

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 572 155**

51 Int. Cl.:

A01N 37/34 (2006.01)
A01N 43/48 (2006.01)
C07C 255/57 (2006.01)
C07C 255/58 (2006.01)
C07C 255/60 (2006.01)
C07C 323/62 (2006.01)
C07D 213/82 (2006.01)
C07D 285/06 (2006.01)
C07D 307/68 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **12.12.2007 E 07856600 (7)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **09.03.2016 EP 2120556**

54 Título: **Compuestos insecticidas**

30 Prioridad:

21.12.2006 GB 0625597
26.07.2007 GB 0714571
06.09.2007 GB 0717339
25.10.2007 GB 0721001

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:
30.05.2016

73 Titular/es:

SYNGENTA PARTICIPATIONS AG (100.0%)
SCHWARZWALDALLEE 215
4058 BASEL, CH

72 Inventor/es:

JUNG, PIERRE;
GODFREY, CHRISTOPHER RICHARD AYLES;
LUTZ, WILLIAM;
MAIENFISCH, PETER;
STOLLER, ANDRÉ y
ZAMBACH, WERNER

74 Agente/Representante:

LEHMANN NOVO, María Isabel

Observaciones :

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

ES 2 572 155 T3

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

DESCRIPCIÓN

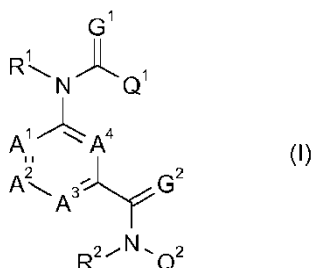
Compuestos insecticidas

La presente invención se refiere a ciertos derivados de bisamidas aromáticas, a procedimientos e intermedios para prepararlos, a composiciones insecticidas, acaricidas, molusquicidas y nematocidas que los comprenden, y a métodos para usarlos para combatir y controlar plagas de insectos, ácaros, moluscos y nematodos.

Los derivados de bisamidas aromáticas con propiedades insecticidas se describen, por ejemplo, en los documentos EP 1.714.958, JP 2006/306771, WO 06/137376, WO 06/137395 y WO 07/017075.

Ahora se ha encontrado sorprendentemente que ciertos derivados de bisamidas aromáticas que tienen al menos un sustituyente ciano, tiocianato, aminotiocarbonilo, *N*-alquil C₁-C₄-aminotiocarbonilo, o *N,N*-dialquil C₁-C₄-aminotiocarbonilo en el anillo aromático central tienen propiedades insecticidas.

La presente invención proporciona por lo tanto un compuesto de fórmula (I):



en la que

A¹, A², A³ y A⁴ son independientemente entre sí C-R³, C-R⁵ o nitrógeno, con la condición de que al menos uno de A¹, A², A³ y A⁴ sea C-R³ y no más de dos de A¹, A², A³ y A⁴ sean nitrógeno;

R¹ y R² son, independientemente el uno del otro, hidrógeno, alquilo de C₁-C₄, alquenilo de C₂-C₄, alquinilo de C₂-C₄, alquilo de C₁-C₄-carbonilo, hidroxilo, alquilo de C₁-C₄-carboniloxi, arilcarboniloxi o arilcarboniloxi, en el que el anillo arilo está sustituido con uno a cinco sustituyentes independientemente seleccionados de halógeno, alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₄, alcoxi de C₁-C₄ o haloalcoxi de C₁-C₄; G¹ y G² son, independientemente el uno del otro, oxígeno o azufre;

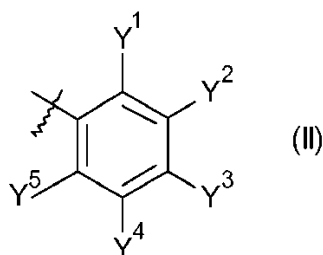
cada R³ es ciano;

cada R⁵ es independientemente hidrógeno, halógeno, alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₄ o alcoxi de C₁-C₄;

Q¹ es arilo o arilo sustituido con uno a cinco sustituyentes R⁶, que pueden ser iguales o diferentes, o Q¹ es heterociclilo o heterociclilo sustituido con uno a cinco sustituyentes R⁶, que pueden ser iguales o diferentes; en el que

cada R⁶ es independientemente ciano, nitro, hidroxilo, halógeno, alquilo de C₁-C₆, haloalquilo de C₁-C₆, alcoxi C₁-C₄-alquilo de C₁-C₄, alquenilo de C₂-C₆, haloalquenilo de C₂-C₆, alquinilo de C₂-C₆, haloalquinilo de C₂-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆, halocicloalquilo de C₃-C₆, alcoxi de C₁-C₆, haloalcoxi de C₁-C₆, alcoxi C₁-C₄-alcoxi de C₁-C₄, alquilo de C₁-C₆-tio, haloalquilo de C₁-C₆-tio, alquilo de C₁-C₆-sulfinilo, haloalquilo de C₁-C₆-sulfinilo, alquilo de C₁-C₆-sulfonilo, haloalquilo de C₁-C₆-sulfonilo, *N*-alquilo de C₁-C₆-amino, *N,N*-di-(alquilo de C₁-C₆)amino, *N,N*-di-(alquilo de C₁-C₆)aminocarbonilo, *N,N*-di-(alquilo de C₁-C₆)aminosulfonilo, alquilo de C₁-C₆-carbonilo, alquilo de C₁-C₆-carboniloxi, alcoxi C₁-C₆-carbonilo, alquilo de C₁-C₆-carbonilamino, arilo o arilo que está sustituido con uno a cinco sustituyentes independientemente seleccionados de ciano, nitro, hidroxilo, halógeno, alquilo de C₁-C₆, haloalquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₆ o haloalcoxi de C₁-C₆, o heteroarilo o heteroarilo que está sustituido con uno a cinco sustituyentes independientemente seleccionados de ciano, nitro, hidroxilo, halógeno, alquilo de C₁-C₆, haloalquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₆ o haloalcoxi de C₁-C₆; y

Q² es un resto de fórmula (II)



en la que

Y¹ y Y⁵ son, independientemente el uno del otro, ciano, halógeno, alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo de C₁-C₄, alquilo de C₁-C₃-tio, haloalquilo de C₁-C₃-tio, alquilo de C₁-C₃-sulfinilo, haloalquilo de C₁-C₃-sulfinilo, alquilo de C₁-C₃-sulfonilo o haloalquilo de C₁-C₃-sulfonilo;

Y³ es perfluoroalquilo de C₂-C₆, perfluoroalquilo de C₁-C₆-tio, perfluoroalquilo de C₁-C₆-sulfinilo o perfluoroalquilo de C₁-C₆-sulfonilo;

Y² y Y⁴ son, independientemente el uno del otro, hidrógeno, halógeno o alquilo de C₁-C₄;

o una sal o N-óxido del mismo.

Los compuestos de fórmula (I) pueden existir en diferentes isómeros geométricos u ópticos, o formas tautoméricas. Esta invención engloba la totalidad de dichos isómeros y tautómeros, y mezclas de los mismos, en todas las proporciones, así como formas isotópicas, tales como compuestos deuterados.

Cada resto alquilo, bien solo o como parte de un grupo mayor (tal como alcoxi, alcoxicarbonilo, alquilcarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo) es una cadena lineal o ramificada, y es, por ejemplo, metilo, etilo, *n*-propilo, *n*-butilo, *sec*-butilo, *iso*-butilo o *terc*-butilo. Los grupos alquilo son preferentemente grupos alquilo de C₁ a C₆, más preferiblemente de C₁-C₄ y muy preferiblemente grupos alquilo C₁-C₃.

Los restos alqueno y alquino (bien solos o como parte de un grupo mayor, tal como alquenilo o alquinilo) pueden encontrarse en forma de cadenas lineales o ramificadas, y los restos alqueno, en caso apropiado, pueden ser de la configuración (*E*) o (*Z*). Ejemplos son vinilo, alilo y propargilo. Los grupos alqueno y alquino son preferiblemente grupos alqueno o alqueno de C₂ a C₆, más preferiblemente de C₂-C₄ y muy preferiblemente grupos alqueno o alqueno de C₂-C₃.

Halógeno es flúor, cloro, bromo o yodo.

Los grupos haloalquilo (bien solos o como parte de un grupo mayor, tal como haloalcoxi o haloalquiltio) son grupos alquilo que están sustituidos con uno o más átomos de halógeno iguales o diferentes, y son, por ejemplo, -CF₃, -CF₂Cl, -CH₂CF₃ o -CH₂CHF₂. Los grupos perfluoroalquilo (bien solos o como parte de un grupo mayor, tal como perfluoroalquiltio) son un tipo particular de grupo haloalquilo; son grupos alquilo que están completamente sustituidos con átomos de flúor, y son, por ejemplo, -CF₃, -CF₂CF₃ o -CF(CF₃)₂.

Los grupos haloalqueno y haloalquino (bien solos o como parte de un grupo mayor, tal como haloalqueno o haloalquino) son grupos alqueno y alquino, respectivamente, que están sustituidos con uno o más átomos de halógeno iguales o diferentes, y son, por ejemplo, -CH=CF₂, -CCl=CClF o -CClC≡CH.

Los grupos cicloalquilo pueden encontrarse en forma mono- o bicíclica, y pueden estar sustituidos opcionalmente con uno o más grupos metilo. Los grupos cicloalquilo contienen preferiblemente 3 a 8 átomos de carbono, más preferiblemente 3 a 6 átomos de carbono. Ejemplos de grupos cicloalquilo monocíclicos son ciclopropilo, 1-metilciclopropilo, 2-metilciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo.

Los grupos halocicloalquilo son grupos cicloalquilo que están sustituidos con uno o más átomos de halógeno iguales o diferentes, y pueden estar sustituidos opcionalmente con uno o más grupos metilo. Ejemplos de grupos halocicloalquilo monocíclicos son 2,2-dicloro-ciclopropilo, 2,2-dicloro-1-metil-ciclopropilo y 2-cloro-4-fluorociclohexilo.

En el contexto de la presente memoria descriptiva, el término "arilo" se refiere a un sistema anular que puede ser mono-, bi- o tricíclico. Ejemplos de tales anillos incluyen fenilo, naftalenilo, antraceno, indenilo o fenantrenilo. Un grupo arilo preferido es fenilo.

El término "heteroarilo" se refiere a un sistema anular aromático que contiene al menos un heteroátomo y consiste en un solo anillo o dos o más anillos condensados. Preferentemente, los anillos individuales contienen hasta tres, y los sistemas bicíclicos hasta cuatro heteroátomos que se seleccionarán preferentemente de nitrógeno, oxígeno y azufre. Ejemplos de tales grupos incluyen piridilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, furanilo, tiofenilo, oxazolilo, isoxazolilo, oxadiazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, tiadiazolilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, triazolilo y tetrazolilo. Un

grupo heteroarilo preferido es piridina. Ejemplos de grupos bicíclicos son benzotiofenilo, bencimidazolilo, benzotiadiazolilo, quinolinilo, cinolinilo y quinoxalinilo.

El término "heterociclilo" se define de modo que incluye heteroarilo y adicionalmente sus análogos insaturados o parcialmente insaturados tales como 4,5,6,7-tetrahidro-benzotiofenilo, 9*H*-fluorenilo, 3,4-dihidro-2*H*-benzo-1,4-tioxepinilo, 2,3-dihidro-benzofuranilo, piperidinilo, 1,3-dioxolanilo, 1,3-dioxanilo, 4,5-dihidro-isoxazolilo, tetrahidrofuranilo y morfolinilo.

Valores preferidos de A¹, A², A³, A⁴, R¹, R², G¹, G², R³, R⁵, Q¹, R⁶, Q², Y¹, Y², Y³, Y⁴, Y⁵, Y⁶, Y⁷, Y⁸ y Y⁹ son, en cualquier combinación, como se expone a continuación.

Preferiblemente A¹ es C-R³ o C-R⁵.

10 Preferiblemente, A² es C-R³ o C-R⁵.

Preferiblemente, A³ es C-R³ o C-R⁵.

Preferiblemente, A⁴ es C-R³ o C-R⁵.

Preferiblemente, uno, dos o tres de A¹, A², A³ y A⁴ son C-R³.

Más preferiblemente, uno o dos de A¹, A², A³ y A⁴ son C-R³.

15 Más preferiblemente, uno de A¹, A², A³ y A⁴ es C-R³.

Preferiblemente, R¹ es hidrógeno, metilo, etilo, alilo, propargilo, acetilo hidroxilo, acetiloxilo o benzoiloxilo.

Más preferiblemente, R¹ es hidrógeno, metilo, etilo, alilo, propargilo, acetilo o hidroxilo.

Aún más preferiblemente, R¹ es hidrógeno, metilo o etilo.

Todavía más preferiblemente, R¹ es hidrógeno o metilo.

20 Más preferiblemente, R¹ es hidrógeno.

Preferiblemente, R² es hidrógeno, metilo, etilo, alilo, propargilo, acetilo hidroxilo, acetiloxilo o benzoiloxilo.

Más preferiblemente, R² es hidrógeno, metilo, etilo, alilo, propargilo, acetilo o hidroxilo.

Aún más preferiblemente, R² es hidrógeno, metilo o etilo.

Todavía más preferiblemente, R² es hidrógeno o metilo.

25 Más preferiblemente, R² es hidrógeno.

Preferiblemente, G¹ es oxígeno.

Preferiblemente, G² es oxígeno.

Preferiblemente, cada R⁵ es independientemente hidrógeno, fluoro, cloro, bromo, metilo, trifluorometilo o metoxi.

Más preferiblemente, cada R⁵ es independientemente hidrógeno, fluoro, cloro, bromo, metilo o trifluorometilo.

30 Aún más preferiblemente, cada R⁵ es independientemente hidrógeno, fluoro, metilo o trifluorometilo.

Todavía más preferiblemente, cada R⁵ es independientemente hidrógeno o fluoro.

Más preferiblemente, cada R⁵ es hidrógeno.

Preferiblemente, Q¹ es arilo o arilo sustituido con uno a cinco sustituyentes R⁶, que pueden ser iguales o diferentes, o Q¹ es heteroarilo o heteroarilo sustituido con uno a cinco sustituyentes R⁶, que pueden ser iguales o diferentes.

35 Más preferiblemente, Q¹ es fenilo, piridilo, furanilo, tiofenilo, pirazolilo o 1,2,3-tiadiazolilo, o fenilo, piridilo, furanilo, tiofenilo, pirazolilo o 1,2,3-tiadiazolilo sustituido con uno a cuatro sustituyentes independientemente seleccionados de ciano, nitro, hidroxilo, bromo, cloro, fluoro, metilo, trifluorometilo, metoxi, trifluorometoxi, metiltio, metilsulfonilo, metilsulfonilo o fenilo. Ejemplos de tales grupos más preferidos para Q¹ son 5-bromo-furan-2-ilo, 2-bromo-fenilo, 5-bromo-pirid-3-ilo, 2-cloro-4-fluoro-fenilo, 3-cloro-2-fluoro-fenilo, 5-cloro-2-fluoro-fenilo, 3-cloro-2-metil-fenilo, 2-cloro-4-nitro-fenilo, 2-cloro-5-nitro-fenilo, 2-cloro-fenilo, 3-cloro-fenilo, 2-cloro-pirid-3-ilo, 2-cloro-pirid-4-ilo, 6-cloro-pirid-3-ilo, 5-cloro-tiofen-2-ilo, 3-cloro-5-trifluorometilpirid-2-ilo, 4-ciano-2-fluoro-fenilo, 4-ciano-fenilo, 2,5-dicloro-fenilo, 2,3-difluoro-fenilo, 1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-ilo, 2-fluoro-fenilo, 4-fluoro-fenilo, 2-fluoro-pirid-3-ilo, 2-fluoro-3-trifluorometil-fenilo, 2-fluoro-5-trifluorometil-fenilo, 4-fluoro-3-trifluorometil-fenilo, furan-2-ilo, 2-metoxi-fenilo, 2-metil-fenilo, 3-metil-

pirid-2-ilo, 4-metil-1,2,3-tiadiazol-5-ilo, 4-metiltio-fenilo, 2-metiltio-pirid-3-ilo, 4-nitro-fenilo, fenilo, pirid-3-ilo, pirid-4-ilo, 1,2,3-tiadiazol-4-ilo, tiofen-2-ilo, 2-trifluorometoxi-fenilo, 4-trifluorometoxi-fenilo, 2-trifluorometil-fenilo y 4-trifluorometil-fenilo.

5 Aún más preferiblemente, Q¹ es fenilo, piridilo, furanilo, tiofenilo, pirazolilo o 1,2,3-tiadiazolilo, o fenilo, piridilo, furanilo, tiofenilo, pirazolilo o 1,2,3-tiadiazolilo sustituido con uno a tres sustituyentes independientemente seleccionados de ciano, nitro, hidroxilo, bromo, cloro, fluoro, metilo, trifluorometilo, metoxi, metiltio, metilsulfinilo, metilsulfonilo o fenilo.

10 Todavía más preferiblemente, Q¹ es fenilo o piridilo, o fenilo o piridilo sustituido con uno a dos sustituyentes independientemente seleccionados de ciano, hidroxilo, cloro, fluoro, metilo, trifluorometilo, metoxi, metiltio, metilsulfinilo, metilsulfonilo o fenilo.

Más preferiblemente, Q¹ es fenilo sustituido con uno a dos sustituyentes seleccionados de cloro, fluoro o metilo.

En una realización preferida, Q¹ es 2-cloro-4-fluoro-fenilo.

En una realización preferida, Q¹ es 3-cloro-2-fluoro-fenilo.

