

19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 547 383**

51 Int. Cl.:

**C07D 401/14** (2006.01)

**C07D 405/14** (2006.01)

**C07D 413/14** (2006.01)

**A01N 43/713** (2006.01)

**A01N 43/56** (2006.01)

**C07D 231/14** (2006.01)

**A01N 43/54** (2006.01)

**A01N 43/653** (2006.01)

**A01N 43/80** (2006.01)

**C07D 403/06** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **06.06.2007 E 07764582 (8)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **22.07.2015 EP 2032556**

54 Título: **Derivados de diamidas de ácido antranílico con sustituyentes heteroaromáticos y heterocíclicos**

30 Prioridad:

**13.06.2006 DE 102006027336**

**12.07.2006 DE 102006032168**

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

**05.10.2015**

73 Titular/es:

**BAYER INTELLECTUAL PROPERTY GMBH**

**(100.0%)**

**Alfred-Nobel-Strasse 10**

**40789 Monheim am Rhein, DE**

72 Inventor/es:

**ALIG, BERND;**

**FISCHER, RÜDIGER;**

**FUNKE, CHRISTIAN;**

**GESING, ERNST RUDOLF F.;**

**HENSE, ACHIM;**

**MALSAM, OLGA;**

**DREWES, MARK WILHELM;**

**GÖRGENS, ULRICH;**

**MURATA, TETSUYA;**

**WADA, KATSUAKI;**

**ARNOLD, CHRISTIAN y**

**SANWALD, ERICH**

74 Agente/Representante:

**CARPINTERO LÓPEZ, Mario**

**Observaciones :**

**Véase nota informativa (Remarks) en el folleto original publicado por la Oficina Europea de Patentes**

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).

**ES 2 547 383 T3**

## DESCRIPCIÓN

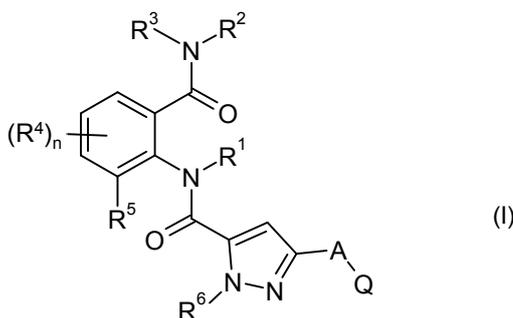
Derivados de diamidas de ácido antranílico con sustituyentes heteroaromáticos y heterocíclicos

La presente invención se refiere a nuevos insecticidas, a varios procedimientos para su preparación y a su uso como principios activos, especialmente a su uso como plaguicidas.

5 Ya se sabe que determinadas antranilamidas (por ejemplo, documentos WO01/70671, WO03/015519, WO03/016284, WO03/015518, WO03/024222, WO03/016282, WO03/016283, WO03/062226, WO03/027099, WO04/027042, WO04/033468, WO2004/046129, WO2004/067528, WO2005/118552, WO2005/077934, WO2005/085234, WO2006/023783, WO2006/000336, WO2006/040113, WO2006/111341, WO2007/006670, WO2007/024833, WO2007/020877) poseen propiedades insecticidas.

10 La eficacia de estas sustancias es buena, pero en algunos casos deja que desear.

Ahora se han descubierto nuevas antranilamidas de fórmula (I)



que comprenden compuestos de la fórmula general (I), además de N-óxidos y sales.

15 Finalmente se ha descubierto que los compuestos según la invención de fórmula (I) poseen propiedades insecticidas muy buenas y pueden usarse tanto en fitoprotección como en la protección de materiales para combatir organismos nocivos no deseados, como insectos.

20 Los compuestos según la invención pueden presentarse, dado el caso, como mezclas de distintas formas isoméricas posibles, especialmente de estereoisómeros, como por ejemplo isómeros E y Z, treo y eritro, así como isómeros ópticos, pero dado el caso también de tautómeros. Se reivindican tanto los isómeros E como los Z, como también los isómeros treo y eritro, así como los isómeros ópticos, mezclas discrecionales de estos isómeros, así como las posibles formas tautómeras.

25 Las antranilamidas según la invención se definen en general mediante la fórmula (I). A continuación se indican definiciones de restos preferidos de las fórmulas mencionadas anteriormente y que se mencionan a continuación. Estas definiciones son válidas para los productos finales de fórmula (I), de la misma manera que para todos los productos intermedios.

$R^1$  representa hidrógeno, metilo, ciclopropilo, cianometilo, metoximetilo, metiltiometilo, metilsulfinilmetilo o metilsulfonilmetilo.

$R^1$  representa de modo particularmente preferente hidrógeno.

$R^2$  representa hidrógeno o alquilo  $C_1-C_6$ .

30  $R^2$  representa hidrógeno o metilo.

$R^2$  representa de modo particularmente preferente hidrógeno.

35  $R^5$  representa hidrógeno o representa alquilo  $C_1-C_6$ , alcoxi  $C_1-C_6$ , en cada caso, dado el caso, monosustituido o polisustituido, de manera igual o diferente, pudiendo seleccionarse los sustituyentes independientemente entre sí de halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, alquilo  $C_1-C_6$ , cicloalquilo  $C_3-C_6$ , alcoxi  $C_1-C_4$ , haloalcoxi  $C_1-C_4$ , alquil  $C_1-C_4$ -tio, alquil  $C_1-C_4$ -sulfinilo, alquil  $C_1-C_4$ -sulfonilo, alquil  $C_1-C_4$ -sulfimino, alquil  $C_1-C_4$ -sulfimino-alquilo  $C_1-C_4$ , alquil  $C_1-C_4$ -sulfimino-alquil  $C_2-C_5$ -carbonilo, alquil  $C_1-C_4$ -sulfoximino, alquil  $C_1-C_4$ -sulfoximino-alquilo  $C_1-C_4$ , alquil  $C_1-C_4$ -sulfoximino-alquil  $C_2-C_5$ -carbonilo, alcoxi  $C_2-C_6$ -carbonilo, alquil  $C_2-C_6$ -carbonilo o trialquil  $C_3-C_6$ -sililo,

40  $R^3$  representa además cicloalquilo  $C_3-C_6$ , dado el caso monosustituido o polisustituido, de manera igual o diferente, pudiendo seleccionarse los sustituyentes independientemente entre sí de halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, alquilo  $C_1-C_6$ , cicloalquilo  $C_3-C_6$ , alcoxi  $C_1-C_4$ , haloalcoxi  $C_1-C_4$ , alquil  $C_1-C_4$ -tio, alquil  $C_1-C_4$ -sulfinilo, alquil  $C_1-C_4$ -sulfonilo, alquil  $C_1-C_4$ -sulfimino, alquil  $C_1-C_4$ -sulfimino-alquilo  $C_1-C_4$ , alquil  $C_1-C_4$ -sulfimino-alquil  $C_2-C_5$ -carbonilo, alquil  $C_1-C_4$ -sulfoximino, alquil  $C_1-C_4$ -sulfoximino-alquilo  $C_1-C_4$ , alquil  $C_1-C_4$ -sulfoximino-alquil  $C_2-C_5$ -carbonilo, alcoxi  $C_2-C_6$ -carbonilo, alquil  $C_2-C_6$ -carbonilo o trialquil  $C_3-C_6$ -sililo,

45  $R^3$  representa de modo particularmente preferente alquilo  $C_1-C_4$  (metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, n-butilo, iso-butilo, sec-butilo o terc-butilo) o cianoalquilo  $C_1-C_3$  (cianometilo, 1-cianoetilo, 2-cianoetilo, 1-ciano-n-propilo, 2-ciano-n-propilo, 3-ciano-n-propilo, 1-ciano-iso-propilo, 2-ciano-iso-propilo).

R<sup>3</sup> representa de modo especialmente preferente metilo, iso-propilo o cianometilo.

R<sup>4</sup> representa hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, halógeno, ciano o haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>.

Además, dos restos contiguos R<sup>4</sup> representan de modo particularmente preferente -(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>-, -(CH=CH)<sub>2</sub>-, -(O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>O)-, -(O(CF<sub>2</sub>)<sub>2</sub>O)-, -(CH=CH-CH=N)- o -(CH=CH-N=CH)-.

5 R<sup>4</sup> representa de modo particularmente preferente hidrógeno, metilo, trifluorometilo, ciano, flúor, cloro, bromo, yodo o trifluorometoxi. Además, dos restos contiguos R<sup>4</sup> representan de modo particularmente preferente -(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>- o -(CH=CH)<sub>2</sub>-.

R<sup>4</sup> representa de modo especialmente preferente cloro o bromo.

10 R<sup>1</sup> representa además de modo especialmente preferente yodo o ciano. Además, dos restos contiguos R<sup>4</sup> representan de modo especialmente preferente -(CH=CH)<sub>2</sub>-.

R<sup>5</sup> representa alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halocicloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueniilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalqueniilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro o trialkil C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-sililo.

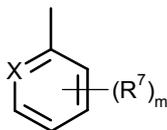
R<sup>5</sup> representa de modo particularmente preferente metilo, flúor, cloro, bromo o yodo.

15 R<sup>5</sup> representa de modo especialmente preferente metilo o cloro.

R<sup>6</sup> representa preferentemente o

R<sup>6</sup> representa además preferentemente cicloalcoxi,

R<sup>6</sup> representa de modo particularmente preferente metilo o



20 R<sup>7</sup> representa de modo particularmente preferente, independientemente entre sí, hidrógeno, halógeno o haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>,

R<sup>7</sup> representa de modo particularmente preferente flúor, cloro o bromo,

R<sup>7</sup> representa de modo especialmente preferente cloro.

m representa preferentemente 3,

25 m representa de modo particularmente preferente 1 o 2,

m representa de modo particularmente preferente 1,

X representa preferentemente N, CCl, CBr o Cl,

X representa N, CH, CF, CCl o CBr,

X representa de modo particularmente preferente N, CCl o CH.

30 A representa de modo particularmente preferente -CH<sub>2</sub>-, -CH(CH<sub>3</sub>), C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> o CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>,

A representa además de modo particularmente preferente -CH(CN)-,

A representa de modo muy particularmente preferente CH<sub>2</sub> o CH(CH<sub>3</sub>),

A representa de modo especialmente preferente CH<sub>2</sub>,

35 Q representa preferentemente un anillo heterocíclico aromático de 5 o 6 miembros, dado el caso monosustituido o polisustituido, de la serie Q-36 a Q-40, o un sistema de anillo Q-54 a Q-56 heterobícíclico condensado aromático de 9 miembros, pudiendo seleccionarse los sustituyentes independientemente entre sí de alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, halógeno, ciano, hidroxilo, nitro o haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>.

40 Q representa además un anillo heterocíclico aromático de 5 o 6 miembros, dado el caso monosustituido o polisustituido, de la serie Q-36 a Q-40 y Q-58 a Q-59, un sistema de anillo Q-54 a Q-56 heterobícíclico condensado aromático de 9 miembros, así como un anillo Q-60 a Q-61 heterocíclico de 5 miembros, pudiendo seleccionarse los sustituyentes independientemente entre sí de alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, halógeno, ciano, hidroxilo, nitro o haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, o pudiendo seleccionarse los sustituyentes independientemente entre sí de fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, pudiendo estar el fenilo o el anillo monosustituido o polisustituido, dado el caso, de manera igual o diferente, con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueniilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalqueniilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>,

Q representa de modo particularmente preferente un anillo heterocíclico aromático, dado el caso monosustituido o polisustituido, de la serie Q-37, Q-38, Q-39, Q-40, Q-58 y Q-59, así como un anillo Q-60 heterocíclico de 5 miembros, pudiendo seleccionarse los sustituyentes independientemente entre sí de alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, halógeno, ciano, hidroxilo, nitro o haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>,

5 o pudiendo seleccionarse los sustituyentes independientemente entre sí de fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, pudiendo estar el fenilo o el anillo monosustituido o polisustituido, dado el caso, de manera igual o diferente, con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>,

10 Q representa además de modo particularmente preferente un anillo heterocíclico aromático, dado el caso monosustituido o polisustituido, de la serie Q-37, Q-38, Q-39, Q-40, Q-58 y Q-59, así como un anillo Q-60 heterocíclico de 5 miembros, pudiendo seleccionarse los sustituyentes independientemente entre sí de alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, halógeno, ciano, nitro o haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>,

15 o pudiendo seleccionarse los sustituyentes independientemente entre sí de fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, pudiendo estar el fenilo o el anillo monosustituido o polisustituido, dado el caso, de manera igual o diferente, con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>,

20 Q representa de modo especialmente preferente un anillo Q-37, Q-40, Q-58 y Q-59 heterocíclico aromático, dado el caso sustituido una, dos o tres veces en átomos de carbono, así como un anillo Q-60 heterocíclico de 5 miembros, pudiendo seleccionarse los sustituyentes independientemente entre sí de cloro, flúor, yodo, bromo, ciano, trifluorometilo y pentafluoroetilo,

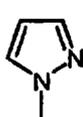
o pudiendo seleccionarse los sustituyentes independientemente entre sí de fenilo, pudiendo estar el anillo de fenilo monosustituido o polisustituido, dado el caso, de manera igual o diferente, con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>,

25 Q representa además de modo especialmente preferente un anillo heterocíclico aromático, dado el caso monosustituido o polisustituido, de la serie Q-37, Q-40, Q-58 y Q-59, así como un anillo Q-60 heterocíclico de 5 miembros, pudiendo seleccionarse los sustituyentes independientemente entre sí de cloro, flúor, yodo, ciano, trifluorometilo y pentafluoroetilo,

30 o pudiendo seleccionarse los sustituyentes independientemente entre sí de fenilo, pudiendo estar el anillo de fenilo monosustituido o polisustituido, dado el caso, de manera igual o diferente, con cloro, flúor, yodo, bromo, ciano, trifluorometilo y pentafluoroetilo.



Q-36



Q-37



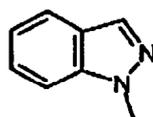
Q-38



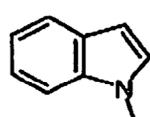
Q-39



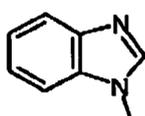
Q-40



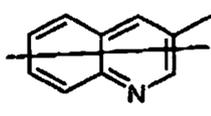
Q-54



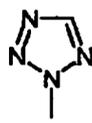
Q-55



Q-56



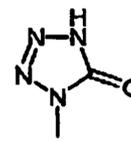
Q-57



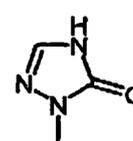
Q-58



Q-59

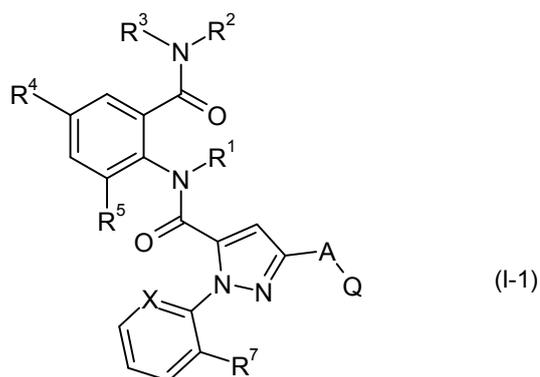


Q-60



Q-61

Destacan compuestos de fórmula (I-1),



en los que  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^7$ , A, Q y X tienen los significados generales, preferentes, particularmente preferentes, muy particularmente preferentes y especialmente preferentes anteriormente indicados.

5 Los restos sustituidos por halógeno, por ejemplo haloalquilo, están halogenados una o varias veces hasta el máximo número de sustituyentes posibles. En caso de halogenación múltiple, los átomos de halógeno pueden ser iguales o diferentes. A este respecto halógeno representa flúor, cloro, bromo o yodo, especialmente flúor, cloro o bromo.

Son preferentes, particularmente preferentes, muy particularmente preferentes y especialmente preferentes los compuestos que portan respectivamente los sustituyentes mencionados bajo preferentemente, de modo particularmente preferente, de modo muy particularmente preferente y de modo especialmente preferente.

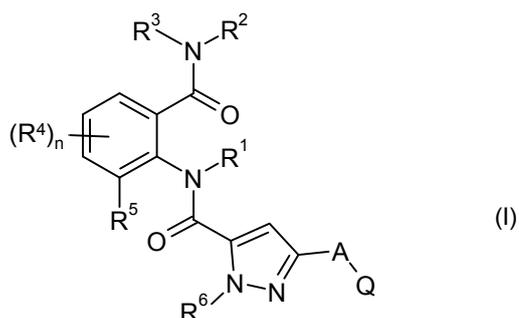
10 Siempre que sea posible, los restos de hidrocarburos saturados o insaturados, como alquilo o alqueniilo, pueden ser, respectivamente, ramificados o de cadena lineal, también en un compuesto con heteroátomos, como por ejemplo en alcoxi.

Los restos dado el caso sustituidos pueden estar monosustituidos o polisustituidos, en los que en el caso de sustituciones múltiples los sustituyentes pueden ser iguales o diferentes.

15 Sin embargo, las definiciones de restos o explicaciones generales enumeradas anteriormente o enumeradas en intervalos preferentes también pueden combinarse discrecionalmente entre sí, es decir, entre los intervalos respectivos y los intervalos preferentes. Son válidas correspondientemente para los productos finales, así como para los precursores e intermedios.

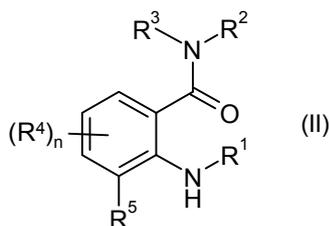
20 Además, se ha descubierto que se obtienen antranilamidas de fórmula (I) según uno de los siguientes procedimientos.

Se obtienen antranilamidas de fórmula (I)



en las que A,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$ , Q y n tienen los significados anteriormente indicados, haciendo reaccionar

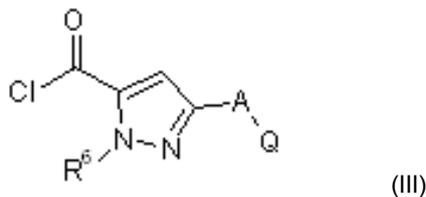
(A) anilinas de fórmula (II),



25

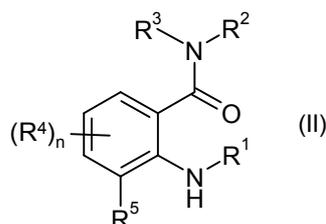
en la que A,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  y n tienen los significados anteriormente indicados,

con cloruros de ácido carboxílico de fórmula (III),

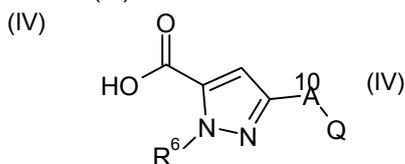


en la que R<sup>6</sup>, A y Q tienen los significados anteriormente indicados, en presencia de un aglutinante ácido, haciendo reaccionar

5 (B) anilinas de fórmula (II),

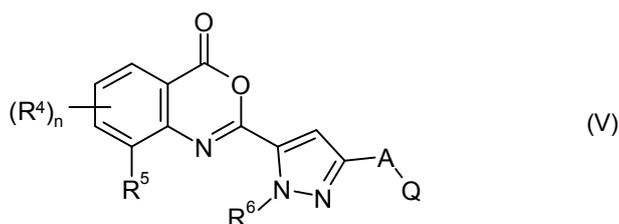


en la que A, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> y n tienen los significados anteriormente indicados, con un ácido carboxílico de fórmula (IV)



en la que R<sup>6</sup>, A y Q tienen los significados anteriormente indicados, en presencia de un agente de condensación, o haciendo reaccionar

15 (C) para la síntesis de antranilamidas de fórmula (I), en las que R<sup>1</sup> representa hidrógeno, benzoxazinonas de fórmula (V),



en la que R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, A, Q y n tienen los significados anteriormente indicados, con una amina de fórmula (XV)

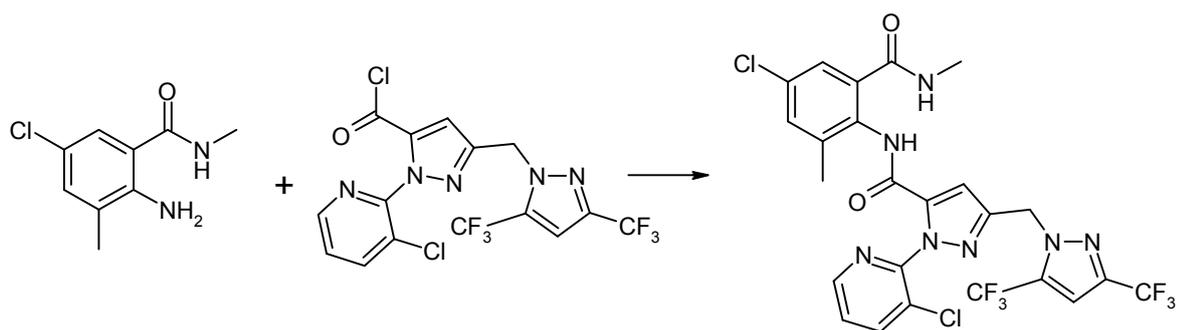


20 en la que R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> tienen los significados anteriormente indicados, en presencia de un diluyente.

### Explicación del procedimiento y productos intermedios

#### Procedimiento (A)

25 Si se usa, por ejemplo, 2-amino-5-cloro-3,N-dimetil-benzamida y cloruro del ácido 5-(3,5-bis-trifluorometil-pirazol-1-ilmetil)-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico como sustancias de partida, entonces el transcurso del procedimiento (A) según la invención puede ilustrarse mediante el siguiente esquema de fórmulas.



Las aminobenzamidas necesarias como sustancias de partida en la realización del procedimiento (A) según la invención se definen en general mediante la fórmula (II). En esta fórmula (II), A, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> y n representan preferentemente, de modo particularmente preferente, de modo muy particularmente preferente o de modo especialmente preferente aquellos significados que ya se mencionaron como preferentes, particularmente preferentes, etc. para estos restos en relación con la descripción de las sustancias de fórmula (I) según la invención.

El procedimiento (A) según la invención se realiza en presencia de un aglutinante de ácidos. Para ello son adecuadas todas las bases inorgánicas u orgánicas habituales para tales reacciones de acoplamiento. Preferentemente pueden usarse hidruros, hidróxidos, amidas, alcoholatos, acetatos, carbonatos o hidrogenocarbonatos de metales alcalinotérreos o metales alcalinos, como por ejemplo hidruro de sodio, amida de sodio, diisopropilamida de litio, metilato de sodio, etilato de sodio, terc-butilato de potasio, hidróxido sódico, hidróxido potásico, acetato de sodio, carbonato sódico, carbonato de potasio, hidrogenocarbonato de potasio, hidrogenocarbonato de sodio o carbonato de amonio, así como aminas terciarias como trimetilamina, trietilamina, tributilamina, diisopropilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetil-bencilamina, piridina, N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabicyclooctano (DABCO), diazabicyclononeno (DBN) o diazabicycloundeceno (DBU). Igualmente pueden usarse, dado el caso, aglutinantes de ácidos basados en polímeros, como por ejemplo diisopropilamina unida a polímero o dimetilaminopiridina unida a polímero.

El procedimiento (A) según la invención puede realizarse, dado el caso, en presencia de un diluyente orgánico inerte habitual para tales reacciones. A éstos pertenece preferentemente hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos, como por ejemplo éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benceno, tolueno, xileno o decalina; hidrocarburos halogenados como por ejemplo clorobenceno, diclorobenceno, diclorometano, cloroformo, tetraclorometano, dicloroetano o tricloroetano; éteres como dietiléter, diisopropiléter, metil-t-butiléter, metil-t-amiléter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano o anisol; cetonas como acetona, butanona, metil-isobutilcetona o ciclohexanona; nitrilos como acetonitrilo, propionitrilo, n- o i-butironitrilo o benzonitrilo; amidas como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilformanilida, N-metilpirrolidona o triamida del ácido hexametilfosfórico; sus mezclas con agua o agua pura. De modo particularmente preferente pueden usarse tolueno, tetrahidrofurano y N,N-dimetilformamida.

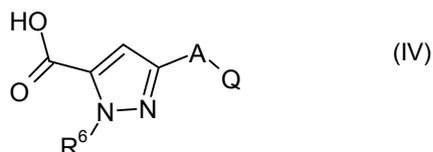
Las temperaturas de reacción pueden variarse en la realización del procedimiento (A) según la invención en un intervalo mayor. En general se trabaja a temperaturas de 0 °C a 150 °C, preferentemente a temperaturas de 20 °C a 100 °C.

El procedimiento según la invención se realiza en general a presión normal. Sin embargo, también es posible realizar el procedimiento según la invención a presión elevada o reducida, en general entre 10 kPa y 1000 kPa.

Las aminobenzamidas de fórmula (II) son conocidas (véanse, por ejemplo, M. J. Kornet, *J. Heterocycl. Chem.* 1992, 29, 103-105; G. P. Lahm y col., *Bioorg. Med. Chem. Letters* 2005, 15, 4898-4906; documentos WO2003/016284, WO2006/062978).

