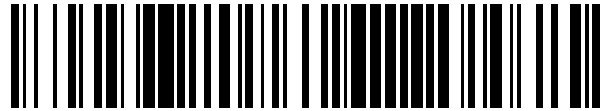


19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 571 327**

51 Int. Cl.:

**A01N 47/18** (2006.01)  
**C07D 249/10** (2006.01)  
**C07D 401/12** (2006.01)  
**C07D 403/12** (2006.01)  
**C07D 405/12** (2006.01)  
**C07D 409/12** (2006.01)  
**C07D 413/12** (2006.01)  
**C07D 417/12** (2006.01)  
**C07H 13/12** (2006.01)  
**A01P 7/04** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **05.08.2010 E 10807152 (3)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **16.03.2016 EP 2461688**

54 Título: **Composiciones plaguicidas**

30 Prioridad:

**07.08.2009 US 232142 P**

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

**24.05.2016**

73 Titular/es:

**DOW AGROSCIENCES LLC (100.0%)  
9330 Zionsville Road  
Indianapolis, IN 46268-1054, US**

72 Inventor/es:

**LAMBERT, WILLIAM;  
CROUSE, GARY;  
SPARKS, THOMAS y  
CUDWORTH, DENISE**

74 Agente/Representante:

**DE ELZABURU MÁRQUEZ, Alberto**

**ES 2 571 327 T3**

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

## DESCRIPCIÓN

Composiciones plaguicidas

**Campo de la invención**

La invención desvelada en el presente documento se refiere al campo de plaguicidas y su uso para combatir plagas.

**5 Antecedentes de la invención**

Las plagas provocan millones de muertes humanas en todo el mundo cada año. Además, hay más de diez mil especies de plagas que provocan pérdidas en agricultura. Estas pérdidas agrícolas suman miles de millones de dólares americanos cada año. Las termitas provocan daño a diversas estructuras tales como hogares. Estas pérdidas por daño por termitas suman miles de millones de dólares americanos cada año. Como un último apunte, muchas plagas de alimentos almacenados se alimentan de y adulteran alimentos almacenados. Estas pérdidas de alimentos almacenados suman miles de millones de dólares americanos cada año, pero lo que es más importante, privan a las personas de alimentos necesarios.

El documento US 2007/0066617 A1 se refiere a compuestos de benzamida isoxazolina sustituida y su uso como insecticidas. El documento WO 00/24735 A1 se refiere a 1-(piridilo sustituido)-1,2,4-triazoles insecticidas.

15 Existe una gran necesidad de nuevos plaguicidas. Los insectos están desarrollando resistencia a los plaguicidas usados en la actualidad. Cientos de especies de insectos son resistentes a uno o más plaguicidas. El desarrollo de resistencia a algunos de los plaguicidas más antiguos, tales como DDT, los carbamatos y los organofosfatos, se conoce bien. No obstante, se ha desarrollado resistencia incluso a algunos de los plaguicidas más nuevos. Por lo tanto, existe la necesidad de nuevos plaguicidas y particularmente plaguicidas que tengan nuevos modos de acción.

**20 Sustituyentes (lista no exhaustiva)**

Los ejemplos dados para los sustituyentes son (excepto para halo) no exhaustivos.

"alquenilo" significa un sustituyente acíclico, insaturado (al menos un doble enlace carbono-carbono), ramificado o sin ramificar, que consiste en carbono e hidrógeno, por ejemplo, vinilo, alilo, butenilo, pentenilo, hexenilo, heptenilo, octenilo, nonenilo y decenilo.

25 "alqueniloxi" significa un alquenilo que consiste adicionalmente en un enlace sencillo carbono-oxígeno, por ejemplo, aliloxi, buteniloxi, penteniloxi, hexeniloxi, hepteniloxi, octeniloxi, noneniloxi y deceniloxi.

"alcoxi" significa un alquilo que consiste adicionalmente en un enlace sencillo carbono-oxígeno, por ejemplo, metoxi, etoxi, propoxi, isopropoxi, 1-butoxi, 2-butoxi, isobutoxi, *terc*-butoxi, pentoxi, 2-metilbutoxi, 1,1-dimetilpropoxi, hexoxi, heptoxi, octoxi, nonoxi y decoxi.

30 "alquilo" significa un sustituyente acíclico, saturado, ramificado o sin ramificar, que consiste en carbono e hidrógeno, por ejemplo, metilo, etilo, propilo, isopropilo, 1-butilo, 2-butilo, isobutilo, *terc*-butilo, pentilo, 2-metilbutilo, 1,1-dimetilpropilo, hexilo, heptilo, octilo, nonilo y decilo.

35 "alquinilo" significa un sustituyente acíclico, sin saturar (al menos un triple enlace carbono-carbono, y cualquier doble enlace), ramificado o sin ramificar, que consiste en carbono e hidrógeno, por ejemplo, etinilo, propargilo, butinilo, pentinilo, hexinilo, heptinilo, octinilo, noninilo y decinilo.

"alquiniloxi" significa un alquinilo que consiste adicionalmente en un enlace sencillo carbono-oxígeno, por ejemplo, pentiniloxi, hexiniloxi, heptiniloxi, octiniloxi, noniniloxi y deciniloxi.

"arilo" significa un sustituyente cíclico, aromático que consiste en hidrógeno y carbono, por ejemplo, fenilo, naftilo y bifenilo.

40 "cicloalquenilo" significa un sustituyente monocíclico o policíclico, sin saturar (al menos un doble enlace carbono-carbono) que consiste en carbono e hidrógeno, por ejemplo, ciclobutenilo, ciclopentenilo, ciclohexenilo, cicloheptenilo, ciclooctenilo, ciclodecenilo, norbornenilo, biciclo[2.2.2]octenilo, tetrahidronaftilo, hexahidronaftilo y octahidronaftilo.

45 "cicloalqueniloxi" significa un cicloalquenilo que consiste adicionalmente en un enlace sencillo carbono-oxígeno, por ejemplo, ciclobuteniloxi, ciclopenteniloxi, ciclohexeniloxi, ciclohepteniloxi, cicloocteniloxi, ciclodeceniloxi, norborneniloxi y biciclo[2.2.2]octeniloxi.

"cicloalquilo" significa un sustituyente monocíclico o policíclico, saturado que consiste en carbono e hidrógeno, por ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo, ciclooctilo, ciclodecilo, norbornilo, biciclo[2.2.2]octilo y decahidronaftilo

50

"cicloalcoxi" significa un cicloalquilo que consiste adicionalmente en un enlace sencillo carbono-oxígeno, por ejemplo, ciclopropiloxi, ciclobutiloxi, ciclopentiloxi, ciclohexiloxi, cicloheptiloxi, ciclooctiloxi, ciclodeciloxi, norborniloxi y biciclo[2.2.2]octiloxi.

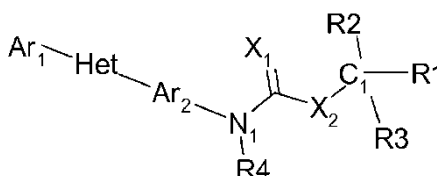
"halo" significa flúor, cloro, bromo y yodo.

5 "haloalquilo" significa un alquilo que consiste adicionalmente, de uno al máximo número posible de, idénticos o diferentes, halos, por ejemplo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, clorometilo, triclorometilo y 1,1,2,2-tetrafluoroetilo.

10 "heterocíclico" significa un sustituyente cíclico que puede estar completamente saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado, donde la estructura cíclica contiene al menos un carbono y al menos un heteroátomo, donde dicho heteroátomo es nitrógeno, azufre u oxígeno, por ejemplo, benzofuranilo, benzoisotiazolilo, benzoisoxazolilo, benzoxazolilo, benzotienilo, benzotiazolilo cinnolinilo, furanilo, indazolilo, indolilo, imidazolilo, isoindolilo, isoquinolinilo, isotiazolilo, isoxazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, oxazolinilo, oxazolilo, ftalazinilo, pirazinilo, pirazolinilo, pirazolilo, piridazinilo, piridilo, pirimidinilo, pirrolilo, quinazolinilo, quinolinilo, quinoxalinilo, 1,2,3,4-tetrazolilo, tiazolinilo, tiazolilo, tienilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo, 1,2,3-triazolilo y 1,2,4-triazolilo.

### 15 Descripción detallada de la invención

Los compuestos de esta invención tienen la siguiente fórmula:



en donde:

20 (a) Ar<sub>1</sub> es un fenilo sustituido en donde dicho fenilo sustituido tiene uno o más sustituyentes seleccionados de haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> y haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>;

(b) Het es un 1,2,4-triazol 1,3-disustituido donde Ar<sub>1</sub> y Ar<sub>2</sub> no son orto entre sí (pero son 1,3;

(c) Ar<sub>2</sub> es

(d) X<sub>1</sub> es O o S;

(e) X<sub>2</sub> es O o S;

25 (f) R<sub>4</sub> es H o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>;

30 (g) R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub> y R<sub>3</sub> se seleccionan independientemente de H, F, Cl, Br, I, CN, NO<sub>2</sub>, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, C(=O)H, C(=O)NR<sub>x</sub>R<sub>y</sub>, (alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)NR<sub>x</sub>R<sub>y</sub>, C(=O)(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)O(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)O(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)O(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)(haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)O(haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)(cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)O(cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)(alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)O(alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), (alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)O(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)S(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)C(=O)O(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)fenilo, alquilfenilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, C(=O)fenoxi, fenoxi, alquilfenoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, C(=O)Het-1, Het-1 o alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> Het-1,

en donde Het-1 es un anillo heterocíclico, saturado o insaturado, de 5 o 6 miembros, que contiene uno o más heteroátomos seleccionados independientemente de nitrógeno, azufre u oxígeno, y

35 en donde cada alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, halocicloalquilo, cicloalcoxi, halocicloalcoxi, alcoxi, haloalcoxi, alqueno, alquinilo, fenilo, fenoxi y Het-1, se sustituyen opcionalmente con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de F, Cl, Br, I, CN, NO<sub>2</sub>, oxo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalcoxi C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalcoxi C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, S(=O)<sub>n</sub>(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), S(=O)<sub>n</sub>(haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), OSO<sub>2</sub>(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), OSO<sub>2</sub>(haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)H, C(=O)NR<sub>x</sub>R<sub>y</sub>, (alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)NR<sub>x</sub>R<sub>y</sub>, (alqueno C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)NR<sub>x</sub>R<sub>y</sub>, (alquinilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)NR<sub>x</sub>R<sub>y</sub>, C(=O)(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)O(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)(haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)O(haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)(cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)O(cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)(alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)O(alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), (alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)O(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)S(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)C(=O)O(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), fenilo, fenoxi y Het-1,

en donde n = 0, 1 o 2;

45 en donde R<sub>x</sub> y R<sub>y</sub> se seleccionan independientemente de H, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalcoxi C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalcoxi C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>,

alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, S(=O)<sub>n</sub>(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), S(=O)<sub>n</sub>haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), OSO<sub>2</sub>(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), OSO<sub>2</sub>(haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)H, C(=O)(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)O(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)(haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)O(haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)(cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)O(cicloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)(alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)O(alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), (alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)O(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)S(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)C(=O)O(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), fenilo y fenoxi;

en donde R1 y R2 juntos pueden formar opcionalmente un grupo cíclico, saturado o insaturado de 3 a 12 miembros que puede contener uno o más heteroátomos seleccionados de nitrógeno, azufre y oxígeno (con la condición de que preferiblemente no sea un enlace C-O en tal grupo cíclico) en donde dicho grupo cíclico puede tener uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de F, Cl, Br, I, CN, NO<sub>2</sub>, oxo, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalcoxi C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalcoxi C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, S(=O)<sub>n</sub>(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), S(=O)<sub>n</sub>(haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), OSO<sub>2</sub>(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), OSO<sub>2</sub>(haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)H, C(=O)NR<sub>x</sub>R<sub>y</sub>, (alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)NR<sub>x</sub>R<sub>y</sub>, C(=O)(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)O(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)(haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)O(haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)(cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)O(cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)(alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)O(alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), (alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)O(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)S(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)C(=O)O(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), fenilo, fenoxi y Het-1.

En otra realización R1, R2 y R3 se seleccionan independientemente de H, CN, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, C(=O)O(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), fenilo y Het-1.

En otra realización R1, R2 y R3 se seleccionan independientemente de alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, C(=O)O(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), fenilo y Het-1 sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de F, Cl, Br, I, CN, NO<sub>2</sub>, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, S(=O)<sub>n</sub>(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)NR<sub>x</sub>R<sub>y</sub>, (alqueno C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)NR<sub>x</sub>R<sub>y</sub>, (alquinilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)NR<sub>x</sub>R<sub>y</sub>, C(=O)O(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) y fenilo.

En otra realización cuando R1, R2 y R3 son Het-1 se seleccionan independientemente de pirimidinilo, piridilo, quinolinilo, tiazolilo, tienilo, furanilo, isoxazolilo, cada uno de los cuales puede estar opcionalmente sustituido.

En otra realización Het-1 cuando tiene un anillo de nitrógeno incluye un grupo (N<sup>+</sup>-O<sup>-</sup>).

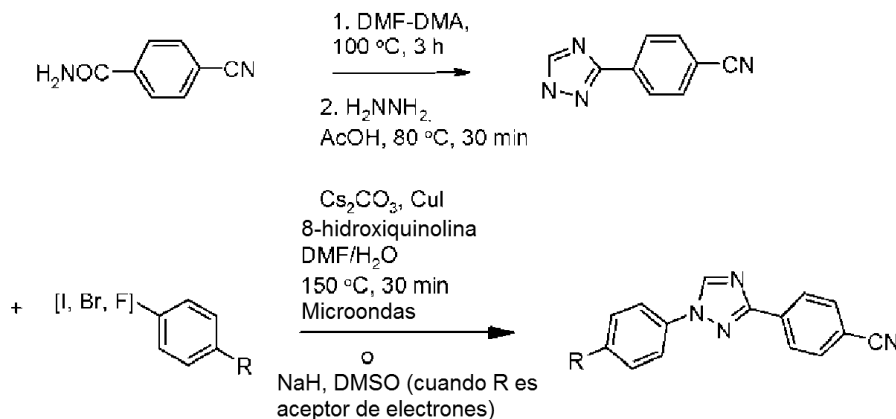
Aunque han sido expresadas estas realizaciones, son posibles otras realizaciones y combinaciones de estas realizaciones expresadas y otras realizaciones.

### Preparación de intermedios de triarilo

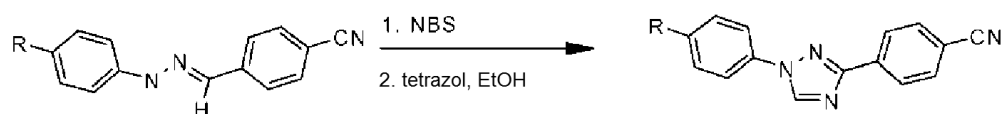
Los compuestos de esta invención se preparan enlazando el X<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>)R1R2R3 a un intermedio de triarilo, Ar<sub>1</sub>-Het-Ar<sub>2</sub>, por medio de un enlace de carbamato o tiocarbamato N<sub>1</sub>(C=X<sub>1</sub>) (definido anteriormente). Una amplia variedad de precursores de triarilo pueden usarse para preparar compuestos de esta invención, con la condición de que contengan un grupo funcional adecuado en Ar<sub>2</sub>. Los grupos funcionales adecuados incluyen un grupo amino o ácido carboxílico. Estos intermedios de triarilo pueden prepararse mediante los métodos descritos previamente en la bibliografía química. Varios de estos métodos se describen a continuación.

Los compuestos intermedios en donde 'Het' es un 1,2,4-triazol 1,3-disustituido pueden prepararse según uno de los siguientes esquemas.

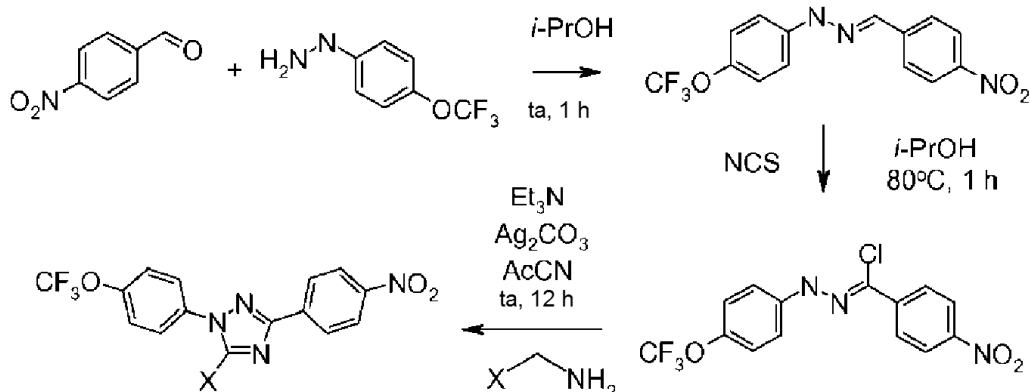
Ruta A: Se prepararon 1,3-diaril 1,2,4-triazoles a partir de los correspondientes -NH 3-aril 1,2,4-triazoles siguiendo una ruta publicada para N-arilación de imidazoles (Lin *et al.* J. Org. Chem. 1979, 44, 4160). El acoplamiento de 1,2,4-triazoles a los haluros de arilo se hizo en condiciones térmicas o, preferiblemente, microondas (Antilla *et al.* J. Org. Chem. 2004, 69, 5578).



Ruta B: La bromación de hidrazonas seguido del tratamiento de la brohidrazona con tetrazol da como resultado la formación de 1,3-diaril 1,2,4-triazol (Butler and Fitzgerald J. Chem. Soc., Perkin Trans. 1 1988, 1587).



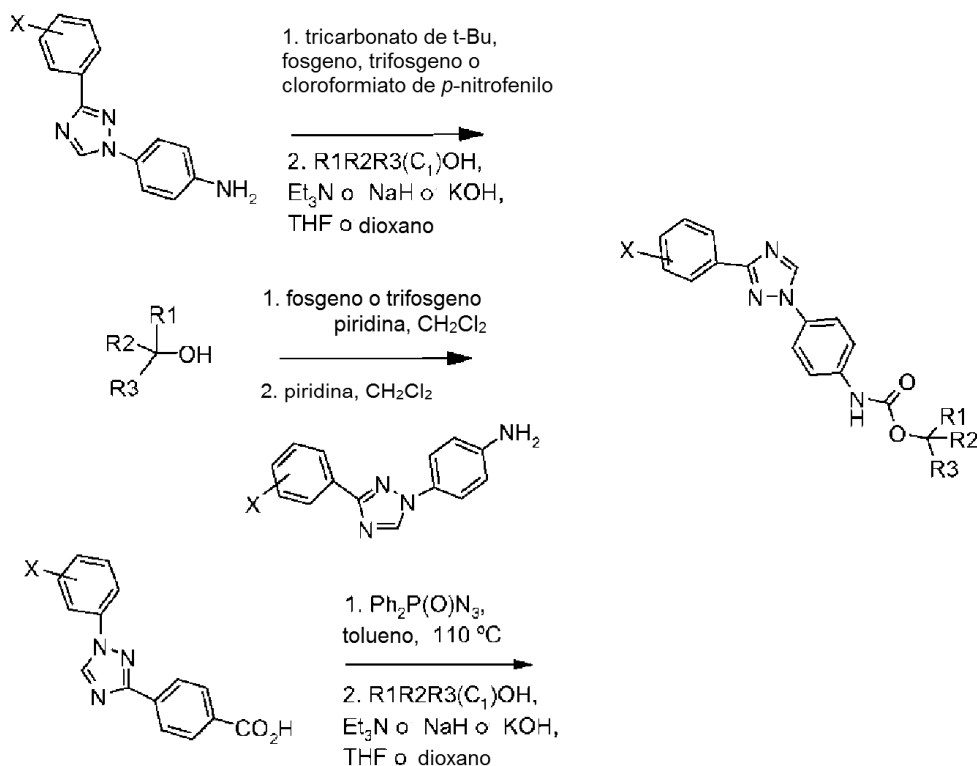
5 Ruta C. Los compuestos 1,2,4-triazol en los que la posición 5 se sustituye adicionalmente con grupo alquilo o alquilo sustituido pueden prepararse según el siguiente esquema (Paulvannan and Hale Tetrahedron 2000, 56, 8071):



#### Preparación de compuestos enlazados a (tio)carbamato

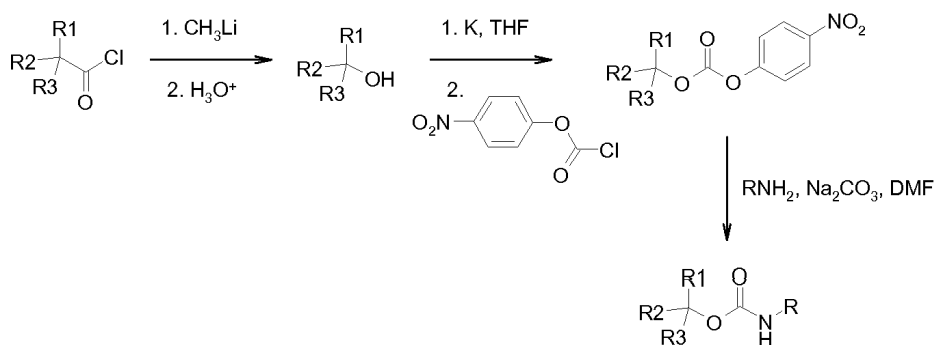
10 Los compuestos enlazados a carbamato o tiocarbamato pueden prepararse a partir de las correspondientes aril aminas mediante la conversión en, o bien un isocianato, isotiocianato o carbamato de *p*-nitrofenilo, seguido del tratamiento con el alcohol apropiado (ROH) y una base orgánica o inorgánica en un disolvente adecuado, tal como tetrahidrofurano (THF), a temperaturas entre 0 y 100 °C. Alternativamente, el carbamato puede formarse a partir de un cloroformiato, generado a partir del alcohol (ROH) por el tratamiento con trifosgeno en presencia de una base, tal como piridina, seguido de la reacción con una amina apropiada.

15 Un intermedio de isocianato puede generarse a partir del ácido carboxílico por el tratamiento con una fuente de azida, tal como difenilfosforil azida (DPPA). Después, se puede someter la azida de acilo a una transposición de Curtius por calentamiento a 110 °C en tolueno y el isocianato resultante se trató con un alcohol y una base apropiados como se ha descrito anteriormente para generar el carbamato. Los ácidos carboxílicos precursores pueden prepararse a través de la oxidación de un aldehído, usando las condiciones descritas en el Ejemplo 18, a  
20 través de una hidrólisis básica de un nitrilo (por ejemplo 4-(1-(4-trifluorometoxifenil)-1,2,4-triazol-3-il)-benzonnitrilo como se describe en el Ejemplo 10), o a través de una hidrólisis ácida de un nitrilo usando cualquiera de una variedad de condiciones descritas en la bibliografía.



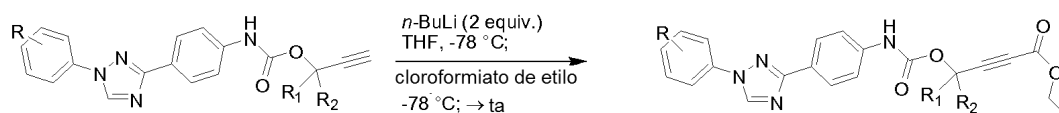
Los carbamatos también pueden prepararse a través de carbonatos de nitrofenilo como se muestra a continuación y se demuestra en McClure and Sieber Heteroat. Chem. 2000, 11, 192. La reacción de un carbinol terciario con metal de potasio, seguido de la adición de cloroformiato de *p*-nitrofenilo, proporciona el carbonato de *p*-nitrofenilo deseado. La reacción posterior del carbonato con una amina en presencia de carbonato sódico en DMF, proporciona el carbamato.

5

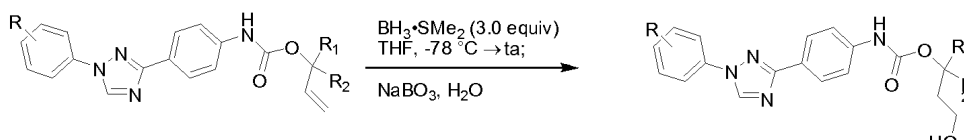


Los carbamatos de alquínilo pueden funcionalizarse adicionalmente por la desprotonación con una base, tal como *n*-butilitio, en un disolvente aprótico polar, tal como THF, seguido de la reacción con cloroformiato de etilo para proporcionar el alquino sustituido.

10



Los carbamatos que contienen alqueno pueden funcionalizarse a través de hidrobromación-oxidación con un complejo borano-sulfuro de dimetilo, seguido del tratamiento tetrahidrato de perborato sódico.



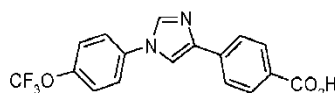
### Ejemplos

Los ejemplos son con propósitos ilustrativos.

5 Los materiales de partida, reactivos y disolventes que se obtuvieron de fuentes comerciales se usaron sin purificación adicional. Los disolventes anhidros se adquirieron como Sure/Seal™ de Aldrich y se usaron como se recibieron. Se obtuvieron puntos de fusión en un aparato de punto de fusión capilar Thomas Hoover Unimelt o un sistema de punto de fusión automatizado OptiMelt de Sanford Research Systems y son incorrectos.

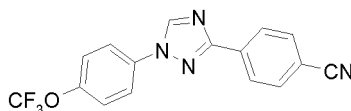
Los Ejemplos 15 - 22 y 39 - 42 ilustran la preparación de moléculas adicionales útiles en la fabricación de diversas realizaciones de esta invención.

#### 10 **Ejemplo 10: Preparación de ácido 4-[1-(4-trifluorometoxifenil)-1H-imidazol-4-il]-benzoico.**



15 Una solución del nitrilo (1,1 g, 3,3 mmol) en EtOH (5 ml) y agua (2 ml) se trató con NaOH (1 g, 20 mmol) y la solución se calentó a reflujo durante 6 h. Después, se enfrió y se hizo ácido con HCl 1 N y el sólido de color blanco resultante se filtró y se secó al aire para dar el ácido (1,1 g) en forma de un sólido de color gris claro: pf 230 °C; RMN <sup>1</sup>H (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 11,4 (s, 1H), 7,90 (d, J = 6,4 Hz, 2H), 7,89 (s, 1H), 7,80 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 7,63 (d, J = 1,3 Hz, 1H), 7,49 (d, J = 9,3 Hz, 2H), 7,38 (d, J = 8,9 Hz, 2H).

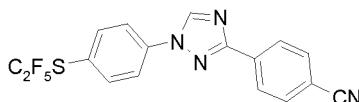
#### **Ejemplo 15: Preparación de 4-[1-(4-trifluorometoxifenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-benzonitrilo.**



20 Etapa 1. 4-(1H-[1,2,4]triazol-3-il)-benzonitrilo. El procedimiento general descrito por Lin *et al.* (J. Org. Chem. 1979, 44, 4163) se usó para la preparación de 3-(4-nitrofenil)-1H-[1,2,4]triazol. Se disolvió 4-cianobenzamida (21,63 g, 0,148 mol) en DMF-DMA (100 ml) y se agitó a reflujo en N<sub>2</sub> durante 8 h. La mezcla se concentró a sequedad y se suspendió en AcOH (50 ml). Después, el recipiente se cargó con monohidrato de hidrazina (7,18 ml, 0,148 mmol) y se agitó a reflujo durante 1 h antes de concentrarse. El 4-(1H-[1,2,4]triazol-3-il)-benzonitrilo deseado se obtuvo en una pureza del 98 % por trituración con Et<sub>2</sub>O seguido de filtración (12,17 g, 0,072 mol, 48 %).

25 Etapa 2. 4-[1-(4-Trifluorometoxifenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-benzonitrilo. El triazol (70 mg, 0,41 mmol), 1-yodo-4-trifluorometoxibenceno (142 mg, 0,493 mmol), Cs<sub>2</sub>CO<sub>3</sub> (535 mg, 1,644 mmol), CuI (3 mg, 0,012 mmol), 8-hidroxiquinolina (2 mg, 0,012 mmol) y DMF/H<sub>2</sub>O (2 ml; solución 10:1) se combinaron en un recipiente de reacción de microondas CEM de 10 ml equipado con una barra agitadora magnética y se sometieron a irradiación por microondas a 150 °C durante 30 min. Después, los contenidos se filtraron y se concentraron a sequedad proporcionando el intermedio 1,3-difenil triazol (18 mg, 13 %).

#### **Ejemplo 16: Preparación de 4-[1-(4-pentafluoroetilsulfanilfenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-benzonitrilo.**

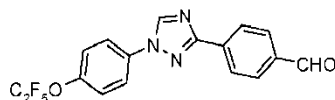


35 Etapa 1. 1-Bromo-4-pentafluoroetilsulfanilbenceno. El compuesto del título se preparó usando condiciones de perfluoroalquilación descritas originalmente por Popov *et al.* J. Fluorine Chem. 1982, 21, 365. A una solución de 4-bromobencenotiol (500 mg, 2,64 mmol, 1,00 equiv.) y cloruro de trietilbencil amonio (60 mg, 0,26 mmol, 0,10 equiv.) en 10 ml de Et<sub>2</sub>O/NaOH 1:1 (ac. al 25 %) a 0 °C se burbujeó gas 1,1,1,2,2-pentafluoro-2-yodoetano durante 30 min (> 5 equiv.). Durante este tiempo una lámpara de UV se dirigió al recipiente de reacción mientras que la temperatura se mantenía por debajo de 10 °C mediante el uso intermitente de un baño de hielo. Después, los contenidos se calentaron a temperatura ambiente, se extrajeron en Et<sub>2</sub>O (300 ml), se secaron (MgSO<sub>4</sub>) y se concentraron a presión reducida. Una porción de este material en bruto se usó en las reacciones posteriores sin purificación adicional (200

mg de residuo: 120 mg de producto, 0,39 mmol, 1,2 equiv.).

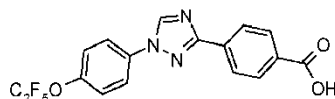
Etapa 2. 4-[1-(4-Pentafluoroetilfenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-benzonitrilo. El acoplamiento con 4-(1H-[1,2,4]triazol-3-il)-benzonitrilo como se ha descrito anteriormente dio 4-[1-(4-pentafluoroetilfenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-benzonitrilo (70 mg, 46 %).

#### 5 Ejemplo 17: Preparación de 4-[1-(4-pentafluoroetiloxi-fenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-benzaldehído.



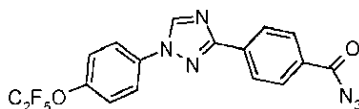
Etapa 1. Una solución de 3-*p*-tolil-1H-[1,2,4]triazol (4,85 g, 30,5 mmol), 4-bromofenil pentafluoroetil éter (10,0 g, 34,4 mmol), Cs<sub>2</sub>CO<sub>3</sub> (25 g, 77 mmol), CuI (1,25 g, 6,5 mmol) y 8-hidroxiquinolina (0,35 g, 2,4 mmol) en DMF/H<sub>2</sub>O 9:1 (50 ml) se agitó vigorosamente y se calentó a 130 °C (temperatura interna) durante 20 h. Después, la solución se enfrió, se vertió en agua y se acidificó con HCl 2 N a pH 2. Después se añadió éter (250 ml) y la solución se sacudió y se filtró antes de la separación de las fases. La fase orgánica se secó y se concentró y el sólido gomoso resultante se calentó con hexanos (100 ml). La fase de hexano caliente se decantó del residuo insoluble, la solución resultante se enfrió a 0 °C y el sólido precipitado se filtró y se secó al aire para suministrar 1-(4-pentafluoroetiloxi-fenil)-3-*p*-tolil-1H-[1,2,4]triazol (7,0 g, 61 % basándose en el triazol de partida) en forma de un sólido de color blanquecino: pf 130-132 °C; IENEM *m/z* 370,8 (M+H).

