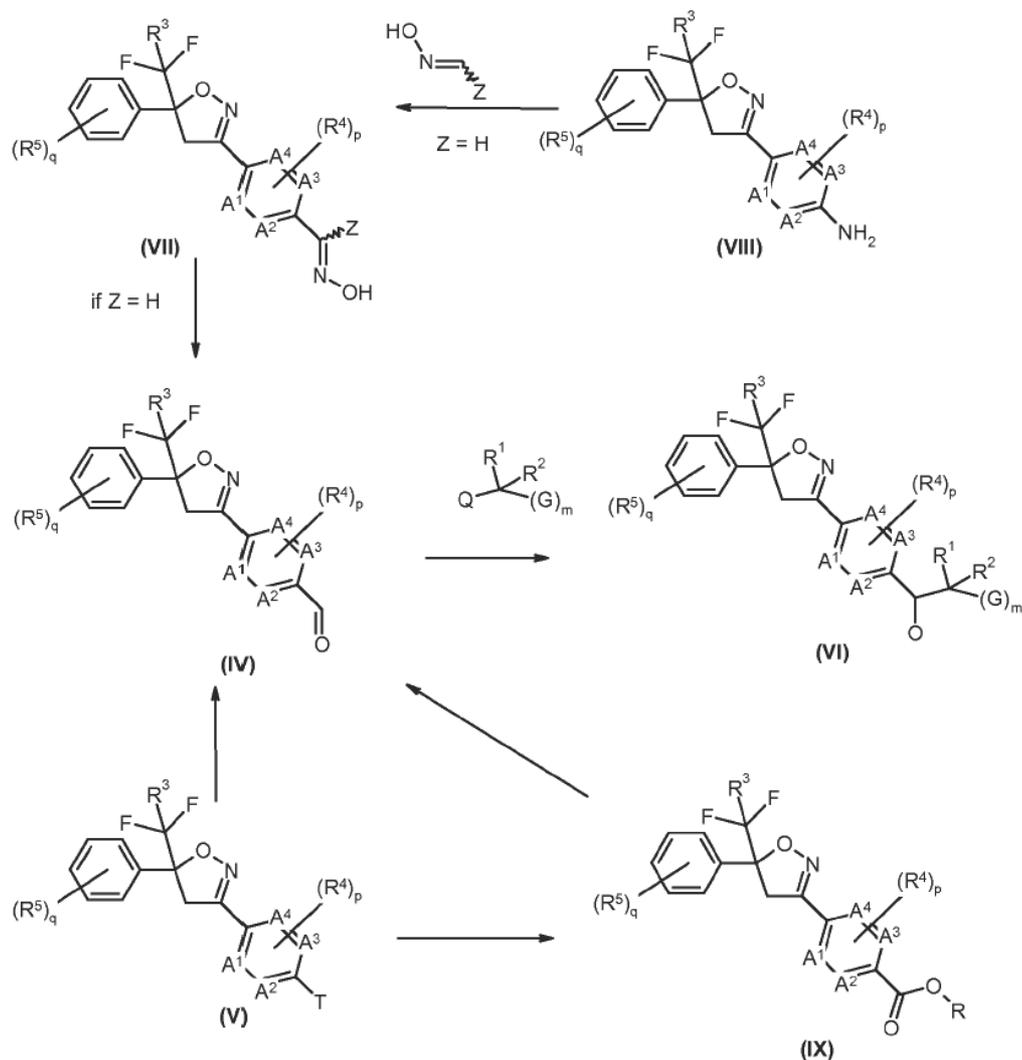


5 Los organilos de metal correspondientes de fórmula IV se pueden preparar mediante una reacción de intercambio halógeno-metal de haluros de fórmula V. Los haluros correspondientes de fórmula V se pueden preparar como se describe por ejemplo en el documento US 2007066617 o en la solicitud EP 09159246.9 (en donde T está en la fórmula V es Cl, Br, I).

Los compuestos de fórmula VI también se pueden preparar como se describe en el esquema 3 haciendo reaccionar un aldehído de fórmula IV con un nucleófilo apropiado, como por ejemplo descrito por Joncour et al, ChemMedChem (2008), 3(11), 1731-1739.

10 Los compuestos de fórmula IV en el esquema 3 se pueden preparar por carbonilación catalizada por paladio de compuestos de fórmula V, como se describe por ejemplo por Banard et al, Organic Process Research & Development (2008), 12(4), 566-574. Los compuestos de fórmula IV también se pueden preparar por reducción o una secuencia de reducción/oxidación de ésteres de fórmula IX, como por ejemplo se describe en el documento WO 2007017468 (reducción) o en el documento WO 2006128803 (secuencia de reducción/oxidación).  
 15 Los compuestos de fórmula IX se pueden preparar por carbonilación de compuestos de fórmula V, como por ejemplo se describe en el documento WO 2005/085216.

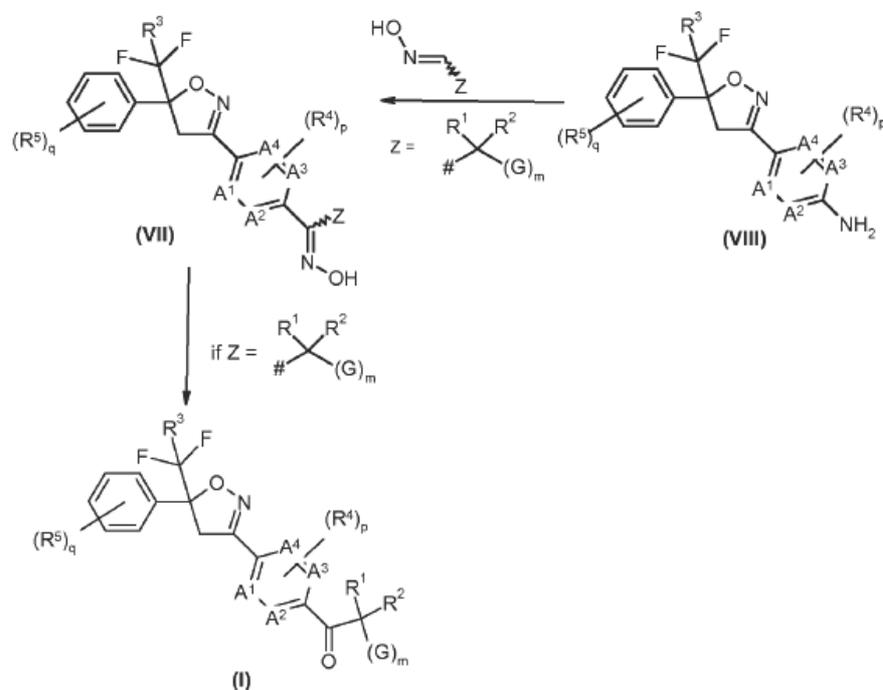
Esquema 3:



Los aldehídos de fórmula IV también se pueden preparar a partir de las oximas respectivas (si Z es hidrógeno) de fórmula VII por hidrólisis ácida, como por ejemplo descrito por Lin et al, Chemistry - A European Journal (2009), 15(10), 2305-2309. Los compuestos de fórmula VII se pueden preparar por diazotación de una amina de fórmula VIII y reacción de cobre catalizado con una formoxima (Z es hidrógeno) como en el esquema 3 o una oxima mayor sustituida (Z es  $C(R^1)(R^2)-G$ ) como en el esquema 3a (véase más abajo), como por ejemplo se describe por Philipp et al, Justus Liebig's Annalen der Chemie (1936), 523, 285-289 o por Woodward et al, Tetrahedron (1958), 2, 1-57 o en la solicitud EP 09159246.9. En el caso de este último, los compuestos de fórmula I se pueden entonces preparar de acuerdo con el esquema 3a directamente por hidrólisis ácida de compuestos de fórmula VII (Z en este caso es igual a  $C(R^1)(R^2)-G$ ), como por ejemplo se describe por Singh et al, European Journal of Organic Chemistry (2008), (32), 5446-5460, y obtenidas después de la diazotación de la amina de fórmula VIII con la oxima sustituida concordantemente. Los compuestos correspondientes de fórmula VIII se pueden preparar generalmente de acuerdo con el documento WO 2007/125984.

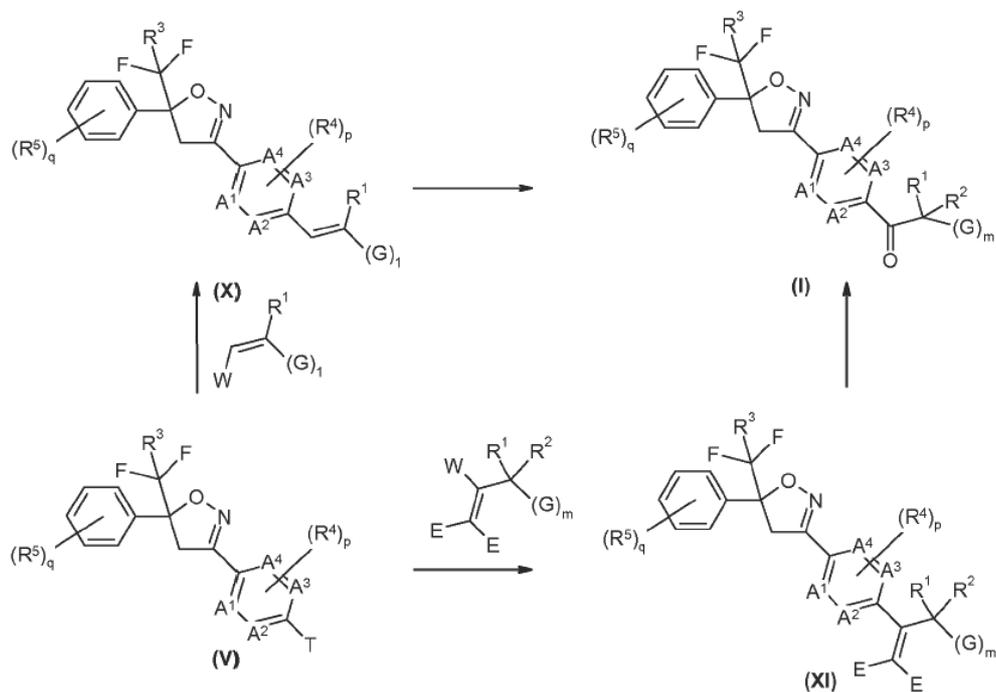
5  
10

Esquema 3a



- Compuestos de fórmula I también se pueden preparar como se delinea en el esquema 4 por una oxidación de tipo Wacker de una olefina de fórmula X, como por ejemplo descrita por Lu et al, *Catalysis Letters* (2009), 131(3-4), 517-525 . La olefina correspondiente de fórmula X se puede preparar por reacción catalizada de metal de transición de un haluro de fórmula V con un ácido borónico o un estannano. En el esquema 4, W puede ser por ejemplo B(OR)<sub>2</sub> o Sn(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo)<sub>3</sub>, T puede ser un halógeno como por ejemplo Cl, Br o I o un grupo saliente LG como por ejemplo OS(O)<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> y E es hidrógeno, alquilo, arilo o similar], como por ejemplo se describe por Giannini et al, *Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters* (2009), 19(8), 2346-2349. Los compuestos de fórmula I también se pueden preparar por ozonólisis de compuestos de fórmula XI como se describe por ejemplo por Gioiello et al, *Journal of Organic Chemistry* (2009), 74(9), 3520-3523. Alternativamente, esta reacción puede ser sustituida por una secuencia de dihidroxilación/escisión glicol como por ejemplo descrita por Bogar et al, *Organic Letters* (2007), 9(17), 3401-3404.

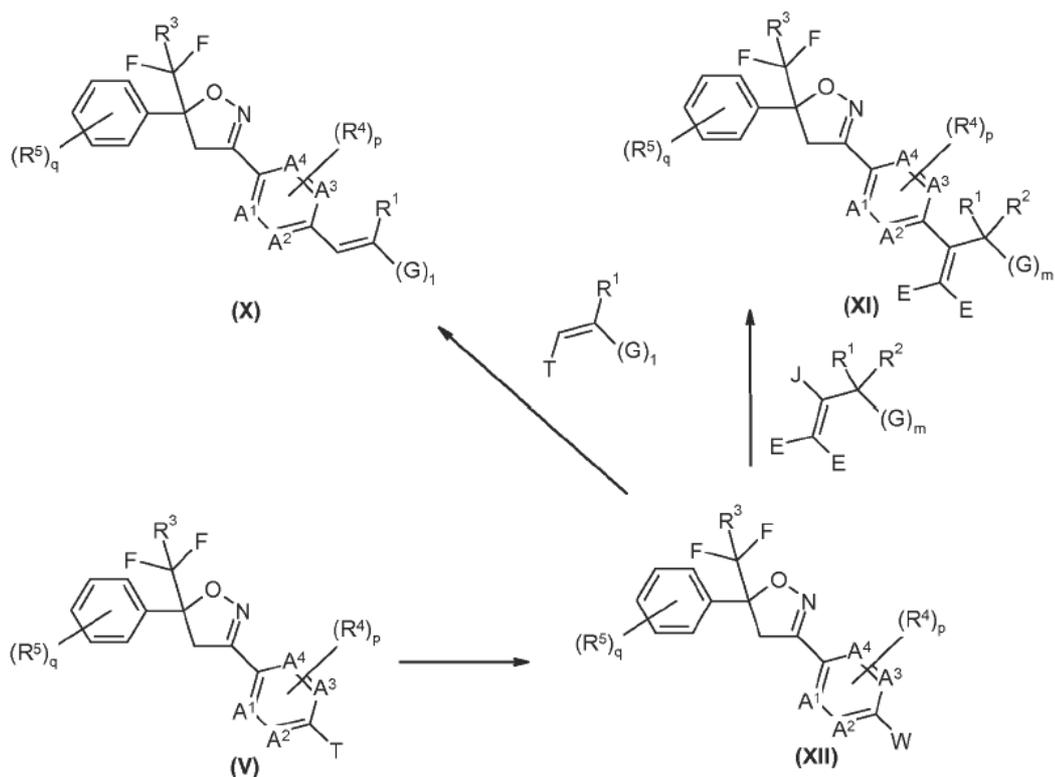
Esquema 4:



Los compuestos correspondientes de fórmula XI se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula V en la misma manera como se describió anteriormente, en donde [W puede ser por ejemplo B(OR)<sub>2</sub> o Sn(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo)<sub>3</sub>], como se describe por ejemplo por Konno et al, Journal of Organic Chemistry (2004), 69(6), 2188-2190.

- 5 Compuestos de fórmula X y XI también se pueden preparar como se delinea en el esquema 5, en donde las variables W, T y E son definidas en el esquema 4, haciendo reaccionar un compuesto organometálico o un compuesto órgano bórico de fórmula XII, con una olefina halogenada, como se describe por ejemplo por Simard-Mercier et al, Journal of Organic Chemistry (2008), 73(15), 5899-5906.

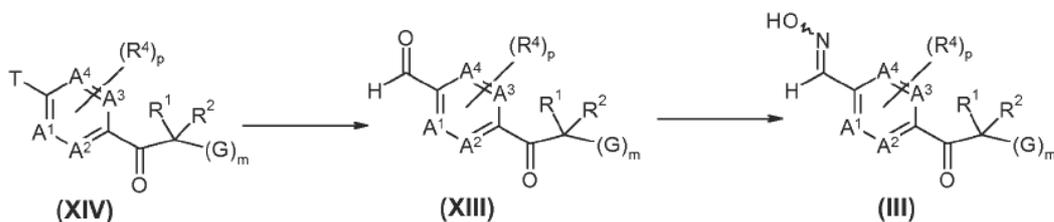
Esquema 5:



Los compuestos correspondientes de fórmula XII se pueden preparar a partir de halógenos de fórmula V por intercambio de metal halógeno, transmetalación subsecuente o reacción con un éster bórico o un compuesto de diboro, como por ejemplo descrito por Liu et al, Journal of the American Chemical Society (2009), 131(24), 8703-8707.

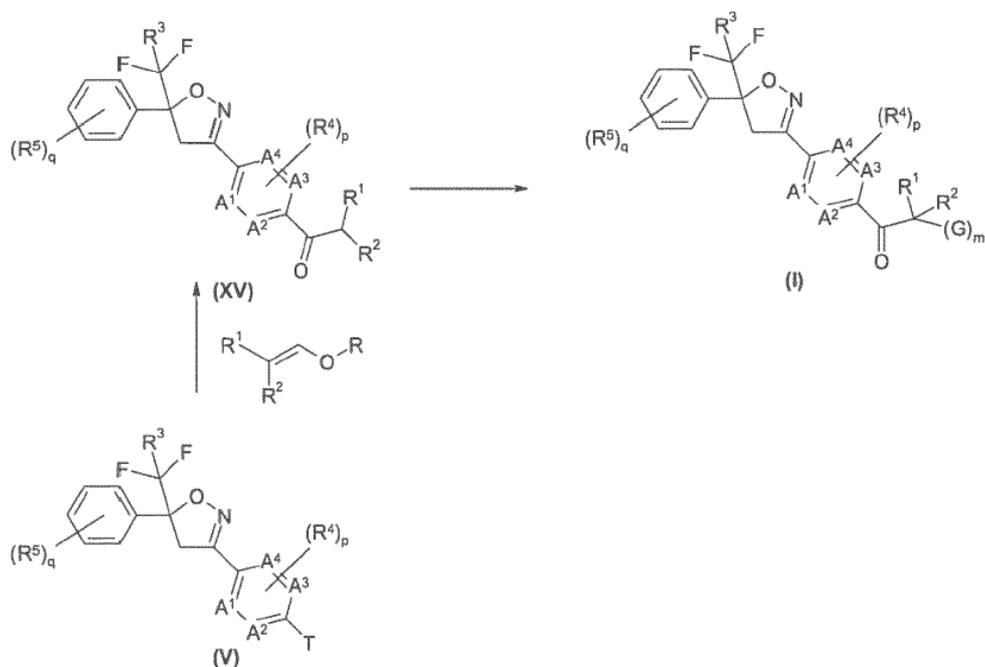
Los compuestos de fórmula III se pueden preparar como se describe en el esquema 6 haciendo reaccionar un aldehído de fórmula XIII con hidroxilamina como se describe por ejemplo en el documento WO 2005/085216. Compuestos aldehído de fórmula XIII se pueden preparar por ejemplo por metalación de un halogenado de fórmula XIV (T puede ser un halógeno como por ejemplo Cl, Br, I) y la reacción con un reactivo de formilación o monóxido de carbono como se describe por ejemplo en el documento WO 2005/085.216. Los compuestos correspondientes de fórmula XIV se pueden preparar como se describe por ejemplo en el documento WO 2009/127609.

Esquema 6:



Los compuestos de fórmula I se pueden preparar como se describe en el esquema 7 por alfa-alkilación de cetona de fórmula XV y la detención con un electrófilo, como se describe por ejemplo por Zheng et al, Chemistry-- A European Journal (2008), 14(32), 9864- 9867. Esto puede implicar también un proceso de dos etapas a través de la intermediación de un enol éter o un silil enol éter y reacción subsecuente de tipo Mukaiyama, como se describe por ejemplo por Mukaiyama et al, Chemistry Letters (1991), (6), 949-52. Las cetonas de fórmula XV se pueden preparar a partir de haluros de fórmula V por una reacción de tipo de Heck con un enol éter, como se describe por ejemplo en el documento JP 2008-044858.

Esquema 7.



Si los compuestos individuales no se pueden preparar a través de las rutas anteriormente descritas, se pueden preparar por derivación de otros compuestos I o por modificaciones habituales de las rutas de síntesis descritas.

- 5 Las mezclas de reacción se manipulan en la forma habitual, por ejemplo mediante la mezcla con agua, separación de las fases, y, si es apropiado, purificando los productos crudos por cromatografía, por ejemplo sobre alúmina o sílica gel. Algunos de los intermediarios y productos finales se pueden obtener en la forma de aceites viscosos incoloros o de color marrón pálido, que se liberan o purifican a partir de componentes volátiles bajo presión reducida y temperatura moderadamente elevada. Si los intermedios y los productos finales se obtienen como sólidos, se pueden purificar por recristalización o digestión.

## 10 Plagas

Los compuestos de la fórmula (I-5), y sus sales son en particular adecuados para controlar eficientemente plagas de artrópodos tales como arácnidos, miriápodos e insectos así como nematodos.

Los compuestos de la fórmula (I-5) son especialmente adecuados para combatir eficientemente las siguientes plagas:

- 15 Insectos del orden de los lepidópteros (*Lepidoptera*), por ejemplo *Agrotis ypsilon*, *Agrotis segetum*, *Alabama argillacea*, *Anticarsia gemmatalis*, *Argyresthia conjugella*, *Autographa gamma*, *Bupalus piniarius*, *Cacoecia murinana*, *Capua reticulana*, *Cheimatobia brumata*, *Choristoneura fumiferana*, *Choristoneura occidentalis*, *Cirphis unipuncta*, *Cydia pomonella*, *Dendrolimus pini*, *Diaphania nitidalis*, *Diatraea grandiosella*, *Earias insulana*, *Elasmopalpus lignosellus*, *Eupoecilia ambiguella*, *Evetria bouliana*, *Feltia subterranea*, *Galleria mellonella*, *Grapholitha funebrana*, *Grapholitha molesta*, *Heliothis armigera*, *Heliothis virescens*, *Heliothis zea*, *Hellula undalis*, *Hibernia defoliaria*, *Hyphantria cunea*, *Hyponomeuta mallnellus*, *Keiferia lycopersicella*, *Lambdina fiscellaria*, *Laphygma exigua*, *Leucoptera coffeella*, *Leucoptera scitella*, *Lithocolletis blancardella*, *Lobesia botrana*, *Loxostege sticticalis*, *Lymantria dispar*, *Lymantria monacha*, *Lyonetia clerkella*, *Malacosoma neustria*, *Mamestra brassicae*, *Orgyia pseudotsugata*, *Ostrinia nubilalis*, *Panolis flammea*, *Pectinophora gossypiella*, *Peridroma saucia*, *Phalera bucephala*, *Phthorimaea operculella*, *Phyllocnistis citrella*, *Pieris brassicae*, *Plathypena scabra*, *Plutella xylostella*, *Pseudoplusia includens*, *Rhyacionia frustrana*, *Scrobipalpula absoluta*, *Sitotroga cerealella*, *Sparganothis pillariana*, *Spodoptera frugiperda*, *Spodoptera littoralis*, *Spodoptera litura*, *Thaumatopoea ptyocampa*, *Tortrix viridana*, *Trichoplusia ni* y *Zeiraphera canadensis*,
- 20
- 25
- 30 escarabajos (*Coleoptera*), por ejemplo *Agrilus sinuatus*, *Agriotes lineatus*, *Agriotes obscurus*, *Amphimallus solstitialis*, *Anisandrus dispar*, *Anthonomus grandis*, *Anthonomus pomorum*, *Apthona euphoridae*, *Athous haemorrhoidalis*, *Atomaria linearis*, *Blastophagus piniperda*, *Blitophaga undata*, *Bruchus rufimanus*, *Bruchus pisorum*, *Bruchus lentis*, *Byctiscus betulae*, *Cassida nebulosa*, *Ceratomyia trifurcata*, *Cetonia aurata*, *Ceuthor rhynchus assimilis*, *Ceuthorrhynchus napi*, *Chaetocnema tibialis*, *Conoderus vespertinus*, *Crioceris asparagi*, *Ctenicera ssp.*, *Diabrotica longicornis*, *Diabrotica semipunctata*, *Diabrotica 12-punctata*, *Diabrotica speciosa*, *Diabrotica virgifera*, *Epilachna varivestis*, *Epitrix hirtipennis*, *Eutinobothrus brasiliensis*, *Hylobius abietis*, *Hypera brunneipennis*, *Hypera*
- 35