Los cloruros del ácido pirazolcarboxílico de fórmula (III) son nuevos. Pueden prepararse, por ejemplo, haciendo reaccionar

(D) derivados del ácido pirazolcarboxílico de fórmula (IV),

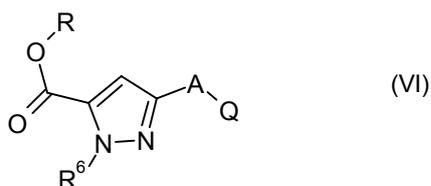


en la que A, Q y R<sup>6</sup> tienen los significados anteriormente indicados,

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

Los derivados del ácido pirazolcarboxílico de fórmula (IV) son nuevos. Pueden prepararse, por ejemplo, haciendo reaccionar

(E) ésteres del ácido pirazolcarboxílico de fórmula (VI),

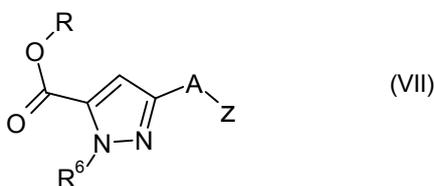


en la que A, Q y R<sup>6</sup> tienen los significados anteriormente indicados y R representa alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>,

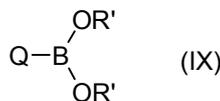
con un hidróxido de metal alcalino (por ejemplo hidróxido sódico o hidróxido de potasio) en presencia de un diluyente inerte (por ejemplo dioxano/agua o etanol/agua).

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

(F) derivados de los ésteres del ácido pirazolcarboxílico de fórmula (VII),



- 10 en la que A, R<sup>6</sup> y R tienen los significados anteriormente indicados y Z representa cloro, bromo, yodo, metilsulfonilo o toluenosulfonilo, con un compuesto heteroaromático de fórmula (VIII) o un ácido borónico o un éster del ácido borónico de fórmula (IX), en la que R' representa H, CH<sub>3</sub>, C<sub>2</sub>H<sub>5</sub> o R'-R' C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> y Q tiene los significados anteriormente indicados, en presencia de un metal de transición (por ejemplo, tetraquis(trifenilfosfina)paladio(0)) y una base (por ejemplo carbonato de potasio o carbonato sódico) en presencia de un disolvente (por ejemplo tetrahidrofurano, acetonitrilo o dioxano).

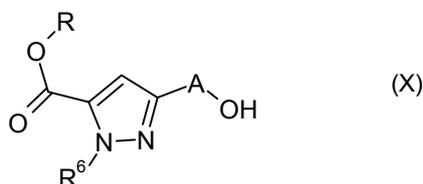


- 20 Los compuestos heteroaromáticos y los compuestos heterocíclicos de fórmula (VIII) son conocidos, incluso pueden obtenerse en parte comercialmente o pueden obtenerse según procedimientos conocidos (véanse, por ejemplo, H. V. Dias y col., *Organometallics* 1996, 15, 5374-5379; M. D. Threadgill y col., *J. Fluorine Chem.* 1993, 65, 21-23; M. Abdul-Ghani y col., *J. Fluorine Chem.* 1990, 48, 149-152; T. Kitazaki, *Chem. Pharm. Bull.* 1996, 44, 314-327; documentos DE1995-19504627; WO2004080984, WO2005095351).

Los ácidos borónicos heterocíclicos o boronatos de fórmula (IX) son conocidos, incluso pueden obtenerse en parte comercialmente o pueden obtenerse según procedimientos conocidos (véanse, por ejemplo, W. Li, D. P. Nelson, M. S. Jensen, R. S. Hoermer, D. Cai, R. D. Larsen, P. J. Reider, *J. Org. Chem.* 2002, 67, 5394-5397).

- 25 Los derivados de los ésteres del ácido pirazolcarboxílico de fórmula (VII) pueden prepararse, por ejemplo, haciendo reaccionar

(G) alcoholes de fórmula (X),

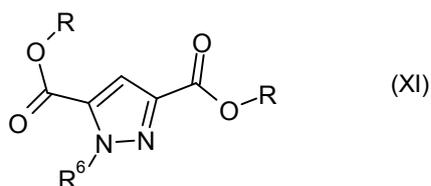


- 30 en la que R, R<sup>6</sup> y A tienen los significados anteriormente indicados, con un cloruro de sulfonilo (por ejemplo cloruro del ácido metilsulfónico o cloruro del ácido toluenosulfónico) o un agente de halogenación (por ejemplo cloruro de tionilo), dado el caso en presencia de un disolvente (por ejemplo diclorometano) y, dado el caso, en presencia de una base (por ejemplo trietilamina o piridina).

Las temperaturas de reacción pueden variarse en la realización del procedimiento (G) según la invención en un intervalo mayor. En general se trabaja a temperaturas de 0 °C a 150 °C, preferentemente a temperaturas de 0 °C a 60 °C.

- 35 Los alcoholes de fórmula (X) pueden prepararse, por ejemplo, haciendo reaccionar

(H) ésteres del ácido pirazoldicarboxílico de fórmula (XI),

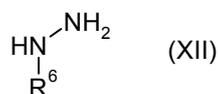


en la que R y R<sup>6</sup> tienen los significados anteriormente indicados, con un agente reductor (por ejemplo hidruro de litio y aluminio o hidruro de diisobutilaluminio) en presencia de un disolvente (por ejemplo tetrahidrofurano o éter dietílico).

- 5 Las temperaturas de reacción pueden variarse en la realización del procedimiento (H) según la invención en un intervalo mayor. En general se trabaja a temperaturas de -100 °C a 20 °C, preferentemente a temperaturas de -78 °C a 0 °C.

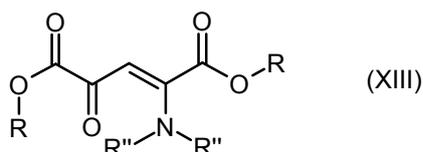
Los ésteres del ácido pirazoldicarboxílico de fórmula (XI) pueden prepararse, por ejemplo, haciendo reaccionar

(I) hidrazinas o sus sales correspondientes de fórmula (XII),



10

en la que R<sup>6</sup> tiene el significado anteriormente indicado, con una tricetona (XIII) de fórmula (XIII),



en la que R tiene el significado anteriormente indicado y R'' representa metilo o etilo o R''-R'' (CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub> o (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>, en presencia de un disolvente (por ejemplo metanol o etanol).

- 15 Las hidrazinas o sus sales correspondientes de fórmula (XII) son conocidas, pueden obtenerse en parte comercialmente o también pueden prepararse según procedimientos de síntesis generales (véase, por ejemplo, *Advanced Organic Chemistry*, cuarta edición, Jerry March, John Wiley & Sons, Inc. Nueva York, 1992, página 1288).

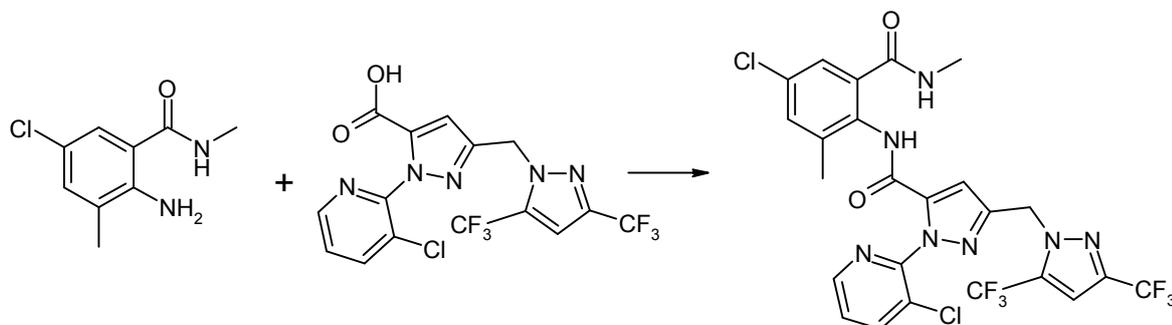
Las tricetonas de fórmula (XIII) son conocidas y pueden prepararse según procedimientos de síntesis generales (véase, por ejemplo, Cvetovich, Raymond J.; Pipik, Brenda; Hartner, Frederick W.; Grabowski, Edward J. J.; *Tetrahedron Lett* 2003, 44, 5867 – 5870).

20

Las temperaturas de reacción pueden variarse en la realización del procedimiento (I) según la invención en un intervalo mayor. En general se trabaja a temperaturas de 0 °C a 80 °C, preferentemente a temperaturas de 40 °C a 60 °C.

#### Procedimiento (B)

- 25 Si se usa, por ejemplo, 2-amino-5-cloro-3,N-dimetil-benzamida y ácido 5-(3,5-bis-trifluorometil-pirazol-1-ilmetil)-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico como sustancias de partida, entonces el transcurso del procedimiento (B) según la invención puede ilustrarse mediante el siguiente esquema de fórmulas.



- 30 Las antranilamidas de fórmula (II) necesarias en la realización del procedimiento (B) según la invención como sustancias de partida ya se describieron en relación con el procedimiento (A) según la invención.

Los ácidos carboxílicos heterocíclicos necesarios además como sustancias de partida en la realización del

procedimiento (B) según la invención se definen en general mediante la fórmula (IV). En esta fórmula (IV), R<sup>6</sup>, A y Q representan preferentemente, de modo particularmente preferente, de modo muy particularmente preferente o de modo especialmente preferente aquellos significados que ya se mencionaron como preferentes, particularmente preferentes, etc., para estos restos en relación con la descripción de las sustancias de fórmula (I) según la invención.

5 El procedimiento (B) según la invención se realiza en presencia de un agente de condensación. Para esto son adecuados todos los agentes habituales para tales reacciones de acoplamiento. A modo de ejemplo se pueden mencionar formadores de halogenuros de ácidos como fosgeno, tribromuro de fósforo, tricloruro de fósforo, pentacloruro de fósforo, oxicluro de fósforo o cloruro de tionilo; formadores de anhídridos como éster etílico del ácido clorofórmico, éster metílico del ácido clorofórmico, éster isopropílico del ácido clorofórmico, éster isobutílico del ácido clorofórmico o cloruro de metanosulfonilo; carbodiimidias como N,N'-diciclohexilcarbodiimida (DCC) u otros  
10 agentes de condensación habituales como pentóxido de fósforo, ácido polifosfórico, 1,1'-carbonildiimidazol, 2-etoxi-N-etoxicarbonil-1,2-dihidroquinolina (EEDQ), trifenilfosfina/tetraclorocarbono, hexafluorofosfato de bromotripirrolidinofosfonio, cloruro de bis(2-oxo-3-oxazolidinil)fosfina o hexafluorofosfato de benzotriazol-1-iloxitris(dimetilamino)-fosfonio. También pueden usarse reactivos basados en polímeros, como por ejemplo  
15 ciclohexilcarbodiimida unida a polímero.

El procedimiento (B) según la invención se realiza, dado el caso, en presencia de un catalizador. Por ejemplo, se pueden mencionar 4-dimetilaminopiridina, 1-hidroxi-benzotriazol o dimetilformamida.

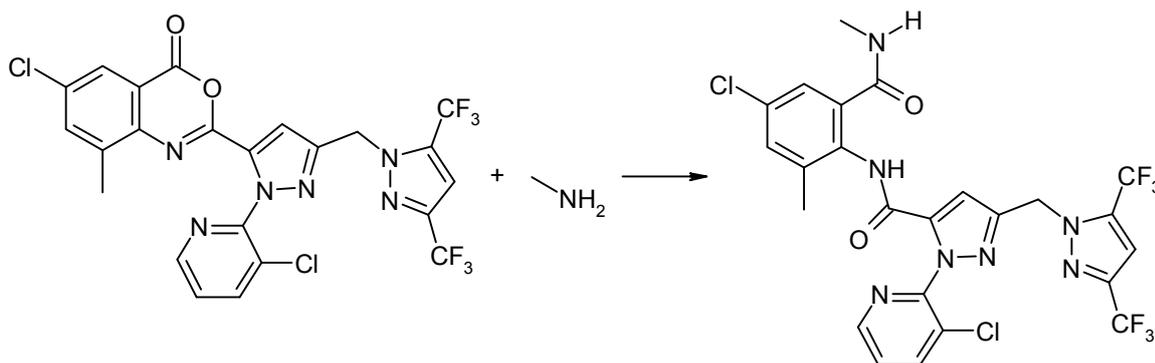
El procedimiento (B) según la invención puede realizarse, dado el caso, en presencia de un diluyente orgánico inerte habitual para tales reacciones. A éstos pertenecen preferentemente hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos, como por ejemplo éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benceno, tolueno, xileno o decalina; hidrocarburos halogenados como por ejemplo clorobenceno, diclorobenceno, diclorometano cloroformo, tetraclorometano, dicloroetano o tricloroetano; éteres como dietiléter, diisopropiléter, metil-t-butiléter, metil-t-amiléter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano 1,2-dietoxietano o anisol; cetonas como acetona, butanona, metil-isobutilcetona o ciclohexanona; nitrilos como acetonitrilo, propionitrilo, n- o i-butironitrilo o benzonitrilo; amidas como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilformanilida, N-metilpirrolidona o triamida del ácido hexametilfosfórico; sus mezclas con agua o agua pura. De modo particularmente preferente pueden usarse  
20 diclorometano y N,N-dimetilformamida.

Las temperaturas de reacción pueden variarse en la realización del procedimiento (B) según la invención en un intervalo mayor. En general se trabaja a temperaturas de 0 °C a 150 °C, preferentemente a temperaturas de 0 °C a 80 °C.  
30

El procedimiento según la invención se realiza en general a presión normal. Sin embargo, también es posible realizar el procedimiento según la invención a presión elevada o reducida - en general entre 10 kPa y 1000 kPa.

#### Procedimiento (C)

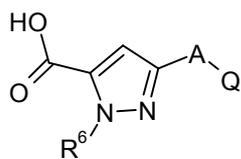
Si se usa 2-[3-[[3,5-bis(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]metil]-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona y metilamina, entonces el transcurso del procedimiento (C) según la invención puede ilustrarse mediante el siguiente esquema de fórmulas.  
35



Las benzoxazinonas necesarias como sustancias de partida en la realización del procedimiento (C) según la invención se definen en general mediante la fórmula (V). En esta fórmula (V), R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, A, Q y n representan preferentemente, de modo particularmente preferente, de modo muy particularmente preferente o de modo especialmente preferente aquellos significados que ya se mencionaron como preferentes, particularmente preferentes, etc. para estos restos en relación con la descripción de las sustancias de fórmula (I) según la invención.  
40

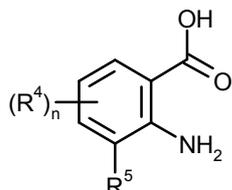
Las benzoxazinonas de fórmula (V) son nuevas. Pueden obtenerse, por ejemplo, haciendo reaccionar

(J) derivados del ácido pirazolcarboxílico de fórmula (IV),



(IV)

en la que  $R^6$ , A y Q tienen los significados anteriormente indicados,  
con ácidos antranílicos de fórmula (XIV),



(XIV)

- 5 en la que  $R^4$ ,  $R^5$  y n tienen los significados anteriormente indicados, en presencia de una base (por ejemplo trietilamina o piridina) y en presencia de un cloruro de ácido sulfónico (por ejemplo cloruro del ácido metanosulfónico), así como, dado el caso, en presencia de un diluyente (por ejemplo acetonitrilo).

10 Los derivados del ácido pirazolcarboxílico de fórmula (IV) necesarios como sustancias de partida en la realización del procedimiento (J) según la invención ya se describieron anteriormente en relación con el procedimiento (A) según la invención.

15 Los ácidos antranílicos necesarios además como sustancias de partida en la realización del procedimiento (J) según la invención se definen en general mediante la fórmula (XIV). En esta fórmula (XIV),  $R^4$ ,  $R^5$  y n representan preferentemente, de modo particularmente preferente, de modo muy particularmente preferente o de modo especialmente preferente aquellos significados que ya se mencionaron como preferentes, particularmente preferentes, etc. para estos restos en relación con la descripción de las sustancias de fórmula (I) según la invención.

Los ácidos antranílicos de fórmula (XIV) son conocidos y pueden prepararse según procedimientos de síntesis generales (véanse, por ejemplo, Baker y col. *J. Org. Chem.* 1952, 149-153; G. Reissenweber y col., *Angew. Chem* 1981, 93, 914-915, P.J. Montoya-Pelaez, *J. Org. Chem.* 2006, 71, 5921-5929; F. E. Sheibley, *J. Org. Chem.* 1938, 3, 414-423, documento WO2006023783).

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

25 Los principios activos según la invención son adecuados por su buena compatibilidad con las plantas, toxicidad favorable en animales de sangre caliente y buena compatibilidad con el medio ambiente para proteger plantas y órganos de plantas, para aumentar las cosechas, mejorar la calidad del producto cosechado y para combatir plagas animales, especialmente insectos, arácnidos, helmintos, nematodos y moluscos que aparecen en la agricultura, en la horticultura, en la cría de animales, en silvicultura, en jardines y en instalaciones al aire libre, en la protección de mercancías y materiales, así como en el sector higiénico. Pueden usarse preferentemente como producto fitosanitario. Son eficaces contra especies normalmente sensibles y resistentes, así como contra todos los estadios de desarrollo o estadios de desarrollo individuales. A los organismos nocivos anteriormente mencionados pertenecen:

Del orden de los anopluros (ftirápteros), por ejemplo *Damalinia* spp., *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Trichodectes* spp.

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

- 40 De la clase de los bivalvos, por ejemplo *Dreissena* spp.

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

- 45 Del orden de los coleópteros, por ejemplo *Acanthoscelides obtectus*, *Adoretus* spp., *Agelastica alni*, *Agriotes* spp., *Amphimallon solstitialis*, *Anobium punctatum*, *Anoplophora* spp., *Anthonomus* spp., *Anthrenus* spp., *Apogonia* spp., *Atomaria* spp., *Attagenus* spp., *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp., *Ceuthorhynchus* spp., *Cleonus mendicus*, *Conoderus* spp., *Cosmopolites* spp., *Costelytra zealandica*, *Curculio* spp., *Cryptorhynchus lapathi*, *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp., *Epilachna* spp., *Faustinus cubae*, *Gibbium psylloides*, *Heteronychus arator*, *Hylamorpha elegans*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera postica*, *Hypothenemus* spp., *Lachnosterna consanguinea*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lixus* spp., *Lyctus* spp., *Meligethes aeneus*, *Melolontha melolontha*, *Migdolus* spp., *Monochamus* spp., *Naupactus xanthographus*, *Niptus hololeucus*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus surinamensis*,

Otiorrhynchus sulcatus, Oxycetonia jucunda, Phaedon cochleariae, Phyllophaga spp., Popillia japonica, Premnotypes spp., Psylliodes chrysocephala, Ptinus spp., Rhizobius ventralis, Rhizopertha dominica, Sitophilus spp., Sphenophorus spp., Sternechus spp., Symphyletes spp., Tenebrio molitor, Tribolium spp., Trogoderma spp., Tychius spp., Xylotrechus spp., Zabrus spp.

5 Del orden de los colémbolos, por ejemplo Onychiurus armatus.

Del orden de los dermápteros, por ejemplo Forficula auricularia.

Del orden de los diplópodos, por ejemplo Blaniulus guttulatus.

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

De la clase de los gastrópodos, por ejemplo Arion spp., Biomphalaria spp., Bulinus spp., Deroceras spp., Galba spp., Lymnaea spp., Oncomelania spp., Succinea spp.

15 De la clase de los helmintos, por ejemplo Ancylostoma duodenale, Ancylostoma ceylanicum, Ancylostoma braziliense, Ancylostoma spp., Ascaris lubricoides, Ascaris spp., Brugia malayi, Brugia timori, Bunostomum spp., Chabertia spp., Clonorchis spp., Cooperia spp., Dicrocoelium spp., Dictyocaulus filaria, Diphylobothrium latum, Dracunculus medinensis, Echinococcus granulosus, Echinococcus multilocularis, Enterobius vermicularis, Faciola spp., Haemonchus spp., Heterakis spp., Hymenolepis nana, Hyostrongylus spp., Loa Loa, Nematodirus spp., 20 Oesophagostomum spp., Opisthorchis spp., Onchocerca volvulus, Ostertagia spp., Paragonimus spp., Schistosomen spp., Strongyloides fuelleborni, Strongyloides stercoralis, Strongyloides spp., Taenia saginata, Taenia solium, Trichinella spiralis, Trichinella nativa, Trichinella britovi, Trichinella nelsoni, Trichinella pseudospiralis, Trichostrongylus spp., Trichuris trichuria, Wuchereria bancrofti.

Además, pueden combatirse protozoos como Eimeria.

25 Del orden de los heterópteros, por ejemplo Anasa tristis, Antestiopsis spp., Blissus spp., Calocoris spp., Campylomma livida, Cavalerius spp., Cimex spp., Creontiades dilutus, Dasynus piperis, Dichelops furcatus, Diconocoris hewetti, Dysdercus spp., Euschistus spp., Eurygaster spp., Heliopeltis spp., Horcias nobilellus, Leptocoris spp., Leptoglossus phyllopus, Lygus spp., Macropes excavatus, Miridae, Nezara spp., Oebalus spp., Pentomidae, Piesma quadrata, Piezodorus spp., Psallus seriatus, Pseudacysta perseae, Rhodnius spp., Sahlbergella 30 singularis, Scotinophora spp., Stephanitis nashi, Tibraca spp., Triatoma spp.

Del orden de los homópteros, por ejemplo Acyrthosipon spp., Aeneolamia spp., Agonoscena spp., Aleurodes spp., Aleurolobus barodensis, Aleurothrixus spp., Amrasca spp., Anuraphis cardui, Aonidiella spp., Aphanostigma piri, Aphid spp., Arboridia apicalis, Aspidiella spp., Aspidiotus spp., Atanus spp., Aulacorthum solani, Bemisia spp., Brachycaudus helichrysi, Brachycolus spp., Brevicoryne brassicae, Calligypona marginata, Carneiocephala fulgida, 35 Ceratovacuna lanigera, Cercopidae, Ceroplastes spp., Chaetosiphon fragaefolii, Chionaspis tegalensis, Chlorita onukii, Chromaphis juglandicola, Chrysomphalus ficus, Cicadulina mbila, Coccothrips halli, Coccus spp., Cryptomyzus ribis, Dalbulus spp., Dialeurodes spp., Diaphorina spp., Diaspis spp., Doralis spp., Drosicha spp., Dysaphis spp., Dysmicoccus spp., Empoasca spp., Eriosoma spp., Erythroneura spp., Euscelis bilobatus, Geococcus coffeae, Homalodisca coagulata, Hyalopterus arundinis, Icerya spp., Idiocerus spp., Idioscopus spp., Laodelphax striatellus, Lecanium spp., Lepidosaphes spp., Lipaphis erysimi, Macrosiphum spp., Mahanarva fimbriolata, 40 Melanaphis sacchari, Metcalfiella spp., Metopolophium dirhodum, Monellia costalis, Monelliopsis pecanis, Myzus spp., Nasonovia ribisnigri, Nephrotettix spp., Nilaparvata lugens, Oncometopia spp., Orthezia praelonga, Parabemisia myricae, Paratrioza spp., Parlatoria spp., Pemphigus spp., Peregrinus maidis, Phenacoccus spp., Phloeomyzus passerinii, Phorodon humuli, Phylloxera spp., Pinnaspis aspidistrae, Planococcus spp., Protopulvinaria pyriformis, 45 Pseudaulacaspis pentagona, Pseudococcus spp., Psylla spp., Pteromalus spp., Pyrilla spp., Quadraspidiotus spp., Quesada gigas, Rastrococcus spp., Rhopalosiphum spp., Saissetia spp., Scaphoides titanus, Schizaphis graminum, Selenaspis articulatus, Sogata spp., Sogatella furcifera, Sogatodes spp., Stictocephala festina, Tenalaphara malayensis, Tinocallis caryaefoliae, Tomaspis spp., Toxoptera spp., Trialeurodes vaporariorum, Trioza spp., Typhlocyba spp., Unaspis spp., Viteus vitifolii.

50 Del orden de los himenópteros, por ejemplo Diprion spp., Hoplocampa spp., Lasius spp., Monomorium pharaonis, Vespa spp.

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

Del orden de los isópteros, por ejemplo Reticulitermes spp., Odontotermes spp.

55 Del orden de los lepidópteros, por ejemplo Acronicta major, Aedia leucomelas, Agrotis spp., Alabama argillacea, Anticarsia spp., Barathra brassicae, Bucculatrix thurberiella, Bupalus piniarius, Cacoecia podana, Capua reticulana, Carpocapsa pomonella, Cheimantobia brumata, Chilo spp., Choristoneura fumiferana, Clysia ambiguella, Cnaphalocerus spp., Earias insulana, Ephestia kuehniella, Euproctis chrysoorrhoea, Euxoa spp., Feltia spp., Galleria mellonella, Helicoverpa spp., Heliothis spp., Hofmannophila pseudospretella, Homona magnanima, Hyponomeuta padella, Laphygma spp., Lithocolletis blancardella, Lithophane antennata, Loxagrotis albicosta, Lymantria spp., 60 Malacosoma neustria, Mamestra brassicae, Mocis repanda, Mythimna separata, Oria spp., Oulema oryzae, Panolis flammea, Pectinophora gossypiella, Phyllocnistis citrella, Pieris spp., Plutella xylostella, Prodenia spp., Pseudaletia spp., Pseudoplusia includens, Pyrausta nubilalis, Spodoptera spp., Thermesia gemmatalis, Tinea pellionella, Tineola bisselliella, Tortrix viridana, Trichoplusia spp.

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

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

Del orden de los sínfilos, por ejemplo *Scutigerella immaculata*.

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

Del orden de los tisanuros, por ejemplo *Lepisma saccharina*.