En una realización preferida, Q¹ es 5-cloro-2-fluoro-fenilo.

15 En una realización preferida, Q¹ es 3-cloro-2-metil-fenilo.

En una realización preferida, Q¹ es 2-cloro-fenilo.

En una realización preferida, Q¹ es 3-cloro-fenilo.

En una realización preferida, Q¹ es 4-ciano-fenilo.

En una realización preferida, Q¹ es 2,5-dicloro-fenilo.

20 En una realización preferida, Q¹ es 2,3-difluoro-fenilo.

En una realización preferida, Q¹ es 2-fluoro-fenilo.

En una realización preferida, Q¹ es 4-fluoro-fenilo.

En una realización preferida, Q¹ es 2-metil-fenilo.

25 Un grupo de compuestos particularmente preferido son los compuestos de fórmula (I) en la que Q¹ es arilo o arilo sustituido con uno a cinco sustituyentes R⁶, que pueden ser iguales o diferentes.

Preferiblemente, Q¹ es fenilo o fenilo sustituido con uno a cuatro sustituyentes independientemente seleccionados de ciano, nitro, hidroxilo, bromo, cloro, fluoro, metilo, trifluorometilo, metoxi, trifluorometoxi, metiltio, metilsulfinilo, metilsulfonilo o fenilo.

30 Más preferiblemente, Q¹ es fenilo o fenilo sustituido con uno a tres sustituyentes independientemente seleccionados de ciano, nitro, hidroxilo, bromo, cloro, fluoro, metilo, trifluorometilo, metoxi, metiltio, metilsulfinilo, metilsulfonilo o fenilo.

Aún más preferiblemente, Q¹ es fenilo o fenilo sustituido con uno a dos sustituyentes independientemente seleccionados de ciano, hidroxilo, cloro, fluoro, metilo, trifluorometilo, metoxi, metiltio, metilsulfinilo, metilsulfonilo o fenilo.

35 Otro grupo de compuestos particularmente preferido son los compuestos de fórmula (I) en la que Q¹ es heterociclilo o heterociclilo sustituido con uno a cinco sustituyentes R⁶, que pueden ser iguales o diferentes. El grupo heterociclilo es preferiblemente un grupo heteroarilo.

40 Preferiblemente, Q¹ es piridilo, furanilo, tiofenilo, pirazolilo o 1,2,3-tiadiazolilo, o piridilo, furanilo, tiofenilo, pirazolilo o 1,2,3-tiadiazolilo sustituido con uno a cuatro sustituyentes independientemente seleccionados de ciano, nitro, hidroxilo, bromo, cloro, fluoro, metilo, trifluorometilo, metoxi, trifluorometoxi, metiltio, metilsulfinilo, metilsulfonilo o fenilo.

Más preferiblemente, Q¹ es piridilo, furanilo, tiofenilo, pirazolilo o 1,2,3-tiadiazolilo, o piridilo, furanilo, tiofenilo, pirazolilo o 1,2,3-tiadiazolilo sustituido con uno a tres sustituyentes independientemente seleccionados de ciano, nitro, hidroxilo, bromo, cloro, fluoro, metilo, trifluorometilo, metoxi, metiltio, metilsulfinilo, metilsulfonilo o fenilo.

45 Aún más preferiblemente, Q¹ es piridilo o piridilo sustituido con uno a dos sustituyentes independientemente seleccionados de ciano, hidroxilo, cloro, fluoro, metilo, trifluorometilo, metoxi, metiltio, metilsulfinilo, metilsulfonilo o fenilo.

Más preferiblemente, Q¹ es piridilo sustituido con uno a dos sustituyentes independientemente seleccionados de cloro, fluoro o metilo.

5 Preferiblemente, cada R⁶ es independientemente ciano, nitro, hidroxilo, halógeno, alquilo de C₁-C₆, haloalquilo de C₁-C₆, alcoxi C₁-C₄-alquilo de C₁-C₄, cicloalquilo de C₃-C₆, alcoxi de C₁-C₆, haloalcoxi de C₁-C₆, alcoxi C₁-C₄-alcoxi de C₁-C₄, alquilo de C₁-C₆-tio, alquilo de C₁-C₆-sulfonilo, *N,N*-di-(alquilo de C₁-C₆)amino, *N,N*-di-(alquilo de C₁-C₆)aminocarbonilo, *N,N*-di-(alquilo de C₁-C₆)aminosulfonilo, alquilo de C₁-C₆-carbonilo, alquilo de C₁-C₆-carboniloxi, alcoxi C₁-C₆-carbonilo o alquilo de C₁-C₆-carbonilamino.

10 Más preferiblemente, cada R⁶ es independientemente ciano, nitro, hidroxilo, bromo, cloro, fluoro, yodo, metilo, etilo, *n*-propilo, prop-2-ilo, *n*-butilo, *tert*-butilo, clorometilo, trifluorometilo, metoximetilo, ciclopropilo, metoxi, etoxi, trifluorometoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-metoxi-etoxi, metiltio, etiltio, *n*-propiltio, *n*-butiltio, metilsulfonilo, prop-2-ilsulfonilo, *N,N*-dimetilamino, *N,N*-dimetilaminocarbonilo, *N,N*-dimetilaminosulfonilo, metilcarbonilo, metilcarboniloxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, metilcarbonilamino, arilo o arilo que está sustituido con uno a cinco sustituyentes independientemente seleccionados de ciano, nitro, hidroxilo, cloro, fluoro, metilo, etilo, trifluorometilo, metoxi o trifluorometoxi, o heteroarilo o heteroarilo que está sustituido con uno a cinco sustituyentes independientemente seleccionados de ciano, nitro, hidroxilo, cloro, fluoro, metilo, etilo, trifluorometilo, metoxi o trifluorometoxi.

Más preferiblemente, cada R⁶ es independientemente ciano, nitro, cloro, fluoro, metilo, trifluorometilo, metoxi, trifluorometoxi, metiltio, *N,N*-dimetilamino o metoxicarbonilo.

Preferiblemente, Q² es un resto de fórmula (II).

Preferiblemente, Y¹ es ciano, halógeno, metilo, etilo, trifluorometilo o metoximetilo.

20 Más preferiblemente, Y¹ es ciano, bromo, cloro, metilo, etilo, trifluorometilo o metoximetilo.

Aún más preferiblemente, Y¹ es bromo, cloro, metilo, etilo o metoximetilo.

Todavía más preferiblemente, Y¹ es bromo, metilo o etilo.

Aún más preferiblemente, Y¹ es metilo o etilo.

Más preferiblemente, Y¹ es metilo.

25 Preferiblemente, Y² es hidrógeno, cloro, fluoro o metilo.

Más preferiblemente, Y² es hidrógeno.

Preferiblemente, Y³ es heptafluoropropilo, heptafluoroprop-2-ilo, heptafluoropropiltio, heptafluoropropilsulfonilo, heptafluoropropilsulfonilo, heptafluoroprop-2-iltio, heptafluoroprop-2-ilsulfonilo, heptafluoroprop-2-ilsulfonilo o nonafluorobut-2-ilo.

30 En una realización, Y³ es perfluoroalquilo de C₂-C₆, más preferiblemente, Y³ es heptafluoroprop-2-ilo o nonafluorobut-2-ilo.

En una realización, Y³ es heptafluoroprop-2-ilo.

En una realización, Y³ es nonafluorobut-2-ilo.

Preferiblemente, Y⁴ es hidrógeno, cloro, fluoro o metilo.

35 Más preferiblemente, Y⁴ es hidrógeno.

Preferiblemente, Y⁵ es ciano, halógeno, metilo, etilo o trifluorometilo.

Más preferiblemente, Y⁵ es ciano, bromo, cloro, metilo, etilo o trifluorometilo.

Aún más preferiblemente, Y⁵ es bromo, cloro, metilo o etilo.

Todavía más preferiblemente, Y⁵ es bromo, metilo o etilo.

40 Aún más preferiblemente, Y⁵ es metilo o etilo.

Más preferiblemente, Y⁵ es metilo.

Preferiblemente, Y⁶ es ciano, halógeno, metilo, etilo, trifluorometilo o metoximetilo.

Más preferiblemente, Y⁶ es ciano, bromo, cloro, metilo, etilo, trifluorometilo o metoximetilo.

Aún más preferiblemente, Y⁶ es bromo, cloro, metilo, etilo o metoximetilo.

Todavía más preferiblemente, Y⁶ es bromo, metilo o etilo.

Aún más preferiblemente, Y⁶ es metilo o etilo.

Más preferiblemente, Y⁶ es metilo.

Preferiblemente, Y⁷ es hidrógeno, cloro, fluoro o metilo.

5 Más preferiblemente, Y⁷ es hidrógeno.

Preferiblemente, Y⁸ es heptafluoropropilo, heptafluoroprop-2-ilo, heptafluoropropiltio, heptafluoropropilsulfinilo, heptafluoropropilsulfonilo, heptafluoroprop-2-iltio, heptafluoroprop-2-ilsulfinilo, heptafluoroprop-2-ilsulfonilo o nonafluorobut-2-ilo.

10 En una realización, Y⁸ es perfluoroalquilo de C₂-C₆, más preferiblemente, Y⁸ es heptafluoroprop-2-ilo o nonafluorobut-2-ilo.

En una realización, Y⁸ es heptafluoroprop-2-ilo.

En una realización, Y⁸ es nonafluorobut-2-ilo.

Preferiblemente, Y⁹ es ciano, halógeno, metilo, etilo, trifluorometilo o metoximetilo.

Más preferiblemente, Y⁹ es ciano, bromo, cloro, metilo, etilo, trifluorometilo o metoximetilo.

15 Aún más preferiblemente, Y⁹ es bromo, cloro, metilo, etilo o metoximetilo.

Todavía más preferiblemente, Y⁹ es bromo, metilo o etilo.

Aún más preferiblemente, Y⁹ es metilo o etilo.

Más preferiblemente, Y⁹ es metilo.

Una realización preferida son los compuestos de fórmula (Ia) en la que A¹ es C-CN, y A², A³, A⁴ son CH.

20 Una realización preferida son los compuestos de fórmula (Ib) en la que A² es C-CN, y A¹, A³, y A⁴ son CH.

Una realización preferida son los compuestos de fórmula (Ic) en la que A³ es C-CN, y A¹, A², y A⁴ son CH.

Una realización preferida son los compuestos de fórmula (Id) en la que A⁴ es C-CN, y A¹, A², y A³ son CH.

Una realización preferida son los compuestos de fórmula (Ie) en la que A¹ es C-CN, A⁴ es C-F, y A² y A³ son CH.

Una realización preferida son los compuestos de fórmula (If) en la que A¹ es C-CN, A² y A⁴ son C-F, y A³ es CH.

25 En una realización preferida, Q² es 2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo.

En una realización preferida, Q² es 2-etil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo.

En una realización preferida, Q² es 2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo.

En una realización preferida, Q² es 2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo.

En una realización preferida, Q² es 2-bromo-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo.

30 En una realización preferida, Q² es 2-bromo-6-etil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo.

En una realización preferida, Q² es 2,6-dicloro-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo.

En una realización preferida, Q² es 2,6-dibromo-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo.

En una realización preferida, Q² es 2,6-dimetil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo.

En una realización preferida, Q² es 2-etil-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo.

35 En una realización preferida, Q² es 2,6-dietil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo.

En una realización preferida, Q² es 2-metoximetil-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo.

En una realización preferida, Q² es 2-bromo-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo.

En una realización preferida, Q² es 2-bromo-6-etil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo.

En una realización preferida, Q² es 2,6-dicloro-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo.

En una realización preferida, Q² es 2,6-dibromo-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo.

5 En una realización de la invención, R¹ y R² son, independientemente el uno del otro, hidrógeno, alquilo de C₁-C₄, o alquilo de C₁-C₄-carbonilo. Las preferencias para R¹ y R² son las mismas como se exponen para los compuestos de fórmula (I) salvo que R¹ y R² no pueden ser alilo, propargilo, hidroxilo, acetiloxi o benzoiloxi.

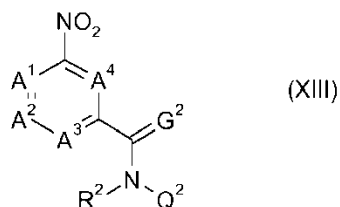
En una realización de la invención, cada R⁵ es independientemente hidrógeno, halógeno, alquilo de C₁-C₄ o trifluorometilo. Las preferencias para R⁵ son las mismas como se exponen para los compuestos de fórmula (I) salvo que R⁵ no puede ser metoxi.

10 En una realización de la invención, cada R⁶ es independientemente ciano, nitro, hidroxilo, halógeno, alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₄, alqueno de C₂-C₄, haloalqueno de C₂-C₄, alquino de C₂-C₄, haloalquino de C₂-C₄, cicloalquilo de C₃-C₆, halocicloalquilo de C₃-C₆, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, alquilo de C₁-C₃-tio, haloalquilo de C₁-C₃-tio, alquilo de C₁-C₃-sulfinilo, haloalquilo de C₁-C₃-sulfinilo, alquilo de C₁-C₃-sulfonilo, haloalquilo de C₁-C₃-sulfonilo, N-alquilo de C₁-C₄-amino, N,N-di-(alquilo de C₁-C₄)amino, alquilo de C₁-C₄-carbonilo, alquilo de C₁-C₄-carboniloxi, alcoxi C₁-C₄-carbonilo, alquilo de C₁-C₄-carbonilamino o fenilo. Las preferencias para R⁶ son las mismas como se exponen para los compuestos de fórmula (I).

En una realización de la invención, Y¹ y Y⁵ son, independientemente el uno del otro, ciano, halógeno, alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₄, alquilo de C₁-C₃-tio, haloalquilo de C₁-C₃-tio, alquilo de C₁-C₃-sulfinilo, haloalquilo de C₁-C₃-sulfinilo, alquilo de C₁-C₃-sulfonilo o haloalquilo de C₁-C₃-sulfonilo. Las preferencias para Y¹ y Y⁵ son las mismas como se exponen para los compuestos de fórmula (I) salvo que Y¹ no puede ser metoximetilo.

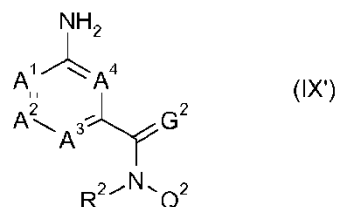
20 En una realización de la invención, Y⁶ y Y⁹ son, independientemente el uno del otro, ciano, halógeno, alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₄, alquilo de C₁-C₃-tio, haloalquilo de C₁-C₃-tio, alquilo de C₁-C₃-sulfinilo, haloalquilo de C₁-C₃-sulfinilo, alquilo de C₁-C₃-sulfonilo o haloalquilo de C₁-C₃-sulfonilo. Las preferencias para Y⁶ y Y⁹ son las mismas como se exponen para los compuestos de fórmula (I) salvo que Y⁶ y Y⁹ no pueden ser metoximetilo.

25 Determinados intermedios son nuevos y como tales forman un aspecto adicional de la invención. Un grupo de nuevos intermedios son compuestos de fórmula (XIII)



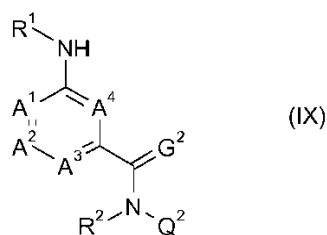
en la que A¹, A², A³, A⁴, R², G² y Q² son como se definen en relación con la fórmula I; o sales o N-óxidos de los mismos. Las preferencias para A¹, A², A³, A⁴, R², G² y Q² son las mismas que las preferencias expuestas para los sustituyentes correspondientes de los compuestos de la fórmula (I).

30 Otro grupo de nuevos intermedios son compuestos de fórmula (IX')



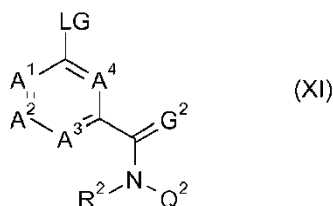
en la que A¹, A², A³, A⁴, R², G² y Q² son como se definen en relación con la fórmula I; o sales o N-óxidos de los mismos. Las preferencias para A¹, A², A³, A⁴, R², G² y Q² son las mismas que las preferencias expuestas para los sustituyentes correspondientes de los compuestos de la fórmula (I).

35 Un grupo adicional de nuevos intermedios son compuestos de fórmula (IX)



en la que A¹, A², A³, A⁴, R¹, R², G² y Q² son como se definen en relación con la fórmula I; o sales o N-óxidos de los mismos. Las preferencias para A¹, A², A³, A⁴, R¹, R², G² y Q² son las mismas que las preferencias expuestas para los sustituyentes correspondientes de los compuestos de la fórmula (I).

5 Otro grupo de nuevos intermedios son compuestos de fórmula (XI)



en donde A¹, A², A³, A⁴, R², G², y Q² son como se definen en relación con la fórmula I y LG es un grupo saliente; o sales o N-óxidos de los mismos. Las preferencias para A¹, A², A³, A⁴, R², G² y Q² son las mismas que las preferencias expuestas para los correspondientes sustituyentes de los compuestos de la fórmula (I). Preferiblemente LG es halógeno, más preferiblemente fluoro o cloro, muy preferiblemente fluoro.

10

Los compuestos en las Tablas 1 a 63 más abajo ilustran los compuestos de la invención.

Tabla 1:

La tabla 1 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ia) en la que Q² es 2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores listados en la tabla siguiente.