- 5 *postica*, *Ips typographus*, *Lema bilineata*, *Lema melanopus*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Limonius californicus*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Melanotus communis*, *Meligethes aeneus*, *Melolontha hippocastani*, *Melolontha melolontha*, *Oulema oryzae*, *Otiorrhynchus sulcatus*, *Otiorrhynchus ovatus*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllobius pyri*, *Phyllotreta chrysocephala*, *Phyllophaga* sp., *Phyllopertha horticola*, *Phyllotreta nemorum*, *Phyllotreta striolata*, *Popillia japonica*, *Sitona lineatus* y *Sitophilus granaria*;
- 10 moscas, mosquitos (*Díptera*), por ejemplo *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes vexans*, *Anastrepha ludens*, *Anopheles maculipennis*, *Anopheles crucians*, *Anopheles albimanus*, *Anopheles gambiae*, *Anopheles freeborni*, *Anopheles leucosphyrus*, *Anopheles minimus*, *Anopheles quadrimaculatus*, *Calliphora vicina*, *Ceratitis capitata*, *Chrysomya bezziana*, *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macellaria*, *Chrysops discalis*, *Chrysops silacea*, *Chrysops atlanticus*, *Cochliomyia hominivorax*, *Contarinia sorghicola* *Cordylobia anthropophaga*, *Culicoides furens*, *Culex pipiens*, *Culex nigripalpus*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex tarsalis*, *Culiseta inornata*, *Culiseta melanura*, *Dacus curcurbitae*, *Dacus oleae*, *Dasineura brassicae*, *Delia antiqua*, *Delia coarctata*, *Delia platura*, *Delia radicum*, *Dermatobia hominis*, *Fannia canicularis*, *Geomyza Tripunctata*, *Gasterophilus intestinalis*, *Glossina morsitans*, *Glossina palpalis*, *Glossina fuscipes*, *Glossina tachinoides*, *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hippelates* spp., *Hylemyia platura*, *Hypoderma lineata*, *Leptoconops torrens*, *Liriomyza sativae*, *Liriomyza trifolii*, *Lucilia caprina*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*, *Lycoria pectoralis*, *Mansonina titillanus*, *Mayetiola destructor*, *Musca autumnalis*, *Musca domestica*, *Muscina stabulans*, *Oestrus ovis*, *Opomyza florum*, *Oscinella frit*, *Pegomya hysocyami*, *Phorbia antiqua*, *Phorbia brassicae*, *Phorbia coarctata*, *Phlebotomus argentipes*, *Psorophora columbiae*, *Psila rosae*, *Psorophora discolor*, *Prosimulium mixtum*, *Rhagoletis cerasi*, *Rhagoletis pomonella*, *Sarcophaga haemorrhoidalis*, *Sarcophaga* spp., *Simulium vittatum*, *Stomoxys calcitrans*, *Tabanus bovinus*, *Tabanus atratus*, *Tabanus lineola*, y *Tabanus similis*, *Tipula oleracea*, y *Tipula paludosa*;
- 15 tripsos (*Tisanóptera*), por ejemplo *Dichromothrips corbetti*, *Dichromothrips* ssp., *Frankliniella fusca*, *Frankliniella occidentalis*, *Frankliniella tritici*, *Scirtothrips citri*, *Thrips oryzae*, *Thrips palmi* y *Thrips tabaci*,
- 25 termitas (*Isóptera*), por ejemplo *Calotermes flavicollis*, *Leucotermes flavipes*, *Heterotermes aureus*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes virginicus*, *Reticulitermes lucifugus*, *Reticulitermes santonensis*, *Reticulitermes grassei*, *Termes natalensis*, y *Coptotermes formosanus*;
- cucarachas (*Blattaria* - *Blattodea*), por ejemplo *Blattella germanica*, *Blattella asahinae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta japonica*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Periplaneta australasiae*, y *Blatta orientalis*;
- 30 bichos, áfidos, saltamontes, moscas blancas, cohinillas, cigarras, (*Hemiptera*), por ejemplo *Acrosternum hilare*, *Blissus leucopterus*, *Cyrtopeltis notatus*, *Dysdercus cingulatus*, *Dysdercus intermedius*, *Eurygaster integriceps*, *Euschistus impictiventris*, *Leptoglossus phyllopus*, *Lygus lineolaris*, *Lygus pratensis*, *Nezara viridula*, *Piesma quadrata*, *Solubea insularis*, *Thyanta perditor*, *Acyrtosiphon onobrychis*, *Adelges laricis*, *Aphidula nasturtii*, *Aphis fabae*, *Aphis forbesi*, *Aphis pomi*, *Aphis gossypii*, *Aphis grossulariae*, *Aphis schneideri*, *Aphis spiraecola*, *Aphis sambuci*, *Acyrtosiphon pisum*, *Aulacorthum solani*, *Bemisia argentifolii*, *Brachycaudus cardui*, *Brachycaudus helichrysi*, *Brachycaudus persicae*, *Brachycaudus prunicola*, *Brevicoryne brassicae*, *Capitophorus horni*, *Cerosiphia gossypii*, *Chaetosiphon fragaefolii*, *Cryptomyzus ribis*, *Dreyfusia nordmanniana*, *Dreyfusia piceae*, *Dysaphis radicola*, *Dysaulacorthum pseudosolani*, *Dysaphis plantaginea*, *Dysaphis pyri*, *Empoasca fabae*, *Hyalopterus pruni*, *Hyperomyzus lactucae*, *Macrosiphum avenae*, *Macrosiphum euphorbiae*, *Macrosiphum rosae*, *Megoura viciae*, *Melanaphis pyrius*, *Metopolophium dirhodum*, *Myzus persicae*, *Myzus ascalonicus*, *Myzus cerasi*, *Myzus varians*, *Nasonovia ribis-nigri*, *Nilaparvata lugens*, *Pemphigus bursarius*, *Perkinsiella saccharicida*, *Phorodon humuli*, *Psylla mali*, *Psylla piri*, *Rhopalosiphum ascalonicus*, *Rhopalosiphum maidis*, *Rhopalosiphum padi*, *Rhopalosiphum insertum*, *Sappaphis mala*, *Sappaphis mali*, *Schizaphis graminum*, *Schizoneura lanuginosa*, *Sitobion avenae*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Toxoptera aurantiiand*, *Viteus vitifolii*, *Cimex lectularius*, *Cimex hemipterus*, *Reduvius senilis*, *Triatoma* spp., y *Arilus critatus*;
- 35 hormigas, abejas, avispas, moscas de sierra (*Himenóptera*), por ejemplo *Athalia rosae*, *Atta cephalotes*, *Atta capiguara*, *Atta cephalotes*, *Atta laevigata*, *Atta robusta*, *Atta sexdens*, *Atta texana*, *Crematogaster* spp., *Hoplocampa minuta*, *Hoplocampa testudinea*, *Lasius niger*, *Monomorium pharaonis*, *Solenopsis geminata*, *Solenopsis invicta*, *Solenopsis richteri*, *Solenopsis xyloni*, *Pogonomyrmex barbatus*, *Pogonomyrmex californicus*, *Pheidole megacephala*, *Dasymutilla occidentalis*, *Bombus* spp., *Vespula squamosa*, *Paravespula vulgaris*, *Paravespula pennsylvanica*, *Paravespula germanica*, *Dolichovespula maculata*, *Vespa crabro*, *Polistes rubiginosa*, *Camponotus floridanus*, y *Linepithema humile*;
- 40 grillos, saltamontes, langostas (*Ortóptera*), por ejemplo *Acheta domestica*, *Gryllotalpa gryllotalpa*, *Locusta migratoria*, *Melanoplus bivittatus*, *Melanoplus femurrubrum*, *Melanoplus mexicanus*, *Melanoplus sanguinipes*, *Melanoplus spretus*, *Nomadacris septemfasciata*, *Schistocerca americana*, *Schistocerca gregaria*, *Dociostaurus maroccanus*, *Tachycines asynamorus*, *Oedaleus senegalensis*, *Zonozelus variegatus*, *Hieroglyphus daganensis*, *Kraussaria angulifera*, *Calliptamus italicus*, *Chortoicetes terminifera*, y *Locustana pardalina*;
- 55 aracnoides, tales como arácnidos (*Acarina*), por ejemplo de las familias *Argasidae*, *Ixodidae* y *Sarcoptidae*, tales como *Amblyomma americanum*, *Amblyomma variegatum*, *Amblyomma maculatum*, *Argas persicus*, *Boophilus*

- annulatus*, *Boophilus decoloratus*, *Boophilus microplus*, *Dermacentor silvarum*, *Dermacentor andersoni*, *Dermacentor variabilis*, *Hyalomma truncatum*, *Ixodes ricinus*, *Ixodes rubicundus*, *Ixodes scapularis*, *Ixodes holocyclus*, *Ixodes pacificus*, *Ornithodoros moubata*, *Ornithodoros hermsi*, *Ornithodoros turicata*, *Ornithonyssus bacoti*, *Otobius megnini*, *Dermanyssus gallinae*, *Psoroptes ovis*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Rhipicephalus appendiculatus*, *Rhipicephalus evertsi*, *Sarcoptes scabiei*, y Eriophyidae spp. tales como *Aculus schlechtendali*, *Phyllocoptera oleivora* y *Eriophyes sheldoni*; Tarsonemidae spp. tales como *Phytonemus pallidus* y *Polyphagotarsonemus latus*; Tenuipalpidae spp. tales como *Brevipalpus phoenicis*; Tetranychidae spp. tales como *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus kanzawai*, *Tetranychus pacificus*, *Tetranychus telarius* y *Tetranychus urticae*, Panonychus ulmi, Panonychus citri, y *Oligonychus pratensis*; Araneida, por ejemplo *Latrodectus mactans*, y *Loxosceles reclusa*;
- 10 pulgas (*Sifonáptera*), por ejemplo *Ctenocephalides felis*, *Ctenocephalides canis*, *Xenopsylla cheopis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, y *Nosopsyllus fasciatus*,
- pececillo de plata, insecto del fuego (*Thysanura*), por ejemplo *Lepisma saccharina* y *Thermobia domestica*,
- ciempiés (*Chilopoda*), por ejemplo *Scutigera coleoptrata*,
- milípedos (*Diplopoda*), por ejemplo *Narceus spp.*,
- 15 tijeretas (*Dermaptera*), por ejemplo *forficula auricularia*,
- piojos (*Phthiraptera*), por ejemplo *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pthirus pubis*, *Haematopinus eurysternus*, *Haematopinus suis*, *Linognathus vituli*, *Bovicola bovis*, *Menopon gallinae*, *Menacanthus stramineus* y *Solenopotes capillatus*.
- Colémbolos (springtails), por ejemplo *Onychiurus ssp.*
- 20 También son adecuados para controlar Nematodos: nematodos parásitos de plantas tales como nematodos de los nudos de la raíz, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne javanica*, y otras especies de *Meloidogyne*; nematodos formadores de quistes, *Globodera rostochiensis* y otras especies de *Globodera*; *Heterodera avenae*, *Heterodera glycines*, *Heterodera schachtii*, *Heterodera trifolii*, y otras especies de *Heterodera*; nematodos carcomedores de semillas, especies de *Anguina*; nematodos de tallos y foliares, especies de Aphelenchoides; nematodos de aguijón, *Belonolaimus longicaudatus* y otras especies de *Belonolaimus*; nematodos del pino, *Bursaphelenchus xylophilus* y otras especies de *Bursaphelenchus*; nematodos de anillo, especies de *Criconema*, especies de *Criconemella*, especies de *Criconemoides*, especies de *Mesocriconema*; nematodos de tallos y bulbos *Ditylenchus destructor*, *Ditylenchus dipsaci* y otras especies de *Ditylenchus*; nematodos de Punzón, especies de *Dolichodorus*; nematodos de Espiral, *Helicotylenchus multicinctus* y otras especies de *Helicotylenchus*;
- 30 nematodos de vaina y vainoides, especies de *Hemicycliophora* y especies de *Hemicriconemoides*; especies de *Hirshmanniella*; nematodos Lance, especies de *Hoploaimus*; nematodos falsos de los bulbos de raíz, especies de *Nacobbus*; nematodos de aguja, *Longidorus elongatus* y otras especies de *Longidorus*; nematodos de Lesion, *Pratylenchus neglectus*, *Pratylenchus penetrans*, *Pratylenchus curvatus*, *Pratylenchus goodeyi* y otras especies de *Pratylenchus*; nemátodos Cavadores, *Radopholus similis* y otras especies de *Radopholus*; nemátodos Reniformes, *Rotylenchus robustus* y otras especies de *Rotylenchus*; especies de *Scutellonema*; nematodos de raíces regordetas, *Trichodorus primitivus* y otras especies de *Trichodorus*, especies de *Paratrichodorus*; nemátodos acróbatas, *Tylenchorhynchus claytoni*, *Tylenchorhynchus dubius* y otras especies de *Tylenchorhynchus*; nematodos Cítricos, especies de *Tylenchulus*; nematodos de daga, especies de *Xifinema*; y otras especies de nematodos parásitos de las plantas.
- 40 Los compuestos de la fórmula (I-5) y sus sales son también útiles para controlar arácnidos (*Arachnoidea*), tales como ácaros (*Acarina*), por ejemplo de las familias *Argasidae*, *Ixodidae* y *Sarcoptidae*, tales como *Amblyomma americanum*, *Amblyomma variegatum*, *Argas persicus*, *Boophilus annulatus*, *Boophilus decoloratus*, *Boophilus microplus*, *Dermacentor silvarum*, *Hyalomma truncatum*, *Ixodes ricinus*, *Ixodes rubicundus*, *Ornithodoros moubata*, *Otobius megnini*, *Dermanyssus gallinae*, *Psoroptes ovis*, *Rhipicephalus appendiculatus*, *Rhipicephalus evertsi*,
- 45 *Sarcoptes scabiei*, y Eriophyidae spp. tales como *Aculus schlechtendali*, *Phyllocoptera oleivora* y *Eriophyes sheldoni*, Tarsonemidae spp. tales como *Phytonemus pallidus* y *Polyphagotarsonemus latus*, Tenuipalpidae spp. tales como *Brevipalpus phoenicis*; Tetranychidae spp. tales como *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus kanzawai*, *Tetranychus pacificus*, *Tetranychus telarius* y *Tetranychus urticae*, *Panonychus ulmi*, *Panonychus citri*, y *oligonychus pratensis*.
- 50 Los compuestos de la fórmula I son particularmente útiles para controlar insectos, preferiblemente insectos chupadores o perforadores tales como insectos de los géneros Tisanóptera, Díptera y Hemiptera, en particular, las siguientes especies:
- Tisanóptera: *Frankliniella fusca*, *Frankliniella occidentalis*, *Frankliniella tritici*, *Scirtothrips citri*, *Thrips oryzae*, *Thrips palmi* y *Thrips tabaci*,

Díptera, por ejemplo *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes vexans*, *Anastrepha ludens*, *Anopheles maculipennis*, *Anopheles crucians*, *Anopheles albimanus*, *Anopheles gambiae*, *Anopheles freeborni*, *Anopheles leucosphyrus*, *Anopheles minimus*, *Anopheles quadrimaculatus*, *Calliphora vicina*, *Ceratitis capitata*, *Chrysomya bezziana*, *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macellaria*, *Chrysops discalis*, *Chrysops silacea*, *Chrysops atlanticus*,  
 5 *Cochliomyia hominivorax*, *Contarinia sorghicola* *Cordylobia anthropophaga*, *Culicoides furens*, *Culex pipiens*, *Culex nigripalpus*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex tarsalis*, *Culiseta inornata*, *Culiseta melanura*, *Dacus cucurbitae*, *Dacus oleae*, *Dasineura brassicae*, *Delia antique*, *Delia coarctata*, *Delia platura*, *Delia radicum*, *Dermatobia hominis*, *Fannia canicularis*, *Geomyza Tripunctata*, *Gasterophilus intestinalis*, *Glossina morsitans*, *Glossina palpalis*, *Glossina fuscipes*, *Glossina tachinoides*, *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hippelates spp.*, *Hylemyia platura*,  
 10 *Hypoderma lineata*, *Leptoconops torrens*, *Liriomyza sativae*, *Liriomyza trifolii*, *Lucilia caprina*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*, *Lycoria pectoralis*, *Mansonia titillanus*, *Mayetiola destructor*, *Musca autumnalis*, *Musca domestica*, *Muscina stabulans*, *Oestrus ovis*, *Opomyza florum*, *Oscinella frit*, *Pegomya hysocyami*, *Phorbia antiqua*, *Phorbia brassicae*, *Phorbia coarctata*, *Phlebotomus argentipes*, *Psorophora columbiae*, *Psila rosae*, *Psorophora discolor*, *Prosimulium mixtum*, *Rhagoletis cerasi*, *Rhagoletis pomonella*, *Sarcophaga haemorrhoidalis*, *Sarcophaga spp.*, *Simulium vittatum*,  
 15 *Stomoxys calcitrans*, *Tabanus bovinus*, *Tabanus atratus*, *Tabanus lineola*, y *Tabanus similis*, *Tipula oleracea*, y *Tipula paludosa*;

Hemíptera, en particular áfidos: *Acyrtosiphon onobrychis*, *Adelges laricis*, *Aphidula nasturtii*, *Aphis fabae*, *Aphis forbesi*, *Aphis pomi*, *Aphis gossypii*, *Aphis grossulariae*, *Aphis schneideri*, *Aphis spiraeicola*, *Aphis sambuci*,  
 20 *Acyrtosiphon pisum*, *Aulacorthum solani*, *Brachycaudus cardui*, *Brachycaudus helichrysi*, *Brachycaudus persicae*, *Brachycaudus prunicola*, *Brevicoryne brassicae*, *Capitophorus horni*, *Cerosiphia gossypii*, *Chaetosiphon fragaefolii*, *Cryptomyzus ribis*, *Dreyfusia nordmanniana*, *Dreyfusia piceae*, *Dysaphis radicola*, *Dysaulacorthum pseudosolani*, *Dysaphis plantaginea*, *Dysaphis pyri*, *Empoasca fabae*, *Hyalopterus pruni*, *Hyperomyzus lactucae*, *Macrosiphum avenae*, *Macrosiphum euphorbiae*, *Macrosiphon rosae*, *Megoura viciae*, *Melanaphis pyriarius*, *Metopolophium dirhodum*, *Myzodes persicae*, *Myzus ascalonicus*, *Myzus cerasi*, *Myzus varians*, *Nasonovia ribis-nigri*, *Nilaparvata lugens*, *Pemphigus bursarius*, *Perkinsiella saccharicida*, *Phorodon humuli*, *Psylla mali*, *Psylla piri*, *Rhopalomyzus ascalonicus*, *Rhopalosiphum maidis*, *Rhopalosiphum padi*, *Rhopalosiphum insertum*, *Sappaphis mala*, *Sappaphis mali*, *Schizaphis graminum*, *Schizoneura lanuginosa*, *Sitobion avenae*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Toxoptera aurantiand*, y *Viteus vitifolii*.

Compuestos de la fórmula (I-5) son particularmente útiles para controlar insectos de los órdenes Hemiptera y Tisanóptera.

#### Formulaciones

Para uso en un método de acuerdo con la presente invención, los compuestos (I-5) se pueden convertir en las formulaciones habituales, por ejemplo, soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, pulverizados, pastas, gránulos y soluciones directamente asperjables. La forma de uso depende del propósito particular y el método de aplicación.  
 35 Las formulaciones y métodos de aplicación se escogen para asegurar en cada caso una distribución fina y uniforme del compuesto de la fórmula (I-5) de acuerdo con la presente invención.

Las formulaciones se preparan de una manera conocida (véase, por ejemplo para revisión la US 3,060,084, EP-A 707 445 (para concentrados líquidos) Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, Dec. 4, 1967, 147-48, Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, pages 8-57 and et seq. WO 91/13546, US 4,172,714, US 4,144,050, US 3,920,442, US 5,180,587, US 5,232,701, US 5,208,030, GB 2,095,558, US 3,299,566, Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, Hance et al., Weed Control Handbook, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989 and Mollet, H., Grubemann, A., Formulation technology, Wiley VCH Verlag GmbH, Weinheim (Germany), 2001, 2. D. A. Knowles, Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations, Kluwer Academic Publishers, Dordrecht, 1998 (ISBN 0-7514-0443-8), por  
 40 ejemplo al extender el compuesto activo con agentes auxiliares adecuados para la formulación de agroquímicos, tales como solventes y/o vehículos, si se desea emulsificantes, surfactantes y dispersantes, conservantes, agentes antiespumantes, agentes anticongelantes, para la formulación de tratamiento de semillas también opcionalmente colorantes y/o aglomerantes y/o agentes gelificantes.

Solventes/vehículos, que son adecuados, son por ejemplo:

50 - solventes tales como agua, solventes aromáticos (por ejemplo productos Solvesso, xileno y similares), parafinas (por ejemplo fracciones minerales), alcoholes (por ejemplo metanol, butanol, pentanol, alcohol bencílico), cetonas (por ejemplo ciclohexanona, gamma-butirolactona), pirrolidonas (N-metil-pirrolidona (NMP), N-octilpirrolidona NOP), acetatos (diacetato de glicol), lactatos de alquilo, lactonas tales como g-butirolactona, glicoles, dimetilamidas de ácidos grasos, ácidos grasos y ésteres de ácidos grasos, triglicéridos, aceites de origen vegetal o animal y aceites modificados tales como aceites vegetales alquilados. En principio, también se pueden utilizar mezclas de solventes.

- vehículos tales como minerales naturales molidos y minerales sintéticos molidos, tales como sílica gel, ácido silícico finamente dividido, silicatos, talco, caolín, atapulgita, piedra caliza, cal, tiza, bole, loess, arcilla, dolomita, tierra de diatomáceas, sulfato de calcio y sulfato de magnesio, óxido de magnesio, materiales sintéticos del suelo,

fertilizantes, tales como, por ejemplo, sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, ureas y productos de origen vegetal, tales como harina de cereales, harina de corteza de árbol, harina de madera y harina de cáscara de nuez, polvos de celulosa y otros vehículos sólidos.

5 Emulsificantes adecuados son emulsificantes no iónicos y aniónicos (por ejemplo éteres de alcoholes grasos de polioxietileno, alquilsulfonatos y arilsulfonatos).

Ejemplos de dispersantes son licores residuales de sulfito de lignina y metilcelulosa.

10 Surfactantes adecuados son metales alcalinos, sales de metales alcalinotérreos y de amonio de ácido lignosulfónico, ácido naftalenosulfónico, ácido fenolsulfónico, ácido dibutilnaftalenosulfónico, alquilarilsulfonatos, alquil sulfatos, alquilsulfonatos, sulfatos de alcoholes grasos, ácidos grasos y éteres de glicol alcohol grasos sulfatados, adicionalmente condensados de naftaleno sulfonado y derivados de naftaleno con formaldehído, condensados de naftaleno o de ácido naftalenosulfónico con fenol y formaldehído, polioxietilen octilfenil éter, isoctilfenol etoxilado, octilfenol, nonilfenol, alquilfenil poliglicol éteres, tributilfenil poliglicol éter, tristearilfenil poliglicol éter, alquilaril poliéter alcoholes, alcohol y condensados de alcohol graso/óxido de etileno, aceite de castor etoxilado, polioxietilen alquil éteres, polioxipropileno etoxilado, alcohol laurílico poliglicol éter acetal, ésteres de sorbitol.

15 También agentes anticongelantes tales como glicerina, etilen glicol, propilen glicol y bactericidas, como tales se puede agregar a la formulación.

Agentes antiespumantes adecuados son por ejemplo agentes antiespumantes basados en silicio o estearato de magnesio.

Conservantes adecuados son por ejemplo diclorofeno y alcohol bencílico hemiformal

20 Los espesantes adecuados son compuestos que confieren un comportamiento de flujo pseudoplástico a la formulación, esto es, alta viscosidad en reposo y baja viscosidad en la fase agitada. Se pueden citar, en este contexto, por ejemplo, de espesantes comerciales basados en polisacáridos, tales como Xanthan Gum® (Kelzan® de Kelco), Rhodopol®23 (Rhone Poulenc) o Veegum® (de R.T. Vanderbilt), o filosilicatos orgánicos, tales como Attaclay® (de Engelhardt). Agentes antiespumantes adecuados para las dispersiones de acuerdo con la invención son, por ejemplo, emulsiones de silicona (tales como, por ejemplo, Silikon® SRE, Wacker o Rhodorsil® de Rhodia), alcoholes de cadena larga, ácidos grasos, compuestos organofluorados y mezclas de los mismos. Los biocidas pueden ser agregados para estabilizar las composiciones de acuerdo con la invención contra el ataque por microorganismos. Biocidas adecuados son, por ejemplo, con base en isotiazolonas tales como los compuestos comercializados bajo la marcas registradas Proxel® de Avecia (o Arch) o Acticide® RS de Thor Chemie y Kathon® MK de Rohm & Haas. Agentes anticongelantes adecuados son polioles orgánicos, por ejemplo etilen glicol, propilen glicol o glicerol. Estos se emplean usualmente en cantidades de no más de 10% en peso, con base en el peso total de la composición de compuesto activo. Si es apropiado, las composiciones de compuestos activos de acuerdo con la invención pueden comprender 1 a 5% en peso de regulador, con base en la cantidad total de la formulación preparada, para regular el pH, la cantidad y el tipo de regulador usado dependiendo de las propiedades químicas del compuesto activo o los compuestos activos. Ejemplos de reguladores son las sales de metales alcalinos de ácidos inorgánicos u orgánicos débiles, tales como, por ejemplo, ácido fosfórico, ácido bórico, ácido acético, ácido propiónico, ácido cítrico, ácido fumárico, ácido tartárico, ácido oxálico y ácido succínico.

40 Sustancias que son adecuadas para la preparación de soluciones, emulsiones, pastas o dispersiones oleosas directamente asperjables son fracciones de aceite mineral de punto de ebullición medio a alto, tales como queroseno o aceite diesel, adicionalmente aceites de alquitrán de carbón y aceites de origen vegetal o animal, hidrocarburos alifáticos, cíclicos y aromáticos, por ejemplo tolueno, xileno, parafina, tetrahidronaftaleno, naftalenos alquilados o sus derivados, metanol, etanol, propanol, butanol, ciclohexanol, ciclohexanona, isoforona, solventes polares fuertes, por ejemplo dimetil sulfóxido, N-metilpirrolidona y agua.

45 Los pulverizados, materiales para aspersión y polvos pueden prepararse mezclando o triturando concomitantemente las sustancias activas con un vehículo sólido.

50 Los gránulos, por ejemplo los gránulos recubiertos, gránulos impregnados y gránulos homogéneos, pueden prepararse enlazando los ingredientes activos a vehículos sólidos. Ejemplos de vehículos sólidos son tierras minerales tales como geles de sílica, silicatos, talco, caolín, atarilla, caliza, cal, tiza, bolo, loess, arcilla, dolomita, tierra de diatomáceas, sulfato de calcio, sulfato de magnesio, óxido de magnesio, materiales sintéticos triturados, fertilizantes, tales como, por ejemplo, sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, ureas y productos de origen vegetal tales como tortas de cereales, tortas de corteza de árbol, tortas de madera y tortas de cubierta de nueces, polvos de celulosa y otros vehículos sólidos.

55 En general, las formulaciones comprenden de 0.01 a 95% en peso, preferiblemente de 0.1 a 90% en peso, de los ingredientes activos. Los ingredientes activos se emplean con una pureza del 90% a 100%, preferiblemente de 95% a 100% (de acuerdo con un espectro de RMN).

## ES 2 546 417 T3

Para propósitos de tratamiento de semillas, las formulaciones respectivas pueden ser diluidas de 2 a 10 veces llevando a concentraciones en las preparaciones listas para el uso de 0.01 a 60% en peso de compuesto activo por peso, preferiblemente 0.1 a 40% en peso.