Etapa 2. El producto de la Etapa 1 (7,0 g, 18,7 mmol) se disolvió en acetonitrilo (200 ml) y se agitó a temperatura ambiente mientras que se añadía en porciones nitrato de amonio cérico (32 g, 58 mmol) en agua (60 ml) durante 10 min. Después, la solución se calentó a reflujo durante 4 h, se enfrió y se diluyó con agua (200 ml). La solución se extrajo con éter (2 x 200 ml) y la fase orgánica combinada se secó y se concentró para dar un aceite de color naranja. Este material se disolvió en dioxano (40 ml) y se trató con una solución de KOH (5 g, 90 mmol) en agua (20 ml). La solución se calentó a reflujo durante 2 h, después se enfrió y se diluyó con agua (100 ml). El de aldehído precipitó y se recogió por filtración. La recristalización de MeOH/H<sub>2</sub>O dio el aldehído puro en forma de un sólido de color blanco (2,2 g, 30 %): pf 137-144 °C RMN <sup>1</sup>H (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 10,1 (s, 1H), 8,65 (s, 1H), 8,40 (d, *J* = 8,4 Hz, 2H), 8,0 (d, *J* = 8,4 Hz, 2H), 7,85 (d, *J* = 9 Hz, 2H), 7,45 (d, *J* = 9 Hz, 2H); IENEM *m/z* 384,2 (M+H). Ejemplo 18: Preparación de ácido 4-[1-(4-pentafluoroetiloxi-fenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-benzoico.



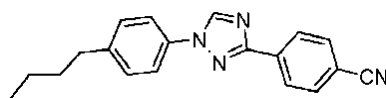
Una solución de 4-[1-(4-pentafluoroetiloxi-fenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-benzaldehído (1,7 g, 4,4 mmol), bromato sódico (2,1 g, 13,9 mmol) y bisulfato sódico (0,53 g, 4,5 mmol) en acetonitrilo (50 ml) se calentó a reflujo durante 5 h, tiempo durante el cual se formó un precipitado voluminoso. Después, la solución se enfrió y se vertió en agua (100 ml), se filtró y se secó para suministrar el ácido (1,67 g) en forma de un sólido de color blanco: pf 225 °C; RMN <sup>1</sup>H (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 10,1 (s, 1H), 8,63 (s, 1H), 8,35 (d, *J* = 8,4 Hz, 2H), 8,5 (d, *J* = 8,4 Hz, 2H), 7,85 (d, *J* = 9 Hz, 2H), 7,43 (d, *J* = 9 Hz, 2H); IENEM *m/z* 399,2 (M+H<sup>+</sup>).

#### Ejemplo 19: Preparación de 4-[1-(4-pentafluoroetiloxi-fenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-benzoil azida.



Una solución de ácido 4-[1-(4-pentafluoroetiloxi-fenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-benzoico (1,67 g, 4,2 mmol), difenilfosforil azida (1,26 g, 4,58 mmol) y trietilamina (0,5 g, 5 mmol) en *t*-BuOH seco (10 ml) se calentó a 75 °C durante 90 min, dando como resultado una disolución del ácido de partida y la precipitación posterior de la azida. Después, la solución enfriada se vertió en hielo (10 g) y la mezcla resultante se filtró y se secó para suministrar la azida (0,80 g) en forma de un sólido de color blanco: pf 112-115 °C dec; RMN <sup>1</sup>H (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 8,62 (s, 1H), 8,33 (d, *J* = 8,4 Hz, 2H), 8,16 (d, *J* = 8,4 Hz, 2H), 7,85 (d, *J* = 9 Hz, 2H), 7,42 (d, *J* = 9 Hz, 2H); IENEM *m/z* 425 (M+H).

#### Ejemplo 20: Preparación de 4-[1-(4-butilfenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-benzonitrilo.

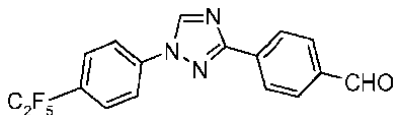


Una solución de 4-*n*-butil fenil hidrazina (1,0 g, 5 mmol) y 4-cianobenzaldehído (0,8 g, 6,0 mmol) en *i*-PrOH (15 ml) se calentó en un baño de vapor durante 2 h y después se enfrió y se diluyó con agua (5 ml). El sólido de color naranja resultante se filtró y se secó al aire para dar la hidrazona (1,30 g) en forma de un sólido de color amarillo, pf



107 °C. Una solución de esta hidrazona (1,1 g, 4,0 mmol) y NCS (0,67 g, 5 mmol) en *i*-PrOH (20 ml) se agitó en nitrógeno a temperatura ambiente durante 2 h, tiempo durante el cual el sólido original se disolvió y se formó un sólido nuevo. La solución de color naranja resultante se trató después con tetrazol (0,45 g, 6,4 mmol) y trietilamina (960 µl, 7,0 mmol). la solución de color naranja pardo se calentó a reflujo durante 2 h. Después, la solución se enfrió, se diluyó con agua (25 ml), se extrajo con EtOAc, se secó, se concentró y se purificó por cromatografía (Biotage, hexano:EtOAc 4:1) para dar el triazol (0,42 g, 35 %) en forma de un sólido de color blanquecino: pf 124 °C; RMN <sup>1</sup>H (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 8,58 (s, 1H), 8,33 (d, *J* = 8 Hz, 2H), 7,78 (d, *J* = 8 Hz, 2H), 7,64 (d, *J* = 8,2 Hz, 2H), 7,33 (d, *J* = 8,2 Hz, 2H), 2,70 (t, *J* = 7,8 Hz, 2H), 1,63 (m, 2H), 1,38 (m, 2H), 0,95 (t, *J* = 7,5 Hz, 3H); IENEM *m/z* 303,1.

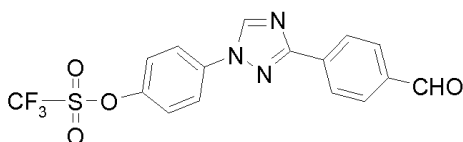
**Ejemplo 21: Preparación de 4-[1-(4-pentafluoroetil-fenil)-1*H*-[1,2,4]triazol-3-il]-benzaldehído.**



Etapa 1. 1-(4-Pentafluoroetil-fenil)-3-*p*-tolil-1*H*-[1,2,4]triazol. Se condensó yoduro de pentafluoroetilo (521 mg, 2,12 mmol) en un vial que contenía 1-bromo-4-yodobenceno (300 mg, 1,06 mmol), polvo de cobre (0) (135 mg, 2,12 mmol) y DMSO (5 ml). Después, el vial se cerró herméticamente y se sometió a irradiación por microondas a 150 °C durante 60 min. La CG-EM demostró el consumo de material de partida produciendo ambos intermedios, 1-bromo-4-pentafluoroetilbenceno y 1-yodo-4-pentafluoroetilbenceno. La mezcla (1,06 mmol) se transfirió a un matraz de fondo redondo de 250 ml y se añadieron 3-*p*-tolil-1*H*-[1,2,4]triazol (169 mg, 1,06 mmol), Cs<sub>2</sub>CO<sub>3</sub> (1,38 g, 4,24 mmol), CuI (202 mg, 1,06 mmol), 8-hidroxiquinolina (2 mg, 0,011 mmol) y DMF/H<sub>2</sub>O (12 ml; solución 10:1). La solución se agitó a reflujo a 160 °C durante 6 h. Tras la finalización, los contenidos enfriados se vertieron en H<sub>2</sub>O y la precipitación se dejó durante 1 h. El precipitado se recogió por filtración al vacío y se secó durante una noche en un horno de vacío a 45 °C. El intermedio 1-(4-pentafluoroetilfenil)-3-*p*-tolil-1*H*-[1,2,4]triazol en bruto se usó en la Etapa 2 sin purificación adicional.

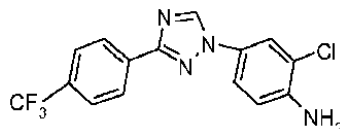
Etapa 2. Oxidación al aldehído. Se combinaron nitrato de amonio cérico (IV) (3,32 g, 4,24 mmol) y el intermedio de la Etapa 1 en un matraz de fondo redondo con acetonitrilo y agua (20 ml; 1:1). La solución se agitó a reflujo a 110 °C durante 4 h, proporcionando una mezcla de los intermedios 3-(4-nitrooximetil-fenil)-1-(4-pentafluoroetil-fenil)-1*H*-[1,2,4]triazol y 4-[1-(4-pentafluoroetil-fenil)-1*H*-[1,2,4]triazol-3-il]-benzaldehído. El acetonitrilo se retiró al vacío y los precipitados intermedios en bruto se recogieron por filtración. Después, el material se combinó con KOH en polvo (178 mg, 3,18 mmol) en dioxano y agua (10 ml; 1:1) y se agitó a reflujo a 105 °C durante 90 min antes de retirar el dioxano al vacío, que permitió la precipitación del intermedio de agua. El intermedio 4-[1-(4-pentafluoroetil-fenil)-1*H*-[1,2,4]triazol-3-il]-benzaldehído se recogió por filtración (35 mg, 0,095 mmol, 9 % en total del 4-tolil triazol).

**Ejemplo 22: Preparación de 4-[3-(4-formil-fenil)-[1,2,4]triazol-1-il]-fenil éster del ácido trifluorometano-sulfónico.**



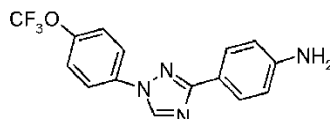
Etapa 1. Se preparó 1-(4-metoxifenil)-3-*p*-tolil-1*H*-[1,2,4]triazol acoplado 3-*p*-tolil-1*H*-[1,2,4]triazol con 4-yodoanisol en las condiciones descritas en la Etapa 1 del ejemplo previo. Después, este material se desmetilizó usando las condiciones descritas en Hitchcock *et al.* Synlett 2006, 2625. Se añadió gota a gota tribromuro de boro (solución 1 M en hexanos; 1,67 ml, 1,67 mmol) a una solución de 1-(4-metoxifenil)-3-*p*-tolil-1*H*-[1,2,4]triazol (300 mg, 1,28 mmol) en CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> (10 ml) a 0 °C en N<sub>2</sub>. Después de completarse la adición, el recipiente se calentó a temperatura ambiente antes de someterse a reflujo a 40 °C durante 6 h. Después, los contenidos enfriados se inactivaron con H<sub>2</sub>O antes de la retirada del CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> y repartirse entre EtOAc y agua. La fase orgánica se recogió, se lavó con salmuera, se secó (MgSO<sub>4</sub>), se concentró y se purificó a través de cromatografía (3:1:1, hexanos:EtOAc:acetona) para proporcionar el intermedio 4-(3-*p*-tolil-[1,2,4]triazol-1-il)-fenol (219 mg, 0,872 mmol, 68 %). Se añadió gota a gota trifluorometanosulfónico anhídrido (0,16 ml, 0,96 mmol) a una solución del fenol y 4-*terc*-butil-2,6-dimetilpiridina (142 mg, 0,872 mmol) en CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> (10 ml) a 0 °C en N<sub>2</sub>. El recipiente se calentó a temperatura ambiente antes de que el disolvente se retirara a presión reducida y el residuo se purificó a través de cromatografía (2:2:1, hexanos:EtOAc:acetona) proporcionando el intermedio 4-(3-*p*-tolil-[1,2,4]triazol-1-il)-fenil éster del ácido trifluorometanosulfónico (304 mg, 0,794 mmol, 91 %).

Etapa 2. La oxidación al intermedio 4-metilo anterior al aldehído correspondiente se llevó a cabo usando nitrato de amonio cérico (IV) en las condiciones descritas en la Etapa 2 del ejemplo previo.

**Ejemplo 39: Preparación de 2-cloro-4-[3-(4-trifluorometilfenil)-[1,2,4]triazol-1-il]-fenilamina.**

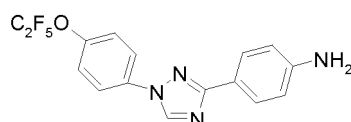
Etapa 1. 1-(3-cloro-4-nitrofenil)-3-(4-trifluorometilfenil)-1*H*-[1,2,4]triazol. Una solución de NBS (180 mg, 1 mmol) en CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> (4 ml) se agitó en nitrógeno a 0 °C mientras se añadía a través de una jeringa sulfuro de dimetilo (110 mg, 1,8 mmol). La solución, que formó un sólido de color blanco, después se enfrió a -20 °C y se añadió *N*-(3-cloro-4-nitrofenil)-*N'*-(4-trifluorometilbencilideno)-hidrazina (200 mg, 0,58 mmol) en CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> (4 ml). La solución se dejó calentar a temperatura ambiente y se agitó durante 2 h más. La solución de color naranja resultante se diluyó después con CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> (25 ml) y se lavó con agua y salmuera antes de secarse y concentrarse. El bromuro de hidrazonilo sólido de color naranja resultante (150 mg) después, se trató directamente con tetrazol (25 mg, 0,35 mmol) y trietilamina (50 µl, 0,35 mmol) en EtOH absoluto (5 ml). La solución de color naranja pardo resultante se calentó a reflujo durante 2 h. La TLC mostró que el bromuro inicial se convirtió primero en dos intermedios de color amarillo, que después desaparecieron y se reemplazaron por un solo punto incoloro. La solución de color naranja se diluyó después con agua (10 ml), produciendo un sólido de color castaño amarillo que se filtró, se filtró al aire y se recrystalizó a partir de tolueno para dar un sólido de color amarillo castaño (60 mg): pf 185 °C RMN <sup>1</sup>H (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 8,60 (s, 1 H), 8,41 (d, *J* = 8,7 Hz, 1H), 8,33 (d, *J* = 7,5 Hz, 2H), 7,90 (d, *J* = 2 Hz, 1H), 7,70 (d, *J* = 7,5 Hz, 2H), 7,65 (dd, *J* = 8,7, 2 Hz, 1H); EIEM *m/z* 368,9. Anal. Calc. para C<sub>15</sub>H<sub>8</sub>ClF<sub>3</sub>N<sub>4</sub>O<sub>2</sub>: C, 48,86; H, 2,19; N, 15,20. Encontrado: C, 48,39; H, 2,61; N, 14,91.

Etapa 2. 2-cloro-4-[3-(4-trifluorometilfenil)-[1,2,4]triazol-1-il]-fenilamina. Una solución del derivado de nitrofenilo (0,75 g, 2,0 mmol) en MeOH (7 ml) y agua (3 ml) se trató con polvo de hierro (0,7 g, 12,5 mmol) y sulfato de amonio ferroso (hexahidrato; 0,7 g, 1,8 mmol). La solución se calentó en un baño de vapor durante 3 h, después del cual la TLC mostró la conversión completa a un producto más polar, fluorescente. La solución se enfrió y se filtró y el filtrado se concentró al vacío. La purificación por cromatografía a través de un lecho corto de gel de sílice (7:2:1 hexano/EtOAc/CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>) dio la amina (0,55 g) en forma de un sólido de color castaño claro: pf 148 °C; RMN <sup>1</sup>H (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 8,40 (s, 1H), 8,31 (d, *J* = 8,4 Hz, 1H), 7,72 (d, *J* = 8,4 Hz, 2H), 7,69 (d, *J* = 2 Hz, 1H), 7,42 (dd, *J* = 8,5, 2 Hz, 1H), 6,9 (d, *J* = 8,4 Hz, 1H); EIEM *m/z* 340,4, 342,3 (M+H). Anal. Calc. para C<sub>15</sub>H<sub>10</sub>ClF<sub>3</sub>N<sub>4</sub>: C, 53,19; H, 2,98; N, 16,83. Encontrado: C, 52,90 H, 3,10; N, 16,83.

**Ejemplo 40: Preparación de 4-[1-(4-trifluorometoxifenil)-1*H*-[1,2,4]triazol-3-il]-fenilamina.**

Etapa 1. 1-(4-Trifluorometoxifenil)-3-(4-nitrofenil)-1*H*-[1,2,4]triazol. Una solución de NBS (0,70 g, 3,9 mmol) en CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> (25 ml) se agitó en nitrógeno a 0 °C mientras que se añadía a través de una jeringa sulfuro de dimetilo (0,40 g, 6,5 mmol). La solución, que formó un sólido de color blanco, después se enfrió a -20 °C, y se añadió *N*-(4-nitrobencilideno)-*N'*-(4-trifluorometoxifenil)-hidrazina (0,70 g, 2,15 mmol) en CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> (10 ml). La solución se dejó calentar a temperatura ambiente y se agitó durante 2 h más. La solución de color naranja resultante se diluyó después con CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> (25 ml) y se lavó con agua y salmuera antes de secarse y concentrarse. El bromuro de hidrazonilo sólido de color naranja resultante (0,9 g) después, se trató directamente con tetrazol (154 mg, 2,2 mmol) y trietilamina (280 µl, 0,23 mmol) en EtOH absoluto (5 ml). La solución de color naranja pardo resultante se calentó a reflujo durante 2 h. La TLC mostró que el bromuro inicial se convirtió primero en dos intermedios de color amarillo, que se reemplazaron por un solo punto incoloro. Después, la solución de color naranja se concentró y se purificó por cromatografía (2:1:2 hexanos/EtOAc/CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>), produciendo el compuesto del título (0,30 g) en forma de un sólido de color amarillo claro: pf 147 °C; RMN <sup>1</sup>H (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 8,68 (s, 1H), 8,40 (d, *J* = 5 Hz, 2H), 8,35 (d, *J* = 5 Hz, 2H), 7,85 (d, *J* = 8 Hz, 2H), 7,42 (d, *J* = 8 Hz, 2H); EIEM *m/z* 350 (M<sup>+</sup>, 100), 299 (57).

Etapa 2. 4-[1-(4-Trifluorometoxifenil)-1*H*-[1,2,4]triazol-3-il]-fenilamina. La reducción catalítica usando un catalizador de Pd/C en EtOH en atmósfera de hidrógeno dio la anilina correspondiente en forma de un sólido de color gris claro: pf 160 °C; RMN <sup>1</sup>H (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 8,50 (s, 1H), 8,00 (d, *J* = 8,4 Hz, 2H), 7,78 (d, *J* = 8,7 Hz, 2H), 7,35 (d, *J* = 8 Hz, 2H), 6,76 (d, *J* = 8,7 Hz, 2H), 3,9 (s a, 2H); EIEM *m/z* 321.

**Ejemplo 41: Preparación de 4-[1-(4-pentafluoroetiloxifenil)-1*H*-[1,2,4]triazol-3-il]-fenilamina.**

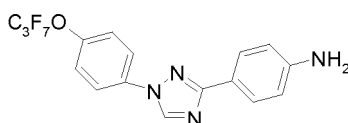
Etapa 1. 1-(4-Pentafluoroetiloxifenil)-3-(4-nitrofenil)-1*H*-[1,2,4]triazol. Una suspensión de 3-(4-nitrofenil)triazol (11,4 g, 60 mmol), 1-yodo-4-pentafluoroetoxibenceno (20 g, 60 mmol), carbonato de cesio (39,0 g, 120 mmol), CuI (3,5 g, 18 mmol), 8-hidroxiquinolina (2,0 g, 13,8 mmol) y DMF-H<sub>2</sub>O 9:1 (155 ml) se calentó a 150 °C durante 5 h y después se enfrió. Los contenidos del matraz de fondo redondo se vertieron en agua (150 ml) y se extrajeron con Et<sub>2</sub>O (2 x 100 ml). La fase orgánica se secó y se concentró y el residuo sólido se recrystalizó a partir de MeOH y agua para dar el nitrotriazol (11,8 g, 49 %) en forma de un sólido de color castaño: pf 170-175 °C; RMN <sup>1</sup>H (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 8,68 (s, 1H), 8,40 (d, *J* = 5 Hz, 2H), 8,35 (d, *J* = 5 Hz, 2H), 7,85 (d, *J* = 8 Hz, 2H), 7,42 (d, *J* = 5,2 Hz, 8 Hz, 2H); EIEM *m/z* 400 (M<sup>+</sup>).

5

10

Etapa 2. 4-[1-(4-Pentafluoroetiloxifenil)-1*H*-[1,2,4]triazol-3-il]-fenilamina. La reducción catalítica usando un catalizador de Pd/C en EtOH en atmósfera de hidrógeno dio la anilina correspondiente en forma de un sólido de color castaño claro: pf 160 °C; RMN <sup>1</sup>H (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 8,55 (s, 1H), 8,00 (d, *J* = 7 Hz, 2H), 7,78 (d, *J* = 8 Hz, 2H), 7,35 (d, *J* = 8 Hz, 2H), 6,78 (d, *J* = 8 Hz, 2H), 3,9 (s a, 2H); EIEM *m/z* 371.

#### Ejemplo 42: Preparación de 4-[1-(4-heptafluoropropiloxifenil)-1*H*-[1,2,4]triazol-3-il]-fenilamina.



15

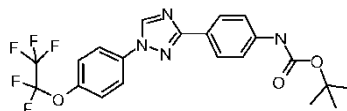
Etapa 1. 1-(4-Heptafluoropropiloxifenil)-3-(4-nitrofenil)-1*H*-[1,2,4]triazol. Una suspensión de 3-(4-nitrofenil) triazol (1,0 g, 5,2 mmol), 1-yodo-4-heptafluoropropiloxibenceno (6,1 g, 15,8 mmol), carbonato de cesio (10,0 g, 30,7 mmol), CuI (900 mg, 4,7 mmol) y 8-hidroxiquinolina (500 mg, 3,4 mmol) en DMF-H<sub>2</sub>O 9:1 (40 ml) se calentó a 150 °C durante 12 h, después se enfrió y los contenidos se vertieron en agua (50 ml) y NH<sub>4</sub>OH concentrado (50 ml). La solución de color azul se extrajo con éter (100 ml) y la fase orgánica se separó y se filtró para retirar algún material insoluble, después se secó y se concentró. El residuo sólido se recrystalizó a partir de MeOH/agua para suministrar el nitrofenil triazol (4,69 g) en forma de un sólido de color castaño claro: pf 114-116 °C; RMN <sup>1</sup>H (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 8,66 (s, 1H), 8,40 (m, 4H), 7,85 (d, *J* = 8 Hz, 2H), 7,42 (d, *J* = 8 Hz, 2H); EIEM *m/z* 450,1 (M<sup>+</sup>).

20

25

Etapa 2. 4-[1-(4-Heptafluoropropiloxifenil)-1*H*-[1,2,4]triazol-3-il]-fenilamina. La reducción catalítica en las condiciones descritas anteriormente dio la anilina correspondiente en forma de un sólido de color castaño claro: pf 181-183 °C; RMN <sup>1</sup>H (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 8,54 (s, 1H), 8,00 (d, *J* = 8 Hz, 2H), 7,80 (d, *J* = 8 Hz, 2H), 7,40 (d, *J* = 8 Hz, 2H), 6,78 (d, *J* = 8 Hz, 2H), 3,9 (s a, 2H); EIEM *m/z* 421,3 (M+1).

#### Ejemplo 56: Preparación de *tert*-butil éster del ácido {4-[1-(4-pentafluoroetiloxifenil)-1*H*-[1,2,4]triazol-3-il]-fenil}-carbámico (Compuesto 1)



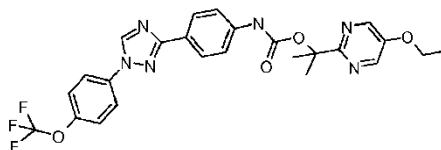
30

Una solución de 4-[1-(4-pentafluoroetiloxifenil)-1*H*-[1,2,4]triazol-3-il]-fenilamina (1,0 g, 2,7 mmol) en THF seco (8 ml) se agitó mientras que se añadía en una porción de cloroformiato de *p*-nitrofenilo (0,60 g, 3 mmol) y la solución se dejó agitar durante 3 h. El sólido resultante se filtró y se secó al aire. Una porción más pequeña del *p*-nitrofenilcarbamato (152 mg, 0,28 mmol) se suspendió en THF seco (3 ml). A esta se le añadió 2-metil-2-propanol (41 mg, 0,32 mmol) en THF seco (1 ml) seguido de NaH (dispersión al 60 % en aceite mineral; 26 mg, 0,67 mmol) en una porción. Se usó más THF seco THF (1 ml) para enjuagar articulaciones, etc. La solución se calentó a 60 °C (externa) durante 1,5 h, punto en el cual la TLC (3:3:3:1 EtOAc/hexanos/CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>/acetona) no mostró material de partida. La mezcla se enfrió y se dejó agitar a 25 °C durante 20 h. La mezcla se enfrió, se vertió en agua enfriada con hielo (50 ml) y se extrajo con EtOAc (3 x 50 ml). Los extractos combinados se lavaron con NaCl ac. sat. (75 ml), se secaron (Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>), se filtraron y se concentraron. La RP-HPLC (gradiente de agua-acetonitrilo en medio libre de ácido) proporcionó el compuesto del título (31 mg, 23 %) en forma de un sólido de color blanquecino: pf 205-209 °C; RMN <sup>1</sup>H (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 8,55 (s, 1H), 8,12 (d, *J* = 9,0 Hz, 2H), 7,80 (d, *J* = 9,3 Hz, 2H), 7,48 (d, *J* = 8,8 Hz, 2H), 7,38 (d, *J* = 9,0 Hz, 2H), 6,58 (s, 1H), 1,54 (s, 9H); IENEM *m/z* 471 (M+H), 469 (M-H).

35

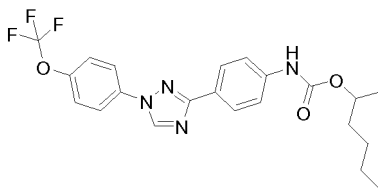
40

El Compuesto 2 en la Tabla 1 se sintetizó como en el Ejemplo 56.

**Ejemplo 57: Preparación de 1-(5-etoxi-pirimidin-2-il)-1-metil-etil éster del ácido {4-[1-(4-trifluorometoxifenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-fenil}-carbámico (Compuesto 3)**

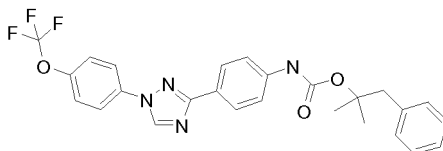
Se recogió 4-[1-(4-trifluorometoxifenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-benzoil azida (204 mg, 0,55 mmol) en tolueno seco (2 ml) y la mezcla se calentó a 110 °C y se agitó a esa temperatura durante 1,5 h. Se observó desprendimiento de gas durante el calentamiento. La mezcla se enfrió y después se añadieron el alcohol (106 mg, 0,59 mmol) y NaH (dispersión al 60 % en aceite mineral; 76 mg, 1,9 mmol). La mezcla se agitó a 25 °C durante 18 h. La mezcla se vertió en H<sub>2</sub>O (50 ml) y se extrajo con EtOAc (3 x 50 ml). Los extractos orgánicos combinados se secaron sobre Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>, se filtraron y se concentraron para dar un residuo de color castaño claro. La cromatografía en columna sobre gel de sílice (3:3:3:1 ciclohexano:EtOAc:CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>:acetona) dio el compuesto del título (97 mg, 34 %) en forma de un sólido de color castaño claro: pf 168-171 °C; RMN <sup>1</sup>H (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 8,52 (s, 1H), 8,37 (s, 2H), 8,08 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,77 (d, J = 8,9 Hz, 2H), 7,42 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,36 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 6,91 (s, 1H), 4,12 (q, J = 7,0 Hz, 2H), 1,87 (s, 6H), 1,44 (t, J = 6,9 Hz, 3H); IENEM *m/z* 529 (M+H), 527 (M-H); HRMS-IEN (*m/z*): [M]<sup>+</sup> calc. para C<sub>25</sub>H<sub>23</sub>F<sub>3</sub>N<sub>6</sub>O<sub>4</sub>, 528,1727; encontrado, 528,1730.

Los compuestos 4-8 en la Tabla 1 se sintetizaron como en el Ejemplo 57.

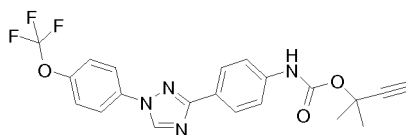
**Ejemplo 58: Preparación de 1-metil-pentil éster del ácido {4-[1-(4-trifluorometoxifenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-fenil}-carbámico (Compuesto 9)**

Se suspendió 4-[1-(4-trifluorometoxifenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-benzoil azida (131 mg, 0,350 mmol) en tolueno seco (1,0 ml). A la suspensión resultante se le añadió 2-hexanol (221 µl, 1,75 mmol) en una porción. La suspensión de color blanquecino se calentó después a 100 °C (externa). Una vez que el análisis por UPLC indicó el consumo completó del material de partida, la solución de color amarillo transparente se enfrió a 23 °C y se concentró. La cromatografía de gel de sílice (Biotage 10 g columna SNAP, eluyó con un gradiente de EtOAc del 20 % al 40 % al 75 %/hexanos) proporcionó el compuesto del título (134 mg, 85 %) en forma de un sólido de color blanco: pf 111-113 °C; RMN <sup>1</sup>H (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 8,54 (s, 1H), 8,13 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,51 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,37 (dd, J = 9,0, 0,8 Hz, 2H), 6,76 (s, 1H), 5,00-4,83 (m, 1H), 1,76-1,44 (m, 2H), 1,44-1,31 (m, 4H), 1,29 (d, J = 6,3 Hz, 3H), 0,91 (t, J = 7,0 Hz, 3H); IENEM *m/z* 449 (M+H), 447 (M-H); HRMS-IEN (*m/z*): [M]<sup>+</sup> calc. para C<sub>22</sub>H<sub>23</sub>F<sub>3</sub>N<sub>4</sub>O<sub>3</sub>, 448,172; encontrado, 448,173.

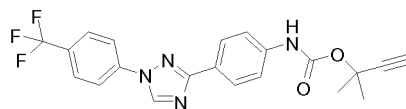
El Compuesto 10 en la Tabla 1 se sintetizó como en el Ejemplo 58.

**Ejemplo 59: Preparación de 1,1-dimetil-2-fenil-etil éster del ácido {4-[1-(4-trifluorometoxifenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-fenil}-carbámico (Compuesto 11)**

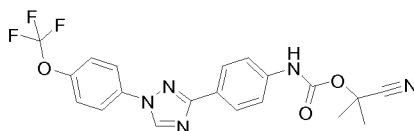
Se suspendió 4-[1-(4-trifluorometoxifenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-benzoil azida (93 mg, 0,248 mmol) en tolueno seco (0,71 ml). A la suspensión resultante se le añadió 2-metil-1-fenil-2-propanol (191 µl, 1,24 mmol) en una porción. La suspensión de color blanquecino se calentó después a 100 °C (externa). Una vez que el análisis por UPLC indicó el consumo completo del material de partida, la suspensión de color amarillo se enfrió a 23 °C, se filtró a través de una fritada de porosidad media y se concentró. La cromatografía sobre gel de sílice (Biotage 10 g columna SNAP, eluyó con un gradiente de EtOAc del 10 % al 40 % al 75 %/hexanos) proporcionó el compuesto del título (71 mg, 58 %) en forma de un sólido de color blanco: pf 153-155 °C; RMN <sup>1</sup>H (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 8,54 (s, 1H), 8,14 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,79 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,50 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 7,38 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 7,34-7,17 (m, 5H), 6,61 (s, 1H), 3,19 (s, 2H), 1,53 (s, 6H); IENEM *m/z* 497 (M+H), 495 (M-H); HRMS-IEN (*m/z*): [M]<sup>+</sup> calc. para C<sub>26</sub>H<sub>23</sub>F<sub>3</sub>N<sub>4</sub>O<sub>3</sub>, 496,172; encontrado, 496,172.

**Ejemplo 60: Preparación de 1,1-dimetil-prop-2-ynil éster del ácido {4-[1-(4-trifluorometoxifenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-fenil]-carbámico (Compuesto 12)**

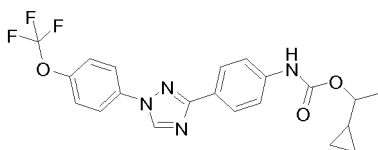
5 Se añadió 2-metil-3-butin-2-ol (48  $\mu$ l, 0,44 mmol) a una solución de trifosgeno (42 mg, 0,14 mmol) y piridina (38  $\mu$ l, 0,47 mmol) en  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$  (1,0 ml) a 23  $^\circ\text{C}$ . Se observó desprendimiento de gas durante la adición del y se observó un precipitado para formar. La suspensión resultante se agitó a 23  $^\circ\text{C}$  durante 1 h. La agitación cesó, el sólido se dejó sedimentar en un matraz de fondo redondo y el sobrenadante se añadió a través de una cánula a una suspensión de 4-[1-(4-trifluorometoxifenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-fenilamina (100 mg, 0,312 mmol) y piridina (38  $\mu$ l, 0,47 mmol) en  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$  (1,0 ml) a 23  $^\circ\text{C}$ . Se observó un precipitado espeso para formar. En este punto, el análisis TLC indicó que quedaba algunos materiales de partida, por lo que una cantidad equivalente de trifosgeno/piridina/alcohol se combinó como anteriormente y el sobrenadante resultante se añadió de nuevo a la mezcla de anilina. Después de agitarse durante otras 3 h a 23  $^\circ\text{C}$ , la mezcla de reacción se diluyó con EtOAc al 30 %/hexanos (10 ml) y se filtró un precipitado fino de color blanco en una frita gruesa. El filtrado de color amarillo transparente se concentró y el aceite de color amarillo resultante se purificó por cromatografía sobre gel de sílice (Biotage 10 g columna SNAP, eluyó con un gradiente de EtOAc del 10 % al 25 % al 50 %/hexanos) para proporcionar el compuesto del título (55 mg, 41 %) en forma de un sólido de color blanco: pf 164-165  $^\circ\text{C}$ ; RMN  $^1\text{H}$  (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  8,54 (s, 1H), 8,13 (d,  $J$  = 8,7 Hz, 2H), 7,79 (d,  $J$  = 9,0 Hz, 2H), 7,53 (d,  $J$  = 8,5 Hz, 2H), 7,38 (d,  $J$  = 8,8 Hz, 2H), 6,73 (s, 1H), 2,61 (s, 1H), 1,77 (s, 6H); IENEM  $m/z$  431 (M+H); HRMS-IEN ( $m/z$ ):  $[\text{M}]^+$  calc. para  $\text{C}_{21}\text{H}_{17}\text{F}_3\text{N}_4\text{O}_3$ , 430,125; encontrado, 430,126.