<p style="text-align: right;">(Ia)</p>	
Número de compuesto	Q ¹
1.01	5-bromo-furan-2-ilo
1.02	2-bromo-fenilo
1.03	5-bromo-pirid-3-ilo
1.04	2-cloro-4-fluoro-fenilo
1.05	5-cloro-2-fluoro-fenilo
1.06	2-cloro-4-nitro-fenilo
1.07	2-cloro-5-nitro-fenilo
1.08	2-cloro-fenilo
1.09	3-cloro-fenilo
1.10	2-cloro-pirid-3-ilo

Número de compuesto	Q ¹
1.11	2-cloro-pirid-4-ilo
1.12	6-cloro-pirid-3-ilo
1.13	5-cloro-tiofen-2-ilo
1.14	3-cloro-5-trifluorometil-pirid-2-ilo
1.15	4-ciano-fenilo
1.16	2,5-dicloro-fenilo
1.17	2,3-difluoro-fenilo
1.18	1,3-dimetil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
1.19	2-fluoro-fenilo
1.20	4-fluoro-fenilo
1.21	2-fluoro-pirid-3-ilo
1.22	2-fluoro-3-trifluorometil-fenilo
1.23	2-fluoro-5-trifluorometil-fenilo
1.24	4-fluoro-3-trifluorometil-fenilo
1.25	furan-2-ilo
1.26	2-metoxi-fenilo
1.27	2-metil-fenilo
1.28	3-metil-pirid-2-ilo
1.29	4-metil-1,2,3-tiadiazol-5-ilo
1.30	2-metiltio-pirid-3-ilo
1.31	4-nitro-fenilo
1.32	fenilo
1.33	1,2,3-tiadiazol-4-ilo
1.34	tiofen-2-ilo
1.35	2-trifluorometoxi-fenilo
1.36	4-trifluorometoxi-fenilo
1.37	2-trifluorometil-fenilo
1.38	4-trifluorometil-fenilo

Tabla 2:

La Tabla 2 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ia) en la que Q² es 2-etil-6-metil-4-(hepta-fluoroprop-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

5 Tabla 3:

La Tabla 3 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ia) en la que Q² es 2,6-dietil-4-(heptafluoro-prop-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

Tabla 4:

La Tabla 4 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ia) en la que Q² es 2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

Tabla 5:

5 La Tabla 5 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ia) en la que Q² es 2-bromo-6-metil-4-(hepta-fluoroprop-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

Tabla 6:

La Tabla 6 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ia) en la que Q² es 2-bromo-6-etil-4-(hepta-fluoroprop-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

Tabla 7:

10 La Tabla 7 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ia) en la que Q² es 2,6-dicloro-4-(heptafluoro-prop-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

Tabla 8:

La Tabla 8 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ia) en la que Q² es 2,6-dibromo-4-(heptafluoro-prop-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

15 Tabla 9:

La Tabla 9 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ia) en la que Q² es 2,6-dimetil-4-(nonafluoro-but-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

Tabla 10:

20 La Tabla 10 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ia) en la que Q² es 2-etil-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

Tabla 11:

La Tabla 11 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ia) en la que Q² es 2,6-dietil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

Tabla 12:

25 La Tabla 12 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ia) en la que Q² es 2-metoximetil-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

Tabla 13:

La Tabla 13 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ia) en la que Q² es 2-bromo-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

30 Tabla 14:

La Tabla 14 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ia) en la que Q² es 2-bromo-6-etil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

Tabla 15:

35 La Tabla 15 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ia) en la que Q² es 2,6-dicloro-4-(nonafluoro-but-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

Tabla 16:

La Tabla 16 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ia) en la que Q² es 2,6-dibromo-4-(nonafluoro-but-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

Tabla 17:

40 La Tabla 17 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ia') en la que Q² es 2,6-dimetil-4-(heptafluoro-prop-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores listados en la tabla siguiente.

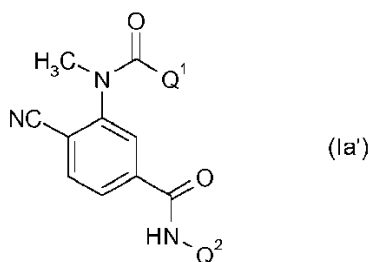


Tabla 18:

La Tabla 18 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ia') en la que Q² es 2-etil-6-metil-4-(hepta-fluoroprop-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

5 Tabla 19:

La Tabla 19 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ia') en la que Q² es 2,6-dietil-4-(heptafluoro-prop-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

Tabla 20:

10 La Tabla 20 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ia') en la que Q² es 2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

Tabla 21:

La Tabla 21 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ia') en la que Q² es 2-bromo-6-metil-4-(hepta-fluoroprop-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

Tabla 22:

15 La Tabla 22 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ia') en la que Q² es 2-bromo-6-etil-4-(hepta-fluoroprop-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

Tabla 23:

La Tabla 23 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ia') en la que Q² es 2,6-dicloro-4-(heptafluoro-prop-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

20 Tabla 24:

La Tabla 24 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ia') en la que Q² es 2,6-dibromo-4-(heptafluoro-prop-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

Tabla 25:

25 La Tabla 25 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ia') en la que Q² es 2,6-dimetil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

Tabla 26:

La Tabla 26 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ia') en la que Q² es 2-etil-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

Tabla 27:

30 La Tabla 27 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ia') en la que Q² es 2,6-dietil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

Tabla 28:

La Tabla 28 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ia') en la que Q² es 2-metoximetil-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

35 Tabla 29:

La Tabla 29 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ia') en la que Q² es 2-bromo-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

Tabla 30:

La Tabla 30 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ia') en la que Q² es 2-bromo-6-etil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

Tabla 31:

- 5 La Tabla 31 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ia') en la que Q² es 2,6-dicloro-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

Tabla 32:

La Tabla 32 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ia') en la que Q² es 2,6-dibromo-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

10 Tabla 33:

La Tabla 33 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ib) en la que Q² es 2,6-dimetil-4-(heptafluoro-prop-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

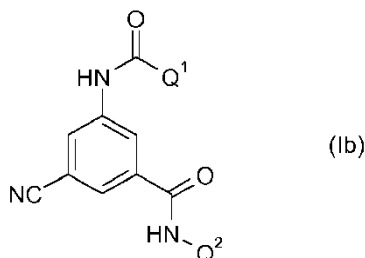


Tabla 34:

- 15 La Tabla 34 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ic) en la que Q² es 2,6-dimetil-4-(heptafluoro-prop-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

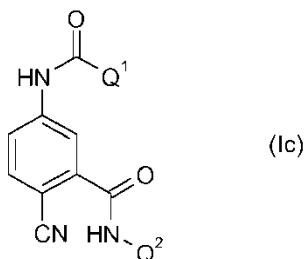


Tabla 35:

- 20 La Tabla 35 proporciona 38 compuestos de fórmula (Id) en la que Q² es 2,6-dimetil-4-(heptafluoro-prop-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

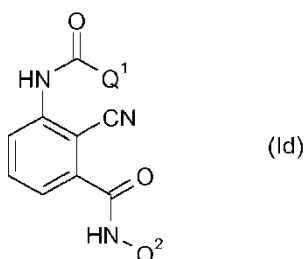


Tabla 36:

La Tabla 36 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ie) en la que Q² es 2,6-dimetil-4-(heptafluoro-prop-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores listados en la tabla siguiente.

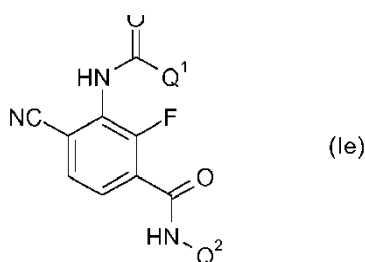


Tabla 37:

La Tabla 37 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ie) en la que Q² es 2-etil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

5 Tabla 38:

La Tabla 38 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ie) en la que Q² es 2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

Tabla 39:

10 La Tabla 39 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ie) en la que Q² es 2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

Tabla 40:

La Tabla 40 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ie) en la que Q² es 2-bromo-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

Tabla 41:

15 La Tabla 41 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ie) en la que Q² es 2-bromo-6-etil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

Tabla 42:

La Tabla 42 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ie) en la que Q² es 2,6-dicloro-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

20 Tabla 43:

La Tabla 43 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ie) en la que Q² es 2,6-dibromo-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

Tabla 44:

25 La Tabla 44 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ie) en la que Q² es 2,6-dimetil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

Tabla 45:

La Tabla 45 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ie) en la que Q² es 2-etil-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

Tabla 46:

30 La Tabla 46 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ie) en la que Q² es 2,6-dietil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

Tabla 47:

La Tabla 47 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ie) en la que Q² es 2-metoximetil-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

35 Tabla 48:

La Tabla 48 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ie) en la que Q² es 2-bromo-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

Tabla 49:

La Tabla 49 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ie) en la que Q² es 2-bromo-6-etil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

Tabla 50:

- 5 La Tabla 50 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ie) en la que Q² es 2,6-dicloro-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

Tabla 51:

La Tabla 51 proporciona 38 compuestos de fórmula (Ie) en la que Q² es 2,6-dibromo-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

- 10 Tabla 52:

La Tabla 52 proporciona 38 compuestos de fórmula (If) en la que Q² es 2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores listados en la tabla siguiente.

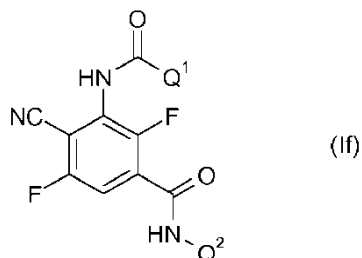


Tabla 53:

- 15 La Tabla 53 proporciona 38 compuestos de fórmula (If) en la que Q² es 2-etil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

Tabla 54:

La Tabla 54 proporciona 38 compuestos de fórmula (If) en la que Q² es 2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

- 20 Tabla 55:

La Tabla 55 proporciona 38 compuestos de fórmula (If) en la que Q² es 2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

Tabla 56:

- 25 La Tabla 56 proporciona 38 compuestos de fórmula (If) en la que Q² es 2-bromo-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

Tabla 57:

La Tabla 57 proporciona 38 compuestos de fórmula (If) en la que Q² es 2-bromo-6-etil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

Tabla 58:

- 30 La Tabla 58 proporciona 38 compuestos de fórmula (If) en la que Q² es 2,6-dicloro-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

Tabla 59:

La Tabla 59 proporciona 38 compuestos de fórmula (If) en la que Q² es 2,6-dibromo-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

- 35 Tabla 60:

La Tabla 60 proporciona 38 compuestos de fórmula (If) en la que Q² es 2,6-dimetil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

Tabla 61:

La Tabla 61 proporciona 38 compuestos de fórmula (If) en la que Q² es 2-etil-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

Tabla 62:

- 5 La Tabla 62 proporciona 38 compuestos de fórmula (If) en la que Q² es 2,6-dietil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

Tabla 63:

La Tabla 63 proporciona 38 compuestos de fórmula (If) en la que Q² es 2-metoximetil-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

- 10 Tabla 64:

La Tabla 64 proporciona 38 compuestos de fórmula (If) en la que Q² es 2-bromo-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

Tabla 65:

- 15 La Tabla 65 proporciona 38 compuestos de fórmula (If) en la que Q² es 2-bromo-6-etil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

Tabla 66:

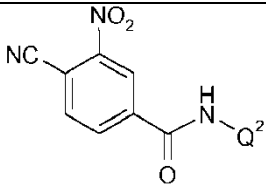
La Tabla 66 proporciona 38 compuestos de fórmula (If) en la que Q² es 2,6-dicloro-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

Tabla 67:

- 20 La Tabla 67 proporciona 38 compuestos de fórmula (If) en la que Q² es 2,6-dibromo-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo y Q¹ tiene los valores dados en la Tabla 1.

Tabla 68:

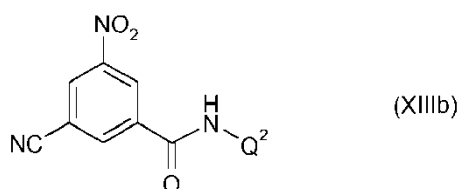
La Tabla 68 proporciona 16 compuestos de fórmula (XIIIa) en la que Q² tiene los valores listados en la tabla siguiente.

 (XIIIa)	
Número de compuesto	Q ²
68.01	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo
68.02	2-etil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo
68.03	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo
68.04	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo
68.05	2-bromo-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo
68.06	2-bromo-6-etil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo
68.07	2,6-dicloro-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo
68.08	2,6-dibromo-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo
68.09	2,6-dimetil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo
68.10	2-etil-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo

Número de compuesto	Q ²
68.11	2,6-dietil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo
68.12	2-metoximetil-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo
68.13	2-bromo-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo
68.14	2-bromo-6-etil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo
68.15	2,6-dicloro-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo
68.16	2,6-dibromo-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo

Tabla 69:

La Tabla 69 proporciona 1 compuesto de fórmula (XIIIb) en la que Q² es 2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo.



5 Tabla 70:

La Tabla 70 proporciona 1 compuesto de fórmula (XIIIc) en la que Q² es 2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo.

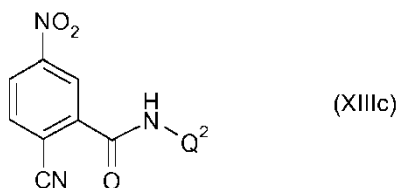
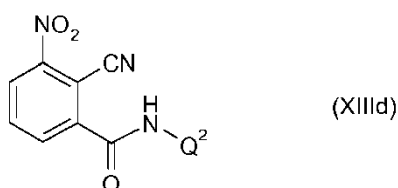


Tabla 71:

La Tabla 71 proporciona 1 compuesto de fórmula (XIIIId) en la que Q² es 2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo.



10

Tabla 72:

La Tabla 72 proporciona 16 compuestos de fórmula (XIIIe) en la que Q² tiene los valores dados en la Tabla 68.

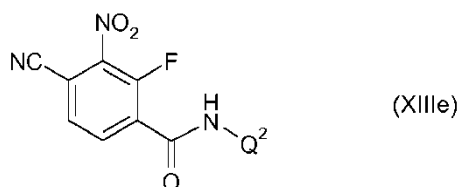


Tabla 73:

15 La Tabla 73 proporciona 16 compuestos de fórmula (XIIIIf) en la que Q² tiene los valores dados en la Tabla 68.

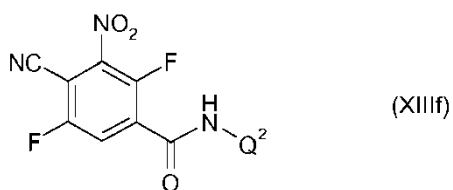


Tabla 74:

La Tabla 74 proporciona 16 compuestos de fórmula (IXa) en la que Q² tiene los valores listados en la tabla siguiente.

<p style="text-align: right;">(IXa)</p>	
Número de compuesto	Q ²
74.01	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo
74.02	2-etil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo
74.03	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo
74.04	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo
74.05	2-bromo-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo
74.06	2-bromo-6-etil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo
74.07	2,6-dicloro-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo
74.08	2,6-dibromo-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo
74.09	2,6-dimetil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo
74.10	2-etil-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo
74.11	2,6-dietil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo
74.12	2-metoximetil-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo
74.13	2-bromo-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo
74.14	2-bromo-6-etil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo
74.15	2,6-dicloro-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo
74.16	2,6-dibromo-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo

5 Tabla 75:

La Tabla 75 proporciona 1 compuesto de fórmula (IXb) en la que Q² es 2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo.

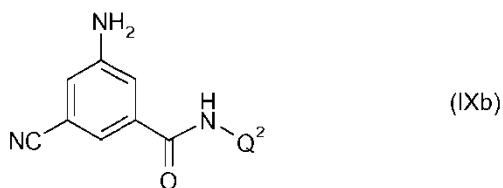


Tabla 76:

La Tabla 76 proporciona 1 compuesto de fórmula (IXc) en la que Q² es 2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo.

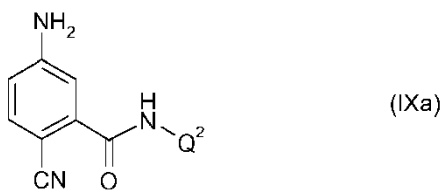
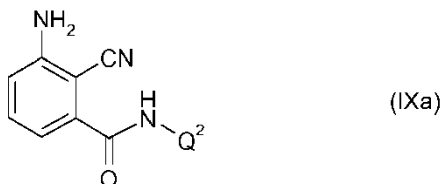


Tabla 77:

La Tabla 77 proporciona 1 compuesto de fórmula (IXd) en la que Q² es 2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo.



5 Tabla 78:

La Tabla 78 proporciona 16 compuestos de fórmula (IXe) en la que Q² tiene los valores dados en la Tabla 74.