- 5 El compuesto de la fórmula (I-5) puede ser usado como tal, en la forma de sus formulaciones o las formas de uso preparadas a partir de las mismas, por ejemplo en la forma de soluciones, polvos, suspensiones o dispersiones, emulsiones, dispersiones en aceite, pastas, productos pulverizables, materiales para dispersión o gránulos, directamente asperjables, por medio de aspersión, atomización, pulverización, dispersión o vertimiento. Las formas de uso dependen completamente de los propósitos buscados, están previstas para asegurar en cada caso la distribución más fina posible de los compuestos activos de acuerdo con la invención.
- 10 Los siguientes son ejemplos de formulaciones:
1. Productos para dilución con agua. Para propósitos de tratamiento de semilla, tales productos se pueden aplicar a la semilla, diluidos o no diluidos.
- A) Concentrados solubles en agua (SL, LS)
- 15 Se disuelven 10 partes en peso del compuesto activo en 90 partes en peso de agua o un solvente soluble en agua. Como alternativa, se agregan humectantes u otros auxiliares. El compuesto activo se disuelve por dilución con agua, mediante lo cual se obtiene una formulación al 10% (p/p) de compuesto activo.
- B) Concentrados dispersables (DC)
- 20 Se disuelven 20 partes en peso del compuesto activo en 70 partes en peso de ciclohexanona con adición de 10 partes en peso de un dispersante, por ejemplo polivinilpirrolidona. La dilución con agua da una dispersión, mediante la cual se obtienen una formulación con 20% (p/p) de compuestos activos.
- C) Concentrados emulsificables (CE)
- 25 Se disuelven 15 partes en peso de los compuestos activos en 7 partes en peso de xileno con adición de dodecilmecanosulfonato de calcio y aceite de castor etoxilado (en cada caso 5 partes en peso). La dilución con agua produce una emulsión, mediante la cual se obtiene una formulación con 15% (p/p) de compuestos activos.
- D) Emulsiones (EW, EO, ES)
- 30 Se disuelven 25 partes en peso del compuesto activo en 35 partes en peso de xileno con adición de dodecilmecanosulfonato de calcio y aceite de castor etoxilado (en cada caso 5 partes en peso). Esta mezcla se introduce en 30 partes en peso de agua por medio de una máquina emulsificadora (por ejemplo Ultraturax) y se convierte en una emulsión homogénea. La dilución con agua da una emulsión, mediante la cual se obtiene una formulación con 25% (p/p) de compuesto activo.
- E) Suspensiones (SC, OD, FS)
- 35 En un molino de bolas con agitación, se trituran 20 partes en peso del compuesto activo con adición de 10 partes en peso de dispersantes, humectantes y 70 partes en peso de agua o de un solvente orgánico para dar una suspensión fina de compuesto activo. La dilución con agua da una suspensión estable del compuesto activo, con la cual se obtiene una formulación con 20% (p/p) de compuesto activo.
- F) Gránulos dispersables en agua y gránulos solubles en agua (WG, SG)
- 40 Se trituran finamente 50 partes en peso del compuesto activo con la adición de 50 partes en peso de dispersantes y humectantes y se fabrican gránulos dispersables en agua o gránulos solubles en agua por medio de dispositivos técnicos (por ejemplo, extrusión, torre de aspersión, lecho fluidizado). La dilución con agua da una dispersión o solución estable del compuesto activo, mediante la cual se obtiene una formulación con 50% (p/p), del compuesto activo.
- G) Polvos dispersables en agua y polvos solubles en agua (WP, SP, SS, WS)
- 45 Se trituran 75 partes en peso del compuesto activo en un molino rotor-estator con la adición de 25 partes en peso de dispersantes, humectantes y sílica gel. La dilución con agua da una dispersión o solución estable del compuesto activo, con la cual se obtiene una formulación del 75% (p/p) del compuesto activo.
- H) Formulación en gel (GF)

En un molino de bolas con agitación, se trituran 20 partes en peso del compuesto activo con la adición de 10 partes en peso de dispersantes, 1 parte en peso de un agente gelificante, humectantes y 70 partes en peso de agua o de un solvente orgánico para dar una suspensión fina del compuesto activo. La dilución con agua da una suspensión estable del compuesto activo, con la cual se obtiene una formulación con 20% (p/p), del compuesto activo.

- 5 2. Productos para aplicar no diluidos para aplicaciones foliares. Para propósitos de tratamiento de semillas, tales productos pueden aplicarse a la semilla diluidos o no diluidos.

I) Polvos pulverizables (PS, DS)

5 partes en peso del compuesto activo se trituran finamente y se mezclan de manera íntima con 95 partes en peso de caolín finamente dividido. Esto da un producto pulverizable que tiene 5% (p/p) del compuesto activo.

- 10 J) Gránulos (GR, FG, GG, MG)

Se trituran finamente 0.5 partes en peso del compuesto activo y se asocian con 95.5 partes en peso de vehículos, mediante lo cual se obtiene una formulación con 0.5% (p/p) de compuesto activo. Los métodos habituales son extrusión, aspersión-secado o lecho fluidizado. Esto da gránulos que se pueden aplicar sin dilución para uso foliar.

K) Soluciones ULV (UL)

- 15 10 partes en peso del compuesto activo se disuelven en 90 partes en peso de un solvente orgánico, por ejemplo, xileno. Esto da un producto que tiene 10% (p/p) de compuesto activo, el cual se aplica sin dilución para uso foliar.

Las formas de uso acuosas pueden prepararse a partir de concentrados en emulsión, pastas o polvos humectables (polvos asperjables, dispersiones en aceite) agregando agua. Para preparar emulsiones, pastas o dispersiones en aceite, las sustancias, como tales o disueltas en un aceite o solvente, pueden homogeneizarse en agua por medio de un humectante, aglomerante, dispersante o emulsificante. Alternativamente, es posible preparar concentrados compuestos de sustancias activas, humectantes, aglomerantes, dispersante o emulsificantes y, si es apropiado, un solvente o un aceite, y tales concentrados son adecuados para dilución con agua.

- 20 Las concentraciones de los ingredientes activos en los productos listos para el uso pueden variar dentro de rangos relativamente amplios. En general, van de 0.0001 a 10%, preferiblemente de 0.01 a 1%.

- 25 Los ingredientes activos también pueden ser utilizados con éxito en el proceso de volumen ultra bajo (ULV), siendo posible aplicar formulaciones que comprenden más del 95% en peso de ingrediente activo, o incluso aplicar el ingrediente activo sin aditivos.

- 30 En el método de esta invención, los compuestos I se pueden aplicar con otros ingredientes activos, por ejemplo, con otros pesticidas, insecticidas, herbicidas, fertilizantes tales como nitrato de amonio, urea, potasa, y superfosfato, fitotóxicos y reguladores del crecimiento de las plantas, aseguradores y nematocidas. Estos ingredientes adicionales se pueden utilizar secuencialmente o en combinación con las composiciones antes descritas, si es apropiado también agregados sólo inmediatamente antes del uso (mezcla en tanque). Por ejemplo, las plantas pueden ser asperjadas con una composición de esta invención bien sea antes o después de ser tratadas con otros ingredientes activos.

- 35 La siguiente lista M de plaguicidas junto con los cuales se pueden utilizar los compuestos de acuerdo con la invención y con los cuales se podría producir efectos sinérgicos potenciales, pretende ilustrar las posibles combinaciones, pero no impone ninguna limitación:

- 40 M.1. Compuestos organo(tio)fosfato: acefato, azametifos, azinfos-etilo, azinfos-metilo, cloretoxifos, clorfenvinfos, clormefos, clorpirifos, clorpirifos-metilo, cumafós, cianofós, demetón-S-metilo, diazinon, diclorvos/DDVP, dicrotofos, dimetoato, dimetilvinfos, disulfoton, EPN, etión, etoprofos, famphur, fenamifos, fenitrotión, fentiión, flupirazofos, fostiazato, heptenofos, isoxatiión, malatiión, mecarbam, metamidofos, metidatiión, mevinfos, monocrotofos, naled, ometoato, oxidemetón-metilo, paration, paration-metilo, fentoato, forato, fosalona, fosmet, fosfamidón, foxim, pirimifos-metilo, profenofos, propetamfos, protiofos, piraclofos, piridafentiión, quinalfos, sulfotep, tebupirimfos, temefos, terbufos, tetraclorvinfos, tiometón, triazofos, triclórforon, vamidotión;

- 45 M.2. Compuestos carbamato: aldicarb, alanicarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxicarboxim, carbaril, carbofuran, carbosulfan, etiofenarb, fenobucarb, formetanato, furatiocarb, isoprocarb, metiocarb, metomilo, metolcarb, oxamil, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, trimetacarb, XMC, xililcarb, triazamato;

- 50 M.3. Compuestos piretroides: acrinatrina, aletrina, d-cis-trans aletrina, d-trans aletrina, bifentrina, bioaletrina, bioaletrina S-ciclopentenilo, bioresmetrin, cicloprotrina, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, lambda-cihalotrina, gamma-cihalotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, beta-cipermetrina, theta-cipermetrina, zeta-cipermetrina, cifenotrina, deltametrina, empentrina, esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flumetrina,

tau-fluvalinato, halfenprox, imiprotrina, metoflutrina, permetrina, fenotrina, praletrina, proflutrina, piretrina (pyrethrum), resmetrina, silafluofeno, teflutrina, tetrametrina, tralometrina, transflutrina;

M.4. Imitadores de la hormona juvenil: hidropreno, kinopreno, metopreno, fenoxicarb, piriproxifeno;

5 M.5. Compuestos agonistas/antagonistas del receptor nicotínico: acetamiprid, bensultap, clorhidrato de cartap, clotianidina, dinotefurano, imidacloprid, tiametoxam, nitenpiram, nicotina, spinosad (agonista alostérico), spinetoram (agonista alostérico), tiacloprid, tiociclam, tiosultap-sodio y AKD1022.

M.6. Compuestos antagonistas del canal de cloruro cerrado de GABA: clordano, endosulfán, gamma-HCH (lindano); etiprol, fipronil, pirafluprol, piriprol

M.7. Activadores de los canales de cloruro: abamectina, benzoato de emamectina, milbemectina, lepimectina;

10 M.8. Compuestos MET II: fenazaquin, fenpiroximato, plrimidifen, piridaben, tebufenpirad, tolfenpirad, flufenerim, rotenona;

M.9. Compuestos METI II y III: acequinocilo, fluaciprim, hidrametilnon;

M.10. Desacopladores de la fosforilación oxidativa: clorfenapir, DNOC;

15 M.11. Inhibidores de la fosforilación oxidativa: azociotolin, cihexatina, diafentiurón, óxido de fenbutatin, propargita, tetradifón;

M.12. Perturbadores de la muda: ciromazina, chromafenozide, halofenozide, metoxi-fenozide, tebufenozide;

M.13. Sinérgicos: butóxido de piperonilo, tribufos;

M.14. Compuestos bloqueadores del canal de sodio: indoxacarb, metaflumizone;

M.15. Fumigantes: bromuro de metilo, sulfuril fluoruro de cloropricrina;

20 M.16. Bloqueadores de alimentación selectiva: crilotie, pimetrozina, flonicamid;

M.17. Inhibidores del crecimiento de ácaros: clofentezine, hexitiazox, etoxazol;

M.18. Inhibidores de la síntesis de quitina: buprofezina, bistrifluron, clorfluazuron, diflubenzuron, flucicloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, teflubenzuron, triflumuron;

M.19. Inhibidores de la biosíntesis de lípidos: espirodiclofeno, espiromesifeno, espirotetramat;

25 M.20. Agonistas octapaminérgicos: amitraz;

M.21. Moduladores del receptor de rianodina: flubendiamida y el compuesto ftalamida (R) -, (S)- 3- Clor-N1-{2-metil-4-[1,2,2,2 - tetrafluor-1-(trifluorometil)etil]fenil}-N2-(1-metil-2-metilsulfoniletil)ftalamida (M21.1)

30 M.22. Otros compuestos de isoxazolina: 4-[5-(3,5-Dicloro-fenil)-5-trifluorometil-4,5-dihidro-isoxazol-3-il]-2-metil- N-piridin-2-ilmetil-benzamida (M22.1), 4-[5-(3,5-Dicloro-fenil)-5-trifluorometil-4,5-dihidro-isoxazol-3- il]-2-metil-N-(2,2,2-trifluoro-etil)-benzamida (M22.2), 4-[5-(3,5-Dicloro-fenil)-5-trifluorometil-4,5-dihidroisoxazol- 3-il]-2-metil-N-[(2,2,2-trifluoro-etilcarbamoil)-metil]-benzamida (M22.3), [(2,2,2-trifluoro-etilcarbamoil)-metil]-amida del ácido 4-[5-(3,5-Dicloro-fenil)- 5-trifluorometil-4,5-dihidro-isoxazol-3-il]-naftaleno-1-carboxílico (M22.4)4-[5-(3,5-Diclorofenil)-5-trifluorometil-4,5-dihidro-isoxazol-3-il]-N-[(metoxiimino)metil]- 2-metilbenzamida (M22.5), 4-[5-(3-Cloro-5-trifluorometil-fenil)-5-trifluorometil-4,5-dihidro-isoxazol- 3-il]-2-metil-N-[(2,2,2-trifluoro-etilcarbamoil)-metil]-benzamida (M22.6),  
35 [(2,2,2-trifluoro-etilcarbamoil)- metil]-amida del ácido 4-[5-(3-Cloro-5-trifluorometil fenil)-5-trifluorometil-4,5-dihidro-isoxazol-3-il]-naftaleno-1-carboxílico (M22.7) y 5-[5-(3,5-Dicloro-4-fluoro-fenil)-5-trifluorometil-4,5-dihidro-isoxazol-3-il]- 2-[1,2,4]triazol-1-yl-benzonitrilo (M22.8);

40 M.23. Compuestos de antranilamida: clorantraniliprol, ciantraniliprol, [4-ciano-2-(1-ciclopropil-etilcarbamoil)-6-metil-fenil]-amida del ácido 5-Bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol- 3-carboxílico (M23.1), [2-cloro-4-ciano-6-(1-ciclopropil-etilcarbamoil)-fenil]- amida del ácido 5-Bromo-2-(3- cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico (M23.2), [2-bromo-4-ciano-6-(1-ciclopropil- etilcarbamoil)-fenil]-amida del ácido 5-Bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico (M23.3), [2- bromo-4-cloro-6-(1-ciclopropil-etilcarbamoil)-fenil]-amida del ácido 5-Bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico (M23.4), [2,4-dicloro-6-(1-ciclopropil-etilcarbamoil)-fenil]-amida del ácido 5-Bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico (M23.5), [4-cloro-2-(1-ciclopropil-etilcarbamoil)-6-metil-fenil]- amida del ácido  
45 5-Bromo-2-(3- cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico (M23.6), metil éster del ácido N'-(2-{[5-Bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carbonil]-amino}-5-cloro-3-metilbenzoil)- hidrazinacarboxílico (M23.7), metil éster del ácido

- N'-(2-[[5-Bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carbonil]-amino]-5-cloro-3-metil-benzoil)-N'-metil-hidrazinacarboxílico (M23.8), metil éster del ácido N'-(2-[[5-Bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carbonil]-amino]-5-cloro-3-metil-benzoil)-N,N'-dimetil-hidrazinacarboxílico (M23.9), metil éster del ácido N'-(3,5-Dibromo-2-[[5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carbonil]-amino]-benzoil)-hidrazinacarboxílico (M23.10), metil éster del ácido N'-(3,5-Dibromo-2-[[5-bromo-2-(3-cloropiridin-2-il)-2H-pirazol-3-carbonil]-amino]-benzoil)-N'-metil-hidrazinacarboxílico (M23.11) y metil éster del ácido N'-(3,5-Dibromo-2-[[5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carbonil]-amino]-benzoil)-N,N'-dimetil-hidrazinacarboxílico (M23.12);
- M.24. Compuestos de malononitrilo: 2-(2,2,3,3,4,4,5,5-octafluoropentil)-2-(3,3,3-trifluoro-propil)malononitrilo (CF<sub>2</sub>HCF<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-C(CN)<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CF<sub>3</sub>) (M24.1) y 2-(2,2,3,3,4,4,5,5-octafluoropentil)-2-(3,3,4,4,4-pentafluorobutil)-malonodinitrilo (CF<sub>2</sub>H-CF<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-C(CN)<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CF<sub>2</sub>-CF<sub>3</sub>) (M24.2);
- M.25. Perturbadores microbianos: *Bacillus thuringiensis* subsp. *Israelensi*, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus thuringiensis* subsp. *Aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subsp. *Kurstaki*, *Bacillus thuringiensis* subsp. *Tenebrionis*;
- M.26. Compuestos de aminofuranona:
- 4-[[6-Bromopirid-3-il]metil](2-fluoroetil)amino}furan-2(5H)-ona (M26.1),
- 4-[[6-Fluoropirid-3-il]metil](2,2-difluoroetil)amino}furan-2(5H)-ona (M26.2),
- 4-[[2-Cloro-1,3-tiazolo-5-il]metil](2-fluoroetil)amino}furan-2(5H)-ona (M26.3),
- 4-[[6-Cloropirid-3-il]metil](2-fluoroetil)amino}furan-2(5H)-ona (M26.4),
- 4-[[6-Cloropirid-3-il]metil](2,2-difluoroetil)amino}furan-2(5H)-ona (M26.5),
- 4-[[6-Cloro-5-fluoropirid-3-il]metil](metil)amino}furan-2(5H)-ona (M26.6),
- 4-[[5,6-Dicloropirid-3-il]metil](2-fluoroetil)amino}furan-2(5H)-ona (M26.7),
- 4-[[6-Cloro-5-fluoropirid-3-il]metil](ciclopropil)amino}furan-2(5H)-ona (M26.8),
- 4-[[6-Cloropirid-3-il]metil](ciclopropil)amino}furan-2(5H)-ona (M26.9) y
- 4-[[6-Cloropirid-3-il]metil](metil)amino}furan-2(5H)-ona (M26.10);
- M.27. Compuestos diversos: fosfuro de aluminio, amidoflumet, benclotiaz, benzoximato, bifenzazato, bórax, bromopropilato, cianuro, cienopirafen, ciflumetofeno, quinometionato, dicofol, fluoroacetato, fosfina, piridilil, pirifluquinazon, azufre, compuestos orgánicos de azufre, tártaro emético, sulfoaxlor, N-R'2,2-dihalo-1-R" ciclopropanocarboxamida-2-(2,6-dicloro- $\alpha,\alpha,\alpha$ -trifluoro-p-toluil)hidrazona o N-R'-2,2-di(R"")propionamida-2-(2,6-dicloro- $\alpha,\alpha,\alpha$ -trifluoro-p-toluil)-hidrazona, en donde R' es metilo o etilo, halo es cloro o bromo, R" es hidrógeno o metilo y R' "es metilo o etilo, 4-but-2-iniloxi-6-(3,5-dimetil-piperidin-1-il)-2-fluoro-pirimidina (M27.1), ácido ciclopropanoacético, 1,1'-[(3S,4R,4aR,6S,6aS,12R,12aS,12bS)-4-[[2-ciclopropilacetil]oxi]metil]-1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-decahidro-12-hidroxi-4,6a,12b-trimetil-11-oxo-9-(3-piridinil)-2H,11H-nafto[2,1-b]pirano[3,4-e]piran-3,6-dil] éster (M27.2) y
- 8-(2-Ciclopropilmetoxi-4-trifluorometil-fenoxi)-3-(6-trifluorometil-piridazin-3-il)-3-aza-biciclo[3.2.1]octano (M27.3).
- Los compuestos comercialmente disponibles del grupo M se pueden encontrar en *The Pesticide Manual*, 13ª edición, British Crop Protection Council (2003), entre otras publicaciones.
- El paraoxón y su preparación han sido descritos en *Farm Chemicals Handbook*, Volumen 88, Meister Publishing Company, 2001. Flupirazofos y su preparación se han descrito en *Pesticide Science* 54, 1988, p.237-243 y en US 4822779. AKD 1022 y su preparación se ha descrito en US 6300348. Las antranilamidas M23.1 a M23.6 se han descrito en WO 2008/72743 y WO 200872783, aquellos M23.7 a M23.12 en WO2007/043677. La ftalamida M 21.1 se conoce de WO 2007/101540.- El compuesto de alquililéter M27.1 es descrito por ejemplo en JP 2006131529. Compuestos de azufre orgánicos se han descrito en WO 2007060839. Los compuestos de isoxazolina M 22.1y22.8 se han descrito en por ejemplo WO2005/085216, WO 2007/079162, WO 2007/026965, WO 2009/126668 y WO2009/051956. Los compuestos de aminofuranona M 26.1 a M 26.10 se han descrito por ejemplo en WO 2007/115644. El derivado de piriropeno M 27.2 se ha descrito en WO 2008/66153 y WO 2008/108491. El compuesto de piridazina M 27.3 se ha descrito en JP 2008/115155. Los compuestos de malononitrilo como aquellos (M24.1) y (M24.2) se han descrito en WO 02/089579, WO 02/090320, WO 02/090321, WO 04/006677, WO 05/068423, WO 05/068432 y WO 05/063694.

Asociados de mezclas fungicidas son los seleccionados del grupo que consiste de acilalaninas tales como benalaxil, metalaxil, ofurace, oxadixil,

derivados de aminas tales como aldimorf, dodina, dodemorf, fenpropimorf, fenpropidina, guazatina, iminoctadina, espiroxamina, tridemorf,

5 anilino pirimidinas tales como pirimetanilo, mepanipirim o cirodinil,

antibióticos tales como cycloheximid, griseofulvina, kasugamicina, natamicina, polioxina o estreptomicina,

10 azoles tales como bitertanol, bromoconazole, ciproconazole, difenoconazole, diniconazole, epoxiconazole, fenbuconazole, fluquiconazole, flusilazole, hexaconazole, imazalil, metconazole, miclobutanil, penconazole, propiconazole, procloraz, protioconazole, tebuconazole, triadimefon, triadimenol, triflumizol, triticonazol, flutriafol, dicarboximidas tales como iprodion, myclozolin, procimidon, vinclozolina, ditiocarbamatos tales como ferbam, nabam, maneb, mancozeb, metam, metiram, propineb, policarbamato, tiram, ziram, zineb,

15 compuestos heterocíclicos tales como anilazina, benomilo, boscalid, carbendazim, carboxina, oxicarboxin, ciazofamida, dazomet, ditanon, famoxadon, fenamidon, fenarimol, fuberidazol, flutolanil, furametpir, isoprothiolane, mepronil, nuarimol, probenazol, proquinazid, pirifenox, piroquilon, quinoxifen, siltiofam, tiabendazol, thifluzamid, tiofanate-metilo, tiadinilo, triciclazole, triforine,

fungicidas de cobre tales como mezcla de Bordeaux, acetato de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato básico de cobre,

derivados de nitrofenilo tales como, binapacril, dinocap, dinobuton, nitroftalisopropilo, fenilpirroles tales como fencipclonil o fludioxonil,

azufre,

20 otros fungicidas tales como acibenzolar-S-metilo, bentiavalicarb, carpropamid, clorotalonil, ciflufenamida, cimoxanil, diclomezin, diclocimet, dietofencarb, edifenfos, etaboxam, fenhexamida, fentin-acetato, fenoxanilo, ferimzone, fluazinam, fosetil, fosetil-aluminio, iprovalicarb, hexaclorobenceno, metrafenon, pencicuron, propamocarb, ftalide, toloclofos-metilo, quintozene, zoxamid,

25 estrobilurinas tales como azoxistrobina, dimoxistrobin, fluoxastrobin, kresoxim-metilo, metominostrobin, orisastrobin, picoxistrobin o trifloxistrobin,

derivados del ácido sulfénico tales como captafol, captan, diclofluanid, folpet, toluilfluanid, cinemamidas y análogos tales como dimetomorf, flumetover o flumorf.

#### Aplicaciones

30 La plaga animal, esto es, los insectos, arácnidos y nematodos, la planta, el suelo o el agua en el que la planta está creciendo puede ponerse en contacto con los presentes compuestos de fórmula (I-5) o las composiciones que los contienen mediante cualquier método de aplicación conocido en la técnica. Como tal, "poner en contacto" incluye tanto contacto directo (aplicar los compuestos/composiciones sobre la plaga animal o planta - típicamente al follaje, tallo o raíces de la planta) y contacto indirecto (aplicar los compuestos/composiciones al locus de la plaga animal o planta).

35 Los compuestos de fórmula (I-5) o las composiciones pesticidas que los comprenden se pueden utilizar para proteger las plantas en crecimiento y los cultivos del ataque o infestación de plagas animales, especialmente insectos, ácaros o arácnidos poniendo en contacto la planta/cultivo con una cantidad efectiva como pesticida de compuestos de fórmula (I-5). El término "cultivo" se refiere tanto a los cultivos en crecimiento como a los recolectados.

40 Los compuestos de la presente invención y las composiciones que los comprenden son particularmente importantes en el control de una multitud de insectos en diversas plantas cultivadas, tales como cereales, cultivos de raíz, cultivos oleaginosos, vegetales, especias, plantas ornamentales, por ejemplo semillas de trigo durum y de otros trigos, cebada, avena, centeno, maíz (maíz de mazorca y maíz de azúcar/maíz dulce y de campo), soja, cultivos oleaginosos, crucíferas, algodón, girasoles, plátanos, arroz, colza oleaginosa, colza de rábano, remolacha de azúcar, remolacha de forraje, berenjenas, patatas, césped, pastos, turbas, pastos de forraje, tomates, puerros, calabacines/calabazas, repollo, lechuga iceberg, pimienta, cocombros, melones, especies de Brassica, melones, judías, guisantes, ajo, cebollas, zanahorias, plantas tuberosas tales como patatas, azúcar de caña, tabaco, uvas, petunias, geranio/pelargonios, margaritas y claveles

50 Los compuestos de la presente invención se emplean como tales o en forma de composiciones para el tratamiento de los insectos o las plantas, materiales de propagación de plantas, tales como semillas, suelos, superficies,

materiales o habitaciones que van a ser protegidas de ataque insecticida con una cantidad efectiva como insecticida de los compuestos activos. La aplicación puede llevarse a cabo tanto antes como después de la infección por los insectos, de las plantas, materiales de propagación de plantas, tales como semillas, suelos, superficies, materiales o habitaciones.

5 La presente invención también incluye un método para combatir plagas animales, que comprende poner en contacto las plagas animales, su hábitat, terrenos de cría, fuente de alimentación, plantas cultivadas, semillas, suelos, área, material o ambiente en el cual las plagas animales están creciendo o pueden crecer, o los materiales, plantas, semillas, suelos, superficies o espacios para ser protegidos de ataque de animales o infestación con una cantidad efectiva como pesticida de una mezcla de al menos un compuesto activo (I-5).

10 Además, las plagas animales pueden ser controladas poniendo en contacto la plaga objetivo, su fuente de alimentación, hábitat, terreno de cría o su locus con una cantidad efectiva como pesticida de compuestos de fórmula I. Como tal, la aplicación puede llevarse a cabo antes o después de la infección por la plaga del locus, cultivos en crecimiento o cultivos recolectados.

15 Los compuestos de la invención también pueden aplicarse preventivamente a lugares en los que se espera ocurrencia de las plagas.