- 10 A los nematodos parasitarios de las plantas pertenecen, por ejemplo, *Anguina* spp., *Aphelenchoides* spp., *Belonoaimus* spp., *Bursaphelenchus* spp., *Ditylenchus dipsaci*, *Globodera* spp., *Helicotylenchus* spp., *Heterodera* spp., *Longidorus* spp., *Meloidogyne* spp., *Pratylenchus* spp., *Radopholus similis*, *Rotylenchus* spp., *Trichodorus* spp., *Tylenchorhynchus* spp., *Tylenchulus* spp., *Tylenchulus semipenetrans*, *Xiphinema* spp.

- 15 Los compuestos según la invención también pueden usarse, dado el caso, en determinadas concentraciones o dosis como herbicidas, antídotos, reguladores del crecimiento o agentes para mejorar las propiedades de las plantas, o como microbicidas, por ejemplo como fungicidas, antimicóticos, bactericidas, viricidas (incluidos agentes contra viroides) o como agente contra MLO (organismo similar a micoplasma) y RLO (organismo similar a *Rickettsia*). Dado el caso, también pueden usarse como productos intermedios o precursores para la síntesis de otros principios activos.

- 20 Los principios activos pueden convertirse en las formulaciones habituales, como soluciones, emulsiones, polvos humectables, suspensiones basadas en agua y aceite, polvos, polvos para espolvorear, pastas, polvos solubles, gránulos solubles, gránulos para esparcir, concentrados de suspensiones-emulsiones, sustancias naturales impregnadas con principios activos, sustancias sintéticas impregnadas con principios activos, fertilizantes, así como escapsulaciones muy finas en sustancias poliméricas.

- 25 Estas formulaciones se preparan de manera conocida, por ejemplo, mediante mezclado de los principios activos con diluyentes, es decir, disolventes líquidos y/o vehículos sólidos, dado el caso con uso de agentes tensioactivos, es decir, emulsionantes y/o agentes dispersantes y/o agentes espumantes. La preparación de las formulaciones tiene lugar o en instalaciones adecuadas o también antes o durante la aplicación.

- 30 Como coadyuvantes pueden usarse aquellas sustancias que son adecuadas para conferir propiedades especiales al propio agente o y/o a preparados derivados del mismo (por ejemplo, caldos de pulverización, desinfectantes para semillas), como determinadas propiedades técnicas y/o también propiedades biológicas especiales. Como coadyuvantes típicos se consideran: diluyentes, disolventes y vehículos.

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

- 40 En caso de uso de agua como diluyente también pueden usarse, por ejemplo, disolventes orgánicos como disolventes auxiliares. Como disolventes líquidos se consideran esencialmente: compuestos aromáticos como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, compuestos aromáticos clorados e hidrocarburos alifáticos clorados como clorobencenos, cloroetilenos o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos como ciclohexano o parafinas, por ejemplo fracciones de petróleo, aceites minerales y vegetales, alcoholes como butanol o glicol, así como sus éteres y ésteres, cetonas como acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona o ciclohexanona, disolventes fuertemente polares como dimetilsulfóxido, así como agua.

- 45 Como vehículos sólidos se consideran:

- por ejemplo, sales de amonio y polvos minerales naturales como caolines, tierras arcillosas, talco, creta, cuarzo, atapulgita, montmorillonita o tierra de diatomeas y polvos minerales sintéticos como ácido silícico altamente disperso, óxido de aluminio y silicatos, como vehículos sólidos para gránulos se consideran: por ejemplo, rocas naturales rotas y fraccionadas como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita, así como gránulos sintéticos de harinas inorgánicas y orgánicas, así como gránulos de material orgánico como papel, serrín, cáscaras de coco, mazorcas de maíz y tallos de tabaco; como emulsionantes y/o agentes espumantes se consideran: por ejemplo, emulsionantes no ionógenos y aniónicos como ésteres de ácidos grasos de polioxietileno, éteres de alcoholes grasos de polioxietileno, por ejemplo, alquilarilpoliglicoléteres, alquilsulfonatos, arilsulfonatos, así como hidrolizados de proteínas; como agentes dispersantes se consideran sustancias no iónicas y/o iónicas, por ejemplo de las clases de los éteres de POE de alcohol y/o de POP, ésteres de ácidos y/o de POP-POE, éteres de alquilarilo y/o de POP-POE, aductos de grasas y/o de POP-POE, derivados de POE y/o de POP-poliol, aductos de POE y/o de POP-sorbitano o de azúcares, sulfatos de alquilo o arilo, sulfonatos y fosfatos o los aductos de PO-éter correspondientes. Además, oligómeros o polímeros adecuados, por ejemplo, partiendo de monómeros vinílicos, de ácido acrílico, de EO y/o PO solo o junto con, por ejemplo, (poli-)alcoholes o (poli-)aminas. Además, puede usarse lignina y su derivado de ácido sulfónico, celulosas sencillas o modificadas, ácidos sulfónicos aromáticos y/o alifáticos, así como sus aductos con formaldehído.
- 60

En las formulaciones pueden usarse agentes adherentes como carboximetilcelulosa, polímeros naturales y

sintéticos, en polvo, granulados o con forma de látex, como goma arábica, poli(alcohol vinílico), poli(acetato de vinilo), así como fosfolípidos naturales, como cefalinas y lecitinas, y fosfolípidos sintéticos.

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

Otros aditivos pueden ser sustancias olorosas, aceites minerales o vegetales, dado el caso aceites, ceras y nutrientes modificados (también micronutrientes), como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc.

Además, pueden estar contenidos estabilizadores como estabilizadores del frío, conservantes, antioxidantes, agentes fotoprotectores u otros agentes que mejoran la estabilidad química y/o física.

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

15 El principio activo según la invención puede presentarse en sus formulaciones habituales en el comercio, así como en las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones mezcladas otros principios activos como insecticidas, atrayentes, esterilizantes, bactericidas, acaricidas, nematocidas, fungicidas, sustancias reguladoras del crecimiento, herbicidas, sustancias protectoras, fertilizantes o productos semioquímicos.

Componentes de mezcla especialmente favorables son, por ejemplo, los siguientes:

**Fungicidas:**

Inhibidores de la síntesis de ácidos nucleicos

20 Benalaxil, benalaxil-M, bupirimato, quiralaxil, clozilacon, dimetirimol, etirimol, furalaxil, himexazol, metalaxil, metalaxil-M, ofurace, oxadixil, ácido oxolínico

Inhibidores de la mitosis y división celular

Benomilo, carbendazima, dietofencarb, fuberidazol, pencicuron, tiabendazol, tiofanato-metilo, zoxamida

Inhibidores del complejo I de la cadena respiratoria

Diflumentorim

25 Inhibidores del complejo II de la cadena respiratoria

Boscalid, carboxina, fenfuram, flutolanil, furametpir, mepronilo, oxicarboxina, pentiopirad, tifluzamida

Inhibidores del complejo III de la cadena respiratoria

Azoxistrobina, ciazofamida, dimoxistrobina, enestrobina, famoxadona, fenamidona, fluoxastrobina, kresoxim-metilo, metominostrobin, orisastrobina, piraclostrobina, picoxistrobina, trifloxistrobina

30 Desacopladores

Dinocap, fluazinam

Inhibidores de la producción de ATP

Acetato de fentina, cloruro de fentina, hidróxido de fentina, siltiofam

Inhibidores de la biosíntesis de aminoácidos y proteínas

35 Andoprim, blasticidina-S, ciprodinil, kasugamicina, clorhidrato de kasugamicina hidratado, mepanipirim, pirimetanil

Inhibidores de la transducción de señales

Fenpiclonilo, fludioxonil, quinoxifeno

Inhibidores de la síntesis de grasas y membranas

Clozolinato, iprodiona, procimidona, vinclozolina

40 Ampropilfos, ampropilfos de potasio, edifenfos, iprobenfos (IBP), isoprotilano, pirazofos, tolclofos-metilo, bifenilo

Yodocarb, propamocarb, clorhidrato de propamocarb

Inhibidores de la biosíntesis del ergosterol

Fenhexamida,

45 Azaconazol, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, diclobutrazol, difenoconazol, diniconazol, diniconazol-M, epoxiconazol, etaconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, furconazol, furconazol-cis, hexaconazol, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanil, paclobutrazol, penconazol, propiconazol, protioconazol,

simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefon, triadimenol, triticonazol, uniconazol, voriconazol, imazalil, sulfato de imazalil, oxpoconazol, fenarimol, flurprimidol, nuarimol, pirifenox, triforina, pefurazoato, procloraz, triflumizol, viniconazol,

Aldimorf, dodemorf, acetato de dodemorf, fenpropimorf, tridemorf, fenpropidin, espiroxamina,

5 Naftifina, piributicarb, terbinafina

Inhibidores de la síntesis de pared celular

Bentiavalicarb, bialafos, dimetomorf, flumorf, iprovalicarb, polioxinas, polioxorim, validamicina A

Inhibidores de la biosíntesis de melanina

Capropamida, diclocimet, fenoxanil, ftalida, piroquilona, triciclazol

10 Inducción de resistencia

Acibenzolar-S-metilo, probenazol, tiadinil

Multisitio

15 Captafol, captan, clorotalonilo, sales de cobre como: hidróxido de cobre, naftenato de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato de cobre, óxido de cobre, oxina-cobre y mezcla de Burdeos, diclofluanida, ditanona, dodina, base sin dodina, ferbam, folpet, fluorfolpet, guazatina, acetato de guazatina, iminocadina, albesilato de iminocadina, triacetato de iminocadina, mancobre, mancozeb, maneb, metiram, metiram cinc, propineb, azufre y preparados de azufre que contienen poli(sulfuro de calcio), tiram, tolilfluanida, zineb, ziram

Mecanismo desconocido

20 Amibromdol, bentiazol, betoxazin, capsimicina, carvona, quinometionato, cloropicrina, cufraneb, ciflufenamida, cimoxanilo, dazomet, debacarb, diclomezina, diclorofeno, dicloran, difenzoquat, metilsulfato de difenzoquat, difenilamina, etaboxam, ferimzón, flumetover, flusulfamida, fluopicolid, fluoroimid, hexaclorobenceno, sulfato de 8-hidroxiquinolina, irumamicina, metasulfocarb, metrafenona, isotiocianato de metilo, mildiomicina, natamicina, dimetilditiocarbamato de níquel, nitrotal-isopropil, octilina, oxamocarb, oxifentiina, pentaclorofenol y sales, 2-fenilfenol y sales, piperalina, propanosina-sodio, proquinazid, pirrolnitrin, quintozena, tecloftalam, tecnazeno, triazóxido, 25 triclamida, zarilamid y 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)-piridina, N-(4-cloro-2-nitrofenil)-N-etil-4-metil-bencenosulfonamida, 2-amino-4-metil-N-fenil-5-tiazolcarboxamida, 2-cloro-N-(2,3-dihidro-1,1,3-trimetil-1H-inden-4-il)-3-piridincarboxamida, 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetilisoxazolidin-3-il]piridina, cis-1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-cicloheptanol, 2,4-dihidro-5-metoxi-2-metil-4-[[[1-[3-(trifluorometil)-fenil]-etiliden]-amino]-oxi]-metil]-fenil]-3H-1,2,3-triazol-3-ona (185336-79-2), 1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-inden-1-il)-1H-imidazol-5-carboxilato de metilo, 3,4,5-tricloro-2,6-piridindicarbonitrilo, 2-[[[ciclopropil[(4-metoxifenil)imino]metil]tio]metil]-alfa-(metoximetilen)-benzoacetato de metilo, 4-cloro-alfa-propinilo-N-[2-[3-metoxi-4-(2-propinilo)fenil]etil]-benzacetamida, (2S)-N-[2-[4-[3-(4-clorofenil)-2-propinilo]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(metilsulfonil)amino]-butanamida, 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina, 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-N-[(1R)-1,2,2-trimetilpropil][1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-amina, 5-cloro-N-[(1R)-1,2-dimetilpropil]-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-amina, N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2,4-dicloronicotinamida, N-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)metil-2,4-dicloronicotinamida, 2-butoxi-6-yod-3-propil-benzopiranon-4-ona, N-(Z)-[(ciclopropilmetoxi)imino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil]-2-benzacetamida, N-(3-etil-3,5,5-trimetil-ciclohexil)-3-formilamino-2-hidroxi-benzamida, 2-[[[1-[3-(1-fluoro-2-feniletil)oxi]fenil]etiliden]amino]oxi]metil]-alfa-(metoxiimino)-N-metil-alfa-E-benzacetamida, N-[2-[3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il]etil]-2-(trifluorometil)benzamida, N-(3',4'-dicloro-5-fluorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, N-(6-metoxi-3-piridinil)-ciclopropanocarboxamida, ácido 1-[(4-metoxifenoxi)metil]-2,2-dimetilpropil-1H-imidazol-1-carboxílico, ácido O-[1-[(4-metoxifenoxi)metil]-2,2-dimetilpropil]-1H-imidazol-1-carbotioico, 2-(2-[[6-(3-cloro-2-metilfenoxi)-5-fluoropirimidin-4-il]oxi]fenil)-2-(metoxiimino)-N-metilacetamida

**Bactericidas:**

45 Bronopol, diclorofeno, nitrapirina, dimetilditiocarbamato de níquel, kasugamicina, octilina, ácido furanocarboxílico, oxitetraciclina, probenazol, estreptomina, tecloftalam, sulfato de cobre y otros preparados de cobre.

**Insecticidas / acaricidas / nematocidas:**

Inhibidores de la acetilcolinesterasa (AChE)

Carbamatos,

50 por ejemplo, alanicarb, aldicarb, aldoxicarb, alixicarb, aminocarb, bendiocarb, benfuracarb, bufencarb, butacarb, butocarboxim, butoxicarboxim, carbaril, carbofurano, carbosulfan, cloetocarb, dimetilan, etiofencarb, fenobucarb, fenotiocarb, formetanato, furatiocarb, isoprocarb, metam-sodio, metiocarb, metomilo, metolcarb, oxamilo, pirimicarb, promecarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, trimetacarb, XMC, xilicarb, triazamato

Organofosfatos,

55 por ejemplo, acefato, azametifós, azinfos (-metil, -etil), bromofosetilo, bromfenvinfos (-metilo), butatiofos, cadusafos, carbofenotio, cloretiofos, clorfenvinfos, clormefos, clorpirifos (-metilo/-etilo), coumafos, cianofenfos, cianofos, clorfenvinfos, demeton-S-metil, demeton-S-metilsulfona, dialifos, diazinón, diclofentio, diclorvos/DDVP, dicrotofos, dimetoato, dimetilvinfos, dioxabenzofos, disulfotón, EPN, etión, etoprofos, etrimfos, famfur, fenamifos, fenitroton,

5 fensulfotión, fention, flupirazofos, fonofos, formotion, fosmetilán, fostiazato, heptenofos, yodofenfos, iprobenfos, isazofos, isofenfos, O-salicilato de isopropilo, isoxatión, malatión, mecarbam, metacrifos, metamidofos, metidatió, mevinfos, monocrotófos, naled, ometoato, oxidemetón-metilo, paratió (-metil/-etil), fentoato, forato, fosalón, fosmet, fosfamidón, fosfocarb, foxim, pirimifos (-metilo/-etilo), profenofos, propafos, propetamfos, protiofos, protoato, piraclofos, piridafention, piridation, quinalfos, sebufos, sulfotep, sulprofos, tebupirimfos, temefos, terbufos, tetraclorovinfos, tiometon, triazofos, triclorfón, vamidotión

Moduladores de los canales de sodio / bloqueadores de los canales de sodio dependientes del voltaje

Piretroides,

10 por ejemplo, acrinatrina, alletrina (d-cis-trans, d-trans), beta-ciflutrina, bifentrina, bioaletrina, isómero de bioaletrina-S-ciclopentilo, bioetanometrina, biopermetrina, bioresmetrina, clovaportrina, cis-cipermetrina, cis-resmetrina, cis-permetrina, clocitrina, cicloprotrina, ciflutrina, cihalotrina, cipermetrina (alfa-, beta-, teta-, zeta-), cifenotrina, deltametrina, empentrina (isómero 1R), esfenvalerato, etofenprox, fenflutrina, fenpropatrina, fenpiritrina, fenvalerato, flubrocitrinato, flucitrinato, flufenprox, flumetrina, fluvalinato, fubfenprox, gamma-cihalotrina, imiprotrina, kadetrina, lambda-cihalotrina, metoflutrina, permetrina (cis-, trans-), fenotrina (isómero 1R-trans), praletrina, proflutrina, protrifenbuto, piresmetrina, resmetrina, RU 15525, silafluofeno, tau-fluvalinato, teflutrina, teraletrina, tetrametrina (isómero 1R), tralometrina, transflutrina, ZXI 8901, piretrinas (piretrum)

DDT

Oxadiazinas,

por ejemplo indoxacarb

20 Semicarbazona,

por ejemplo metaflumizona (BAS3201)

Agonistas / antagonistas de receptores de acetilcolina

Cloronicotinilos,

por ejemplo, acetamiprid, clotianidin, dinotefuran, imidacloprid, nitenpiram, nitiazina, tiacloprid, tiametoxam

25 Nicotina, bensultap, cartap

Moduladores de los receptores de acetilcolina

Espinosinas,

por ejemplo espinosad

Antagonistas de canales de cloruro controlados por GABA

30 Organocloro,

por ejemplo, canfecloro, clordano, endosulfan, gamma-HCH, HCH, heptacloro, lindano, metoxicloro

Fiproles,

por ejemplo, acetoprol, etiprol, fipronil, pirafluprol, piriprol, vaniliprol

Activadores de canales de cloruro

35 Mectinas,

por ejemplo, abamectina, emamectina, benzoato de emamectina, ivermectina, lepimectina, milbemicina

Miméticos de la hormona juvenil,

por ejemplo, diofenolan, epofenonano, fenoxicarb, hidropreno, kinopreno, metopreno, piriproxifen, tripreno

Agonistas / disruptores de ecdisona

40 Diacilhidrazinas,

por ejemplo cromafenozida, halofenozida, metoxifenozida, tebufenozida

Inhibidores de la biosíntesis de quitina

Benzoilureas,

45 por ejemplo, bistrifluron, clofluazuron, diflubenzuron, fluazuron, flucicloخور, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, penfluron, teflubenzuron, triflumuron

Buprofezina

- Ciromazina
- Inhibidores de la fosforilación oxidativa, disruptores de ATP
- Diafentiurón
- Compuestos de organoestaño,
- 5     por ejemplo azociclotina, cihexatin, óxidos de fenbutatina
- Desacopladores de la fosforilación oxidativa mediante interrupción de gradientes de protones H
- Pirroles,
- por ejemplo clorfenapir
- Dinitrofenoles,
- 10    por ejemplo binapacril, dinobuton, dinocap, DNOC
- Inhibidores del transporte de electrones al sitio I
- METI,
- por ejemplo, fenazaquin, fenpiroximato, pirimidifen, piridabeno, tebufenpirad, tolfenpirad
- Hidrametilnona
- 15    Dicofol
- Inhibidores del transporte de electrones al sitio II
- Rotenona
- Inhibidores del transporte de electrones al sitio III
- Acequinocilo, fluacripirim
- 20    Disruptores microbianos de la membrana intestinal de insectos
- Cepas de *Bacillus thuringiensis*
- Inhibidores de la síntesis de grasas
- Ácidos tetrónicos,
- por ejemplo, espirodiclofen, espiromesifen
- 25    Ácidos tetrámicos,
- por ejemplo spirotettratamat, cis-3-(2,5-dimetilfenil)-4-hidroxi-8-metoxi-1-azaespiro[4.5]dec-3-en-2-ona
- Carboxamidas,
- por ejemplo flonicamida
- Agonistas octopaminérgicos,
- 30    por ejemplo amitraz
- Inhibidores de la ATPasa estimulada con magnesio,
- Propargita
- Análogos de la nereistoxina,
- por ejemplo tiociclám-hidrógeno-oxalatos, tiosultap-sodio
- 35    Agonistas del receptor rianodin,
- Dicarboxamidas de ácido benzoico,
- por ejemplo flubendiamida
- Antranilamidas,
- 40    por ejemplo rinaxipir (3-bromo-N-{4-cloro-2-metil-6-[(metilamino)carbonil]fenil}-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-carboxamidas)

Productos biológicos, hormonas o feromonas

Azadirachtina, Bacillus spec, Beauveria spec, Codlemone, Metarrhizium spec, Paecilomyces spec, Thuringiensin, Verticillium spec.

Principios activos con mecanismos de acción desconocidos o no específicos

5 Fumigantes,

por ejemplo fosfuros de aluminio, bromuros de metilo, fluoruros de sulfuro

Inhibidores de efecto antinutritivo,

por ejemplo criolita, flonicamida, pimetozina

Inhibidores del crecimiento de ácaros,

10 por ejemplo clofentezina, etoxazol, hexitiazox

Amidoflomet, benclotiaz, benzoximato, bifenazato, bromopropilato, buprofezin, quinometionato, clordimeform, clorobencilato, cloropicrina, clotiazoben, ciclopreno, ciflometofen, diciclanilo, fenoxacrim, fentripanil, flubenzimina, flufenimerim, flutenzin, gossyplure, hidrametilnona, japoniluro, metoxadiazona, petróleo, butóxido de piperonilo, oleato de potasio, piridalilo, sulfluramida, tetradifon, tetrasul, triaratenol, verbutin.

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

20 Además, los principios activos según la invención pueden presentarse en el uso como insecticidas en sus formulaciones habituales en el comercio, así como en las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones mezcladas con agentes sinérgicos. Los agentes sinérgicos son compuestos a través de los que se aumenta el efecto de los principios activos sin que el agente sinérgico añadido deba ser por sí mismo activamente eficaz. Especialmente pueden añadirse sales de amonio o fosfonio y/o promotores de la penetración para aumentar el efecto.

25 Los principios activos según la invención pueden presentarse además en el uso como insecticidas en sus formulaciones habituales en el comercio, así como en las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones en mezclas con inhibidores, que evitan una descomposición del principio activo después de la aplicación en el entorno de la planta, en la superficie de las partes vegetales o en tejidos vegetales.

30 El contenido de principio activo de las formas de aplicación preparadas a partir de las formulaciones habituales en el comercio puede variar en amplios intervalos. La concentración de principio activo de las formas de aplicación puede ser del 0,0000001 hasta el 95 % en peso de principio activo, preferentemente entre el 0,00001 y el 1 % en peso.

La aplicación se produce de un modo habitual adaptado a las formas de aplicación.

35 Según la invención pueden tratarse todas las plantas y partes vegetales. A este respecto, por plantas se entienden todas las plantas y poblaciones vegetales, como plantas silvestres o plantas de cultivo deseadas y no deseadas (incluidas plantas de cultivo de procedencia natural). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que pueden obtenerse mediante procedimientos de cultivo y optimización convencionales o mediante procedimientos biotecnológicos y genéticos o combinaciones de estos procedimientos, incluidas las plantas transgénicas e incluidas las variedades vegetales que pueden estar protegidas o pueden no estar protegidas por los derechos de protección de especies. Por partes vegetales deben entenderse todas las partes y órganos superficiales y subterráneos de las plantas, como brote, hoja, flor y raíz, enumerándose a modo de ejemplo hojas, acículas, tallos, troncos, flores,

40 cuerpos fructíferos, frutos y semillas, así como raíces, tubérculos y rizomas. A las partes vegetales también pertenece la cosecha, así como el material de multiplicación vegetativo y generativo, por ejemplo plantones, tubérculos, rizomas, esquejes y semillas.

45 El tratamiento de las plantas y las partes vegetales según la invención con los principios activos tiene lugar directamente o mediante acción sobre su entorno, hábitat o espacio de almacenamiento según los procedimientos de tratamiento habituales, por ejemplo, mediante inmersión, pulverización, gasificación, nebulizado, espolvoreado, recubrimiento, inyección y, en el caso del material de multiplicación, especialmente de semillas, además mediante envoltorio de una o varias capas.

50 Como ya se menciona anteriormente, según la invención pueden tratarse todas las plantas y sus partes. En una forma de realización preferente se tratan especies vegetales y variedades vegetales de procedencia silvestre u obtenidas mediante procedimientos de cultivo biológico convencional, como cruce o fusión de protoplastos, así como sus partes. En otra forma de realización preferida se tratan plantas y variedades vegetales transgénicas que se obtuvieron mediante procedimientos genéticos, dado el caso junto con procedimientos convencionales (organismos genéticamente modificados), y sus partes. Los términos "partes" o "partes de las plantas" o "partes vegetales" se explicaron anteriormente.

55 Se prefiere tratar especialmente según la invención plantas de las variedades vegetales respectivamente habituales en el comercio o que se encuentran en uso. Por variedades vegetales se entienden plantas con nuevas propiedades ("rasgos") que se han cultivado tanto por cultivo convencional como por mutagénesis o mediante técnicas de ADN recombinante. Éstas pueden ser obtenciones, biotipos y genotipos.