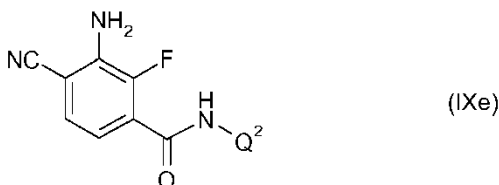
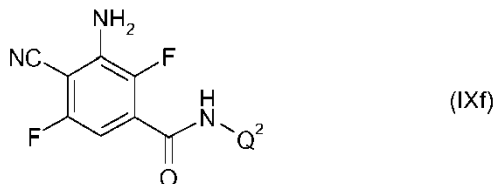


Tabla 79:

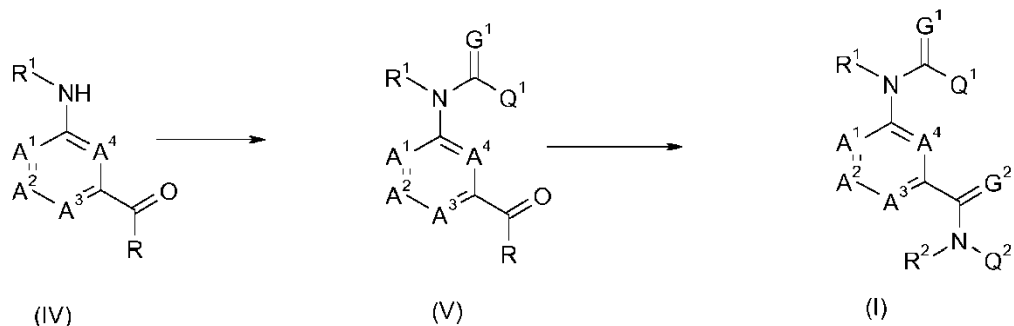
La Tabla 79 proporciona 16 compuestos de fórmula (IXf) en la que Q² tiene los valores dados en la Tabla 74.



10

Los compuestos de la invención pueden producirse por una diversidad de métodos.

1) Los compuestos de fórmula (I), en la cual G¹ y G² son oxígeno, se pueden obtener por tratamiento de compuestos de fórmula (V), en la cual G¹ es oxígeno y R es OH, alcoxi C₁-C₆ o Cl, F o Br, con una amina de fórmula NHR²Q²:



15

20

Cuando R es OH, tales reacciones se llevan a cabo usualmente en presencia de un reactivo de acoplamiento, tal como DCC (N,N'-diciclohexilcarbodiimida), EDC (hidrocloruro de 1-etil-3-[3-dimetilamino-propil]-carbodiimida) o BOP-Cl (bis(cloruro 2-oxo-3-oxazolidinil)fosfónico), en presencia de una base, tal como piridina, trietilamina, 4-(dimetilamino)-piridina o diisopropiletilamina, y opcionalmente en presencia de un catalizador nucleófilo, tal como hidroxibenzotriazol. Cuando R es Cl, tales reacciones se llevan a cabo usualmente en condiciones básicas (por ejemplo en presencia de piridina, trietilamina, 4-(dimetilamino)-piridina o diisopropiletilamina), opcionalmente de nuevo en presencia de un catalizador nucleófilo. Como alternativa, es

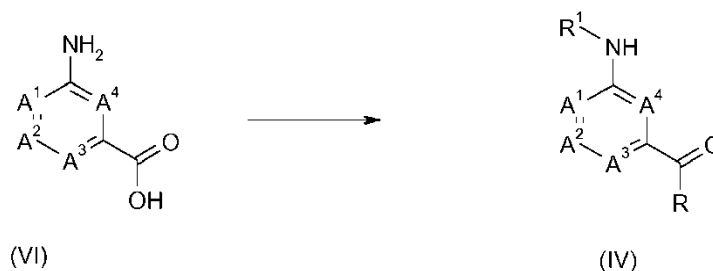
posible llevar a cabo la reacción en un sistema bifásico que comprende un disolvente orgánico, preferiblemente acetato de etilo, y un disolvente acuoso, preferiblemente una disolución de hidrogenocarbonato de sodio. Cuando R es alcoxi de C₁-C₆, a veces es posible convertir el éster directamente en la amida por calentamiento del éster y la amina juntos en un proceso térmico.

5 2) Los haluros de ácido de fórmula (V), en la cual G¹ es oxígeno y R es Cl, F o Br, se pueden obtener a partir de ácidos carboxílicos de fórmula (V), en la cual G¹ es oxígeno y R es OH, en condiciones estándar, tales como tratamiento con cloruro de tionilo o cloruro de oxalilo.

10 3) Los ácidos carboxílicos de fórmula (V), en la cual G¹ es oxígeno y R es OH, se pueden obtener a partir de ésteres de fórmula (V), en la cual G¹ es oxígeno y R es alcoxi C₁-C₆. Es conocido por las personas expertas en la técnica que existen muchos métodos para la hidrólisis de tales ésteres dependiendo de la naturaleza del grupo alcoxi. Un método muy utilizado para conseguir dicha transformación es el tratamiento del éster con un hidróxido alcalino, tal como hidróxido de sodio, en un disolvente, tal como etanol y/o agua.

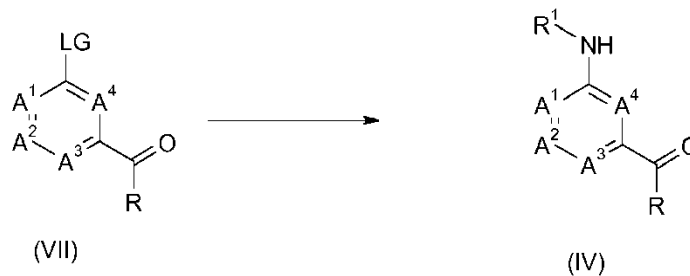
15 4) Los ésteres de fórmula (V), en la cual G¹ es oxígeno y R es alcoxi C₁-C₆, se pueden obtener por tratamiento de compuestos de fórmula (IV), en la cual R es alcoxi C₁-C₆, por acilación con un ácido carboxílico de fórmula Q¹-COOH o un haluro de ácido de fórmula Q¹-COHal, en la cual Hal es Cl, F o Br, en condiciones estándar como se describe en 1).

20 5) Los compuestos de fórmula (IV), en la cual R es alcoxi C₁-C₆, se pueden obtener a partir de un compuesto de fórmula (VI) por tratamiento secuencial con un alcohol R-OH en condiciones ácidas seguido por formación del enlace N-R¹. Es conocido por una persona experta en la técnica que existen muchos métodos dados a conocer para la formación de este enlace, dependiendo de la naturaleza del sustituyente R¹:



25 Como alternativa, se pueden usar reacciones basadas en versiones oxidadas de los alcoholes, tales como los aldehídos o cetonas correspondientes, o basadas en análogos más activados de los alcoholes, tales como los haluros o sulfonatos correspondientes. Por ejemplo, la aminación reductora puede realizarse por tratamiento de la amina con un aldehído o cetona y un agente reductor tal como cianoborohidruro de sodio o borohidruro de sodio. Alternativamente, la alquilación puede realizarse por tratamiento de la amina con un agente alquilante tal como un haluro de alquilo, opcionalmente en presencia de una base. Alternativamente, la arilación puede realizarse por tratamiento de la amina con un haluro o sulfonato de arilo en presencia de un sistema adecuado de catalizador/ligando, a menudo un complejo de paladio (0). Los compuestos de fórmula (VI) y los alcoholes de fórmula R-OH son compuestos conocidos o se pueden obtener mediante métodos conocidos por una persona experta en la técnica.

30 6) Alternativamente, los compuestos de fórmula (IV), en la cual R es alcoxi C₁-C₆, se pueden obtener a partir de un compuesto de fórmula (VII) en la cual R es alcoxi C₁-C₆ y LG es un grupo saliente, tal como flúor, cloro o sulfonato, por desplazamiento nucleófilo del grupo saliente por una amina de fórmula R¹-NH₂.

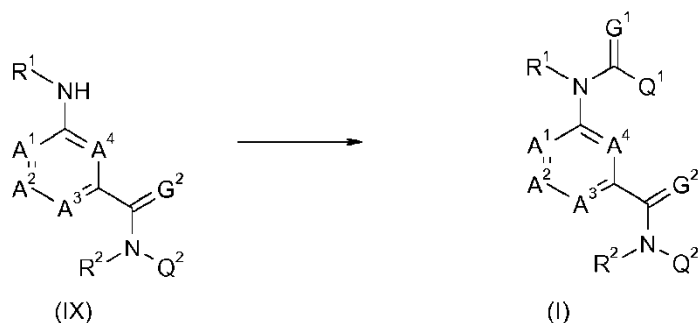


35 Los compuestos de fórmula (VII) y las aminas de fórmula R¹-NH₂ son compuestos conocidos o se pueden obtener por métodos conocidos por una persona experta en la técnica.

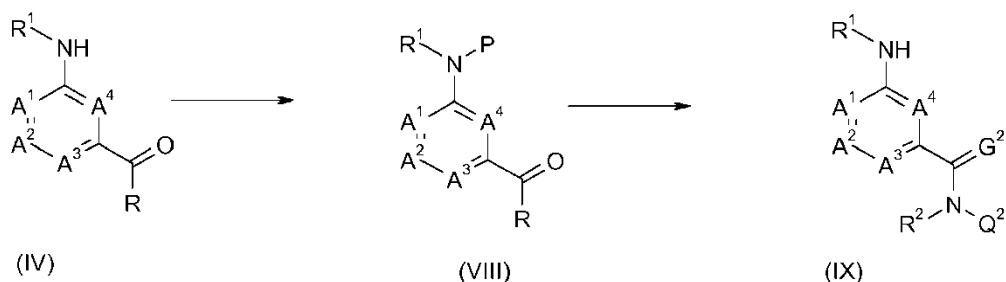
40 7) Los compuestos de fórmula (I), en la cual G¹ y G² son azufre, se pueden obtener a partir de un compuesto de fórmula (I), en la cual G¹ y G² son oxígeno, por tratamiento con un reactivo de transferencia de azufre, tal como reactivo de Lawesson o pentasulfuro de fósforo.

8) Los compuestos de fórmula (I), en la cual G^1 es azufre y G^2 es oxígeno, se pueden obtener a partir de compuestos de fórmula (V), en la cual G^1 es oxígeno y R es OH o alcoxi C_1-C_6 , por tratamiento con un reactivo de transferencia de azufre, tal como reactivo de Lawesson o pentasulfuro de fósforo, antes de acoplamiento con la amina de fórmula NHR^2Q^2 .

5 9) Alternativamente, los compuestos de fórmula (I), en la cual G^1 y G^2 son oxígeno, se pueden obtener por el tratamiento de un compuesto de fórmula (IX), en la cual G^2 es oxígeno, con un ácido carboxílico de fórmula Q^1-COOH o un haluro de ácido de fórmula $Q^1-COHal$, en la que Hal es Cl, F o Br, en condiciones estándar como se describe en 1):



10 10) Los compuestos de fórmula (IX), en la cual G^2 es oxígeno, se pueden obtener a partir de compuestos de fórmula (VIII), en la cual P es un grupo protector adecuado y R es OH, Cl, alcoxi C_1-C_6 , por formación de enlace de amida con una amina de fórmula NHR^2Q^2 en condiciones estándar como se describe en 1), seguido de la eliminación del grupo protector P en condiciones estándar:



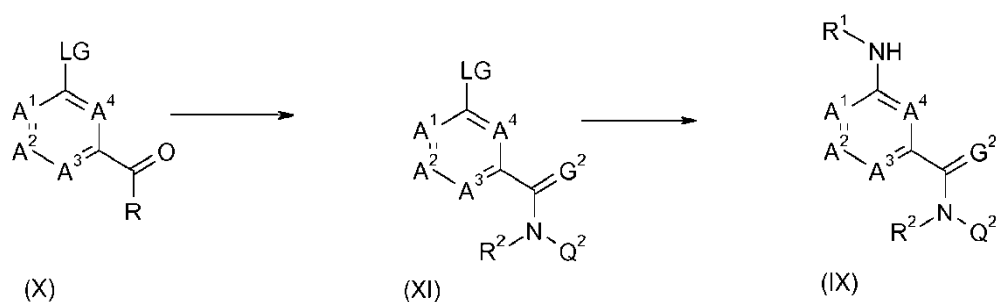
15 11) Los compuestos de fórmula (VIII), en la cual R es OH o alcoxi C_1-C_6 , se pueden obtener por protección de la funcionalidad amina en compuestos de fórmula (IV), en la que R es OH o alcoxi C_1-C_6 . Grupos protectores adecuados incluyen carbamatos (tales como *tert*-butiloxicarbonilo, aliloxicarbonilo y benciloxicarbonilo), grupos trialquilsililo (tales como *tert*-butildimetilsililo) y grupos acilo (tales como acetilo). La formación y eliminación de tales grupos está publicada abundantemente en la bibliografía, y es conocida por las personas expertas en la técnica.

20 12) Para compuestos de fórmula (VIII) y compuestos de fórmula (IV), los ésteres (en los cuales R es alcoxi C_1-C_6) pueden hidrolizarse a los ácidos (en los cuales R es OH) por tratamiento con un hidróxido alcalino, tal como hidróxido de sodio, en un disolvente, tal como etanol. Los ácidos (en los cuales R es OH) se pueden convertir en los haluros de ácido (en los cuales R es Cl) por tratamiento con cloruro de tionilo o cloruro de oxalilo como se describe en 2) y 3).

25 13) Alternativamente, puede ser posible convertir compuestos de fórmula (IV), en la que R es OH, Cl, F, o Br o alcoxi C_1-C_6 , directamente en compuestos de fórmula (IX) por formación de enlace de amida con una amina de fórmula NHR^2Q^2 en condiciones estándar como se describe en 1).

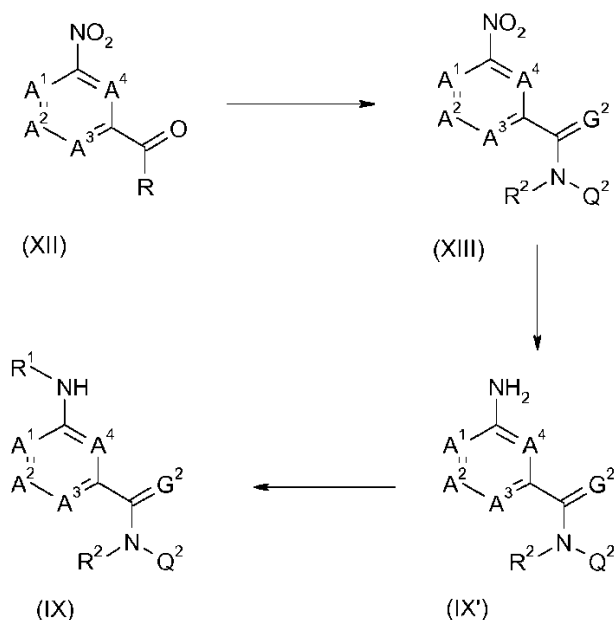
30 14) Alternativamente, los compuestos de fórmula (IX), en la cual G^2 es oxígeno, se pueden obtener a partir de un compuesto de fórmula (XI), en la cual G^2 es oxígeno y LG es un grupo saliente, tal como fluoro, cloro o sulfonato, por desplazamiento del grupo saliente con un compuesto de fórmula R^1-NH_2 . Tales reacciones se realizan usualmente en condiciones básicas.

35 15) Los compuestos de fórmula (XI) se pueden obtener a partir de compuestos de fórmula (X), en la cual R es Cl u OH, y LG es un grupo saliente como se describe en 14), por formación de enlace de amida en condiciones estándar como se describe en 1). Los compuestos de fórmula (X) y fórmula (IV) son compuestos conocidos o se pueden obtener por métodos conocidos por las personas expertas en la técnica.



5 16) Los compuestos de fórmula (I), en la cual G^1 es oxígeno y G^2 es azufre, se pueden obtener por tratamiento de compuestos de fórmula (XI), en la cual G^2 es oxígeno y LG es un grupo saliente, o compuestos de fórmula (IX), en la cual G^2 es oxígeno, un reactivo de transferencia de azufre tal como reactivo de Lawesson o pentasulfuro de fósforo antes de la elaboración para dar compuestos de fórmula (I), en la cual G^1 es oxígeno y G^2 es azufre, como se describe en 9).

17) Alternativamente, los compuestos de fórmula (IX), en la cual G^2 es oxígeno, se pueden preparar mediante formación de un enlace $N-R^1$ en un compuesto de fórmula (IX'), en la que G^2 es oxígeno, usando los métodos como se describen en 5).

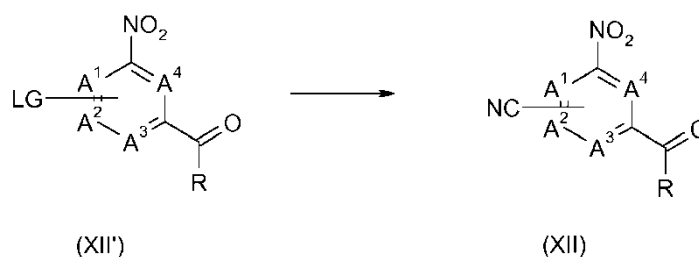


10 18) Los compuestos de fórmula (IX'), en la cual G^2 es oxígeno, se puede obtener por reducción de un nitrocompuesto de fórmula (XIII), en la cual G^2 es oxígeno. Existen numerosos métodos para conseguir una transformación de este tipo consignada en la bibliografía, tales como tratamiento con cloruro de estaño en condiciones ácidas, o hidrogenación catalizada por un metal noble tal como paladio sobre carbono:

15 19) Los compuestos de fórmula (XIII), en la cual G^2 es oxígeno, se pueden derivar de compuestos de fórmula (XII), en la cual R es OH, Cl, o alcoxi C_1-C_6 , por acilación con una amina de fórmula NHR^2Q^2 en las condiciones estándar como se describen en 1).

20 20) Para compuestos de fórmula (XII), los ésteres (en los cuales R es alcoxi C_1-C_6) pueden hidrolizarse para dar los ácidos (en los cuales R es OH) por tratamiento con un hidróxido alcalino, tal como hidróxido de sodio, en un disolvente, tal como etanol como se describe en 3). Los ácidos (en los cuales R es OH) pueden convertirse en los haluros de ácido (en los cuales R es Cl) por tratamiento con cloruro de tionilo o cloruro de oxalilo como se describe en 2). Los compuestos de fórmula (XII) son conocidos o se pueden obtener por métodos conocidos por una persona experta en la técnica.