Los compuestos de fórmula (I-5) también se pueden utilizar para proteger plantas en crecimiento del ataque o infestación por plagas poniendo en contacto la planta con una cantidad efectiva como pesticida de compuestos de fórmula (I-5). Como tal, "poner en contacto" incluye tanto contacto directo (aplicar los compuestos/composiciones directamente sobre la plaga y/o planta - típicamente al follaje, tallo o raíces de la planta) y contacto indirecto (aplicación de los compuestos/composiciones al locus de la plaga y/o planta).

20 "Locus" significa un hábitat, terrenos de cría, planta, semilla, suelo, área, materia o ambiente en el que una plaga o parásito está creciendo o puede crecer.

25 El término "material de propagación vegetal" se ha de entender para denotar todas las partes generativas de la planta tales como semillas y material de la planta vegetativa tales como esquejes y tubérculos (por ejemplo patatas), que pueden utilizarse para la multiplicación de la planta. Esto incluye semillas, raíces, frutos, tubérculos, bulbos, rizomas, tallos, brotes y otras partes de plantas. También se pueden incluir los plantones y plantas jóvenes, que son para ser trasplantados después de la germinación o después de emerger de la tierra. Estos materiales de propagación vegetal pueden ser tratados profilácticamente con un compuesto de protección de las plantas, bien sea en o antes de la siembra o trasplante.

30 El término "plantas cultivadas" debe ser entendido que incluye las plantas que han sido modificados mediante el cruzamiento, mutagénesis o ingeniería genética. Las plantas modificadas genéticamente son plantas, cuyo material genético ha sido modificado mediante el uso de técnicas de ADN recombinante que bajo circunstancias naturales no se pueden obtener fácilmente por cruzamiento, mutaciones o recombinación natural. Típicamente, uno o más genes se han integrado en el material genético de una planta modificada genéticamente con el fin de mejorar ciertas propiedades de la planta. Tales modificaciones genéticas también incluyen, pero no se limitan a modificación post-transicional específica de proteínas (oligo o polipéptidos) poli por ejemplo, mediante glicosilación o adiciones de polímeros tales como unidades estructurales preniladas, acetiladas o farnesiladas o unidades estructurales de PEG (por ejemplo, como se describe en Biotechnol Prog. 2001 Jul-Aug;17(4):720-8., Protein Eng Des Sel. 2004 Jan;17(1):57-66, Nat Protoc. 2007;2(5):1225-35., Curr Opin Chem Biol. 2006 Oct;10(5):487-91. Epub 2006 Aug 28., Biomaterials. 2001 Mar;22(5):405-17, Bioconj Chem. 2005 Jan-Feb;16(1):113-21).

35 El término "plantas cultivadas" ha de entenderse que incluye también plantas que se han hecho tolerantes a las aplicaciones de clases específicas de herbicidas, tales como inhibidores de hidroxifenilpiruvato dioxigenasa (HPPD); inhibidores de acetolactato sintasa (ALS), tales como sulfonil ureas (véase, por ejemplo U6,222,100, WO 01/82685, WO 00/26390, WO 97/41218, WO 98/02526, WO 98/02527, WO 04/106529, WO 05/20673, WO 03/14357, WO 03/13225, WO 03/14356, WO 04/16073) o imidazolinonas (véase, por ejemplo US 6,222,100, WO 01/82685, WO 00/26390, WO 97/41218, WO 98/02526, WO 98/02527, WO 04/106529, WO 05/20673, WO 03/14357, WO 03/13225, WO 03/14356, WO 04/16073); inhibidores de enolpiruvilshikimato- 3-fosfato sintasa (EPSPS), tales como el glifosato (véase por ejemplo WO 92/00377); inhibidores de la glutamina sintetasa (GS), tales como glufosinato (véase por ejemplo EP-A-0242236, EP-A-242246) u oxinil herbicidas (véase, por ejemplo US 5,559,024) como resultado de métodos convencionales de cruzamiento o de ingeniería genética. Varias plantas cultivadas se han hecho tolerantes a los herbicidas por métodos convencionales de cruzamiento (mutagénesis), por violación ejemplo colza de verano Clearfield® (Canola) siendo tolerante a imidazolinonas, por ejemplo, imazamox. Métodos de ingeniería genética han sido usados para hacer que las plantas cultivadas, como la soja, el algodón, el maíz, la remolacha y colza, sean tolerantes a los herbicidas, como el glifosato y glufosinato, algunos de los cuales están disponibles comercialmente bajo el nombre comercial RoundupReady® (glifosato) y LibertyLink® (glufosinato).

55 El término "plantas cultivadas" ha de entenderse que incluye también plantas que son por el uso de técnicas de ADN recombinante capaz de sintetizar una o más proteínas insecticidas, especialmente aquellas conocidas del género

bacteriano *Bacillus*, particularmente del *Bacillus thuringiensis*, tales como  $\delta$ -endotoxinas, por ejemplo CryIA(b), CryIA(c), CryIF, CryIF(a2), CryIIA(b), CryIIIA, CryIIIB(b1) o Cry9c; proteínas vegetativas insecticidas (VIP), por ejemplo VIP1, VIP2, VIP3 o VIP3A; proteínas insecticidas de bacterias que colonizan nematodos, por ejemplo *Photorhabdus* spp. o *Xenorhabdus* spp.; toxinas producidas por animales, tales como toxinas de escorpión, toxinas de arácnido, toxinas de avispa, u otras neurotoxinas específicas para insectos; toxinas producidas por hongos, tales como toxinas de *Streptomyces*, lectinas vegetales, tales como lectinas de guisantes o cebada; aglutininas; inhibidores de proteinasas, tales como inhibidores de tripsina, inhibidores de serina proteasa, patatina, inhibidores de cistatina o papaína; proteínas que inactivan ribosomas (RIP), tales como ricina, RIP-maíz, abrina, lufina, saporina o briedina; enzimas del metabolismo esteroide, tales como 3-hidroxiesteroide oxidasa, ecdisteroide-IDP-glicosil-transferasa, colesterol oxidasa, inhibidores de ecdisona o de HMG-CoA-reductasa; bloqueadores del canal de iones, tales como bloqueadores de los canales de sodio o calcio; hormona juvenil esterasa; receptores de hormonas diuréticas (receptores de helicoquinina); estilben sintasa, bibencil sintasa, quitinasas o glucanasas. En el contexto de la presente invención estas proteínas o toxinas insecticidas son entendidas expresamente también como pretoxinas, proteínas híbridas, proteínas truncadas o de otra forma modificadas. Las proteínas híbridas se caracterizan por una nueva combinación de dominios de la proteína, (véase, por ejemplo WO 02/015701). Ejemplos adicionales de tales toxinas o plantas modificadas genéticamente capaces de sintetizar tales toxinas se divulgan, por ejemplo, en EP-A 374 753, WO 93/007278, WO 95/34656, EP-A 427 529, EP-A 451 878, WO 03/018810 y WO 03/052073. Los métodos para producir tales plantas modificadas genéticamente son generalmente conocidos por la persona experta en la técnica y se describen, por ejemplo, en las publicaciones mencionadas anteriormente. Estas proteínas insecticidas contenidas en las plantas modificadas genéticamente imparten a las plantas que producen estas proteínas protección contra las plagas perjudiciales de ciertos grupos taxonómicos de artrópodos, en especial a escarabajos (Coleóptera), moscas (Díptera), y mariposas y polillas (Lepidóptera) y de nematodos parásitos de plantas (Nematoda).

El término "plantas cultivadas" ha de entenderse que incluye también plantas que son por el uso de técnicas de ADN recombinante capaces de sintetizar una o más proteínas para incrementar la resistencia o tolerancia de aquellas plantas a patógenos bacterianos, virales o fúngicos. Ejemplos de tales proteínas son las denominadas "proteínas relacionadas con patogénesis" (proteínas PR, véase, por ejemplo EP-A 0 392 225), genes de plantas resistentes a enfermedades (por ejemplo cultivares de patatas, la cual expresa resistencia a genes que actúan contra *Phytophthora infestans* derivado de la patata salvaje mexicana *Solanum bulbocastanum*) o T4-lisozima (por ejemplo, cultivares de patata capaces de sintetizar estas proteínas con incremento de la resistencia contra las bacterias como *Erwinia amylovora*). Los métodos para producir tales plantas modificadas genéticamente son generalmente conocidos por la persona experta en la técnica y se describen, por ejemplo, en las publicaciones mencionadas anteriormente.

El término "plantas cultivadas" ha de entenderse que incluye también plantas que son por el uso de técnicas de ADN recombinantes capaces de sintetizar una o más proteínas para incrementar la productividad (por ejemplo, producción de biomasa, rendimiento de grano, contenido de almidón, contenido de aceite o contenido de proteínas), tolerancia a la sequía, salinidad u otro limitante de crecimiento de factores ambientales o tolerancia a plagas y patógenos fúngicos, bacterianos o virales de esas plantas.

El término "plantas cultivadas" ha de entenderse que incluye también plantas que contienen por el uso de técnicas de ADN recombinante una cantidad modificada de sustancias de contenido o nuevas sustancias de contenido, específicamente para mejorar la nutrición humana o animal, por ejemplo cultivos oleosos que producen ácidos grasos omega-3 de cadena larga promotores de la salud o ácidos grasos omega-9 insaturados (por ejemplo, colza Nexera®).

El término "plantas cultivadas" ha de entenderse que incluye también plantas que contienen por el uso de técnicas de ADN recombinante una cantidad modificada de sustancias de contenido o nuevas sustancias de contenido, específicamente para mejorar la producción de materias primas, por ejemplo, patatas que producen cantidades incrementadas de amilopectina (por ejemplo patata Amflora®).

En general, "cantidad efectiva como pesticida" significa la cantidad de ingrediente activo necesaria para lograr un efecto observable sobre el crecimiento, incluyendo los efectos de necrosis, muerte, retardo, prevención, y remoción, destrucción, o de otra manera disminución de la aparición y actividad del organismo objetivo. La cantidad efectiva como pesticida puede variar para los diversos compuestos/composiciones utilizados en la invención. Una cantidad efectiva como pesticida de las composiciones también variará de acuerdo con las condiciones prevalecientes tales como el efecto plaguicida deseado y la duración, el clima, las especies objetivo, el locus, modo de aplicación, y similares.

En el caso de tratamiento del suelo o para aplicación al sitio de alojamiento de las plagas o nido, la cantidad de ingrediente activo varía desde 0.0001 hasta 500 g por 100 m<sup>2</sup>, preferiblemente desde 0.001 hasta 20 g por 100 m<sup>2</sup>.

Las tasas de aplicación habituales en la protección de materiales son, por ejemplo, desde 0.01 g hasta 1000 g de compuesto activo por m<sup>2</sup> de material tratado, deseablemente desde 0.1 g hasta 50 g por m<sup>2</sup>.

Las composiciones insecticidas para uso en la impregnación de materiales contienen típicamente desde 0.001 hasta 95% en peso, preferiblemente desde 0.1 hasta 45% en peso, y más preferiblemente desde 1 hasta 25% en peso de al menos un repelente y/o insecticida.

5 Para el uso en el tratamiento de plantas de cultivo, la tasa de aplicación de los ingredientes activos de esta invención puede estar en el rango de 0.1 g hasta 4000 g por hectárea, deseablemente desde 25 g hasta 600 g por hectárea, más deseablemente desde 50 g hasta 500 g por hectárea.

Los compuestos de fórmula (I-5) son efectivos tanto a través de contacto (a través del suelo, vidrio, pared, mosquitero, alfombra, partes de plantas o partes de animales), como por ingestión (cebo, o parte de la planta).

10 Los compuestos de la invención también se pueden aplicar contra plagas de insectos que no afectan cultivos, tales como hormigas, termitas, avispas, moscas, mosquitos, grillos, o cucarachas. Para el uso contra dichas plagas que no afectan cultivos, los compuestos de fórmula I se usan preferiblemente en una composición de cebo.

15 El cebo puede ser un líquido, un sólido o una preparación semisólida (por ejemplo un gel). Los cebos sólidos se pueden formar en diversas formas y formas adecuadas para la aplicación respectiva por ejemplo, gránulos, bloques, barras, discos. Los cebos líquidos se pueden cargar en diversos dispositivos para asegurar la aplicación apropiada, por ejemplo, contenedores abiertos, dispositivos de aspersión, fuentes de gotas, o fuentes de evaporación. Los geles pueden basarse en matrices acuosas u oleosas y se pueden formular para necesidades particulares en términos de pegajosidad, retención de humedad o características de envejecimiento.

20 El cebo empleado en la composición es un producto, que es lo suficientemente atractivo para incitar a los insectos tales como hormigas, termitas, avispas, moscas, mosquitos, grillos, etc., o cucarachas para comerlo. El atractivo se puede manipular mediante el uso de estimulantes de la alimentación o feromonas sexuales. Estimulantes de alimentos se eligen, por ejemplo, pero no exclusivamente, de proteínas animales y/o de plantas (harina de carne, de pescado o de sangre, partes de insectos, yema de huevo), de grasas y aceites de origen animal y/o vegetal, o mono-, oligo- o poliorganosacáridos, especialmente de sacarosa, lactosa, fructosa, dextrosa, glucosa, almidón, pectina o incluso melaza o miel. Partes frescas o en descomposición de frutas, cultivos, plantas, animales, insectos o partes  
25 específicas de los mismos también pueden servir como un estimulante de la alimentación. Las feromonas sexuales son conocidas por ser más específicas de insectos. Las feromonas específicas se describen en la literatura y son conocidos por los expertos en la técnica.

Para uso en composiciones de cebo, el contenido típico del ingrediente activo es desde 0.001% en peso hasta 15% en peso, deseablemente desde 0.001% en peso hasta 5% en peso de compuesto activo.

30 Las formulaciones de compuestos de fórmula (I-5) como aerosoles (por ejemplo, en las latas de aspersión), aspersiones en aceite o aspersiones por bombeo son altamente adecuados para el usuario no profesional para el control de plagas como moscas, pulgas, garrapatas, mosquitos o cucarachas. Las recetas en aerosol están compuestas preferiblemente del compuesto activo, solventes tales como alcoholes inferiores (por ejemplo, metanol, etanol, propanol, butanol), cetonas (por ejemplo acetona, metil etil cetona), hidrocarburos e parafina (por ejemplo  
35 querosenos) que tienen rangos de ebullición de aproximadamente 50 a 250 °C, dimetilformamida, N-metilpirrolidona, dimetil sulfóxido, hidrocarburos aromáticos tales como tolueno, xileno, agua, adicionalmente agentes auxiliares tales como emulsionantes tales como monooleato de sorbitol, etoxilato de oleilo que tiene 3-7 moles de óxido de etileno, etoxilato de alcohol graso, aceites de perfume tales como aceites etéreos, ésteres de ácidos grasos medianos con alcoholes inferiores, compuestos carbonílicos aromáticos, si es apropiado, estabilizantes tales como benzoato de sodio, surfactantes anfotéricos, epóxidos inferiores, ortoformiato de trietilo y, si se requiere, propelentes tales como propano, butano, nitrógeno, aire comprimido, dimetil éter, dióxido de carbono, óxido nitroso, o mezclas de estos gases.

Las formulaciones de aspersión en aceite difieren de las recetas en aerosol en que no se utilizan propelentes.

45 Para uso en composiciones de aspersión, el contenido de ingrediente activo es desde 0.001 hasta 80% peso, preferiblemente desde 0.01 hasta 50% en peso y lo más preferiblemente desde 0.01 hasta 15% en peso.

Los compuestos de fórmula (I-5) y sus respectivas composiciones también se pueden utilizar en espirales contra mosquitos y de fumigación, cartuchos de humo, placas vaporizadoras o vaporizadores a largo plazo y también en papeles para polillas, paños para polillas u otros sistemas vaporizadores independientes del calor.

50 Los métodos para controlar enfermedades infecciosas transmitidas por insectos (por ejemplo, malaria, dengue y fiebre amarilla, filariasis linfática y leishmaniasis) con compuestos de fórmula (I-5) y sus respectivas composiciones comprenden también tratar superficies de construcciones y casas, aspersión en aérea e impregnación de cortinas, tiendas, artículos de vestuario, mosquiteros, trampa para mosca tsetsé o similares. Las composiciones insecticidas para aplicación a telas, textiles, tejidos, material no tejido, material para redes o láminas y tarpaulinas comprenden preferiblemente una mezcla que incluye el insecticida, opcionalmente un repelente y al menos un aglomerante.  
55 Repelentes adecuados por ejemplo son N,N-Dietil-meta-toluamida (DEET), N,N-dietilfenilacetamida (DEPA), 1-(3-

- ciclohexan-1-il-carbonil)-2-metilpiperina, ácido (2-hidroximetilciclohexil) acético lactona, 2-etil-1,3-hexandiol, indalon, Metilneodecanamida (MNDA), un piretroide no utilizado para el control de insectos tal como {(+/-)-3-allil-2-metil-4-oxociclopent-2-(+)-enil-(+)-trans-crisantemato (Esbiothrin), un repelente derivado de o idéntico a extractos de plantas tales como limoneno, eugenol, (+)-Eucamalol (1), (-)-1-epi-eucamalol o extractos crudos vegetales de plantas tales como Eucalyptus maculata, Vítex rotundifolia, Cimbopogan martinii, Cimbopogan citratus (limonaria), Cimopogan nartdus (citronela). Los aglomerantes adecuados se seleccionan por ejemplo de polímeros y copolímeros de ésteres vinílicos de ácidos alifáticos (tales como acetato de vinilo y versatato de vinilo), ésteres acrílico y metacrílico de alcoholes, tales como acrilato de butilo, 2-etilhexilacrilato, y acrilato de metilo, hidrocarburos insaturados mono- y dietilénicamente, tales como estireno, y dienos alifáticos tales como butadieno.
- 5
- 10 La impregnación de cortinas y mosquiteros se hace en general sumergiendo el material textil en emulsiones o dispersiones del insecticida o asperjándolos sobre las redes.
- Los compuestos de la fórmula (I-5) y sus composiciones pueden utilizarse para proteger materiales de madera tales como árboles, cercas, durmientes, etc., y construcciones tales como casas, casas exteriores, fábricas, pero también materiales de construcción, muebles, cueros, fibras, artículos de vinilo, alambres y cables eléctricos, etc., frente a hormigas y/o termitas, y para controlar hormigas y termitas y evitar que hagan daño a cultivos o seres humanos (por ejemplo, cuando las plagas invaden las casas y las instalaciones públicos). Los compuestos de la fórmula (I-5) se aplican no solamente en la superficie del suelo circundante o en el suelo bajo el piso con el fin de proteger los materiales de madera sino que también puede aplicarse a artículos elaborados en madera tales como superficies de concreto bajo el piso, soportes, vigas, aglomerados, muebles, etc., artículos de madera tales como tableros de partículas, tableros medios, etc., y artículos de vinilo, tales como alambres eléctricos recubiertos, láminas de vinilo, material aislante del calor, tales como espumas de estireno, etc. En caso de aplicación contra hormigas que afectan cultivos o seres humanos, el controlador de hormigas de la presente invención se aplica a los cultivos o al suelo circundante, o se aplica directamente al nido de las hormigas o similares.
- 15
- 20
- Tratamiento de semillas
- 25 Los compuestos de fórmula (I-5) también son adecuados para el tratamiento de semillas con el fin de proteger la semilla de la plaga de insectos, en particular de las plagas de insectos que viven en el suelo y las raíces y brotes de las plantas resultante contra plagas del suelo e insectos foliares.
- Los compuestos de fórmula (I-5) son particularmente útiles para la protección de la semilla de plagas del suelo y las raíces y brotes de las plantas resultantes contra plagas del suelo e insectos foliares. Se prefiere la protección de las raíces y los brotes de la planta resultantes. Más preferido es la protección de los brotes de las plantas resultantes frente a insectos perforadores y chupadores, en donde es más preferida la protección frente a los áfidos.
- 30
- La presente invención por lo tanto comprende un método para la protección de semillas frente a insectos, en particular frente a insectos del suelo y de las raíces de y brotes de las plantas frente a los insectos, en particular frente a los insectos del suelo y foliares, comprendiendo dicho método poner en contacto las semillas antes de la siembra y/o después de la pregerminación con un compuesto de la fórmula I general o una sal del mismo. Particularmente preferido es un método, en donde las raíces y los brotes de las plantas sean protegidas, más preferiblemente un método, en donde los brotes de las plantas están protegidos frente a insectos perforadores y chupadores, lo más preferiblemente un método, en donde los brotes de las plantas sean protegidos de los áfidos.
- 35
- El término semilla abarca semillas y propágulos de las plantas de todas las clases incluyendo pero no limitándose a semillas verdaderas, partes de semillas, retoños, bulbos subterráneos, bulbos, frutas, tubérculos, granos, cortes, cortes de brotes y similares y en una realización preferida significa semillas verdaderas.
- 40
- El término tratamiento de semillas comprende todas las técnicas de tratamiento de semillas conocidas en la técnica, tales como cubrimiento de semillas, recubrimiento de semillas, pulverización de semillas, inmersión de semillas y pelletización de semillas.
- 45 La presente invención también abarca semillas recubiertas con o que contienen el compuesto activo.
- El término "recubierto con y/o que contiene" significa en general que el ingrediente activo está en su mayor parte sobre la superficie del producto de propagación en el momento de la aplicación, aunque una parte mayor o menor del ingrediente puede penetrar en el producto de propagación, dependiendo del método de aplicación. Cuando el dicho producto de propagación se replanta, puede absorber el ingrediente activo.
- 50 Semillas adecuadas son semillas de cereales, cultivos de raíz, cultivos oleosos, vegetales, especies, ornamentales, por ejemplo semillas de trigo durum o de otros trigos, cebada, avena, centeno, maíz (maíz de mazorca y maíz de azúcar/maíz dulce y de campo), soja, cultivos oleaginosas, crucíferas, algodón, girasoles, plátanos, arroz, colza oleaginosa, colza de rábano, remolacha de azúcar, remolacha de forraje, berenjenas, patatas, césped, pastos, turbas, pastos de forraje, tomates, puerros, calabacines/calabazas, repollo, lechuga iceberg, pimienta, cocombrs,

melones, especies de Brassica, melones, judías, guisantes, ajo, cebollas, zanahorias, plantas tuberosas tales como patatas, azúcar caña, tabaco, uvas, petunias, geranio/pelargonios, margaritas y claveles.

Además, el compuesto activo puede ser utilizado en el tratamiento de semillas de plantas, que toleran la acción de herbicidas o fungicidas o insecticidas, obedeciendo a los métodos de cruzamiento, incluyendo ingeniería genética.

- 5 Por ejemplo, el compuesto activo puede ser empleado en el tratamiento de semillas a partir de plantas, que son resistentes a herbicidas del grupo consistente de sulfonilureas, imidazolinonas, glufosinato de amonio o glifosato isopropilamonio y sustancias activas análogos (véase por ejemplo, EP-A-0242236, EP-A-242246) (WO 92/00377) (EPA-0257993, U.S. Pat. No. 5,013,659) o en plantas de cultivos transgénicos, por ejemplo algodón, con la capacidad de producir toxinas del *Bacillus thuringiensis* (toxinas Bt) que hacen las plantas resistentes a ciertas plagas (EP-A-0142924, EP-A-0193259),

- 10 Adicionalmente, el compuesto activo puede ser utilizado también para el tratamiento de semillas de plantas, las cuales tienen características modificadas en comparación con las plantas existentes, que pueden ser generadas por ejemplo por métodos tradicionales de cruzamiento y/o la generación de mutantes o por procedimientos recombinantes). Por ejemplo, se ha descrito un cierto número de casos de modificaciones recombinantes de plantas de cultivo para el propósito de modificar el almidón sintetizado en las plantas (por ejemplo, WO 92/11376, WO 92/14827, WO 91/19806) o de plantas de cultivos transgénicos que tienen una composición de ácidos grasos modificada (WO 91/13972).

La aplicación de tratamientos a semillas del compuesto activo se lleva a cabo asperjando o pulverizando las semillas antes de la siembra de las plantas y antes de que las plantas emerjan.

- 20 Composiciones que son especialmente útiles para el tratamiento de semillas son, por ejemplo:

A Concentrados solubles (SL, LS)

D Emulsiones (EW, EO, ES)

E Suspensiones (SC, OD, FS)

F Gránulos dispersables en agua y gránulos solubles en agua (WG, SG)

- 25 G Polvos dispersables en agua y polvos solubles en agua (WP, SP, WS)

H Formulaciones en gel (GF)

I Polvos pulverizables (PS, DS)

- 30 Las formulaciones convencionales para tratamiento de semillas incluyen por ejemplo concentrados fluidos FS, soluciones LS, polvos para tratamiento en seco DS, polvos dispersables en agua para tratamiento en pasta WS, polvos solubles en agua SS y emulsiones ES y CE y formulaciones en gel GF. Estas formulaciones pueden aplicarse a la semilla, diluidas o no diluidas. La aplicación a las semillas se lleva a cabo antes de la siembra, bien sea directamente sobre las semillas o después de haber pregerminado estas últimas

- 35 En una realización preferida se usa una formulación FS para un tratamiento de semillas. Típicamente, una formulación FS puede comprender 1-800 g/l de ingrediente activo, 1-200 g/l de surfactante, 0 a 200 g/l de agente anticongelante, 0 a 400 g/l de aglomerante, 0 a 200 g/l de un pigmento y hasta 1 litro de solvente, preferiblemente agua.

- 40 Formulaciones FS especialmente preferidas de los compuestos de la fórmula I para el tratamiento de semillas comprenden usualmente 0.1 a 80% en peso (1 a 800 g/l) del ingrediente activo, de 0.1 a 20% en peso (1 a 200 g/l) de al menos un surfactante, por ejemplo, 0.05 a 5% en peso de agua y de 0.5 a 15% en peso de un agente dispersante, hasta 20% en peso, por ejemplo de 5 a 20% de un agente anticongelante, de 0 a 15% en peso, por ejemplo, 1 a 15% en peso de un pigmento y/o un colorante, de 0 a 40 % en peso, por ejemplo 1 a 40 % en peso de un aglomerante (adhesivo/agente de adhesión), opcionalmente hasta 5 % en peso, por ejemplo 0.1 a 5% en peso de un espesante, opcionalmente de 0.1 a 2% de un agente antiespumante, y opcionalmente un conservante tal como un biocida, antioxidante o similar, por ejemplo en una cantidad de 0.01 a 1% en peso y un agente de relleno/vehículo
- 45 hasta 100% en peso.