**Ejemplo 61: Preparación de 1,1-dimetil-prop-2-ynil éster del ácido {4-[1-(4-trifluorometilfenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-fenil]-carbámico (Compuesto 13)**

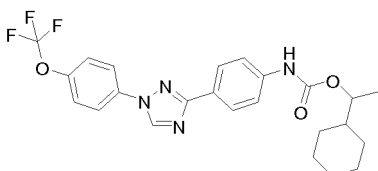
25 Se suspendió 4-[1-(4-trifluorometilfenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-benzoil azida (137 mg, 0,383 mmol) en tolueno seco (1,5 ml). A la suspensión resultante se le añadió 2-metil-3-butin-2-ol (187  $\mu$ l, 1,91 mmol) seguido de  $\text{Et}_3\text{N}$  (264  $\mu$ l, 1,91 mmol). La suspensión de color blanquecino se calentó después a 100  $^\circ\text{C}$  (externa). Una vez que el análisis por UPLC indicó el consumo completo del material de partida, la suspensión de color amarillo se enfrió a 23  $^\circ\text{C}$  y se vertió en EtOAc al 50 %/hexanos. La suspensión de color blanquecino se filtró después a través de una frita de porosidad media y se concentró. La cromatografía sobre gel de sílice (Biotage 10 g columna SNAP, eluyó con un gradiente de EtOAc del 10 % al 40 % al 75 %/hexanos) proporcionó el compuesto del título (20 mg, 13 %) en forma de un sólido de color blanco: pf 187-189  $^\circ\text{C}$ ; RMN  $^1\text{H}$  (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  8,64 (s, 1H), 8,14 (d,  $J$  = 8,7 Hz, 2H), 7,90 (d,  $J$  = 8,4 Hz, 2H), 7,79 (d,  $J$  = 8,6 Hz, 2H), 7,53 (d,  $J$  = 8,6 Hz, 2H), 6,76 (s, 1H), 2,61 (s, 1H), 1,77 (s, 6H); IENEM  $m/z$  415 (M+H), 413 (M-H); HRMS-IEN ( $m/z$ ):  $[\text{M}]^+$  calc. para  $\text{C}_{21}\text{H}_{17}\text{F}_3\text{N}_4\text{O}_2$ , 414,130; encontrado, 414,131.

**Ejemplo 62: Preparación de ciano-dimetil-metil éster del ácido {4-[1-(4-trifluorometoxifenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-fenil]-carbámico (Compuesto 14)**

35 se suspendió 4-[1-(4-trifluorometoxifenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-benzoil azida (107 mg, 0,286 mmol) en tolueno seco (1,0 ml). A la suspensión resultante se le añadió 2-ciano-2-propanol (78  $\mu$ l, 0,858 mmol). La suspensión de color blanquecino se calentó después a 90  $^\circ\text{C}$  (externa). Después de 10 s a esta temperatura, la suspensión se volvió homogénea y se observó desprendimiento de gas vigoroso. Después de 10 min a esta temperatura, se observó un precipitado para formar. Una vez que el análisis por UPLC indicó el consumo completo del material de partida, la suspensión de color amarillo se enfrió a 23  $^\circ\text{C}$  y se vertió en hexanos. La suspensión de color blanquecino se filtró después a través de una frita de porosidad media y se concentró. La cromatografía sobre gel de sílice (Biotage 10 g columna SNAP, eluyó con un gradiente de EtOAc del 20 % al 40 % al 75 %/hexanos) proporcionó el compuesto del título (7 mg, 6 %) en forma de un sólido de color amarillo claro: pf 172-175  $^\circ\text{C}$ ; RMN  $^1\text{H}$  (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  8,55 (s, 1H), 8,16 (d,  $J$  = 8,6 Hz, 2H), 7,79 (d,  $J$  = 9,0 Hz, 2H), 7,52 (d,  $J$  = 8,4 Hz, 2H), 7,38 (d,  $J$  = 8,7 Hz, 2H), 6,79 (s, 1H), 1,84 (s, 6H); IENEM  $m/z$  432 (M+H), 430 (M-H).

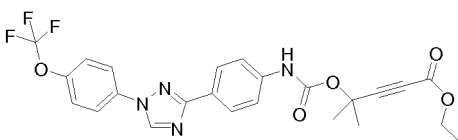
**Ejemplo 63: Preparación de 1-ciclopropil-etil éster del ácido 4-[1-(4-trifluorometoxifenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-fenil]-carbámico (Compuesto 15)**

5 Se suspendió 4-[1-(4-trifluorometoxifenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-benzoil azida (84 mg, 0,225 mmol) en tolueno seco (0,65 ml). A la suspensión resultante se le añadió 1-ciclopropiletil alcohol (109  $\mu$ l, 1,12 mmol). La suspensión de color blanquecino se calentó después a 90 °C (externa). Después de 10 s a esta temperatura, la suspensión se volvió homogénea y se observó desprendimiento de gas vigoroso. Después de 1 h, la solución de color amarillo ligeramente turbia se enfrió a 23 °C y se concentró. La cromatografía sobre gel de sílice (Biotage 10 g columna SNAP, eluyó con un gradiente de EtOAc del 10 % al 25 % al 50 %/hexanos) proporcionó el material de partida recuperado (20 mg, 24 %) en forma de un sólido de color blanco junto con el compuesto del título (67 mg, 69 %) en forma de un sólido de color blanco: pf 123-124 °C; RMN <sup>1</sup>H (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  8,54 (s, 1H), 8,13 (d, *J* = 8,7 Hz, 2H), 7,78 (d, *J* = 9,0 Hz, 2H), 7,51 (d, *J* = 8,6 Hz, 2H), 7,37 (d, *J* = 8,6 Hz, 2H), 6,85 (s, 1H), 4,34 (dc, *J* = 12,7, 6,3 Hz, 1H), 1,38 (d, *J* = 6,3 Hz, 3H), 1,14-0,95 (m, 1H), 0,67-0,42 (m, 3H), 0,29 (ddd, *J* = 7,6, 6,5, 3,8 Hz, 1H); IENEM *m/z* 433 (M+H), 431 (M-H).

**15 Ejemplo 64: Preparación de 1-ciclohexil-etil éster del ácido 4-[1-(4-trifluorometoxifenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-fenil]-carbámico (Compuesto 16)**

20 Se suspendió 4-[1-(4-trifluorometoxifenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-benzoil azida (90 mg, 0,241 mmol) en tolueno seco (0,70 ml). A la suspensión resultante se le añadió (1-ciclohexil)etil alcohol (166  $\mu$ l, 1,20 mmol). La suspensión de color blanquecino se calentó después a 90 °C (externa). Después de 10 s a esta temperatura, la suspensión se volvió homogénea y se observó desprendimiento de gas vigoroso. Después de otros 10 min a esta temperatura, se observó una pequeña cantidad de precipitado para formar. Una vez que el análisis por UPLC indicó el consumo completo del material de partida, la suspensión de color amarillo se enfrió a 23 °C y se vertió en EtOAc al 25 %/hexanos. La suspensión de color blanquecino se filtró después a través de una frita de porosidad media y se concentró. La cromatografía sobre gel de sílice (Biotage 10 g columna SNAP, eluyó con un gradiente de EtOAc del 15 % al 30 % al 50 %/hexanos) proporcionó el compuesto del título (98 mg, 86 %) en forma de un sólido de color blanco: pf 146-148 °C; RMN <sup>1</sup>H (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  8,54 (s, 1H), 8,13 (d, *J* = 8,7 Hz, 2H), 7,78 (d, *J* = 9,0 Hz, 2H), 7,52 (d, *J* = 8,5 Hz, 2H), 7,36 (d, *J* = 8,4 Hz, 2H), 6,89 (s, 1H), 4,76 (p, *J* = 6,3 Hz, 1H), 2,13-1,61 (m, 4H), 1,49 (tdd, *J* = 11,8, 6,1, 3,1 Hz, 1H), 1,24 (d, *J* = 6,4 Hz, 3H), 1,22-0,96 (m, 6H); IENEM *m/z* 475 (M+H), 473 (M-H).

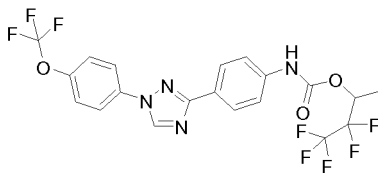
30 Los compuestos 17-22 en la Tabla 1 se sintetizaron como en el Ejemplo 64.

**Ejemplo 65: Preparación de éster etílico del ácido 4-metil-4-[4-[1-(4-trifluorometoxifenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-fenil]carbamoiloxi}-pent-2-inoico (Compuesto 23)**

35 Se disolvió 1,1-dimetil-prop-2-inoil éster del ácido 4-[1-(4-trifluorometilfenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-fenil]-carbámico (Compuesto 13; 11981077; 88 mg, 0,20 mmol) en THF seco (2,0 ml) y se enfrió a -78 °C. Después, se añadió gota a gota *n*-BuLi (164  $\mu$ l de una solución 2,5 M en hexanos, 0,410 mmol). La mezcla se agitó durante 20 min más a -78 °C y después se añadió en una porción cloroformiato de etilo (24  $\mu$ l, 0,25 mmol). La mezcla se agitó durante 30 min más a -78 °C y después se calentó a 23 °C. La mezcla se inactivó con NH<sub>4</sub>Cl acuoso semisaturado y se extrajo con EtOAc al 50 %/hexanos. Las fases orgánicas combinadas se lavaron después con salmuera, se secaron sobre Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> y se concentraron. La cromatografía sobre gel de sílice (Biotage 10 g columna SNAP, eluyó con un gradiente de EtOAc del 15 % al 30 % al 50 % al 75 %/hexanos) seguida de recristalización a partir de Et<sub>2</sub>O/hexanos proporcionó el compuesto del título (10 mg, 10 %) en forma de un sólido de color amarillo: pf 183-188 °C; RMN <sup>1</sup>H

(300 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 8,57 (s, 1H), 8,27 (d, *J* = 8,7 Hz, 2H), 7,80 (d, *J* = 9,1 Hz, 2H), 7,40 (app d, *J* = 8,7 Hz, 4H), 4,99 (s, 1H), 3,66 (q, *J* = 7,1 Hz, 2H), 1,70 (s, 6H), 0,98 (t, *J* = 7,1 Hz, 3H); IENEM *m/z* 503 (M+H).

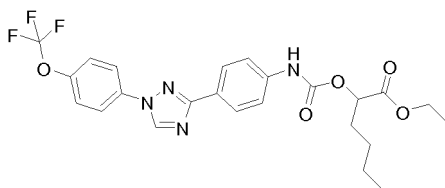
**Ejemplo 66: Preparación de 2,2,3,3,3-pentafluoro-1-metil-propil éster del ácido {4-[1-(4-trifluorometoxifenil)-1*H*-[1,2,4]triazol-3-il]-fenil}-carbámico (Compuesto 24)**



5 Se suspendió 4-[1-(4-trifluorometoxifenil)-1*H*-[1,2,4]triazol-3-il]-benzoil azida (77 mg, 0,206 mmol) en tolueno seco (0,60 ml). A la suspensión resultante se le añadió 3,3,4,4,4-pentafluoro-2-butanol (120 µl, 1,03 mmol). La suspensión de color blanquecino se calentó después a 90 °C (externa). Después de 10 s a esta temperatura, la suspensión se volvió homogénea y se observó desprendimiento de gas vigoroso. Después de otros 10 min a esta temperatura, se observó una pequeña cantidad de precipitado para formar. Una vez que el análisis por UPLC indicó el consumo completo del material de partida, la suspensión de color amarillo se enfrió a 23 °C y se vertió en EtOAc al 25 %/hexanos. La suspensión de color blanquecino se filtró a través de una frita de porosidad media y se concentró para proporcionar el compuesto del título (80 mg, 76 %) en forma de un sólido de color blanquecino: pf 171-173 °C; RMN <sup>1</sup>H (400 MHz, DMSO-*d*<sub>6</sub>) δ 10,33 (s, 1H), 9,38 (s, 1H), 8,10-7,99 (m, 4H), 7,67-7,58 (m, 4H), 5,81-5,23 (m, 1H), 1,47 (d, *J* = 6,3 Hz, 3H); IENEM *m/z* 511 (M+H), 509 (M-H); HRMS-IEN (*m/z*): [M]<sup>+</sup> calc. para C<sub>20</sub>H<sub>14</sub>F<sub>8</sub>N<sub>4</sub>O<sub>3</sub>, 510,0933; encontrado 510,0998.

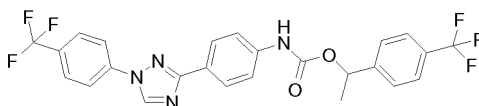
El Compuesto 25 en la Tabla 1 se sintetizó como en el Ejemplo 66.

**Ejemplo 67: Preparación de éster etílico del ácido 2-{4-[1-(4-trifluorometoxifenil)-1*H*-[1,2,4]triazol-3-il]-fenilcarbamoiloxi}-hexanoico (Compuesto 26)**



20 Se suspendió 4-[1-(4-trifluorometoxifenil)-1*H*-[1,2,4]triazol-3-il]-benzoil azida (90 mg, 0,241 mmol) en tolueno seco (0,70 ml). La suspensión de color blanquecino se calentó después a 90 °C (externa) y se agitó durante 30 min. Después de 10 s a esta temperatura, la suspensión se volvió homogénea y se observó desprendimiento de gas vigoroso. La solución de color amarillo ligeramente turbia se enfrió a 23 °C y se añadió 2-hidroxicaproato de etilo (52 µl, 1,20 mmol). La mezcla se agitó a 23 °C durante 15 h más y después, se vertió en EtOAc al 25 %/hexanos. La suspensión de color blanquecino se filtró a través de una frita de porosidad media y se concentró. La cromatografía sobre gel de sílice (Biotage 10 g columna SNAP, eluyó con un gradiente de EtOAc del 15 % al 30 % al 50 al 75 %/hexanos) proporcionó el compuesto del título (10 mg, 8 %) en forma de un sólido de color blanco: pf 135-139 °C; RMN <sup>1</sup>H (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 8,55 (s, 1H), 8,14 (d, *J* = 8,7 Hz, 2H), 7,79 (d, *J* = 9,0 Hz, 2H), 7,51 (d, *J* = 8,8 Hz, 2H), 7,38 (dd, *J* = 9,0, 0,8 Hz, 2H), 6,97 (s, 1H), 5,08 (dd, *J* = 7,2, 5,4 Hz, 1H), 4,25 (q, *J* = 7,1 Hz, 2H), 1,95-1,80 (m, 2H), 1,52-1,34 (m, 4H), 1,30 (t, *J* = 7,1 Hz, 3H), 0,93 (t, *J* = 7,2 Hz, 3H); IENEM 507 (M+H), 505 (M-H).

**Ejemplo 68: Preparación de 4-(1-(4-(trifluorometil)fenil)-1*H*-1,2,4-triazol-3-il)-fenilcarbamoato de 1-(4-(trifluorometil)fenil)etil (Compuesto 27)**



35 Se suspendió 4-(1-(4-(trifluorometil)fenil)-1*H*-1,2,4-triazol-3-il)benzoil azida (62,5 mg, 0,174 mmol) en tolueno seco (0,498 ml). A la suspensión resultante se le añadió 1-(4-(trifluorometil)fenil)etil alcohol (36,5 mg, 0,192 mmol). La suspensión de color blanquecino se calentó a 100 °C (externa) durante 18 h y se enfrió a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se aplicó directamente a una columna sobre gel de sílice y la elución con un gradiente de EtOAc del 10 % al 50 % al 100 %/hexanos proporcionó el compuesto del título (57,6 mg, 63 %) en forma de un sólido de color blanco: pf 155,5-158,5 °C; RMN <sup>1</sup>H (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 8,62 (s, 1H), 8,15 (d, *J* = 8,8 Hz, 2H), 7,90 (d, *J* = 8,5 Hz, 2H), 7,79 (d, *J* = 8,5 Hz, 2H), 7,64 (d, *J* = 8,2 Hz, 2H), 7,51 (app t, *J* = 8,4 Hz, 4H), 6,79 (s, 1H), 5,95 (q, *J* = 6,6 Hz, 1H), 1,63 (d, *J* = 6,7 Hz, 3H); IENEM 521 (M+H), 519 (M-H).

**Ejemplo 69: Preparación de Carbamatos - Método General A**

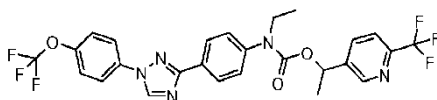
La azida de acilo se suspendió en tolueno seco (0,35 M). A la suspensión resultante se le añadió el alcohol apropiado (1,20 equiv.). La suspensión se calentó a 100 °C (externa) durante 4-24 h y después se enfrió a temperatura ambiente. El producto se aisló por filtración al vacío o se purificó por cromatografía en columna sobre gel de sílice (después de aplicarse el material directamente a la columna) que eluyó con un gradiente de EtOAc/hexanos. En algunos casos, fue necesaria la purificación adicional mediante recristalización. Los disolventes típicos usado incluyen: cloroformo-*d*, mezclas de éter dietílico/hexanos y éster dietílico/diclorometano/hexanos.

Los compuestos 28-121 en la Tabla 1 se sintetizaron como en el Ejemplo 69.

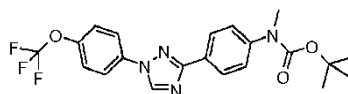
**Ejemplo 70: Preparación de Carbamatos - Método General B**

La azida de acilo se suspendió en tolueno seco (0,35 M). A la suspensión resultante se le añadió el alcohol apropiado (1,20 equiv.). La suspensión se calentó a 100 °C (externa) durante 4-24 h y después se enfrió a temperatura ambiente. Se añadió trietilamina (1,50 equiv.) y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante una 1 h más. El producto se aisló por filtración al vacío o se purificó por cromatografía en columna sobre gel de sílice (después de aplicarse el material directamente a la columna) que eluyó con un gradiente de EtOAc/hexanos.

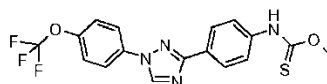
Los compuestos 122-129 se sintetizaron como en el Ejemplo 70.

**Ejemplo 71: Preparación de etil(4-(1-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1*H*-1,2,4-triazol-3-il)fenil)carbamato de 1-(6-(trifluorometil)piridin-3-il)etilo (Compuesto 130)**

Se disolvió 4-(1-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1*H*-1,2,4-triazol-3-il)fenilcarbamato de 1-(6-(trifluorometil)piridin-3-il)etilo (54 mg, 0,10 mmol) en DMF anhidra (0,5 ml) en N<sub>2</sub> y se enfrió a 0 °C. Se añadió NaH (suspensión al 60 % en aceite mineral; 4,4 mg, 0,11 mmol) y la mezcla se agitó durante 10 min a 0 °C. Se añadió yodoetano (9 µl, 0,11 mmol) y la mezcla se calentó a temperatura ambiente y se agitó durante 1 h. Se añadieron más NaH (4 mg) y yodoetano (5 µl) a temperatura ambiente para promover el consumo completo del material de partida. La mezcla se inactivó con NH<sub>4</sub>Cl acuoso y se extrajo con EtOAc al 80 %/hexanos (x3). Las fases orgánicas combinadas se lavaron con salmuera, se secaron sobre Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> y se concentraron. EL producto en bruto se aplicó a una columna sobre gel de sílice y la elución con un gradiente de EtOAc del 15 % al 40 % al 80 %/hexanos proporcionó el compuesto del título (52,1 mg, 91 %) en forma de un aceite amarillo de color claro: IR 3111, 2983, 2936, 1707, 1519, 1340, 1268, 1155 cm<sup>-1</sup>; RMN <sup>1</sup>H (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 8,62 (s, *J* = 10,6 Hz, 1H), 8,58 (s, 1H), 8,21 (d, *J* = 8,5 Hz, 2H), 7,81 (d, *J* = 9,0 Hz, 2H), 7,73-7,58 (m, 2H), 7,40 (d, *J* = 8,5 Hz, 2H), 7,30 (d, *J* = 8,5 Hz, 2H), 5,95 (q, *J* = 6,6 Hz, 1H), 3,84 - 3,70 (m, 2H), 1,53 (d, *J* = 6,2 Hz, 3H), 1,19 (t, *J* = 7,1 Hz, 3H); HRMS-FAB (*m/z*) [M+H]<sup>+</sup> calc. para C<sub>26</sub>H<sub>21</sub>F<sub>6</sub>N<sub>5</sub>O<sub>3</sub>, 565,1549; encontrado, 565,1568.

**Ejemplo 72: Preparación de metil(4-(1-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1*H*-1,2,4-triazol-3-il)fenil)carbamato de *tert*-butilo (Compuesto 131)**

Se disolvió 4-(1-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1*H*-1,2,4-triazol-3-il)fenilcarbamato de *tert*-butilo (120 mg, 0,286 mmol) en DMF anhidra (2,0 ml) en N<sub>2</sub> y se enfrió a 0 °C. Se añadió NaH (suspensión al 60 % en aceite mineral; 15 mg, 0,372 mmol) y la mezcla se agitó durante 10 min a 0 °C. Se añadió yodometano (23 µl, 0,372 mmol) y la mezcla se calentó a temperatura ambiente y se agitó durante 1 h. La mezcla se inactivó con NH<sub>4</sub>Cl acuoso y se extrajo con EtOAc al 80 %/hexanos (x3). Las fases orgánicas combinadas se lavaron con salmuera, se secaron sobre Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> y se concentraron. El producto en bruto se aplicó a una columna sobre gel de sílice y la elución con un gradiente de EtOAc del 15 % al 40 % al 80 %/hexanos proporcionó el compuesto del título (108,0 mg, 87 %) en forma de un sólido de color blanco: pf 125-128 °C; RMN <sup>1</sup>H (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 8,55 (s, 1H), 8,14 (d, *J* = 8,6 Hz, 2H), 7,79 (d, *J* = 8,9 Hz, 2H), 7,38 (d, *J* = 9,8 Hz, 2H), 7,35 (d, *J* = 8,8 Hz, 2H), 3,31 (s, 3H), 1,47 (s, 9H); HRMS-FAB (*m/z*) [M+H]<sup>+</sup> calc. para C<sub>21</sub>H<sub>21</sub>F<sub>3</sub>N<sub>4</sub>O<sub>3</sub>, 434,156; encontrado, 434,157.

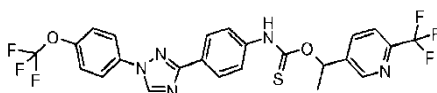
**Ejemplo 73: Preparación de 4-(1-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1*H*-1,2,4-triazol-3-il)fenilcarbamoato de *O*-metilo (Compuesto 132)**



Etapa 1. Se disolvió 4-(1-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1*H*-1,2,4-triazol-3-il)anilina en THF (2,5 ml) para dar una solución de color castaño. Después, se añadió clorotioformiato de fenilo (0,205 mg, 1,19 mmol). Un sólido precipitó inmediatamente y la agitación se volvió difícil. Se añadió más THF (2,5 ml) para facilitar la agitación. Se añadió una porción más de clorotioformiato de fenilo (0,205 mg, 1,19 mmol) seguido de trietilamina (0,38 ml, 2,80 mmol). La reacción se detuvo con NaHCO<sub>3</sub> ac. sat. y se extrajo con EtOAc al 50 %/hexanos. La fase orgánica se lavó con una solución NaHCO<sub>3</sub> ac. y salmuera, se secó sobre Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> y se concentró. La purificación a través de cromatografía sobre gel de sílice (gradiente de EtOAc del 15 % al 30 % al 50 % al 80 %/hexanos) proporcionó *N,N*-bis(tionofenoxi)-4-(1-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1*H*-1,2,4-triazol-3-il)anilina (0,472 g, 80 %) en forma de un sólido de color amarillo: pf 142-144 °C; RMN <sup>1</sup>H (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 8,58 (s, 1H), 8,34 (d, *J* = 8,6 Hz, 2H), 7,80 (d, *J* = 9,0 Hz, 2H), 7,66 (d, *J* = 8,6 Hz, 2H), 7,49-7,34 (m, 6H), 7,34-7,28 (m, 2H), 7,26 - 7,13 (m, 4H); HRMS-FAB (*m/z*) [M+H]<sup>+</sup> calc. para C<sub>29</sub>H<sub>19</sub>F<sub>3</sub>N<sub>4</sub>O<sub>3</sub>S<sub>2</sub>, 592,085; encontrado, 592,0861.

Etapa 2. A una solución del producto de la Etapa 1 en MeOH (2,5 ml) y THF (2,5 ml) se le añadió NaOH (2,5 ml de una solución ac. 1 M). Se formó inmediatamente un precipitado espeso de color amarillo. Se añadieron más THF, MeOH y NaOH 1 M (2,5 ml de cada uno) y se obtuvo una solución de color amarillo transparente. Después la mezcla se vertió en NaHCO<sub>3</sub> ac. y se extrajo con EtOAc al 50 %/hexanos (x3). Las fases orgánicas combinadas se lavaron con salmuera, se secaron sobre Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> y se concentraron para dar un sólido de color amarillo. El sólido se trituró con EtOAc al 20 %/hexanos para dar el compuesto del título (137 mg, 51 %) en forma de un sólido de color blanco. El filtrado se concentró y se purificó por cromatografía sobre gel de sílice (que eluyó con un gradiente de EtOAc del 15 % al 40 % al 80 %/hexanos) para proporcionar más producto (57,6 mg, 0,126 mmol, 22 %): pf 192-194 °C; RMN <sup>1</sup>H (300 MHz, DMSO-*d*<sub>6</sub>) δ 11,32 (s, 1H), 9,39 (s, 1H), 8,14-7,95 (m, 4H), 7,90-7,65 (a, 1H), 7,62 (app dd, *J* = 9,0, 0,7 Hz, 2H), 7,60-7,40 (a, 1H), 4,01 (s a, 3H); HRMS-FAB (*m/z*) [M+H]<sup>+</sup> calc. para C<sub>17</sub>H<sub>13</sub>F<sub>3</sub>N<sub>4</sub>O<sub>2</sub>S, 394,071; encontrado, 394,0712.

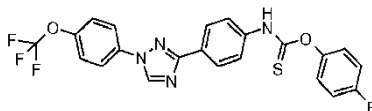
**Ejemplo 74: Preparación de 4-(1-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1*H*-1,2,4-triazol-3-il)fenilcarbamoato de O-1-(6-(trifluorometil)piridin-3-il)etilol (Compuesto 133)**



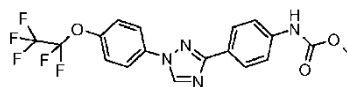
En una atmósfera de N<sub>2</sub>, se añadió gota a gota tiosfogeno (0,56 mmol) a diclorometano frío, enfriado en un baño con hielo. A esta solución se le añadió una solución 0,2 mM de K<sub>2</sub>CO<sub>3</sub> (0,13 mmol) fría. La reacción se agitó durante 10 min. Se disolvió 4-(1-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1*H*-1,2,4-triazol-3-il)anilina (0,56 mmol) en diclorometano y se añadió gota a gota a la mezcla anterior. La reacción se dejó agitar durante 10 min más. Después, se añadió una solución 0,6 mM de KOH (0,92 mmol) fría. Después de 30 min, la mezcla de reacción se diluyó con diclorometano y se lavó con agua y salmuera. La fase orgánica se secó sobre MgSO<sub>4</sub> y se concentró. El isotiocianato en bruto se usó sin purificación adicional en la siguiente etapa.

A una suspensión de NaH (9,2 mg de una suspensión al 60 % en aceite mineral, 0,229 mmol) en THF (1 ml) a 0 °C se le añadió 1-(6-(trifluorometil)piridin-3-il)etanol (43,7 mg, 0,229 mmol) en PhCH<sub>3</sub> (0,4 ml). La mezcla se calentó a temperatura ambiente y se agitó durante 15 min y después se añadió a través de una cánula el isotiocianato del anterior (75,6 mg, 0,209 mmol) en THF (1 ml). Después de agitar durante 20 min, la mezcla se inactivó por adición de una solución ac. de NH<sub>4</sub>Cl y se extrajo con EtOAc (x3). Los extractos orgánicos combinados se lavaron con salmuera, se secaron sobre Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> y se concentraron. EL producto en bruto se aplicó a una columna sobre gel de sílice y la elución con un gradiente de EtOAc del 15 % al 40 % al 65 %/hexanos proporcionó el compuesto del título (88,2 mg, 77 %) en forma de un sólido de color blanquecino: pf 186,5-188 °C; RMN <sup>1</sup>H (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 8,76 (s, 1H), 8,58 (s, 1H), 8,50 (s, 1H), 8,19 (d, *J* = 8,7 Hz, 2H), 7,91-7,83 (m, 1H), 7,80 (d, *J* = 9,1 Hz, 2H), 7,69 (d, *J* = 8,1 Hz, 1H), 7,49-7,29 (m, 4H), 6,68 (q, *J* = 6,7 Hz, 1H), 1,76 (d, *J* = 6,6 Hz, 3H); HRMS-FAB (*m/z*) [M+H]<sup>+</sup> calc. para C<sub>24</sub>H<sub>17</sub>F<sub>6</sub>N<sub>5</sub>O<sub>2</sub>S, 553,101; encontrado, 553,1006.

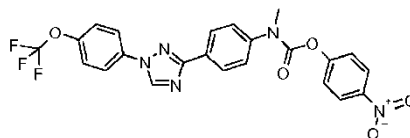
**Ejemplo 75: Preparación de 4-(1-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1*H*-1,2,4-triazol-3-il)fenilcarbamoato de O-4-fluorofenilo (Compuesto 134)**



En un matraz de fondo redondo de 25 ml se añadieron 4-(1-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1*H*-1,2,4-triazol-3-il)anilina (200 mg, 0,624 mmol), carbonocloridato de O-4-fluorofenilo (238 mg, 1,249 mmol) y trietilamina (0,348 ml, 2,498 mmol) en THF (5 ml). La solución se agitó en condiciones ambientales durante 2 h, antes el disolvente se retiró a presión reducida. El producto en bruto se añadió a una columna sobre gel de sílice y eluyó con un gradiente de EtOAc/hexanos para proporcionar el compuesto del título (50 mg, 0,105 mmol, 17 %) en forma de un sólido de color amarillo: pf 164-169 °C; RMN <sup>1</sup>H (400 MHz, DMSO-*d*<sub>6</sub>) δ 9,42 (s, 1H), 8,19-8,04 (m, 6H), 7,97 (s a, 1H), 7,66-7,57 (d, *J* = 8,24 Hz, 2H), 7,33-7,19 (m, 4H); IENEM *m/z* 475 (M+1).

**Ejemplo 76: Preparación de 4-(1-(4-(perfluoroetoxi)fenil)-1H-1,2,4-triazol-3-il)fenilcarbamato de metilo (Compuesto 135)**

5 Se suspendió 4-(1-(4-(perfluoroetoxi)fenil)-1H-1,2,4-triazol-3-il)fenilcarbamato de 4-nitrofenilo (1,90 g, 3,55 mmol) en MeOH (15 ml) y se enfrió en un baño de hielo seco/acetona a -10 °C. Se añadió gota a gota metóxido sódico (1,33 ml de una solución al 30 % en peso en MeOH, 7,10 mmol) durante 10 min. La suspensión de color amarillo brillante resultante se calentó a temperatura ambiente y se vertió en agua enfriada con hielo (150 ml). Después de agitar vigorosamente durante 10 min, la mezcla se filtró en un embudo Büchner. El sólido de color castaño se aclaró con agua y se secó al aire. La recristalización de MeOH/agua proporcionó el compuesto del título (0,989 g, 65 %) en  
10 forma de un sólido de color castaño: pf 183-184,5 °C; RMN <sup>1</sup>H (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 8,55 (s, 1H), 8,14 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,79 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,50 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 7,38 (d, J = 8,9 Hz, 2H), 6,79 (s, 1H), 3,80 (s, 3H); HRMS-FAB (m/z) [M+H]<sup>+</sup> calc. para C<sub>18</sub>H<sub>13</sub>F<sub>5</sub>N<sub>4</sub>O<sub>3</sub>, 428,0908; encontrado, 428,0903.