25 21) Los compuestos de fórmula (XII), en la cual R^3 es ciano, se pueden obtener a partir de un compuesto de fórmula (XII') en la que LG es halógeno, tal como fluoruro o cloruro, mediante reacción con una sal de cianuro, tal como cianuro potásico, opcionalmente en presencia de una base, tal como carbonato de potasio.



El desplazamiento de un halógeno con cianuro también se puede llevar a cabo en intermedios de fórmula (XIII). En ambos casos, la presencia del grupo nitro facilita el desplazamiento del grupo saliente por el ion cianuro.

- 5 22) Los compuestos de fórmula (XII), en la cual R³ es ciano, se pueden obtener a partir de un compuesto de fórmula (XII') en la que LG es una amina, mediante reacción con una sal de cianuro, tal como cianuro de cobre, vía una reacción de diazotación. El desplazamiento de una amina con cianuro también se puede llevar a cabo en intermedios de fórmula (XIII).

10 Los compuestos de fórmula (I) se pueden usar para combatir y controlar infestaciones de plagas de insectos tales como Lepidoptera, Diptera, Hemiptera, Thysanoptera, Orthoptera, Dictyoptera, Coleoptera, Siphonaptera, Hymenoptera e Isoptera, y también otras plagas de invertebrados, por ejemplo, plagas de ácaros, nematodos y moluscos. De aquí en adelante, los insectos, ácaros, nematodos y moluscos se denominan colectivamente plagas. Las plagas que se pueden combatir y controlar mediante el uso de los compuestos de la invención incluyen aquellas plagas asociadas con la agricultura (cuyo término incluye el crecimiento de cultivos de productos alimentarios y textiles), la horticultura y la cría de animales, los animales de compañía, la silvicultura y el almacenamiento de productos de origen vegetal (tales como fruta, grano y madera); aquellas plagas asociadas con el daño producido a estructuras hechas por el hombre y la transmisión de enfermedades del hombre y animales; y también plagas molestas (tales como moscas).

20 Los ejemplos de especies de plagas que se pueden controlar mediante los compuestos de fórmula (I) incluyen: *Myzus persicae* (pulgón), *Aphis gossypii* (pulgón), *Aphis fabae* (pulgón), *Lygus* spp. (chinchas), *Dysdercus* spp. (chinchas), *Nilaparvata lugens* (saltahojas), *Nephotettix inciticeps* (saltahojas), *Nezara* spp. (chinchas apestosas), *Euschistus* spp. (chinchas apestosas), *Leptocorisa* spp. (chinchas apestosas), *Frankliniella occidentalis* (trip), Thrips spp. (trips), *Leptinotarsa decemlineata* (escarabajo de la patata del Colorado), *Anthonomus grandis* (gorgojo del algodón), *Aonidiella* spp. (cochinillas), *Trialeurodes* spp. (moscas blancas), *Bemisia tabaci* (mosca blanca), *Ostrinia nubilalis* (barrenador del maíz), *Spodoptera littoralis* (gusano de la hoja del algodón), *Heliothis virescens* (cogollero del tabaco), *Helicoverpa armigera* (gusano bellotero del algodón), *Helicoverpa zea* (gusano bellotero del algodón), *Sylepta derogata* (perforador de la hoja del algodón), *Pieris brassicae* (mariposa blanca), *Plutella xylostella* (polilla de la col), *Agrotis* spp. (gusanos cortadores), *Chilo suppressalis* (barrenador del arroz), *Locusta migratoria* (langosta), *Chortiocetes terminifera* (langosta), *Diabrotica* spp. (gusanos de la raíz), *Panonychus ulmi* (ácaros de los frutales), *Panonychus citri* (ácaros de los cítricos), *Tetranychus urticae* (arañuela roja), *Tetranychus cinnabarinus* (araña roja del clavel), *Phyllocoptruta oleivora* (ácaro de los cítricos), *Polyphagotarsonemus latus* (ácaro blanco), *Brevipalpus* spp. (ácaros planos), *Boophilus microplus* (garrapata común del ganado), *Dermacentor variabilis* (garrapata del perro), *Ctenocephalides felis* (piojo del gato), *Liriomyza* spp. (minadores de hojas), *Musca domestica* (mosca doméstica), *Aedes aegypti* (mosquito), *Anopheles* spp. (mosquitos), *Culex* spp. (mosquitos), *Lucilia* spp. (moscas azules de la carne), *Blattella germanica* (cucaracha), *Periplaneta americana* (cucaracha), *Blatta orientalis* (cucaracha), termitas de la familia Mastotermitidae (por ejemplo, *Mastotermes* spp.), las Kalotermitidae (por ejemplo, *Neotermes* spp.), las Rhinotermitidae (por ejemplo, *Coptotermes formosanus*; *Reticulitermes flavipes*, *R. speratu*, *R. virginicus*, *R. hesperus* y *R. santonensis*) y las Termitidae (por ejemplo, *Globitermes sulfureus*), *Solenopsis geminata* (hormiga brava), *Monomorium pharaonis* (hormiga cosechadora), *Damalinia* spp. y *Linognathus* spp. (piojos mordedores y chupadores), *Meloidogyne* spp. (nematodos del nudo de raíz), *Globodera* spp. y *Heterodera* spp. (nematodos del quiste), *Pratylenchus* spp. (nematodos de la lesión), *Rhodopholus* spp. (nematodos horadadores de la banana), *Tylenchulus* spp. (nematodos de los cítricos), *Haemonchus contortus* (gusano de poste de barbero), *Caenorhabditis elegans* (anguilula del vinagre), *Trichostrongylus* spp. (nematodos gastrointestinales) y *Deroceas reticulatum* (babosa).

45 Por lo tanto, la invención proporciona un método para combatir y controlar insectos, ácaros, nematodos o moluscos que comprende aplicar una cantidad insecticida, acaricida, nematocida o molusquicida eficaz de un compuesto de fórmula (I), o una composición que contiene un compuesto de fórmula (I), a una plaga, a un sitio de acción de una plaga, preferiblemente a una planta, o a una planta susceptible de ser atacada por una plaga. Los compuestos de fórmula (I) se usan preferiblemente contra insectos, ácaros o nematodos.

50 El término "planta", como se usa aquí, incluye plantas de semillero, arbustos y árboles.

A fin de aplicar un compuesto de fórmula (I) como un insecticida, acaricida, nematocida o molusquicida a una plaga, a un sitio de acción de una plaga, o a una planta susceptible de ser atacada por una plaga, un compuesto de fórmula

- (I) se formula habitualmente en una composición que incluye, además del compuesto de fórmula (I), un diluyente o vehículo inerte adecuado y, opcionalmente, un agente tensioactivo (SFA). Los SFAs son sustancias químicas capaces de modificar las propiedades de una interfaz (por ejemplo, las interfaces líquido/sólido, líquido/aire o líquido/líquido) reduciendo la tensión interfacial y conduciendo de ese modo a cambios en otras propiedades (por ejemplo dispersión, emulsión y humectación). Se prefiere que todas las composiciones (tanto las formulaciones sólidas como las líquidas) comprendan, en peso, 0,0001 a 95%, más preferiblemente 1 a 85%, por ejemplo 5 a 60%, de un compuesto de fórmula (I). La composición se usa generalmente para el control de plagas de manera que se aplique un compuesto de fórmula (I) a una dosis de 0,1 g a 10 kg por hectárea, preferiblemente de 1 g a 6 kg por hectárea, más preferiblemente de 1 g a 1 kg por hectárea.
- 5
- 10 Cuando se usa en un tratamiento de semillas, un compuesto de fórmula (I) se usa a una dosis de 0,0001 g a 10 g (por ejemplo de 0,001 g o 0,05 g), preferiblemente de 0,005 g a 10 g, más preferiblemente de 0,005 g a 4 g, por kilogramo de semilla.
- En otro aspecto, la presente invención proporciona una composición insecticida, acaricida, nematocida o molusquicida que comprende una cantidad insecticida, acaricida, nematocida o molusquicidamente eficaz de un compuesto de fórmula (I) y un vehículo o diluyente adecuado para él. La composición es preferiblemente una composición insecticida, acaricida, nematocida o molusquicida.
- 15
- Las composiciones se pueden escoger entre un número de tipos de formulación, que incluyen polvos espolvoreables (DP), polvos solubles (SP), gránulos solubles en agua (SG), gránulos dispersables en agua (WG), polvos humectables (WP), gránulos (GR) (de liberación lenta o rápida), concentrados solubles (SL), líquidos miscibles con aceite (OL), líquidos de volumen ultra bajo (UL), concentrados emulsionables (EC), concentrados dispersables (DC), emulsiones (tanto de aceite en agua (EW) como de agua en aceite (EO)), microemulsiones (ME), concentrados en suspensión (SC), aerosoles, formulaciones para nebulización/humo, suspensiones en cápsula (CS) y formulaciones para tratamiento de semillas. El tipo de formulación escogido dependerá en cualquier caso del fin particular previsto y de las propiedades físicas, químicas y biológicas del compuesto de fórmula (I).
- 20
- 25 Los polvos espolvoreables (DP) se pueden preparar mezclando un compuesto de fórmula (I) con uno o más diluyentes sólidos (por ejemplo arcillas naturales, caolín, pirofilita, bentonita, alúmina, montmorillonita, kieselguhr, tiza, tierras de diatomeas, fosfatos de calcio, carbonatos de calcio y magnesio, azufre, cal, harinas, talco y otros vehículos sólidos orgánicos e inorgánicos) y moliendo mecánicamente la mezcla hasta un polvo fino.
- Los polvos solubles (SP) se pueden preparar mezclando un compuesto de fórmula (I) con una o más sales inorgánicas solubles en agua (tal como hidrogenocarbonato de sodio, carbonato de sodio o sulfato de magnesio) o uno o más sólidos orgánicos solubles en agua (tal como un polisacárido) y, opcionalmente, uno o más agentes humectantes, uno o más agentes dispersantes o una mezcla de dichos agentes, para mejorar la dispersabilidad/solubilidad en agua. Después, la mezcla se muele hasta un polvo fino. Composiciones similares también se pueden granular para formar gránulos solubles en agua (SG).
- 30
- 35 Los polvos humectables (WP) se pueden preparar mezclando un compuesto de fórmula (I) con uno o más diluyentes o vehículos sólidos, uno o más agentes humectantes y, preferiblemente, uno o más agentes dispersantes y, opcionalmente, uno o más agentes de suspensión, para facilitar la dispersión en líquidos. Después, la mezcla se muele hasta un polvo fino. Composiciones similares también se pueden granular para formar gránulos dispersables en agua (WG).
- 40
- 45 Los gránulos (GR) se pueden formar granulando una mezcla de un compuesto de fórmula (I) y uno o más diluyentes o vehículos sólidos en polvo, o a partir de gránulos blanco preformados absorbiendo un compuesto de fórmula (I) (o una disolución del mismo, en un agente adecuado) en un material granular poroso (tal como piedra pómez, arcillas de atapulgita, tierra de batán, kieselguhr, tierras de diatomeas, o mazorcas de maíz molidas) o adsorbiendo un compuesto de fórmula (I) (o una disolución del mismo, en un agente adecuado) en un material de núcleo duro (tal como arenas, silicatos, carbonatos, sulfatos o fosfatos minerales) y secando si fuera necesario. Los agentes que se usan habitualmente para ayudar en la absorción o adsorción incluyen disolventes (tales como disolventes de petróleo alifáticos y aromáticos, alcoholes, éteres, cetonas y ésteres) y agentes adherentes (tales como acetatos de polivinilo, alcoholes polivinílicos, dextrinas, azúcares y aceites vegetales). También se pueden incluir en los gránulos uno o más aditivos (por ejemplo un agente emulsionante, agente humectante o agente dispersante).
- 50
- Los concentrados dispersables (DC) se pueden preparar disolviendo un compuesto de fórmula (I) en agua o en un disolvente orgánico, tal como una cetona, un alcohol o un glicol éter. Estas disoluciones pueden contener un agente tensioactivo (por ejemplo para mejorar la dilución en agua o para evitar la cristalización en un tanque de aspersión).
- 55
- Los concentrados emulsionables (EC) o las emulsiones de aceite en agua (EW) se pueden preparar disolviendo un compuesto de fórmula (I) en un disolvente orgánico (que contenga opcionalmente uno o más agentes humectantes, uno o más agentes emulsionantes o una mezcla de dichos agentes). Los disolventes orgánicos adecuados para uso en los ECs incluyen hidrocarburos aromáticos (tales como alquilbencenos o alquilnaftalenos, ejemplificados por SOLVESSO 100, SOLVESSO 150 y SOLVESSO 200; SOLVESSO es una marca registrada), cetonas (tales como ciclohexanona o metilciclohexanona) y alcoholes (tales como alcohol bencílico, alcohol furfúrico o butanol), *N*-

alquilpirrolidonas (tales como *N*-metilpirrolidona o *N*-octilpirrolidona), dimetilamidas de ácidos grasos (tales como dimetilamida de un ácido graso de C₈-C₁₀) e hidrocarburos clorados. Un producto de EC se puede emulsionar espontáneamente al añadirlo a agua, para producir una emulsión con estabilidad suficiente para permitir la aplicación por aspersión mediante un equipo adecuado. La preparación de una EW implica obtener un compuesto de fórmula (I), ya sea un líquido (si no es un líquido a temperatura ambiente, se puede fundir a una temperatura razonable, típicamente por debajo de 70°C) o en disolución (disolviéndolo en un disolvente apropiado), y después emulsionando el líquido o disolución resultante en agua que contiene uno o más SFAs, a cizallamiento elevado, para producir una emulsión. Los disolventes adecuados para uso en las EWs incluyen aceites vegetales, hidrocarburos clorados (tales como clorobenzenos), disolventes aromáticos (tales como alquilbenzenos o alquilnaftalenos) y otros disolventes orgánicos adecuados que tengan baja solubilidad en agua.

Las microemulsiones (ME) se pueden preparar mezclando agua con una mezcla de uno o más disolventes con uno o más SFAs, para producir espontáneamente una formulación líquida isotrópica termodinámicamente estable. Un compuesto de fórmula (I) está presente inicialmente en la mezcla de agua o disolvente/SFA. Los disolventes adecuados para uso en las MEs incluyen los descritos aquí anteriormente para uso en los ECs o en las EWs. Una ME puede ser un sistema de aceite en agua o de agua en aceite (el hecho de cuál sistema está presente se puede determinar por medidas de conductividad), y puede ser adecuada para mezclar en la misma formulación plaguicidas solubles en agua y solubles en aceite. Una ME es adecuada para la dilución en agua, quedando como una microemulsión o formando una emulsión de aceite en agua convencional.

Los concentrados en suspensión (SC) pueden comprender suspensiones acuosas o no acuosas de partículas sólidas insolubles finamente divididas de un compuesto de fórmula (I). Los SCs se pueden preparar moliendo con perlas o bolas el compuesto sólido de fórmula (I) en un medio adecuado, opcionalmente con uno o más agentes dispersantes, para producir una suspensión de partículas finas del compuesto. Se puede incluir uno o más agentes humectantes en la composición, y se puede incluir un agente de suspensión para reducir la velocidad a la cual sedimentan las partículas. Como alternativa, un compuesto de fórmula (I) se puede moler en seco y añadir a agua, que contiene los agentes descritos aquí anteriormente, para producir el producto final deseado.

Las formulaciones en aerosol comprenden un compuesto de fórmula (I) y un propelente adecuado (por ejemplo *n*-butano). Un compuesto de fórmula (I) también se puede disolver o dispersar en un medio adecuado (por ejemplo agua o un líquido miscible con agua, tal como *n*-propanol) para proporcionar composiciones para uso en bombas de aspersión no presurizadas, accionadas a mano.

Un compuesto de fórmula (I) se puede mezclar en estado seco con una mezcla pirotécnica para formar una composición adecuada para generar, en un espacio cerrado, un humo que contenga el compuesto.

Las suspensiones en cápsulas (CS) se pueden preparar de manera similar a la preparación de las formulaciones de EW, pero con una etapa de polimerización adicional, de modo que se obtenga una dispersión acuosa de gotitas de aceite, en la cual cada gotita de aceite está encapsulada por una cubierta polimérica y contiene un compuesto de fórmula (I) y, opcionalmente, un vehículo o diluyente para él. La cubierta polimérica se puede producir mediante una reacción de policondensación interfacial o mediante un procedimiento de coacervación. Las composiciones pueden proporcionar liberación controlada del compuesto de fórmula (I), y se pueden usar para el tratamiento de semillas. Un compuesto de fórmula (I) también se puede formular en una matriz polimérica biodegradable para proporcionar una liberación controlada, lenta, del compuesto.

Una composición puede incluir uno o más aditivos para mejorar el comportamiento biológico de la composición (por ejemplo mejorando la humectación, retención o distribución sobre superficies; la resistencia a la lluvia en superficies tratadas; o la absorción o movilidad de un compuesto de fórmula (I)). Tales aditivos incluyen agentes tensioactivos, aditivos para aspersión a base de aceites, por ejemplo ciertos aceites minerales o aceites vegetales naturales (tales como aceite de soja y de colza), y mezclas de éstos con otros coadyuvantes biomejoradores (ingredientes que pueden ayudar o modificar la acción de un compuesto de fórmula (I)).