Las formulaciones para el tratamiento de semillas pueden comprender adicionalmente aglomerantes y opcionalmente colorantes.

Los aglomerantes pueden agregarse para mejorar la adhesión de los materiales activos sobre las semillas después del tratamiento. Aglomerantes adecuados son homo- y copolímeros, de óxidos de alquileno, como óxido de etileno u

óxido de propileno, polivinilacetato, polivinilalcoholes, polivinilpirrolidonas, y copolímeros de los mismos, copolímeros de etilen-vinil acetato, homo- y copolímeros acrílicos, polietilenaminas, polietilenamidas y polietileniminas, polisacáridos como celulosas, tilosa y almidón, homo- y copolímeros de poliolefina como copolímeros de olefina/anhídrido maleico, poliuretanos, poliésteres, homo y copolímeros de poliestireno.

- 5 Opcionalmente, también pueden incluirse colorantes en la formulación. Colorantes o pigmentos adecuados para formulaciones para el tratamiento de semillas son rodamina B, C.I. Pigmento rojo 112, C.I. Solvente rojo 1, pigmento azul 15:4, pigmento azul 15:3, pigmento azul 15:2, pigmento azul 15:1, pigmento azul 80, pigmento amarillo 1, pigmento amarillo 13, pigmento rojo 112, pigmento rojo 48:2, pigmento rojo 48:1, pigmento rojo 57:1, pigmento rojo 53:1, pigmento naranja 43, pigmento naranja 34, pigmento naranja 5, pigmento verde 36, pigmento verde 7, pigmento blanco 6, pigmento pardo 25, violeta básico 10, violeta básico 49, rojo ácido 51, rojo ácido 52, rojo ácido 14, azul ácido 9, amarillo ácido 23, rojo básico 10, rojo básico 108.

Ejemplos de un agente gelificante es carragenano (Satiagel®)

- 15 En el tratamiento de semillas, las tasas de aplicación de los compuestos I van generalmente de 0.1 g hasta 10 kg por 100 kg de semillas, preferiblemente de 1 g a 5 kg por 100 kg de semillas, más preferiblemente de 1 g a 1000 g por 100 kg de semillas y en particular de 1 g a 200 g por 100 kg de semillas.

- 20 La invención por lo tanto también se relaciona con semillas que comprenden un compuesto de la fórmula (I-5) y/o una sal de I útil desde el punto de vista agrícola, tal como se definió aquí. La cantidad del compuesto I o de la sal útil desde el punto de vista agrícola del mismo, en general variará de 0.1 g hasta 10 kg por cada 100 kg de semilla, preferiblemente de 1 g a 5 kg por 100 kg de semillas, en particular de 1 g a 1000 g por 100 kg de semilla. Para cultivos específicos tales como lechuga la tasa puede ser superior.

Sanidad animal

Los compuestos de la fórmula (I-5) o los enantiómeros o las sales aceptables desde el punto de vista veterinario de los mismos también son en particular adecuados para utilizarse en el combate de parásitos en y sobre animales.

- 25 Un objeto de la presente invención por lo tanto es proveer nuevos métodos para controlar parásitos en y sobre animales. Otro objeto de la invención es proveer pesticidas más seguros para animales. Otro objeto de la invención es adicionalmente proveer pesticidas para animales que puedan ser utilizados en dosis inferiores a los pesticidas existentes. Y otro objeto de la invención es proveer pesticidas para animales, que provean un control residual prolongado de los parásitos.

- 30 La invención también se relaciona con composiciones que contienen una cantidad efectiva como parasiticidad de compuestos de la fórmula (I-5) o los enantiómeros o sales aceptables desde el punto de vista veterinario de los mismos y un vehículo aceptable, para combatir parásitos en y sobre animales.

- 35 La presente invención también provee un método para tratar, controlar, prevenir y proteger animales contra la infestación e infección por parásitos, que comprende administrar oralmente, por vía tópica o parenteral o aplicar a los animales una cantidad efectiva como parasiticida de un compuesto de la fórmula I o los enantiómeros o las sales aceptables desde el punto de vista veterinario de los mismos o una composición que los comprende.

La invención también provee un proceso para la preparación de una composición para tratar, controlar, prevenir o proteger animales contra la infestación o infección por parásitos que comprende una cantidad efectiva como parasiticida de un compuesto de la fórmula (I-5) o los enantiómeros o sales aceptables desde el punto de vista veterinario de los mismos o una composición que los comprende.

- 40 La actividad de los compuestos contra las plagas agrícolas no sugiere su adecuabilidad para el control de endo y ectoparásitos en y sobre animales que los requieren, por ejemplo, dosificaciones bajas no eméticas, en el caso de la aplicación oral, compatibilidad metabólica con el animal, baja toxicidad y un manejo seguro.

Sorprendentemente se ha encontrado ahora que los compuestos de la fórmula (I-5) son adecuados para combatir endo y ectoparásitos en y sobre animales.

- 45 Los compuestos de la fórmula (I-5) o los enantiómeros o las sales aceptables desde el punto de vista veterinario de los mismos y las composiciones que los comprenden se utilizan preferiblemente para controlar y evitar infestaciones e infecciones en animales incluyendo animales de sangre caliente (incluyendo humanos) y peces. Son adecuados por ejemplo para controlar y prevenir infestaciones e infecciones en mamíferos tales como ganado, ovejas, cerdos, camellos, venados, caballos, cerdos, aves, conejos, cabras, perros y gatos, búfalos de agua, asnos, corzos y renos, y también en animales de piel tales como mink, Chinchilla y mapache, aves tales como gallinas, gansos, pavos y patos y peces tales como peces de agua dulce y agua salada tales como trucha, carpa y anguilas.

Los compuestos de la fórmula (I-5) o los enantiómeros o las sales aceptables desde el punto de vista veterano de los mismos y las composiciones que los comprenden son utilizados preferiblemente para controlar y evitar infestaciones e infecciones en animales domésticos, tales como perros y gatos.

- 5 Las infestaciones en animales de sangre caliente y peces incluyen, pero no se limitan a, piojos, piojos mordedores, garrapatas, lombrices nasales, keds, moscas picadoras, moscas muscoides, moscas, larvas de moscas miasóticas, niguas, jejenes, mosquitos y pulgas.

Los compuestos de la fórmula (I-5) o los enantiómeros o las sales aceptables desde el punto de vista veterinario de los mismos y las composiciones que los comprenden son adecuados para el control sistémico y/o no sistémico de ecto y/o endoparásitos. Son activos contra todas o algunas de etapas de desarrollo.

- 10 Los compuestos de la fórmula (I-5) son especialmente útiles para combatir ectoparásitos.

Los compuestos de la fórmula (I-5) son especialmente útiles para combatir parásitos de los siguientes órdenes y especies, respectivamente:

pulgas (Sifonáptera), por ejemplo. *Ctenocephalides felis*, *Ctenocephalides canis*, *Xenopsylla cheopis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, y *Nosopsyllus fasciatus*,

- 15 cucarachas (Blattaria - Blattodea), por ejemplo. *Blattella germanica*, *Blattella asahinae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta japonica*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Periplaneta australasiae*, y *Blatta orientalis*,

moscas, mosquitos (Díptera), por ejemplo. *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes vexans*, *Anastrepha ludens*, *Anopheles maculipennis*, *Anopheles crucians*, *Anopheles albimanus*, *Anopheles gambiae*, *Anopheles freeborni*, *Anopheles leucosphyrus*, *Anopheles minimus*, *Anopheles quadrimaculatus*, *Calliphora vicina*, *Chrysomya bezziana*,

- 20 *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macellaria*, *Chrysops discalis*, *Chrysops silacea*, *Chrysops atlanticus*, *Cochliomyia hominivorax*, *Cordylobia anthropophaga*, *Culicoides furens*, *Culex pipiens*, *Culex nigripalpus*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex tarsalis*, *Culiseta inornata*, *Culiseta melanura*, *Dermatobia hominis*, *Fannia canicularis*, *Gasterophilus intestinalis*, *Glossina morsitans*, *Glossina palpalis*, *Glossina fuscipes*, *Glossina tachinoides*, *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hippelates* spp., *Hypoderma lineata*, *Leptoconops torrens*, *Lucilia caprina*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*, *Lycoria pectoralis*, *Mansonina* spp., *Musca domestica*, *Muscina stabulans*,

- 25 *Oestrus ovis*, *Phlebotomus argentipes*, *Psorophora columbiae*, *Psorophora discolor*, *Prosimulium mixtum*, *Sarcophaga haemorrhoidalis*, *Sarcophaga* sp., *Simulium vittatum*, *Stomoxys calcitrans*, *Tabanus bovinus*, *Tabanus atratus*, *Tabanus lineola*, y *Tabanus similis*, piojos (Phthiraptera), por ejemplo. *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pthirus pubis*, *Haematopinus eurysternus*, *Haematopinus suis*, *Linognathus vituli*, *Bovicola bovis*,  
30 *Menopon gallinae*, *Menacanthus stramineus* y *Solenopotes capillatus*.

garrapatas y gorgojos parasíticos (Parasitiformes): garrapatas (Ixodida), por ejemplo. *Ixodes scapularis*, *Ixodes holocyclus*, *Ixodes pacificus*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Dermacentor andersoni*, *Dermacentor variabilis*, *Amblyomma americanum*, *Amblyomma maculatum*, *Ornithodoros hermsi*, *Ornithodoros turicata* y gorgojos parasíticos (Mesostigmata), por ejemplo. *Ornithonyssus bacoti* y *Dermanyssus gallinae*,

- 35 Actiniedida (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., y *Laminosioptes* spp,

- 40 Bichos (Heteroptera): *Cimex lectularius*, *Cimex hemipterus*, *Reduvius senilis*, *Triatoma* spp., *Rhodnius* ssp., *Panstrongylus* ssp. y *Arilus critatus*,

Anoplurida, por ejemplo. *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Pthirus* spp., y *Solenopotes* spp,

Mallophagida (subórdenes Amblycerina e Ischnocerina), por ejemplo. *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Trichodectes* spp., y *Felicola* spp,

Gusanos Nematoda:

- 45 Gusanos frotadores y Trichinosis (Trichosyringida), por ejemplo. Trichinellidae (*Trichinella* spp.), (Trichuridae) *Trichuris* spp., *Capillaria* spp,

Rhabditida, por ejemplo. *Rhabditis* spp, *Strongyloides* spp., *Helicephalobus* spp,

Strongylida, por ejemplo. *Strongylus* spp., *Ancylostoma* spp., *Necator americanus*, *Bunostomum* spp. (Hookworm), *Trichos trongylus* spp., *Haemonchus contortus*., *Ostertagia* spp. , *Cooperia* spp., *Nematodirus* spp., *Dictyocaulus* spp., *Cyathostoma* spp., *Oesophagostomum* spp., *Stephanurus dentatus*, *Ollulanus* spp., *Chabertia* spp.,

- 50

*Stephanurus dentatus*, *Syngamus trachea*, *Ancylostoma* spp., *Uncinaria* spp., *Globocephalus* spp., *Necator* spp., *Metastrongylus* spp., *Muellerius capillaris*, *Protostrongylus* spp., *Angiostrongylus* spp., *Parelaphostrongylus* spp., *Aleurostrongylus abstrusus*, y *Dioctophyma renale*,

5 Gusanos intestinales (Ascaridida), por ejemplo. *Ascaris lumbricoides*, *Ascaris suum*, *Ascaridia galli*, *Parascaris equorum*, *Enterobius vermicularis* (Threadworm), *Toxocara canis*, *Toxascaris leonine*, *Skjabinema* spp., y *Oxyuris equi*,

Camallanida, por ejemplo. *Dracunculus medinensis* (gusano de guinea)

Spirurida, por ejemplo. *Thelazia* spp. *Wuchereria* spp., *Brugia* spp., *Onchocerca* spp., *Dirofilari* spp.a, *Dipetalonema* spp., *Setaria* spp., *Elaeophora* spp., *Spirocerca lupi*, y *Habronema* spp.,

10 Gusanos de cabeza espinosa (Acanthocephala), por ejemplo. *Acanthocephalus* spp., *Macracanthorhynchus hirudinaceus* y *Oncicola* spp,

Planarios (Plathelminthes):

15 Lombrices del ganado (Trematoda), por ejemplo *Faciola* spp., *Fascioloides magna*, *Paragonimus* spp., *Dicrocoelium* spp., *Fasciolopsis buski*, *Clonorchis sinensis*, *Schistosoma* spp., *Trichobilharzia* spp., *Alaria alata*, *Paragonimus* spp., y *Nanocyetes* spp,

Cercomeromorpha, en particular Cestoda (Tapeworms), por ejemplo *Diphyllobothrium* spp., *Tenia* spp., *Echinococcus* spp., *Dipylidium caninum*, *Multiceps* spp., *Hymenolepis* spp., *Mesocestoides* spp., *Vampirolepis* spp., *Moniezia* spp., *Anoplocephala* spp., *Sirometra* spp., *Anoplocephala* spp., y *Hymenolepis* spp.

20 Los compuestos de la fórmula (I-5) y las composiciones que los contienen son particularmente útiles para el control de plagas de los órdenes Díptera, Sifonáptera e Ixodida.

Además, se prefiere especialmente el uso de los compuestos de la fórmula (I-5) y las composiciones que los contienen para combatir mosquitos.

El uso de los compuestos de la fórmula (I-5) y las composiciones que los contienen para combatir moscas es una realización adicional preferida de la presente invención.

25 Adicionalmente, se prefiere especialmente el uso de compuestos de la fórmula (I-5) y las composiciones que los contienen para combatir pulgas.

El uso de los compuestos de la fórmula (I-5) y las composiciones que los contienen para combatir garrapatas es una realización adicional preferida de la presente invención.

30 Los compuestos de la fórmula (I-5) también son especialmente útiles para combatir endoparásitos (gusanos nematodos, gusanos de cabeza espinosa y planarios).

La administración puede llevarse a cabo tanto profiláctica como terapéuticamente.

La administración de los compuestos activos se lleva a cabo directamente o en la forma de preparaciones adecuadas, oralmente, por vía tópica/dérmica o parenteral.

35 Para la administración oral a animales de sangre caliente, los compuestos de la fórmula (I-5) pueden formularse como alimentos para animales, premezclas para alimentos de animales, concentrados para alimentación de animales, píldoras, soluciones, pastas, suspensiones, pociones, geles, tabletas, bolos y cápsulas. Además, los compuestos de la fórmula (I-5) pueden administrarse a los animales en su agua de abrevadero. Para administración oral, la forma de dosificación escogida debería proveer al animal con 0.01 mg/kg hasta 100 mg/kg de peso corporal del animal por día del compuesto de la fórmula (I-5), preferiblemente con 0.5 mg/kg a 100 mg/kg de peso corporal del animal por día.

40 Alternativamente, los compuestos de la fórmula (I-5) pueden administrarse a los animales por vía parenteral, por ejemplo, por inyección intraluminal, intramuscular, intravenosa o subcutánea. Los compuestos de la fórmula (I-5) pueden dispersarse o disolverse en un vehículo fisiológicamente aceptable para inyección subcutánea. Alternativamente, los compuestos de la fórmula (I-5) pueden formularse en un implante para administración subcutánea. Además, el compuesto de la fórmula (I-5) puede administrarse por vía transdérmica a los animales. Para administración parenteral, la forma de dosificación escogida debería proveer al animal con 0.01 mg/kg hasta 100 mg/kg de peso corporal del animal por día del compuesto de la fórmula I.

- Los compuestos de la fórmula (I-5) también pueden aplicarse por vía tópica a los animales en forma de gotas, polvos, pulverizados, collares, medallones, aspersiones, champús, formulaciones para aplicación y vertimiento y en ungüentos o en emulsiones aceite en agua o agua en aceite. Para aplicación tópica, las gotas y las aspersiones contienen usualmente 0.5 ppm a 5,000 ppm y preferiblemente de 1 ppm a 3,000 ppm del compuesto de la fórmula (I-5). Además, los compuestos de la fórmula (I-5) pueden formularse en etiquetas para orejas para animales, particularmente cuadrúpedos tales como ganado y ovejas.
- 5
- Preparaciones adecuadas son:
- Soluciones tales como soluciones orales, concentrados para administración oral después de la dilución, soluciones para el uso en la piel o cavidades corporales, formulaciones para vertimiento, geles;
- 10
- Emulsiones y suspensiones para administración oral o dérmica; preparaciones semisólidas;
  - Formulaciones en las cuales el compuesto activo es procesado en una base de ungüento o en una emulsión aceite en agua o agua en aceite;
  - Preparaciones sólidas tales como polvos, premezclas o concentrados, gránulos, pellas, tabletas, bolos, cápsulas; aerosoles e inhalantes, y artículos conformados que contienen el compuesto activo.
- 15
- Las composiciones adecuadas para inyección se preparan disolviendo el ingrediente activo en un solvente adecuado y agregando opcionalmente ingredientes adicionales tales como ácidos, bases, sales reguladoras, conservantes y solubilizantes. Las soluciones se filtran y se empaquetan de manera estéril.
- Solventes adecuados son solventes fisiológicamente tolerables tales como agua, alcoholes tales como etanol, butanol, alcohol bencílico, glicerol, propilenglicol, polietilenglicoles, N-metil-pirrolidona, 2-pirrolidona y mezclas de los mismos.
- 20
- Los compuestos activos pueden disolverse opcionalmente en aceites vegetales o sintéticos fisiológicamente tolerables los cuales son adecuados para inyección.
- Solubilizantes adecuados son solventes que promueven la disolución del compuesto activo en el solvente principal o evita su precipitación. Ejemplos son polivinilpirrolidona, alcohol polivinílico, aceite de castor polioxiethylado y éster de sorbitano polioxiethylado.
- 25
- Conservantes adecuados son alcohol bencílico, triclorobutanol, ésteres del ácido p-hidroxibenzoico y n-butanol.
- Las soluciones orales se administran directamente. Los concentrados se administran oralmente después de una dilución previa hasta la concentración de uso. Las soluciones y concentrados orales se preparan de acuerdo con el estado de la técnica y tal como se describió anteriormente para soluciones para inyección, no siendo necesarios los procedimientos estériles.
- 30
- Las soluciones para uso sobre la piel son rociadas, esparcidas, frotadas, pulverizadas o asperjadas.
- Las soluciones para uso sobre la piel se preparan de acuerdo con el estado de la técnica y de acuerdo a lo que se describe anteriormente para soluciones en inyección, no siendo necesarios los procedimientos estériles.
- 35
- Solventes adecuados adicionales son polipropilén glicol, fenil etanol, fenoxietanol, ésteres tales como acetato de etilo o butilo, benzoato de bencilo, éteres tales como alquilenglicol alquiléter, por ejemplo, dipropilenglicol monometiléter, cetonas tales como acetona, metiletilcetona, hidrocarburos aromáticos, aceites vegetales y sintéticos, dimetilformamida, dimetilacetamida, transcutool y solketal, carbonato de propileno y mezclas de los mismos.
- Puede ser ventajoso agregar espesantes durante la preparación. Espesantes adecuados son espesantes inorgánicos tales como bentonitas, ácido silícico coloidal, monoestearato de aluminio, espesantes orgánicos tales como derivados de celulosa, alcoholes polivinílicos y sus copolímeros, acrilatos y metacrilatos.
- 40
- Los geles se aplican por distribución sobre la piel o se introducen en cavidades corporales. Los geles se preparan tratando soluciones que han sido preparadas tal como se describe en el caso de las soluciones para inyección con un aglomerante suficiente de tal forma que da como resultado un material claro que tiene una consistencia similar a un ungüento. Los espesantes empleados son los espesantes dados anteriormente.
- 45
- Las formulaciones para vertimiento se vierten o se asperjan sobre áreas limitadas de la piel, penetrando el compuesto activo la piel y actuando sistémicamente.

## ES 2 546 417 T3

Las formulaciones para vertimiento se preparan disolviendo, suspendiendo o emulsificando el compuesto activo en solventes o mezclas de solventes compatibles con la piel. Si es apropiado, se agregan otros auxiliares tales como colorantes, sustancias promotoras de la bioabsorción, antioxidantes, estabilizadores frente a la luz, adhesivos.

5 Solventes adecuados son: agua, alcanoles, glicoles, polietilenglicoles, polipropilenglicoles, glicerol, alcoholes aromáticos tales como alcohol bencílico, feniletanol, fenoxietanol, ésteres tales como acetato de etilo, acetato de butilo, benzoato de bencilo, éteres tales como éteres de alquilen glicol alquilo, tales como dipropilen glicol monoetil éter, dietilenglicol mono-butyl éter, cetonas tales como acetona, metil etil cetona, carbonatos cíclicos tales como carbonato de propileno, carbonato de etileno, hidrocarburos aromáticos y/o alifáticos, aceites vegetales o sintéticos, DMF, dimetilacetamida, n-alquilpirrolidonas tales como metilpirrolidona, N-butilpirrolidona o n-octilpirrolidona, N-metilpirrolidona, 2-pirrolidona, 2,2-dimetil-4-oximetilén-1,3-diox-olano y glicerol formal.

10 Colorantes adecuados son todos los colorantes permitidos para uso en animales y que pueden ser disueltos o suspendidos.

15 Sustancias promotoras de la absorción adecuada son, por ejemplo, DMSO, aceites de aplicación tales como miristato de isopropilo, pelargonato de dipropilenglicol, aceites de silicona y copolímeros de los mismos con poliéteres, ésteres de ácidos grasos, triglicéridos, alcoholes grasos.

Antioxidantes adecuados son sulfitos o metabisulfitos tales como metabisulfito de potasio, ácido ascórbico, butilhidroxitolueno, butilhidroxianisol, tocoferol.

Estabilizadores frente a luz adecuados son, por ejemplo, ácido novantisólico.

20 Adhesivos adecuados son, por ejemplo, derivados de celulosa, derivados de almidón, poliácridatos, polímeros naturales tales como alginatos, gelatinas.

Las emulsiones pueden administrarse oralmente, por vía dérmica o como inyecciones.

Las emulsiones son bien del tipo agua en aceite o aceite en agua.

25 Se preparan disolviendo el compuesto activo, bien sea en la fase hidrófoba o en la hidrofílica y homogeneizándolas con el solvente de la otra fase con la ayuda de emulsificantes adecuados y, si es apropiado, otros agentes auxiliares tales como colorantes, sustancias promotoras de la absorción, conservantes, antioxidantes, estabilizadores a la luz, sustancias potenciadoras de la viscosidad.

Fases hidrófobas adecuadas (aceites) son:

30 parafinas líquidas, aceites de silicona, aceites vegetales naturales tales como aceite de sésamo, aceite de almendras, aceite de castor, triglicéridos sintéticos tales como biglicéridos caprílico/cáprico, mezclas de triglicéridos con ácidos grasos vegetales de longitud de cadena  $C_8-C_{12}$  u otros ácidos grasos naturales especialmente seleccionados, mezclas parciales de glicéridos de ácidos grasos saturados o insaturados posiblemente también con contenido de grupos hidroxilo, mono y diglicéridos de los ácidos grasos  $C_8-C_{10}$ , ésteres de ácidos grasos tales como estearato de etilo, adipato de di-n-butirilo, laurato de hexilo, pelargonato de dipropilén glicol, ésteres de ácidos grasos ramificados de longitud de cadena media con alcoholes grasos saturados de longitud de cadena  $C_{16}-C_{18}$ , miristato de isopropilo, palmitato de isopropilo, ésteres de ácido caprílico/cáprico de alcoholes grasos saturados de longitud de cadena  $C_{12}-C_{18}$ , estearato de isopropilo, oleato de oleílo, oleato de decilo, oleato de etilo, lactato de etilo, ésteres de ácidos grasos cerosos tales como grasa de la glándula coccigeal de pato, ftalato de dibutilo, adipato de diisopropilo, y mezclas de ésteres relacionadas con estos últimos, alcoholes grasos tales como alcohol isotridecílico, 2-octildodecanol, alcohol cetilestearílico, alcohol oleílico, ácidos grasos tales como ácido oleico y mezclas de los mismos.

40 Fases hidrofílicas adecuadas son: agua, alcoholes tales como propilén glicol, glicerol, sorbitol y mezclas de los mismos.

Emulsificantes adecuados son:

45 surfactantes no iónicos, por ejemplo, aceite de castor polietoxilado, monooleato de sorbitano polietoxilado, monoestearato de sorbitano, monoestearato de glicerol, estearato de polioxietilo, alquilfenol poliglicol éter;

surfactantes anfólicos tales como N-lauril-p-iminodipropionato de di-sodio o lecitina; surfactantes aniónicos, tales como lauril sulfato de sodio, sulfatos de éteres de alcoholes grasos, mono/dialquil poliglicol éter y sales de monoetanolamina de ésteres de ácido ortofosfórico; surfactantes activos anticaciones, tales como cloruro de cetiltrimetilamonio.

Agentes auxiliares adecuados adicionales son: sustancias que potencian la viscosidad y estabilizan la emulsión, tales como carboximetilcelulosa, metilcelulosa y otros derivados de celulosa y almidón, poliacrilatos, alginatos, gelatina, goma arábiga, polivinilpirrolidona, alcohol polivinílico, copolímeros de metil vinil éter y anhídrido maleico, polietilén glicoles, ceras, ácido silícico coloidal o mezclas de las sustancias mencionadas

- 5 Las suspensiones pueden administrarse oralmente o por vía tópica/dérmica. Se preparan suspendiendo el compuesto activo en un agente de suspensión, si es apropiado con adición de otros auxiliares tales como agentes humectantes, colorantes, sustancias promotoras de la bioabsorción, conservantes, antioxidantes, estabilizadores a la luz.

Los agentes de suspensión en líquido son todos solventes y mezclas de solventes homogéneos.

- 10 Agentes humectantes adecuados (dispersantes) son los emulsificantes dados anteriormente.

Otros agentes auxiliares que pueden mencionarse son los que se dieron anteriormente.

Las preparaciones semisólidas pueden administrarse oralmente o por vía tópica/dérmica. Difieren de las suspensiones y emulsiones descritas anteriormente solamente por su viscosidad mayor.

- 15 Para la producción de preparaciones sólidas, el compuesto activo se mezcla con excipientes adecuados, si es apropiado con la adición de auxiliares, y se lleva a la forma deseada.