**Ejemplo 77: Preparación de 4-nitrofenil éster del ácido metil-{4-[1-(4-trifluorometoxifenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-fenil}-carbámico (Compuesto 136)**

15 Una suspensión de 4-[1-(4-trifluoroetiloxifenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-fenilamina (1,2 g, 3,7 mmol) en EtOH (4 ml) se trató con 1H-benzotriazol (0,48 g, 4,0 mmol) y formaldehído (0,5 ml, acuosa al 37 %, 6 mmol) y la solución se calentó a 40 °C durante 10 min. Tras la refrigeración, se formó un sólido, que se recogió por filtración. Se obtuvieron 1,33 g del aducto de triazol en forma de un sólido de color amarillo claro, pf 185-187 °C. Este material (1,2 g, 2,66 mmol) se disolvió en THF (20 ml) y se trató con NaBH<sub>4</sub> (0,11 g, 2,9 mmol). La solución se agitó a temperatura ambiente durante 30 min, después se calentó a reflujo durante 1 h. Después de la refrigeración, la solución se vertió en agua (30 ml) y se extrajo con éter. El secado y la concentración, seguido de cromatografía sobre gel de sílice (75:25 Hexanos:EtOAc) suministró metil-{4-[1-(4-trifluorometoxifenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-fenil}-amina (0,76 g, 86 %)  
20 en forma de un sólido de color blanco, pf 121-123 °C; RMN <sup>1</sup>H (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 8,51 (s, 1H), 8,02 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,1 Hz, 2H), 7,37 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 6,68 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 3,96 (s, 1H), 2,91 (s, 3H); EIEM m/z 499 (M<sup>+</sup>). Una porción de esta amina (0,11 g, 0,33 mmol) se disolvió en THF seco (2 ml) y se trató con cloroformiato de 4-nitrofenilo (0,069 g, 0,34 mmol). El sólido que se formó durante 10 min se recogió por filtración y se secó al aire para dar un sólido de color blanquecino (0,10 g): pf 145-147 °C; RMN <sup>1</sup>H (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 8,59 (s, 1H), 8,28 (d, J = 8 Hz, 4H), 7,8 (d, J = 8 Hz, 2H), 7,50-7,3 (m, 6 H) 3,55 (s, 3H); EIEM m/z 499 (M<sup>+</sup>).

30 Los compuestos se ensayaron frente a gardama de la remolacha y gusano del maíz usando procedimientos descritos en los siguientes ejemplos y presentados en la Tabla 2.

En cada caso de la Tabla 2, la escala de clasificación es la siguiente:

% de control (o mortalidad)	Clasificación
50-100	A
Menor de 50	B
No ensayado	C

**Ejemplo 78: Ensayo de insecticida para gardama de la remolacha (*Spodoptera exigua*)**

35 Se realizaron bioensayos en gardama de la remolacha (BAW; *Spodoptera exigua*: Lepidoptera) usando un ensayo de bandeja de dieta de 128 pocillos. Se colocaron de tres a cinco larvas de BAW de segunda fase en cada pocillo (3 ml) de la bandeja de dieta que se había cargado previamente con 1 ml de dieta artificial a la que se había aplicado 50 µg/cm<sup>2</sup> del compuesto de ensayo (disuelto en 50 µl de mezcla de acetona-agua 90:10) (a cada uno de ocho pocillos) y después se permitió que se secaran. Las bandejas se taparon con una cubierta autoadhesiva transparente, y se mantuvieron a 25 °C, luz-oscuridad 14:10 durante seis días. Se registró el porcentaje de mortalidad para las larvas en cada pocillo; después se promedió la actividad de los ocho pocillos. Los resultados para ambos bioensayos se indican en la tabla 2.  
40

**Ejemplo 79: Ensayo de insecticida para gusano del maíz (*Helicoverpa zea*)**

Se realizaron bioensayos en gusano del maíz (CEW; *Helicoverpa zea*: Lepidoptera) usando un ensayo de bandeja de dieta de 128 pocillos. Se colocaron de tres a cinco larvas de CEW de segunda fase en cada pocillo (3 ml) de la bandeja de dieta que se había cargado previamente con 1 ml de dieta artificial a la que se habían aplicado 50 µg /cm<sup>2</sup> del compuesto de ensayo (disuelto en 50 µl de mezcla de acetona-agua 90:10) (a cada uno de ocho pocillos) y después se permitió que se secaran. Las bandejas se taparon con una cubierta autoadhesiva transparente, y se mantuvieron a 25 °C, luz-oscuridad 14:10 durante seis días. Se registró el porcentaje de mortalidad para las larvas en cada pocillo; después se promedió la actividad de los ocho pocillos. Los resultados para ambos bioensayos se indican en la tabla 2.

Los compuestos también se ensayaron frente a pulgón verde del melocotonero usando un procedimiento descrito en el siguiente ejemplo y presentado en la tabla 2.

En cada caso de la Tabla 2, la escala de clasificación es la siguiente:

% de control (o mortalidad)	Clasificación
80-100	A
Menor de 80	B
No ensayado	C

**Ejemplo 80: Ensayo insecticida para pulgón verde del melocotonero (*Myzus persicae*) en ensayo de pulverización foliar**

Se usaron plántulas de col cultivadas en macetas de 7,62 centímetros, con 2-3 hojas verdaderas pequeñas (3-5 cm) como sustrato de ensayo. Las plántulas se infestaron con 20-50 pulgones verdes de melocotonero (adulto sin alas y ninfa) un día antes de la aplicación química. Se usaron cuatro macetas con plántulas individuales para cada tratamiento. Se disolvieron compuestos (2 mg) en 2 ml de disolvente de acetona/metanol (1:1), formando soluciones de reserva de 1000 ppm. Las soluciones de reserva se diluyeron 5X con Tween 20 a 0,025 % en H<sub>2</sub>O para obtener la solución a 200 ppm. Se usó un pulverizador Devilbiss portátil para pulverizar una solución en ambos lados de hojas de col hasta la escorrentía. Se pulverizaron plantas de referencia (comprobación de disolvente) solamente con el diluyente. Las plantas tratadas se mantuvieron en una habitación de mantenimiento durante tres días a aproximadamente 25 °C y 40 % de humedad relativa (HR) antes de la clasificación. La evaluación se realizó contando el número de pulgones vivos por planta bajo un microscopio. Se midió la actividad insecticida usando la fórmula de corrección de Abbott presentada en la tabla 2:

$$\% \text{ de Control Corregido} = 100 * (X - Y) / X$$

en la que X = N.º de pulgones vivos en plantas de control de disolvente

Y = N.º de pulgones vivos en plantas tratadas

**30 Ácido y derivados de sales y solvatos**

Los compuestos divulgados en esta invención pueden estar en la forma de sales de adición de ácido pesticídicamente aceptables.

A modo de ejemplo, una función amina puede formar sales con ácidos hidroclicóric, hidrobromico, sulfúrico, fosfórico, acético, benzoico, cítrico, malónico, salicílico, málico, fumárico, oxálico, succínico, tartárico, láctico, glucónico, ascórbico, maleico, aspártico, bencenosulfónico, metanosulfónico, etanosulfónico, hidroximetanosulfónico e hidroxietanosulfónico.

Adicionalmente, a modo de ejemplo, una función ácida puede formar sales que incluyen las obtenidas a partir de metales alcalinos y alcalinotérreos y las obtenidas a partir de amoniaco y aminas. Los ejemplos de cationes preferidos incluyen cationes de sodio, potasio, magnesio y amonio.

Las sales se preparan poniendo en contacto la forma de base libre con una cantidad suficiente de ácido deseado para producir una sal. Las formas de base libre pueden regenerarse tratando la sal con una solución de base acuosa, diluida, adecuada, tal como NaOH acuoso, diluido, carbonato potásico, amoniaco y bicarbonato sódico. Como ejemplo, en muchos casos, se modifica un plaguicida a una forma más soluble en agua, p. ej. la sal dimetil amina del ácido 2,4-diclorofenoxi acético es una forma más soluble en agua de ácido 2,4-diclorofenoxi acético, un herbicida bien conocido.

Los compuestos descritos en esta invención también pueden formar complejos estables con moléculas disolventes que permanecen intactas después de las moléculas de disolvente no complejadas se retiren de los compuestos. Estos complejos se denominan a menudo como "solvatos".

### Estereoisómeros

- 5 Ciertos compuestos descritos en este documento pueden existir como uno o más estereoisómeros. Los diversos estereoisómeros incluyen isómeros geométricos, diastereómeros y enantiómeros. Por lo tanto, los compuestos descritos en esta invención incluyen mezclas racémicas, estereoisómeros individuales y mezclas ópticamente activas. Se apreciará por los expertos en la materia que un estereoisómero puede ser más activo que los otros. Los estereoisómeros individuales y las mezclas ópticamente activas pueden obtenerse mediante procedimientos sintéticos selectivos, mediante procedimientos sintéticos convencionales usando materiales de partida resueltos o mediante procedimientos de resolución convencionales.

### Plagas

En otra realización, la invención desvelada en el presente documento puede usarse para combatir plagas.

- 15 En otra realización, la invención desvelada en el presente documento puede usarse para combatir plagas del Filo Nemátodos.

En otra realización, la invención desvelada en el presente documento puede usarse para combatir plagas del Filo Artrópodos.

En otra realización, la invención desvelada en el presente documento puede usarse para combatir plagas del Subfilo Quelicerados.

- 20 En otra realización, la invención desvelada en el presente documento puede usarse para combatir plagas de la Clase Arácnidos.

En otra realización, la invención desvelada en el presente documento puede usarse para combatir plagas del Subfilo Miriápodos.

- 25 En otra realización, la invención desvelada en el presente documento puede usarse para combatir plagas de la Clase Sinfilos.

En otra realización, la invención desvelada en el presente documento puede usarse para combatir plagas del Subfilo Hexápodos.

En otra realización, la invención desvelada en el presente documento puede usarse para combatir plagas de la Clase Insecto.

- 30 En otra realización, la invención desvelada en el presente documento puede usarse para combatir Coleópteros (escarabajos). Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye *Acanthoscelides spp.* (gorgojos), *Acanthoscelides obtectus* (gorgojo común de las judías), *Agrius planipennis* (barrenador esmeralda del fresno), *Agriotes spp.* (gusanos de alambre), *Anoplophora glabripennis* (escarabajo asiático de antenas largas), *Anthonomus spp.* (gorgojos), *Anthonomus grandis* (gorgojo del algodón), *Aphidius spp.*, *Apion spp.* (gorgojos), *Apogonia spp.* (larvas), *Ataenius spretulus* (ataenius negro de la hierba), *Atomaria linearis* (escarabajo pigmeo de la remolacha forrajera), *Aulacophore spp.*, *Bothynoderes punctiventris* (cleonus de la remolacha), *Bruchus spp.* (gorgojos), *Bruchus pisorum* (gorgojo del guisante), *Cacoesia spp.*, *Callosobruchus maculatus* (gorgojo del garbanzo del sur), *Carpophilus hemipteras* (escarabajo de los frutos secos), *Cassida vittata*, *Cerosterna spp.*, *Cerotoma spp.* (crisomelas), *Cerotoma trifurcata* (escarabajo de hoja de la judía), *Ceutorhynchus spp.* (gorgojos), *Ceutorhynchus assimilis* (ceutorrinco de la colza), *Ceutorhynchus napi* (ceutorrinco de la col), *Chaetocnema spp.* (crisomelas), *Colaspis spp.* (escarabajos del suelo), *Conoderus scalaris*, *Conoderus stigmosus*, *Conotrachelus nenuphar* (gorgojo del ciruelo), *Cotinus nitidis* (ronrón verde), *Crioceris asparagi* (escarabajo del espárrago), *Cryptolestes ferrugineus* (caroma achatada), *Cryptolestes pusillus* (escarabajo plano del grano), *Cryptolestes turcicus* (escarabajo turco del grano), *Ctenicera spp.* (gusanos de alambre), *Curculio spp.* (gorgojos), *ciclocephala spp.* (larvas), *Cylindroctonus adspersus* (gorgojo del tallo del girasol), *Deporaus marginatus* (gorgojo cortador de hoja del mango), *Dermestes lardarius* (dermeste del tocino), *Dermestes maculatus* (derméstido), *Diabrotica spp.* (crisomélidos), *Epilachna varivestis* (maya del frijol), *Faustinus cubae*, *Hylobius pales* (gorgojo de las estacas), *Hypera spp.* (gorgojos), *Hypera postica* (gorgojo de la alfalfa), *Hyperdoes spp.* (gorgojo Hyperodes), *Hapthenemus hampei* (barrenador del café), *Ips spp.* (escarabajos de la corteza), *Lasioderma serricornis* (escarabajo del tabaco), *Leptinotarsa decemlineata* (escarabajo de la patata), *Liogenys fuscus*, *Liogenys suturalis*, *Lissorhoptrus oryzophilus* (picudo acuático), *Lyctus spp.* (escarabajos de la madera/carcoma de polvo de salvadera), *Maecolaspis jolivetii*, *Megascelis spp.*, *Melanotus communis*, *Meligethes spp.*, *Meligethes aeneus* (escarabajo de la colza), *Melolontha melolontha* (abejorro común), *Oberea brevis*, *Oberea linearis*, *Oryctes rhinoceros* (escarabajo rinoceronte), *Oryzaephilus mercator* (escarabajo mercante de los granos), *Oryzaephilus surinamensis* (escarabajo de dientes serrados del grano), *Otiorynchus spp.*
- 55 (gorgojos), *Oulema melanopus* (criocero de los cereales), *Oulema oryzae*, *Pantomorus spp.* (gorgojos), *Phyllophaga*

spp. (escarabajo de mayo/junio), *Phyllophaga cuyabana*, *Phyllotreta* spp. (crisomélidos), *Phynchites* spp., *Popillia japonica* (escarabajo japonés), *Prostephanus truncates* (barrenador mayor de los granos), *Rhizopertha dominica* (barrenador menor de los granos), *Rhizotrogus* spp. (escarabajo de San Juan), *Rhynchophorus* spp. (gorgojos), *Scolytus* spp. (escarabajos de la madera), *Shenophorus* spp. (gorgojos), *Sitona lineatus* (sitona del guisante), *Sitophilus* spp. (gorgojo de los granos), *Sitophilus granaries* (gorgojo de los graneros), *Sitophilus oryzae* (gorgojo del arroz), *Stegobium paniceum* (gorgojo del pan), *Tribolium* spp. (escarabajo de los cereales), *Tribolium castaneum* (gorgojo de la harina y del afrecho), *Tribolium confusum* (gorgojo de la harina), *Trogoderma variabile* (gorgojo de productos almacenados) y *Zabrus tenebrioides*.

En otra realización, la invención desvelada en el presente documento puede usarse para combatir Dermápteros (tijeretas).

En otra realización, la invención desvelada en el presente documento puede usarse para combatir Dictiópteros (cucarachas). Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye *Blattella germanica* (cucaracha alemana), *Blatta orientalis* (cucaracha oriental), *Parcoblatta pennylvanica*, *Periplaneta americana* (cucaracha americana), *Periplaneta australoasiae* (cucaracha australiana), *Periplaneta brunnea* (cucaracha marrón), *Periplaneta fuliginosa* (cucaracha marrón ahumado), *Pycnoselus suninamensis* (cucaracha de Surinam) y *Supella longipalpa* (cucaracha marrón con bandas).

En otra realización, la invención desvelada en el presente documento puede usarse para combatir Dípteros (moscas verdaderas). Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye *Aedes* spp. (mosquitos), *Agromyza frontella* (barrenador de mancha del alfalfa), *Agromyza* spp. (moscas minadoras de hojas), *Anastrepha* spp. (moscas de la fruta), *Anastrepha suspensa* (mosca de la fruta caribeña), *Anopheles* spp. (mosquitos), *Batrocera* spp. (moscas de la fruta), *Batrocera cucurbitae* (mosca del melón), *Batrocera dorsalis* (mosca de la fruta oriental), *Ceratitidis* spp. (moscas de la fruta), *Ceratitidis capitata* (mosca de la fruta mediterránea), *Chrysops* spp. (moscas del venado), *Cochliomyia* spp. (gusanos barrenadores), *Contarinia* spp. (moscas de las agallas), *Culex* spp. (mosquitos), *Dasineura* spp. (moscas de las agallas), *Dasineura brassicae* (moscas de las agallas de la col), *Delia* spp., *Delia platyura* (mosca de la semilla), *Drosophila* spp. (moscas del vinagre), *Fannia* spp. (moscas de la mugre), *Fannia canicularis* (mosca doméstica pequeña), *Fannia scalaris* (mosca de las letrinas), *Gasterophilus intestinalis* (mosca del intestino equino), *Gracillia perseae*, *Haematobia irritans* (mosca de los cuernos), *Hylemyia* spp. (gusanos de las raíces), *Hypoderma lineatum* (rezno común del ganado), *Liriomyza* spp. (moscas minadoras de hojas), *Liriomyza brassica* (minador de las hojas en serpentina), *Melophagus ovinus* (hipobóscido de las ovejas), *Musca* spp. (moscas múscidas), *Musca autumnalis* (mosca facial), *Musca domestica* (mosca doméstica), *Oestrus ovis* (estro), *Oscinella frit* (mosca frit), *Pegomyia betae* (mosca de la remolacha), *Phorbia* spp., *Psila rose* (mosca de la zanahoria), *Rhagoletis cerasi* (mosca de las cerezas), *Rhagoletis pomonella* (mosca de las manzanas), *Sitodiplosis mosellana* (mosquito del trigo), *Stomoxys calcitrans* (mosca de los establos), *Tabanus* spp. (tábanos) y *Tipula* spp. (tipulas).

En otra realización, la invención desvelada en el presente documento puede usarse para combatir Hemípteros (chinches). Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye *Acrosternum hilare* (chinche hedionda verde), *Blissus leucopterus* (chinche del prado), *Calocoris norvegicus* (chinche de la patata), *Cimex hemipterus* (chinche de cama tropical), *Cimex lectularius* (chinche de cama), *Dagbertus fasciatus*, *Dichelops furcatus*, *Dysdercus suturellus* (chinche tintórea), *Edessa mediatubunda*, *Eurygaster maura* (chinche de los cereales), *Euschistus heros*, *Euschistus servus* (chinche hedionda marrón), *Helopeltis antonii*, *Helopeltis theivora* (chinche de la roya del té), *Lagynotomus* spp. (chinches hediondas), *Leptocoris oratorius*, *Leptocoris varicornis*, *Lygus* spp. (chinches vegetales), *Lygus hesperus* (chinche manchador occidental), *Maconellicoccus hirsutus*, *Neurocolpus longirostris*, *Nezara viridula* (chinche hediondo verde meridional), *Phytocoris* spp. (chinches vegetales), *Phytocoris californicus*, *Phytocoris relativus*, *Piezodorus guildingi*, *Poecilocapsus lineatus* (chinche vegetal de cuatro líneas), *Psallus vaccinicola*, *Pseudacysta perseae*, *Scaptocoris castanea* y *Triatoma* spp. (chinches triatomas).

En otra realización, la invención desvelada en el presente documento puede usarse para combatir Homópteros (áfidos, insectos escama, mosquitas blancas, cicadélidos). Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye *Acrythosiphon pisum* (pulgón verde del guisante), *Adelges* spp. (adélgidos), *Aleurodes proletella* (mosquita blanca del repollo), *Aleurodicus disperses*, *Aleurothrix floccosus* (mosquita blanca de los citros), *Alutacaspis* spp., *Amrasca bigattella bigattella*, *Aphrophora* spp. (cicadas), *Aonidiella aurantii* (cochinilla roja australiana), *Aphis* spp. (pulgones), *Aphis gossypii* (pulgón del algodón), *Aphis pomi* (pulgón de la manzana), *Autlacorthum solani* (pulgón de la patata), *Bemisia* spp. (mosquitas blancas), *Bemisia argentifolii*, *Bemisia tabaci* (mosquita blanca del boniato), *Brachycolus noxius* (pulgón ruso), *Brachycorynella asparagi* (pulgón del espárrago), *Brevennia rehi*, *Brevicoryne brassicae* (pulgón del repollo), *Ceroplastes* spp. (insectos escamas), *Ceroplastes rubens* (insecto escama de cera roja), *Chionaspis* spp. (insectos escamas), *Chrysomphalus* spp. (insectos escamas), *Coccus* spp. (insectos escamas), *Dysaphis plantaginea* (pulgón rojo del manzano), *Empoasca* spp. (cicadas), *Eriosoma lanigerum* (pulgón lanígero), *Icerya purchasi* (cochinilla acanalada), *Idioscopus nitidulus* (cicada del mango), *Laodelphax striatellus* (furgoroide marrón menor), *Lepidosaphes* spp., *Macrosiphum* spp., *Macrosiphum euphorbiae* (pulgón de la patata), *Macrosiphum granarium* (pulgón del trigo), *Macrosiphum rosae* (pulgón del rosal), *Macrosteles quadrilineatus* (saltahojas del áster), *Mahanarva frimbiolata*, *Metopolophium dirhodum* (pulgón de cereales), *Mictis longicornis*, *Myzus persicae* (pulgón verde del melocotón), *Nephotettix* spp. (cicadas), *Nephotettix cinctipes* (cicada verde), *Nilaparvata lugens* (furgoroide marrón), *Parlatoria pergandii* (insecto escama de la paja), *Parlatoria ziziphi* (piojo negro de los agrinos), *Peregrinus maidis* (delfácido del maíz), *Philaenus* spp. (afróforas), *Phylloxera vitifoliae*

(floxera), *Physokermes piceae* (insecto escama de brote del abeto), *Planococcus spp.* (chinchas harinosas), *Pseudococcus spp.* (chinchas harinosas), *Pseudococcus brevipes* (escama harinosa de la piña), *Quadraspidiotus perniciosus* (escama de San José), *Rhaphalosiphum spp.* (pulgones), *Rhaphalosiphum maidae* (pulgón del maíz), *Rhaphalosiphum padi* (pulgón del cerezo aliso-avena), *Saissetia spp.* (escamas), *Saissetia oleae* (escama negra),  
 5 *Schizaphis graminum* (pulgón verde), *Sitobion avenae* (pulgón del trigo), *Sogatella furcifera* (cícada de espalda blanca), *Therioaphis spp.* (pulgones), *Toumeyella spp.* (escamas), *Toxoptera spp.* (pulgones), *Trialeurodes spp.* (mosquitas blancas), *Trialeurodes vaporariorum* (mosquita blanca de los invernaderos), *Trialeurodes abutiloneus* (mosquita blanca de alas en bandas), *Unaspis spp.* (escamas), *Unaspis yanonensis* (escama de cabeza de flecha) y *Zulia entrerriana*.

10 En otra realización, la invención desvelada en el presente documento puede usarse para combatir Himenópteros (hormigas, avispas y abejas). Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye *Acromyrmex spp.*, *Athalia rosae*, *Atta spp.* (hormigas cortadoras), *Camponotus spp.* (hormigas carpinteras), *Diprion spp.* (mosca de sierra), *Formica spp.* (hormigas), *Iridomyrmex humilis* (hormiga argentina), *Monomorium ssp.*, *Monomorium minimum* (hormiga negra pequeña), *Monomorium pharaonis* (hormiga cosechadora), *Neodiprion spp.* (moscas de sierra), *Pogonomyrmex spp.*  
 15 (hormigas cosechadoras), *Polistes spp.* (avispa de papel), *Solenopsis spp.* (hormigas bravas), *Tapinoma sessile* (hormiga doméstica olorosa), *Tetranorium spp.* (hormigas de pavimento), *Vespula spp.* (véspula) y *Xylocopa spp.* (abejorros carpinteros).

En otra realización, la invención desvelada en el presente documento puede usarse para combatir Isópteros (termitas). Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye *Coptotermes spp.*, *Coptotermes curvignathus*,  
 20 *Coptotermes frenchii*, *Coptotermes formosanus* (térmita subterránea de Formosa), *Cornitermes spp.* (termitas narigudas), *Cryptotermes spp.* (termitas de madera seca), *Heterotermes spp.* (termitas subterráneas del desierto), *Heterotermes aureus*, *Kaloterms spp.* (termitas de madera seca), *Incisitermes spp.* (termitas de madera seca), *Macrotermes spp.* (termitas cultivadoras de hongos), *Marginitermes spp.* (termitas de madera seca), *Microcerotermes spp.* (termitas recolectoras), *Microtermes obesi*, *Procornitermes spp.*, *Reticulitermes spp.* (termitas subterráneas), *Reticulitermes banyulensis*, *Reticulitermes grassei*, *Reticulitermes flavipes* (térmita subterránea oriental), *Reticulitermes hageni*, *Reticulitermes hesperus* (térmita subterránea occidental), *Reticulitermes santonensis*, *Reticulitermes speratus*, *Reticulitermes tibialis*, *Reticulitermes virginicus*, *Schedorhinotermes spp.*, y *Zootermopsis spp.* (termitas de madera podrida).

En otra realización, la invención desvelada en el presente documento puede usarse para combatir Lepidópteros (polillas y mariposas). Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye *Achoea janata*, *Adoxophyes spp.*, *Adoxophyes orana*, *Agrotis spp.* (oruga podadera), *Agrotis ipsilon* (cucumilla negra), *Alabama argillacea* (gusano de la hoja del algodón), *Amorbia cuneana*, *Amyelosis transitella*, *Anacamptodes defectaria*, *Anarsia lineatella* (polilla del melocotonero), *Anomis sabulifera* (medidora del yute), *Anticarsia gemmatalis* (oruga de las leguminosas), *Archips argyrospila* (tortrix de frutales), *Archips rosana* (tortrix del rosal), *Argyrotaenia spp.* (polillas tortricidas), *Argyrotaenia citrana* (tortrix naranja), *Autographa gamma*, *Bonagota cranaodes*, *Borbo cinnara* (cacoecia del arroz), *Bucculatrix thurberiella* (perforador de la hoja del algodón), *Caloptilia spp.* (minadores de las hojas), *Capua reticulana*, *Carposina niponensis* (polilla del melocotón), *Chilo spp.*, *Chlumetia transversa* (perforador de las yemas del mango), *Choristoneura rosaceana* (tortrix de bandas oblicuas), *Chrysodeixis spp.*, *Cnaphalocerus medinalis* (tortrix de hierba), *Colias spp.*, *Conpomorpha cramerella*, *Cossus cossus* (polilla carpintera), *Crambus spp.* (palomilla),  
 40 *Cydia funebrana* (polilla de las ciruelas), *Cydia molesta* (polilla oriental del melocotonero), *Cydia nigricana* (polilla de los guisantes), *Cydia pomonella* (polilla de las manzanas), *Darna diducta*, *Diaphania spp.* (barrenadores del tallo), *Diatraea spp.* (barrenadores del tronco), *Diatraea saccharalis* (barrenador de la caña de azúcar), *Diatraea graniosella* (barrenador del maíz sudoccidental), *Earias spp.* (oruga de la cápsula del algodón), *Earias insulata* (oruga espinosa de las cápsulas), *Earias vitella* (oruga septentrional dura), *Ecdytopopha aurantianum*, *Elasmopalpus lignosellus* (barrenador menor), *Epiphysias postruttana* (polilla de las manzanas marrón claro), *Ephestia spp.* (polilla gris de la harina), *Ephestia cautella* (polilla del almendro), *Ephestia elutella* (polilla del tabaco), *Ephestia kuehniella* (polilla de la harina mediterránea), *Epimeces spp.*, *Epinotia aporema*, *Erionota thorax*, *Eupoecilia ambiguella* (polillas de las uvas), *Euxoa auxiliaris* (oruga podadera), *Feltia spp.* (orugas podaderas), *Gortyna spp.* (barrenadores del tallo), *Grapholita molesta* (polilla oriental del melocotonero), *Hedylepta indicata* (palomilla de las hojas de las judías),  
 50 *Helicoverpa spp.* (noctuidos), *Helicoverpa armigera* (oruga de la cápsula del algodón), *Helicoverpa zea* (oruga del algodón/oruga del maíz), *Heliothis spp.* (noctuidos), *Heliothis virescens* (gusano de la yema del tabaco), *Hellula undalis* (palomilla del repollo), *Indarbela spp.* (barrenadores de la raíz), *Keiferia lycopersicella* (gusano alfiler del tomate), *Leucinodes orbonalis* (barrenador de la berenjena), *Leucoptera malifoliella*, *Lithocolletis spp.*, *Lobesia botrana* (polillas de las uvas), *Loxagrotis spp.* (noctuidos), *Loxagrotis albicosta* (oruga podadera de las judías occidental), *Lymantria dispar* (largata peluda), *Lyonetia clerkella* (minadora de las hojas de los frutales), *Mahasena corbeti* (oruga de bolsón de palma oleaginosa), *Malacosoma spp.* (orugas de librea), *Mamestra brassicae* (noctuido de la col), *Maruca testulalis* (taladrador de las vainas), *Metisa plana* (oruga de bolsón), *Mythimana unipuncta* (gardama africana), *Neoleucinodes elegantalis* (barrenador del tomate pequeño), *Nymphula depunctalis* (oruga de vaina del arroz), *Operophtera brumata* (falena invernal), *Ostrinia nubilalis* (barrenador del maíz europeo), *oxidia vesulia*, *Pandemis cerasana* (tortrix de la grosella común), *Pandemis heparana* (tortrix de la manzana marrón), *Papilio demodocus*, *Pectinophora gossypiella* (gusano rosado del algodón), *Peridroma spp.* (orugas podaderas), *Peridroma saucia* (cortador), *Perileucoptera coffeella* (minador de las hojas del café), *Phthorimaea operculella* (polilla de la patata), *Phyllocnistis citrella*, *Phyllonorycter spp.* (minadores de las hojas), *Pieris rapae* (mariposa

pequeña de la col), *Plathopena scabra*, *Plodia interpunctella* (polillas de la harina de la India), *Plutella xylostella* (palomilla dorso diamante), *Polychrosis viteana* (polilla de la uva), *Prays endocarpa*, *Prays oleae* (polilla de la oliva), *Pseudaletia* spp. (noctuidos), *Pseudaletia unipunctata* (gardama), *Pseudoplusia includens* (medidor de soja), *Rachiplusia nu*, *Scirpophaga incertulas*, *Sesamia* spp. (barrenadores del tallo), *Sesamia inferens* (barrenadores del tallo del arroz rosados), *Sesamia nonagrioides*, *Setora nitens*, *Sitotroga cerealella* (polilla de los cereales), *Sparganothis pilleriana*, *Spodoptera* spp. (gardamas), *Spodoptera exigua* (gardama de la remolacha), *Spodoptera frugiperda* (gusano cogollero), *Spodoptera oridania* (gardama meridional), *Synanthedon* spp. (barrenadores de la raíz), *Thecla basilides*, *Thermisia gemmatalis*, *Tineola bisselliella* (polilla de la ropa), *Trichoplusia ni* (falso medidor), *Tuta absoluta*, *Yponomeuta* spp., *Zeuzera coffeae* (barrenador de las ramas rojo) y *Zeuzera pirina* (taladro amarillo de los troncos).

En otra realización, la invención desvelada en el presente documento puede usarse para combatir Malophaga (piojos masticadores). Una lista no exhaustiva de estas plagas incluyen *Bovicola ovis* (piojos de lanares), *Menacanthus stramineus* (piojo de cuerpo de pollo) y *Menopon gallinea* (piojo de gallina común).

En otra realización, la invención desvelada en el presente documento puede usarse para combatir Ortópteros (saltamontes, langostas y grillos). Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye *Anabrus simplex* (grillo mormón), *Gryllotalpidae* (grillo topo), *Locusta migratoria*, *Melanoplus* spp. (saltamontes), *Microcentrum retinerve* (saltamontes logicornio de alas angulares), *Pterophylla* spp. (saltamontes logicornios), *chistocerca gregaria*, *Scuddería furcata* (saltamonte logicornio de arbustos con cola de horquilla) y *Valanga nigricorni*.