- 5 Dependiendo de las especies vegetales u variedades vegetales, su hábitat y condiciones de crecimiento (suelos, clima, periodos de vegetación, alimentación), mediante el tratamiento según la invención también pueden aparecer efectos ("sinérgicos") sobreañadidos. Así son posibles, por ejemplo, dosis disminuidas y/o ampliaciones del espectro de acción y/o un refuerzo del efecto de las sustancias y agentes que pueden usarse según la invención, mejor crecimiento vegetal, alta tolerancia frente a temperaturas altas o bajas, alta tolerancia contra la sequedad o contra el contenido de agua o sales en el suelo, alta capacidad para florecer, recolección facilitada, aceleración de la madurez, mayores cosechas, mayor calidad y/o mayor valor nutritivo de los productos recolectados, mayor capacidad de conservación y/o maquinabilidad de los productos recolectados, que superan los efectos que realmente se esperan.
- 10 A las plantas o variedades vegetales transgénicas (obtenidas genéticamente) preferentes que van a tratarse según la invención pertenecen todas las plantas que se han obtenido mediante la modificación genética de material genético, que confiere a estas plantas propiedades valiosas especialmente ventajosas ("rasgos"). Ejemplos de tales propiedades son mejor crecimiento vegetal, alta tolerancia frente a temperaturas altas o bajas, alta tolerancia contra la sequedad o contra el contenido de agua o sales en el suelo, alta capacidad para florecer, recolección facilitada,
- 15 aceleración de la madurez, mayores cosechas, mayor calidad y/o mayor valor nutritivo de los productos recolectados. Otros ejemplos y especialmente destacados de tales propiedades son una alta fitoprotección contra plagas animales y microbianas, como frente a insectos, ácaros, hongos patógenos vegetales, bacterias y/o virus, así como una alta fitotolerancia a determinados principios activos herbicidas. Como ejemplos de plantas transgénicas se mencionan plantas de cultivo importantes como cereales (trigo, arroz), maíz, soja, patatas, remolacha azucarera, tomates, guisantes y otras hortalizas, algodón, tabaco, colza, así como plantas frutales (con los frutos manzanas, peras, cítricos y uvas), destacando especialmente maíz, soja, patatas, algodón, tabaco y colza. Como propiedades ("rasgos") destacan especialmente la alta fitoprotección contra insectos, arácnidos, nematodos y caracoles mediante toxinas que se forman en las plantas, especialmente aquellas que se generan en las plantas (a continuación "plantas Bt") mediante
- 20 el material genético de *Bacillus thuringiensis* (por ejemplo, mediante los genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb y CryIF, así como sus combinaciones). Como propiedades ("rasgos") también destacan especialmente la alta fitoprotección contra hongos, bacterias y virus mediante resistencia sistémica adquirida (SAR), sistemina, fitoalexinas, elicitores, así como genes resistentes y proteínas y toxinas correspondientemente expresadas. Como propiedades ("rasgos") destacan además especialmente la alta fitotolerancia en frente a determinados principios activos herbicidas, por ejemplo imidazolinonas, sulfonilureas, glifosatos o fosfotricina (por ejemplo, gen "PAT"). Los genes que confieren respectivamente las propiedades ("rasgos") deseadas también pueden estar presentes en combinaciones entre sí en las plantas transgénicas. Como ejemplos de "plantas de Bt" se pueden mencionar variedades de maíz, variedades de algodón, variedades de soja y variedades de patatas que se comercializan con las denominaciones comerciales YIELD GARD® (por ejemplo, maíz, algodón, soja), KnockOut® (por ejemplo, maíz), StarLink® (por ejemplo, maíz), Bollgard® (algodón), Nucotn® (algodón) y NewLeaf® (patatas). Como ejemplos de plantas tolerantes a herbicidas se pueden mencionar variedades de maíz, variedades de algodón y variedades de soja que se comercializan con las denominaciones comerciales Roundup Ready® (tolerancia contra glifosato, por ejemplo, maíz, algodón, soja), Liberty Link® (tolerancia contra fosfotricina, por ejemplo colza), IMI® (tolerancia contra imidazolinonas) y STS® (tolerancia contra sulfonilureas, por ejemplo maíz). Como plantas resistentes a herbicidas (convencionalmente cultivadas con tolerancia a herbicidas) también se pueden mencionar las variedades comercializadas con la denominación Clearfield® (por ejemplo maíz). Evidentemente, estas afirmaciones también sirven para variedades vegetales desarrolladas en el futuro o que llegarán en el futuro al mercado con estas propiedades genéticas o propiedades genéticas desarrolladas en el futuro ("rasgos").
- 45 Las plantas enumeradas pueden tratarse especialmente de manera ventajosa según la invención con los compuestos de fórmula general I o las mezclas de principios activos según la invención. Los intervalos preferentes en los principios activos o mezclas anteriormente indicados también son válidos para el tratamiento de estas plantas. Destaca especialmente el tratamiento de las plantas con los compuestos o mezclas especialmente enumerados en el presente texto.
- 50 Los principios activos según la invención actúan no sólo contra plagas vegetales, sanitarias y mercancías, sino también en el sector de la medicina veterinaria contra parásitos animales (ecto y endoparásitos), como garrapatas comunes, garrapatas de las plumas, ácaros de la sarna, trombidiformes, moscas (picadoras y chupadoras), larvas de moscas parásitas, piojos, piojos del cabello, piojos de las plumas y pulgas. A estos parásitos pertenecen:
- 55 Del orden de los anopluros, por ejemplo, Haematopinus spp., Linognathus spp., Pediculus spp., Phtirus spp., Solenopotes spp.
- Del orden de los malófagos y de los subordenes ambliceros, así como ischnóceros, por ejemplo, Trimenopon spp., Menopon spp., Trinoton spp., Bovicola spp., Werneckiella spp., Lepikentron spp., Damalina spp., Trichodectes spp., Felicola spp.
- 60 Del orden de los dípteros y de los subordenes de los nematóceros, así como de los braquíceros, por ejemplo, Aedes spp., Anopheles spp., Culex spp., Simulium spp., Eusimulium spp., Phlebotomus spp., Lutzomyia spp., Culicoides spp., Chrysops spp., Hybomitra spp., Atylotus spp., Tabanus spp., Haematopota spp., Philipomyia spp., Braula spp., Musca spp., Hydrotaea spp., Stomoxys spp., Haematobia spp., Morellia spp., Fannia spp., Glossina spp., Calliphora spp., Lucilia spp., Chrysomyia spp., Wohlfahrtia spp., Sarcophaga spp., Oestrus spp., Hypoderma spp., Gasterophilus spp., Hippobosca spp., Lipoptena spp., Melophagus spp.
- 65 Del orden de los sifonápteros, por ejemplo, Pulex spp., Ctenocephalides spp., Xenopsylla spp., Ceratophyllus spp.
- Del orden de los heterópteros, por ejemplo, Cimex spp., Triatoma spp., Rhodnius spp., Panstrongylus spp.
- Del orden de los blatarios, por ejemplo, Blatta orientalis, Periplaneta americana, Blattella germanica, Supella spp.

De la subclase de los ácaros (acáridos) y de los ordenes de los metastigmados, así como mesostigmados, por ejemplo, *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Otobius* spp., *Ixodes* spp., *Amblyomma* spp., *Boophilus* spp., *Dermacentor* spp., *Haemophysalis* spp., *Hyalomma* spp., *Rhipicephalus* spp., *Dermanyssus* spp., *Raillietia* spp., *Pneumonyssus* spp., *Sternostoma* spp., *Varroa* spp.

- 5 Del orden de los actinédidos (prostigmados) y acarídidos (astigmados), por ejemplo, *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp., *Ornithocheyletia* spp., *Myobia* spp., *Psorergates* spp., *Demodex* spp., *Trombicula* spp., *Listrophorus* spp., *Acarus* spp., *Tyrophagus* spp., *Caloglyphus* spp., *Hypodectes* spp., *Pterolichus* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Otodectes* spp., *Sarcoptes* spp., *Notoedres* spp., *Knemidocoptes* spp., *Cytodites* spp., *Laminosioptes* spp.

- 10 Los principios activos de fórmula (I) según la invención también son adecuadas para el control de artrópodos que infestan animales de producción agrícola, como por ejemplo ganado vacuno, ovejas, cabras, caballos, cerdos, burros, camellos, búfalos, conejos, pollos, pavos, patos, gansos, abejas, otros animales domésticos, como por ejemplo perros, gatos, aves domésticas, peces de acuario, así como los denominados animales de experimentación, como por ejemplo hámsteres, cobayas, ratas y ratones. Mediante el control de estos artrópodos deben evitarse casos de muerte y disminuciones del rendimiento (en la carne, leche, lanas, pieles, huevos, miel, etc.), de manera que mediante el uso de los principios activos según la invención es posible una cría de animales más económica y más fácil.

- 20 La aplicación de los principios activos según la invención se produce en el sector veterinario y en la cría de animales de manera conocida mediante administración enteral en forma de, por ejemplo, comprimidos, cápsulas, pociones, brebajes, gránulos, pastas, bolos, del procedimiento a través del alimento, de supositorios, mediante administración parenteral, como por ejemplo mediante inyecciones (intramuscular, subcutánea, intravenosa, intraperitoneal, entre otras), implantes, mediante aplicación nasal, mediante aplicación dérmica en forma de, por ejemplo, inmersión o baño (empapado), rociado (pulverización), vertido (en el dorso y en la cruz), de lavado, de empolvado, así como con ayuda de cuerpos moldeados que contienen principios activos, como collares, marcas para las orejas, marcas para la cola, bandas para extremidades, ronzales, dispositivos de marcaje, etc.

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

- 30 Además, se encontró que los compuestos según la invención muestran un alto efecto insecticida contra los insectos que destruyen materiales industriales.

A modo de ejemplo y con preferencia, pero sin limitación, se mencionan los siguientes insectos:

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

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

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

Tisanuros como *Lepisma saccharina*.

Por materiales industriales se entienden en el presente contexto los materiales inanimados, como preferentemente plásticos, adhesivos, colas, papeles y cartones, piel, madera, productos de transformación de la madera y materiales de recubrimiento.

- 45 Los agentes listos para su aplicación todavía pueden contener, dado el caso, otros insecticidas y, dado el caso, incluso uno o varios fungicidas.

En lo referente a posibles componentes de mezcla adicionales se remite a los insecticidas y fungicidas anteriormente mencionados.

- 50 Al mismo tiempo, los compuestos según la invención pueden usarse para proteger de incrustaciones de objetos, especialmente de cascos de buques, tamices, redes, obras civiles, instalaciones del muelle e instalaciones de señalización que están en contacto con agua de mar o salobre.

Además, los compuestos según la invención pueden usarse solos o en combinación con otros principios activos, como agentes antiincrustantes.

- 55 Los principios activos también son adecuados para el control de plagas animales en la protección doméstica, higiénica y de productos, especialmente de insectos, arácnidos y ácaros, que pueden estar presentes en espacios cerrados, como por ejemplo viviendas, naves de fábricas, oficinas, cabinas de automóviles, entre otros. Pueden usarse para combatir estos organismos nocivos solos o en combinación con otros principios activos o coadyuvantes en productos insecticidas domésticos. Son eficaces contra especies sensibles y resistentes, así como contra todos los estadios de desarrollo. A estos organismos nocivos pertenecen:

- 60 Del orden de los escorpiones, por ejemplo, *Buthus occitanus*.

Del orden de los acarinos, por ejemplo, *Argas persicus*, *Argas reflexus*, *Bryobia* ssp., *Dermanyssus gallinae*, *Glyciphagus domesticus*, *Ornithodoros moubat*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Trombicula alfreddugesi*, *Neutrombicula autumnalis*, *Dermatophagoides pteronissimus*, *Dermatophagoides farinae*.

Del orden de las arañas, por ejemplo, avicularias, araneidas.

- 5 Del orden de los opiliones, por ejemplo, *Pseudoscorpiones chelifer*, *Pseudoscorpiones cheiridium*, *Opiliones phalangium*.

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

Del orden de los diplópodos, por ejemplo, *Blaniulus guttulatus*, *Polydesmus* spp.

Del orden de los quilópodos, por ejemplo, *Geophilus* spp..

- 10 Del orden de los zigentomas, por ejemplo, *Ctenolepisma* spp., *Lepisma saccharina*, *Lepismodes inquilinus*.

Del orden de los blatarios, por ejemplo, *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Blattella asahinai*, *Leucophaea maderae*, *Panchlora* spp., *Parcoblatta* spp., *Periplaneta australasiae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Supella longipalpa*.

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

- 15 Del orden de los dermápteros, por ejemplo, *Forficula auricularia*.

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

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

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

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

- 25 Del orden de los lepidópteros, por ejemplo, *Achroia grisella*, *Galleria mellonella*, *Plodia interpunctella*, *Tinea cloacella*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*.

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

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

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

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

- 35 La aplicación en el campo de los insecticidas domésticos tiene lugar sola o en combinación con otros principios activos adecuados, como ésteres del ácido fosfórico, carbamatos, piretroides, neonicotinoides, reguladores del crecimiento o principios activos de otras clases de insecticidas conocidos.

- 40 La aplicación tiene lugar en aerosoles, medios de pulverización sin presión, por ejemplo aerosoles de bomba y de pulverización, distribuidores automáticos de niebla, nebulizadores térmicos, espumas, geles, productos de evaporación con pastillas de evaporación de celulosa o plástico, evaporadores de líquidos, evaporadores de gel y de membrana, evaporadores accionados por propulsores, sistemas de evaporación sin energía o pasivos, papeles antipolillas, saquitos antipolillas y geles antipolillas, como gránulos o polvos, en cebos de dispersión o puntos de cebo.

Los siguientes ejemplos de preparación y uso ilustran la invención, sin limitarla.

- 45 **Ejemplos de preparación**

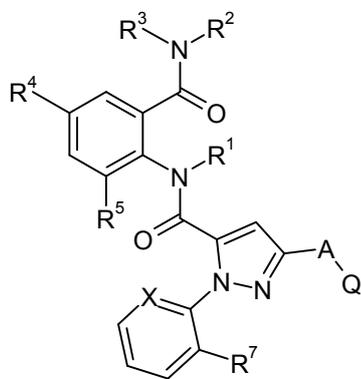
Ejemplo 1

(4-Cloro-2-metil-6-metilcarbamoil-fenil)-amida del ácido 5-(3,5-bis-trifluorometil-pirazol-1-ilmetil)-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico (I-1-1):

- 50 Se disponen previamente 300 mg (509 µmol) de 2-[5-(3,5-bis-trifluorometil-pirazol-1-ilmetil)-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-il]-6-cloro-8-metil-benzo[d][1,3]oxazin-4-ona en 3,3 ml tetrahydrofurano y se añaden gota a gota 764 µl (1,53 mmol) de una solución 2 M de metilamina en tetrahydrofurano. Se agita 1 h a 50 °C, después del enfriamiento el disolvente se elimina al vacío y el residuo se purifica en gel de sílice (ciclohexano/acetato de etilo = 2 : 1 → 1 : 1).

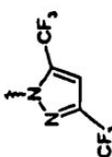
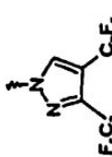
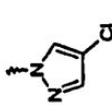
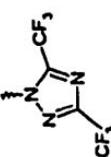
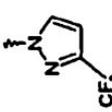
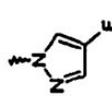
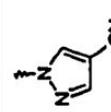
Rendimiento: 200 mg (logP: 3,67)

Los siguientes compuestos de fórmula (I-1) se obtienen análogamente al ejemplo anteriormente enumerado (I-1-1), así como la descripción general.

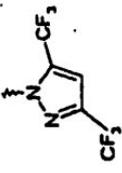
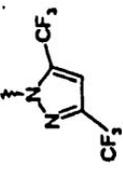
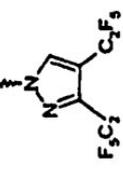
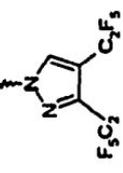
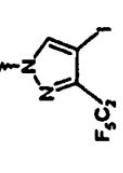
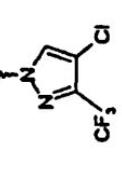
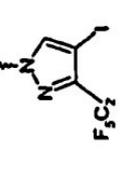


(I-1)

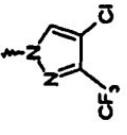
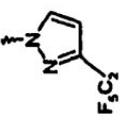
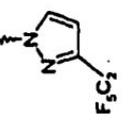
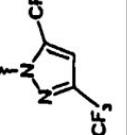
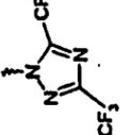
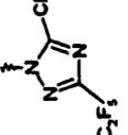
Tabla 1

N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-2	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4.08
I-1-3	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4.39
I-1-4	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2.54
I-1-5	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3.88
I-1-6	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3.27
I-1-7	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2.70
I-1-8	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2.57
I-1-9	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2.45

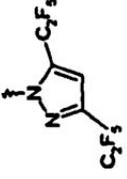
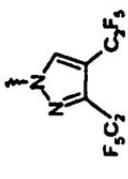
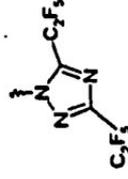
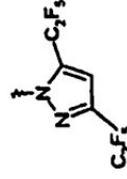
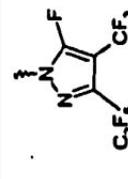
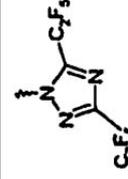
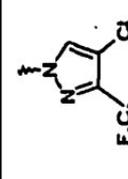
(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-10	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		CH	Cl	4.70
I-1-11	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		CH	Cl	4.12
I-1-12	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4.89
I-1-13	H	H	<i>i</i> -Pr	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4.98
I-1-14	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4.29
I-1-15	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3.85
I-1-16	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3.79

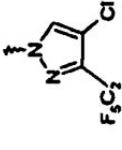
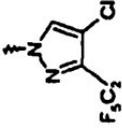
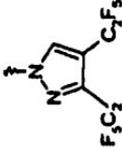
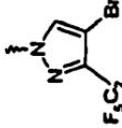
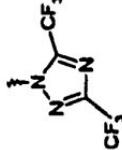
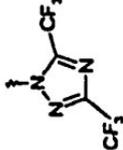
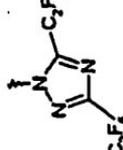
(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-17	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3.35
I-1-18	H	H	i-Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3.75
I-1-19	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3.29
I-1-20	H	H	i-Pr	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4.16
I-1-21	H	H	i-Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2.02
I-1-22	H	H	i-Pr	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3.91
I-1-23	H	H	i-Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4.25

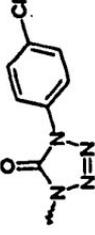
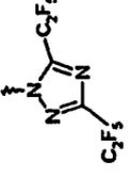
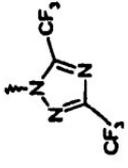
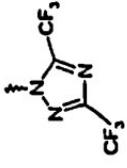
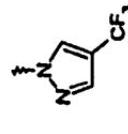
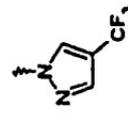
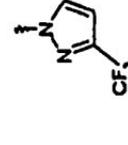
(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-24	H	H	CH <sub>3</sub>	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4.49
I-1-25	H	H	CH <sub>3</sub>	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4.39
I-1-26	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4.17
I-1-27	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4.45
I-1-28	H	H	i-Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4.63
I-1-29	H	H	i-Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4.64
I-1-30	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3.77

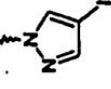
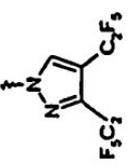
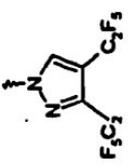
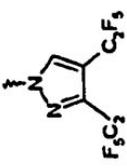
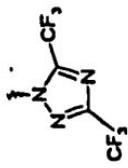
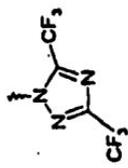
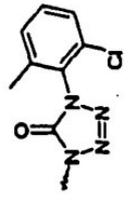
(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-31	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4.21
I-1-32	H	H	CH <sub>2</sub> CN	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3.70
I-1-33	H	H	CH <sub>2</sub> CN	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4.28
I-1-34	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3.80
I-1-35	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3.43
I-1-36	H	H	CH <sub>3</sub>	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3.52
I-1-37	H	H	<i>i</i> -Pr	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4.73

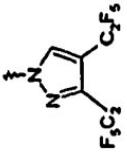
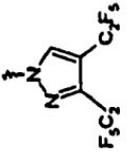
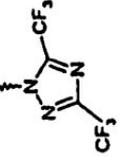
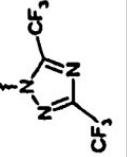
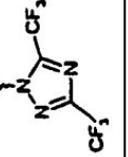
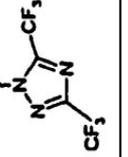
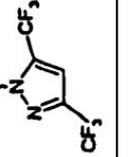
(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-38	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,28
I-1-39	H	H	CH <sub>3</sub>	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,31
I-1-40	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		CCl	Cl	4,58
I-1-41	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		CCl	Cl	4,13
I-1-42	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,76
I-1-43	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,20
I-1-44	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,92

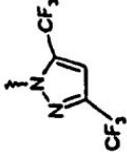
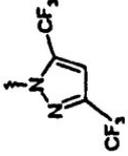
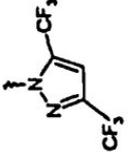
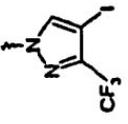
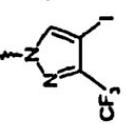
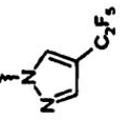
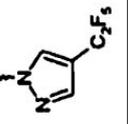
(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-45	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,67
I-1-46	H	H	<i>o</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,58
I-1-47	H	H	CH <sub>2</sub> CN	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,31
I-1-48	H	H	H	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,15
I-1-49	H	H	CH <sub>2</sub> CN	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,97
I-1-50	H	H	H	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,88
I-1-51	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,52

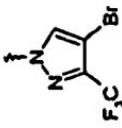
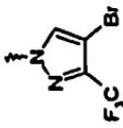
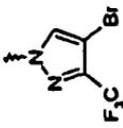
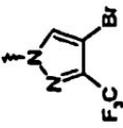
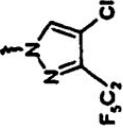
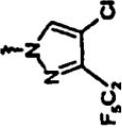
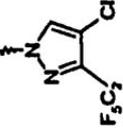
(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-52	H	H	<i>o</i> -Pr	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,59
I-1-53	H	H	H	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,17
I-1-54	H	H	<i>o</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,61
I-1-55	H	H	CH <sub>2</sub> CN	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,40
I-1-56	H	H	CH <sub>2</sub> CN	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,44
I-1-57	H	H	<i>o</i> -Pr	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,67
I-1-58	H	H	CH <sub>3</sub>	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,76

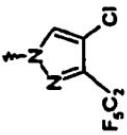
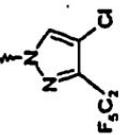
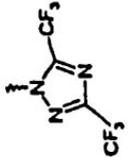
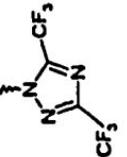
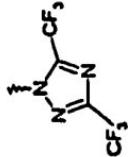
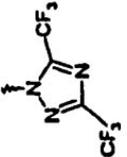
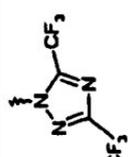
(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-59	H	H	CH <sub>2</sub> CN	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,65
I-1-60	H	H	<i>c</i> -Pr	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,91
I-1-61	H	H	H	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,53
I-1-62	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,41
I-1-63	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,85
I-1-64	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,21
I-1-65	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,67

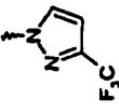
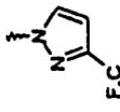
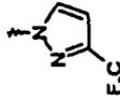
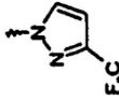
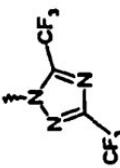
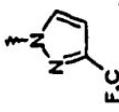
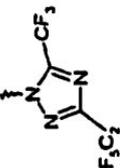
(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-66	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,38
I-1-67	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,78
I-1-68	H	H	CH <sub>3</sub>	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,46
I-1-69	H	H	<i>i</i> -Pr	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,92
I-1-70	H	H	CH <sub>3</sub>	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,94
I-1-71	H	H	<i>i</i> -Pr	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,40
I-1-72	H	H	<i>c</i> -Pr	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,14

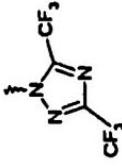
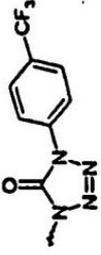
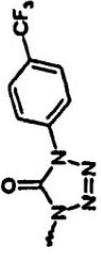
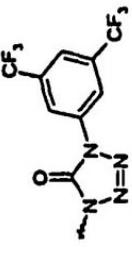
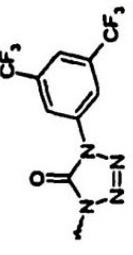
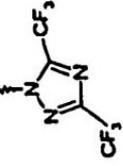
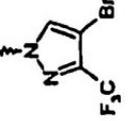
(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-73	H	H	CH <sub>2</sub> CN	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,87
I-1-74	H	H	H	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,68
I-1-75	H	H	(S)-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,04
I-1-76	H	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,49
I-1-77	H	H	(S)-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> O(C=O)NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,58
I-1-78	H	H	(S)-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> O(C=O)NHCH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,36
I-1-79	H	H	CH <sub>2</sub> CN	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,62

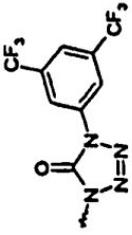
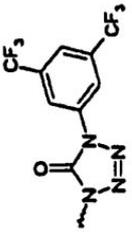
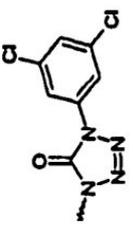
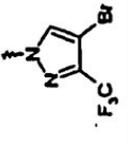
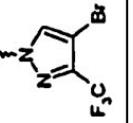
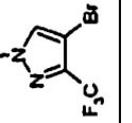
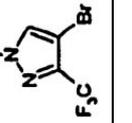
(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-80	H	H	CH <sub>3</sub>	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,99
I-1-81	H	H	<i>i</i> -Pr	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,46
I-1-82	H	H	<i>o</i> -Pr	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,18
I-1-83	H	H	H	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,75
I-1-84	H	H	( <i>S</i> )-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,62
I-1-85	H	H	CH <sub>2</sub> CN	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,98
I-1-86	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,78