Excipientes adecuados son todas las sustancias inertes sólidas fisiológicamente tolerables. Se utilizan sustancias inorgánicas y orgánicas. Las sustancias inorgánicas son, por ejemplo, cloruro de sodio, carbonatos tales como carbonato de calcio, hidrogenocarbonatos, óxidos de aluminio, óxido de titanio, ácidos silícicos, tierras arcillosas, sílica precipitada o coloidal, o fosfatos. Las sustancias orgánicas son, por ejemplo, azúcar, celulosa, alimentos y piensos tales como leche en polvo, torta de animales, tortas y deshechos de granos y almidones.

- 20

Auxiliares adecuados son conservantes, antioxidantes y/o colorantes que se han mencionado anteriormente.

Otros auxiliares adecuados son lubricantes y deslizantes tales como estearato de magnesio, ácido esteárico, talco, bentonitas, sustancias promotoras de la desintegración, tales como almidón o polivinilpirrolidona entrecruzada, aglomerantes tales como almidón, gelatina o polivinilpirrolidona lineal, y aglomerantes en seco tales como celulosa microcristalina.

- 25

En general, "cantidad efectiva como parasiticida" significa la cantidad de ingrediente activo necesaria para alcanzar un efecto observable sobre el crecimiento, incluyendo los efectos de necrosis, muerte, retardamiento, prevención y eliminación, destrucción o disminución de alguna otra manera de la presencia y actividad del organismo objetivo. La cantidad efectiva como parasiticida puede variar para los diversos compuestos/composiciones usados en la invención. Una cantidad efectiva como parasiticida de las composiciones también variará de acuerdo con las condiciones prevalentes tales como efecto y duración parasiticidas deseados, especie objetivo, modo de aplicación y similares.

- 30

Las composiciones que pueden utilizarse en la invención pueden comprender generalmente desde aproximadamente 0.001 a 95% del compuesto de fórmula (I-5).

- 35 En general es favorable aplicar los compuestos de la fórmula (I-5) en cantidades totales de 0.5 mg/kg a 100 mg/kg por día, preferiblemente 1 mg/kg a 50 mg/kg por día.

Las preparaciones listas para el uso contienen los compuestos que actúan contra parásitos, preferiblemente ectoparásitos en concentraciones de 10 ppm a 80 por ciento en peso, preferiblemente de 0.1 a 65 por ciento en peso, más preferiblemente de 1 a 50 por ciento en peso, lo más preferiblemente de 5 a 40 por ciento en peso.

- 40 Las preparaciones que se diluyen antes del uso contienen los compuestos que actúan contra ectoparásitos en concentraciones de 0.5 a 90 por ciento en peso, preferiblemente de 1 a 50 por ciento en peso.

Adicionalmente, las preparaciones comprenden los compuestos de la fórmula (I-5) contra endoparásitos en concentraciones de 10 ppm a 2 por ciento en peso, preferiblemente de 0.05 a 0.9 por ciento en peso, muy particularmente de forma preferible de 0.005 a 0.25 por ciento en peso.

- 45 En una realización preferida de la presente invención, la composición que comprende los compuestos de la fórmula (I-5) se aplica por vía dérmica/tópica.

En una realización preferida adicional, la aplicación tópica se lleva a cabo en la forma de artículos conformados que contienen el compuesto tales como collares, medallones, etiquetas para oreja, bandas para fijar a partes del cuerpo, y tiras y láminas adhesivas.

En general es favorable aplicar las formulaciones sólidas que liberan los compuestos de la fórmula (I-5) en cantidades totales de 10 mg/kg a 300 mg/kg, preferiblemente 20 mg/kg a 200 mg/kg, lo más preferiblemente de 25 mg/kg a 160 mg/kg de peso corporal del animal tratado en el transcurso de tres semanas.

- 5 Para la preparación de los artículos conformados, se utilizan termoplásticos y plásticos flexibles así como elastómeros y elastómeros termoplásticos. Los plásticos y elastómeros adecuados son resinas de polivinilo, poliuretano, poliacrilato, resinas epoxi, celulosa, derivados de celulosa, poliamidas y poliéster que son suficientemente compatibles con los compuestos de la fórmula (I-5). Una lista detallada de plásticos y elastómeros así como de procedimientos de preparación para los artículos conformados se da por ejemplo en WO 03/086075.

### Ejemplos

- 10 La presente invención se ilustra ahora en detalle adicional mediante los siguientes ejemplos, sin imponer ninguna limitación a los mismos.

### C. Ejemplos de compuestos

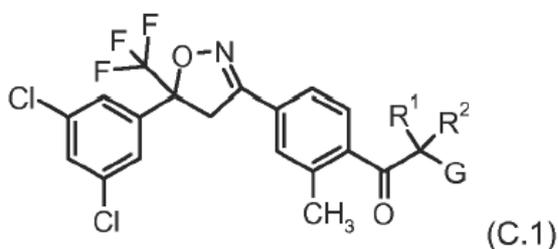
Los compuestos pueden ser caracterizados por ejemplo, por Cromatografía Líquida de Alto rendimiento/espectrometría de masas acopladas (HPLC/MS), por <sup>1</sup>H-RMN y/o por sus puntos de fusión.

- 15 Columna HPLC analítica: columna RP-18 Chromolith Speed ROD de Merck KgaA, Alemania). Elución: acetonitrilo + 0.1 % de ácido trifluoroacético (TFA)/agua + 0.1 % de ácido trifluoroacético (TFA) en una relación de desde 5:95 a 100:0 en 5 minutos a 40 °C (método estándar); o en algunos casos desde 5:95 a 100:0 en 4 minutos a 40 °C (caracterizado como método (B) en la tabla (s) más abajo).

- 20 <sup>1</sup>H-RMN, respectivamente <sup>13</sup>C-RMN: Las señales se caracterizan por desplazamiento químico (ppm) vs. tetrametilsilano, respectivamente CDCl<sub>3</sub> para <sup>13</sup>C-RMN, por su multiplicidad y por su integral (número relativo de átomos de hidrógeno dado). Las siguientes abreviaturas se utilizan para caracterizar la multiplicidad de las señales: m = multiplete, q = cuarteto, t = triplete, d = doblete y s = singlete.

### C.1 Compuestos de ejemplo 1

Los compuestos de ejemplo de 1-1 a 1-4 corresponden a compuesto de la Fórmula C.1



25

en donde R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> y G de cada compuesto de ejemplo se define en la Tabla C.1 a continuación.

Tabla C.1

Compuesto de Ej.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G	HPLC-MS: R <sub>t</sub> (min) y [M + H]	
1-1	H	H	H	n.a.	n.a.
1-2	H	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4.220	458.05
1-3	H	H	C(=O)-OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4.684	488.05
1-4	H	H	C(=O)-OCH <sub>3</sub>	4.945	474.00
1-5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(=O)-OCH <sub>3</sub>	4.759	501.80
1-6	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4.866	443.80

ES 2 546 417 T3

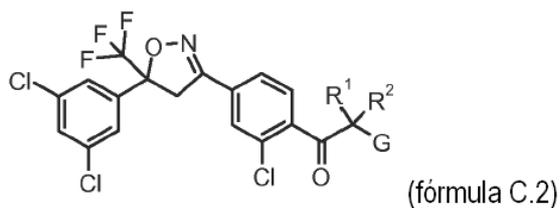
Compuesto de Ej.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G	HPLC-MS: R <sub>t</sub> (min) y [M + H]	
1-7	H	H	CH <sub>3</sub>	4.721	429.80
1-8	H	H	C(=O)-N(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4.490	500.80
1-9	H	H	C(=O)-NHCH <sub>2</sub> C(=O)-NCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3.920	543.80
1-10	H	H	C(=O)-NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4.294	501.05
1-11	H	H	C(=O)-NHCH <sub>3</sub>	4.001	472.80
1-12	H	H	CH <sub>2</sub> C(=O)-OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4.668	502.05
1-13	H	H	C(=O)-NHCH <sub>2</sub> C(=O)-NCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4.110	597.70
1-14	H	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	4.846	492.05
1-15	H	H	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	4.301	506.05
1-16	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4.773	497.70
1-17	=N-OH		C(=O)-OCH <sub>3</sub>	4.287	502.95
1-18	=O		OCH <sub>3</sub>	4.465	459.95
1-19	=CH-CH <sub>3</sub>		H	4.753	441.80
1-20	=O		NHCH <sub>3</sub>	4.194	458.80
1-21	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -		H	4.732	442.05
1-22	H	H	C(=O)-N(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	3.990(B)	515.05
1-23	H	H	CH <sub>2</sub> C(=O)-NHCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3.767(B)	513.05
1-24	H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(=O)-NHCH(CH <sub>3</sub> )ciclopropilo	3.925	555.05
1-25	=N-OCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>		C(=O)-OCH <sub>3</sub>	4.153(B)	593.05
1-26	H	H	CH <sub>2</sub> C(=O)-NHCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4.759	501.80
1-27	H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4.809	511.8
1-28	H	H	C(=O)-NHCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	3.558(B)	487.05
1-29	H	H	CH <sub>2</sub> C(=O)-NHCH <sub>3</sub>	3.578(B)	487.05
1-30	=CH <sub>2</sub>		CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(=O)-NHCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	3.764(B)	541.15
1-31	H	H	CH <sub>2</sub> C(=O)-NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4.384	515.05
1-32	H	H	CH <sub>2</sub> C(=O)-NHCH <sub>2</sub> ciclopropilo	3.833(B)	527.05
1-33	=N-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>		C(=O)-OCH <sub>3</sub>	4.051 (B)	531.0
1-34	=N-OCH <sub>3</sub>		C(=O)-OCH <sub>3</sub>	4.555	516.50
1-35	H	H	CH <sub>2</sub> -ciclopropilo	4.943	470.05
1-36	H	H	CH <sub>2</sub> C(=O)-N(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3.745(B)	515.00

ES 2 546 417 T3

Compuesto de Ej.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G	HPLC-MS: R <sub>t</sub> (min) y [M + H]	
1-37	=N-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>		C(=O)-OCH <sub>3</sub>	4.152(B)	545.0
1-38	H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(=O)-NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3.710	515.05
1-39	H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(=O)-NH C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	3.835(B)	529.00
1-40	H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(=O)-N(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3.913(B)	529.00
1-41	H	H	C(=O)-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	3.669(B)	487.05
1-42	H	H	C(=O)-NHCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	3.660(B)	501.05
1-43	H	H	C(=O)-NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3.674(B)	541.00
1-44	H	H	C(=O)-NHCH(CH <sub>3</sub> )ciclopropilo	3.779(B)	527.00
1-45	H	H	C(=O)-NHCH <sub>2</sub> ciclopropilo	3.674(B)	513.05
1-46	H	H	CH <sub>2</sub> C(=O)-N(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	4.618	529.15
1-47	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4.155	493.95
1-48	=CHN-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>		C(=O)-OCH <sub>3</sub>	3.856	583.05
1-49	=N-OCH <sub>2</sub> -ciclopropilo		C(=O)-OCH <sub>3</sub>	4.147(B)	557.0
1-50	H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(=O)-NHCH <sub>3</sub>	3.606	501.05
1-51	H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(=O)-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	3.784	515.05
1-52	H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(=O)-NHCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	3.775	527.05
1-53	H	H	CH <sub>2</sub> C(=O)-NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4.459	555.05
1-54	H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(=O)-NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3.895(B)	569.0
1-55	H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(=O)-N(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	3.999	543.05
1-56	H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(=O)-NHCH <sub>2</sub> C≡CH	3.728	525.05
1-57	H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(=O)-NHCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	3.695	529.15
1-58	=CHN(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		C(=O)-NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4.043(B)	596.0
1-59	=CHN(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		C(=O)-OCH <sub>3</sub>	3.575(B)	529.05
1-60	H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(=O)-NHCH <sub>2</sub> ciclopropilo	3.838	541.05
1-61	H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(=O)-OCH <sub>3</sub>	4.072(B)	502.00
1-62	H	H	CH <sub>2</sub> C(=O)-NHCH <sub>2</sub> C≡CH	3.723	511.05

**C.2 Compuestos de ejemplo 2**

Los compuestos de ejemplo 2-1 corresponden al compuesto de la fórmula C.2:



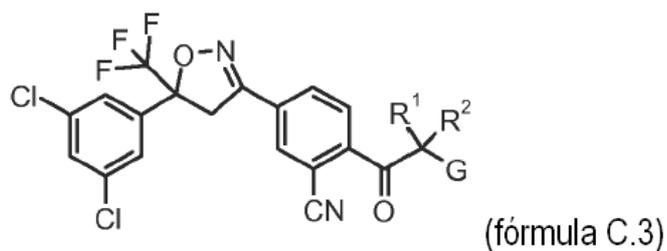
en donde  $R^1$ ,  $R^2$  y G de cada compuesto de ejemplo se define en la Tabla C.2 a continuación.

Tabla C.2

Compuesto de Ej.	$R^1$	$R^2$	G
2-1	H	H	H

### 5 C.3 Compuestos de ejemplo 3

Los compuestos de ejemplo 3-1 corresponden al compuesto de la fórmula C.3:



en donde  $R^1$ ,  $R^2$  y G de cada compuesto de ejemplo se define en la tabla C.3 a continuación.

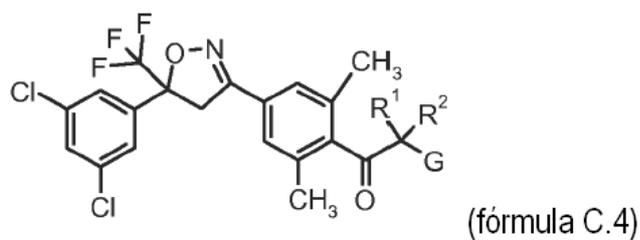
Tabla C.3

Compuesto de Ej.	$R^1$	$R^2$	G
3-1	H	H	H

10

### C.4 Compuestos de ejemplo 4

Los compuestos de ejemplo 4-1 corresponden al compuesto de la fórmula C.4:



en donde  $R^1$ ,  $R^2$  y G de cada compuesto de ejemplo se define en la tabla C.4 a continuación.

15

Tabla C.4

Compuesto de Ej.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G	HPLC-MS: R <sub>t</sub> (min) y [M + H]	
4-1	H	H	H	4.758	430.05

### S. Ejemplos de síntesis

5 S.1 Síntesis de 1-{4-[5-(3,5-Dicloro-fenil)-5-trifluorometil-4,5-dihidro-isoxazol-3-il]-2-metil-fenil}-etanona (Compuesto 1-1 de la tabla C.1)

10 Una mezcla de 3-(4-Bromo-3-metil-fenil)-5-(3,5-dicloro-fenil)-5-trifluorometil-4,5-dihidro-isoxazol (500 mg), 1,4-butandiol-monovinil éter (385 mg), 1,3-bis(difenilfosfina)propano (dppp, 9 mg), paladio sobre carbón (10%, 23 mg), dicilohexilmetilamina (259 mg) y n-butanol (3 mL) se agitaron bajo una atmósfera de nitrógeno a reflujo durante la noche. Después de enfriar, se agregaron acetato de etilo (30 mL) y ácido clorhídrico acuoso (1 M, 20 mL) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 1 h. Después de la filtración, las capas se separaron, la capa orgánica se extrajo con HCl 1 M, se secó (Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>) y se evaporó en vacío. La purificación del residuo sobre sílica gel produjo el compuesto del título (270 mg, 60%).

Caracterización por HPLC-MS: 4.224 min, M = 415.60

Caracterización por <sup>1</sup>H-NMR (500 MHz, CDCl<sub>3</sub>):

15 δ [delta] = 2.53 (s, 3H), 2.60 (s, 3H), 3.71 (d, 1 H), 4.11 (d, 1 H), 7.42 (s, 1 H), 7.52 (s, 3H), 7.58 (m, 1 H), 7.73 (d, 1 H) ppm.

S.2 Síntesis de 1-{4-[5-(3,5-Dicloro-fenil)-5-trifluorometil-4,5-dihidro-isoxazol-3-il]-2-metil-fenil}-3-metilbutan- 1-ona (Compuesto 1-2 de la tabla C.1)

Etapa 1: Síntesis de 1-{4-[5-(3,5-Dicloro-fenil)-5-trifluorometil-4,5-dihidro-soxazol-3-il]-2-metil-fenil}-3-metil- butan-1-ol

20 A una solución de 3-(4-Bromo-3-metil-fenil)-5-(3,5-dicloro-fenil)-5-trifluorometil-4,5-dihidro-isoxazol (2.00 g) en éter (80 mL) se agregó tert.-butil litio (1.6 M en pentano, 5.8 mL) a -78 °C. Después de 10 min, se agregó una solución de MgBr<sub>2</sub> (0.15 M en THF, 58.9 mL) a esta temperatura. Después de otros 15 minutos a -78 °C, se agregó valeraldehído (0.52 mL) y se dejó durante 1 h a esta temperatura, antes de que la mezcla se dejara calentar hasta temperatura ambiente. Se agregó una solución saturada de NH<sub>4</sub>Cl y la mezcla se extrajo con MTBE. La capa orgánica se separó y se secó (Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>). La evaporación en vacío produjo un residuo que se purificó por cromatografía instantánea sobre sílica gel para producir el compuesto del título (1.02 g, 50%).

25 La capa orgánica se separó y se secó (Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>). La evaporación en vacío produjo un residuo que se purificó por cromatografía instantánea sobre sílica gel para producir el compuesto del título (1.02 g, 50%).

Caracterización por HPLC-MS: 3.935 min, M = 460.00

Etapa 2: Síntesis de 1-{4-[5-(3,5-Dicloro-fenil)-5-trifluorometil-4,5-dihidro-isoxazol-3-il]-2-metil-fenil}-3-metil- butan-1-ona

30 A una solución de 1-{4-[5-(3,5-Dicloro-fenil)-5-trifluorometil-4,5-dihidro-soxazol-3-il]-2-metil-fenil}-3- metil-butan-1-ol (esto es el producto de la Etapa 1, 1.20 g) en diclorometano (50 mL) se agregó reactivo de Dess-Martin ([87413-09-0], 1.216 g) en pequeñas porciones. Después de 30 min a temperatura ambiente, se agregó solución acuosa de NaHCO<sub>3</sub>, seguido por solución de Na<sub>2</sub>S<sub>2</sub>O<sub>4</sub>. La capa orgánica se separó y se lavó con agua y se secó (Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>). La evaporación en vacío produjo un residuo que se purificó por cromatografía instantánea sobre sílica gel para producir el compuesto del título (1.05 g, 88%).

35 el compuesto del título (1.05 g, 88%).

Caracterización por HPLC-MS: 4.220 min, M = 458.05 B.

### B. Ejemplos biológicos

La actividad de los compuestos de fórmula (I-5) de la presente invención podría ser demostrada y evaluada en pruebas biológicas descritas en lo que sigue.

40 Si no se especifica otra cosa, las soluciones de prueba se prepararon como sigue:

El compuesto activo se disolvió a la concentración deseada en una mezcla de 1:1 (vol:vol) de agua destilada:acetona. La solución de prueba se preparó en el día de uso y en general a concentraciones de ppm (peso/vol).

B.1 Polilla dorso de diamante (*plutella xylostella*)

Se sumergieron hojas de col China en solución de prueba y se secaron al aire. Las hojas tratadas fueron colocadas en platos de Petri forrados con papel de filtro húmedo. La mortalidad se registró 24, 72, y 120 horas después del tratamiento.

- 5 En esta prueba, los compuestos 1-1 1-2, 1-16, 1-22, 1-23, 1-27, 1-28, 1-29, 1-31, 1-32, 1-35, 1-36, 1-38, 1-39, 1-40, 1-41, 1-42, 1-43, 1-44, 1-45, 1-46, 1-47, 1-48, 1-50, 1-51, 1-52, 1-53, 1-54, 1-55, 1-56, 1-57, 1-58 y 1-60, respectivamente, a 300 ppm mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los controles no tratados.

B.2 Mosca mediterránea de la fruta (*Ceratitis capitata*)

- 10 Para evaluar el control de la mosca mediterránea de la fruta (*Ceratitis capitata*) la unidad de prueba consistió en placas de microtitulación que contenía una dieta de insectos y 50-80 huevos de *C. capitata*. Los compuestos se formularon utilizando una solución que contenía 75% v/v de agua y 25% v/v de DMSO. Se asperjaron diferentes concentraciones de compuestos formulados sobre la dieta de insectos en 5 ml, usando un micro atomizador hecho a la medida, en dos repeticiones. Después de la aplicación, las placas de microtitulación se incubaron a
- 15 aproximadamente  $28 \pm 1$  °C y humedad relativa de aproximadamente  $80 \pm 5\%$  durante 5 días. La mortalidad de los huevos y las larvas fue entonces establecida visualmente.

En esta prueba, los compuestos 1-1, 1-2, 1-3, 1-6, 1-18, 1-23, 1-24, 1-26, 1-29, 1-31, 1-32, 1-38, 1-39, 1-40, 1-45, 1-46, 1-48, 1-50, 1-51, 1-52, 1-53, 1-54, 1-55, 1-56, 1-57, 1-58 y 1-60 respectivamente, a 2500 ppm mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los controles no tratados.

- 20 B.3 Mosca blanca de las hojas plateadas (*Bemisia argentifolii*)

Los compuestos activos se formularon en ciclohexanona como una solución de 10,000 ppm suministrado en tubos. Los tubos se insertaron en un aspersor electrostático automatizado equipado con una boquilla atomizadora y sirvieron como soluciones de reserva para las que se hicieron diluciones más bajas en 50% de acetona:50% de agua (v/v). Se incluyó un agente surfactante no iónico (Kinetic®) en la solución a un volumen de 0.01% (v/v).

- 25 Las plantas de algodón en la etapa de cotiledón (una planta por maceta) se asperjaron mediante un aspersor de plantas electrostático automatizado equipado con una boquilla de pulverización de atomización. Las plantas fueron secadas en la campana aspersora de humos y luego se retiraron del aspersor. Cada maceta se colocó en una taza de plástico y se introdujeron aproximadamente 10 a 12 adultos de mosca blanca (aproximadamente 3-5 días de edad). Los insectos se recolectaron utilizando un aspirador y un tubo no tóxico de Tygon® conectado a una punta de pipeta de barrera. La punta, que contenía los insectos recolectados, se insertó entonces suavemente en el suelo que
- 30 contenía la planta tratada, permitiendo que los insectos se arrastraran fuera de la punta para alcanzar el follaje para alimentarse. Las tazas estaban cubiertas con una tapa de malla reutilizable. Las plantas de prueba se mantuvieron en una cámara de crecimiento a aproximadamente 25 °C y humedad relativa de aproximadamente 20-40% durante 3 días, evitando la exposición directa a la luz fluorescente (fotoperiodo de 24 horas) para prevenir la captura de calor
- 35 dentro de la taza. Se estableció la mortalidad 3 días después del tratamiento, en comparación con las plantas de control no tratadas.

En esta prueba, los compuestos 1-1,1-2, 1-23, 1-24, 1-26, 1-27, 1-29, 1-31, 1-36, 1-38, 1-39, 1-40, 1-41, 1-42, 1-44, 1-46, 1-50, 1-51, 1-52, 1-53,1-54, 1-55, 1-56 y 1-57, respectivamente, a 300 ppm mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con los controles no tratados.

- 40 B.4 Gusano soldado meridional (*Spodoptera eridania*)

Los compuestos activos se formularon en ciclohexanona como una solución de 10,000 ppm suministrada en tubos. Los tubos se insertaron en un aspersor electrostático automatizado equipado con una boquilla atomizadora y sirvieron como soluciones de reserva para las que se hicieron diluciones más bajas en 50% de acetona:50% de agua (v/v). Se incluyó un agente surfactante no iónico (Kinetic®) en la solución a un volumen de 0.01% (v/v).

- 45 Se cultivaron plantas de frijol Lima (variedad Sieva) a 2 plantas por maceta y se seleccionaron para el tratamiento en la primera etapa de floración. Las soluciones de prueba se asperjaron sobre el follaje mediante un aspersor de plantas electrostático automatizado equipado con una boquilla de pulverización de atomización. Las plantas fueron secadas en la campana aspersora de humos y luego se retiraron del aspersor. Cada maceta se colocó en bolsas de plástico con un cierre de cremallera. Se colocaron aproximadamente de 10 a 11 larvas de gusano soldado en la
- 50 bolsa y las bolsas se cerraron con cremallera. Las plantas de prueba se mantuvieron en una cámara de crecimiento a aproximadamente 25 °C y humedad relativa de aproximadamente 20-40% durante 4 días, evitando la exposición directa a la luz fluorescente (fotoperiodo de 24 horas) para evitar la captura de calor dentro de las bolsas. La mortalidad y la alimentación reducida se establecieron 4 días después del tratamiento, en comparación con las plantas de control no tratadas.

En esta prueba, los compuestos 1-1, 1-2, 1-5, 1-16, 1-22, 1-23, 1-24, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-31, 1-32, 1-35, 1-36, 1-38, 1-39, 1-40, 1-41, 1-42, 1-43, 1-44, 1-45, 1-46, 1-47, 1-50, 1-51, 1-52, 1-53, 1-54, 1-55, 1-56, 1-57, 1-58 y 1-60, respectivamente, a 300 ppm mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con controles no tratados.

#### B.5 Áfido del algarrobo (*Megoura viciae*)

- 5 Para evaluar el control del áfido del algarrobo (*Megoura viciae*) a través de medios de contacto o sistémicos la unidad de prueba consistió de placas de microtitulación de 24 pozos que contenían discos anchos de hojas de frijol

Los compuestos se formularon utilizando una solución que contenía 75% v/v de agua y 25% v/v de DMSO. Se asperjaron diferentes concentraciones de compuestos formulados sobre los discos de hoja a 2.5 µl, utilizando un microatomizador hecho a la medida, en dos repeticiones.

- 10 Después de la aplicación, los discos de hoja se secaron al aire y 5-8 áfidos adultos colocados en los discos de hojas dentro de los pozos de la placa de microtitulación. Los áfidos se dejaron para chupar los discos de hoja tratados y se incubaron a aproximadamente 23 ± 1 °C y aproximadamente 50 ± 5% de humedad relativa durante 5 días. La mortalidad y la fecundidad del áfido fueron entonces establecidas visualmente.

- 15 En esta prueba, los compuestos 1-1, 1-2, 1-23, 1-24, 1-26, 1-29, 1-31, 1-32, 1-38, 1-39, 1-40, 1-45, 1-46, 1-50, 1-51, 1-52, 1-53, 1-54, 1-55, 1-56, 1-57 y 1-60 respectivamente, a 2500 ppm mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con controles no tratados.