En otra realización, la invención desvelada en el presente documento puede usarse para combatir Ftirópteros (piojos). Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye *Haematopinus* spp. (piojos de los vacunos y porcinos), *Linognathus ovillus* (piojo de las ovejas), *Pediculus humanus capitis* (piojo del cuerpo humano), *Pediculus humanus humanus* (piojos del cuerpo humano) y *Pthirus pubis* (ladilla),

En otra realización, la invención desvelada en el presente documento puede usarse para combatir Sifonópteros (pulgas). Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye *Ctenocephalides canis* (pulga de perro), *Ctenocephalides felis* (pulga de gato) y *Pulex irritans* (pulga humana).

En otra realización, la invención desvelada en el presente documento puede usarse para combatir Tisanópteros (trips). Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye *Frankliniella fusca* (trips del tabaco), *Frankliniella occidentalis* (trips occidental de las flores), *Frankliniella schultzei*, *Frankliniella williamsi* (trips de los cereales), *Heliothrips haemorrhaidalis* (trips de los invernaderos), *Rhipiphorothrips cruentatus*, *Scirtothrips* spp., *Scirtothrips citri* (trips de los agrios), *Scirtothrips dorsalis* (trips amarillo del té), *Taeniothrips rhopalantennalis* y *Thrips* spp.

En otra realización, la invención desvelada en el presente documento puede usarse para combatir Tisanuros. Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye *Lepisma* spp. (pececillo de plata) y *Thermobia* spp. (insectos de fuego).

En otra realización, la invención desvelada en el presente documento puede usarse para combatir Acarina (ácaros y garrapatas). Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye *Acaropsis woodi* (ácaro traqueal de abejas melíferas), *Acarus* spp. (ácaros alimentarios), *Acarus siro* (ácaro de la harina), *Aceria mangiferae* (ácaro de la yema del mango), *Aculops* spp., *Aculops lycopersici* (deca de los tomates), *Aculops pelekasi*, *Aculus pelekassi*, *Aculus schlechtendali* (ácaro de la roya del manzano), *Amblyomma americanum* (garrapata de la estrella solitaria), *Boophilus* spp. (garrapatas), *Brevipalpus obovatus* (ácaro de la alheña), *Brevipalpus phoenicis* (ácaro plano rojo y negro), *Demodex* spp. (ácaros de la sarna), *Dermacentor* spp. (garrapatas duras), *Dermacentor variabilis* (garrapata de perro americana), *Dermatophagoides pteronyssinus* (ácaro del polvo), *Eotetranychus* spp., *Eotetranychus carpini* (ácaro araña amarillo), *Epitimerus* spp., *Eriophyes* spp., *Ixodes* spp. (garrapatas), *Metatetranychus* spp., *Notoedres cati*, *Oligonychus* spp., *Oligonychus coffeee*, *Oligonychus ilicis* (ácaro rojo meridional), *Panonychus* spp., *Panonychus citri* (ácaro rojo de los cítricos), *Panonychus ulmi* (ácaro rojo europeo), *Phyllocoptruta oleivora* (ácaro de la roya de los cítricos), *Polyphagotarsonemum latuts* (ácaro blanco), *Rhipicephalus sanguineus* (garrapata del perro), *Rhizoglyphus* spp. (ácaro de los bulbos), *Sarcoptes scabiei* (ácaro de la sarna), *Tegolophus perseiflorae*, *Tetranychus* spp., *Tetranychus urticae* (ácaro rojo) y *Varroa destructor* (ácaro de las abejas).

En otra realización, la invención desvelada en el presente documento puede usarse para combatir Nematoda (nematodos). Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye *Aphelenchoides* spp. (nematodos de yema y hoja y madera de pinos), *Belonolaimus* spp. (nematodos de aguijón), *Criconemella* spp. (nematodos anulares), *Dirofilaria immitis* (lombriz de corazón de perro), *Ditylenchus* spp. (nematodos de tallo y bulbo), *Heterodera* spp. (nematodos de las raíces), *Heterodera zae* (nematodo de las raíces del maíz), *Hirschmanniella* spp. (nematodos de las raíces), *Hoplolaimus* spp. (nematodos de lanza), *Meloidogyne* spp. (nematodos de nudosidad de la raíz), *Meloidogyne incognita* (nematodo de nudosidad de la raíz), *Onchocerca volvulus* (lombriz de cola en gancho), *Pratylenchus* spp. (nematodos de lesión), *Radopholus* spp. (nematodos del banano) y *Rotylenchus reniformis* (nematodo en forma de riñón).

En otra realización, la invención desvelada en el presente documento puede usarse para combatir Symphyla (sínfilos). Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye *Scutigerella immaculata*.

Para una información más detallada consúltese "HANDBOOK OF PEST CONTROL - THE BEHAVIOR, LIFE HISTORY AND CONTROL OF HOUSEHOLD PESTS" de Arnold Mallis, 9ª Edición, copyright 2004 de GIE Media Inc.

### Mezclas

- 5 La invención desvelada en este documento también puede usarse con diversos insecticidas, tanto por razones de economía como de sinergia. Dichos insecticidas incluyen insecticidas antibióticos, insecticidas de lactona macrocíclicos (por ejemplo, insecticidas de avermectina, insecticidas de milbemicina e insecticidas de espinosina), insecticidas arsénicos, insecticidas botánicos, insecticidas de carbamato (por ejemplo, insecticidas de metilcarbamato de benzofuranilo, insecticidas de dimetilcarbamato, insecticidas de carbamato de oxima e insecticidas de fenil metilcarbamato), insecticidas de diamida, insecticidas desencantes, insecticidas de dinitrofenol, insecticidas de flúor, insecticidas de formamida, insecticidas fumigantes, insecticidas inorgánicos, reguladores del crecimiento de insectos (por ejemplo, inhibidores de síntesis de quitina, miméticos de hormona juvenil, hormonas juveniles, agonistas de la hormona de muda, hormonas de muda, inhibidores de muda, precocenos y otros reguladores de crecimiento de insectos no clasificados), insecticidas de análogos de nereistoxina, insecticidas de nicotinoides (por ejemplo, insecticidas de nitroguanidina, insecticidas de nitrometileno e insecticidas de piridilmetilamina), insecticidas de organocloro, insecticidas de organofósforo, insecticidas de oxadiazina, insecticidas de oxadiazolona, insecticidas de ftalimida, insecticidas de pirazol, insecticidas de piretroide, insecticidas de pirimidinamina, insecticidas de pirrol, insecticidas de ácido tetrámico, insecticidas de ácido tetrónico, insecticidas de tiazol, insecticidas de tiazolidina, insecticidas de tiourea, insecticidas de urea, así como otros insecticidas no clasificados.

Algunos de los insecticidas particulares que pueden emplearse beneficiosamente en combinación con la invención desvelada en este documento, incluyen los siguientes, 1,2-dicloropropano, 1,3-dicloropropeno, abamectina, acefato, acetamiprida, acetión, acetoprol, acrinatrina, acrilonitrilo, alanicarb, aldicarb, aldoxicarb, aldrina, aletrina, alosamidina, alixicarb, alfa-cipermetrina, alfa-endosulfán, amiditió, aminocarb, amitón, amitraz, anabasina, atidatió, azadiractina, azametifos, azinfos-etilo, azinfos-metilo, azotoato, hexafluorosilicato de bario, bartrina, bendiocarb, benfuracarb, bensultap, beta-ciflutrina, beta-cipermetrina, bifentrina, bioaletrina, bioetanometrina, biopermetrina, bioresmetrina, bistriflurón, borax, ácido bórico, ácido bórico, bromfenvinfos, bromocicleno, bromo-DDT, bromofos, bromofos-etilo, bufencarb, buprofezina, butacarb, butatíofos, butocarboxim, butonato, butoxicarboxim, cadusafos, arsenato cálcico, polisulfuro cálcico, canfecloro, carbanolato, carbarilo, carbofurano, disulfuro de carbono, tetracloruro de carbono, carbofenotión, carbosulfán, cartap, clorantraniliprol, clorbicicleno, clordano, clordecona, clordimeform, cloretoxifos, clorfenapir, clorfenvinfos, clorfluazurón, clormefos, cloroformo, cloropicrina, clorfoxim, clorprazofos, clorpirifos, clorpirifos-metilo, clortíofos, cromafenozida, cinerina I, cinerina II, cismetrina, cloetocarb, closantel, clotianidina, acetoarsenita de cobre, arsenato de cobre, naftenato de cobre, oleato de cobre, coumafos, coumitoato, crotamitón, crotoxifos, crufomato, criolita, cianofenos, cianofos, ciantoato, ciantraniliprol, cicletrina, cicloprotrina, ciflutrina, cihalotrina, cipermetrina, cifenotrina, ciromazina, citioato, DDT, decarbofurano, deltametrina, demefión, demefión-O, demefión-S, demetón, demetón-metilo, demetón-O, demetón-O-metilo, demetón-S, demetón-S-metilo, demetón-S-metilsulfona, diafentiurón, dialifos, tierras diatomeas, diazinón, dicaptón, diclofentión, diclorvos, dicresilo, dicrotofos, diciclanilo, dieldrina, diflubenzurón, dilor, dimeflutrina, dimefox, dimetano, dimetoato, dimetrina, dimetilvinfos, dimetilano, dinex, dinoprop, dinosam, dinotefurano, diofenolano, dioxabenzofos, dioxacarb, dioxatió, disulfotón, diticrofos, *g*-limoneno, DNOC, doramectina, ecdisterona, emamectina, EMPC, empentrina, endosulfano, endotió, endrina, EPN, epofenonano, eprinomectina, esfenvalerato, etafo, etiofencarb, etió, etiprol, etoato-metilo, etoprofos, etil formato, etil-DDD, dibromuro de etileno, dicloruro de etileno, óxido de etileno, etofenprox, etrimfos, EXD, fanfur, fenamifos, fenazaflor, fenclorfos, fenetacarb, fenflutrina, fenitrotión, fenobucarb, fenoxacrim, fenoxicarb, fenpiritrina, fenpropatrina, fensulfotión, fentión, fentión-etilo, fenvalerato, fipronilo, flonicamida, flubendiamida, flucofurón, flucicloxurón, flucitrinato, flufenerim, flufenoxurón, flufenprox, fluvalinato, fonofos, formetanato, formotió, formparanato, fosmetilán, fospirato, fostietán, furatiocarb, furetrina, gamma-cihalotrina, gamma-HCH, halfenprox, halofenozida, HCH, HEOD, heptaclor, heptenofos, heterofos, hexaflumurón, HHDN, hidrametilnón, cianuro de hidrógeno, hidropreno, hiqincarb, imidacloprid, imiprotrina, indoxacarb, yodometano, IPSP, isazofos, isobenzan, isocarbofos, isodrina, isofenos, isoprocarb, isoprotiolano, isotioato, isoxatió, ivermectina, jasmolina I, jasmolina II, jodfenfos, hormonal juvenil I, hormona juvenil II, hormona juvenil III, keleván, kinopreno, lambda-cihalotrina, arsenato de plomo, lepimectina, leptofos, lindano, lirimfos, lufenuron, litidatió, malatió, malonobeno, mazidox, mecarb, mecarfón, menazón, mefosfolán, cloruro mercurioso, mesulfenfos, metaflumizona, metacrifos, metamidofos, metidatió, metiocarb, metocrotofos, metomilo, metopreno, metoxiclor, metoxifenozida, metil bromuro, metilcloroformo, cloruro de metileno, metoflutrina, metolcarb, metoxadiazona, mevinfos, mexacarbato, milbemectina, oxima de milbemicina, mipafox, mirex, monocrotofos, morfotió, moxidectina, naftalofos, naled, naftaleno, nicotina, nifluriduro, nitenpiram, nitiazina, nitrilacarb, novalurón, noviflumurón, ometoato, oxamilo, oxidemetón-metilo, oxideprofos, oxidisulfotón, para-diclorobenceno, paratió, paratió-metilo, penflurón, pentaclorofenol, permetrina, fenkaptón, fenotrina, fentoato, forato, fosalona, fosfolán, fosmet, fosniclor, fosamidón, fosfina, foxim, foxim-metilo, pirimetafos, pirimicarb, pirimifos-etilo, pirimifos-metilo, arsenito potásico, tiocianato potásico, pp'-DDT, praletrina, precoceno I, precoceno II, precoceno III, primidofos, profenofos, proflutrina, promacilo, promecarb, propafos, propetanfos, propoxur, protidatió, protíofos, protoato, protrifenbuto, piraclofos, pirafluprol, pirazofos, piresmetrina, piretrina I, piretrina II, piridabeno, piridalil, piridafentión, pirifluquinazón, pirimidifeno, pirimitato, piriprol, piriproxifeno, quassia, quinalfos, quinalfos-metilo, quinotió, rafoxanida, resmetrina, rotenona, riania, sabadilla, schradan,



selamectina, silafluofeno, gel de sílice, arsenito sódico, fluoruro sódico, hexafluorosilicato sódico, tiocianato sódico, sofamida, espinetoram, espinosad, espiromesifeno, espirotetramat, sulcofurón, sulfoxaflor, sulfloramida, sulfotep, fluoruro de sulfurilo, sulprofos, tau-fluvalinato, tazimcarb, TDE, tebufenozida, tebufenpirad, tebupirimfos, teflubenzurón, teflutrina, temefos, TEPP, teraletrina, terbufos, tetracloroetano, tetraclorvinfos, tetrametrina, theta-cipermetrina, tiacloprida, tiametoxam, ticrofos, tiocarboxima, tiociclam, tiodicarb, tiofanox, tiometón, tiosultap, turingiensina, tolfenpirad, tralometrina, transflutrina, transpermetrina, triarateno, triazamato, triazofos, triclorfón, triclormetafos-3, tricloronato, trifenofos, triflumurón, trimetacarb, tripreno, vamidotion, vaniliprol, XMC, xililcarb, zeta-cipermetrina, zolapropfos y  $\alpha$ -ecdisona.

Adicionalmente, puede usarse cualquier combinación de los insecticidas anteriores.

- 10 La invención desvelada en este documento también puede usarse, por motivos de economía y sinergia, con acaricidas, algicidas, inhibidores alimentarios, avicidas, bactericidas, repelentes de aves, quimioesterilizantes, fungicidas, protectores de herbicidas, herbicidas, atrayentes de insectos, repelentes de insectos, repelentes de mamíferos, disruptores de copula, moluscicidas, activadores vegetales, reguladores de crecimiento de plantas, rodenticidas, sinérgicos, desfoliantes, desecantes, desinfectantes, semioquímicos y virucidas (estas categorías no son mutuamente excluyentes).

15 Para más información consúltese "COMPENDIUM OF PESTICIDE COMMON NAMES" localizado en <http://www.alanwood.net/pesticides/index.html>. Consúltese también "THE PESTICIDE MANUAL" 14ª Edición, editado por C D S Tomlin, copyright 2006 de British Crop Production Council.

### Mezclas sinérgicas

- 20 La invención desvelada en este documento puede usarse con otros compuestos tales como los mencionados bajo el encabezamiento "Mezclas" para formar mezclas sinérgicas en las que el modo de acción de los compuestos en las mezclas son iguales, similares o diferentes.

25 Los ejemplos de modo de acción incluyen: inhibidor de acetilcolinesterasa; modulador de canal de sodio; inhibidor de la biosíntesis de quitina; antagonista del canal de cloruro abierto por GABA; agonista de canal de cloruro abierto por GABA y glutamato; agonista de receptor de acetilcolina; inhibidor de MET I; inhibidor de ATPasa estimulado por Mg; receptor nicotínico de acetilcolina; disruptor de membrana de intestino medio; disruptor de fosforilación oxidativa y receptor de rianodina (RyRs).

Adicionalmente, se conocen los siguientes compuestos como sinérgicos y pueden usarse con la invención desvelada en este documento: butóxido de piperonilo, piprotal, propil isoma, sesamex, sesamolina y sulfóxido.

### 30 Formulaciones

Un plaguicida es pocas veces adecuado para la aplicación en forma pura. Es necesario habitualmente añadir otras sustancias de modo que el plaguicida puede usarse a la concentración requerida y en una forma apropiada, permitiendo facilidad de aplicación, manipulación, transporte, almacenamiento y actividad plaguicida máxima. Por lo tanto, los plaguicidas se formulan en, por ejemplo, señuelos, emulsiones concentradas, polvos, concentrados emulsionables, fumigantes, geles, gránulos, microencapsulaciones, tratamientos de semillas, concentrados de suspensión, suspoemulsiones, comprimidos, líquidos solubles en agua, gránulos dispersables en agua o concentrados de suspensión secos, polvos humectables y soluciones de volumen ultrabajo.

Para más información sobre tipos de formulación véase "CATALOGUE OF PESTICIDE FORMULATION TYPES AND INTERNATIONAL CODING SYSTEM" Technical Monograph n.º 2, 5ª Edición de CropLife International (2002).

40 Los plaguicidas se aplican más frecuentemente como suspensiones o emulsiones acuosas preparadas a partir de formulaciones concentradas de dichos plaguicidas. Dichas formulaciones solubles en agua, suspendibles en agua o emulsionables, son sólidos, habitualmente conocidos como polvos humectables o granos dispersables en agua, o líquidos habitualmente conocidos como concentrados emulsionables, o suspensiones acuosas. Los polvos humectables, que pueden compactarse para formar gránulos dispersables en agua, comprenden una mezcla íntima del plaguicida, un vehículo y tensioactivos. La concentración de plaguicida es habitualmente de aproximadamente 10 % a aproximadamente 90 % en peso. El vehículo se selecciona habitualmente de entre las arcillas de atapulgita, las arcillas de montmorillonita, las tierras diatomeas o los silicatos purificados. Se encuentran tensioactivos eficaces, que comprenden de aproximadamente 0,5 % a aproximadamente 10 % del polvo humectable, entre ligninas sulfonatadas, naftalenosulfonatos condensados, naftalenosulfonatos, alquilbencenosulfonatos, alquil sulfatos y tensioactivos no iónicos tales como aductos de óxido de etileno de alquil fenoles.

55 Los concentrados emulsionables de plaguicidas comprenden una concentración conveniente de un plaguicida, tal como de aproximadamente 50 a aproximadamente 500 gramos por litro de líquido disuelto en un vehículo que es un disolvente miscible en agua o una mezcla de disolvente orgánico miscible en agua y emulsionantes. Los disolventes orgánicos útiles incluyen aromáticos, especialmente xilenos y fracciones de petróleo, especialmente las partes naftalénica y olefínica de alta temperatura de ebullición del petróleo tales como nafta aromática pesada. Otros disolventes orgánicos también pueden usarse, tales como los disolventes terpénicos incluyendo derivados de rosina,

cetonas alifáticas tales como ciclohexanona y alcoholes complejos tales como 2-etoxietanol. Se seleccionan emulsionantes adecuados para concentrados emulsibles a partir de tensioactivos aniónicos y no iónicos convencionales.

5 Las suspensiones acuosas comprenden suspensiones de plaguicidas insolubles en agua dispersados en un vehículo acuoso a una concentración en el intervalo de aproximadamente 5 % a aproximadamente 50 % en peso. Se preparan suspensiones moliendo finamente el plaguicida y mezclándolo vigorosamente en un vehículo comprendido por agua y tensioactivos. También pueden añadirse ingredientes, tales como sales inorgánicas y gomas sintéticas o naturales, para aumentar la densidad y viscosidad del vehículo acuoso. Es con frecuencia más eficaz moler y mezclar el plaguicida al mismo tiempo preparando la mezcla acuosa y homogeneizándola en un instrumento tal como un molino de arena, molino de bolas u homogeneizador de tipo pistón.

10 También pueden aplicarse plaguicidas como composiciones granulares que son particularmente útiles para aplicaciones al suelo. Las composiciones granulares habitualmente contienen de aproximadamente 0,5 % a aproximadamente 10 % en peso del plaguicida, dispersado en un vehículo que comprende arcilla o una sustancia similar. Dichas composiciones se preparan habitualmente disolviendo el plaguicida en un disolvente adecuado y aplicándolo a un vehículo granular que se ha preformado al tamaño de partícula apropiado, en el intervalo de aproximadamente 0,5 a aproximadamente 3 mm. Dichas composiciones también pueden formularse preparando una masa o pasta del vehículo y compuesto y machacando y secando para obtener el tamaño de partícula granular deseado.

20 Se preparan polvos que contienen un plaguicida mezclando íntimamente el plaguicida en forma de polvo con un vehículo agrícola en polvo adecuado, tal como arcilla de caolín, roca volcánica molida y similares. Los polvos pueden contener adecuadamente de aproximadamente 1 % a aproximadamente 10 % de plaguicida. Puede aplicarse como un tratamiento de semillas o como una aplicación a follaje con una máquina sopladora de polvo.

25 Es igualmente práctico aplicar un plaguicida en forma de una solución en un disolvente orgánico apropiado, habitualmente aceite de petróleo, tal como los aceites de pulverización, que se usan ampliamente en química agrícola.

También pueden aplicarse plaguicidas en forma de una composición de aerosol. En dichas composiciones el plaguicida se disuelve o se dispersa en un vehículo, que es una mezcla de propulsor generador de presión. La composición de aerosol se envasa en un recipiente del que se distribuye la mezcla mediante una válvula de atomización.

30 Se forman señuelos de plaguicidas cuando el plaguicida se mezcla con alimento o un atrayente o ambos. Cuando las plagas comen el señuelo también consumen el plaguicida. Los señuelos toman la forma de gránulos, geles, polvos fluidos, líquidos o sólidos. Se usan en refugios de plagas.

35 Los fumigantes son plaguicidas que tienen una presión de vapor relativamente alta y por lo tanto pueden existir como un gas en suficientes concentraciones para destruir plagas en suelo o en espacios cerrados. La toxicidad del fumigante es proporcional a su concentración y el tiempo de exposición. Se caracterizan por una buena capacidad de difusión y actúan penetrando en el sistema respiratorio de la plaga o absorbiéndose a través de la cutícula de la plaga. Los fumigantes se aplican a plagas de productos almacenados de control en láminas a prueba de gas, en habitaciones selladas con respecto a gas o edificios o en cámaras especiales.

40 Los plaguicidas pueden microencapsularse suspendiendo las partículas de plaguicidas o gotas en polímeros de plástico de diversos tipos. Alterando la química del polímero o cambiando factores en el procesamiento, pueden formarse microcápsulas de diversos tamaños, solubilidad, grosores de pared y grados de penetrabilidad. Estos factores dominan la velocidad con la que el principio activo en su interior se libera, lo que a su vez afecta al rendimiento residual, velocidad de acción y olor del producto.

45 Se realizan concentraciones de soluciones oleosas disolviendo plaguicidas en un disolvente que contendrá el plaguicida en solución. Las soluciones oleosas de un plaguicida habitualmente proporcionan reducción y destrucción de plagas más rápidas que otras formulaciones debido a que los disolventes en sí mismos tienen acción plaguicida y que la disolución de la cobertura cerosa del integumento aumenta la velocidad de captación del plaguicida. Otras ventajas de soluciones de aceite incluyen mejor estabilidad en almacenamiento, mejor penetración de grietas y mejor adhesión a superficies grasas.

50 Otra realización es una emulsión de aceite en agua, en la que la emulsión comprende glóbulos oleosos que se proporcionan cada uno con un recubrimiento de cristal líquido lamelar y se dispersan en una fase acuosa, en la que cada glóbulo oleoso comprende al menos un compuesto que es agrícolamente activo, y está recubierto individualmente con una capa monolamelar u oligolamelar que comprende: (1) al menos un agente tensioactivo lipófilo no iónico, (2) al menos un agente tensioactivo hidrófilo no iónico y (3) al menos un agente de tensioactivo iónico, en el que los glóbulos tienen un diámetro de partícula medio de menos de 800 nanómetros. Se desvela más información sobre la realización en la publicación de patente de Estados Unidos 20070027034 publicado el 1 de febrero de 2007, que tiene el número de serie de solicitud de patente 11/495.228. Para facilitar el uso esta realización se denominará "OIWE".

Para más información consúltese "INSECT PEST MANAGEMENT" 2ª Edición por D. Dent, copyright de CAB International (2000). Adicionalmente, para una información más detallada consúltese "HANDBOOK OF PEST CONTROL - THE BEHAVIOR, LIFE HISTORY y CONTROL OF HOUSEHOLD PESTS" de Arnold Mallis, 9ª Edición, copyright 2004 de GIE Media Inc.

## 5 Otros componentes de formulación

Generalmente, la invención describe es este documento cuando se usa es una formulación, tal formulación puede contener otros componentes. Estos compuestos incluyen (esta es una lista no exhaustiva y no mutuamente exclusiva) humectantes, esparcidores, adhesivos, penetrantes, tampones, agentes secuestrantes, agentes de reducción de la deriva, agentes de compatibilidad, agentes antiespumantes, agentes de limpieza y emulsionantes. Unos pocos componentes se describen de inmediato.

Un agente humectante es una sustancia que cuando se añade a un líquido aumenta el poder de difusión o penetración del líquido mediante la reducción de la tensión interfacial entre el líquido y la superficie sobre la que se está extendiendo. Los agentes humectantes se usan para dos funciones principales en formulaciones agroquímicas: durante el procesamiento y la producción para aumentar la velocidad de humectación de los polvos en agua para hacer líquidos solubles o concentrados de suspensión; y durante la mezcla de un producto con agua en un tanque de pulverización para reducir el tiempo de humectación de los polvos humectables y para mejorar la penetración de agua en los gránulos dispersables en agua. Los ejemplos de agentes humectantes en polvo humectable, concentrados de suspensión y gránulos dispersables en agua, son formulaciones: lauril sulfato sódico; dioctil sulfosuccinato sódico; etoxilatos de alquilfenol; y etoxilatos de alcohol alifático.

Un agente dispersante es una sustancia que absorbe en la superficie de unas partículas y ayuda a conservar el estado de dispersión de las partículas y les impide el reagrupamiento. Los agentes dispersantes se añaden a formulaciones agroquímicas para facilitar la dispersión y la suspensión durante la fabricación y para asegurar la redispersión de las partículas en un tanque de pulverización. Se usan ampliamente en polvos humectantes, concentrados de suspensión y gránulos dispersables en agua. Los tensioactivos que se usan como agentes dispersantes tienen la capacidad de absorber fuertemente en una superficie de la partícula y proporcionan una barrera cargada o estérica para el reagrupamiento de partículas. Los tensioactivos más comúnmente usados son aniónicos, no iónicos, o mezclas de los dos tipos. Para las formulaciones de polvos humectables, los agentes dispersantes más comunes son lignosulfonatos sódicos. Para concentrados de suspensión, se obtiene muy buena adsorción y estabilización usando polielectrolitos, tales como condensados de formaldehído de naftalen sulfonato sódicos. También se usan fosfato ésteres de etoxilato de tristirilfenol. Algunas veces se combinan no iónicos, tales como condensados de óxido de alquilariletileno y copolímeros en bloque EO-PO con aniónicos como agentes dispersantes para concentrados de suspensión. En los años recientes, se han desarrollado nuevos tipos de tensioactivos poliméricos de alto peso molecular como agentes dispersantes. Estos tienen 'cadenas principales' hidrófobas muy largas y un gran número de cadenas de óxido de etileno que forma el 'diente' de un tensioactivo 'peine'. Estos polímeros de alto peso molecular pueden dar muy buena estabilidad a largo plazo a concentrados de suspensión debido a que las cadenas principales hidrófobas tienen muchos puntos de anclaje en las superficies de las partículas. Los ejemplos de agentes dispersantes usados en formulaciones agroquímicas son: lignosulfonatos sódicos; condensados de formaldehído de naftalen sulfonato sódico; fosfato ésteres de etoxilato de tristirilfenol; etoxilatos de alcohol alifático; etoxilatos de alquilo; copolímeros en bloque EO-PO ; y copolímeros de injerto.

Un agente emulsionante es una sustancia que estabiliza una suspensión de gotitas de una fase líquida a otra fase líquida. Sin el agente emulsificante los dos líquidos se separarían en dos fases líquidas inmiscibles. Las mezclas de emulsionantes más comúnmente usadas contienen alquilfenol o alcohol alifático con doce o más unidades de óxido de etileno y la sal de calcio soluble en aceite de ácido dodecibencenosulfónico. Un intervalo de valores de equilibrio hidrófilo-lipófilo ("HLB") de 8 a 18 normalmente proporcionará buenas emulsiones estables. Algunas veces la estabilidad de la emulsión puede mejorarse por la adición de una pequeña cantidad de un tensioactivo copolímero en bloque EO-PO.

Un agente solubilizante es un tensioactivo que formará micelas en agua a concentraciones superiores a la concentración micelar crítica. Después, las micelas son capaces de disolver o solubilizar materiales insolubles en agua en el interior de la parte hidrófoba de la micela. El tipo de tensioactivo usado usualmente para la solubilización son no iónicos: monooleatos de sorbitán; etoxilatos de monooleatos de sorbitán; y ésteres de oleato de metilo.

Algunas veces se usan tensioactivos, ya sean solos o con otros aditivos, tales como aceites minerales o vegetales como adyuvantes para pulverizar mezclas de tanque para mejorar el rendimiento biológico del plaguicida en la diana. Los tipos de tensioactivos usados para la mejora biológica dependen generalmente de la naturaleza y del modo de acción del plaguicida. Sin embargo, a menudo son no iónicos, tales como: etoxilatos de alquilo; etoxilatos de alcohol alifático lineal; etoxilatos de amina alifática.

Un vehículo o diluyente en una formulación agrícola es un material añadido al plaguicida para dar un producto de la resistencia requerida. Los vehículos son usualmente materiales con altas capacidades de absorción, mientras que los diluyentes son usualmente materiales con baja capacidad de absorción. Los vehículos y diluyentes se usan en la formulación de polvos finos, polvos humectables, gránulos y gránulos dispersables en agua.

Los disolventes orgánicos se usan principalmente en la formulación de concentrados emulsionables, formulaciones ULV (volumen ultra bajo) y en menor medida las formulaciones granulares. Algunas veces se usan mezclas de los disolventes. Los primeros grupos principales de disolventes son aceites parafínicos alifáticos, tales como queroseno o parafinas refinadas. El segundo grupo principal y el más común comprende, los disolventes aromáticos, tales como xileno y fracciones de peso molecular más altos de disolventes aromáticos C9 y C10. Los hidrocarburos clorados se usan como codisolventes para evitar la cristalización de los plaguicidas cuando la formulación se emulsiona en agua. Algunas veces, los alcoholes se usan como codisolventes para aumentar el poder disolvente.

Principalmente se usan agentes espesantes y gelificantes en la formulación de concentrados de suspensión, emulsiones y suspoemulsiones para modificar las propiedades reológicas o de caudal del líquido y para evitar la separación y sedimentación de las partículas o gotitas dispersas. Los agentes espesantes, gelificantes y antisedimentación se dividen en dos categorías, a saber, partículas insolubles en agua y polímeros solubles en agua. Es posible producir formulaciones de concentrados de suspensión usando arcillas y sílices. Los ejemplos de estos tipos de materiales, incluyen, pero sin limitación, montmorillonita, p. ej. bentonita; silicato de magnesio y aluminio; y atapulgita. Han sido usados polisacáridos solubles en agua como agentes espesantes-gelificantes durante muchos años. Los tipos de polisacáridos usados más comúnmente son extractos naturales de semillas y algas marinas o son derivados sintéticos de celulosa. Los ejemplos de estos tipos de materiales incluyen, pero sin limitación, goma guar; goma de algarrobo; carragenanos; alginatos; metil celulosa; carboximetil celulosa sódica (SCMC); hidroxietil celulosa (HEC). Otros tipos de agentes antisedimentación se basan en almidones modificados, poliácridatos, alcohol polivinílico y óxido de polietileno. Otro buen agente antisedimentación es goma xanthan.

Los microorganismos causan el deterioro de los productos formulados. Por lo tanto agentes conservantes se usan para eliminar o reducir su efecto. Los ejemplos de tales agentes incluyen: ácido propiónico y su sal sódica; ácido sórbico y sus sales sódicas o potásicas; ácido benzoico y su sal sódica; sal sódica del ácido *p*-hidroxibenzoico; *p*-hidroxibenzoato de metilo; y 1,2-benzisotiazalin-3-ona (BIT).

La presencia de tensioactivos, que bajan la tensión interfacial, a menudo hace que las formulaciones a base de agua espumen durante las operaciones de producción y en la aplicación de muestra a través de un tanque de pulverización. Para reducir la tendencia a espumar, a menudo se añaden agentes antiespumantes ya sea, durante la etapa de producción o antes del llenado en botellas. Generalmente, hay dos tipos de agentes antiespumantes, a saber, siliconas y no siliconas. Las siliconas son usualmente emulsiones acuosas de polisiloxano de dimetilo, mientras que los agentes antiespumante no de silicona son aceites insolubles en agua, tal como octanol y nonanol o sílice. En ambos casos, la función del agente antiespumante es desplazar el tensioactivo de la interfaz aire-agua.