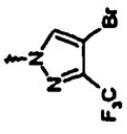
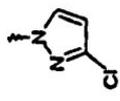
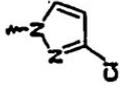
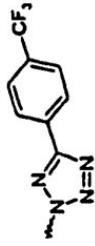
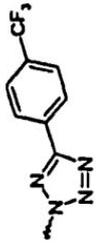
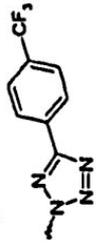
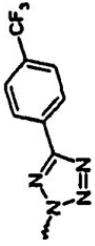
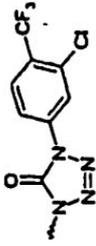
(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-87	H	H	(S)-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,92
I-1-88	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,61
I-1-89	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,96
I-1-90	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,08
I-1-91	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,51
I-1-92	H	H	(S)-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,65
I-1-93	H	H	<i>c</i> -Pr	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,69

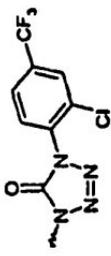
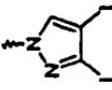
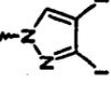
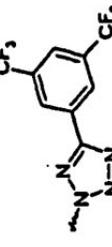
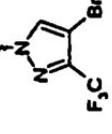
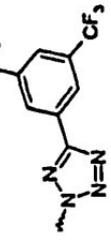
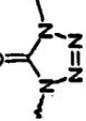
(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-94	H	H	H	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,85
I-1-95	H	H	CH <sub>2</sub> CN	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,01
I-1-96	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,90
I-1-97	H	H	CH <sub>2</sub> CN	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,45
I-1-98	H	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,47
I-1-99	H	H	(S)-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,10
I-1-100	H	H	H	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,24

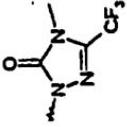
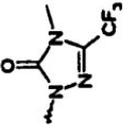
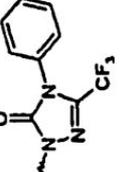
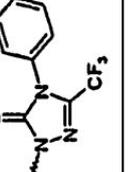
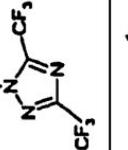
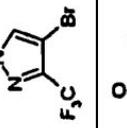
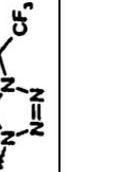
(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-101	H	H	(S)-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,32
I-1-102	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,51
I-1-103	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,96
I-1-104	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,79
I-1-105	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,14
I-1-106	H	H	H	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,46
I-1-107	H	H	CH <sub>2</sub> CN	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,65
I-1-108	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,90

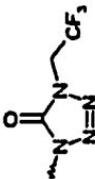
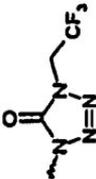
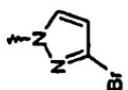
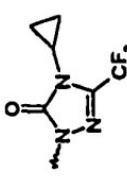
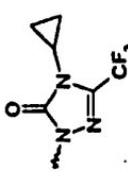
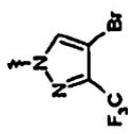
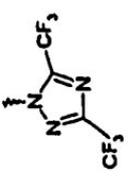
(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-109	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,51
I-1-110	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,13
I-1-111	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,58
I-1-112	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,28
I-1-113	H	H	(S)-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,97
I-1-114	H	H	H	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,03
I-1-115	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,31

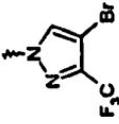
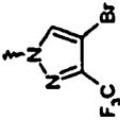
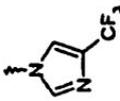
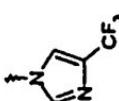
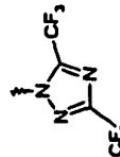
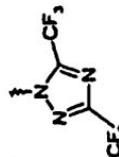
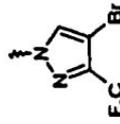
(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-116	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,44
I-1-117	H	H	<i>t</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,85
I-1-118	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,10
I-1-119	H	H	<i>t</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,54
I-1-120	H	H	(S)-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SO(=NH)CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,75
I-1-121	H	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,57
I-1-122	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,51

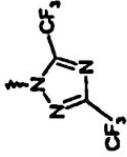
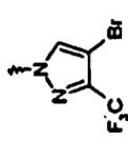
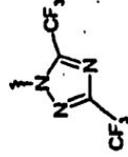
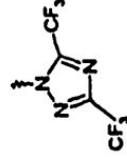
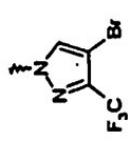
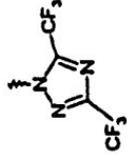
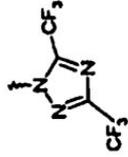
(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-123	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,92
I-1-124	H	H	( <i>S</i> )-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,13
I-1-125	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,56
I-1-126	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,18
I-1-127	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,74
I-1-128	H	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,25
I-1-129	H	H	( <i>S</i> )-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,27

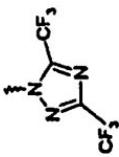
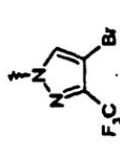
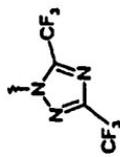
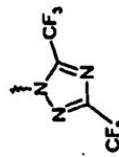
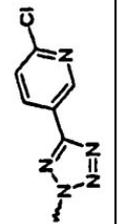
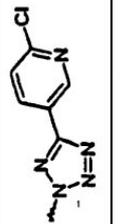
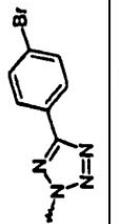
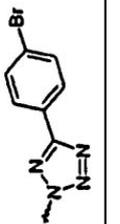
(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-130	H	H	(S)-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,11
I-1-131	H	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,48
I-1-132	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,39
I-1-133	H	H	<i>t</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,77
I-1-134	H	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,63
I-1-135	H	H	(S)-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,24
I-1-136	H	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,23

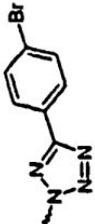
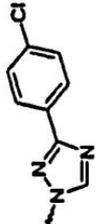
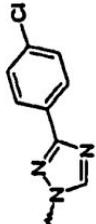
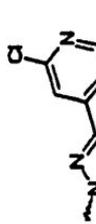
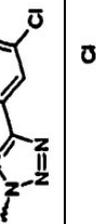
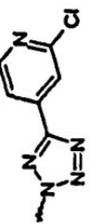
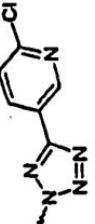
(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-137	H	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,22
I-1-138	H	H	(S)-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,91
I-1-139	H	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,50
I-1-140	H	H	(S)-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,05
I-1-141	H	H	(S)-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,26
I-1-142	H	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,67
I-1-143	H	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,20

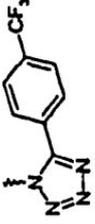
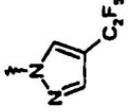
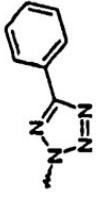
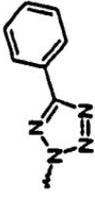
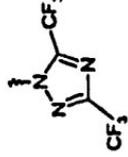
(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-144	H	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,38
I-1-145	H	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,56
I-1-146	H	H	(S)-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,36
I-1-147	H	H	(S)-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,95
I-1-148	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,91
I-1-149	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,41
I-1-150	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,70
I-1-151	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,20

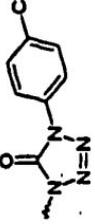
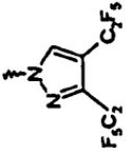
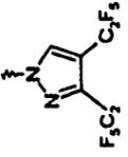
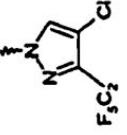
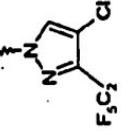
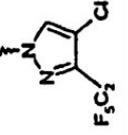
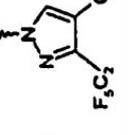
(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-152	H	H	(S)-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,41
I-1-153	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,07
I-1-154	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,56
I-1-155	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,69
I-1-156	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,17
I-1-157	H	H	(S)-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,36
I-1-158	H	H	(S)-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,67
I-1-159	H	H	(S)-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,78

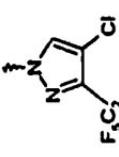
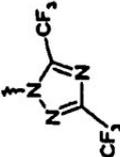
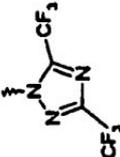
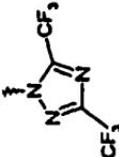
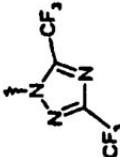
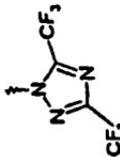
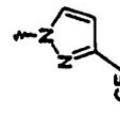
(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-160	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,39
I-1-161	H	H	<i>t</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,87
I-1-162	H	H	( <i>S</i> )-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,10
I-1-163	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,15
I-1-164	H	H	NH[S(=O) <sub>2</sub> ]N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,35
I-1-165	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,09
I-1-166	H	H	<i>t</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,60
I-1-167	H	H	=S( <i>t</i> -Pr) <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,44

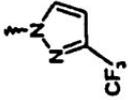
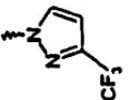
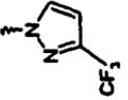
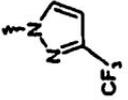
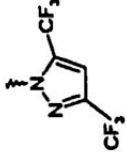
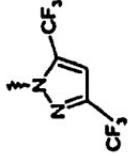
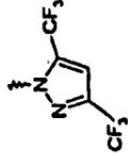
(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-168	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,79
I-1-169	H	H	<i>i</i> -Pr	CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,55
I-1-170	H	H	CH <sub>3</sub>	CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,08
I-1-171	H	H	CH <sub>3</sub>	CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,44
I-1-172	H	H	<i>i</i> -Pr	CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,87
I-1-173	H	H	<i>o</i> -Pr	CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,59
I-1-174	H	H	H	CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,20

(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-175	H	H	CH <sub>2</sub> CN	CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,40
I-1-176	H	H	CH <sub>3</sub>	CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,11
I-1-177	H	H	<i>t</i> -Pr	CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,53
I-1-178	H	H	<i>c</i> -Pr	CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,31
I-1-179	H	H	H	CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,91
I-1-180	H	H	CH <sub>2</sub> CN	CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,11
I-1-181	H	H	CH <sub>3</sub>	CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,57

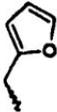
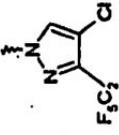
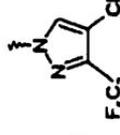
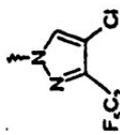
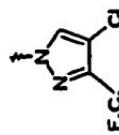
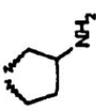
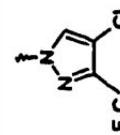
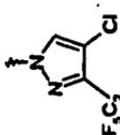
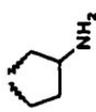
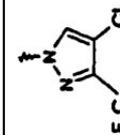
(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-182	H	H	<i>i</i> -Pr	CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,96
I-1-183	H	H	<i>c</i> -Pr	CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,75
I-1-184	H	H	H	CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,42
I-1-185	H	H	CH <sub>2</sub> CN	CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,62
I-1-186	H	H	CH <sub>3</sub>	CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,35
I-1-187	H	H	<i>i</i> -Pr	CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,80
I-1-188	H	H	<i>c</i> -Pr	CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,56

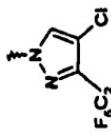
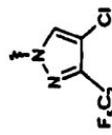
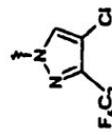
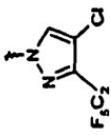
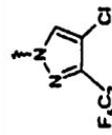
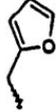
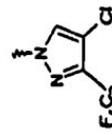
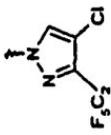
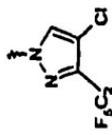
(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-189	H	H	H	CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,15
I-1-190	H	H	CH <sub>2</sub> CN	CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,28
I-1-191	H	H	c-Pr	CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,29
I-1-192	H	H	H	CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,91
I-1-193	H	H	CH <sub>2</sub> CN	CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,04
I-1-194	H	H		CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,18
I-1-195	H	H	(S)-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,13

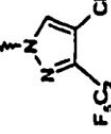
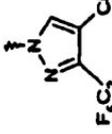
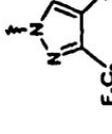
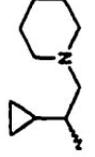
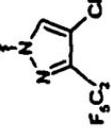
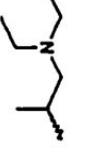
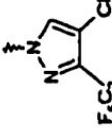
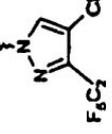
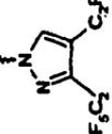
(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-196	H	H		F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,90
I-1-197	H	H		CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,50
I-1-198	H	H		CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,11
I-1-199	H	H		F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,55
I-1-200	H	H		F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,19
I-1-201	H	H		Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,21
I-1-202	H	H		Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,30

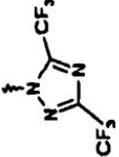
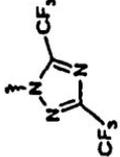
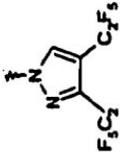
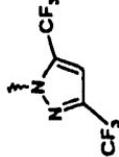
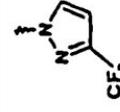
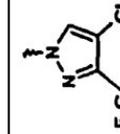
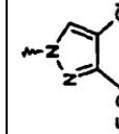
(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-203	H	H		F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,14
I-1-204	H	H	(S)-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,34
I-1-205	H	H		Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,88
I-1-206	H	H	(S)-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,41
I-1-207	H	H		Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,37
I-1-208	H	H		CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,90
I-1-209	H	H	(S)-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,05
I-1-210	H	H	(S)-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,34

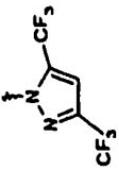
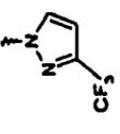
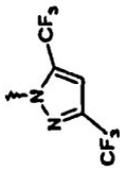
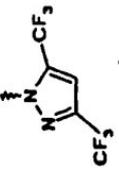
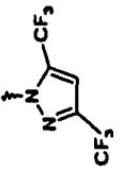
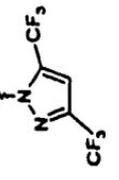
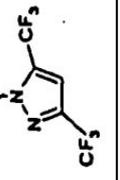
(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-211	H	H	(S)-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,02
I-1-212	H	H	(S)-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,25
I-1-213	H	H	(S)-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,60
I-1-214	H	H		Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,77
I-1-215	H	H		Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,62
I-1-216	H	H	(S)-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,03
I-1-217	H	H	iPr	F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,47

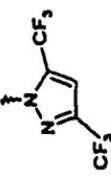
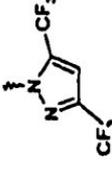
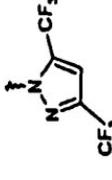
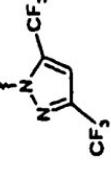
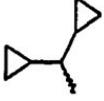
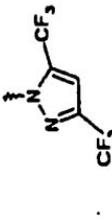
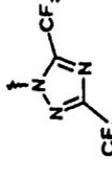
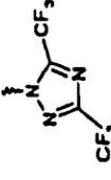
(continuación)

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-218	H	H	<i>i</i> -Pr	F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,55
I-1-219	H	H	CH <sub>3</sub>	F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,12
I-1-220	H	H	CH <sub>3</sub>	F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,06
I-1-221	H	H	CH <sub>3</sub>	F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,32
I-1-222	H	H	CH <sub>3</sub>	F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,58
I-1-223	H	H	CH <sub>3</sub>	F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,47
I-1-224	H	H	<i>i</i> -Pr	F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,89

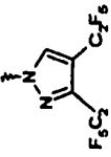
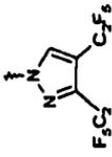
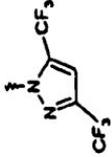
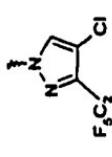
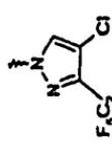
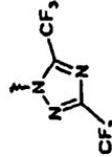
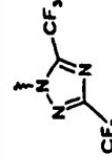
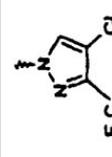
(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-225	H	H	<i>i</i> -Pr	F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,77
I-1-226	H	H	<i>i</i> -Pr	F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,00
I-1-227	H	H	CH <sub>3</sub>	I	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,87
I-1-228	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	I	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,06
I-1-229	H	H	<i>n</i> -Pr	I	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,33
I-1-230	H	H	<i>i</i> -Pr	I	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,29
I-1-231	H	H	<i>c</i> -Pr	I	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,01

(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-232	H	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>		CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	5,28
I-1-233	H	H			CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,55
I-1-234	H	H	H		CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,56
I-1-235	H	H			CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,34
I-1-236	H	H			CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,80
I-1-237	H	H	CH <sub>3</sub>		CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,60
I-1-238	H	H	<i>i</i> -Pr		CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,06

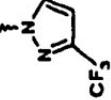
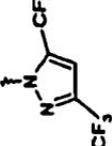
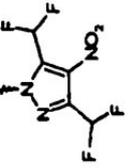
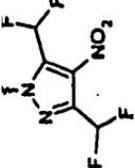
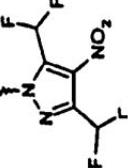
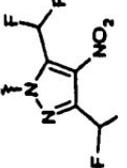
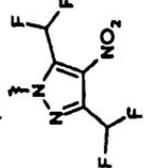
(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-239	H	H	CH <sub>3</sub>		CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,51
I-1-240	H	H	<i>i</i> -Pr		CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,96
I-1-241	H	H	CH <sub>2</sub> CN		CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,73
I-1-242	H	H	<i>i</i> -Pr		CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,40
I-1-243	H	H	CH <sub>3</sub>		CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,96
I-1-244	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>		CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,83
I-1-245	H	H	CH <sub>2</sub> CN		CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,53
I-1-246	H	H	CH <sub>2</sub> CN		CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,85

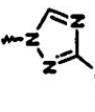
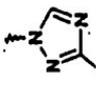
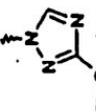
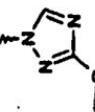
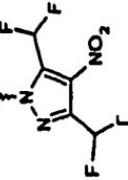
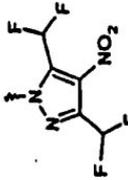
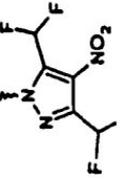
(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-247	H	H	CH <sub>3</sub>		CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,05
I-1-248	H	H	<i>i</i> -Pr		CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,51
I-1-249	H	H	<i>o</i> -Pr		CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,27
I-1-250	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>		CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,28
I-1-251	H	H	CH <sub>2</sub> CN		CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,04
I-1-252	H	H	<i>o</i> -Pr		CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,81
I-1-253	H	H			CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,13
I-1-254	H	H			CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,47

(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-255	H	H			CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,60
I-1-256	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>		CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,84
I-1-257	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,92
I-1-258	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,32
I-1-259	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,27
I-1-260	H	H	<i>c</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,12
I-1-261	H	H	<i>c</i> -Pr	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,08

(continuación)

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-262	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,31
I-1-263	H	H	<i>c</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,13
I-1-264	H	H		Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,39
I-1-265	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	1,94
I-1-266	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,99
I-1-267	H	H	<i>i</i> -Pr		CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,67
I-1-268	H	H	<i>c</i> -Pr		CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,44

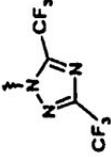
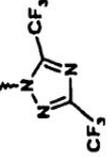
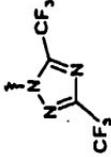
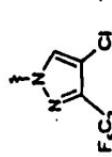
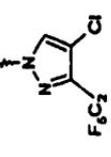
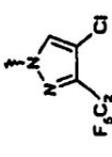
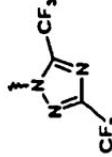
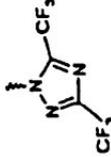
(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-269	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,4
I-1-270	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,95
I-1-271	H	H	<i>c</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,17
I-1-272	H	H	H		CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,38
I-1-273	H	H	H		CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,84
I-1-274	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>		CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,74
I-1-275	H	H	<i>c</i> -Pr		CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,71
I-1-276	H	H	<i>c</i> -Pr		CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,15

(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-277	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>		CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,17
I-1-278	H	H	CH <sub>3</sub>		CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,25
I-1-279	H	H			CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,47
I-1-280	H	H			CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	6,56
I-1-281	H	H			CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,54
I-1-282	H	H			CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,18
I-1-283	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>		CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,89

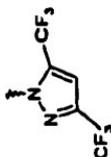
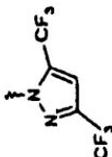
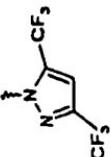
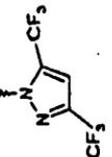
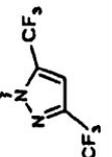
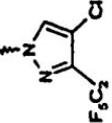
(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-284	H	H			CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,16
I-1-285	H	H			CH <sub>3</sub>	°CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,23
I-1-286	H	H			CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,52
I-1-287	H	H			CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,69
I-1-288	H	H			CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,79
I-1-289	H	H			CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4,63
I-1-290	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,40
I-1-291	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,76

(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-292	H	H	CH <sub>2</sub> CN	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2.83
I-1-293	H	H		Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3.22
I-1-294	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	4.00
I-1-295	H	H	<i>c</i> -Pr	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2.95
I-1-296	H	H	H	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3.43
I-1-297	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3.59
I-1-298	H	H	H	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2.61
I-1-299	H	H	CH <sub>2</sub> CN	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3.53

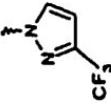
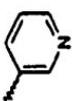
(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-300	H	H	<i>o</i> -Pr	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,19
I-1-301	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,60
I-1-302	H	H	H	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,80
I-1-303	H	H	CH <sub>2</sub> CN	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,98
I-1-304	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,01
I-1-305	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,40
I-1-306	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,18
I-1-307	H	H	H	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,95

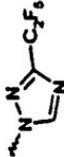
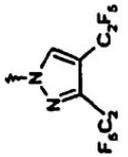
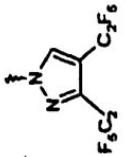
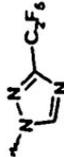
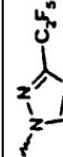
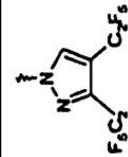
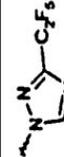
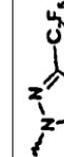
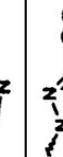
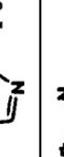
(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-308	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,18
I-1-309	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,53
I-1-310	H	H	CH <sub>2</sub> CN	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,13
I-1-311	H	H	H	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,21
I-1-312	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,37
I-1-313	H	H	CH <sub>2</sub> CN	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,43
I-1-314	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,77

(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-315	H	H	<i>o</i> -Pr	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,54
I-1-316	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	1,03
I-1-317	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	1,31
I-1-318	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	1,62
I-1-319	H	H	H	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,02
I-1-320	H	H	CH <sub>2</sub> CN	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	1,49
I-1-321	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	1,41
I-1-322	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	1,94

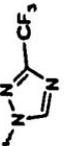
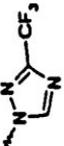
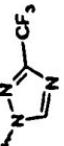
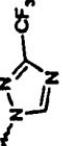
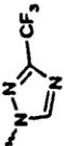
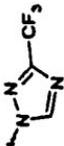
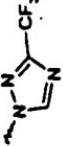
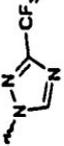
(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-323	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,01
I-1-324	H	H	(S)-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	*
I-1-325	H	H	(S)-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SOCH <sub>3</sub>	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,54
I-1-326	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,55
I-1-327	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,97
I-1-328	H	H	(S)-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	3,63
I-1-329	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,57
I-1-330	H	H	H	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,39
I-1-331	H	H	<i>o</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,78
I-1-332	H	H	CH <sub>2</sub> CN	Cl	CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,59

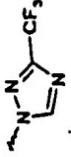
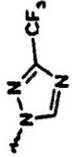
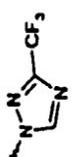
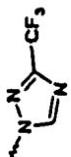
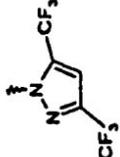
(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-333	H	H	CH <sub>3</sub>	CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,25
I-1-334	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,66
I-1-335	H	H	<i>o</i> -Pr	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,69
I-1-336	H	H	H	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,32
I-1-337	H	H	CH <sub>2</sub> CN	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,56
I-1-338	H	H	<i>o</i> -Pr	CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,45
I-1-339	H	H	H	CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,11
I-1-340	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,55
I-1-341	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,63
I-1-342	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,15

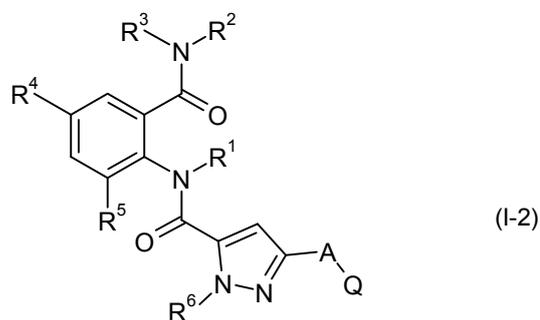
(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-343	H	H	H	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,02
I-1-344	H	H	c-Pr	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,37
I-1-345	H	H	c-Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,42
I-1-346	H	H	H	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,01
I-1-347	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,19
I-1-348	H	H	CH <sub>2</sub> CN	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,21
I-1-349	H	H	CH <sub>2</sub> CN	Cl	Cl	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,19
I-1-350	H	H	H	CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	1,75

(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	A	Q	X	R <sup>7</sup>	logP
I-1-351	H	H	CH <sub>2</sub> CN	CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	1,96
I-1-352	H	H	CH <sub>3</sub>	CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	1,91
I-1-353	H	H	c-Pr	CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,08
I-1-354	H	H	i-Pr	CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		N	Cl	2,23
I-1-355	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	C=NOCH <sub>3</sub>		N	Cl	4,07

Los siguientes compuestos de fórmula (I-2) se obtienen análogamente a los ejemplos anteriormente enumerados, así como la descripción general.