#### B.6 Gusano del cogollo del tabaco (*Heliothis virescens*) I

- 20 Los compuestos activos fueron formulados en ciclohexanona como una solución de 10,000 ppm suministrado en tubos. Los tubos se insertaron en un pulverizador electrostático automatizado equipado con una boquilla atomizadora y sirvieron como soluciones de reserva para las que se hicieron diluciones más bajas en 50% de acetona:50% de agua (v/v). Se incluyó un agente surfactante no iónico (Kinetic®) en la solución a un volumen de 0.01% (v/v).

- 25 Se cultivaron plantas de algodón a 2 plantas por maceta y se seleccionaron para el tratamiento en la etapa de cotiledón. Las soluciones de prueba se asperjaron sobre el follaje mediante un aspersor de plantas electrostático automatizado equipado con una boquilla de pulverización de atomización. Las plantas fueron secadas en la campana aspersora de humos y luego se retiraron del aspersor. Cada maceta se colocó en bolsas plásticas perforadas, con un cierre de cremallera. Se colocaron aproximadamente de 10 a 11 larvas de gusano cogollero en la bolsa y las bolsas se cerraron con cremallera. Las plantas de prueba se mantuvieron en una cámara de crecimiento a aproximadamente 25 °C y humedad relativa de aproximadamente 20-40% durante 4 días, evitando la exposición directa a la luz fluorescente (fotoperiodo de 24 horas) para prevenir la captura de calor dentro de las bolsas. La mortalidad y la alimentación reducida se establecieron 4 días después del tratamiento, en comparación con las plantas de control no tratadas.

- 35 En esta prueba, los compuestos 1-1, 1-2, 1-3, 1-23, 1-24, 1-26, 1-29, 1-31, 1-32, 1-38, 1-39, 1-40, 1-45, 1-46, 1-50, 1-51, 1-52, 1-53, 1-54, 1-55, 1-56, 1-58, 1-60 y 1-61 respectivamente, a 2500 ppm mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con controles no tratados.

#### B.7 Gorgojo (*Anthonomus grandis*)

Para evaluar el control del gorgojo (*Anthonomus grandis*) la unidad de prueba consistió en placas de microtitulación de 24 pozos que contenían una dieta de insectos y 20-30 huevos de *A. grandis*.

- 40 Los compuestos se formularon utilizando una solución que contenía 75% v/v de agua y 25% v/v de DMSO. Se asperjaron diferentes concentraciones de compuestos formulados sobre la dieta de insectos en 20 ml, utilizando un microatomizador hecho a la medida, en dos repeticiones.

Después de la aplicación, las placas de microtitulación se incubaron a aproximadamente 23 ± 1 °C y humedad relativa de aproximadamente 50 ± 5% durante 5 días. La mortalidad de los huevos y las larvas se establecieron entonces visualmente.

- 45 En esta prueba, los compuestos 1-1, 1-3, 1-23, 1-24, 1-26, 1-29, 1-31, 1-32, 1-38, 1-39, 1-40, 1-45, 1-46, 1-50, 1-51, 1-52, 1-53, 1-54, 1-55, 1-56, 1-57, 1-58, 1-60 y 1-61 respectivamente, a 2500 ppm mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con controles no tratados.

#### B.8 Áfido verde del melocotón (*Myzus Persicae*)

## ES 2 546 417 T3

Para evaluar el control de áfido verde del melocotón (*Myzus persicae*) a través de medios sistémicos la unidad de prueba consistió en placas de microtitulación de 96 pozos que contenían dieta artificial líquida bajo una membrana artificial.

5 Los compuestos se formularon utilizando una solución que contenía 75% v/v de agua y 25% v/v de DMSO. Se transfirieron con pipeta diferentes concentraciones de compuestos formulados en la dieta del áfido, usando una pipeta hecha a la medida, en dos repeticiones.

10 Después de la aplicación, se colocaron 5-8 áfidos adultos en la membrana artificial dentro de los pozos de la placa de microtitulación. Se dejó que los áfidos chuparan de la dieta de áfido tratada y se incubaron a aproximadamente  $23 \pm 1$  °C y humedad relativa de aproximadamente  $50 \pm 5\%$  durante 3 días. La mortalidad y la fecundidad del áfido se establecieron entonces visualmente.

En esta prueba, los compuestos 1-1, 1-2, 1-3, 1-18, 1-23, 1-24, 1-26, 1-29, 1-31, 1-32, 1-38, 1-39, 1-40, 1-45, 1-46, 1-50, 1-51, 1-52, 1-53, 1-54, 1-55, 1-56, 1-57, 1-58, y 1-60 respectivamente, a 2500 ppm mostraron una mortalidad de al menos 75% en comparación con controles no tratados.

15 La actividad de los compuestos de fórmula I también puede ser evaluada mediante la aplicación de otros ensayos biológicos, tales como:

### HB.1 Áfido del algodón (*Aphis gossypii*)

20 Los compuestos activos se formulan en ciclohexanona como una solución de 10,000 ppm suministrado en tubos. Los tubos se insertan en un aspersor electrostático automatizado equipado con una boquilla atomizadora y que sirven como soluciones de reserva para las que se hacen diluciones más bajas en 50% de acetona:50% de agua (v/v). En la solución está incluido un agente surfactante no iónico (Kinetic®) a un volumen de 0.01% (v/v).

25 Las plantas de algodón en la etapa de cotiledón se infestan con áfidos antes del tratamiento colocando una hoja densamente infestada de la colonia principal de áfidos en la parte superior de cada cotiledón. Se les permite a los áfidos transferirse toda la noche para lograr una infestación de 80 a 100 áfidos por planta y se retira la hoja anfitriona. Las plantas infestadas se asperjaron entonces mediante un aspersor de plantas electrostático automatizado equipado con una boquilla de pulverización de atomización. Las plantas fueron secadas en la campana aspersora de humos, retiradas del aspersor, y luego mantenidas en una habitación de crecimiento bajo iluminación fluorescente en un fotoperiodo de 24-hr a 25 °C y la humedad relativa de 20-40%. La mortalidad de los áfidos sobre las plantas tratadas, con relación a la mortalidad en las plantas de control no tratadas, es determinada después de 5 días.

### 30 HB.2 Áfido del caupí (*Aphis craccivora*)

Plantas caupí en maceta colonizadas con aproximadamente 100 a 150 áfidos de diversas etapas son asperjadas después de que se ha registrado la población de la plaga. La reducción de la población es establecida después de 24, 72 y 120 horas.

### HB.3 Tisanópteros de la orquídea (*Dichromothrips corbettii*)

35 *Dichromothrips corbettii* adultos utilizados para el bioensayo se obtienen a partir de una colonia mantenida continuamente bajo condiciones de laboratorio. Para propósitos de prueba, el compuesto de prueba se diluye a una concentración de 300 ppm (compuesto en peso:vol diluyente) en una mezcla 1:1 de acetona:agua (vol:vol), más 0.01% vol/vol de surfactante Kinetic®.

40 La potencia de los tisanópteros de cada compuesto se evaluó mediante el uso de una técnica de inmersión floral. Placas de petri de plástico se utilizan como zonas de prueba. Todos los pétalos de flores de orquídeas intactas, individuales se sumergen en solución de tratamiento y se dejan secar. Las flores tratadas se colocan en placas de Petri individuales junto con 10 - 15 tisanópteros adultos. Las placas de Petri se cubren entonces con tapas. Todas las zonas de prueba se mantienen bajo luz continua y a una temperatura de aproximadamente 28 °C durante la duración del ensayo. Después de 4 días, se cuentan el número de tisanópteros vivos en cada flor, y a lo largo de las paredes internas de cada placa de Petri. El nivel de mortalidad de los tisanópteros se extrapola de los números de tisanópteros de pre-tratamiento.

### 45 HB.4 Garrapata araña roja (*Tetranychus kanzawai*)

El compuesto activo se disuelve a la concentración deseada en una mezcla de 1:1 (v/v) de agua destilada:acetona. Se agrega un agente surfactante (Alkamuls® EL 620) a una tasa de 0.1% (v/v).

50 Frijol caupí en macetas de 7-10 días de edad se limpia con agua del grifo y se asperjan con 5 ml de la solución de prueba utilizando aire impulsado con atomizador de mano. Se deja que las plantas tratadas se sequen al aire y

## ES 2 546 417 T3

después son inoculadas con 20 o más ácaros por el recorte de una sección de la hoja de yuca con población de ácaros conocida. Se deja que las plantas tratadas se sequen al aire y después inoculadas con 20 o más ácaros por el recorte de una sección de la hoja de la yuca con población de ácaros conocida. Las plantas tratadas se colocan dentro de una sala de conservación a aproximadamente 25-27 °C y 50-60% de humedad relativa.

- 5 La mortalidad se determina contando los ácaros vivos 72 HAT. El porcentaje de mortalidad se estableció después de 72 h.

### HB.5 Tisanóptero occidental de las flores (*Frankliniella occidentalis*)

- 10 Diluciones seriadas de cada grado técnico son hechas en acetona pura. Se depositaron 0.5 ml de la solución de tratamiento en el fondo del vial de vidrio (vial de centelleo). La tapa se enrosca de nuevo en el vial y se invierte durante aproximadamente cinco segundos. La tapa se retira subsecuentemente y el vial es puesto sobre su lado y se rueda constantemente, sobre un rodillo para perros calientes, hasta que toda la acetona se ha proyectado fuera y la superficie interior del vial está seca. También se sumergen discos de hojas de algodón también se sumergen simultáneamente en las soluciones de tratamiento y se dejan secar. Después de que los viales se secan, los discos de las hojas se colocan en los viales para servir como fuente de alimento/agua para los tisanópteros. Cada tratamiento se repite 5 veces. Los tisanópteros occidentales de las flores se aspiran dentro de los viales, aproximadamente 5 larvas o adultos/vial. Después de la aplicación del tratamiento los viales se llevan a una sala de conservación bajo luz fluorescente y a 26 °C constantes. La mortalidad de los tisanópteros es establecida en 2 DAT (días después del tratamiento), contando todos los tisanópteros tanto los muertos como los vivos.

- 20 Si no se especifica otra cosa en estas pruebas, las soluciones de prueba se preparan como sigue: El compuesto activo se disuelve a la concentración deseada en una mezcla de 1:1 (vol:vol) de agua destilada:acetona. La solución de prueba se prepara en el día de uso y en general a concentraciones de ppm (peso/vol).

### BA. Salud animal

Condiciones generales de prueba de los ensayos por contacto en vial de vidrio de la salud animal

- 25 Si no se especifica otra cosa las pruebas son usualmente llevadas a cabo como ensayos por contacto en vial de vidrio. Se utilizan viales de vidrio (viales de centelleo de 20 ml). Las soluciones de tratamiento se mezclan con los productos químicos de grado técnico diluidos en acetona. Las soluciones de tratamiento necesarias para los ensayos incluyen generalmente 1 y 10 ppm (0.01 y 0.1 µg/cm<sup>2</sup>, respectivamente), pero opcionalmente también 100 y/o 1000 ppm para viales de primer nivel. Como estándar comercial, se procesa alfacipermetrina, a 1 ppm. Como control de solvente, la acetona se usa para el ensayo. La solución de tratamiento se traslada con pipeta en la parte inferior de cada vial. Cada vial es puesto sobre su lado y colocado sobre un rodillo para perros calientes de grado comercial sin la aplicación de calor. Se permite que los viales destapados rueden para permitir que el tratamiento con acetona se ventile. Después del secado, los viales se colocan en las cajas compartimentadas para envío de viales. La estación de trabajo se prepara enfriando la mesa y los platos Petri de plástico con la pared interior recubierta con Fluon. También se prepara un bote de peso de 10% de agua de azúcar algodón saturado con pellas dentales. Las plagas animales son recolectadas en un tubo con una aspiradora de insectos recargable. El tubo de plagas animales se coloca en un refrigerador de laboratorio hasta que las plagas animales están incapacitadas. Las plagas animales se vacían en placas de Petri refrigeradas. Una pequeña pella dental de algodón se instila en agua o en agua con 10% en peso de azúcar, mientras que el exceso de solución se exprime suavemente. La pella dental de algodón se coloca en la parte inferior de cada vial. Para la prueba las plagas animales se agregan a cada vial y luego la tapa se pone flojamente en el vial para permitir la ventilación. Los viales de prueba se mantienen a temperatura ambiente en cajas compartimentadas. En general, las plagas animales se observan en cuanto a incapacitación al menos en 4, 24, y 48 horas después de la infestación, o para un período más largo, si se requiere. La mortalidad se define como un insecto incapaz de movimiento coordinado cuando es agitado.

### BA.1 Hormigas acróbatas trabajadoras (*Crematogaster* sp.)

- 45 Las soluciones de tratamiento se mezclan con el compuesto de ensayo diluido en acetona en concentraciones de 10 y 100 ppm. Las hormigas recolectadas para la colocación en los viales típicamente no se enfrían antes de que infesten los viales. Los datos se recolectan en los días 1, 2, y 4 después de la infestación.

### BA.2 Adultos de garrapatas marrones de perro (*Rhipicephalus sanguineus*)

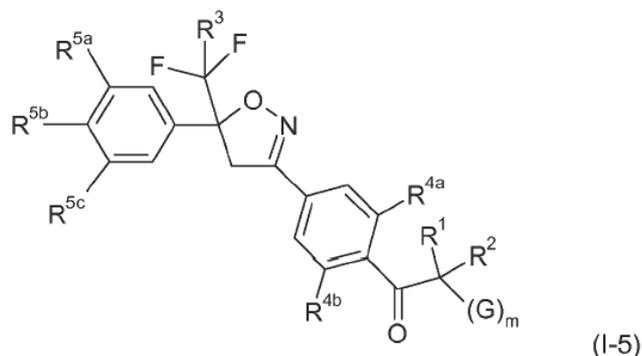
- 50 Las soluciones de tratamiento se mezclan con el compuesto de prueba diluido en acetona en concentraciones de 10 y 100 ppm. No se proveen fuentes de comida ni agua en los viales. Los datos se recolectan a 5 días después de la infestación. Las garrapatas son evaluadas haciendo rodar los viales sobre un rodillo precalentado para perros calientes. La actividad de las garrapatas es estimulada por dentro aproximadamente 1-2 minutos.

### BA.3 Adultos de pulgas de gato (*Ctenocephalides felis*)

- Las soluciones de tratamiento se mezclan con el compuesto de prueba diluido en acetona en concentraciones de 10 y 100 ppm. El estándar (alfacipermetrina) se utiliza a 10 ppm. Los adultos de pulgas de gato son incapacitadas mediante la colocación de los viales de envío de las pulgas en un congelador de laboratorio (-20 °C) durante aproximadamente 3 minutos. Tras retirarlas del congelador, las pulgas se vacían entonces en una placa de Petri enfriada y recubierta. No se proveen fuentes de comida ni agua en los viales. Las pulgas se observan en cuanto a incapacitación a los 1, 2, y 3 días después de la infestación.
- 5
- BA.4 Adultos de cucaracha alemana (*Blattella germanica*)
- Las soluciones de tratamiento se mezclan con el compuesto de prueba diluido en acetona en concentraciones de 10 y 100 ppm. Las cucarachas son incapacitadas enfriándolas en un Fluon o bandeja de plástico tratada con vaselina de petróleo/aceite mineral que se coloca en un lecho de hielo establecido en una gran tina de plástico. Entonces, las cucarachas se vacían en placas de Petri enfriadas. La pequeña pella dental de algodón instilada en agua se agrega en la parte inferior de cada vial. Viales de las pruebas se mantienen a temperatura ambiente en cajas compartimentadas, mientras que las cajas compartimentadas se almacena con los viales en su lado. Los datos son recolectados a las 4 horas, y 1, 2 días después de la infestación.
- 10
- 15 BA.5 Adultos de mosca doméstica (*Musca domestica*)
- Las soluciones de tratamiento se mezclan con el compuesto de prueba diluido en acetona en concentraciones de 1 y 10 ppm. La pequeña pella de algodón dental agregada es instilada 10% de agua de azúcar. Las moscas se observan en cuanto a incapacitación a las 4, 24, y 48 horas después de la infestación.
- BA.6 adultos de mosquitos de la fiebre amarilla (*Aedes aegypti*)
- 20 BA.6.a Ensayo por contacto en vial de vidrio (condiciones de prueba como se describieron anteriormente)
- Las soluciones de tratamiento se mezclan con el compuesto de prueba diluido en acetona en concentraciones de 1 y 10 ppm. Los mosquitos son incapacitados mediante la colocación de toda la jaula en un refrigerador a ras de suelo o en el refrigerador de laboratorio durante 5-10 minutos. La placa Petri de plástico refrigerada con la pared interior recubierta con Fluon y la parte inferior forrada con un pedazo de toalla de papel se colocan dentro de la jaula. Los mosquitos se recolectan con un aspirador de boca y se vacían en la placa de Petri, reemplazando rápidamente la tapa sobre la placa. La placa se retira de la jaula y la pequeña pella dental de algodón instilada en 10% de agua con azúcar se agrega en la parte inferior de cada vial y luego se coloca sobre la mesa de enfriamiento. Las moscas se observan en cuanto a incapacitación a los 4, 24, y 48 horas después de la infestación.
- 25
- BA.6.b Ensayo de tratamiento de agua de mosquitos larval
- 30 El ensayo se realiza en placas de poliestireno de 6 pozos usando una placa por tasa de tratamiento. Las soluciones de reserva se preparan en 100 y 1000 ppm. Las tasas de pantalla son en 1 y 10 ppm. Se agrega agua destilada a cada pozo, los pozos de control se tratan con acetona. Se utiliza Temephos (técnica Abate) como estándar a 0.1 ppm. Se agregan a cada pozo diez larvas de mosquito de la fiebre amarilla de tercer estadio tardío (*Aedes aegypti*) en agua. Una gota de solución de polvo de hígado (6 g en 100 ml de agua destilada) se agrega a cada pozo como fuente de alimento diario. Las placas son mantenidas a 22-25 °C y 25-50% de HR (humedad relativa) y se observaron diariamente para larvas y pupas muertas en 1, 2, 3, y 5 días después del tratamiento. Las larvas y todas las pupas muertas se retiran diariamente. La mortalidad es definida define como un insecto incapaz de movimiento coordinado cuando se agita.
- 35

## REIVINDICACIONES

1. Compuestos de isoxazolina cetónica sustituidos de la fórmula general (I-5)



en donde

5 m es 0 o 1;

G es seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, nitro, ciano, -SCN, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalcoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalquiltio, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-cicloalquilo, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-halocicloalquilo, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alquenilo, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-haloalquenilo, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alquinilo, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> haloalquinilo, en donde los átomos de carbono de los radicales alifáticos y ciclo-alifáticos antes mencionados pueden ser opcionalmente sustituidos con uno o más R<sup>6</sup>, los cuales se seleccionan independientemente uno de otro;

10 NR<sup>9a</sup>R<sup>9b</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>7</sup>, -S(O)<sub>n</sub>NR<sup>9a</sup>R<sup>9b</sup>, C(=O)R<sup>6</sup>, C(=O)OR<sup>7</sup>, C(=O)NR<sup>9a</sup>R<sup>9b</sup>, C(=S)R<sup>6</sup>, C(=S)SR<sup>7</sup>, C(=S)NR<sup>9a</sup>R<sup>9b</sup>, C(=NR<sup>8</sup>)R<sup>6</sup>;

15 fenilo, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes R<sup>10</sup>, los cuales se seleccionan independientemente uno de otro, un anillo heterocíclico aromático de 3-, 4-, 5-, 6- o 7- miembros saturado, parcialmente saturado o insaturado que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre, opcionalmente sustituidos con k sustituyentes R<sup>10</sup>, seleccionados independientemente uno de otro, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden ser opcionalmente oxidados;

20 R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> son seleccionados independientemente uno de otro del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno, ciano, azido, nitro, -SCN, SF<sub>5</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalcoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilsulfinilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilsulfonilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalquiltio, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-cicloalquilo, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-halocicloalquilo, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alquenilo, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-haloalquenilo, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alquinilo, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> haloalquinilo, en donde los átomos de carbono de los radicales alifáticos y ciclo-alifáticos antes mencionados pueden ser opcionalmente sustituidos con uno o más R<sup>6</sup>, los cuales se seleccionan independientemente uno de otro; Si(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>R<sup>12</sup>, OR<sup>7</sup>, OSO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>7</sup>, S(O)<sub>n</sub>NR<sup>9a</sup>R<sup>9b</sup>, NR<sup>9a</sup>R<sup>9b</sup>, C(=O)NR<sup>9a</sup>R<sup>9b</sup>, C(=S)NR<sup>9a</sup>R<sup>9b</sup>, C(=O)OR<sup>7</sup>,

25 fenilo, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes R<sup>10</sup>, los cuales se seleccionan independientemente uno de otro;

30 un anillo heterocíclico aromático de 3-, 4-, 5-, 6- o 7- miembros saturado, parcialmente saturado o insaturado que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre, opcionalmente sustituidos con k sustituyentes R<sup>10</sup>, seleccionados independientemente uno de otro, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden ser opcionalmente oxidados,

o

R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> pueden formar juntos =O, =CR<sup>13</sup>R<sup>14</sup>, =CR<sup>13</sup>NR<sup>17a</sup>R<sup>17b</sup>, =S(O)<sub>n</sub>R<sup>16</sup>, =S(O)<sub>n</sub>NR<sup>17a</sup>R<sup>17b</sup>, =NR<sup>17a</sup>, =NOR<sup>16</sup>, =NNR<sup>17a</sup>;

o

35 R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> pueden formar junto con los átomos de carbono a los cuales R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> están enlazados a un anillo de 3-, 4-, 5-, 6-, 7- u 8- miembros saturado, parcial o completamente insaturado, o carboxílico o heterocíclico aromático que comprende opcionalmente 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre y/o opcionalmente sustituidos con k sustituyentes R<sup>10</sup>, seleccionados independientemente uno de otro, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden ser opcionalmente oxidados;

R<sup>3</sup> es seleccionado del grupo que consiste de halógeno;

R<sup>4a</sup> y R<sup>4b</sup> son seleccionados independientemente uno de otro del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno, ciano, azido, nitro, -SCN, SF<sub>5</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-cicloalquilo, en donde los átomos de carbono de los dos últimos radicales alifáticos y ciclo-alifáticos pueden ser opcionalmente sustituidos con uno o más R<sup>6</sup>, los cuales se seleccionan independientemente uno de otro,

5 OR<sup>7</sup>, -OS(O)<sub>n</sub>R<sup>7</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>7</sup>, NR<sup>9a</sup>R<sup>9b</sup>, N(R<sup>9a</sup>)C(=O)R<sup>6</sup>, CHO, C(=O)R<sup>6</sup>, -C(=O)OR<sup>7</sup>, C(=NR<sup>9a</sup>)R<sup>6</sup>, C(=S)R<sup>6</sup>, fenilo, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de R<sup>10</sup>, los cuales se seleccionan independientemente uno de otro, y

un anillo heterocíclico aromático de 3-, 4-, 5-, 6- o 7- miembros saturado, parcialmente saturado o insaturado;

10 R<sup>5a</sup> y R<sup>5c</sup> son seleccionados independientemente uno de otro del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, SCN, SF<sub>5</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-cicloalquilo, en donde los átomos de carbono de los últimos dos radicales alifáticos y ciclo-alifáticos pueden ser opcionalmente sustituidos con uno o más R<sup>6</sup>, seleccionados independientemente uno de otro, OR<sup>7</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>7</sup>, NR<sup>9a</sup>R<sup>9b</sup>, C(=O)R<sup>6</sup>, -C(=O)OR<sup>7</sup>, C(=NR<sup>8</sup>)R<sup>6</sup>, y C(=S)NR<sup>6</sup>; y

15 R<sup>5b</sup> es seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, -SCN, SF<sub>5</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-cicloalquilo, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alqueno, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alquino, en donde las cadenas alifáticas de los cinco últimos radicales pueden ser opcionalmente sustituidos con uno o más R<sup>6</sup>, seleccionados independientemente uno de otro,

Si(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>R<sup>12</sup>, OR<sup>7</sup>, OS(O)<sub>n</sub>R<sup>7</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>7</sup>, NR<sup>9a</sup>R<sup>9b</sup>, N(R<sup>9a</sup>)C(=O)R<sup>6</sup>, C(=O)R<sup>6</sup>, C(=O)OR<sup>7</sup>, C(=NR<sup>9a</sup>)R<sup>6</sup>, C(=S)NR<sup>6</sup>,

fenilo, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes R<sup>10</sup>, los cuales se seleccionan independientemente uno de otro; y

20 un anillo heterocíclico aromático de 3-, 4-, 5-, 6- o 7- miembros saturado, parcialmente saturado o insaturado que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre, opcionalmente sustituidos con k sustituyentes R<sup>10</sup>, seleccionados independientemente uno de otro, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden ser opcionalmente oxidados;

25 R<sup>6</sup> es seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno, ciano, azido, nitro, -SCN, SF<sub>5</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalcoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilsulfinilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilsulfonilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalquiltio, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-cicloalquilo, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-halocicloalquilo, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alqueno, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-haloalqueno, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alquino, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-haloalquino, Si(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>R<sup>12</sup>, OR<sup>16</sup>, OSO<sub>2</sub>R<sup>16</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>16</sup>, S(O)<sub>n</sub>NR<sup>17a</sup>R<sup>17b</sup>, NR<sup>17a</sup>R<sup>17b</sup>, NR<sup>17a</sup>C(=O)R<sup>16</sup>, C(=O)NR<sup>17a</sup>R<sup>17b</sup>, C(=S)NR<sup>17a</sup>R<sup>17b</sup>, C(=O)OR<sup>16</sup>,

30 fenilo, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes R<sup>18</sup>, los cuales se seleccionan independientemente uno de otro;

un anillo heterocíclico aromático de 3-, 4-, 5-, 6- o 7- miembros saturado, parcialmente saturado o insaturado que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre, opcionalmente sustituidos con k sustituyentes R<sup>18</sup>, seleccionados independientemente uno de otro, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden ser opcionalmente oxidados;