Para información adicional, véase "CHEMISTRY AND TECHNOLOGY OF AGROCHEMICAL FORMULATIONS" editada por D.A. Knowles, copyright, 1998 de Kluwer Academic Publishers. También véase "INSECTICIDES IN AGRICULTURE AND ENVIRONMENT - RETROSPECTS AND PROSPECTS" de A.S. Perry, I. Yamamoto, I. Ishaaya and R. Perry, copyright, 1998 de Springer-Verlag.

### 35 **Aplicaciones**

La cantidad real de plaguicida para aplicar a loci de plagas generalmente no es crítica y puede determinarse fácilmente por los expertos en la materia. En general, se espera que concentraciones de aproximadamente 0,01 gramos de plaguicida por hectárea a aproximadamente 5000 gramos de plaguicida por hectárea proporcionen un buen control.

El locus en el que se aplica un plaguicida puede ser cualquier locus inhabitado por una plaga, por ejemplo, cultivos vegetales, árboles frutales y de frutas con cáscara, vides, plantas ornamentales, animales domesticados, el interior o exterior de superficies de edificios, y el suelo alrededor de edificios. El control de plagas generalmente significa que las poblaciones, la actividad o ambas de las plagas se reducen en un locus. Esto puede suceder cuando: las poblaciones de plagas se expulsan de un locus; cuando las plagas se incapacitan en o cerca de un locus; o las plagas se exterminan, completamente o en parte en o en torno a un locus. Por supuesto puede producirse una combinación de estos resultados. En general, las poblaciones de plagas, su actividad, o ambas, se reducen convenientemente más del cincuenta por ciento, preferentemente más del 90 por ciento.

En general, con señuelos, los señuelos se colocan en el suelo, donde, por ejemplo, las termitas pueden entrar en contacto con el señuelo. También pueden aplicarse señuelos en la superficie de un edificio, (superficie horizontal, vertical o inclinada) en la que, por ejemplo, las hormigas, las termitas, las cucarachas y las moscas pueden entrar en contacto con el señuelo.

Debido a la capacidad única de los huevos de algunas plagas para resistir a plaguicidas pueden ser deseables aplicaciones repetidas para combatir larvas de nueva emergencia.

Puede utilizarse movimiento sistémico de plaguicida en plantas para combatir plagas en una parte de la planta aplicando los plaguicidas a una parte diferente de la planta. Por ejemplo, puede controlarse el control de insectos de alimentación foliar mediante irrigación por goteo o aplicación en el surco, o tratando la semilla antes de plantar. Puede aplicarse tratamiento de semillas a todos los tipos de semillas, incluyendo de las que germinarán plantas genéticamente transformadas para expresar rasgos especializados. Los ejemplos representativos incluyen los que

5 expresan proteínas tóxicas para plagas de invertebrados, tales como *Bacillus thuringiensis* u otras toxinas insecticidas, las que expresan resistencia herbicida, tales como semilla "Roundup Ready", o las que tienen genes ajenos "apilados" que expresan toxinas insecticidas, resistencia a herbicida, potenciación de la nutrición o cualquier otro rasgo beneficioso. Además, dichos tratamientos de semillas con la invención desvelada en el presente documento pueden potenciar adicionalmente la capacidad de una planta para soportar mejor las condiciones de crecimiento tensas. Esto da como resultado una planta más sana, más vigorosa, que puede conducir a mayores rendimientos en el momento de la cosecha.

10 Debería ser fácilmente evidente que la invención puede usarse con plantas genéticamente transformadas para expresar rasgos especializados, tales como *Bacillus thuringiensis* u otras toxinas e insecticidas, o las que expresan resistencia a herbicida, o las que tienen genes ajenos "apilados" y expresan toxinas insecticidas, resistencia a herbicida, potenciación de la nutrición o cualquier otro rasgo beneficioso.

15 La invención desvelada en este documento es adecuada para combatir endoparásitos y ectoparásitos en el sector de la medicina veterinaria o en el campo de la cría de animales. Se aplican compuestos de una manera conocida, tal como por administración oral en forma de, por ejemplo, comprimidos, cápsulas, bebidas, gránulos por aplicación dérmica en forma de, por ejemplo, goteo, pulverización, vertido, aplicación puntual y espolvoreo, y por administración parenteral en forma de, por ejemplo, una inyección.

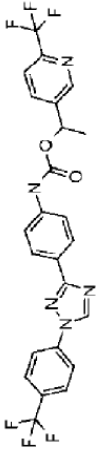
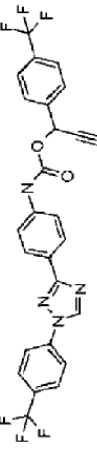
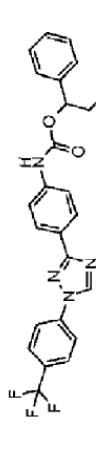
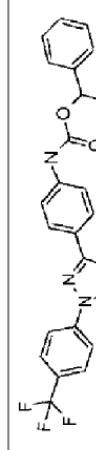
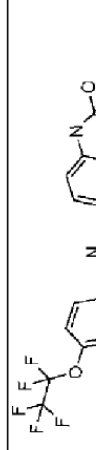
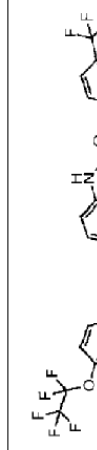
20 La invención desvelada en este documento también puede emplearse provechosamente en la cría de ganado, por ejemplo, vacas, ovejas, cerdos, pollos y gansos. Se administran formulaciones adecuadas por vía oral a los animales con el agua para beber o el pienso. Las dosificaciones y formulaciones que son adecuadas dependen de la especie.

Los encabezamientos de este documento son solamente por conveniencia y no deben usarse para interpretar cualquier parte del mismo.

Tabla 1

n.º	Estructura	IR (cm <sup>-1</sup> )	EM	pf (°C)	RMN <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> , δ) <sup>1</sup>
<b>2</b>			551,1 (M-H)	108-124	8,55 (s, 1H), 8,15 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,80 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,55 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,39 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 6,90 (s, 1H), 5,17 (dd, J = 9,5, 3,4 Hz, 1H), 4,73 (d, J = 1,9 Hz, 1H), 3,79-3,62 (m, 2H), 3,51 (s, 3H), 3,49 (s, 3H), 3,39 (s, 3H), 3,28 (t, J = 9,4 Hz, 1H), 1,35 (d, J = 6,3 Hz, 3H)
<b>4</b>			459 (M-H)	151-155	8,54 (s, 1H), 8,14 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 7,79 (d, J = 8,9 Hz, 2H), 7,55-7,48 (m, 2H), 7,37 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 6,77-6,73 (m, 1H), 2,18-1,06 (m, 10H), 1,00-0,93 (m, 3H)
<b>5</b>			449 (M-H)	136-138	8,53 (s, 1H), 8,12 (d, J = 7,9 Hz, 2H), 7,79 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,46 (d, J = 8,9 Hz, 2H), 7,37 (d, J = 9,1 Hz, 2H), 6,70 (s, 1H), 3,59 (s, 2H), 3,42 (s, 3H), 1,54 (s, 6H)
<b>6</b>			447 (M-H)	161-164	8,53 (s, 1H), 8,12 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,2 Hz, 2H), 7,47 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,37 (d, J = 8,9 Hz, 2H), 6,61 (s, 1H), 1,84-1,77 (m, 2H), 1,51 (s, 6H), 1,46-1,32 (m, 2H), 0,95 (t, J = 7,3 Hz, 3H)
<b>7</b>		3334, 1758, 1740, 1725, 1616, 1517	590 (M+H), 588 (M-H)		8,60 (s, 1H), 8,16 (s, 1H), 8,05 (d, J = 9,1 Hz, 2H), 7,77 (d, J = 9,1 Hz, 2H), 7,57 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,35 (d, J = 8,9 Hz, 2H), 5,81 (s, 1H), 4,37 (q, J = 7,1 Hz, 2H), 1,43 (s, 6H), 1,37 (t, J = 7,1 Hz, 3H)
<b>8</b>			473 (M-H)	170-173	8,54 (s, 1H), 8,15 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 7,79 (d, J = 9,1 Hz, 2H), 7,48 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,37 (d, J = 8,9 Hz, 2H), 6,80 (a, 1H), 1,78 (s, 6H)
<b>10</b>			457 (M+H)	203-207	8,55 (s, 1H), 8,14 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,80 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,50 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,39 (d, J = 8,9 Hz, 2H), 6,65 (s, 1H), 5,17-4,92 (m, 1H), 1,32 (d, J = 6,3 Hz, 3H)

n.º	Estructura	IR (cm <sup>-1</sup> )	EM	pf (°C)	RMN <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> , δ)
17			479 (M+H)	88-90	8,55 (s, 1H), 8,13 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,79 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,51 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 7,38 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 6,87 (s, 1H), 5,41-5,21 (m, 1H), 4,16 (qd, J = 7,1, 1,2 Hz, 2H), 2,71 (dd, J = 15,4, 7,5 Hz, 1H), 2,57 (dd, J = 15,4, 5,6 Hz, 1H), 1,39 (d, J = 6,3 Hz, 3H), 1,26 (t, J = 7,1 Hz, 3H)
18			495 (M+H), 493(M-H)	72-75	8,54 (s, 1H), 8,12 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,79 (d, J = 8,9 Hz, 2H), 7,48 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,38 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 6,79 (s, 1H), 3,69 (dd, J = 5,5, 3,9 Hz, 2H), 3,68 (s, 2H), 3,56 (dd, J = 5,8, 3,5 Hz, 2H), 3,37 (s, 3H), 1,54 (s, 6H)
19			433 (M+H), 431 (M-H)	163-165	8,53 (s, 1H), 8,10 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 7,77 (d, J = 8,9 Hz, 2H), 7,48 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 7,36 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 6,77 (s, 1H), 6,18 (dd, J = 17,5, 10,9 Hz, 1H), 5,23 (d, J = 17,5 Hz, 1H), 5,13 (d, J = 10,9 Hz, 1H), 1,59 (s, 6H)
20			479 (M+H), 477 (M-H)	151-154	8,54 (s, 1H), 8,12 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 8,9 Hz, 2H), 7,48 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 7,37 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 6,89 (s, 1H), 4,25 (q, J = 7,2 Hz, 2H), 1,64 (s, 6H), 1,28 (t, J = 7,1 Hz, 3H)
21			483 (M+H)	174-177	8,52 (s, 1H), 8,09 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,77 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,54-7,32 (m, 8H), 7,31-7,18 (m, 1H), 6,82 (s, 1H), 1,85 (s, 6H)
22			513 (M+H), 511 (M-H)	131-133	8,54 (s, 1H), 8,13 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,2 Hz, 2H), 7,49 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 7,38 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 7,15 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 6,84 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 6,73 (s, 1H), 5,17-5,04 (m, 1H), 3,78 (s, 3H), 2,96 (dd, J = 13,8, 6,3 Hz, 1H), 2,77 (dd, J = 13,8, 6,7 Hz, 1H), 1,28 (d, J = 6,3 Hz, 3H)
25			421 (M+H), 419 (M-H)	177-179	8,54 (s, 1H), 8,11 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,48 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,37 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 6,64 (s, 1H), 1,53 (s, 9H)

n.º	Estructura	IR (cm <sup>-1</sup> )	EM	pf (°C)	RMN <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> , δ) <sup>1</sup>
<b>28</b>			HRMS-FAB ( <i>m/z</i> ) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>24</sub> H <sub>17</sub> F <sub>8</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub> , 521,129; encontrado, 521,1286	164,5- 167,0	8,78 (d, <i>J</i> = 2,0 Hz, 1H), 8,63 (s, 1H), 8,14 (d, <i>J</i> = 8,8 Hz, 2H), 7,91 (m, 3H), 7,80 (d, <i>J</i> = 8,6 Hz, 2H), 7,71-7,66 (m, 1H), 7,49 (d, <i>J</i> = 8,7 Hz, 2H), 6,96 (s, 1H), 5,99 (q, <i>J</i> = 6,7 Hz, 1H), 1,66 (d, <i>J</i> = 6,7 Hz, 3H)
<b>29</b>			HRMS-FAB ( <i>m/z</i> ) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>26</sub> H <sub>16</sub> F <sub>8</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> , 530,118; encontrado, 530,1175	177,5- 179,5	8,64 (s, 1H), 8,16 (d, <i>J</i> = 8,7 Hz, 2H), 7,90 (d, <i>J</i> = 8,5 Hz, 2H), 7,79 (d, <i>J</i> = 8,6 Hz, 2H), 7,75-7,64 (m, 4H), 7,51 (d, <i>J</i> = 8,7 Hz, 2H), 6,93 (s, 1H), 6,56 (d, <i>J</i> = 2,3 Hz, 1H), 2,77 (d, <i>J</i> = 2,3 Hz, 1H)
<b>30</b>			HRMS-FAB ( <i>m/z</i> ) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>25</sub> H <sub>21</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> , 466,162; encontrado, 466,1619	152- 154	8,69 (s, 1H), 8,13 (d, <i>J</i> = 8,7 Hz, 2H), 7,90 (d, <i>J</i> = 8,5 Hz, 2H), 7,78 (d, <i>J</i> = 8,6 Hz, 2H), 7,50 (d, <i>J</i> = 8,7 Hz, 2H), 7,41-7,34 (m, 4H), 7,33-7,27 (m, 1H), 6,86 (s, 1H), 5,68 (t, <i>J</i> = 6,9 Hz, 1H), 2,01 (dq, <i>J</i> = 22,1, 7,4 Hz, 1H), 1,95-1,82 (m, 1H), 0,95 (t, <i>J</i> = 7,4 Hz, 3H)
<b>31</b>			HRMS-FAB ( <i>m/z</i> ) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>25</sub> H <sub>17</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub> , 462,130; encontrado, 462,1305	170- 173	8,63 (s, 1H), 8,15 (d, <i>J</i> = 8,7 Hz, 2H), 7,89 (d, <i>J</i> = 8,5 Hz, 2H), 7,78 (d, <i>J</i> = 8,6 Hz, 2H), 7,60 (dd, <i>J</i> = 7,7, 1,8 Hz, 2H), 7,51 (d, <i>J</i> = 8,6 Hz, 2H), 7,45-7,32 (m, 3H), 6,90 (s, 1H), 6,52 (d, <i>J</i> = 2,2 Hz, 1H), 2,73 (d, <i>J</i> = 2,3 Hz, 1H)
<b>32</b>			HRMS-FAB ( <i>m/z</i> ) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>21</sub> H <sub>18</sub> ClF <sub>5</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 504,0988; encontrado, 504,1002	181- 184	8,55 (s, 1H), 8,13 (d, <i>J</i> = 8,7 Hz, 2H), 7,80 (d, <i>J</i> = 9,0 Hz, 2H), 7,48 (d, <i>J</i> = 8,7 Hz, 2H), 7,38 (d, <i>J</i> = 8,9 Hz, 2H), 6,75 (s, 1H), 3,89 (s, 2H), 1,61 (s, 6H)
<b>33</b>			588 ([M+H] <sup>+</sup> ), 586 ([M-H] <sup>-</sup> )	173- 175	8,78 (d, <i>J</i> = 1,9 Hz, 1H), 8,55 (s, 1H), 8,14 (d, <i>J</i> = 8,8 Hz, 2H), 7,89 (dd, <i>J</i> = 8,1, 2,1 Hz, 1H), 7,79 (d, <i>J</i> = 9,1 Hz, 2H), 7,74-7,65 (m, 1H), 7,48 (d, <i>J</i> = 8,7 Hz, 2H), 7,38 (d, <i>J</i> = 9,0 Hz, 2H), 6,89 (s, 1H), 5,99 (q, <i>J</i> = 6,7 Hz, 1H), 1,66 (d, <i>J</i> = 6,7 Hz, 3H)



n.º	Estructura	IR (cm <sup>-1</sup> )	EM	pf (°C)	RMN <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> , δ)
34		(película delgada) 3230,3114, 3063,2974, 2941, 1719, 1615, 1516, 1445, 1416, 1315, 1225 1137, 1092, 1051,985, 843	HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>26</sub> H <sub>21</sub> F <sub>5</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 532,153; encontrado, 532,1539		8,89 (s, 1H), 8,14 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,85 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,51 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,38 (dd, J = 9,6, 6,7 Hz, 6H), 7,33-7,26 (m, 1H), 6,89 (s, 1H), 5,68 (t, J = 6,9 Hz, 1H), 2,08-1,94 (m, 1H), 1,94-1,81 (m, 1H), 0,94 (t, J = 7,4 Hz, 3H)
35			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>24</sub> H <sub>18</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 594,0376; encontrado, 594,0411	139- 142,5	8,54 (s, 1H), 8,12 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,70 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,48 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 7,38 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,15 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 6,79 (s, 1H), 5,84 (q, J = 6,6 Hz, 1H), 1,59 (d, J = 6,7 Hz, 3H)
36			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>27</sub> H <sub>20</sub> F <sub>3</sub> N <sub>5</sub> O <sub>3</sub> , 519,1518; encontrado, 519,1527	157,5- 159	8,53 (s, 1H), 8,19 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 8,12 (app d, J = 8,7 Hz, 3H), 7,81 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 7,78 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,72 (ddd, J = 8,4, 6,9, 1,4 Hz, 1H), 7,58-7,47 (m, 4H), 7,37 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,01 (s, 1H), 6,12 (q, J = 6,7 Hz, 1H), 1,76 (d, J = 6,7 Hz, 3H)
37			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>24</sub> H <sub>21</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 484,1591; encontrado, 484,1589	152,5- 155	8,54 (s, 1H), 8,11 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,1 Hz, 2H), 7,57 (t, J = 7,7 Hz, 1H), 7,50 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,37 (dd, J = 9,0, 0,7 Hz, 2H), 7,17 (d, J = 7,7 Hz, 1H), 7,07 (d, J = 7,7 Hz, 1H), 6,99 (s, 1H), 5,91 (q, J = 6,7 Hz, 1H), 2,57 (s, 3H), 1,65 (d, J = 6,7 Hz, 3H)
38			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>27</sub> H <sub>25</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 510,1879; encontrado, 510,1889	149- 151	8,52 (s, 1H), 8,12 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,1 Hz, 2H), 7,49 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,40-7,35 (m, 2H), 7,33 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 7,23 (d, J = 8,1 Hz, 2H), 6,76 (s, 1H), 5,91 (q, J = 6,6 Hz, 1H), 2,97-2,85 (m, 1H), 1,62 (d, J = 6,6 Hz, 3H), 1,25 (d, J = 6,9 Hz, 6H)
39		(película delgada) 3317, 1723, 1518, 1263, 1224, 1071	HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>24</sub> H <sub>18</sub> BrF <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 546,0514; encontrado, 546,0513		8,53 (s, 1H), 8,13 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,1 Hz, 2H), 7,53-7,42 (m, 4H), 7,38 (dd, J = 9,0, 0,7 Hz, 2H), 7,28 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 6,76 (s, 1H), 5,87 (q, J = 6,6 Hz, 1H), 1,60 (d, J = 6,6 Hz, 3H)

n.º	Estructura	IR (cm <sup>-1</sup> )	EM	pf (°C)	RMN <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> , δ)
40			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>28</sub> H <sub>27</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 524,2035; encontrado, 524,2058	189- 190,5	8,53 (s, 1H), 8,12 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,1 Hz, 2H), 7,49 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,43-7,31 (m, 6H), 6,79 (s, 1H), 5,92 (q, J = 6,6 Hz, 1H), 1,62 (d, J = 6,6 Hz, 3H), 1,32 (s, 9H)
41			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>24</sub> H <sub>17</sub> F <sub>6</sub> N <sub>5</sub> O <sub>3</sub> , 537,124; encontrado, 537,1235	154- 156	8,78 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 8,54 (s, 1H), 8,13 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,89 (dd, J = 8,1, 2,0 Hz, 1H), 7,78 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,69 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 7,48 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 7,37 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 6,94 (s, 1H), 5,99 (q, J = 6,6 Hz, 1H), 1,66 (d, J = 6,7 Hz, 3H)
42			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>25</sub> H <sub>18</sub> F <sub>6</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 536,128; encontrado, 536,1284	128- 131	(400 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) 10,11 (s, 1H), 9,36 (s, 1H), 8,05 (d, J = 9,1 Hz, 2H), 8,01 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,77 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 7,65 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 7,60 (d, J = 8,6 Hz, 4H), 5,90 (q, J = 6,5 Hz, 1H), 1,57 (d, J = 6,6 Hz, 3H)
43		(película delgada) 3318, 1734, 1519, 1327, 1265, 1220	HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>30</sub> H <sub>20</sub> F <sub>6</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 598,144; encontrado, 598,1445		8,54 (s, 1H), 8,14 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,1 Hz, 2H), 7,63 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 7,55-7,47 (m, 4H), 7,42-7,30 (m, 7H), 6,95 (s, 1H), 6,94 (s, 1H)
44			493 ([M+H] <sup>+</sup> ), 491 ([M-H] <sup>-</sup> )	132- 134,5	8,53 (s, 1H), 8,13 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,53-7,43 (m, 4H), 7,41-7,32 (m, 4H), 6,78 (s, 1H), 5,90 (q, J = 6,6 Hz, 1H), 3,07 (s, 1H), 1,60 (d, J = 6,6 Hz, 3H)
45			494 ([M+H] <sup>+</sup> ), 492 ([M-H] <sup>-</sup> )	186,5- 187,5	8,54 (s, 1H), 8,14 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,67 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,55-7,43 (m, 4H), 7,38 (dd, J = 8,9, 0,6 Hz, 2H), 6,81 (s, 1H), 5,92 (q, J = 6,6 Hz, 1H), 1,61 (d, J = 6,7 Hz, 3H)
46			470 ([M+H] <sup>+</sup> ), 468 ([M-H] <sup>-</sup> )	143- 145	8,61 (ddd, J = 4,8, 1,6, 0,8 Hz, 1H), 8,54 (s, 1H), 8,11 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,1 Hz, 2H), 7,69 (td, J = 7,7, 1,8 Hz, 1H), 7,49 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,41-7,32 (m, 3H), 7,22 (ddd, J = 7,5, 4,9, 1,1 Hz, 1H), 7,08 (s, 1H), 5,95 (q, J = 6,6 Hz, 1H), 1,66 (d, J = 6,7 Hz, 3H)

n.º	Estructura	IR (cm <sup>-1</sup> )	EM	pf (°C)	RMN <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> , δ) <sup>a</sup>
47			484 ([M+H] <sup>+</sup> ), 482 ([M-H] <sup>-</sup> )	55-75	8,93 (d, J = 1,6 Hz, 1H), 8,55 (s, 1H), 8,14 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 8,07 (dd, J = 8,2, 2,0 Hz, 1H), 7,79 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,50 (app t, J = 8,9 Hz, 3H), 7,42-7,34 (m, 2H), 7,06 (s, 1H), 5,98 (q, J = 6,6 Hz, 1H), 2,80 (s, 3H), 1,67 (d, J = 6,7 Hz, 3H)
48		(película delgada) 3243, 1731, 1607, 1548, 1518, 1445, 1416, 1313, 1228	470 ([M+H] <sup>+</sup> ), 468 ([M-H] <sup>-</sup> )		(400 MHz, CD <sub>3</sub> OD) 9,03 (s, 1H), 8,51 (dd, J = 4,6, 1,6 Hz, 2H), 8,02 (d, J = 8,9 Hz, 2H), 7,94 (d, J = 9,1 Hz, 2H), 7,54 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,45 (ddd, J = 9,6, 6,8, 1,0 Hz, 4H), 5,86 (q, J = 6,6 Hz, 1H), 1,58 (d, J = 6,7 Hz, 3H)
49			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>26</sub> H <sub>20</sub> F <sub>6</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 550,144; encontrado, 550,146	168,5- 171	8,51 (s, 1H), 8,10 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,76 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,60 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,52 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,44 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,39-7,31 (m, 2H), 6,89 (s, 1H), 1,84 (s, 6H)
50			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>24</sub> H <sub>16</sub> F <sub>8</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 522,1127; encontrado, 522,1139	166,5- 168	8,53 (s, 1H), 8,15 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,1 Hz, 2H), 7,64 (d, J = 8,1 Hz, 2H), 7,57-7,45 (m, 4H), 7,37 (dd, J = 9,0, 0,8 Hz, 2H), 6,92 (s, 1H), 5,27 (s, 2H)
51			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>24</sub> H <sub>17</sub> FN <sub>5</sub> O <sub>4</sub> , 553,1185; encontrado, 553,1191	199- 202,5	(300 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) 10,16 (s, 1H), 9,36 (s, 1H), 8,59 (s, 1H), 8,10-7,95 (m, 5H), 7,68-7,50 (m, 5H), 5,86 (q, J = 6,5 Hz, 1H), 1,58 (d, J = 6,6 Hz, 3H)
52			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>24</sub> H <sub>15</sub> C <sub>1</sub> F <sub>6</sub> N <sub>5</sub> O <sub>3</sub> , 513,0816; encontrado, 513,0832	156,5- 158	(300 MHz, acetona-d <sub>6</sub> ) 9,18 (s, 1H), 9,13 (s, 1H), 8,66 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,16 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 8,13-8,06 (m, 3H), 7,71 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,63-7,52 (m, 3H), 6,63 (d, J = 2,3 Hz, 1H), 3,46 (d, J = 23 Hz, 1H)
53			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>25</sub> H <sub>15</sub> C <sub>1</sub> F <sub>6</sub> N <sub>5</sub> O <sub>3</sub> , 547,1079; encontrado, 547,1098	177- 179	(300 MHz, acetona-d <sub>6</sub> ) 9,24 (s, 1H), 9,13 (s, 1H), 9,02 (d, J = 1,9 Hz, 1H), 8,33 (dd, J = 8,1, 2,1 Hz, 1H), 8,16 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 8,10 (d, J = 9,1 Hz, 2H), 7,97 (d, J = 8,2 Hz, 1H), 7,72 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,63-7,52 (m, 2H), 6,74 (d, J = 2,3 Hz, 1H), 3,51 (d, J = 2,3 Hz, 1H)

n.º	Estructura	IR (cm <sup>-1</sup> )	EM	pf (°C)	RMN <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> , δ)
54		(película delgada) 3248, 3111, 3062, 1728, 1608, 1518, 1445, 1417, 1262, 1223, 1053	HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>21</sub> H <sub>15</sub> ClF <sub>3</sub> NO <sub>3</sub> O <sub>3</sub> , 509,054; encontrado, 509,0531		8,54 (s, 1H), 8,14 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,55 (s, 1H), 7,49 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 7,38 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 6,83 (s, 1H), 6,09 (q, J = 6,6 Hz, 1H), 1,71 (d, J = 6,6 Hz, 3H)
55		(película delgada) 3307, 3119, 2986, 2950, 1725, 1611, 1517, 1495, 1445, 1416, 1257, 1215	HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>22</sub> H <sub>20</sub> F <sub>3</sub> N <sub>5</sub> O <sub>4</sub> , 499,147; encontrado, 499,1463		8,53 (s, 1H), 8,22 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,12 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,63 (dd, J = 8,6, 2,5 Hz, 1H), 7,48 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,42-7,32 (m, 2H), 6,81 (s, 1H), 6,75 (d, J = 8,6 Hz, 1H), 5,89 (q, J = 6,6 Hz, 1H), 3,93 (s, 3H), 1,61 (d, J = 6,6 Hz, 3H)
56		(película delgada) 3259, 3117, 3062, 2986, 1729, 1597, 1518, 1445, 1417, 1263, 1225	HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>23</sub> H <sub>17</sub> ClF <sub>3</sub> N <sub>5</sub> O <sub>3</sub> , 503,097; encontrado, 503,0970		8,54 (s, 1H), 8,45 (d, J = 2,5 Hz, 1H), 8,13 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,1 Hz, 2H), 7,68 (dd, J = 8,3, 2,5 Hz, 1H), 7,48 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 7,37 (dd, J = 8,9, 0,6 Hz, 2H), 7,33 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 6,97 (s, 1H), 5,91 (q, J = 6,6 Hz, 1H), 1,62 (d, J = 6,7 Hz, 3H)
57			539 ([M+H] <sup>+</sup> ), 537 ([M-H] <sup>-</sup> )	185- 187	8,94 (s, 2H), 8,55 (s, 1H), 8,15 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,48 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 7,36 (d, J = 0,7 Hz, 2H), 6,91 (s, 1H), 6,01 (q, J = 6,7 Hz, 1H), 1,71 (d, J = 6,8 Hz, 3H)
58		(película delgada) 3295, 3120, 3066, 3036, 2934, 2894, 1728, 1597, 1518, 1493, 1445, 1263, 1223	HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>25</sub> H <sub>21</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>4</sub> , 498,152; encontrado, 498,1511		8,54 (s, 1H), 8,11 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,49 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,44-7,31 (m, 7H), 6,97 (s, 1H), 5,99 (dd, J = 8,0, 3,6 Hz, 1H), 3,80 (dd, J = 10,9, 8,0 Hz, 1H), 3,63 (dd, J = 10,9, 3,7 Hz, 1H), 3,43 (s, 3H)
59			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>24</sub> H <sub>19</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 468,140; encontrado, 468,141	136 138	8,53 (s, 1H), 8,12 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,49 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 7,45-7,34 (m, 6H), 7,34-7,28 (m, 1H), 6,82 (s, 1H), 5,92 (q, J = 6,6 Hz, 1H), 1,62 (d, J = 6,6 Hz, 3H)
60			469 ([M+H] <sup>+</sup> )	122,5- 125,0	8,54 (s, 1H), 8,12 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,50 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 7,46-7,34 (m, 6H), 7,34-7,28 (m, 1H), 6,78 (s, 1H), 5,92 (q, J = 6,6 Hz, 1H), 1,63 (d, J = 6,6 Hz, 3H)

n.º	Estructura	IR (cm <sup>-1</sup> )	EM	pf (°C)	RMN <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> , δ) <sup>a</sup>
<b>61</b>			469 ([M+H] <sup>+</sup> )	123,5- 125,0	8,53 (s, 1H), 8,12 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,49 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,44-7,34 (m, 6H), 7,34-7,28 (m, 1H), 6,81 (s, 1H), 5,92 (q, J = 6,6 Hz, 1H), 1,62 (d, J = 6,6 Hz, 3H)
<b>62</b>		(película delgada) 3320, 3120, 2973, 2938, 1722, 1596, 1518, 1490, 1445, 1416, 1314, 1263, 1222, 1051, 732	562 ([M+H] <sup>+</sup> )		8,53 (s, 1H), 8,12 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,2 Hz, 2H), 7,58-7,40 (m, 4H), 7,37 (dd, J = 9,0, 0,8 Hz, 2H), 7,28-7,14 (m, 2H), 6,85 (s, 1H), 5,62 (t, J = 6,9 Hz, 1H), 2,11-1,73 (m, 2H), 0,93 (t, J = 7,4 Hz, 3H)
<b>63</b>		(película delgada) 3318, 3121, 3064, 2973, 2938, 1720, 1596, 1518, 1491, 1445, 1416, 1313, 1263, 1222, 1051, 909, 732	HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>25</sub> H <sub>20</sub> BrF <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 560,067; encontrado, 560,0672		8,54 (s, 1H), 8,12 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,54-7,47 (m, 3H), 7,43 (ddd, J = 7,7, 1,9, 1,4 Hz, 1H), 7,37 (dd, J = 9,0, 0,8 Hz, 2H), 7,29 (dt, J = 7,9, 1,5 Hz, 1H), 7,22 (t, J = 7,7 Hz, 1H), 6,90 (s, 1H), 5,62 (t, J = 6,8 Hz, 1H), 2,08-1,74 (m, 2H), 0,94 (t, J = 7,4 Hz, 3H)
<b>64</b>			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>25</sub> H <sub>18</sub> F <sub>6</sub> N <sub>4</sub> O <sub>4</sub> , 552,123; encontrado, 552,1230	110- 113	8,54 (s, 1H), 8,13 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,49 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,43 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 7,38 (dd, J = 9,0, 0,8 Hz, 2H), 7,22 (dd, J = 8,7, 0,8 Hz, 2H), 6,81 (s, 1H), 5,91 (q, J = 6,6 Hz, 1H), 1,61 (d, J = 6,6 Hz, 3H)
<b>65</b>		(película delgada) 3229, 3181, 3108, 3048, 1742, 1600, 1541, 1519, 1441, 1417, 1310, 1248, 1222, 1083, 985, 843	HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>25</sub> H <sub>20</sub> ClF <sub>3</sub> N <sub>4</sub> CO <sub>3</sub> , 516,118; encontrado, 516,1174		8,54 (s, 1H), 8,13 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,50 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,40-7,34 (m, 3H), 7,31-7,19 (m, 3H), 6,86 (s, 1H), 5,64 (t, J = 6,9 Hz, 1H), 2,08-1,74 (m, 2H), 0,94 (t, J = 7,4 Hz, 3H)
<b>66</b>		(película delgada) 3250, 3117, 3061, 2126, 1735, 1610, 1549, 1519, 1492, 1445, 1417, 1328, 1263, 1220, 1068, 1050, 848	HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>25</sub> H <sub>16</sub> F <sub>6</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 546,113; encontrado, 546,1125		8,55 (s, 1H), 8,15 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,83-7,75 (m, 2H), 7,75-7,64 (m, 4H), 7,51 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,43-7,34 (m, 2H), 6,90 (s, 1H), 6,56 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 2,76 (d, J = 2,4 Hz, 1H)