5

Tabla 2

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>				logP
I-2-1	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>		4,08
I-2-2	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CH <sub>2</sub>		3,85
I-2-3	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CH <sub>2</sub>		3,31
I-2-4	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	Cl		CH <sub>2</sub>		*
I-2-5	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	Cl		CH <sub>2</sub>		2,83
I-2-6	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	Cl		CH <sub>2</sub>		2,99
I-2-7	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl		CH <sub>2</sub>		*
I-2-8	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl		CH <sub>2</sub>		4,68

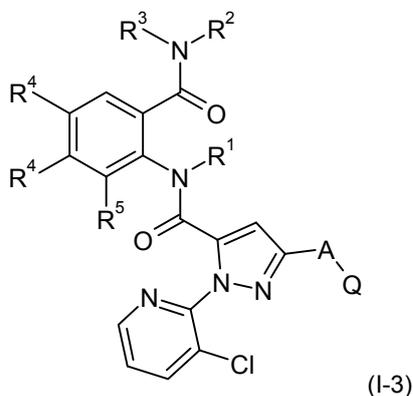
(continuación)

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>				logP
I-2-9	H	H	<i>i</i> -Pr	I	CH <sub>3</sub>		CH <sub>2</sub>		4,98
I-2-10	H	H	<i>c</i> -Pr	I	CH <sub>3</sub>		CH <sub>2</sub>		4,73
I-2-11	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>		CH <sub>2</sub>		4,78
I-2-12	H	H	<i>c</i> -Pr	Cl	CH <sub>3</sub>		CH <sub>2</sub>		4,52
I-2-13	H	H	<i>c</i> -Pr	Cl	Cl		CH <sub>2</sub>		4,46
I-2-14	H	H		Cl	CH <sub>3</sub>		CH <sub>2</sub>		5,27
I-2-15	H	H		Cl	CH <sub>3</sub>		CH <sub>2</sub>		4,04
I-2-16	H	H	<i>t</i> -Bu	Cl	CH <sub>3</sub>		CH <sub>2</sub>		5,12
I-2-17	H	H	H	Cl	CH <sub>3</sub>		CH <sub>2</sub>		4,09
I-2-18	H	H	>H <sub>2</sub> CN	Cl	CH <sub>3</sub>		CH <sub>2</sub>		4,23
I-2-19	H	H	<i>c</i> -Pr	F	CH <sub>3</sub>		CH <sub>2</sub>		4,11

(continuación)

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>				logP
I-2-20	H	H	<i>i</i> -Pr	F	CH <sub>3</sub>		CH <sub>2</sub>		4,47
I-2-21	H	H	<i>i</i> -Pr	Br	CH <sub>3</sub>		CH <sub>2</sub>		4,75
I-2-22	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>		CH <sub>2</sub>		3,53
I-2-23	H	H	CH <sub>3</sub>	Cl	Cl		CH <sub>2</sub>		3,54
I-2-24	H	H	<i>o</i> -Pr	Br	CH <sub>3</sub>		CH <sub>2</sub>		4,63

Los siguientes compuestos de fórmula (I-3) se obtienen análogamente a los ejemplos anteriormente enumerados, así como la descripción general.



5

Tabla 3

Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup> -R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>			logP
I-3-1	H	H	<i>i</i> -Pr	-CH=CH-CH=CH-	Cl	CH <sub>2</sub>		4,08

Datos de RMN de <sup>1</sup>H de compuestos seleccionados:

10 I-1-21 (400 MHz, DMSO): 1,11 (d, 6 H), 2,14 (s, 3 H), 3,91 (m, 1 H), 5,55 (s, 2 H), 7,12 (s, 1 H), 7,28 (s, 1 H), 7,39 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,76 (d, 1 H), 7,99 (s, 1 H), 8,08 (d, 1 H), 8,43 (d, 1 H), 8,61 (s, 1 H), 10,12 (s, 1 H).

I-1-22 (400 MHz, DMSO): 1,18 (d, 6 H), 2,14 (s, 3 H), 3,90 (m, 1 H), 5,87 (s, 2 H), 7,24 (s, 1 H), 7,42 (s, 1 H), 7,53 (s,

## ES 2 547 383 T3

- 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,80 (d, 1 H), 8,08 (d, 1 H), 8,44 (d, 1 H), 10,07 (s, 1 H).
- I-1-26 (400 MHz, DMSO): 2,14 (s, 3 H), 2,67 (d, 3 H), 5,93 (s, 2 H), 7,21 (s, 1 H), 7,33 (s, 1 H), 7,40 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 8,00 (d, 1 H), 8,08 (d, 1 H), 8,45 (d, 1 H), 10,12 (s, 1 H).
- 5 I-1-48 (400 MHz, DMSO): 2,13 (s, 3 H), 5,69 (s, 2 H), 7,18 (s, 1 H), 7,41 (s, 2 H), 7,55 (dd, 1 H), 8,10 (d, 1 H), 8,45 (d, 1 H), 8,80 (s, 1 H), 10,19 (s, 1 H).
- I-1-65 (400 MHz, DMSO): 1,06 (d, 6 H), 2,17 (s, 3 H), 3,95 (m, 1 H), 5,58 (s, 2 H), 7,15 (s, 1 H), 7,31 (s, 1 H), 7,42 (s, 1 H), 7,58 (dd, 1 H), 7,78 (d, 1 H), 7,92 (s, 1 H), 8,09 (d, 1 H), 8,46 (d, 1 H), 8,47 (s, 1 H), 10,04 (s, 1 H).
- 10 I-1-75 (400 MHz, DMSO): 1,09 (d, 6 H), 2,00 (s, 3 H), 2,15 (s, 3 H), 2,44 (dd, 1 H), 2,53 (dd, 1 H), 3,99 (m, 1 H), 5,86 (s, 2 H), 7,23 (s, 1 H), 7,33 (s, 1 H), 7,42 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,92 (d, 1 H), 8,09 (d, 1 H), 8,44 (d, 1 H), 10,04 (s, 1 H).
- I-1-88 (400 MHz, DMSO): 2,14 (s, 3 H), 2,67 (d, 3 H), 5,38 (s, 2 H), 7,28 (s, 1 H), 7,33 (s, 1 H), 7,40 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,96 (d, 2 H), 8,00 (d, 1 H), 8,08 (d, 1 H), 8,17 (d, 2 H), 8,46 (d, 1 H), 10,10 (s, 1 H).
- I-1-104 (400 MHz, DMSO): 2,13 (s, 3 H), 2,64 (d, 3 H), 6,18 (s, 2 H), 7,28 (s, 1 H), 7,32 (s, 1 H), 7,40 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,92 (d, 2 H), 8,00 (d, 1 H), 8,09 (d, 1 H), 8,30 (d, 2 H), 8,45 (d, 1 H), 10,10 (s, 1 H).
- 15 I-1-117 (400 MHz, DMSO): 1,02 (d, 6 H), 2,15 (s, 3 H), 3,34 (s, 3 H), 3,92 (m, 1 H), 5,10 (s, 2 H), 7,17 (s, 1 H), 7,29 (s, 1 H), 7,39 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,78 (d, 1 H), 8,09 (d, 1 H), 8,44 (d, 1 H), 10,01 (s, 1 H).
- I-1-126 (400 MHz, DMSO): 0,99-1,10 (m, 4 H), 1,03 (d, 6 H), 2,15 (s, 3 H), 3,00-3,08 (m, 1 H), 3,92 (m, 1 H), 5,05 (s, 2 H), 7,16 (s, 1 H), 7,29 (s, 1 H), 7,40 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,78 (d, 1 H), 8,09 (d, 1 H), 8,44 (d, 1 H), 10,01 (s, 1 H).
- 20 I-1-139 (400 MHz, DMSO): 1,38 (s, 6 H), 2,14 (s, 3 H), 2,89 (s, 3 H), 3,68 (s, 2 H), 5,87 (s, 2 H), 7,21 (s, 1 H), 7,31 (s, 1 H), 7,40 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,79 (s, 1 H), 8,09 (d, 1 H), 8,44 (d, 1 H), 9,93 (s, 1 H).
- I-1-148 (400 MHz, DMSO): 2,14 (s, 3 H), 2,66 (d, 3 H), 6,18 (s, 2 H), 7,29 (s, 1 H), 7,32 (s, 1 H), 7,40 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,70 (d, 1 H), 8,09 (d, 1 H), 8,11 (d, 1 H), 8,45 (s, 1 H), 8,46 (d, 1 H), 9,07 (s, 1 H), 10,10 (s, 1 H).
- I-1-161 (400 MHz, DMSO): 1,04 (d, 6 H), 1,31 (s, 9 H), 2,14 (s, 3 H), 3,90 (m, 1 H), 5,46 (s, 2 H), 7,11 (s, 1 H), 7,29 (s, 1 H), 7,39 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,78 (d, 1 H), 8,09 (d, 1 H), 8,40 (s, 1 H), 8,44 (d, 1 H), 10,10 (s, 1 H).
- 25 I-1-172 (400 MHz, DMSO): 1,04 (d, 6 H), 2,15 (s, 3 H), 3,90 (m, 1 H), 5,58 (s, 2 H), 7,16 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,70 (s, 1 H), 7,78 (s, 1 H), 7,78 (s, 1 H), 7,93 (d, 1 H), 8,09 (d, 1 H), 8,38 (s, 1 H), 8,45 (d, 1 H), 10,32 (s, 1 H).
- I-1-175 (400 MHz, DMSO): 2,21 (s, 3 H), 4,16 (d, 1 H), 5,57 (s, 2 H), 7,16 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,70 (s, 1 H), 7,78 (s, 1 H), 7,86 (d, 1 H), 8,09 (d, 1 H), 8,37 (s, 1 H), 8,46 (d, 1 H), 10,32 (s, 1 H).
- 30 I-1-176 (400 MHz, DMSO): 2,19 (s, 3 H), 2,68 (d, 1 H), 5,88 (s, 2 H), 7,25 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,80 (s, 1 H), 7,97 (s, 1 H), 8,09 (d, 1 H), 8,15 (d, 1 H), 8,44 (d, 1 H), 10,40 (s, 1 H).
- I-1-180 (400 MHz, DMSO): 2,21 (s, 3 H), 4,16 (d, 1 H), 5,87 (s, 2 H), 7,27 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,77 (s, 1 H), 7,86 (s, 1 H), 8,09 (d, 1 H), 8,46 (d, 1 H), 8,96 (d, 1 H), 10,34 (s, 1 H).
- I-1-182 (400 MHz, DMSO): 1,04 (d, 6 H), 2,19 (s, 3 H), 3,92 (m, 1 H), 5,57 (s, 2 H), 6,74 (s, 1 H), 7,15 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,70 (s, 1 H), 7,78 (s, 1 H), 7,91 (d, 1 H), 8,06 (s, 1 H), 8,09 (d, 1 H), 8,45 (d, 1 H), 10,30 (s, 1 H).
- 35 I-1-190 (400 MHz, DMSO): 2,21 (s, 3 H), 4,15 (d, 1 H), 5,69 (s, 2 H), 7,18 (s, 1 H), 7,53 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,76 (s, 1 H), 7,85 (s, 1 H), 8,07 (d, 1 H), 8,45 (d, 1 H), 8,95 (s, 1 H), 10,30 (s, 1 H).
- I-1-195 (400 MHz, DMSO): 1,11 (d, 6 H), 2,00 (s, 3 H), 2,15 (s, 3 H), 2,44 (dd, 1 H), 2,53 (dd, 1 H), 4,02 (m, 1 H), 5,57 (s, 2 H), 7,08 (d, 1 H), 7,15 (s, 1 H), 7,20 (d, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,84 (d, 1 H), 8,09 (d, 1 H), 8,37 (s, 1 H), 8,45 (d, 1 H), 10,30 (s, 1 H).
- 40 I-1-196 (400 MHz, DMSO): 2,15 (s, 3 H), 4,34 (d, 1 H), 5,57 (s, 2 H), 6,19 (d, 1 H), 6,29 (d, 1 H), 7,10 (s, 1 H), 7,13 (d, 1 H), 7,22 (d, 1 H), 7,43 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 8,08 (d, 1 H), 8,38 (s, 1 H), 8,46 (d, 1 H), 8,55 (t, 1 H), 10,30 (s, 1 H).
- I-1-201 (400 MHz, DMSO): 2,14 (s, 3 H), 4,33 (d, 1 H), 5,57 (s, 2 H), 6,19 (d, 1 H), 6,29 (d, 1 H), 7,10 (s, 1 H), 7,33 (s, 1 H), 7,44 (2 d, 2 H), 7,55 (dd, 1 H), 8,08 (d, 1 H), 8,37 (s, 1 H), 8,45 (d, 1 H), 8,55 (t, 1 H), 10,34 (s, 1 H).
- 45 I-1-208 (400 MHz, DMSO): 2,14 (s, 3 H), 4,33 (d, 1 H), 5,57 (s, 2 H), 6,19 (d, 1 H), 6,29 (d, 1 H), 7,13 (s, 1 H), 7,45 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,75 (s, 1 H), 7,80 (s, 1 H), 8,08 (d, 1 H), 8,38 (s, 1 H), 8,69 (s a, 1 H), 8,55 (t, 1 H), 10,34 (s, 1 H).
- I-1-241 (400 MHz, DMSO): 1,02 (d, 3 H), 2,11 (s, 3 H), 3,91 (m, 1 H), 5,57 (s, 2 H), 7,12 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,57 (s, 1 H), 7,69 (s, 1 H), 7,76 (d, 1 H), 8,08 (d, 1 H), 8,37 (s, 1 H), 8,45 (d, 1 H), 10,02 (s, 1 H).
- 50 I-1-243 (400 MHz, DMSO): 2,10 (s, 3 H), 2,67 (d, 3 H), 3,07 (q, 2 H), 5,57 (s, 2 H), 7,13 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,60 (s, 1 H), 7,70 (s, 1 H), 7,98 (d, 1 H), 8,10 (d, 1 H), 8,38 (s, 1 H), 8,45 (d, 1 H), 10,09 (s, 1 H).
- I-1-244 (400 MHz, DMSO): 0,99 (t, 3 H), 2,11 (s, 3 H), 3,07 (q, 2 H), 5,87 (s, 2 H), 7,21 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,59 (s, 1 H), 7,70 (s, 1 H), 7,98 (s, 1 H), 8,09 (d, 1 H), 8,45 (d, 1 H), 10,05 (s, 1 H).

## ES 2 547 383 T3

- I-1-248 (400 MHz, DMSO): 1,01 (d, 6 H), 2,10 (s, 3 H), 3,89 (m, 1 H), 5,56 (s, 2 H), 6,73 (s, 1 H), 7,11 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,56 (s, 1 H), 7,76 (s, 1 H), 7,75 (d, 1 H), 8,04 (s, 1 H), 8,09 (d, 1 H), 8,45 (d, 1 H), 10,01 (s, 1 H).
- I-1-274 (400 MHz, DMSO): 0,99 (t, 3 H), 2,10 (s, 3 H), 3,07 (q, 2 H), 5,68 (s, 2 H), 7,15 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,60 (s, 1 H), 7,97 (s, 1 H), 8,08 (d, 1 H), 8,45 (d, 1 H), 10,09 (s, 1 H).
- 5 I-1-275 (400 MHz, DMSO): 0,40-0,47 (m, 2 H), 0,55-0,60 (m, 2 H), 2,10 (s, 3 H), 2,65-2,71 (m, 1 H), 5,69 (s, 2 H), 7,17 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,56 (s, 1 H), 7,69 (s, 1 H), 8,00 (d, 1 H), 8,08 (d, 1 H), 8,45 (s, 1 H), 8,79 (d, 1 H), 10,05 (s, 1 H).
- 10 I-1-276 (400 MHz, DMSO): 0,41-0,45 (m, 2 H), 0,56-0,61 (m, 2 H), 2,10 (s, 3 H), 2,65-2,71 (m, 1 H), 5,57 (s, 2 H), 7,14 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,55 (s, 1 H), 7,69 (s, 1 H), 8,01 (d, 1 H), 8,08 (d, 1 H), 8,38 (s, 1 H), 8,46 (d, 1 H), 10,02 (s, 1 H).
- I-1-279 (400 MHz, DMSO): 1,34-1,60 (m, 6 H), 1,71-1,78 (m, 2 H), 2,10 (s, 3 H), 4,01-4,08 (m, 1 H), 5,87 (s, 2 H), 7,21 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,57 (s, 1 H), 7,70 (s, 1 H), 7,85 (d, 1 H), 8,07 (d, 1 H), 8,43 (s, 1 H), 10,02 (s, 1 H).
- I-1-280 (400 MHz, DMSO): 1,13-1,51 (m, 20 H), 1,71-1,78 (m, 2 H), 2,07 (s, 3 H), 3,93-3,96 (m, 1 H), 5,83 (s, 2 H), 7,13 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,61 (s, 1 H), 7,68 (d, 1 H), 8,02 (s, 1 H), 8,07 (d, 1 H), 8,43 (s, 1 H), 10,02 (s, 1 H).
- 15 I-1-282 (400 MHz, DMSO): 1,36 (s, 2 H), 1,56-1,65 (m, 2 H), 1,84-1,94 (m, 2 H), 2,07 (s, 3 H), 4,18-4,24 (m, 1 H), 5,87 (s, 2 H), 7,18 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,59 (s, 1 H), 7,70 (d, 1 H), 8,07 (s, 1 H), 8,19 (d, 1 H), 8,43 (s, 1 H), 10,02 (s, 1 H).
- I-1-290 (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>): 2,90 (d, 3 H), 5,74 (s, 2 H), 6,10 (d, 1 H), 7,23 (s, 1 H), 7,23 (s, 1 H), 7,28 (s, 1 H), 7,40 (dd, 1 H), 7,87 (d, 1 H), 8,46 (d, 1 H), 9,74 (s, 1 H).
- 20 I-1-296 (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>): 5,54 (s, 2 H), 5,62 (s, 1 H), 6,11 (s, 1 H), 7,12 (s, 1 H), 7,39 (s, 1 H), 7,40 (dd, 1 H), 7,48 (s, 1 H), 7,90 (d, 1 H), 7,94 (s, 1 H), 8,48 (d, 1 H), 9,45 (s, 1 H).
- I-1-310 (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>): 4,18 (d, 2 H), 5,48 (s, 2 H), 6,74 (t, 1 H), 7,08 (s, 1 H), 7,32 (s, 1 H), 7,43 (dd, 1 H), 7,48 (s, 1 H), 7,92 (d, 1 H), 7,94 (s, 1 H), 8,50 (d, 1 H), 8,93 (s, 1 H).
- 25 I-1-314 (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>): 1,10 (d, 6 H), 4,08 (m, 1 H), 5,50 (s, 2 H), 5,92 (d, 1 H), 6,57 (s, 1 H), 7,15 (s, 1 H), 7,28 (s, 1 H), 7,39 (s, 1 H), 7,40 (dd, 1 H), 7,57 (s, 1 H), 7,87 (d, 1 H), 8,48 (d, 1 H), 9,65 (s, 1 H).
- I-1-324 (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>): 1,24 (d, 3 H), 2,10 (s, 3 H), 2,60 (m, 2 H), 4,22 (m, 1 H), 5,51 (d, 1 H), 5,58 (d, 1 H), 6,13 (d, 1 H), 7,17 (s, 1 H), 7,35 (s, 1 H), 7,39 (s, 1 H), 7,40 (dd, 1 H), 7,87 (d, 1 H), 7,90 (s, 1 H), 8,48 (d, 1 H), 9,60 (s, 1 H).
- 30 I-1-331 (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>): 0,55 (m, 2 H), 0,85 (m, 2 H), 2,16 (s, 3 H), 2,77 (m, 1 H), 5,57 (s, 2 H), 6,18 (d, 1 H), 7,12 (s, 1 H), 7,18 (s, 1 H), 7,24 (s, 1 H), 7,41 (dd, 1 H), 7,88 (d, 1 H), 8,35 (s, 1 H), 8,48 (d, 1 H), 10,15 (s, 1 H).
- I-1-334 (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>): 1,24 (d, 6 H), 2,23 (s, 3 H), 4,18 (m, 1 H), 5,58 (s, 2 H), 5,99 (d, 1 H), 7,12 (s, 1 H), 7,28 (s, 1 H), 7,40 (dd, 1 H), 7,58 (d, 1 H), 7,88 (d, 1 H), 8,36 (s, 1 H), 8,48 (d, 1 H), 10,62 (s, 1 H).
- I-1-340 (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>): 1,24 (d, 6 H), 4,08 (m, 1 H), 5,58 (s, 2 H), 5,92 (d, 1 H), 7,21 (s, 1 H), 7,30 (s, 1 H), 7,32 (s, 1 H), 7,40 (dd, 1 H), 7,77 (d, 1 H), 8,36 (s, 1 H), 8,48 (d, 1 H), 10,06 (s, 1 H).
- 35 I-1-345 (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>): 0,55 (m, 2 H), 0,85 (m, 2 H), 2,77 (m, 1 H), 5,58 (s, 2 H), 6,20 (d, 1 H), 7,14 (s, 1 H), 7,20 (s, 1 H), 7,22 (s, 1 H), 7,40 (dd, 1 H), 7,88 (d, 1 H), 8,32 (s, 1 H), 8,45 (d, 1 H), 10,12 (s, 1 H).
- I-1-354 (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>): 1,21 (d, 6 H), 4,15 (m, 1 H), 5,58 (s, 2 H), 7,16 (s, 1 H), 7,18 (s, 1 H), 7,40 (dd, 1 H), 7,58 (s, 1 H), 7,75 (s, 1 H), 7,84 (d, 1 H), 8,38 (s, 1 H), 8,48 (d, 1 H), 10,95 (s, 1 H).
- 40 I-2-4 (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>): 1,74 (m, 3 H), 2,16 (m, 2 H), 2,40 (m, 1 H), 2,86 (d, 3 H), 3,70 (m, 1 H), 3,88 (m, 1 H), 5,75 (s, 2 H), 5,80 (m, 1 H), 6,45 (s, 1 H), 6,80 (s, 1 H), 7,16 (s, 1 H), 7,42 (s, 1 H), 7,56 (s, 1 H), 9,08 (s, 1 H).
- I-2-7 (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>): 1,24 (m, 6 H), 1,74 (m, 3 H), 2,20 (m, 2 H), 2,40 (m, 1 H), 3,70 (m, 1 H), 3,88 (m, 1 H), 4,10 (m, 1 H), 5,80 (m, 3 H), 6,25 (s, 1 H), 6,80 (s, 1 H), 7,40 (s, 1 H), 7,52 (s, 1 H), 8,85 (s, 1 H).
- 45 La determinación de los datos de RMN de <sup>1</sup>H anteriormente indicados se lleva a cabo con un Bruker Avance 400, equipado con un sistema BEST (celda de 60 ul de volumen), o un Bruker Avance 400, con tetrametilsilano como referencia (0,0 ppm) y los disolventes CDCl<sub>3</sub> a 298 Kelvin o d<sub>6</sub>-DMSO a 304 Kelvin. La caracterización del desdoblamiento de la señal tuvo lugar con s = singlete, d = doblete, t = triplete, q = cuartete, m = multiplete, dd = doble doblete.
- 50 La determinación de los valores de logP indicados en las tablas y ejemplos de preparación precedentes tiene lugar según la directiva 79/831/CEE anexo V.A8 mediante HPLC (cromatografía líquida de alta resolución) en una columna de fase inversa (C 18). Temperatura: 43 °C.
- La determinación con EM-CL en el intervalo ácido tiene lugar a pH 2,7 con 0,1 % de ácido fórmico acuoso y acetonitrilo (contiene 0,1 % de ácido fórmico) como eluyentes; gradiente lineal del 10 % de acetonitrilo al 95 % de acetonitrilo.
- 55 El calibrado tiene lugar con alcan-2-onas no ramificadas (con 3 a 16 átomos de carbono) cuyos valores de logP son conocidos (determinación de los valores de logP por medio de los tiempos de retención mediante interpolación lineal

entres dos alcanonas seguidas).

Los valores máximos de lambda se determinan por medio de espectros de UV de 200 nm a 400 nm en los máximos de las señales cromatográficas.

#### Preparación de sustancias de partida de fórmula (V)

##### 5 Ejemplo 2

2-[5-(3,5-Bis-trifluorometil-pirazol-1-ilmetil)-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-il]-6-cloro-8-metil-benzo[d][1,3]oxazin-4-ona:

Se enfrían en atmósfera de argón 0,12 ml (1,60 mmol) de cloruro del ácido metanosulfónico en 3 ml de acetonitrilo a 0 °C y a continuación se añade gota a gota una solución de 540 mg (1,228 mmol) de ácido 5-(3,5-bis-trifluorometil-pirazol-1-ilmetil)-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico en 0,17 ml (2,09 mmol) de piridina y 6 ml de acetonitrilo. Se deja con agitación 15 min a esta temperatura y a continuación se añade una solución de 228 mg (1,228 mmol) de 2-amino-5-cloro-3,N-dimetil-benzamida en 0,35 ml (4,30 mmol) de piridina y 6 ml de acetonitrilo. Después de otros 15 min a 0 °C se añaden 0,12 ml (1,60 mmol) de cloruro del ácido metanosulfónico y se calienta lentamente durante toda la noche a temperatura ambiente. El disolvente se elimina a vacío, se añaden 15 ml de agua y los cristales formados se separan mediante filtración con succión.