35 o

dos R<sup>6</sup> presentes en un átomo de carbono pueden formar juntos =O, =CR<sup>13</sup>R<sup>14</sup>, =S(O)<sub>n</sub>R<sup>16</sup>, =S(O)<sub>n</sub>NR<sup>17a</sup>R<sup>17b</sup>, =NR<sup>17a</sup>, =NOR<sup>16</sup>, -NNR<sup>17a</sup>R<sup>17b</sup>,

o dos R<sup>6</sup> pueden formar un anillo de 3-, 4-, 5-, 6-, 7- u 8 miembros saturado o parcialmente insaturado carbocíclico o heterocíclico junto con los átomos de carbono a los que los dos R<sup>6</sup> están enlazados a;

40 R<sup>7</sup> es, independientemente uno de otro, seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, ciano, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalcoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilsulfinilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilsulfonilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalquiltio, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-cicloalquilo, C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>-alquilocicloalquilo, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-halocicloalquilo, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alqueno, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-haloalqueno, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alquino, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-haloalquino, -Si(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>R<sup>12</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>16</sup>, -S(O)<sub>n</sub>NR<sup>17a</sup>R<sup>17b</sup>, NR<sup>17a</sup>R<sup>17b</sup>, -N=CR<sup>13</sup>R<sup>14</sup>, -C(=O)R<sup>16</sup>, C(=O)NR<sup>17a</sup>R<sup>17b</sup>, C(=S)NR<sup>17a</sup>R<sup>17b</sup>, C(=O)OR<sup>16</sup>,

45 fenilo, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes R<sup>18</sup>; los cuales se seleccionan independientemente uno de otro; un anillo heterocíclico aromático de 3-, 4-, 5-, 6- o 7- miembros saturado, parcialmente saturado o insaturado que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre, opcionalmente sustituidos con k sustituyentes R<sup>18</sup>, seleccionados independientemente uno de otro, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden ser opcionalmente oxidados;

R<sup>8</sup> es seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, nitro, ciano, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-alquilo, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-cicloalquilo, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-alqueno, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-alquino, en donde los átomos de carbono de los radicales alifáticos y ciclo-alifáticos anteriormente mencionados pueden ser opcionalmente sustituidos con uno o más R<sup>15</sup>, los cuales se seleccionan independientemente uno de otro;

- 5 NR<sup>17a</sup>R<sup>17b</sup>, Si(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>R<sup>12</sup>, OR<sup>16</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>16</sup>, S(O)<sub>n</sub>NR<sup>17a</sup>R<sup>17b</sup>, C(=O)R<sup>15</sup>, -C(=O)OR<sup>16</sup>, C(=O)NR<sup>17a</sup>R<sup>17b</sup>, C(=S)R<sup>15</sup>, C(=S)SR<sup>16</sup>, C(=S)NR<sup>17a</sup>R<sup>17b</sup>, C(=NR<sup>17a</sup>)R<sup>15</sup>;

fenilo, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes R<sup>18</sup>, los cuales se seleccionan independientemente uno de otro;

- 10 un anillo heterocíclico aromático de 3-, 4-, 5-, 6- o 7- miembros saturado, parcialmente saturado o insaturado que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre, opcionalmente sustituidos con k sustituyentes R<sup>18</sup>, seleccionados independientemente uno de otro, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden ser opcionalmente oxidados;

R<sup>9a</sup>, R<sup>9b</sup> son seleccionados independientemente uno de otro del grupo que consiste de hidrógeno, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo, opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes R<sup>10</sup>;

- 15 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalcoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalquiltio, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-cicloalquilo, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-halocicloalquilo, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alqueno, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-haloalqueno, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alquino, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-haloalquino, S(O)<sub>n</sub>R<sup>16</sup>, -S(O)<sub>n</sub>NR<sup>17a</sup>R<sup>17b</sup>, C(=O)R<sup>15</sup>, C(=O)OR<sup>16</sup>, C(=O)NR<sup>17a</sup>R<sup>17b</sup>, C(=S)R<sup>15</sup>, C(=S)SR<sup>16</sup>, C(=S)NR<sup>17a</sup>R<sup>17b</sup>, C(=NR<sup>17a</sup>)R<sup>15</sup>, fenilo, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes R<sup>18</sup>, los cuales se seleccionan independientemente uno de otro;

- 20 un anillo heterocíclico aromático de 3-, 4-, 5-, 6- o 7- miembros saturado, parcialmente saturado o insaturado que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre, opcionalmente sustituidos con k sustituyentes R<sup>18</sup>, seleccionados independientemente uno de otro, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden ser opcionalmente oxidados;

o,

- 25 R<sup>9a</sup> y R<sup>9b</sup> son juntos una cadena a C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub> alquilo y forman un anillo aromático de 3-, 4-, 5-, 6-, 7- u 8- miembros saturado, parcialmente saturado o insaturado junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, en donde la cadena de alquilo puede contener uno o dos heteroátomos seleccionados de oxígeno, azufre o nitrógeno, y pueden ser opcionalmente sustituidos con halógeno, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalcoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalquiltio, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-cicloalquilo, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-halocicloalquilo, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alqueno, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-haloalqueno, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alquino, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-haloalquino;

- 30 fenilo, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes R<sup>18</sup>, los cuales se seleccionan independientemente uno de otro;

- 35 un anillo heterocíclico aromático de 3-, 4-, 5-, 6- o 7- miembros saturado, parcialmente saturado o insaturado que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre, opcionalmente sustituidos con k sustituyentes R<sup>18</sup>, seleccionados independientemente uno de otro, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden ser opcionalmente oxidados;

- 40 R<sup>10</sup> es seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno, ciano, azido, nitro, SCN, SF<sub>5</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-alquilo, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-cicloalquilo, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-alqueno, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-alquino, en donde los átomos de carbono de los radicales alifáticos y ciclo-alifáticos anteriormente mencionados pueden ser opcionalmente sustituidos con uno o más R<sup>15</sup>, los cuales se seleccionan independientemente uno de otro; Si(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>R<sup>12</sup>, OR<sup>16</sup>, OS(O)<sub>n</sub>R<sup>16</sup>, -S(O)<sub>n</sub>R<sup>16</sup>, S(O)<sub>n</sub>NR<sup>17a</sup>R<sup>17b</sup>, NR<sup>17a</sup>R<sup>17b</sup>, C(=O)R<sup>15</sup>, C(=O)OR<sup>16</sup>, -C(=NR<sup>17a</sup>)R<sup>15</sup>, C(=O)NR<sup>17a</sup>R<sup>17b</sup>, C(=S)NR<sup>17a</sup>R<sup>17b</sup>, fenilo, opcionalmente sustituido con halógeno, ciano, nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxi o C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalcoxi;

- 45 un anillo heterocíclico aromático de 3-, 4-, 5-, 6- o 7- miembros saturado, parcialmente saturado o insaturado que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre, opcionalmente sustituidos con k sustituyentes seleccionados independientemente uno de otro de halógeno, ciano, NO<sub>2</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxi o C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalcoxi, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden ser opcionalmente oxidados; o dos R<sup>10</sup> presentes juntos en un átomo de un heterocíclico parcialmente saturado pueden ser =O, =CR<sup>13</sup>R<sup>14</sup>, =S(O)<sub>n</sub>R<sup>16</sup>, =S(O)<sub>n</sub>NR<sup>17a</sup>R<sup>17b</sup>, =NR<sup>17a</sup>, =NOR<sup>16</sup> o =NNR<sup>17a</sup>, o, dos R<sup>10</sup> en átomos de carbono adyacentes pueden ser un puente seleccionado de CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>, CH=CH-CH=CH, N=CH-CH=CH, CH=N-CH=CH, N=CH-N=CH, OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>, OCH=CHCH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>, OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O, OCH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>, CH=CHCH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O, CH=CHO, CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>C(=O)O, C(=O)OCH<sub>2</sub>, O(CH<sub>2</sub>)O, SCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>, SCH=CHCH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>SCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>, SCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>S, SCH<sub>2</sub>SCH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>S, CH=CHS, CH<sub>2</sub>SCH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>C(=S)S, C(=S)SCH<sub>2</sub>, S(CH<sub>2</sub>)S, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NR<sup>9a</sup>, CH<sub>2</sub>CH=N, CH=CH-NR<sup>9a</sup>, OCH=N, SCH=N y forman junto con los átomos de carbono a los cuales los dos R<sup>10</sup> están enlazados a un anillo carboxílico o heterocíclico aromático de 5- miembros o de 6- miembros

parcialmente saturado o insaturado, en donde el anillo puede ser sustituido con uno o dos sustituyentes seleccionados de =O, OH, CH<sub>3</sub>, OCH<sub>3</sub>, halógeno, halometilo o halometoxi;

5 R<sup>11</sup>, R<sup>12</sup> son seleccionados independientemente uno de otro del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcoialquilo, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alqueno, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> haloalqueno, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alquino, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> haloalquino, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> cicloalquilo, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> halocicloalquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcoialquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalcoialquilo,

fenilo, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes R<sup>18</sup>; los cuales se seleccionan independientemente uno de otro;

10 un anillo heterocíclico aromático de 3-, 4-, 5-, 6- a 7- miembros saturado, parcialmente saturado o insaturado que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre, opcionalmente sustituidos con k sustituyentes R<sup>18</sup>, seleccionados independientemente uno de otro, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden ser opcionalmente oxidados;

R<sup>13</sup> R<sup>14</sup> son seleccionados independientemente uno de otro de hidrógeno, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> cicloalquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alcoialquilo, fenilo o bencilo;

15 R<sup>15</sup> es seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno, ciano, azido, nitro, OH, SH, SCN, SF<sub>5</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalcoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilsulfinilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilsulfonilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalquiltio, trimetilsililo, trietilsililo, tertbutildimetilsililo, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquil)amino o di-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquil)amino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalquil)amino o di-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalquil)amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alqueno, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alquino, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-cicloalquilo, en donde los cuatro últimos radicales alifáticos y ciclo-alifáticos mencionados pueden ser no sustituidos, parcial o totalmente halogenados y/o oxigenados y/o pueden llevar 1 o 2 radicales seleccionados de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alcoxi;

20 fenilo, bencilo, piridilo, fenoxi, en donde los cuatro últimos radicales pueden ser no sustituidos, parcial o totalmente halogenados y/o llevar 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados de C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalcoxi, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alcoxi)carbonilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquil)amino o di-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquil)amino;

o

25 dos R<sup>15</sup> presentes en el mismo átomo de carbono pueden ser juntos =O, =CH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquil), =C(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquil)C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo, =N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquil) o =NO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquil);

30 R<sup>16</sup> es seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, ciano, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalcoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilsulfinilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilsulfonilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalquiltio, trimetilsililo, trietilsililo, tertbutildimetilsililo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alqueno, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alquino, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-cicloalquilo, en donde los cuatro últimos radicales mencionados pueden ser no sustituidos, parcial o completamente halogenados y/o oxigenados y/o pueden llevar 1 o 2 radicales seleccionados de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alcoxi ciclopropilo o halociclopropilo;

fenilo, bencilo, piridilo, fenoxi, en donde los cuatro últimos radicales pueden ser no sustituidos, parcial o completamente halogenados y/o llevar 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados de C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalcoxi o (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alcoxi)carbonilo;

35 R<sup>17a</sup>, R<sup>17b</sup> es seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, ciano, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalcoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilsulfinilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilsulfonilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalquiltio, trimetilsililo, trietilsililo, tertbutildimetilsililo,

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alqueno, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alquino, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-cicloalquilo, en donde los últimos cuatro radicales alifáticos y cicloalifáticos mencionados pueden ser no sustituidos, parcial o completamente halogenados y/o oxigenados y/o pueden llevar 1 o 2 radicales seleccionados de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo, ciclopropilo, halociclopropilo o piridilo;

40 fenilo, bencilo, piridilo, fenoxi, en donde los últimos cuatro radicales mencionados pueden ser no sustituidos, parcial o completamente halogenados y/o llevar 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados de C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalcoxi o (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alcoxi)carbonilo;

o,

45 R<sup>17a</sup> y R<sup>17b</sup> pueden ser juntos una cadena de C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alqueno que forman un anillo de 3 a 7 miembros saturado, parcialmente saturado o insaturado, junto con el átomo de nitrógeno R<sup>17a</sup> y R<sup>17b</sup> al que están unidos, en donde la cadena de alqueno puede contener 1 o 2 heteroátomos seleccionados de oxígeno, azufre o nitrógeno, y pueden ser sustituidos opcionalmente con halógeno, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxi o C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalcoxi, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden ser opcionalmente oxidados;

50 R<sup>18</sup> es seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, ciano, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalcoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilsulfinilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilsulfonilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalquiltio, trimetilsililo, trietilsililo, tertbutildimetilsililo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alqueno, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alquino, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-cicloalquilo, en donde los últimos cuatro radicales alifáticos y cicloalifáticos

mencionados pueden ser no sustituidos, parcial o completamente halogenados y/o oxigenados y/o pueden llevar 1 o 2 radicales seleccionados de C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> -alcoxi;

5 fenilo, bencilo, piridilo, fenoxi, en donde los últimos cuatro radicales mencionados pueden ser no sustituidos, parcial o completamente halogenados y/o llevar 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados de C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalcoxi, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alcoxi)carbonilo;

o

dos R<sup>18</sup> juntos presentes en un átomo de un átomo parcialmente saturado pueden ser =O, =N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquil), =NO(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquil), =CH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquil) o =C(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquil)C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl;

o,

10 dos R<sup>18</sup> en dos átomos de carbono adyacentes pueden ser juntos una cadena de C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alquileo, que forman junto con el átomo de carbono al que están unidos a un aromático de 3, 4, 5, 6 ó 7 miembros saturado, parcialmente saturado o no saturado, en donde la cadena de alquileo puede contener 1 o 2 heteroátomos seleccionados de oxígeno, azufre o nitrógeno, y pueden ser sustituidos opcionalmente con halógeno, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alcoxi o C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-haloalcoxi, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden ser opcionalmente oxidados;

n es 0, 1 o 2;

k es un entero seleccionado de 0 a 10;

o un enantiómero, diaestereómero y sal del mismo,

con la condición de que los compuestos de isoxazolina cetónica sustituidos de fórmula (I-5) no representan

20 1-{4-[5-(3,5-Dicloro-fenil)-5-trifluorometil-4,5-dihidro-isoxazol-3-il]-2-metilfenil}-etanona,

1-{4-[5-(3,5-Dicloro-fenil)-5-trifluorometil-4,5-dihidro-isoxazol-3-il]-2-metilfenil}-3-metil-butan-1-ona o

metil éster del ácido {4-[5-(3,5-Dicloro-fenil)-5-trifluorometil-4,5-dihidro-isoxazol-3-il]-2-metilfenil}-oxo-acético.

2. Un compuesto de isoxazolina cetónica de acuerdo con la reivindicación 1, en donde

R<sup>3</sup> es fluoro.

25 3. Un compuesto de isoxazolina cetónica de acuerdo con la reivindicación 1, en donde

R<sup>3</sup> se selecciona del grupo que consiste de cloro, bromo y flúor.

4. Un compuesto de isoxazolina cetónica de acuerdo con la reivindicación 1, en donde

30 R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> son seleccionados independientemente uno de otro del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno, ciano, azido, nitro, -SCN, SF<sub>5</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalcoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilsulfonilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilsulfonilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalquiltio, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-cicloalquilo, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-halocicloalquilo, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alqueno, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-haloalqueno, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alquinilo, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> haloalquinilo, en donde los átomos de carbono de los radicales alifáticos y ciclo-alifáticos anteriormente mencionados pueden ser opcionalmente sustituidos con uno o más R<sup>6</sup>, los cuales se seleccionan independientemente uno de otro, Si(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>R<sup>12</sup>, OR<sup>7</sup>, OSO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>7</sup>, S(O)<sub>n</sub>NR<sup>9a</sup>R<sup>9b</sup>, NR<sup>9a</sup>R<sup>9b</sup>, C(=O)NR<sup>9a</sup>R<sup>9b</sup>, C(=S)NR<sup>9a</sup>R<sup>9b</sup>, C(=O)OR<sup>7</sup>, fenilo, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes R<sup>10</sup>, los cuales se seleccionan independientemente uno de otro, un anillo heterocíclico aromático de 3-, 4-, 5-, 6- o 7-

40 5. Un compuesto de isoxazolina cetónica de acuerdo con la reivindicación 1, en donde

R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> pueden formar juntos =O, =CR<sup>13</sup>R<sup>14</sup>; =CR<sup>13</sup>NR<sup>17a</sup>R<sup>17b</sup> =S(O)<sub>n</sub>R<sup>16</sup>; =S(O)<sub>n</sub>NR<sup>17a</sup>R<sup>17b</sup> =NR<sup>17a</sup>, =NOR<sup>16</sup>; =NNR<sup>17a</sup>,

o

45 pueden formar junto con el átomo de carbono al cual R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> están enlazados un anillo de 3-, 4-, 5-, 6-, 7- u 8- miembros saturado, parcialmente insaturado carbocíclico o heterocíclico que comprende opcionalmente 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre y/o opcionalmente sustituidos con k sustituyentes R<sup>10</sup>,

seleccionados independientemente uno de otro, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden ser opcionalmente oxidados;

m es 1; y

- 5 G es seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, ciano, -SCN, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalcoxi, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalquiltio, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-cicloalquilo, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-halocicloalquilo, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alquenilo, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-haloalquenilo, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alquinilo, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> haloalquinilo, en donde los átomos de carbono de los radicales alifáticos y ciclo-alifáticos anteriormente mencionados pueden ser opcionalmente sustituidos con uno o más R<sup>6</sup>, los cuales se seleccionan independientemente uno de otro, o NR<sup>9a</sup>R<sup>9b</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>7</sup>, -S(O)<sub>n</sub>NR<sup>9a</sup>R<sup>9b</sup>, C(=O)R<sup>6</sup>, C(=O)OR<sup>7</sup>, C(=O)NR<sup>9a</sup>R<sup>9b</sup>, C(=NR<sup>8</sup>)R<sup>6</sup>; fenilo, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes R<sup>10</sup> seleccionados independientemente uno de otro;

un anillo de 3-, 4-, 5-, 6- o 7- miembros saturado, parcialmente saturado, parcial o completamente insaturado o heterocíclico aromático que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de oxígeno, nitrógeno y/o azufre, opcionalmente sustituidos con k sustituyentes R<sup>10</sup>, seleccionados independientemente uno de otro, y en donde los átomos de nitrógeno y/o azufre del anillo heterocíclico pueden ser opcionalmente oxidados;

- 15 6. Un compuesto de isoxazolina cetónica de acuerdo con la reivindicación 1, en donde

R<sup>5a</sup> o R<sup>5c</sup> es seleccionado del grupo que consiste de halógeno, ciano, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-cicloalquilo, en donde los cinco últimos radicales alifáticos y ciclo-alifáticos pueden ser opcionalmente sustituidos con uno o más R<sup>15</sup>, seleccionados independientemente uno de otro;

Si(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>R<sup>12</sup>, OR<sup>7</sup>, OS(O)<sub>n</sub>R<sup>7</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>7</sup>, NR<sup>9a</sup>R<sup>9b</sup>, N(R<sup>9a</sup>)C(=O)R<sup>6</sup>, C(=O)R<sup>6</sup>, C(=O)OR<sup>7</sup>, C(=NR<sup>9a</sup>)R<sup>6</sup> y C(=S)R<sup>6</sup>.

- 20 7. Un compuesto de isoxazolina cetónica de acuerdo con la reivindicación 1, en donde

R<sup>5a</sup> y R<sup>5c</sup> son seleccionados independientemente uno de otro forman el grupo que consiste de halógeno, ciano, OR<sup>7</sup>, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-cicloalquilo, en donde los átomos de carbono de los últimos dos radicales alifáticos y ciclo-alifáticos pueden ser opcionalmente sustituidos con uno o más R<sup>6</sup> y son seleccionados independientemente uno de otro.

- 25 8. Un compuesto de isoxazolina cetónica de acuerdo con la reivindicación 1, en donde

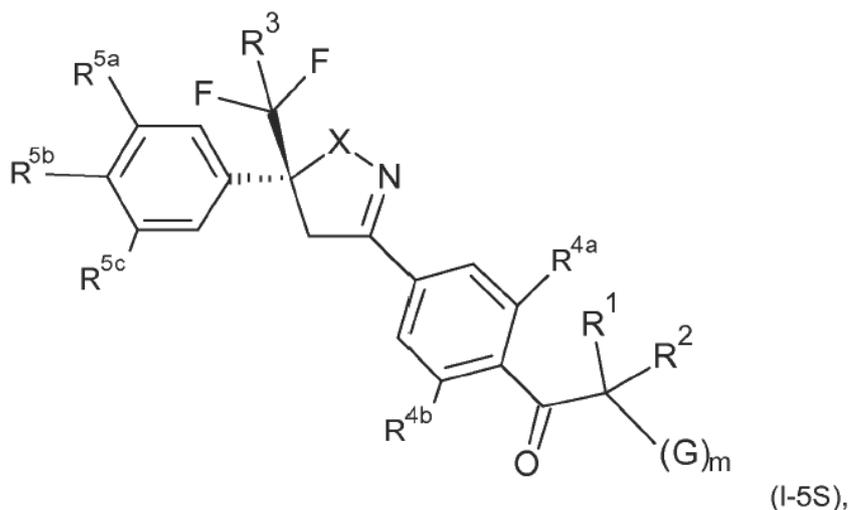
R<sup>4a</sup> y R<sup>4b</sup> son seleccionados independientemente uno de otro del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, SCN, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-cicloalquilo, en donde los dos últimos radicales alifáticos y ciclo-alifáticos pueden ser opcionalmente sustituidos con uno o más R<sup>6</sup>, los cuales se seleccionan independientemente uno de otro, OR<sup>7</sup>, -OS(O)<sub>n</sub>R<sup>7</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>7</sup>, NR<sup>9a</sup>R<sup>9b</sup>, N(R<sup>9a</sup>)C(=O)R<sup>6</sup>, C(=O)R<sup>6</sup>, -C(=O)OR<sup>7</sup>, C(=NR<sup>9a</sup>)R<sup>6</sup>, C(=S)R<sup>6</sup>;

- 30 R<sup>5a</sup> y R<sup>5c</sup> son seleccionados independientemente uno de otro del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno, ciano, OR<sup>7</sup>, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-cicloalquilo, en donde los átomos de carbono de los últimos dos radicales alifáticos y ciclo-alifáticos pueden ser opcionalmente sustituidos con uno o más R<sup>6</sup>, seleccionados independientemente uno de otro; y

R<sup>5b</sup> es seleccionado del grupo que consiste de hidrógeno, halógeno, ciano, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-cicloalquilo, en donde los cinco últimos radicales alifáticos y ciclo-alifáticos pueden ser opcionalmente sustituidos con uno o más R<sup>15</sup>, seleccionados independientemente uno de otro,

- 35 Si(R<sup>11</sup>)<sub>2</sub>R<sup>12</sup>, OR<sup>7</sup>, OS(O)<sub>n</sub>R<sup>7</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>7</sup>, NR<sup>9a</sup>R<sup>9b</sup>, N(R<sup>9a</sup>)C(=O)R<sup>6</sup>, C(=O)R<sup>6</sup>, C(=O)OR<sup>7</sup>, C(=NR<sup>9a</sup>)R<sup>6</sup> y C(=S)R<sup>6</sup>.

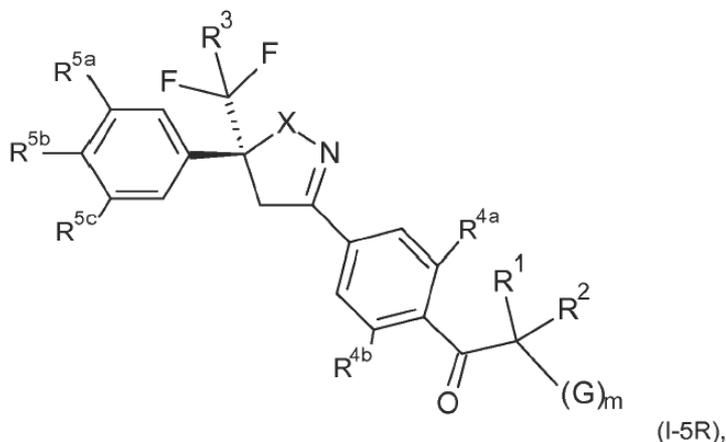
9. Un compuesto de isoxazolina cetónica de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, en donde el compuesto de isoxazolina cetónica es un enantiómero de fórmula (I-5S)



que tiene la configuración en S,

donde X es O.

- 5 10. Un compuesto de isoxazolina cetónica de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, en donde el compuesto de isoxazolina cetónica es un enantiómero de fórmula (I-5R)



que tiene la configuración en R,

donde X es O.

- 10 11. Una composición agrícola o veterinaria que comprende al menos un compuesto de la fórmula (I-5), como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10, un enantiómero, diastereoisómero y/o una sal aceptable desde el punto de vista agrícola del mismo, y al menos un líquido inerte y/o vehículo sólido aceptable desde el punto de vista agrícola.
- 15 12. Un método para controlar o combatir plagas invertebradas cuyo método comprende tratar las plagas, su suministro de alimentos, su hábitat o su terreno de cría o una planta, material de propagación de la planta, suelo, área, material o ambiente en el cual las plagas están creciendo o pueden crecer, con una cantidad efectiva como pesticida de al menos un compuesto de la fórmula (I-5) como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10, un enantiómero, diastereoisómeros y/o una sal aceptable desde el punto de vista agrícola de los mismos.
- 20 13. Un método para la protección de los materiales, plantas, material de propagación de las plantas, suelos, superficies o espacios de ataque o infestación de plagas invertebradas mediante la aplicación de una cantidad efectiva como plaguicida de al menos un compuesto de la fórmula (I-5) como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10, un enantiómero, diastereoisómero y/o una sal aceptable desde el punto de vista agrícola de los mismos a los materiales, plantas, material de propagación de las plantas, suelos, superficies o espacios.

14. Material de propagación de las plantas, que comprende al menos un compuesto de la fórmula (I-5) como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10, un diastereoisómero enantiómero, y/o una sal aceptable desde el punto de vista agrícola del mismo.

5 15. El uso de una cantidad efectiva como plaguicida de al menos un compuesto de la fórmula (I-5) como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10, un enantiómero, diastereoisómero y/o una sal aceptable desde el punto de vista veterinario del mismo, para la preparación de un medicamento para tratar o proteger a un animal de la infestación o infección por plagas invertebradas.