n.º	Estructura	IR (cm <sup>-1</sup> )	EM	pf (°C)	RMN <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> , δ)
67			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>26</sub> H <sub>20</sub> F <sub>6</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 550,144; encontrado, 550,1440	161,5- 163,0	8,54 (s, 1H), 8,13 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,63 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 7,49 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 7,48 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 7,43-7,27 (m, 2H), 6,85 (s, 1H), 5,71 (t, J = 6,8 Hz, 1H), 2,11-1,73 (m, 2H), 0,96 (t, J = 7,4 Hz, 3H)
68			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>25</sub> H <sub>18</sub> F <sub>6</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 536,128; encontrado, 536,1282	118- 119,5	8,54 (s, 1H), 8,13 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,67 (s, 1H), 7,63-7,55 (m, 2H), 7,54-7,46 (m, 3H), 7,38 (dd, J = 9,0, 0,7 Hz, 2H), 6,85 (s, 1H), 5,96 (q, J = 6,6 Hz, 1H), 1,63 (d, J = 6,6 Hz, 3H)
69			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>25</sub> H <sub>18</sub> F <sub>6</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 536,128; encontrado, 536,1282	171,5- 173,5	8,53 (s, 1H), 8,11 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,1 Hz, 2H), 7,67 (app t, J = 7,0 Hz, 2H), 7,58 (dd, J = 11,3, 3,9 Hz, 1H), 7,49 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,44-7,32 (m, 3H), 6,85 (s, 1H), 6,27 (q, J = 6,5 Hz, 1H), 1,61 (d, J = 6,5 Hz, 3H)
70			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>25</sub> H <sub>19</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 480,141; encontrado, 480,1411	118- 121	8,54 (s, 1H), 8,13 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,51 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,46-7,30 (m, 7H), 6,89 (s, 1H), 6,29 (d, J = 5,9 Hz, 1H), 6,09 (ddd, J = 17,0, 10,4, 5,9 Hz, 1H), 5,38 (dt, J = 17,2, 1,3 Hz, 1H), 5,31 (dt, J = 10,5, 1,2 Hz, 1H)
71			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>17</sub> H <sub>25</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 510,188; encontrado, 510,1884	146,5- 148,5	8,53 (s, 1H), 8,11 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,49 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,41-7,33 (m, 6H), 7,32-7,27 (m, 1H), 6,83 (s, 1H), 5,74 (dd, J = 7,5, 6,5 Hz, 1H), 2,09-1,91 (m, 1H), 1,91-1,71 (m, 1H), 1,59-1,02 (m, 4H), 0,89 (t, J = 7,0 Hz, 3H)
72		(película delgada) 3317, 3123, 3066, 3036, 2246, 1731, 1598, 1518, 1492, 1445, 1416, 1263, 1217, 1039, 986, 909, 850, 732	HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>26</sub> H <sub>19</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 492,141; encontrado, 492,1413		8,53 (s, 1H), 8,13 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,77 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,58 (dd, J = 7,9, 1,6 Hz, 2H), 7,50 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 7,44-7,32 (m, 5H), 6,91 (s, 1H), 6,49 (q, J = 2,1 Hz, 1H), 1,93 (d, J = 2,2 Hz, 3H)

n.º	Estructura	IR (cm <sup>-1</sup> )	EM	pf (°C)	RMN <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> , δ) <sup>a</sup>
73			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>24</sub> H <sub>17</sub> Cl <sub>2</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 536,063; encontrado, 536,0634	196- 198	8,69 (s, 1H), 8,11 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,80 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,51 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,37 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 7,30 (d, J = 8,0 Hz, 2H), 7,14 (dd, J = 8,4, 7,7 Hz, 1H), 6,90 (s, 1H), 6,56 (q, J = 6,9 Hz, 1H), 1,73 (d, J = 6,9 Hz, 3H)
74		(película delgada) 3251, 3111, 3064, 2962, 2874, 1724, 1607, 1518, 1493, 1445, 1416, 1313, 1262, 1225, 1179, 1107, 1058	HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>26</sub> H <sub>23</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 496,172; encontrado, 496,1727		8,98 (s, 1H), 8,08 (d, J = 8,1 Hz, 2H), 7,86-7,74 (m, 2H), 7,44 (d, J = 7,8 Hz, 2H), 7,36-7,26 (m, 6H), 7,26-7,20 (m, 1H), 6,80 (s, 1H), 5,69 (dd, J = 7,4, 6,5 Hz, 1H), 1,96-1,83 (m, 1H), 1,80-1,66 (m, 1H), 1,46-1,19 (m, 2H), 0,88 3(t, J = 7,4 Hz, 3H)
75			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>25</sub> H <sub>21</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> S, 546,118; encontrado, 546,1187	131- 135	8,56 (s, 1H), 8,14 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,95 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,79 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,60 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,49 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 7,38 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 6,87 (s, 1H), 5,95 (q, J = 6,6 Hz, 1H), 3,05 (s, 3H), 1,63 (d, J = 6,7 Hz, 3H)
76			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>22</sub> H <sub>17</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> S, 474,097; encontrado, 474,0976	158- 160	(400 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) 10,00 (s, 1H), 9,37 (s, 1H), 8,06 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 8,01 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,67-7,56 (m, 4H), 7,53 (dd, J = 5,1, 1,2 Hz, 1H), 7,19 (d, J = 3,4 Hz, 1H), 7,03 (dd, J = 5,1, 3,5 Hz, 1H), 6,11 (q, J = 6,5 Hz, 1H), 1,66 (d, J = 6,6 Hz, 3H)
77			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>22</sub> H <sub>17</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> S, 474,097; encontrado, 474,0979	135- 137	(400 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) 9,96 (s, 1H), 9,36 (s, 1H), 8,05 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 8,01 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,62 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 7,60 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 7,57-7,51 (m, 2H), 7,20 (dd, J = 4,8, 1,5 Hz, 1H), 5,93 (q, J = 6,5 Hz, 1H), 1,59 (d, J = 6,6 Hz, 3H)
78		(película delgada) 3251, 3064, 2960, 1724, 1608, 1518, 1493, 1445, 1416, 1313, 1262, 1224, 1179, 1056, 849	HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>27</sub> H <sub>25</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 510,1883; encontrado, 510,187		8,93 (s, 1H), 8,14 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,84 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,50 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,44-7,32 (m, 6H), 7,30 (ddd, J = 6,7, 3,8, 1,7 Hz, 1H), 6,86 (s, 1H), 5,83 (dd, J = 8,6, 5,3 Hz, 1H), 2,03-1,80 (m, 1H), 1,75-1,52 (m, 2H), 0,98 (d, J = 6,3 Hz, 3H), 0,97 (d, J = 6,2 Hz, 3H)

n.º	Estructura	IR (cm <sup>-1</sup> )	EM	pf (°C)	RMN <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> , δ)
79			HRMS-FAB ( <i>m/z</i> ) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>25</sub> H <sub>20</sub> F <sub>4</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 500,147; encontrado, 500,1475	123- 126	8,88 (s, 1H), 8,14 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,83 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,50 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 7,43-7,30 (m, 4H), 7,04 (t, J = 8,7 Hz, 2H), 6,91 (s, 1H), 5,64 (t, J = 7,0 Hz, 1H), 2,07-1,91 (m, 1H), 1,91-1,75 (m, 1H), 0,92 (t, J = 7,4 Hz, 3H)
80			HRMS-FAB ( <i>m/z</i> ) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>21</sub> H <sub>14</sub> F <sub>6</sub> N <sub>4</sub> O <sub>4</sub> , 512,092; encontrado, 512,0919	97-99	8,71 (s, 1H), 8,17 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,81 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,66 (s, 1H), 7,51 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,46 (t, J = 1,7 Hz, 1H), 7,39 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 7,05 (s, 1H), 6,55 (s, 1H), 6,22 (q, J = 6,8 Hz, 1H)
81			HRMS-FAB ( <i>m/z</i> ) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>24</sub> H <sub>18</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> Cl, 502,102; encontrado, 502,1020	144- 147	8,58 (s, 1H), 8,13 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,79 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,49 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 7,38 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,34 (app s, 4H), 6,80 (s, 1H), 5,87 (q, J = 6,6 Hz, 1H), 1,59 (d, J = 6,6 Hz, 3H)
82			HRMS-FAB ( <i>m/z</i> ) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>25</sub> H <sub>17</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 478,125; encontrado, 478,1256	142- 144	(400 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) 10,19 (s, 1H), 9,37 (s, 1H), 8,04 (dd, J = 10,4, 8,9 Hz, 4H), 7,68-7,56 (m, 6H), 7,51-7,29 (m, 3H), 6,47 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 3,88 (d, J = 2,2 Hz, 1H)
83			HRMS-FAB ( <i>m/z</i> ) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>29</sub> H <sub>21</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 530,157; encontrado, 530,1564	158- 160	8,99 (s, 1H), 8,18 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,87 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,56 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,47-7,30 (m, 12H), 7,09 (s, 1H), 6,94 (s, 1H)
84			HRMS-FAB ( <i>m/z</i> ) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>24</sub> H <sub>18</sub> F <sub>4</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 486,131; encontrado, 486,1318	142- 144	8,56 (s, 1H), 8,12 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 7,49 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 7,38 (dd, J = 8,6, 5,4 Hz, 4H), 7,05 (t, J = 8,7 Hz, 2H), 6,85 (s, 1H), 5,89 (q, J = 6,6 Hz, 1H), 1,60 (d, J = 6,6 Hz, 3H)
85			HRMS FAB ( <i>m/z</i> ) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>25</sub> H <sub>21</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 482,156; encontrado, 482,1568	127- 131	8,53 (s, 1H), 8,12 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,76 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,50 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 7,42-7,15 (m, 7H), 6,97 (s, 1H), 5,68 (t, J = 6,9 Hz, 1H), 2,07-1,75 (m, 2H), 0,94 (t, J = 7,4 Hz, 3H)



n.º	Estructura	IR (cm <sup>-1</sup> )	EM	pf (°C)	RMN <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> , δ) <sup>1</sup>
86			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>23</sub> H <sub>20</sub> F <sub>3</sub> N <sub>5</sub> O <sub>4</sub> , 487,146; encontrado, 487,1468		8,55 (s, 1H), 8,13 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,79 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,49 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,38 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 6,91 (s, 1H), 5,82 (q, J = 6,8 Hz, 1H), 2,46 (s, 3H), 2,36 (s, 3H), 1,60 (d, J = 6,9 Hz, 3H)
87			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>19</sub> H <sub>17</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 406,125; encontrado, 406,1252	193- 195	8,54 (s, 1H), 8,13 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,79 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,50 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 7,37 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 6,71 (s, 1H), 5,23-4,88 (m, 1H), 1,31 (d, J = 6,3 Hz, 6H)
88			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>28</sub> H <sub>21</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 494,156; encontrado, 494,1567		8,54 (s, 1H), 8,12 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,79 (d, J = 9,1 Hz, 2H), 7,50 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,46-7,28 (m, 7H), 6,82 (s, 1H), 5,21 (d, J = 8,9 Hz, 1H), 1,45-1,29 (m, 1H), 0,76-0,56 (m, 3H), 0,51-0,38 (m, 1H)
89			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>28</sub> H <sub>23</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 496,172; encontrado, 496,1726	181- 183	8,53 (s, 1H), 8,11 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,49 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 7,37 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 7,07 (dd, J = 8,5, 6,3 Hz, 1H), 7,01 (d, J = 7,4 Hz, 2H), 6,79 (s, 1H), 6,34 (q, J = 6,9 Hz, 1H), 2,50 (s, 6H), 1,65 (d, J = 7,0 Hz, 3H)
90			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>24</sub> H <sub>16</sub> F <sub>6</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 522,112; encontrado, 522,1128		8,55 (s, 1H), 8,15 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,58-7,46 (m, 4H), 7,48-7,34 (m, 5H), 7,11 (s, 1H), 6,17 (q, J = 6,9 Hz, 1H)
91			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>25</sub> H <sub>21</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 482,156; encontrado, 482,156	160- 162	8,53 (s, 1H), 8,11 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,77 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,49 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 7,37 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,30 (d, J = 8,1 Hz, 2H), 7,18 (d, J = 7,9 Hz, 2H), 6,84 (s, 1H), 5,89 (q, J = 6,6 Hz, 1H), 2,34 (s, 3H), 1,61 (d, J = 6,6 Hz, 3H)
92			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>25</sub> H <sub>21</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 482,156; encontrado, 482,157	94-97	8,53 (s, 1H), 8,12 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,50 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 7,37 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,30-7,17 (m, 3H), 7,12 (d, J = 7,5 Hz, 1H), 6,86 (s, 1H), 5,88 (q, J = 6,6 Hz, 1H), 2,37 (s, 3H), 1,61 (d, J = 6,6 Hz, 3H)

n.º	Estructura	IR (cm <sup>-1</sup> )	EM	pf (°C)	RMN <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> , δ)
93			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>25</sub> H <sub>21</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 482, 156; encontrado, 482, 157	147- 149	8,53 (s, 1H), 8,12 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,77 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,49 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 7,45-7,39 (m, 1H), 7,37 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,27-7,11 (m, 3H), 6,90 (s, 1H), 6,13 (q, J = 6,5 Hz, 1H), 2,43 (s, 3H), 1,59 (d, J = 6,6 Hz, 3H)
94			525 ([M+H] <sup>+</sup> )	>150	(3:2 mezcla de diastereómeros) 8,52 (s, 1H), 8,11 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 7,77 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,59-7,43 (m, 2H), 7,37 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 6,98-6,89 (m, 2H), 6,82-6,63 (m, 2H), 6,39 (d, J = 2,2 Hz, 0,6H), 6,25 (d, J = 3,0 Hz, 0,4H), 3,76-3,62 (m, 0,6H), 3,09 (dd, J = 16,4, 5,9 Hz, 0,4H), 2,67 (d, J = 9,0 Hz, 1,2H), 2,33-2,20 (m, 0,8H), 2,27 (s, 3H), 1,14 (d, J = 6,8 Hz, 1,5H), 1,08 (d, J = 7,1 Hz, 1,5H)
95			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>25</sub> H <sub>19</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>4</sub> , 496, 135; encontrado, 496, 136	171- 173	8,54 (s, 1H), 8,13 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,79 (d, J = 9,2 Hz, 2H), 7,50 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 7,38 (dd, J = 9,1, 0,8 Hz, 2H), 7,13 (dd, J = 15,8, 7,8 Hz, 2H), 6,94 (ddd, J = 9,7, 7,6, 1,7 Hz, 2H), 6,76 (s, 1H), 6,62 (t, J = 2,5 Hz, 1H), 3,03 (ddd, J = 17,4, 12,3, 5,9 Hz, 1H), 2,77 (ddd, J = 17,0, 6,2, 3,1 Hz, 1H), 2,33 - 1,98 (m, 2H)
96			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>23</sub> H <sub>21</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 458, 156; encontrado, 458, 157	158- 159	8,53 (s, 1H), 8,11 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,51 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 7,36 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 6,77 (s, 1H), 2,23 (q, J = 7,5 Hz, 2H), 1,73 (s, 6H), 1,13 (t, J = 7,5 Hz, 3H)
97		(película delgada) 3317, 3122, 2981, 2933, 2839, 1724, 1615, 1518, 1492, 1445, 1416, 1249, 1225, 1179, 1111, 1064, 986, 847	HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>25</sub> H <sub>21</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>4</sub> , 498, 151; encontrado, 498, 151		8,53 (s, 1H), 8,11 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 8,9 Hz, 2H), 7,48 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 7,37 (d, J = 8,9 Hz, 2H), 7,35 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 6,90 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 6,79 (s, 1H), 5,88 (q, J = 6,6 Hz, 1H), 3,80 (s, 3H), 1,61 (d, J = 6,6 Hz, 3H)
98			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>18</sub> H <sub>15</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 392, 109; encontrado, 392, 109	182- 184	8,55 (s, 1H), 8,12 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,50 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 7,37 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 6,81 (s, 1H), 4,25 (q, J = 7,1 Hz, 2H), 1,32 (t, J = 7,1 Hz, 3H)

n.º	Estructura	IR (cm <sup>-1</sup> )	EM	pf (°C)	RMN <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> , δ)
99			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>24</sub> H <sub>24</sub> F <sub>3</sub> N <sub>5</sub> O <sub>3</sub> , 487,183; encontrado, 487,183	130- 133	(300 MHz, CDCl <sub>3</sub> -CD <sub>3</sub> OD) 8,60 (s, 1H), 7,97 (d, J = 8 Hz, 2H), 7,75 (d, J = 8 Hz, 2H), 7,44 (d, J = 8 Hz, 2H), 7,30 (d, J = 8 Hz, 2H), 3,83 (a, 1H), 3,21 (s, 2H), 2,22 (s, 6H), 1,65 (s, 6H)
100			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>27</sub> H <sub>25</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>4</sub> , 526,182; encontrado, 526,183	173- 176	8,53 (s, 1H), 8,13 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,77 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,50 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 7,37 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,14 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 6,83 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 6,77 (s, 1H), 3,78 (s, 3H), 3,12 (s, 2H), 1,50 (s, 6H)
101			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>24</sub> H <sub>27</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 476,203; encontrado, 476,204	111- 115	8,54 (s, 1H), 8,13 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,1 Hz, 2H), 7,52 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 7,37 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 6,79 (s, 1H), 4,86-4,76 (m, 1H), 1,71-1,50 (m, 4H), 1,47-1,16 (m, 6H), 0,94 (t, J = 7,4 Hz, 3H), 0,88 (t, J = 6,7 Hz, 3H)
102			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>24</sub> H <sub>27</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 476,203; encontrado, 476,204	123- 124	8,54 (s, 1H), 8,13 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,51 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 7,37 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 6,76 (s, 1H), 5,07-4,81 (m, 1H), 1,96-1,58 (m, 1H), 1,58-1,47 (m, 1H), 1,47-1,17 (m, 8H), 1,29 (d, J = 6,2 Hz, 3H), 0,88 (t, J = 6,7 Hz, 3H)
103			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>22</sub> H <sub>23</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 448,172; encontrado, 448,172	165- 166	8,54 (s, 1H), 8,13 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,52 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,37 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 6,77 (s, 1H), 4,71 (q, J = 6,4 Hz, 1H), 1,22 (d, J = 6,4 Hz, 3H), 0,95 (s, 9H)
104			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>17</sub> H <sub>13</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 378,093; encontrado, 378,094	171- 173	8,54 (s, 1H), 8,13 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,50 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 7,37 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 6,85 (s, 1H), 3,80 (s, 3H)
105			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>23</sub> H <sub>17</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 454,125; encontrado, 454,125	155- 157	8,54 (s, 1H), 8,13 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,51 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 7,46-7,32 (m, 7H), 6,89 (s, 1H), 5,22 (s, 2H)

n.º	Estructura	IR (cm <sup>-1</sup> )	EM	pf (°C)	RMN <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> , δ) <sup>1</sup>
106			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>22</sub> H <sub>19</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 480,140; encontrado, 480,141	196- 197	8,52 (s, 1H), 8,11 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 7,77 (d, J = 8,9 Hz, 2H), 7,47 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 7,37 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,30-7,24 (m, 2H), 7,24-7,16 (m, 2H), 6,78 (s, 1H), 5,63-5,58 (m, 1H), 3,35 (dd, J = 17,0, 6,1 Hz, 2H), 3,11 (dd, J = 17,0, 2,3 Hz, 2H)
107			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>25</sub> H <sub>21</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 482,156; encontrado, 482,1567	143- 145	8,54 (s, 1H), 8,13 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,48 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,37 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,34 - 7,27 (m, 2H), 7,27 - 7,19 (m, 3H), 6,76 (s, 1H), 5,16 (h, J = 6,3 Hz, 1H), 3,02 (dd, J = 13,7, 6,4 Hz, 1H), 2,83 (dd, J = 13,7, 6,7 Hz, 1H), 1,30 (d, J = 6,3 Hz, 3H)
108			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>26</sub> H <sub>21</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 494,156; encontrado, 494,157	197- 201	8,54 (s, 1H), 8,12 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,79 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,47 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 7,38 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,23 - 7,11 (m, 4H), 6,68 (s, 1H), 3,51 (d, J = 16,5 Hz, 2H), 3,20 (d, J = 16,5 Hz, 2H), 1,78 (s, 3H)
109			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>25</sub> H <sub>19</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 480,140; encontrado 480,1415	187- 190	8,54 (s, 1H), 8,14 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,51 (d, J = 7,0 Hz, 3H), 7,38 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,35-7,21 (m, 3H), 6,77 (s, 1H), 6,26 (dd, J = 6,9, 3,5 Hz, 1H), 3,19-3,10 (m, 1H), 2,92 (ddd, J = 16,1, 8,6, 4,6 Hz, 1H), 2,62-2,49 (m, 1H), 2,21 (dddd, J = 14,0, 8,3, 4,5, 3,7 Hz, 1H)
110			HRMS FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>23</sub> H <sub>18</sub> F <sub>3</sub> N <sub>5</sub> O <sub>3</sub> , 469,136; encontrado, 469,1366	147- 150	8,70 (s, 1H), 8,58 (d, J = 4,1 Hz, 1H), 8,54 (s, 1H), 8,13 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,73 (dt, J = 7,9, 1,7 Hz, 1H), 7,50 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 7,37 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 7,32 (dd, J = 7,8, 4,9 Hz, 1H), 7,11 (s, 1H), 5,95 (q, J = 6,6 Hz, 1H), 1,65 (d, J = 6,7 Hz, 3H)
111			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>19</sub> H <sub>15</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> Cl <sub>2</sub> , 522,047; encontrado, 522,0480	171- 173	8,54 (s, 1H), 8,13 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,51 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,43-7,32 (m, 4H), 7,24 (dd, J = 8,7, 7,3 Hz, 1H), 6,92 (s, 1H), 5,51 (s, 2H)

n.º	Estructura	IR (cm <sup>-1</sup> )	EM	pf (°C)	RMN <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> , δ)
<b>112</b>			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>24</sub> H <sub>16</sub> F <sub>3</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub> , 479,120; encontrado, 479,1206	134- 136	8,56 (s, 1H), 8,16 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,58 (dd, J = 6,8, 2,9 Hz, 2H), 7,55-7,43 (m, 5H), 7,38 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,08 (s, 1H), 6,53 (s, 1H)
<b>113</b>			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>21</sub> H <sub>21</sub> F <sub>3</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub> , 434,156; encontrado, 434,1568	161- 162	9,05 (s, 1H), 8,17 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,87 (d, J = 8,9 Hz, 2H), 7,54 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 7,39 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 6,80 (s, 1H), 4,80-4,71 (m, 1H), 1,72-1,53 (m, 4H), 0,95 (t, J = 7,4 Hz, 6H)
<b>114</b>			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>24</sub> H <sub>14</sub> F <sub>6</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub> , 558,094; encontrado, 558,0937	185- 188	8,54 (s, 1H), 8,13 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,79 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,48 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,38 (dd, J = 9,0, 0,8 Hz, 2H), 6,84 (s, 1H), 6,18 (q, J = 6,7 Hz, 1H), 1,72 (d, J = 6,9 Hz, 3H)
<b>115</b>			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>26</sub> H <sub>17</sub> F <sub>6</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub> , 604,116; encontrado, 604,1154	212,5- 214,5	10,20 (s, 1H), 9,35 (s, 1H), 8,20 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 8,10-7,95 (m, 6H), 7,58 (app t, J = 9,2 Hz, 4H), 6,09 (q, J = 6,4 Hz, 1H), 1,59 (d, J = 6,5 Hz, 3H)
<b>116</b>			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>30</sub> H <sub>23</sub> F <sub>6</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub> , 544,1722; encontrado, 544,1722	174,5- 177,5	8,54 (s, 1H), 8,13 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,79 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,64-7,55 (m, 4H), 7,54-7,31 (m, 9H), 6,81 (s, 1H), 5,97 (q, J = 6,5 Hz, 1H), 1,67 (d, J = 6,6 Hz, 3H)
<b>117</b>			488 ([M+H] <sup>+</sup> ), 486 ([M-H] <sup>-</sup> )	153,5- 156	8,54 (s, 1H), 8,46 (t, J = 1,6 Hz, 1H), 8,12 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,49 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,44-7,33 (m, 4H), 6,93 (s, 1H), 5,95 (q, J = 6,6 Hz, 1H), 1,66 (d, J = 6,7 Hz, 3H)
<b>118</b>			504 ([M+H] <sup>+</sup> ), 502 ([M-H] <sup>-</sup> )	181- 184,5	8,57 (dd, J = 2,4, 0,5 Hz, 1H), 8,54 (s, 1H), 8,13 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,79 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,68 (dd, J = 8,4, 2,5 Hz, 1H), 7,49 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,38 (dd, J = 9,1, 0,8 Hz, 2H), 7,37-7,33 (m, 1H), 6,90 (s, 1H), 5,93 (q, J = 6,6 Hz, 1H), 1,65 (d, J = 6,7 Hz, 3H)

n.º	Estructura	IR (cm <sup>-1</sup> )	EM	pf (°C)	RMN <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> , δ <sup>1</sup> )
119			500 ([M+H] <sup>+</sup> ), 498 ([M-H] <sup>-</sup> )	143-148	8,54 (s, 1H), 8,34 - 8,28 (m, 1H), 8,11 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 9,1 Hz, 2H), 7,48 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,42-7,34 (m, 2H), 7,32 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 7,19 (dd, J = 8,6, 2,9 Hz, 1H), 6,94 (s, 1H), 5,93 (q, J = 6,6 Hz, 1H), 3,85 (s, 3H), 1,66 (d, J = 6,7 Hz, 3H)
120		(película delgada) 3301, 3119, 3061, 2987, 1721, 1596, 1517, 1491, 1439, 1311, 1220, 1163, 1078, 985, 914, 846, 756, 732	504 ([M+H] <sup>+</sup> ), 502 ([M-H] <sup>-</sup> )		8,54 (s, 1H), 8,13 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,79 (d, J = 9,1 Hz, 2H), 7,66 (t, J = 7,8 Hz, 1H), 7,50 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,41-7,35 (m, 2H), 7,32 (d, J = 7,5 Hz, 1H), 7,28-7,24 (m, 1H), 6,92 (s, 1H), 5,90 (q, J = 6,7 Hz, 1H), 1,66 (d, J = 6,7 Hz, 3H)
121			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>27</sub> H <sub>25</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 510,188; encontrado, 510,1876.	172-173	8,54 (s, 1H), 8,14 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,79 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,51 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 7,38 (dd, J = 9,0, 0,7 Hz, 2H), 6,87 (s, 2H), 6,77 (s, 1H), 4,31-4,19 (m, 2H), 3,10-2,97 (m, 2H), 2,37 (s, 6H), 2,26 (s, 3H)
122			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>22</sub> H <sub>15</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> , 440,109; encontrado, 440,110	186-188	(400 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) 10,49 (s, 1H), 9,37 (s, 1H), 8,08 (d, J = 3,4 Hz, 2H), 8,05 (d, J = 3,7 Hz, 2H), 7,67 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,61 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,45 (t, J = 7,9 Hz, 2H), 7,32-7,19 (m, 3H)
123			HRMS-FAB (m/z) [M+H] <sup>+</sup> calc. para C <sub>22</sub> H <sub>16</sub> F <sub>3</sub> N <sub>5</sub> O <sub>3</sub> , 455,121; encontrado, 455,1206	219-221	(300 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) 10,59 (s, 1H), 9,38 (d, J = 0,4 Hz, 1H), 8,39 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 8,09 (d, J = 2,6 Hz, 2H), 8,06 (d, J = 2,9 Hz, 2H), 7,69-7,59 (m, 4H), 7,34 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,07-7,00 (m, 1H), 2,49 (s, 3H)
124			509 ([M+H] <sup>+</sup> )	153-168	8,56 (s, 1H), 8,19 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,80 (d, J = 9,1 Hz, 2H), 7,70 (d, J = 8,9 Hz, 1H), 7,63 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 7,59 (d, J = 8,9 Hz, 2H), 7,45-7,35 (m, 4H), 7,21 (s, 1H)

n.º	Estructura	IR (cm <sup>-1</sup> )	EM	pf (°C)	RMN <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> , δ) <sup>1</sup>
125			509 ([M+H] <sup>+</sup> )	161-169	8,56 (s, 1H), 8,19 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,80 (d, J = 9,1 Hz, 2H), 7,70 (d, J = 8,9 Hz, 1H), 7,61 (dd, J = 18,0, 8,6 Hz, 3H), 7,40 (dd, J = 15,7, 7,7 Hz, 4H), 7,20 (s, 1H)
126			509 ([M+H] <sup>+</sup> )	183-188	8,56 (s, 1H), 8,19 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,80 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,68 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 7,57 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 7,37 (dd, J = 15,2, 8,3 Hz, 4H), 7,13 (s, 1H)
127			459 ([M+H] <sup>+</sup> ), 457 ([M-H] <sup>-</sup> )	184-188	8,56 (s, 1H), 8,18 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,80 (d, J = 9,1 Hz, 2H), 7,58 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,38 (d, J = 9,7 Hz, 2H), 7,29 (dd, J = 7,9, 1,5 Hz, 1H), 7,24-7,13 (m, 4H)
128			489 ([M+H] <sup>+</sup> )	179-182,5	8,56 (s, 1H), 8,18 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,80 (d, J = 9,1 Hz, 2H), 7,57 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 7,39 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,25 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 7,22-7,20 (m, 1H), 7,20-7,18 (m, 1H), 7,11 (s a, 1H), 7,09 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 2,26 (s, 3H)
129			517 ([M+H] <sup>+</sup> )	172-180	8,55 (s, 1H), 8,19 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,80 (d, J = 9,1 Hz, 2H), 7,64-7,56 (m, 4H), 7,46 (qd, J = 7,7, 4,5 Hz, 5H), 7,37 (dd, J = 12,4, 7,8 Hz, 3H), 7,29 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 7,20 (dd, J = 9,0, 2,4 Hz, 1H), 7,13 (s, 1H)

<sup>1</sup>Todos los datos RMN se midieron en CDCl<sub>3</sub> a 300 o 400 MHz a menos que se notifique otra cosa

Tabla 2

Compuesto número	% de mortalidad CEW 50 $\mu\text{g}/\text{cm}^2$	% de mortalidad BAW 50 $\mu\text{g}/\text{cm}^2$	% de mortalidad GPA 200 ppm
1	A	A	B
2	B	A	B
3	B	A	B
4	B	B	B
5	A	A	B
6	B	A	B
7	B	B	B
8	A	A	B
9	A	A	B
10	B	A	B
11	A	A	B
12	A	A	B
13	A	A	B
14	B	B	C
15	A	A	B
16	B	B	B
17	A	B	B
18	A	A	B
19	A	A	B
20	A	A	B
21	A	A	B
22	A	A	B
23	B	B	B
24	A	A	B
25	A	A	B
26	A	A	C
27	A	A	B
28	A	A	B
29	A	A	B
30	A	A	B
31	A	A	B
32	A	A	B
33	A	A	B
34	A	A	B
35	A	A	B



ES 2 571 327 T3

Compuesto número	% de mortalidad CEW 50 µg/cm <sup>2</sup>	% de mortalidad BAW 50 µg/cm <sup>2</sup>	% de mortalidad GPA 200 ppm
36	A	A	B
37	A	A	B
38	A	A	B
39	A	A	B
40	A	A	B
41	A	A	B
42	A	A	B
43	A	A	B
44	A	A	B
45	A	A	B
46	A	A	B
47	A	A	B
48	A	A	B
49	A	A	B
50	B	B	B
51	A	A	B
52	A	A	B
53	A	A	B
54	A	A	B
55	A	A	B
56	A	A	B
57	A	A	B
58	A	A	B
59	A	A	B
60	A	A	C
61	A	A	C
62	A	A	C
63	A	A	B
64	A	A	B
65	A	A	B
66	A	A	B
67	A	A	B
68	A	A	B
69	A	A	B
70	A	A	B
71	A	A	B