Rendimiento: 500 mg (logP: 5,11)

#### Preparación de sustancias de partida de fórmula (IV)

##### Ejemplo 3

Ácido 5-(3,5-bis-trifluorometil-pirazol-1-ilmetil)-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico:

A una solución de 610 mg (1,34 mmol) de éster metílico del ácido 5-(3,5-bis-trifluorometil-pirazol-1-ilmetil)-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico en 9 ml de etanol se añade gota a gota una solución de 699 mg (1,78 mmol) de hidróxido sódico en 7 ml de agua. Se deja con agitación 2 horas a temperatura ambiente, se concentra en el rotavapor hasta aproximadamente 5 ml. Se añaden 5 ml de terc-butilmetiléter y la fase orgánica se lava a continuación con agua. Las fases acuosas reunidas se ajustan con enfriamiento en hielo con ácido clorhídrico concentrado hasta un valor de pH de aproximadamente 3 y se extraen tres veces cada vez con 50 ml acetato de etilo. Las fases orgánicas reunidas se secan sobre sulfato de magnesio y a continuación se elimina el disolvente en el rotavapor.

Rendimiento: 560 mg (logP: 2,86)

#### Preparación de sustancias de partida de fórmula (IV)

##### 30 Ejemplo 4

Éster metílico del ácido 5-(3,5-bis-trifluorometilpirazol-1-ilmetil)-2-(3-cloropiridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico:

A una solución de 700 mg (2,03 mmol) de éster metílico del ácido 2-(3-cloropiridin-2-il)-5-metanosulfoniloximetil-2H-pirazol-3-carboxílico en 15 ml de acetonitrilo se añaden sucesivamente 336 mg (2,43 mmol) de carbonato de potasio y 413 mg (2,03 mmol) de 3,5-bis(trifluorometil)pirazol, y a continuación se agita 1 h a 60 °C. Después del enfriamiento a temperatura ambiente, el disolvente se concentra en el rotavapor, se añade agua y se extrae tres veces cada vez con 50 ml de acetato de etilo. Las fases orgánicas reunidas se secan sobre sulfato de magnesio y a continuación se elimina el disolvente en el rotavapor.

Rendimiento: 970 mg (logP: 3,71)

#### Preparación de sustancias de partida de fórmula (VII)

##### 40 Ejemplo 5

Éster metílico del ácido 2-(3-cloropiridin-2-il)-5-metanosulfoniloximetil-2H-pirazol-3-carboxílico:

Se disponen previamente en atmósfera de argón 2,10 g (7,85 mmol) de éster metílico del ácido 2-(3-cloropiridin-2-il)-5-hidroximetil-2H-pirazol-3-carboxílico en 13 ml de diclorometano, se enfrían a 0 °C y se añaden sucesivamente gota a gota 64 ml (11,8 mmol) de trietilamina y 0,67 ml (8,63 mmol) de cloruro del ácido metanosulfónico. Se deja con agitación 30 min a esta temperatura, se diluye con 50 ml de diclorometano y se lava sucesivamente con respectivamente 50 ml de solución acuosa saturada de hidrogenosulfato de sodio, ácido clorhídrico acuoso al 10 por ciento y solución acuosa saturada de cloruro sódico. La fase orgánica se seca sobre sulfato de magnesio y a continuación se elimina el disolvente en el rotavapor.

Rendimiento: 2,65 g (logP: 1,55)

#### 50 Preparación de sustancias de partida de fórmula (X)

##### Ejemplo 6

Éster metílico del ácido 2-(3-cloropiridin-2-il)-5-hidroximetil-2H-pirazol-3-carboxílico:

5 Se disponen previamente en atmósfera de argón 12,3 g (41,7 mmol) de éster dimetílico del ácido 1-(3-cloropiridin-2-il)-1*H*-pirazol-3,5-dicarboxílico en 430 ml de tetrahidrofurano, se enfría a -72 °C y se añaden gota a gota 100 ml (100 mmol de una solución 1 M en hexano) de hidruro de diisobutilaluminio. Se deja calentar durante toda la noche hasta 0 °C y se añaden cuidadosamente 65 ml de agua. Los disolventes se eliminan en el rotavapor y el residuo se extrae exhaustivamente en el Soxhlet con metanol. Después de eliminar el disolvente, el residuo se purifica en gel de sílice (ciclohexano/acetato de etilo = 2 : 1 → 1 : 1).

Rendimiento: 9,26 g (logP: 1,26)

**Preparación de sustancias de partida de fórmula (XI)**

Ejemplo 7

10 Éster dimetílico del ácido 1-(3-cloropiridin-2-il)-1*H*-pirazol-3,5-dicarboxílico:

15 A una solución de 15,6 g (64,8 mmol) de éster dimetílico del ácido 2-pirrolidino-4-oxo-2-pentenodícarboxílico y 20,4 g (64,8 mmol) de sal del ácido toluenosulfónico de 3-cloro-2-piridin-2-ilhidrazina en 84 ml de metanol se añade una punta de espátula de ácido toluenosulfónico y se calienta 5 h a 50 °C. A continuación se añaden 12,3 g (64,8 mmol) de ácido toluenosulfónico monohidratado y primero se agita 1 h a 50 °C y 1 h a reflujo. Después del enfriamiento a 0 °C, los cristales precipitados se eliminan mediante filtración con succión y se filtran a través de gel de sílice (ciclohexano/acetato de etilo = 1 : 1).

Rendimiento: 8,56 g (logP: 1,97)

Ejemplos de eficacia biológica de los compuestos según la invención

Ejemplo N° 1

20 **Ensayo con *Heliothis virescens***

Disolvente: 1 % de N-metilpirrolidona (NMP)  
1 % de alcohol de diacetona

Colorante: sulfoflavina brillante para colorear agua

25 Para la preparación de un preparado de principio activo apropiado se mezcla el principio activo con las cantidades de disolvente indicadas y el concentrado se diluye con agua coloreada hasta la concentración deseada.

Los huevos de *Heliothis virescens* se tratan con un preparado de principio activo de la concentración deseada.

Después del tiempo deseado se determina el efecto en %. A este respecto, el 100 % significa que se destruyeron todos los huevos/larvas; el 0 % significa que no se destruyó ningún huevo/larva.

30 En esta prueba, por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación, muestran buena eficacia: véase la tabla

<b>Ensayo con <i>Heliothis virescens</i></b>		
Principio activo	Concentración de principio activo en ppm	Grado de destrucción después de 6-7 <sup>d</sup> en %
I-1-13	300	100
I-1-14	300	100
I-1-15	300	100

Ejemplo N° 2

**Ensayo con *Myzus persicae***

Disolvente: 1 % de N-metilpirrolidona (NMP)

1 % de alcohol de diacetona

Colorante: sulfoflavina brillante para colorear agua

Para la preparación de un preparado de principio activo apropiado se mezcla el principio activo con las cantidades de disolvente indicadas y el concentrado se diluye con agua coloreada hasta la concentración deseada.

- 5 Un preparado de principio activo de la concentración deseada se pone a disposición de *Myzus persicae* para su captación.

Después del tiempo deseado se determina el efecto en %. A este respecto, el 100 % significa que se destruyeron todos los pulgones; el 0 % que no se destruyó ningún pulgón.

- 10 En esta prueba, por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación, muestran buena eficacia: véase la tabla

<b>Ensayo con <i>Myzus persicae</i></b>		
Principio activo	Concentración de principio activo en ppm	Grado de destrucción después de 6-7 <sup>d</sup> en %
I-1-13	30	100
I-1-14	30	100
I-1-15	30	100

Ejemplo N° 3

**Ensayo con *Aedes Aegypti***

Disolvente: 1 % de N-metilpirrolidona (NMP)

1 % de alcohol de diacetona

- 15 Colorante: sulfoflavina brillante para colorear agua

Para la preparación de un preparado de principio activo apropiado se mezcla el principio activo con las cantidades de disolvente indicadas y el concentrado se diluye con agua coloreada hasta la concentración deseada.

Las larvas de *Aedes aegypti* se tratan con un preparado de principio activo de la concentración deseada.

- 20 Después del tiempo deseado se determina el efecto en %. A este respecto, el 100 % significa que se destruyeron todos los *Aedes aegypti*; el 0 % significa que no se destruyó ningún *Aedes aegypti*.

En esta prueba, por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación, muestran buena eficacia: véase la tabla



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

5 Para la preparación de un preparado de principio activo apropiado se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades de disolvente y emulsionante indicadas y el concentrado se diluye con agua que contiene emulsionante hasta la concentración deseada.

Se pulverizan discos de hojas de col de china (*Brassica pekinensis*) con un preparado de principio activo de la concentración deseada y después de secarse se cubren con larvas de escarabajo de las hojas del rábano (*Phaedon cochleariae*).

10 Después del tiempo deseado se determina el efecto en %. A este respecto, el 100 % significa que se destruyeron todas las larvas de escarabajo; el 0 % significa que no se destruyó ninguna larva de escarabajo.

En esta prueba, por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación, muestran un efecto de  $\geq 80$  % a una dosis de 100 g/ha:

15 Ejemplo N° I-1-2, I-1-3, I-1-4, I-1-5, I-1-6, I-1-10, I-1-11, I-1-12, I-1-13, I-1-14, I-1-15, I-1-16, I-1-17, I-1-18, I-1-19, I-1-22, I-1-23, I-1-24, I-1-25, I-1-28, I-1-29, I-1-30, I-1-31, I-1-32, I-1-33, I-1-34, I-1-35, I-1-36, I-1-37, I-1-38, I-1-39, I-1-40, I-1-217, I-1-218, I-1-219, I-1-220, I-1-222, I-1-223, I-1-224, I-1-225, I-1-226, I-1-38, I-1-42, I-1-43, I-1-44, I-1-45, I-1-46, I-1-47, I-1-48, I-1-49, I-1-50, I-1-51, I-1-52, I-1-53, I-1-54, I-1-55, I-1-56, I-1-57, I-1-58, I-1-59, I-1-60, I-1-61, I-1-62, I-1-63, I-1-64, I-1-65, I-1-66, I-1-68, I-1-69, I-1-70, I-1-71, I-1-72, I-1-73, I-1-74, I-1-75, I-1-76, I-1-77, I-1-78, I-1-79, I-1-80, I-1-81, I-1-82, I-1-83, I-1-84, I-1-85, I-1-86, I-1-87, I-1-92, I-1-93, I-1-97, I-1-99, I-1-100, I-1-101, I-1-113, I-1-120, I-1-121, I-1-125, I-1-128, I-1-129, I-1-130, I-1-131, I-1-134, I-1-135, I-1-137, I-1-138, I-1-139, I-1-140, I-1-141, I-1-142, I-1-144, I-1-145, I-1-146, I-1-147, I-1-148, I-1-149, I-1-150, I-1-151, I-1-152, I-1-155, I-1-156, I-1-157, I-1-158, I-1-163, I-1-165, I-1-166, I-1-167, I-1-168, I-1-169, I-1-170, I-1-171, I-1-172, I-1-173, I-1-174, I-1-175, I-1-176, I-1-177, I-1-178, I-1-179, I-1-180, I-1-181, I-1-182, I-1-183, I-1-184, I-1-185, I-1-186, I-1-187, I-1-188, I-1-189, I-1-190, I-1-191, I-1-192, I-1-193, I-1-195, I-1-196, I-1-199, I-1-201, I-1-203, I-1-204, I-1-206, I-1-207, I-1-208, I-1-209, I-1-210, I-1-211, I-1-212, I-1-213, I-1-214, I-1-215, I-1-216, I-1-227, I-1-228, I-1-230, I-1-231, I-1-233, I-1-234, I-1-235, I-1-236, I-1-237, I-1-238, I-1-239, I-1-240, I-1-241, I-1-242, I-1-243, I-1-244, I-1-245, I-1-246, I-1-247, I-1-248, I-1-251, I-1-252, I-1-253, I-1-255, I-1-258, I-1-259, I-1-260, I-1-267, I-1-272, I-1-273, I-1-274, I-1-275, I-1-276, I-1-277, I-1-279, I-1-282, I-1-283, I-1-284, I-1-285, I-1-286, I-1-287, I-1-288, I-1-289, I-1-290, I-1-291, I-1-292, I-1-293, I-1-294, I-1-295, I-1-296, I-1-297, I-1-298, I-1-299, I-1-300, I-1-302, I-1-303, I-1-304, I-1-305, I-1-307, I-1-308, I-1-309, I-1-310, I-1-312, I-1-313, I-1-324, I-1-326, I-1-327, I-1-328, I-1-329, I-1-330, I-1-331, I-1-332, I-1-333, I-1-334, I-1-335, I-1-336, I-1-337, I-1-338, I-1-339, I-1-340, I-1-342, I-1-343, I-1-346, I-1-347, I-1-348, I-1-349, I-1-350, I-1-352, I-1-353, I-1-354, I-1-355, I-2-2.

Ejemplo N° 6

**Ensayo con *Spodoptera frugiperda***

Disolvente: 7 partes en peso de dimetilformamida  
 Emulsionante: 2 partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

35 Para la preparación de un preparado de principio activo apropiado se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades de disolvente y emulsionante indicadas y el concentrado se diluye con agua que contiene emulsionante hasta la concentración deseada.

40 Se tratan hojas de col (*Brassica oleracea*) mediante inmersión en el preparado de principio activo de la concentración deseada y se cubren con orugas de gusano cogollero (*Spodoptera frugiperda*) mientras que las hojas estén todavía húmedas.

Después del tiempo deseado se determina la destrucción en %. A este respecto, el 100 % significa que se destruyeron todas las orugas; el 0 % significa que no se destruyó ninguna oruga.

45 En esta prueba, por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación, muestran buena eficacia: véase la tabla

<b>Ensayo con <i>Spodoptera frugiperda</i></b>		
Principio activo	Concentración de principio activo en g/ha	Grado de destrucción después de 7 <sup>d</sup> en %
I-1-1	100	100
I-1-2	100	100
I-1-3	100	100

(continuación)

<b>Ensayo con <i>Spodoptera frugiperda</i></b>		
Principio activo	Concentración de principio activo en g/ha	Grado de destrucción después de 7 <sup>d</sup> en %
I-1-4	100	100
I-1-5	100	100
I-1-6	100	100
I-1-7	100	100
I-1-8	100	100
I-1-10	100	100
I-1-11	100	100
I-1-12	100	100
I-1-13	100	100
I-1-14	100	100
I-1-15	100	100
I-1-16	100	100
I-1-17	100	100
I-1-18	100	100
I-1-19	100	100
I-1-20	100	100
I-1-21	100	100
I-1-22	100	100
I-1-23	100	100
I-1-24	100	100
I-1-25	100	100
I-1-26	100	100
I-1-27	20	83
I-1-28	100	100
I-1-29	100	100
I-1-30	100	100
I-1-31	100	100
I-1-32	100	100
I-1-33	100	100

(continuación)

<b>Ensayo con <i>Spodoptera frugiperda</i></b>		
Principio activo	Concentración de principio activo en g/ha	Grado de destrucción después de 7 <sup>d</sup> en %
I-1-34	100	100
I-1-35	100	100
I-1-36	100	100
I-1-37	100	100
I-1-39	100	100
I-1-40	100	100

Ejemplo N° 7**Ensayo con *Spodoptera exigua***

- 5           Disolvente:       7 partes en peso de dimetilformamida  
               Emulsionante:   2 partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

10       Para la preparación de un preparado de principio activo apropiado se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades de disolvente y emulsionante indicadas y el concentrado se diluye con agua que contiene emulsionante hasta la concentración deseada. En caso de necesitarse la adición de sales de amonio, promotores de la penetración o sales de amonio y promotores de la penetración, éstos se pipeteen en una concentración de 1000 ppm después de diluir respectivamente la solución de preparado lista para uso. Los ejemplos I-1-3, I-1-5, I-1-6, I-1-8, I-1-22 se comprueban sin adición de sales de amonio o promotores de la penetración.

15       Se tratan plantas de col (*Brassica oleracea*) mediante pulverización del preparado de principio activo con la concentración deseada y se cubren con orugas de gusano de la remolacha (*Spodoptera exigua*) mientras que las hojas estén todavía húmedas.

Después del tiempo deseado se determina la destrucción en %. A este respecto, el 100 % significa que se destruyeron todas las orugas; el 0 % significa que no se destruyó ninguna oruga.

En esta prueba, por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación, muestran un efecto  $\geq 80$  % a una dosis de 4 ppm:

- 20       Ejemplo N° I-1-3, I-1-5, I-1-6, I-1-8, I-1-22, I-1-31, I-1-35, I-1-47, I-1-48, I-1-52, I-1-53, I-1-55, I-1-57, I-1-170, I-1-291, I-1-295, I-1-296, I-1-297, I-1-299, I-1-54

Ejemplo N° 8**Ensayo con *Plutella xylostella***

- 25           Disolvente:       7 partes en peso de dimetilformamida  
               Emulsionante:   2 partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

30       Para la preparación de un preparado de principio activo apropiado se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades de disolvente y emulsionante indicadas y el concentrado se diluye con agua que contiene emulsionante hasta la concentración deseada. En caso de necesitarse la adición de sales de amonio, promotores de la penetración o sales de amonio y promotores de la penetración, éstos se pipeteen respectivamente en una concentración de 1000 ppm después de diluir respectivamente la solución de preparado lista para uso. Los ejemplos I-1-3, I-1-5, I-1-6, I-1-8, I-1-22 se comprueban sin adición de sales de amonio o promotores de la penetración.

Se tratan hojas de col (*Brassica oleracea*) mediante pulverización del preparado de principio activo con la concentración deseada y se cubren con orugas de la polilla de la col (*Plutella xylostella*) mientras que las hojas estén todavía húmedas.

35       Después del tiempo deseado se determina la destrucción en %. A este respecto, el 100 % significa que se destruyeron todas las orugas; el 0 % significa que no se destruyó ninguna oruga.

En esta prueba, por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación, muestran un efecto  $\geq 80$  %

a una dosis de 20 ppm:

5 Ejemplo N° I-1-3, I-1-5, I-1-6, I-1-8, I-1-22, I-1-65, I-1-239, I-1-240, I-1-245, I-1-217, I-1-220, I-1-223, I-1-224, I-1-31, I-1-55, I-1-56, I-1-57, I-1-63, I-1-66, I-1-68, I-1-69, I-1-76, I-1-92, I-1-97, I-1-98, I-1-101, I-1-113, I-1-121, I-1-147, I-1-170, I-1-192, I-1-195, I-1-204, I-1-206, I-1-209, I-1-210, I-1-212, I-1-215, I-1-238, I-1-244, I-1-247, I-1-248, I-1-249, I-1-250, I-1-251, I-1-274, I-1-275, I-1-276, I-1-291, I-1-295, I-1-296, I-1-297, I-1-299, I-1-25, I-1-35, I-1-36, I-1-38, I-1-43, I-1-46, I-1-47, I-1-48, I-1-52, I-1-53, I-1-54, I-1-104, I-1-106, I-1-107, I-1-108, I-1-143, I-1-88, I-1-139

Ejemplo N° 9

**Ensayo con *Spodoptera frugiperda***

Disolvente: 7 partes en peso de dimetilformamida

10 Emulsionante: 2 partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

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

15 Se tratan hojas de col (*Brassica oleracea*) mediante inmersión en el preparado de principio activo de la concentración deseada y se cubren con orugas de gusano cogollero (*Spodoptera frugiperda*) mientras que las hojas estén todavía húmedas.

Después del tiempo deseado se determina la destrucción en %. A este respecto, el 100 % significa que se destruyeron todas las orugas; el 0 % significa que no se destruyó ninguna oruga.

20 En esta prueba, por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación, muestran buena eficacia: véase la tabla

<b>Ensayo con <i>Spodoptera frugiperda</i></b>		
Principio activo	Concentración de principio activo en ppm	Grado de destrucción después de 7 <sup>d</sup> en %
I-1-3	0,8	100
I-1-5	0,8	100
I-1-6	0,8	100
I-1-8	0,8	100
I-1-9	100	100
I-1-22	4	100

Ejemplo N° 10

**Ensayo con *Heliothis armigera***

Disolvente: 7 partes en peso de dimetilformamida

25 Emulsionante: 2 partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

Para la preparación de un preparado de principio activo apropiado se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades de disolvente y emulsionante indicadas y el concentrado se diluye con agua que contiene emulsionante hasta la concentración deseada. En caso de necesitarse la adición de sales de amonio, promotores de la penetración o sales de amonio y promotores de la penetración, éstos se pipeteen en una concentración de 1000

ppm después de diluir respectivamente la solución de preparado lista para uso. Los ejemplos I-1-3, I-1-5, I-1-6, I-1-8 y I-1-22 se comprueban sin adición de sales de amonio o promotores de la penetración.

5 Se tratan plantas de algodón (*Gossypium hirsutum*) mediante pulverización del preparado de principio activo con la concentración deseada y se cubren con orugas de gusano de la cápsula del algodón (*Heliothis armigera*) mientras que las hojas estén todavía húmedas.

Después del tiempo deseado se determina la destrucción en %. A este respecto, el 100 % significa que se destruyeron todas las orugas; el 0 % significa que no se destruyó ninguna oruga.

En esta prueba, por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación, muestran un efecto de  $\geq 80$  % a una dosis de 20 ppm:

10 Ejemplo N° I-1-3, I-1-5, I-1-6, I-1-8, I-1-22, I-1-63, I-1-65, I-1-66, I-1-68, I-1-69, I-1-192, I-1-240, I-1-245, I-1-217, I-1-220, I-1-223, I-1-224, I-1-31, I-1-35, I-1-36, I-1-38, I-1-43, I-1-46, I-1-47, I-1-48, I-1-52, I-1-53, I-1-54, I-1-55, I-1-56, I-1-57, I-1-76, I-1-88, I-1-131, I-1-139, I-1-92, I-1-97, I-1-98, I-1-100, I-1-101, I-1-113, I-1-121, I-1-147, I-1-170, I-1-195, I-1-204, I-1-206, I-1-212, I-1-215, I-1-238, I-1-244, I-1-247, I-1-248, I-1-249, I-1-250, I-1-251, I-1-274, I-1-275, I-1-276, I-1-291, I-1-295, I-1-296, I-1-297, I-1-299, I-1-104, I-1-106, I-1-107, I-1-108, I-1-143

15 Ejemplo N° 11

**Ensayo con *Spodoptera exigua*; cepa resistente**

Disolvente: 7 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: 2 partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

20 Para la preparación de un preparado de principio activo apropiado se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades de disolvente y emulsionante indicadas y el concentrado se diluye con agua que contiene emulsionante hasta la concentración deseada. En caso de necesitarse la adición de sales de amonio, promotores de la penetración o sales de amonio y promotores de la penetración, éstos se pipeteen en una concentración de 1000 ppm después de diluir respectivamente la solución de preparado lista para uso. Los ejemplos I-1-5, I-1-6, I-1-22 se comprueban sin adición de sales de amonio o promotores de la penetración.

25 Se tratan plantas de col (*Brassica oleracea*) mediante pulverización del preparado de principio activo con la concentración deseada y se cubren con orugas de gusano de la remolacha (*Spodoptera exigua*, cepa resistente) mientras que las hojas estén todavía húmedas.

Después del tiempo deseado se determina la destrucción en %. A este respecto, el 100 % significa que se destruyeron todas las orugas; el 0 % significa que no se destruyó ninguna oruga.

30 En esta prueba, por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación, muestran un efecto  $\geq 80$  % a una dosis de 4 ppm:

Ejemplo N° I-1-5, I-1-6, I-1-22, I-1-31, I-1-35, I-1-38, I-1-46, I-1-47, I-1-48, I-1-52, I-1-53, I-1-54, I-1-56, I-1-57, I-1-170, I-1-295, I-1-296, I-1-297, I-1-299

Ejemplo N° 12

35 ***Liriomyza trifolii***

Disolvente: 78 partes en peso de acetona

1,5 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: 0,5 partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

40 Para la preparación de un preparado de principio activo apropiado se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades de disolvente y emulsionante indicadas y el concentrado se diluye con agua que contiene emulsionante hasta la concentración deseada.

Se pulverizan discos de hojas de judía (*Phaseolus vulgaris*), que están infestadas de larvas de minador de las hojas (*Liriomyza trifolii*), con un preparado de principio activo de la concentración deseada.

45 Después del tiempo deseado se determina el efecto en %. A este respecto, el 100 % significa que se destruyeron todos los minadores de las hojas; el 0 % significa que no se destruyó ningún minador de las hojas.

En esta prueba, por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación, muestran buena eficacia: véase la tabla

<b>Ensayo con <i>Liriomyza trifolii</i></b>		
Principio activo	Concentración de principio activo en ppm	Grado de destrucción después de 7 <sup>d</sup> en %
I-1-3	500	98
I-1-4	500	95
I-1-22	500	98

Ejemplo N° 13**Ensayo con *Lucilia cuprina***

5 Disolvente: Dimetilsulfóxido

Para la preparación de un preparado de principio activo apropiado se mezcla 1 parte en peso de principio activo con la cantidad de agua indicada y el concentrado se diluye con agua hasta la concentración deseada.

Se cubren recipientes que contienen carne de caballo, que se trató con el preparado de principio activo de la concentración deseada, con larvas de *Lucilia cuprina*.

10 Después del tiempo deseado se determina la destrucción en %. A este respecto, el 100 % significa que se destruyeron todas las larvas; el 0 % significa que no se destruyó ninguna larva.