Un compuesto de fórmula (I) también se puede formular para uso como un tratamiento de semillas, por ejemplo como una composición en polvo, que incluye un polvo para tratamiento de semillas en seco (DS), un polvo soluble en agua (SS) o un polvo dispersable en agua para tratamiento en suspensión (WS), o como una composición líquida, que incluye un concentrado fluible (FS), una disolución (LS) o una suspensión en cápsula (CS). Las preparaciones de composiciones DS, SS, WS, FS y LS son muy similares, respectivamente, a las de las composiciones DP, SP, WP, SC, y DC descritas anteriormente. Las composiciones para tratar semillas pueden incluir un agente que favorezca la adhesión de la composición a la semilla (por ejemplo un aceite mineral o una barrera formadora de película).

Los agentes humectantes, agentes dispersantes y agentes emulsionantes pueden ser tensioactivos SFAs del tipo catiónico, aniónico, anfótero o no iónico.

SFAs adecuados del tipo catiónico incluyen compuestos de amonio cuaternario (por ejemplo bromuro de cetiltrimetilamonio), imidazolinas y sales de aminas.

SFAs aniónicos adecuados incluyen sales de ácidos grasos con metales alcalinos, sales de monoésteres alifáticos

de ácido sulfúrico (por ejemplo laurilsulfato de sodio), sales de compuestos aromáticos sulfonados (por ejemplo dodecibencenosulfonato de sodio, dodecibencenosulfonato de calcio, butilnaftalenosulfonato y mezclas de diisopropil- y triisopropilnaftalenosulfonatos de sodio), éter sulfatos, alcohol éter sulfatos (por ejemplo lauret-3-sulfato de sodio), éter carboxilatos (por ejemplo lauret-3-carboxilato de sodio), ésteres de fosfato (productos obtenidos de la reacción entre uno o más alcoholes grasos y ácido fosfórico (predominantemente monoésteres) o pentóxido de fósforo (predominantemente diésteres), por ejemplo la reacción entre alcohol laurílico y ácido tetrafosfórico; de forma adicional, estos productos se pueden etoxilar), sulfosuccinatos, parafin u olefin sulfonatos, tauratos y lignosulfonatos.

SFAs adecuados del tipo anfotérico incluyen betaínas, propionatos y glicinatos.

10 SFAs adecuados del tipo no iónico incluyen productos de condensación de óxidos de alquileo, tales como óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de estos, con alcoholes grasos (tales como alcohol oleílico o alcohol cetílico) o con alquifenoles (tales como octilfenol, nonilfenol u octilcresol); ésteres parciales derivados de ácidos grasos de cadena larga o anhídridos de hexitol; productos de condensación de dichos ésteres parciales con óxido de etileno; polímeros de bloques (que comprenden óxido de etileno y óxido de propileno); alcanolamidas; 15 ésteres simples (por ejemplo, ésteres de ácidos grasos con polietilenglicol); óxidos de amina (por ejemplo, óxido de laurildimetilamina); y lecitinas.

Los agentes de suspensión adecuados incluyen coloides hidrofílicos (tales como polisacáridos, polivinilpirrolidona o carboximetilcelulosa de sodio) y arcillas hinchables (tales como bentonita o atapulgita).

20 Un compuesto de fórmula (I) se puede aplicar por cualquiera de los medios conocidos de aplicación de compuestos plaguicidas. Por ejemplo, se puede aplicar, formulado o sin formular, a las plagas o al lugar de las plagas (tal como el hábitat de las plagas, o una planta en crecimiento susceptible a la infestación por las plagas) o a cualquier parte de la planta, incluyendo el follaje, tallos, ramas o raíces, a las semillas antes de plantarlas o a otro medio en el cual se hacen crecer las plantas o en el que se plantarán (tal como el suelo que rodea las raíces, el suelo en general, el agua de los arrozales o los sistemas de cultivos hidropónicos), directamente o se puede pulverizar, aplicar en polvo, 25 aplicar mediante inmersión, aplicar como una formulación en crema o pasta, aplicar como un vapor, o aplicar mediante distribución o incorporación de una composición (tal como una composición granular o una composición envasada en una bolsa soluble en agua) en el suelo o en un entorno acuoso.

30 Un compuesto de fórmula (I) también se puede inyectar en las plantas o se puede pulverizar sobre la vegetación usando técnicas electrodinámicas de pulverización u otros métodos de volumen bajo, o se puede aplicar mediante sistemas de irrigación terrestres o aéreos.

35 Las composiciones para uso como preparaciones acuosas (disoluciones o dispersiones acuosas) se suministran generalmente en forma de un concentrado que contiene una proporción elevada del ingrediente activo, añadiéndose el concentrado al agua antes del uso. A menudo es necesario que estos concentrados, los cuales pueden incluir DCs, SCs, ECs, EWs, MEs, SGs, SPs, WPs, WGs y CSs, soporten periodos prolongados de almacenamiento, y que sea posible, después de dicho almacenamiento, añadirlos al agua para formar preparaciones acuosas que permanezcan homogéneas durante un tiempo suficiente como para permitir que sean aplicadas con un equipo convencional de pulverización. Tales preparaciones acuosas pueden contener cantidades variables de un compuesto de fórmula (I) (por ejemplo 0,0001 a 10% en peso), dependiendo del fin para el que se vayan a usar.

40 Un compuesto de fórmula (I) se puede usar en mezclas con fertilizantes (por ejemplo fertilizantes que contengan nitrógeno, potasio o fósforo). Los tipos de formulaciones adecuadas incluyen gránulos de fertilizante. Las mezclas contienen de forma adecuada hasta 25% en peso del compuesto de fórmula (I).

La invención también proporciona por lo tanto una composición fertilizante que comprende un fertilizante y un compuesto de fórmula (I).

45 Las composiciones de esta invención pueden contener otros compuestos con actividad biológica, por ejemplo micronutrientes o compuestos con actividad fungicida o que poseen actividad reguladora del crecimiento de las plantas, herbicida, insecticida, nematocida o acaricida.

50 El compuesto de fórmula (I) puede ser el único ingrediente activo de la composición, o se puede mezclar con uno o más ingredientes activos adicionales, tales como un plaguicida, un fungicida, un agente sinérgico, un herbicida o un regulador del crecimiento de las plantas, cuando sea apropiado. Un ingrediente activo adicional puede: proporcionar una composición que tenga un espectro más amplio de actividad o una mayor persistencia en el lugar; provocar un efecto sinérgico en la actividad o complementar la actividad (por ejemplo aumentando la velocidad de actuación o evitando la repulsión) del compuesto de fórmula (I); o ayudar a superar o prevenir el desarrollo de resistencia a componentes individuales. El ingrediente activo adicional particular dependerá de la utilidad pretendida de la composición. Ejemplos de plaguicidas adecuados incluyen los siguientes:

55 a) Piretroides, tales como permetrina, cipermetrina, fenvalerato, esfenvalerato, deltametrina, cihalotrina (en particular lambda-cihalotrina), bifentrina, fenpropatrina, ciflutrina, teflutrina, piretroides inocuos para los peces (por ejemplo, etofenprox), piretrina natural, tetrametrina, s-bioaletrina, fenflutrina, praletrina o carboxilato de 5-

bencil-3-furilmetil-(E)-(1R,3S)-2,2-dimetil-3-(2-oxotiolan-3-ilidenometil)ciclopropano;

- 5 b) Organofosfatos, tales como profenofós, sulprofós, acefato, metil paratión, azinfós-metilo, demetón-s-metilo, heptenofós, tiometón, fenamifós, monocrotofós, profenofós, triazofós, metamidofós, dimetoato, fosfamidón, malatión, clorpirifós, fosalona, terbufós, fensulfotiión, fonofós, forato, foxim, pirimifós-metilo, pirimifós-etilo, fenitrotión, fostiazato o diazinón;
- c) Carbamatos (incluyendo arilcarbamatos), tales como pirimicarb, triazamato, cloetocarb, carbofurán, furatiocarb, etiofencarb, aldicarb, tiofurox, carbosulfán, bendiocarb, fenobucarb, propoxur, metomilo u oxamilo;
- d) Benzoilureas, tales como diflubenzurón, triflumurón, hexaflumurón, flufenoxurón o clorfluazurón;
- e) Compuestos orgánicos de estaño, tales como cihexatina, óxido de fenbutatina o azociclotina;
- 10 f) Pirazoles, tales como tebufenpirad y fenpiroximato;
- g) Macrólidos, tales como avermectinas o milbemicinas, por ejemplo abamectina, benzoato de emamectina, ivermectina, milbemicina, o espinosad, espinetoram o azadiractina;
- h) Hormonas o feromonas;
- i) Compuestos organoclorados, tales como endosulfano, hexacloruro de benceno, DDT, clordano o dieldrina;
- 15 j) Amidinas, tales como clordimeform o amitraz;
- k) Agentes fumigantes, tales como cloropicrina, dicloropropano, bromuro de metilo o metam;
- l) Compuestos neonicotínicos, tales como imidacloprida, tiacloprida, acetamiprida, clotianidina, nitenpiram, dinotefuran o tiametoxam;
- m) Diacilhidrazinas, tales como tebufenozida, cromafenozida o metoxifenozida;
- 20 n) Éteres difenílicos, tales como diofenolano o piriproxifeno;
- o) Indoxacarb;
- p) Clorfenapir;
- q) Pimetrozina;
- r) Espirotetramat, espirodiclofeno o espiromesifeno;
- 25 s) Flubendiamida o Rynaxypyr;

Además de las clases químicas principales de plaguicidas enumeradas anteriormente, en la composición se pueden emplear otros plaguicidas que tengan dianas particulares, si es apropiado para la utilidad pretendida de la composición. Por ejemplo, se pueden emplear insecticidas selectivos para cosechas particulares, por ejemplo insecticidas específicos contra los perforadores del tallo (tales como cartap) o insecticidas específicos contra los saltadores (tales como buprofezina) para uso en el arroz. Como alternativa, también se pueden incluir en las composiciones insecticidas o acaricidas específicos para especies de insectos/etapas particulares (por ejemplo ovolarvicidas acaricidas, tales como clofentezina, flubenzimina, hexitiazox o tetradifón; motilicidas acaricidas, tales como dicofol o propargita; acaricidas, tales como bromopropilato o clorobencilato; o reguladores del crecimiento, tales como hidrametilnón, ciromazina, metopreno, clorfluazurón o diflubenzurón).

- 35 Los ejemplos de compuestos fungicidas que se pueden incluir en la composición de la invención son (E)-N-metil-2-[2-(2,5-dimetilfenoximetil)fenil]-2-metoxi-iminoacetamida (SSF-129), 4-bromo-2-ciano-N,N-dimetil-6-trifluorometilbencimidazol-1-sulfonamida, α -[N-(3-cloro-2,6-xilil)-2-metoxiacetamido]- γ -butirolactona, 4-cloro-2-ciano-N,N-dimetil-5-p-tolilimidazol-1-sulfonamida (IKF-916, ciamidazosulfamida), 3-5-dicloro-N-(3-cloro-1-etil-1-metil-2-oxopropil)-4-metilbenzamida (RH-7281, zoxamida), N-alil-4,5-dimetil-2-trimetilsililtiofen-3-carboxamida (MON65500), N-(1-ciano-1,2-dimetilpropil)-2-(2,4-diclorofenoxi)propionamida (AC382042), N-(2-metoxi-5-piridil)-ciclopropanocarboxamida, acibenzolar (CGA245704), alanicarb, aldimorf, anilazina, azaconazol, azoxistrobina, benalaxilo, benomilo, biloxazol, bitertanol, blasticidina S, bromuconazol, bupirimato, captafol, captán, carbendazim, carbendazim clorhidrato, carboxina, carpropamida, carvona, CGA41396, CGA41397, quinometionato, clorotalonilo, clorozolinato, clozilacon, compuestos que contienen cobre tales como oxiclورو de cobre, oxiquinolato de cobre, sulfato de cobre, talato de cobre y mezcla de Bordeaux, cimoxanilo, ciproconazol, ciprodinilo, debacarb, 1,1'-dióxido de disulfuro de di-2-piridilo, diclofluanida, diclomezina, diclorano, dietofencarb, difenoconazol, difenzoquat, diflumetorim, tiofosfato de O,O-di-iso-propil-S-bencilo, dimefluazol, dimetconazol, dimetomorf, dimetirimol, diniconazol, dinocap, ditianón, cloruro de dodecil dimetil amonio, dodemorf, dodina, doguadina, edifenfós, epoxiconazol, etirimol, (Z)-N-bencil-N([metil(metil-tioetilidenaminooxicarbonil)amino]tio)- β -alaninato de etilo,

etridiazol, famoxadona, fenamidona (RPA407213), fenarimol, fenbuconazol, fenfuram, fenhexamida (KBR2738), fenpiclonilo, fenpropidina, fenpropimorf, acetato de fentina, hidróxido de fentina, ferbam, ferimzona, fluazinam, fludioxonilo, flumetover, fluoroimida, fluquinconazol, flusilazol, flutolanilo, flutriafol, folpet, fuberidazol, furalaxilo, furametpir, guazatina, hexaconazol, hidroxiisoxazol, himexazol, imazalilo, imibenconazol, iminoctadina, triacetato de iminoctadina, ipconazol, iprobenfós, iprodiona, iprovalicarb (SZX0722), isopropanil butil carbamato, isoprotiolano, kasugamicina, kresoxim-metilo, LY186054, LY211795, LY248908, mancozeb, maneb, mefenoxam, mepanipirim, mepronilo, metalaxilo, metconazol, metiram, metiram-zinc, metominostrobin, miclobutanilo, neasozina, dimetilditiocarbamato de níquel, nitrotal-isopropilo, nuarimol, ofurace, compuestos de organomercurio, oxadixilo, oxasulfurón, ácido oxolínico, oxpoconazol, oxicarboxina, pefurazoato, penconazol, pencicuron, óxido de fenazina, fosetilo-Al, ácidos fosforosos, ftalida, picoxistrobina (ZA1963), polioxina D, poliram, probenazol, procloraz, procimidona, propamocarb, propiconazol, propineb, ácido propiónico, pirazofós, pirifenox, pirimetanilo, piroquilona, piroxifur, pirrolnitrina, compuestos de amonio cuaternario, quinometionato, quinoxifeno, quintozeno, sipconazol (F-155), pentaclorofenato de sodio, espiroxamina, estreptomycin, azufre, tebuconazol, tecloflam, tecnazeno, tetraconazol, tiabendazol, tifulazida, 2-(tiocianometil)benzotiazol, tiofanato-metilo, tiram, timbenconazol, toiclofós-metilo, tolifluanida, triadimefón, triadimenol, triazbutilo, triazóxido, tricloclazol, tridemorf, trifloxistrobina (CGA279202), triforina, triflumizol, triticonazol, validamicina A, vapam, vinclozolina, zineb y ziram.

Los compuestos de fórmula (I) se pueden mezclar con el suelo, turba u otro medio de enraizamiento para la protección de plantas frente a enfermedades fúngicas portadas por semillas, portadas por el suelo o foliares.

Los ejemplos de sinérgicos adecuados para uso en las composiciones incluyen butóxido de piperonilo, sesamex, safroxano y dodecil imidazol.

Los herbicidas y reguladores del crecimiento de las plantas adecuados para inclusión en las composiciones dependerán de la diana pretendida y del efecto requerido.

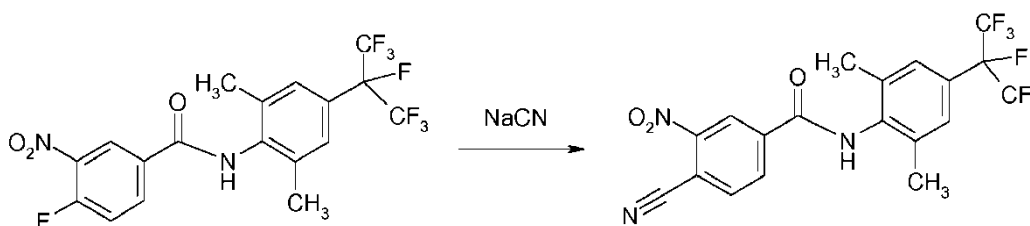
Un ejemplo de un herbicida selectivo para arroz que se puede incluir es propanilo. Un ejemplo de un regulador del crecimiento de las plantas para uso en algodón es PIX™.

Algunas mezclas pueden comprender ingredientes activos que tienen propiedades físicas, químicas o biológicas significativamente diferentes, de modo que no se presten fácilmente al mismo tipo de formulación convencional. En estas circunstancias, pueden prepararse otros tipos de formulaciones. Por ejemplo, si un ingrediente activo es un sólido insoluble en agua y el otro es un líquido insoluble en agua, puede ser posible, no obstante, dispersar cada ingrediente activo en la misma fase acuosa continua dispersando el ingrediente activo sólido como una suspensión (usando una preparación análoga a aquella de un SC) pero dispersando el ingrediente activo líquido como una emulsión (usando una preparación análoga a aquella de una EW). La composición resultante es una formulación en suspoemulsión (SE).

Los siguientes Ejemplos ilustran, pero no limitan, la invención:

Ejemplos de Preparación

Ejemplo I1: Preparación de 4-ciano-N-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluoro-metil-etil)-fenil]-3-nitro-benzamida



A una disolución de *N*-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-4-fluoro-3-nitro-benzamida (2,008 g, 4,4 mmoles) (preparada según el documento WO 05/073165) en *N,N*-dimetilformamida (25 ml) se añadió cianuro de sodio (0,237 g, 4,84 mmoles). La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 48 horas. Después se añadió agua (20 ml), y la fase orgánica se extrajo tres veces con acetato de etilo (3 x 100 ml). Los extractos orgánicos combinados se lavaron con agua y con salmuera, se secaron sobre sulfato de sodio, y se concentraron. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (eluyente: ciclohexano/acetato de etilo 1:4) para dar 4-ciano-*N*-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-3-nitro-benzamida (1,0 g, 49% de rendimiento). ¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃): 8,85 (d, 1H), 8,38 (c, 1H), 8,11 (d, 1H), 7,55 (s, 1H), 7,40 (s, 2H), 2,33 (s, 6H) ppm.