ES 2 571 327 T3

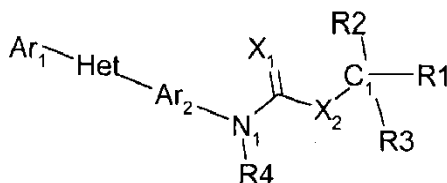
Compuesto número	% de mortalidad CEW 50 µg/cm <sup>2</sup>	% de mortalidad BAW 50 µg/cm <sup>2</sup>	% de mortalidad GPA 200 ppm
72	A	A	B
73	A	A	B
74	A	A	B
75	A	A	B
76	A	A	B
77	A	A	B
78	A	A	B
79	A	A	B
80	A	A	B
81	A	A	B
82	A	A	B
83	A	A	B
84	A	A	B
85	A	A	B
86	A	A	B
87	B	A	B
88	A	A	B
89	A	A	B
90	A	A	B
91	A	A	B
92	A	A	B
93	A	A	B
94	A	A	B
95	A	A	B
96	A	A	B
97	A	A	B
98	A	A	B
99	B	B	B
100	B	B	B
101	A	A	B
102	B	B	B
103	B	A	B
104	A	A	B
105	A	A	B
106	A	B	B
107	A	A	B

ES 2 571 327 T3

Compuesto número	% de mortalidad CEW 50 µg/cm <sup>2</sup>	% de mortalidad BAW 50 µg/cm <sup>2</sup>	% de mortalidad GPA 200 ppm
108	B	B	B
109	A	B	B
110	A	A	B
111	A	B	B
112	A	A	B
113	A	A	B
114	B	A	B
115	B	B	B
116	A	B	B
117	A	A	B
118	A	A	B
119	A	A	B
120	A	A	B
121	A	B	B
122	A	A	B
123	B	B	B
124	A	A	B
125	C	C	B
126	C	C	B
127	C	C	B
128	A	A	B
129	A	A	B
130	A	A	B
131	A	A	B
132	B	A	B
133	A	A	B
134	B	B	B
135	A	A	B
136	B	B	B

## REIVINDICACIONES

1. Una molécula de la siguiente fórmula:



en donde:

- 5 (a) Ar<sub>1</sub> es un fenilo sustituido en donde dicho fenilo sustituido tiene uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> y haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>;
- (b) Het es un 1,2,4-triazol 1,3-disustituido donde Ar<sub>1</sub> y Ar<sub>2</sub> no son orto entre sí, pero son 1,3;
- (c) Ar<sub>2</sub> es un fenilo,
- (d) X<sub>1</sub> es O o S;
- 10 (e) X<sub>2</sub> es O o S; y
- (f) R<sub>4</sub> es H o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>;
- (g) R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub> y R<sub>3</sub> se seleccionan independientemente de H, F, Cl, Br, I, CN, NO<sub>2</sub>, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, C(=O)H, C(=O)NR<sub>x</sub>R<sub>y</sub>, (alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)NR<sub>x</sub>R<sub>y</sub>, C(=O)(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)O(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)O(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)O(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)(haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)O(haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)(cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)O(cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)(alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)O(alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), (alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)O(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)S(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)C(=O)O(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)fenilo, fenilo, alquilfenilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, C(=O)fenoxi, fenoxi, alquilfenoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, C(=O)Het-1, Het-1 o alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> Het-1,

15 en donde Het-1 es un anillo heterocíclico, saturado o insaturado, de 5 o 6 miembros, que contiene uno o más heteroátomos seleccionados independientemente de nitrógeno, azufre u oxígeno, y

20 en donde cada alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, halocicloalquilo, cicloalcoxi halocicloalcoxi, alcoxi, haloalcoxi, alquenilo, alquinilo, fenilo, fenoxi y Het-1 están opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de F, Cl, Br, I, CN, NO<sub>2</sub>, oxo, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalcoxi C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalcoxi C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, S(=O)<sub>n</sub>(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), S(=O)<sub>n</sub>(haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), OSO<sub>2</sub>(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), OSO<sub>2</sub>(haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)H, C(=O)NR<sub>x</sub>R<sub>y</sub>, (alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)NR<sub>x</sub>R<sub>y</sub>, (alquenilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)NR<sub>x</sub>R<sub>y</sub>, (alquinilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)NR<sub>x</sub>R<sub>y</sub>, C(=O)(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)O(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)(haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)O(haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)(cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)O(cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)(alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)O(alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), (alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)O(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)S(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)C(=O)O(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), fenilo, fenoxi y Het-1,

25 en donde n = 0, 1 o 2;

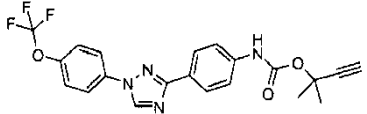
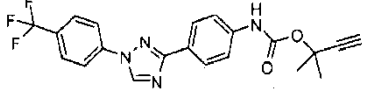
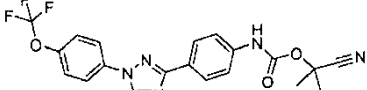
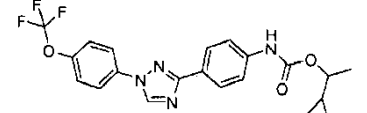
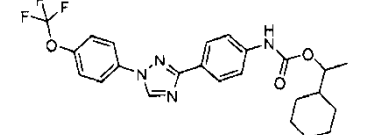
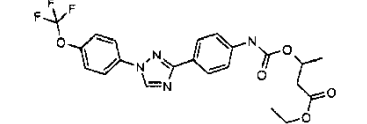
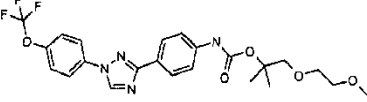
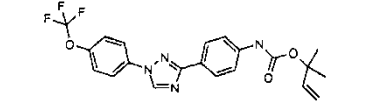
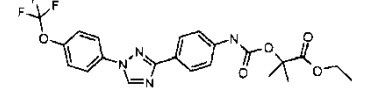
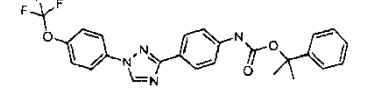
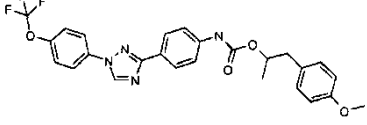
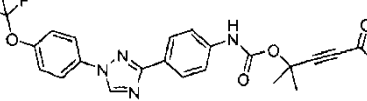
30 en donde R<sub>x</sub> y R<sub>y</sub> se seleccionan independientemente de H, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalcoxi C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalcoxi C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, S(=O)<sub>n</sub>(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), S(=O)<sub>n</sub>(haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), OSO<sub>2</sub>(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), OSO<sub>2</sub>(haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)H, C(=O)(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)O(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)(haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)O(haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)(cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)O(cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)(alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)O(alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), (alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)O(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)S(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)C(=O)O(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), fenilo y fenoxi;

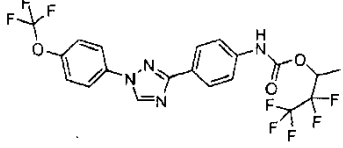
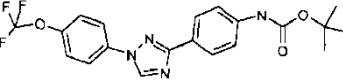
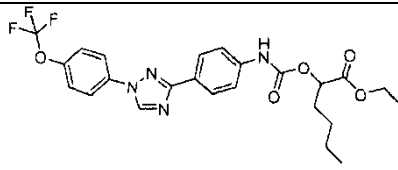
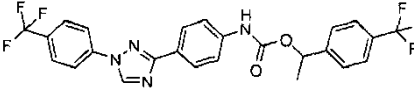
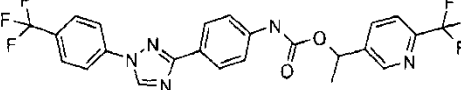
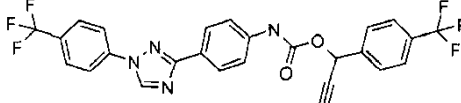
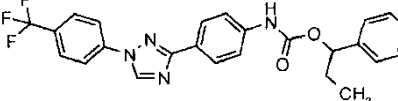
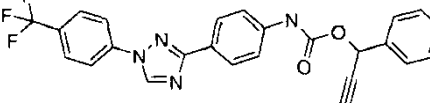
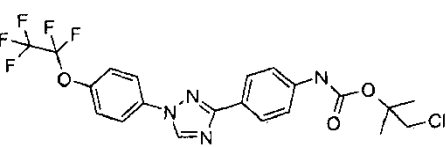
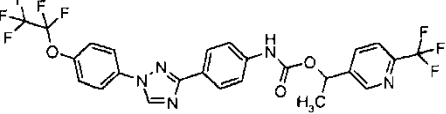
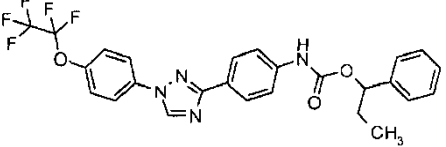
35 en donde R<sub>1</sub> y R<sub>2</sub> juntos pueden formar opcionalmente un grupo cíclico saturado o sin saturar, de 3 a 12 miembros que pueden contener uno o más heteroátomos seleccionados de nitrógeno, azufre y oxígeno con la condición de que no sea un enlace C- O- en tal grupo cíclico, en donde dicho grupo cíclico puede tener uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de F, Cl, Br, I, CN, NO<sub>2</sub>, oxo, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalcoxi C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalcoxi C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, S(=O)<sub>n</sub>(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), S(=O)<sub>n</sub>(haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), OSO<sub>2</sub>(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), OSO<sub>2</sub>(haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)H, C(=O)(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)O(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)(haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)O(haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)(cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)O(cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)(alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)O(alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), (alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)O(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), (alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)S(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), C(=O)(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)C(=O)O(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), fenilo, fenoxi y Het-1.

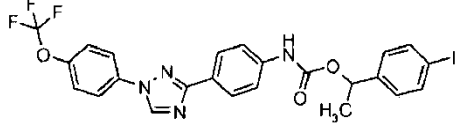
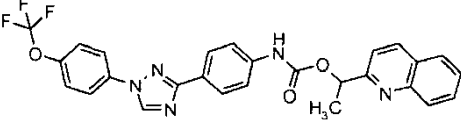
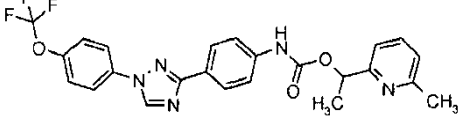
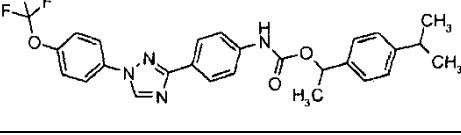
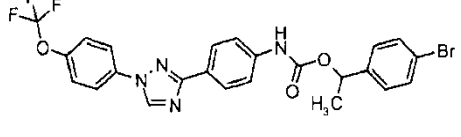
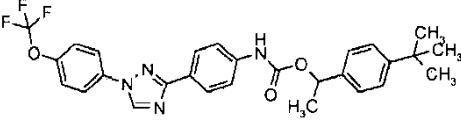
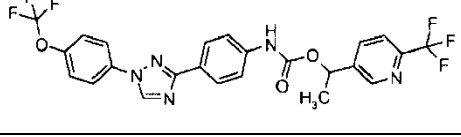
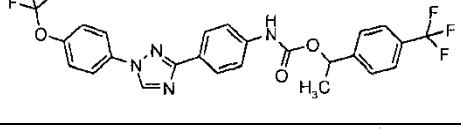
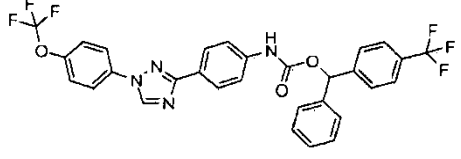
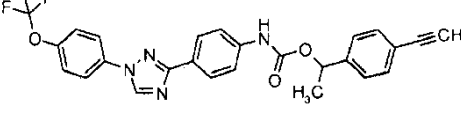
2. Una molécula según la reivindicación 1, en donde R1, R2 y R3 se seleccionan independientemente de H, CN, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, C(=O)O(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), fenilo y Het-1.

3. Una molécula según la reivindicación 1 que tiene una de las siguientes estructuras

n.º	Estructura
1	
2	
3	
4	
5	
6	
7	
8	
9	
10	
11	

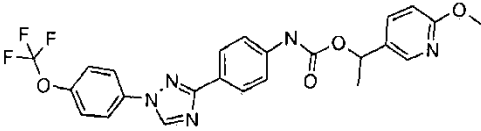
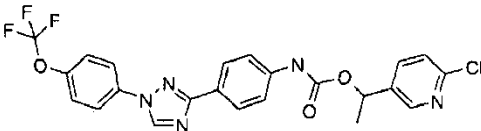
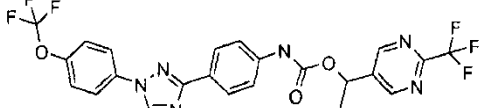
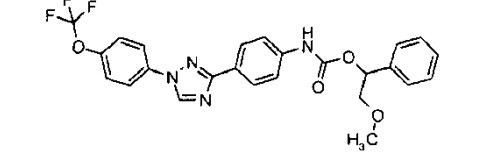
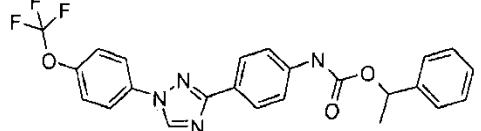
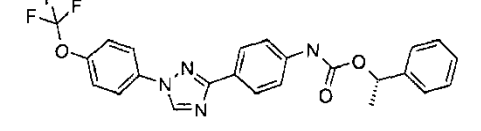
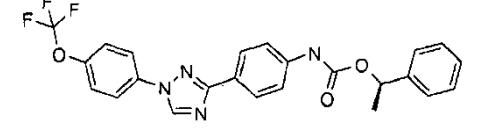
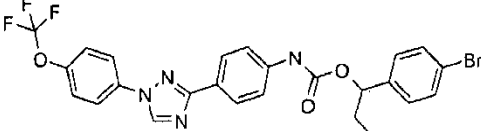
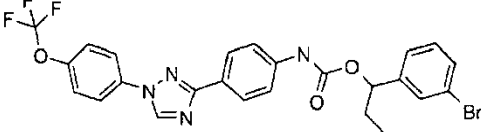
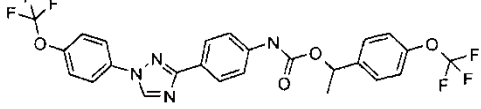
n.º	Estructura
12	
13	
14	
15	
16	
17	
18	
19	
20	
21	
22	
23	

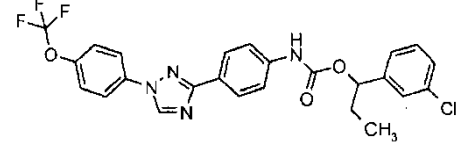
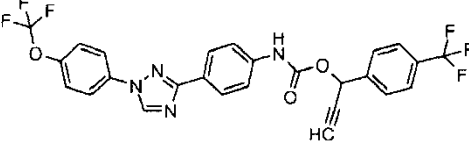
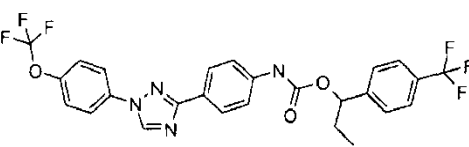
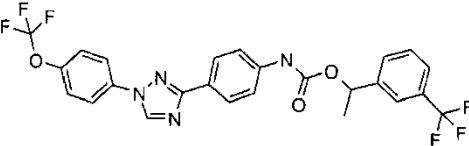
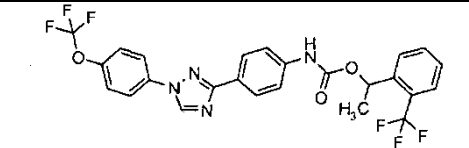
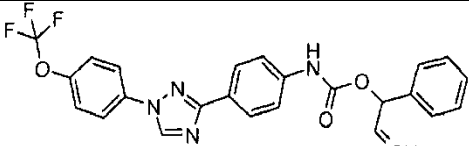
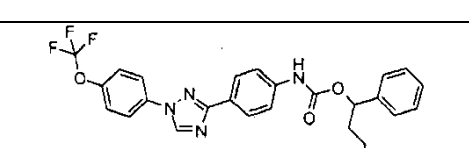
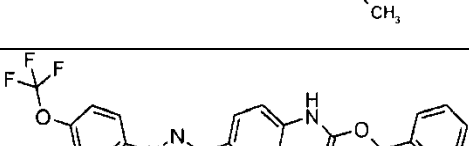
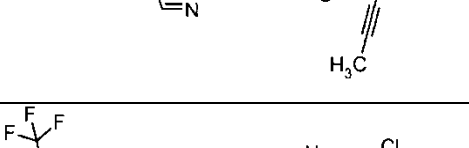
n.º	Estructura
24	
25	
26	
27	
28	
29	
30	
31	
32	
33	
34	

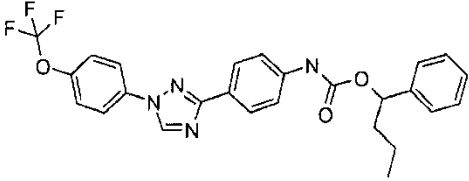
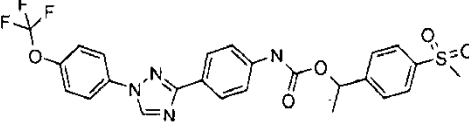
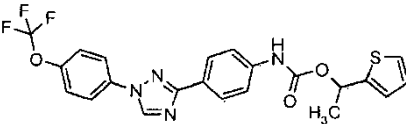
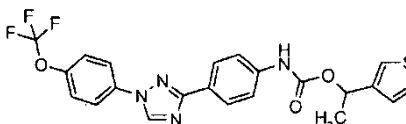
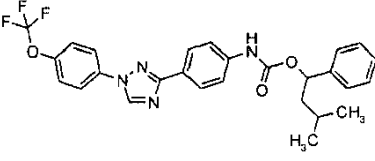
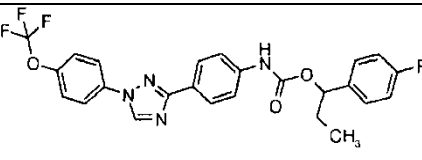
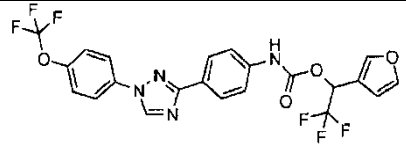
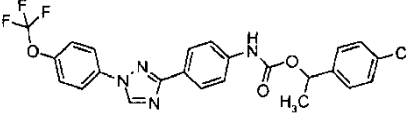
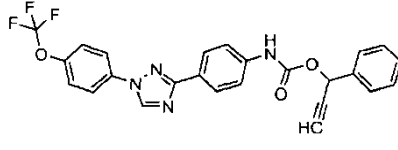
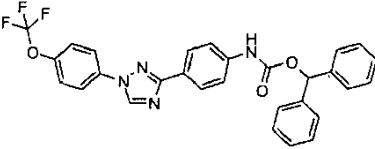
n.º	Estructura
35	
36	
37	
38	
39	
40	
41	
42	
43	
44	

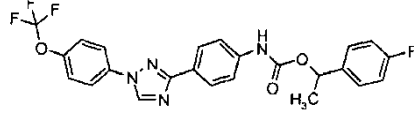
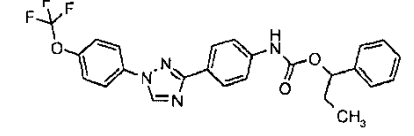
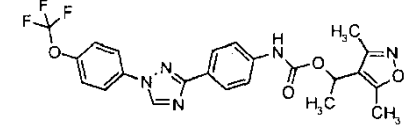
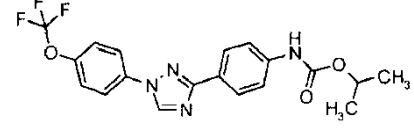
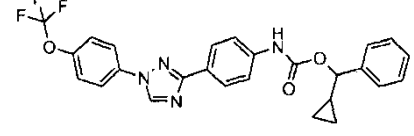
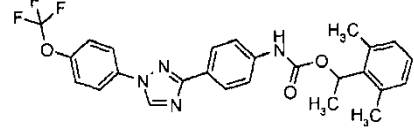
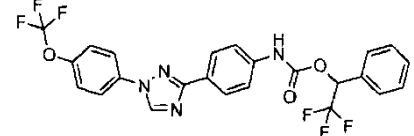
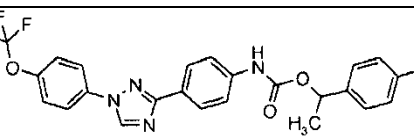
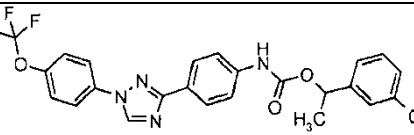
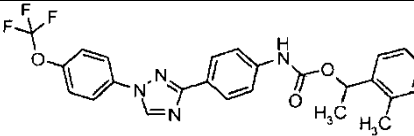
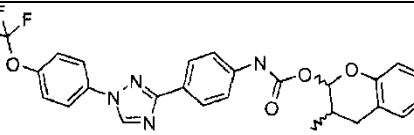


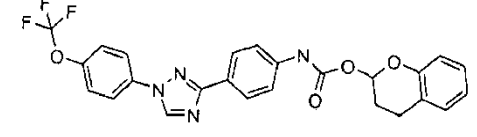
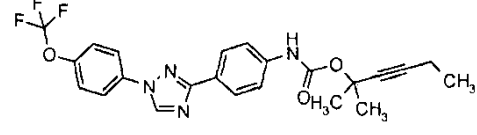
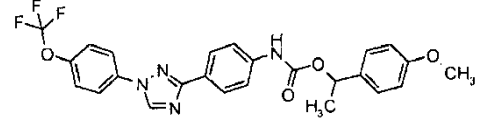
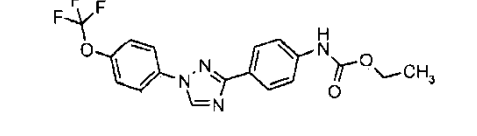
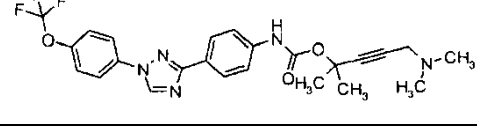
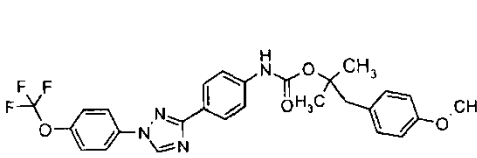
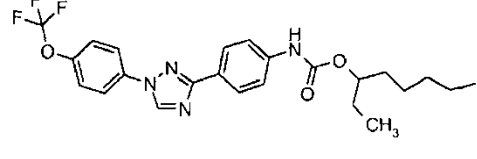
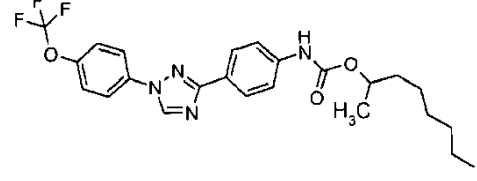
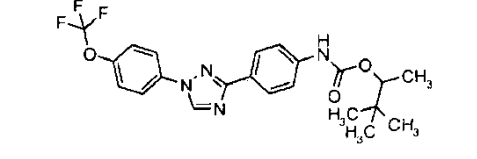
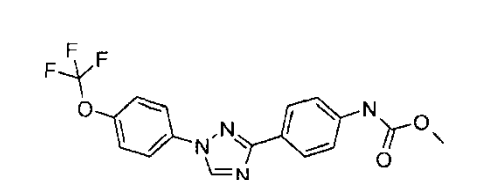
n.º	Estructura
45	
46	
47	
48	
49	
50	
51	
52	
53	
54	

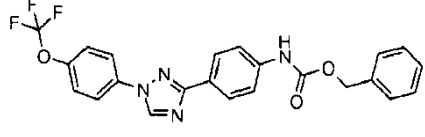
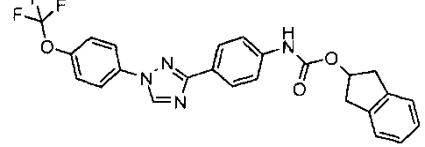
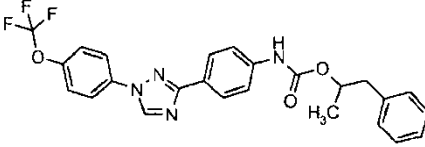
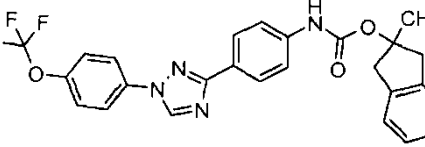
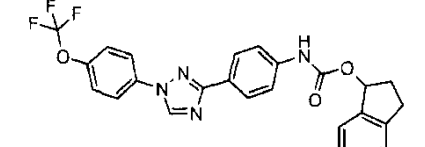
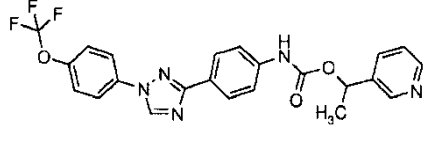
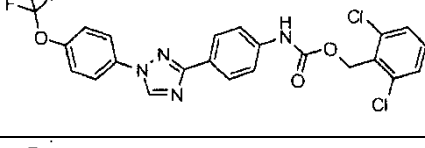
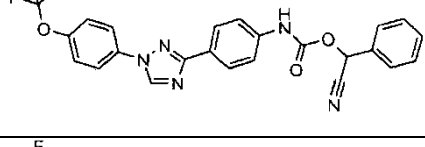
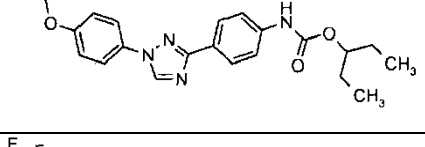
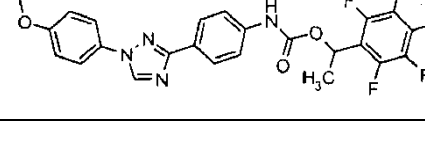
n.º	Estructura
55	
56	
57	
58	
59	
60	
61	
62	
63	
64	

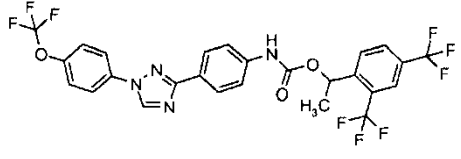
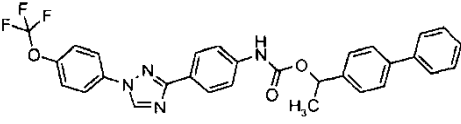
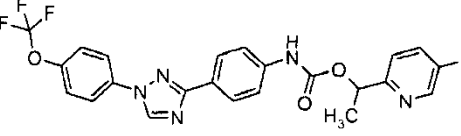
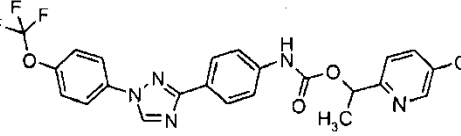
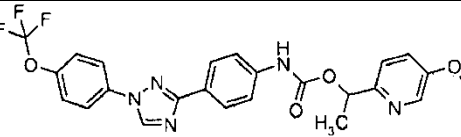
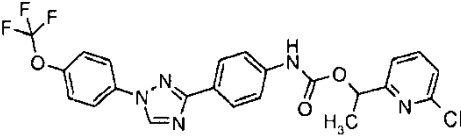
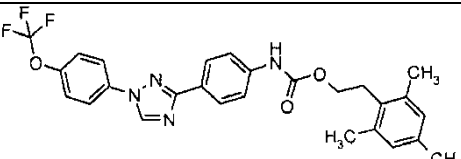
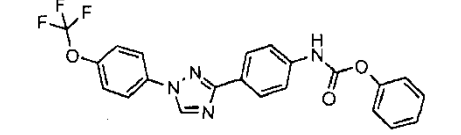
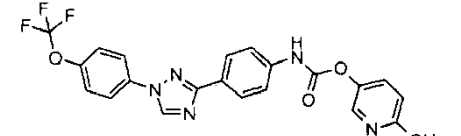
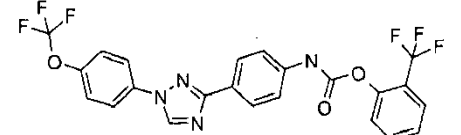
n.º	Estructura
65	
66	
67	
68	
69	
70	
71	
72	
73	

n.º	Estructura
74	
75	
76	
77	
78	
79	
80	
81	
82	
83	

n.º	Estructura
84	
85	
86	
87	
88	
89	
90	
91	
92	
93	
94	

n.º	Estructura
95	
96	
97	
98	
99	
100	
101	
102	
103	
104	

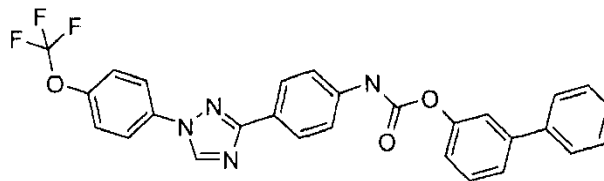
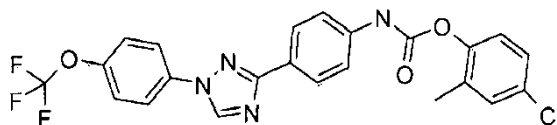
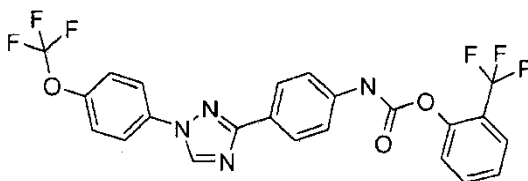
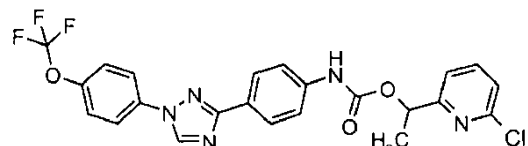
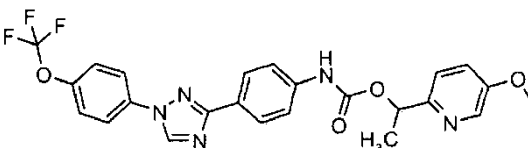
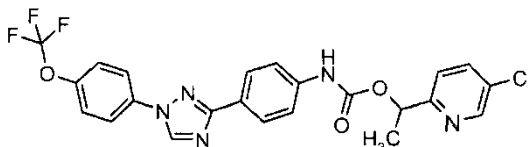
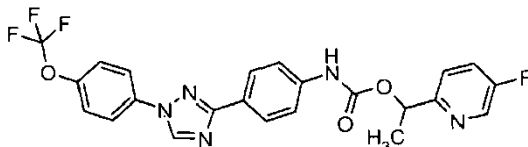
n.º	Estructura
105	
106	
107	
108	
109	
110	
111	
112	
113	
114	

n.º	Estructura
115	
116	
117	
118	
119	
120	
121	
122	
123	
124	



n.º	Estructura
125	
126	
127	
128	
129	
130	
131	
132	
133	
134	
135	
136	

4. Una molécula según la reivindicación 1 que tiene una de las siguientes estructuras



5

10 5. Un proceso para aplicar una molécula según la reivindicación 1, comprendiendo dicho proceso aplicar una molécula según la reivindicación 1, a un área para combatir una plaga, en una cantidad suficiente para combatir dicha plaga.

6. Un proceso según la reivindicación 5, en el que dicha plaga es garrapata de la remolacha (BAW), gusano del elote del maíz (CEW) o pulgón verde del melocotonero (GPA).

15 7. Una molécula que es una sal de adición de ácidos, un derivado salino, un solvato o un derivado de éster plaguicidamente aceptables de una molécula según la reivindicación 1.

8. Una molécula según la reivindicación 1, en donde al menos un H es  $^2\text{H}$  o al menos un C es  $^{14}\text{C}$ .

9. Una composición que comprende una molécula según la reivindicación 1 y al menos otro compuesto que tiene actividad de insecticida, herbicida, acaricida, nematocida o fungicida.

10. Una composición que comprende una molécula según la reivindicación 1 y una semilla.

20 11. Un proceso que comprende aplicar una molécula según la reivindicación 1 a una planta modificada genéticamente, o semilla modificada genéticamente, que se ha modificado genéticamente para expresar uno o más rasgos especializados.

12. Una molécula según la reivindicación 1 para su uso para combatir endoparásitos, ectoparásitos, o ambos, en un animal no humano, preferentemente por administración oral, dérmica o parenteral.