En esta prueba, por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación, muestran un efecto  $\geq 80$  % a una dosis de 100 ppm:

15 Ejemplo N° I-1-1, I-1-2, I-1-3, I-1-4, I-1-5, I-1-6, I-1-7, I-1-8, I-1-9, I-1-12, I-1-14, I-1-15, I-1-16, I-1-17, I-1-18, I-1-19, I-1-21, I-1-22, I-1-29, I-1-30, I-1-31, I-1-217, I-1-220, I-1-223, I-1-224, I-1-42, I-1-43, I-1-46, I-1-47, I-1-48, I-1-52, I-1-53, I-1-54, I-1-55, I-1-56, I-1-57, I-1-64, I-1-65, I-1-66, I-1-67, I-1-68, I-1-74, I-1-88, I-1-92, I-1-97, I-1-104, I-1-107, I-1-108, I-1-109, I-1-111, I-1-114, I-1-122, I-1-123, I-1-192, I-1-238, I-1-239, I-1-240, I-1-244, I-1-247, I-1-274, I-1-275, I-1-291, I-1-295, I-1-296, I-1-297, I-1-299, I-1-323

Ejemplo N° 14**20 Prueba (inyección) con *Boophilus microplus***

Disolvente: Dimetilsulfóxido

Para la preparación de un preparado de principio activo apropiado se mezcla 1 parte en peso de principio activo con la cantidad de disolvente indicada y el concentrado se diluye con disolvente hasta la concentración deseada.

25 La solución de principio activo se inyecta en el abdomen (*Boophilus microplus*), los animales se transfieren a cápsulas y se guardan en una sala climatizada.

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

En esta prueba, por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación, muestran un efecto  $\geq 80$  % a una dosis de 20 µg/animal:

30 Ejemplo N° I-1-1, I-1-2, I-1-3, I-1-4, I-1-5, I-1-6, I-1-7, I-1-8, I-1-9, I-1-12, I-1-14, I-1-15, I-1-16, I-1-17, I-1-18, I-1-19, I-1-21, I-1-29, I-1-30, I-1-31, I-1-217, I-1-222, I-1-223, I-1-224, I-1-42, I-1-43, I-1-46, I-1-47, I-1-48, I-1-52, I-1-53, I-1-54, I-1-55, I-1-56, I-1-57, I-1-64, I-1-65, I-1-66, I-1-67, I-1-68, I-1-74, I-1-88, I-1-92, I-1-97, I-1-104, I-1-107, I-1-108, I-1-109, I-1-111, I-1-114, I-1-122, I-1-123, I-1-192, I-1-238, I-1-239, I-1-240, I-1-244, I-1-247, I-1-274, I-1-275, I-1-291, I-1-295, I-1-296, I-1-297, I-1-299, I-1-323

35 Ejemplo N° 15

**Ensayo con *Musca domestica***

Disolvente: Dimetilsulfóxido

Para la preparación de un preparado de principio activo apropiado se mezcla 1 parte en peso de principio activo con la cantidad de agua indicada y el concentrado se diluye con agua hasta la concentración deseada.

- 5 Se cubren recipientes que contienen un hongo, que se trató con el preparado de principio activo de la concentración deseada, con adultos de *Musca domestica*.

Después del tiempo deseado se determina la destrucción en %. A este respecto, el 100 % significa que se destruyeron todas las moscas; el 0 % significa que no se destruyó ninguna mosca. En los ejemplos I-1-16, I-1-19 y I-1-30 se trata de un efecto fulminante.

- 10 En esta prueba, por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación, muestran un efecto de  $\geq 80$  % a una dosis de 100 ppm:

Ejemplo N° I-1-16 I-1-19, I-1-30, I-1-217, I-1-42, I-1-43, I-1-46, I-1-47, I-1-48, I-1-52, I-1-53, I-1-55, I-1-64, I-1-66, I-1-107, I-1-114, I-1-192, I-1-274, I-1-275, I-1-296, I-1-297, I-1-299

Ejemplo N° 16

- 15 **Prueba (tratamiento por pulverización) con *Spodoptera frugiperda***

Disolvente: 78,0 partes en peso de acetona

1,5 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: 0,5 partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

- 20 Para la preparación de un preparado de principio activo apropiado se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades de disolvente y emulsionante indicadas y el concentrado se diluye con agua que contiene emulsionante hasta la concentración deseada.

Se pulverizan discos de hojas de maíz (*Zea mays*) con un preparado de principio activo de la concentración deseada y después de secarse se cubren con orugas de gusano cogollero (*Spodoptera frugiperda*).

- 25 Después del tiempo deseado se determina el efecto en %. A este respecto, el 100 % significa que se destruyeron todas las orugas; el 0 % significa que no se destruyó ninguna oruga.

En esta prueba, por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación, muestran un efecto  $\geq 80$  % a una dosis de 100 g/ha:

- 30 Ejemplo N° I-1-217, I-1-218, I-1-219, I-1-220, I-1-221, I-1-222, I-1-223, I-1-224, I-1-38, I-1-42, I-1-43, I-1-44, I-1-45, I-1-46, I-1-47, I-1-48, I-1-49, I-1-50, I-1-51, I-1-52, I-1-53, I-1-54, I-1-55, I-1-56, I-1-57, I-1-58, I-1-59, I-1-60, I-1-61, I-1-62, I-1-63, I-1-64, I-1-65, I-1-66, I-1-68, I-1-69, I-1-70, I-1-71, I-1-72, I-1-73, I-1-74, I-1-75, I-1-76, I-1-77, I-1-78, I-1-79, I-1-80, I-1-81, I-1-82, I-1-83, I-1-84, I-1-85, I-1-86, I-1-87, I-1-92, I-1-93, I-1-97, I-1-99, I-1-100, I-1-101, I-1-102, I-1-103, I-1-113, I-1-116, I-1-117, I-1-118, I-1-119, I-1-120, I-1-121, I-1-125, I-1-126, I-1-127, I-1-128, I-1-129, I-1-130, I-1-131, I-1-134, I-1-135, I-1-136, I-1-137, I-1-138, I-1-139, I-1-140, I-1-141, I-1-142, I-1-144, I-1-145, I-1-146, I-1-147, I-1-148, I-1-149, I-1-150, I-1-151, I-1-152, I-1-153, I-1-154, I-1-155, I-1-156, I-1-157, I-1-158, I-1-160, I-1-161, I-1-163, I-1-165, I-1-166, I-1-167, I-1-168, I-3-1, I-1-169, I-1-170, I-1-171, I-1-172, I-1-173, I-1-174, I-1-175, I-1-176, I-1-177, I-1-178, I-1-179, I-1-180, I-1-181, I-1-182, I-1-183, I-1-184, I-1-185, I-1-186, I-1-187, I-1-188, I-1-189, I-1-190, I-1-191, I-1-192, I-1-193, I-1-195, I-1-196, I-1-199, I-1-200, I-1-201, I-1-202, I-1-203, I-1-204, I-1-205, I-1-206, I-1-207, I-1-208, I-1-209, I-1-210, I-1-211, I-1-212, I-1-213, I-1-214, I-1-215, I-1-216, I-1-225, I-1-226, I-1-227, I-1-228, I-1-231, I-1-233, I-1-234, I-1-235, I-1-237, I-1-238, I-1-239, I-1-240, I-1-241, I-1-242, I-1-243, I-1-244, I-1-245, I-1-246, I-1-247, I-1-248, I-1-249, I-1-250, I-1-251, I-1-252, I-1-253, I-1-255, I-1-257, I-1-258, I-1-259, I-1-260, I-1-261, I-1-262, I-1-263, I-1-264, I-1-266, I-1-267, I-1-268, I-1-269, I-1-270, I-1-271, I-1-272, I-1-273, I-1-274, I-1-275, I-1-276, I-1-277, I-1-279, I-1-282, I-1-283, I-1-284, I-1-285, I-1-286, I-1-287, I-1-289, I-2-8, I-2-12, I-2-17, I-2-19, I-1-290, I-1-291, I-1-292, I-1-293, I-1-294, I-1-295, I-1-296, I-1-297, I-1-298, I-1-299, I-1-300, I-1-301, I-1-302, I-1-303, I-1-304, I-1-305, I-1-307, I-1-308, I-1-309, I-1-310, I-1-311, I-1-312, I-1-313, I-1-314, I-1-315, I-1-318, I-1-324, I-1-326, I-1-327, I-1-328, I-1-329, I-1-330, I-1-331, I-1-332, I-1-333, I-1-334, I-1-335, I-1-336, I-1-337, I-1-338, I-1-339, I-1-341, I-1-343, I-1-344, I-1-346, I-1-347, I-1-348, I-1-349, I-1-350, I-1-351, I-1-352, I-1-353, I-1-354, I-1-355, I-2-2, I-2-3

Ejemplo N° 17

**Prueba (tratamiento por pulverización) con *Myzus***

Disolvente: 78,0 partes en peso de acetona

- 50 1,5 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: 0,5 partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

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

Se pulverizan discos de hojas de col de china (*Brassica pekinensis*), que están infestadas por todos los estadios del pulgón verde del melocotonero (*Myzus persicae*), con un preparado de principio activo de la concentración deseada.

Después del tiempo deseado se determina el efecto en %. A este respecto, el 100 % significa que se destruyeron todos los pulgones; el 0 % significa que no se destruyó ningún pulgón.

- 5 En esta prueba, por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación, muestran un efecto  $\geq 80$  % a una dosis de 100 g/ha:

Ejemplo N° I-1-64, I-1-68, I-1-74, I-1-75, I-1-76, I-1-77, I-1-78, I-1-80, I-1-81, I-1-83, I-1-84, I-1-92, I-1-97, I-1-99, I-1-100, I-1-101, I-1-113, I-1-116, I-1-117, I-1-118, I-1-120, I-1-121, I-1-126, I-1-127, I-1-128, I-1-130, I-1-131, I-1-134, I-1-135, I-1-36, I-1-137, I-1-138, I-1-139, I-1-142, I-1-144, I-1-145, I-1-146, I-1-150, I-1-152, I-1-163, I-1-174, I-1-176, I-1-177, I-1-178, I-1-179, I-1-180, I-1-184, I-1-185, I-1-186, I-1-198, I-1-203, I-1-207, I-1-209, I-1-211, I-1-212, I-1-216, I-1-272, I-2-10, I-1-308, I-1-326, I-1-327, I-1-329, I-1-330, I-1-331, I-1-332, I-1-333, I-1-336, I-1-338, I-1-339, I-1-354

10

Ejemplo N° 18

**Ensayo con *Aphis gossypii***

Disolvente: 7 partes en peso de dimetilformamida

15

Emulsionante: 2 partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

Para la preparación de un preparado de principio activo apropiado se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades de disolvente y emulsionante indicadas y el concentrado se diluye con agua que contiene emulsionante hasta la concentración deseada. En caso de necesitarse la adición de sales de amonio, promotores de la penetración o sales de amonio y promotores de la penetración, éstos se pipeteen en una concentración de 1000 ppm después de diluir respectivamente la solución de preparado lista para uso.

20

Se pulverizan hojas de algodón (*Gossypium hirsutum*), que están fuertemente infestadas por el pulgón del algodón (*Aphis gossypii*), con un preparado de principio activo con la concentración deseada.

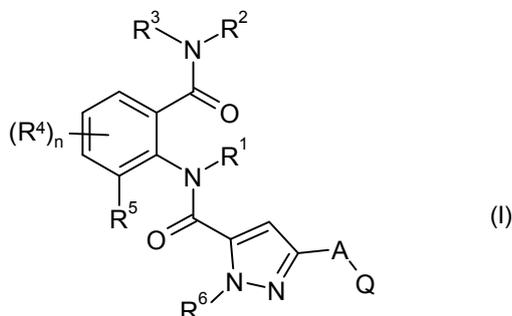
Después del tiempo deseado se determina la destrucción en %. A este respecto, el 100 % significa que se destruyeron todos los pulgones; el 0 % significa que no se destruyó ningún pulgón.

- 25 En esta prueba, por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación, muestran un efecto de  $\geq 80$  % a una dosis de 100 ppm:

Ejemplo N° I-1-68, I-1-75, I-1-76, I-1-88, I-1-98, I-1-99, I-1-104, I-1-108, I-1-113, I-1-131, I-1-139, I-1-143, I-1-176, I-1-251

## REIVINDICACIONES

## 1. Compuestos de fórmula (I)



5 en la que

$R^1$  representa hidrógeno, metilo, ciclopropilo, cianometilo, metoximetilo, metiltiometilo, metilsulfinilmetilo o metilsulfonilmetilo,

$R^2$  representa hidrógeno o metilo,

10  $R^3$  representa hidrógeno o representa alquilo  $C_1-C_6$ , alcoxi  $C_1-C_6$ , en cada caso, dado el caso, monosustituídos o polisustituídos, de manera igual o diferente, pudiendo seleccionarse los sustituyentes independientemente entre sí de halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, alquilo  $C_1-C_6$ , cicloalquilo  $C_3-C_6$ , alcoxi  $C_1-C_4$ , haloalcoxi  $C_1-C_4$ , alquil  $C_1-C_4$ -tio, alquil  $C_1-C_4$ -sulfinilo, alquil  $C_1-C_4$ -sulfonilo, alquil  $C_1-C_4$ -sulfimino, alquil  $C_1-C_4$ -sulfimino-alquilo  $C_1-C_4$ , alquil  $C_1-C_4$ -sulfimino-alquil  $C_2-C_5$ -carbonilo, alquil  $C_1-C_4$ -sulfoximino, alquil  $C_1-C_4$ -sulfoximino-alquilo  $C_1-C_4$ , alquil  $C_1-C_4$ -sulfoximino-alquil  $C_2-C_5$ -carbonilo, alcoxi  $C_2-C_6$ -carbonilo, alquil  $C_2-C_6$ -carbonilo o trialquil  $C_3-C_6$ -sililo,

15  $R^3$  representa además cicloalquilo  $C_3-C_6$ , dado el caso monosustituído o polisustituído, de manera igual o diferente, pudiendo seleccionarse los sustituyentes independientemente entre sí de halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, alquilo  $C_1-C_6$ , cicloalquilo  $C_3-C_6$ , alcoxi  $C_1-C_4$ , haloalcoxi  $C_1-C_4$ , alquil  $C_1-C_4$ -tio, alquil  $C_1-C_4$ -sulfinilo, alquil  $C_1-C_4$ -sulfonilo, alquil  $C_1-C_4$ -sulfimino, alquil  $C_1-C_4$ -sulfimino-alquilo  $C_1-C_4$ , alquil  $C_1-C_4$ -sulfimino-alquil  $C_2-C_5$ -carbonilo, alquil  $C_1-C_4$ -sulfoximino, alquil  $C_1-C_4$ -sulfoximino-alquilo  $C_1-C_4$ , alquil  $C_1-C_4$ -sulfoximino-alquil  $C_2-C_5$ -carbonilo, alcoxi  $C_2-C_6$ -carbonilo, alquil  $C_2-C_6$ -carbonilo o trialquil  $C_3-C_6$ -sililo,

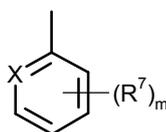
20  $R^4$  representa hidrógeno, alquilo  $C_1-C_4$ , haloalquilo  $C_1-C_2$ , halógeno, ciano o haloalcoxi  $C_1-C_2$ ,

además, dos restos contiguos  $R^4$  representan  $-(CH_2)_4-$ ,  $-(CH=CH)_2-$ ,  $-O(CH_2)_2O-$ ,  $-O(CF_2)_2O-$ ,  $-(CH=CH-CH=N)-$  o  $-(CH=CH-N=CH)-$ ,

$n$  representa 0 a 3,

25  $R^5$  representa alquilo  $C_1-C_4$ , cicloalquilo  $C_3-C_6$ , haloalquilo  $C_1-C_4$ , halocicloalquilo  $C_1-C_6$ , alquenilo  $C_2-C_6$ , haloalquenilo  $C_2-C_4$ , alquinilo  $C_2-C_4$ , haloalquinilo  $C_2-C_4$ , alcoxi  $C_1-C_4$ , haloalcoxi  $C_1-C_4$ , flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro o trialquil  $C_3-C_6$ -sililo.

$R^6$  representa metilo o



30  $R^7$  representa, independientemente entre sí, hidrógeno, halógeno o haloalquilo  $C_1-C_4$ ,

$m$  representa de modo particularmente preferente 1 o 2,

X representa N, CH, CF, CCl o CBr,

A representa  $-CH_2-$ ,  $-CH(CH_3)$ ,  $C(CH_3)_2$  o  $CH_2CH_2$ ,

A representa además  $-CH(CN)-$ ,

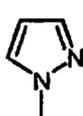
35 Q representa un anillo heterocíclico aromático de 5 o 6 miembros, dado el caso monosustituído o polisustituído, de la serie Q-36 a Q-40, o un sistema de anillo Q-54 a Q-56 heterobíciclico condensado aromático de 9 miembros, pudiendo seleccionarse los sustituyentes independientemente entre sí de alquilo  $C_1-C_3$ , haloalquilo  $C_1-C_3$ , alcoxi  $C_1-C_2$ , halógeno, ciano, hidroxilo, nitro o haloalcoxi  $C_1-C_2$ .

5 Q representa además un anillo heterocíclico aromático de 5 o 6 miembros, dado el caso monosustituido o polisustituido, de la serie Q-36 a Q-40 y Q-58 a Q-59, un sistema de anillo Q-54 a Q-56 heterobícíclico condensado aromático de 9 miembros, así como un anillo Q-60 a Q-61 heterocíclico de 5 miembros, pudiendo seleccionarse los sustituyentes independientemente entre sí de alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, halógeno, ciano, hidroxilo, nitro o haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>,

o pudiendo seleccionarse los sustituyentes independientemente entre sí de fenilo o de un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, pudiendo estar el fenilo o el anillo monosustituidos o polisustituidos, dado el caso, de manera igual o diferente, con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>,



Q-36



Q-37



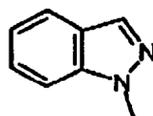
Q-38



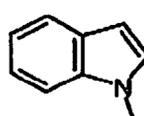
Q-39



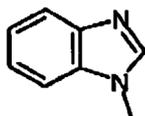
Q-40



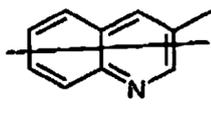
Q-54



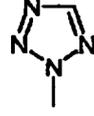
Q-55



Q-56



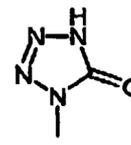
Q-57



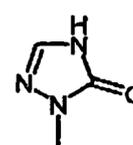
Q-58



Q-59



Q-60



Q-61

10

así como sus N-óxidos y sales.

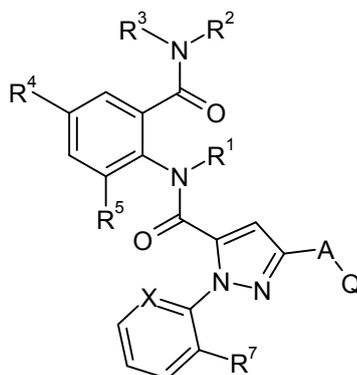
2. Compuestos de fórmula (I) según la reivindicación 1, en la que

A representa -CH<sub>2</sub>-, -CH(CH<sub>3</sub>), C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> o CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>,

15 R<sup>3</sup> representa hidrógeno o representa alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, en cada caso, dado el caso, monosustituidos o polisustituidos, de manera igual o diferente, pudiendo seleccionarse los sustituyentes independientemente entre sí de halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-tio, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfinilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfonilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfimino, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfimino-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfimino-alquil C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub>-carbonilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfoximino, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfoximino-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfoximino-alquil C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub>-carbonilo, alcoxi C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-carbonilo, alquil C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-carbonilo o trialquil C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-sililo,

20 Q representa un anillo heterocíclico aromático de 5 o 6 miembros, dado el caso monosustituido o polisustituido, de la serie Q-36 a Q-40, o un sistema de anillo Q-54 a Q-56 heterobícíclico condensado aromático de 9 miembros, pudiendo seleccionarse los sustituyentes independientemente entre sí de alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, halógeno, ciano, hidroxilo, nitro o haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>.

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



(I-1),

25

en la que

R<sup>1</sup> representa hidrógeno,

R<sup>2</sup> representa hidrógeno,

5 R<sup>3</sup> representa alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> (metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, n-butilo, iso-butilo, sec-butilo o terc-butilo) o cianoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> (cianometilo, 1-cianoetilo, 2-cianoetilo, 1-ciano-n-propilo, 2-ciano-n-propilo, 3-ciano-n-propilo, 1-ciano-iso-propilo, 2-ciano-iso-propilo),

R<sup>4</sup> representa hidrógeno, metilo, trifluorometilo, ciano, flúor, cloro, bromo, yodo o trifluorometoxi,

R<sup>5</sup> representa metilo, flúor, cloro, bromo o yodo,

R<sup>7</sup> representa flúor, cloro o bromo,

X representa N, CCl o CH,

10 A representa CH<sub>2</sub> o CH(CH<sub>3</sub>),

Q representa un anillo heterocíclico aromático de la serie Q-37, Q-38, Q-39, Q-40, Q-58 y Q-59, dado el caso monosustituido o polisustituido, así como un anillo Q-60 heterocíclico de 5 miembros, pudiendo seleccionarse los sustituyentes independientemente entre sí de alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, halógeno, ciano, hidroxilo, nitro o haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>,

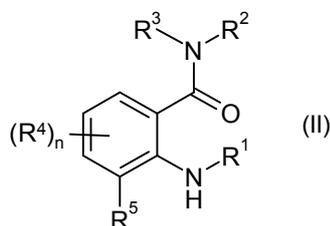
15 o pudiendo seleccionarse los sustituyentes independientemente entre sí de fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, en el que el fenilo o el anillo pueden estar, dado el caso, monosustituidos o polisustituidos, de manera igual o diferente, con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>,

así como sus N-óxidos y sales.

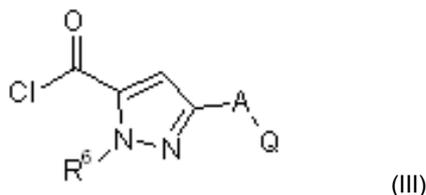
20 4. Procedimiento de preparación de compuestos de la fórmula general (I) según la reivindicación 1, **caracterizado porque**

se hacen reaccionar

(A) anilinas de fórmula (II),

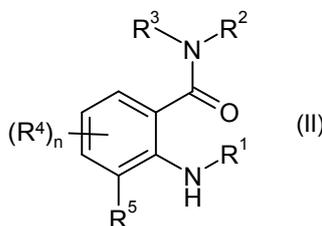


25 en la que R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> y n tienen los significados anteriormente indicados, con cloruros de ácido carboxílico de fórmula (III),

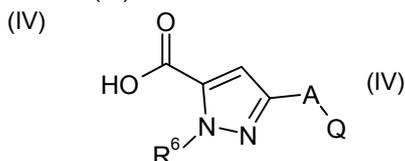


en la que R<sup>6</sup>, A y Q tienen los significados anteriormente indicados, en presencia de un aglutinante ácido, se hacen reaccionar

30 (B) anilinas de fórmula (II),



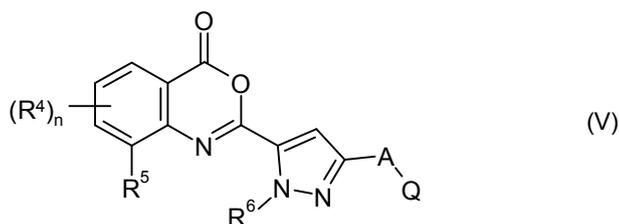
en la que R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> y n tienen los significados anteriormente indicados,  
con un ácido carboxílico de fórmula (IV)



5

en la que R<sup>6</sup>, A y Q tienen los significados anteriormente indicados,  
en presencia de un agente de condensación, o se hacen reaccionar

10 (C) para la síntesis de compuestos de fórmula (I), en la que R<sup>1</sup> representa hidrógeno, benzoxazinonas de fórmula (V),



en la que R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, A, Q y n tienen los significados anteriormente indicados,  
con una amina de fórmula (XV)



15 en la que R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> tienen los significados anteriormente indicados,  
en presencia de un diluyente.

5. Uso de compuestos de fórmula (I) o (I-1) según las reivindicaciones 1 a 3 para combatir plagas animales excepto para el tratamiento terapéutico del cuerpo de animales o de seres humanos.

20 6. Procedimiento para combatir plagas animales, **caracterizado porque** los compuestos de fórmula (I) o (I-1) según las reivindicaciones 1 a 3 se dejan actuar sobre plagas animales y/u hongos fitopatógenos y/o su hábitat y/o semillas, excepto para el tratamiento terapéutico del cuerpo de animales o de seres humanos.

7. Procedimiento de preparación de composiciones agroquímicas, **caracterizado porque** se mezclan compuestos de fórmula (I) o (I-1) según las reivindicaciones 1 a 3 con diluyentes y/o sustancias tensioactivas.

8. Uso de compuestos de fórmula (I) o (I-1) según las reivindicaciones 1 a 3 para el tratamiento de semillas.

25 9. Uso de compuestos de fórmula (I) o (I-1) según las reivindicaciones 1 a 3 para el tratamiento de plantas transgénicas.

10. Uso de compuestos de fórmula (I) o (I-1) según las reivindicaciones 1 a 3 para el tratamiento de semillas de plantas transgénicas.

11. Semillas que han sido recubiertas con un compuesto de fórmula (I) o (I-1) según las reivindicaciones 1 a 3.