Para preparar los siguientes compuestos se usaron procedimientos análogos:

4-Ciano-*N*-[2,6-dietil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-3-nitro-benzamida. ¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃): 8,84 (s, 1H), 8,38 (c, 1H), 8,10 (d, 1H), 7,57 (s, 1H), 7,43 (s, 2H), 2,68 (c, 4H), 1,24 (t, 6H) ppm.

4-Ciano-*N*-[2-metoximetil-6-metil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-3-nitro-benzamida. $^1\text{H-RMN}$ (400 MHz, CDCl_3): 9,18 (s, 1H), 8,88 (s, 1H), 8,39 (d, 1H), 8,11 (d, 1H), 7,55 (s, 2H), 7,40 (s, 1H), 4,55 (s, 2H), 3,45 (s, 3H), 2,39 (s, 3H) ppm.

5 *N*-[2-Bromo-6-metil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-4-ciano-3-nitro-benzamida. $^1\text{H-RMN}$ (400 MHz, CDCl_3): 8,88 (s, 1H), 8,40 (d, 1H), 8,11 (d, 1H), 7,78 (s, 2H), 7,52 (s, 1H), 2,44 (s, 3H) ppm.

N-[2-Bromo-6-etil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-4-ciano-3-nitro-benzamida. $^1\text{H-RMN}$ (400 MHz, CDCl_3): 8,87 (s, 1H), 8,39 (d, 1H), 8,10 (d, 1H), 7,80 (s, 1H), 7,74 (s, 1H), 7,56 (s, 1H), 2,77 (c, 2H), 1,29 (t, 3H) ppm.

10 4-Ciano-*N*-[2,6-dibromo-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-3-nitro-benzamida. Ésta se usó en la etapa siguiente sin purificación adicional.

4-Ciano-*N*-[2-etil-6-metil-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluorometil-propil)-fenil]-3-nitro-benzamida. $^1\text{H-RMN}$ (400 MHz, CDCl_3): 8,86 (s, 1H), 8,39(c, 1H), 8,10 (d, 1H), 7,80 (s, 1H), 7,39 (s, 2H), 2,68 (c, 2H), 2,32 (s, 3H), 1,20 (t, 3H) ppm.

15 4-Ciano-*N*-[2,6-dietil-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluorometil-propil)-fenil]-3-nitro-benzamida. $^1\text{H-RMN}$ (400 MHz, CDCl_3): 8,84 (s, 1H), 8,38 (c, 1H), 8,11 (d, 1H), 7,63 (s, 1H), 7,26 (s, 2H), 2,67 (c, 4H), 1,23 (t, 6H) ppm.

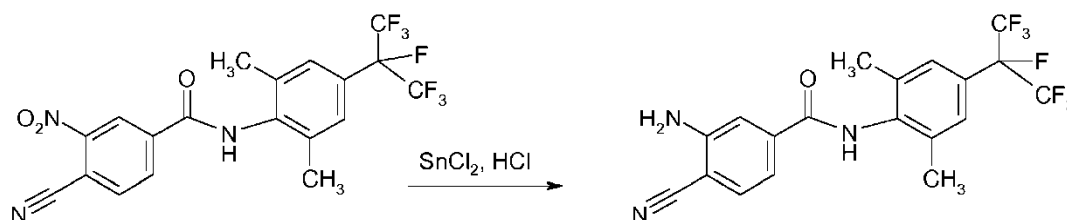
N-[2-Bromo-6-metil-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluorometil-propil)-fenil]-4-ciano-3-nitro-benzamida. $^1\text{H-RMN}$ (400 MHz, CDCl_3): 8,90 (s, 1H), 8,40 (d, 1H), 8,10 (d, 1H), 7,92 (s, 1H), 7,74 (s, 1H), 7,51 (s, 1H), 2,43 (s, 3H) ppm.

20 *N*-[2-Bromo-6-etil-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluorometil-propil)-fenil]-4-ciano-3-nitro-benzamida. $^1\text{H-RMN}$ (400 MHz, CDCl_3): 8,89 (s, 1H), 8,40 (d, 1H), 8,10 (d, 1H), 7,82 (s, 1H), 7,78 (s, 1H), 7,55 (s, 1H), 2,75 (c, 2H), 1,26 (t, 3H) ppm.

2-Ciano-*N*-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-5-nitro-benzamida. $^1\text{H-RMN}$ (400 MHz, CDCl_3): 8,81 (m, 1H), 8,69 (m, 1H), 8,33 (d, 1H), 7,49 (s, 2H), 2,21 (s, 6H) ppm.

25 2-Ciano-*N*-[2,6-dietil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-3-nitro-benzamida. $^1\text{H-RMN}$ (400 MHz, CDCl_3): 10,67 (s, 1H), 8,58 (d, 1H), 8,40 (d, 1H), 8,02 (t, 1H), 7,49 (s, 2H), 2,53 (c, 4H), 1,17 (t, 6H) ppm.

Ejemplo I2: Preparación de 3-amino-4-ciano-*N*-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-tri-fluorometil-etil)-fenil]-benzamida



30 Se disolvió 4-ciano-*N*-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-3-nitro-benzamida (1,0 g, 2,16 mmoles) (Ejemplo I1) en éter dimetilico de dietilenglicol ("diglima") (25 ml), y se añadió cloruro de estaño (1,229 g, 6,48 mmoles). La mezcla se enfrió hasta 0°C, y se añadió lentamente ácido clorhídrico acuoso (concentrado) (4 ml). La mezcla de reacción se agitó a 80°C durante 0,5 horas. Se añadió hidróxido de sodio acuoso (30% p/v) (80 ml) para ajustar el pH a 7-8. La fase acuosa se extrajo tres veces con acetato de etilo (200 ml). Los extractos orgánicos combinados se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (eluyente: ciclohexano/acetato de etilo 1:1 hasta 0:1) para dar 3-amino-4-ciano-*N*-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-benzamida (0,48 g, 51% de rendimiento). $^1\text{H-RMN}$ (400 MHz, CDCl_3): 7,54 (s, 1H), 7,49 (d, 2H), 7,36 (m, 3H), 7,15 (c, 1H), 2,3 (s, 6H) ppm.

40 Para preparar los siguientes compuestos se usaron procedimientos análogos o procedimientos bien conocidos tales como hidrogenación en presencia de un catalizador de paladio, como se describe en, por ejemplo, Journal of Medicinal Chemistry (2005), 48(24), 7560 o Journal of Medicinal Chemistry (2005), 48(6), 1729, y reducción con hidrogenosulfuro de sodio en un sistema bifásico con bromuro de tetrabutilamonio como catalizador de transferencia de fases (véase el Ejemplo I3) como se describe en, por ejemplo, Journal of Medicinal Chemistry (2006), 49(3), 955-970:

45 3-Amino-4-ciano-*N*-[2,6-dietil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-benzamida. $^1\text{H-RMN}$ (400 MHz, CDCl_3): 7,53 (d, 1H), 7,40(s, 2H), 7,33 (m, 2H), 4,65 (s a, 2H), 2,67 (c, 4H), 1,19 (t, 6H) ppm.

3-Amino-4-ciano-*N*-[2-metoximetil-6-metil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluoro-metil-etil)-fenil]-benzamida. ¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃): 8,78 (s, 1H), 7,53 (m, 2H), 7,38 (s, 1H), 7,18 (d, 1H), 4,65 (s, 2H), 4,49 (s, 2H), 3,40 (s, 3H), 2,38 (s, 3H) ppm.

5 3-Amino-*N*-[2-bromo-6-metil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-4-ciano-benzamida. ¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃): 7,72 (s, 1H), 7,60 (s, 1H), 7,54 (d, 1H), 7,50 (s, 1H), 7,35 (s, 1H), 7,21 (d, 1H), 4,65 (s, 2H), 2,40 (s, 3H) ppm.

3-Amino-*N*-[2-bromo-6-etil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-4-ciano-benzamida. ¹H-RMN (400 MHz, acetona d⁶) 7,70 (s, 1H), 7,54 (s, 1H), 7,46 (d, 1H), 7,39 (s, 1H), 7,18 (d, 1H), 5,70 (s, 2H), 2,70 (c, 2H), 1,10 (t, 3H) ppm.

10 3-Amino-4-ciano-*N*-[2,6-dibromo-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-benzamida. ¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃): 8,88 (s, 2H), 7,63 (s, 1H), 7,54 (d, 1H), 7,35 (s, 1H), 7,21 (d, 1H), 4,67 (s a, 2H) ppm.

3-Amino-4-ciano-*N*-[2-etil-6-metil-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluorometil-propil)-fenil]-benzamida. ¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃): 7,53 (d, 1H), 7,33(m, 4H), 7,15 (c, 1H), 4,64 (s a, 2H), 2,67 (c, 2H), 2,33 (s, 3H), 1,21 (t, 3H) ppm.

15 3-Amino-4-ciano-*N*-[2,6-dietil-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluorometil-propil)-fenil]-benzamida. ¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃): 7,74 (d, 1H), 7,38 (s, 2H), 7,34 (m, 2H), 7,15 (c, 1H), 4,66 (s a, 2H), 2,66 (c, 4H), 1,21 (t, 6H) ppm.

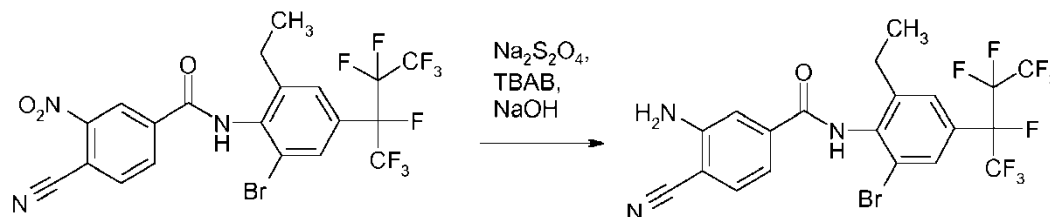
20 3-Amino-*N*-[2-bromo-6-metil-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluorometil-propil)-fenil]-4-ciano-benzamida. ¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃): 7,71 (s, 1H), 7,60 (s, 1H), 7,53 (d, 1H), 7,48 (s, 1H), 7,35 (s, 1H), 7,21 (d, 1H), 4,65 (s, 2H), 2,41 (s, 3H) ppm.

3-Amino-*N*-[2-bromo-6-etil-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluorometil-propil)-fenil]-4-ciano-benzamida. ¹H-RMN (400 MHz, acetona d⁶) 7,70 (s, 1H), 7,53 (s, 1H), 7,44 (d, 1H), 7,40 (s, 1H), 7,19 (d, 1H), 5,70 (s, 2H), 2,70 (c, 2H), 1,08 (t, 3H) ppm.

25 5-Amino-2-ciano-*N*-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-benzamida. ¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃): 7,7 (s, 1H), 7,43 (s, 2H), 7,14 (d, 1H), 7,98 (m, 1H), 4,3 (s, 2H), 2,2 (s, 6H) ppm.

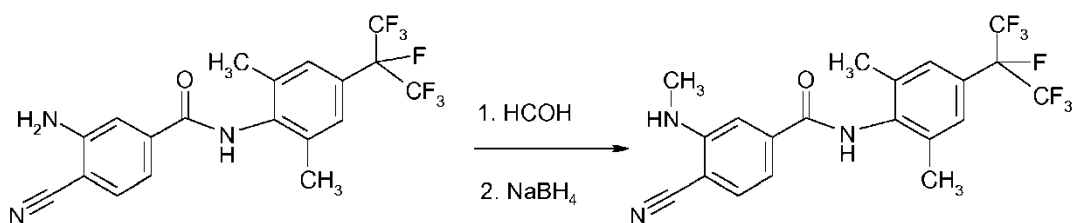
3-Amino-2-ciano-*N*-[2,6-dietil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-benzamida. ¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃): 7,5-7,44 (m, 4H), 7,28 (s, 1H), 6,94 (d, 1H), 5,60 (s, 2H), 2,50 (c, 4H), 1,13 (t, 6H) ppm.

Ejemplo I3: preparación alternativa de 3-amino-*N*-[2-bromo-6-etil-4-(1,2,2,3,3,3-hexa-fluoro-1-trifluorometil-propil)-fenil]-4-ciano-benzamida



35 Se disolvió *N*-[2-bromo-6-etil-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluorometil-propil)-fenil]-4-ciano-3-nitro-benzamida (63,9 g, 102,6 mmoles) en tetrahidrofurano (1200 ml). Se añadieron hidróxido de sodio acuoso (0,1 M, 550 ml), hidrogenosulfito de sodio (65,3 g, 307,7 mmoles) y bromuro de tetrabutilamonio ("TBAB") (3,4 g, 10,3 mmoles). La mezcla se agitó vigorosamente a 65°C. Se añadieron porciones adicionales de hidrogenosulfito de sodio después de 20 minutos (65,3 g, 307,7 mmoles) y después de 80 minutos (32,7 g, 153,8 mmoles). La mezcla de reacción se agitó a 65°C durante 30 minutos. Después la mezcla de reacción se enfrió hasta 25°C y se diluyó con acetato de etilo (1300 ml). Las fases se separaron, y la fase orgánica se extrajo con acetato de etilo (300 ml). Las fases orgánicas combinadas se lavaron con agua, con hidrogenocarbonato de sodio acuoso (10% p/v) (400 ml) y con salmuera, se secaron sobre sulfato de sodio, y se concentraron para producir 3-amino-*N*-[2-bromo-6-etil-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluorometil-propil)-fenil]-4-ciano-benzamida como un sólido amarillo (63,1 g), que se usó en la etapa siguiente sin purificación adicional.

Ejemplo I4: Preparación de 4-ciano-*N*-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluoro-metil-etil)-fenil]-3-metilamino-benzamida



Se disolvió 3-amino-4-ciano-*N*-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-benzamida (3,01 g, 6,95 mmoles) (Ejemplo I2) en acetonitrilo (50 ml), y se añadieron sucesivamente formaldehído acuoso (36,5% p/v) (0,64 ml, 6,95 mmoles) y ácido acético (30 ml). La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 45 minutos. Después se añadieron borohidruro de sodio (0,44 g, 6,95 mmoles) y más ácido acético (5 ml). La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas. La mezcla de reacción se concentró. El residuo se disolvió en acetato de etilo, y la disolución se lavó con hidróxido de sodio acuoso (1N). La fase acuosa se extrajo tres veces con acetato de etilo (200 ml). Los extractos orgánicos combinados se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (eluyente: ciclohexano/acetato de etilo 1:5) para dar 4-ciano-*N*-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-3-metilamino-benzamida (1,80 g, 58% de rendimiento). P.f. 204-206°C. ¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃): 7,53 (d, 1H), 7,37 (s, 3H), 7,23 (s, 1H), 7,10 (c, 1H), 5,88 (d, 1H), 3,02 (d, 3H), 2,35 (s, 6H) ppm.

Para preparar el siguiente compuesto se usó un procedimiento análogo:

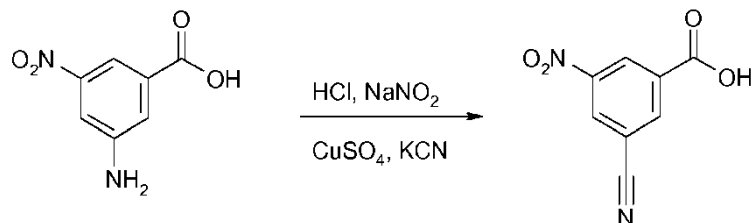
4-Ciano-*N*-[2,6-dietil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-3-metilamino-benzamida. P.f. 199-202°C. ¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃): 7,53 (d, 1H), 7,40 (s, 2H), 7,31 (s, 1H), 7,23 (s, 1H), 7,08 (c, 1H), 5,88 (d, 1H), 3,02 (d, 3H), 2,69 (c, 4H), 1,24 (t, 6H) ppm.

Después se usó el método general como se describe en Ejemplo P2 para preparar un número de compuestos (Compuesto n° C1 a C40 de la Tabla C) en paralelo.

Para preparar el siguiente compuesto se usó un procedimiento análogo:

4-Ciano-*N*-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-3-etilamino-benzamida usando acetaldehído como reactivo. ¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃): 7,52 (d, 1H), 7,37 (s, 2H), 7,35 (s, 1H), 7,23 (s, 1H), 7,08 (m, 1H), 4,69 (t, 1H), 3,35 (m, 2H), 2,35 (s, 6H), 1,24 (t, 3H) ppm.

Ejemplo I5: Preparación de ácido 3-ciano-5-nitro-benzoico



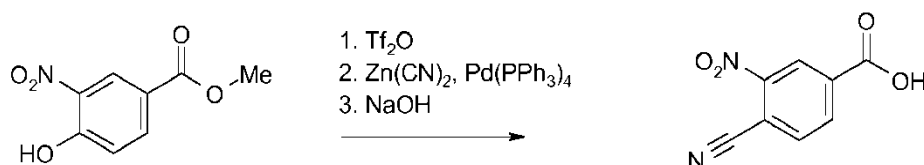
Disolución 1: Se disolvió ácido 3-amino-5-nitro-benzoico (10 g, 54,9 mmoles) en ácido clorhídrico acuoso (concentrado) (55 ml) y se diluyó con agua (200 ml). Se añadió a 0-5°C una disolución de nitrito de sodio (3,788 g, 54,90 mmoles) en agua (30 ml).

Disolución 2: A una disolución de sulfato de cobre hidratado (28,786 g, 115,29 mmoles) en agua (120 ml) se añadió una disolución de cianuro de potasio (27,528 g, 422,73 mmoles) en agua (30 ml).

La Disolución 2 se calentó hasta 65°C. El pH de la Disolución 1 se ajustó a 6-7 con carbonato de sodio acuoso (saturado) a 0-5°C. La Disolución 1 se añadió gota a gota a la Disolución 2 a 65°C. La mezcla de reacción se calentó a reflujo durante 40 minutos. La mezcla de reacción se dejó enfriar hasta la temperatura ambiente y se acidificó con ácido clorhídrico acuoso (2N). La fase acuosa se extrajo tres veces con acetato de etilo (3 x 200 ml). Los extractos orgánicos combinados se lavaron con fosfito de sodio acuoso (saturado), con agua, con salmuera, y se concentraron para dar ácido 3-ciano-5-nitro-benzoico (7,2 g, 68% de rendimiento) que se usó sin purificación adicional. ¹H-RMN (400 MHz, DMSO-*d*₆): 9,0 (s, 1H), 8,82 (s, 1H), 8,70 (s, 1H) ppm.

De forma similar, el ácido 4-ciano-3-nitro-benzoico se preparó a partir de ácido 4-amino-3-nitro-benzoico. ¹H-RMN (400 MHz, DMSO-*d*₆): 8,79 (s, 1H), 8,40 (d, 1H), 8,31 (d, 1H) ppm.

Ejemplo I6: Preparación alternativa de ácido 4-ciano-3-nitro-benzoico

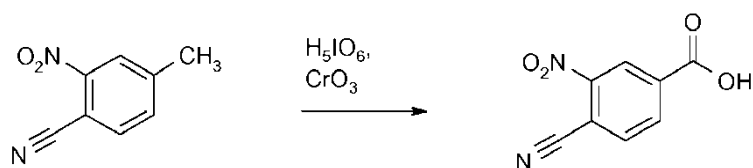


Se disolvieron éster metílico del ácido 4-hidroxi-3-nitro-benzoico (55,9 g, 283 mmoles) y piridina (67 g, 849 mmoles) en diclorometano (1100 ml). La mezcla amarilla se enfrió hasta 0°C , y se añadió anhídrido trifluorometano sulfónico (87,8 g, 311 mmoles) gota a gota durante 60 minutos a 0°C - 5°C . Tras 90 minutos a 5°C , la mezcla de reacción se lavó con ácido clorhídrico acuoso (2M), después con hidrogenocarbonato de sodio acuoso (10% p/v), y finalmente con salmuera. La fase orgánica se secó sobre sulfato de sodio y se concentró para producir éster metílico del ácido 3-nitro-4-trifluorometanosulfoniloxi-benzoico (89,7 g) como un aceite amarillo que se usó en la etapa siguiente sin purificación adicional. $^1\text{H-RMN}$ (400 MHz, CDCl_3): 8,80 (s, 1H), 8,40 (d, 1H), 7,58 (d, 1H), 4,00 (s, 3H) ppm.

Se suspendieron éster metílico del ácido 3-nitro-4-trifluorometanosulfoniloxi-benzoico (89,7 g, 272 mmoles), cianuro de cinc (19,2 g, 163 mmoles) y tetraquis(trifenilfosfina)paladio(0) (15 g) en *N,N*-dimetilformamida (2500 ml). La mezcla de reacción se agitó durante 3 horas a 100°C en una atmósfera inerte. El disolvente se evaporó, y el residuo se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (eluyente: ciclohexano/acetato de etilo 3:1) para dar éster metílico del ácido 4-ciano-3-nitro-benzoico (34,0 g, 60,7% de rendimiento). $^1\text{H-RMN}$ (400 MHz, CDCl_3): 8,92 (s, 1H), 8,48 (d, 1H), 8,04 (d, 1H), 4,03 (s, 3H) ppm.

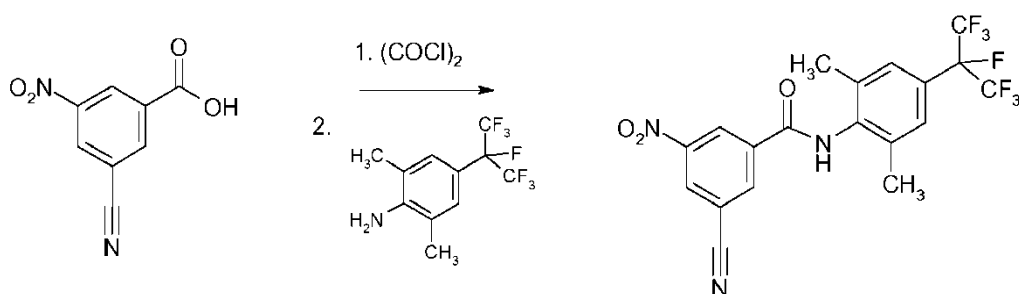
Se disolvió éster metílico del ácido 4-ciano-3-nitro-benzoico (13,4 g, 61,6 mmoles) en tetrahidrofurano (74 ml), y se añadió hidróxido de sodio acuoso (1M) (73,9 ml). La mezcla de reacción se agitó a 25°C durante 4 horas. Después, la mezcla de reacción se diluyó con agua (700 ml) y se acidificó con ácido clorhídrico acuoso (1M). La mezcla se extrajo con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron. El ácido 4-ciano-3-nitro-benzoico (12,0 g) se usó en la etapa siguiente sin purificación adicional. $^1\text{H-RMN}$ (400 MHz, DMSO-d_6): 13,00 (s a, 1H), 8,79 (s, 1H), 8,40 (d, 1H), 8,30 (d, 1H) ppm.

Ejemplo I7: Preparación alternativa de ácido 4-ciano-3-nitro-benzoico



En una atmósfera inerte, se disolvió ácido peryódico (492 g, 2,17 moles) en acetonitrilo (7,7 l) con agitación vigorosa, y después, tras 15 minutos, se añadieron sucesivamente óxido de cromo(VI) (25 g, 0,25 moles) y 4-metil-2-nitro-benzonitrilo (100 g, 0,62 moles). La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas. La mezcla de reacción se decantó, y el sobrenadante se filtró. El filtrado se concentró, y el residuo se repartió entre carbonato de sodio acuoso (1M) y diclorometano. El precipitado se aisló mediante filtración para dar ácido 4-ciano-3-nitro-benzoico (150 g). El filtrado se extrajo dos veces con diclorometano y después se acidificó mediante adición de ácido clorhídrico acuoso (4N) hasta pH 1. El filtrado acidificado se extrajo entonces tres veces con diclorometano. Los extractos orgánicos combinados se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron. Este residuo se repartió entre carbonato de sodio acuoso (1M) y diclorometano. El precipitado se aisló mediante filtración para dar ácido 4-ciano-3-nitro-benzoico (26,67 g). Rendimiento total: 150 g + 26,67 g = 176,67 g; 74,5% de rendimiento.

Ejemplo I8: Preparación de 3-ciano-*N*-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-5-nitro-benzamida

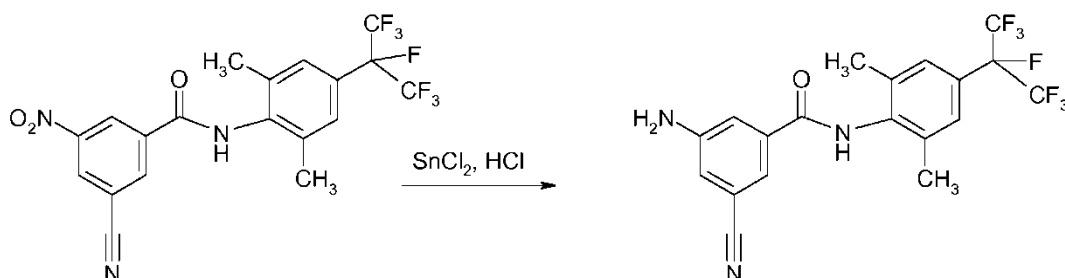


A una suspensión de ácido 3-ciano-5-nitro-benzoico (7,2 g, 37,5 mmoles) (Ejemplo I5) en diclorometano (40 ml) se añadió cloruro de oxalilo (3,808 ml, 45 mmoles) a temperatura ambiente, seguido de *N,N*-dimetilformamida (0,2 ml). La mezcla de reacción se agitó durante 1 hora a temperatura ambiente y después se calentó a reflujo durante 3 horas. La mezcla de reacción se dejó enfriar hasta la temperatura ambiente y después se concentró. El residuo se suspendió en tetrahidrofurano (50 ml). Se disolvió 2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)anilina (9,761 g, 33,7 mmoles)

(preparada según el documento EP 1.006.102) en tetrahidrofurano (50 ml), y se añadió piridina (6,035 ml, 75 mmoles). La mezcla se enfrió hasta 0°C, y se añadió la disolución de cloruro de 2-fluoro-5-nitro-benzoílo. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 12 horas. Después se añadió hidrogenocarbonato de sodio acuoso (saturado) (100 ml), y la fase orgánica se extrajo dos veces con acetato de etilo (2 x 200 ml). Los extractos orgánicos combinados se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (eluyente: ciclohexano/acetato de etilo 6:1) para dar 3-ciano-*N*-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-5-nitro-benzamida (12 g, 77% de rendimiento). ¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃): 8,99 (m, 1H), 8,72 (m, 1H), 8,6 (m, 1H), 7,80 (s, 1H), 7,4 (s, 2H), 2,33 (s, 6H) ppm.

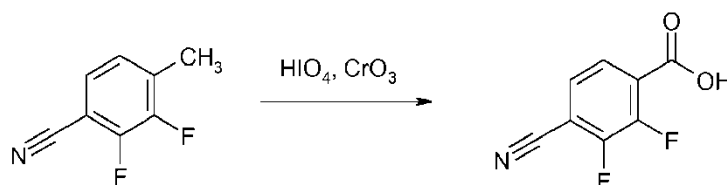
De forma similar, como una síntesis alternativa, se preparó *N*-[2-bromo-6-etil-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluorometil-propil)-fenil]-4-ciano-3-nitro-benzamida a partir de ácido 4-ciano-3-nitro-benzoico (Ejemplo I5, I6 o I7).

Ejemplo I9: Preparación de 5-amino-3-ciano-*N*-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-tri-fluorometil-etil)-fenil]-benzamida



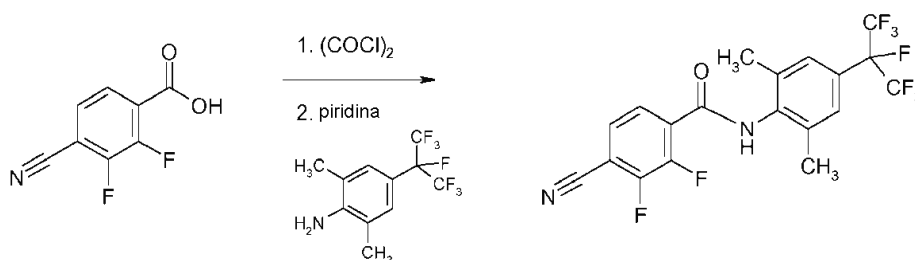
Se disolvió 3-ciano-*N*-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-5-nitro-benzamida (12,0 g, 25,9 mmoles) (Ejemplo I8) en isopropanol (200 ml), y se añadió cloruro de estaño (14,73 g, 77,7 mmoles). La mezcla se enfrió hasta 0°C, y se añadió lentamente ácido clorhídrico acuoso (concentrado) (30 ml). La mezcla de reacción se agitó a 80°C durante 0,5 horas. Se evaporó 1/3 del volumen total de isopropanol. Se añadió agua (100 ml) a la mezcla concentrada, y se añadió hidróxido de sodio acuoso (4N) para ajustar el pH a 7-8. La fase acuosa se extrajo tres veces con acetato de etilo (3x 200 ml). Los extractos orgánicos combinados se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (eluyente: ciclohexano/acetato de etilo 4:1 hasta 0:1) para dar 5-amino-3-ciano-*N*-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-benzamida (10,6 g, 94,4% de rendimiento). ¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃): 7,47 (s, 1H), 7,44 (s, 2H), 7,36 (s, 2H), 7,07 (s, 1H), 4,11 (s, 2H), 2,32 (s, 6H) ppm.

Ejemplo I10: Preparación de ácido 4-ciano-2,3-difluoro-benzoico



Una disolución de ácido peryódico (4,787 g, 21 mmoles) en acetonitrilo (75 ml) en una atmósfera de nitrógeno se agitó a temperatura ambiente durante 15 minutos antes de la adición de óxido de cromo(VI) (120 mg, 1,2 mmoles) y 2,3-difluoro-4-metil-benzonitrilo (0,919 g, 6 mmoles). La mezcla de reacción se agitó durante una hora a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se filtró, y el filtrado se concentró. El residuo se recogió en carbonato de sodio acuoso (1M) y se lavó dos veces con diclorometano. La fase acuosa se acidificó con ácido clorhídrico acuoso (4M) y se extrajo tres veces con diclorometano. Las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron para dar ácido 4-ciano-2,3-difluoro-benzoico (0,77 g, 70% de rendimiento), que se usó sin purificación adicional.

Ejemplo I11: Preparación de 4-ciano-2,3-difluoro-*N*-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-benzamida

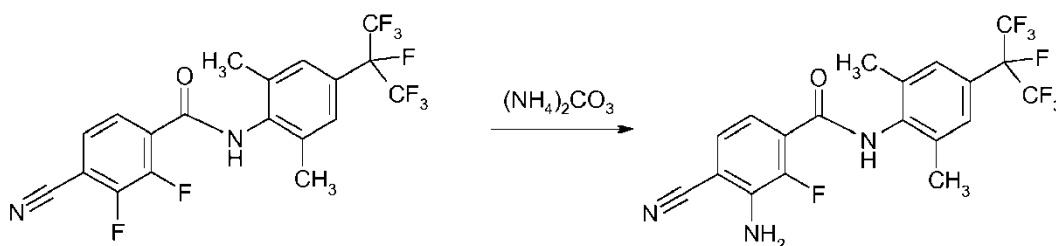


A una disolución de ácido 4-ciano-2,3-difluoro-benzoico (623 mg, 3,4 mmoles) (Ejemplo I10) y *N,N*-dimetilformamida (2 gotas) en diclorometano (17 ml) en una atmósfera de nitrógeno se añadió cloruro de oxalilo (0,3455 ml, 4,08 mmoles). La mezcla de reacción se agitó durante una hora a temperatura ambiente y después a 60°C durante 1,5 horas. La mezcla de reacción se concentró, y el residuo se disolvió en tetrahidrofurano (5 ml). La disolución se añadió gota a gota a una disolución de 2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)anilina (preparada según el documento EP 1.006.102) (787 mg, 2,72 mmoles) y piridina (547 µl, 6,8 mmoles) en tetrahidrofurano (12 ml). La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas. Después, la mezcla de reacción se vertió en hidrogenocarbonato de sodio acuoso (1M), y la mezcla se extrajo tres veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron. El residuo se purificó mediante cromatografía de fase inversa (eluyente: trifluoroacético ácido/agua/acetonitrilo 1:4:5 hasta 1:1:8) para dar 4-ciano-2,3-difluoro-*N*-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-benzamida (0,675 g, 44% de rendimiento). ¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃): 2,35 (6H, s), 7,38 (2H, s), 7,57 (1H, m), 7,79 (1H, d), 8,03 (1H, m) ppm.

De forma similar, se preparó *N*-[2-bromo-6-etil-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluorometil-propil)-fenil]-4-ciano-3-fluoro-benzamida a partir de ácido 4-ciano-3-fluoro-benzoico (comercialmente disponible). ¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃): 7,81 (m, 3H), 7,76 (s, 1H), 7,63 (s, 1H), 7,52 (s, 1H), 2,75 (c, 2H), 1,23 (t, 3H) ppm.

De forma similar, se preparó 4-ciano-3-fluoro-*N*-[2-metoximetil-6-metil-4-(1,2,2,3,3,3-hexa-fluoro-1-trifluorometil-propil)-fenil]-benzamida a partir de ácido 4-ciano-3-fluoro-benzoico (comercialmente disponible). ¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃): 8,95 (s, 1H), 7,82 (m, 2H), 7,53 (s, 1H), 7,36 (s, 1H), 4,5 (s, 2H), 3,39 (s, 3H), 2,37 (s, 3H) ppm.

Ejemplo I12: Preparación de 3-amino-4-ciano-*N*-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-2-fluoro-benzamida



A una disolución de 4-ciano-2,3-difluoro-*N*-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-benzamida (0,693 g, 1,53 mmoles) (Ejemplo I11) en dimetilsulfóxido (2,32 ml) se añadió carbonato de amonio (69 mg, 1,75 mmoles). La mezcla de reacción se calentó hasta 100°C durante 16 horas. La mezcla de reacción se dejó enfriar hasta la temperatura ambiente y después se repartió entre agua y acetato de etilo. La fase orgánica se secó sobre sulfato de sodio y se concentró. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (eluyente: ciclohexano/acetato de etilo 7:3) para dar 3-amino-4-ciano-*N*-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-2-fluoro-benzamida (290 mg, 42% de rendimiento). ¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃): 2,35 (6H, s), 4,68 (1H, s), 7,35 - 7,41 (4H, m), 7,74 (1H, d) ppm.

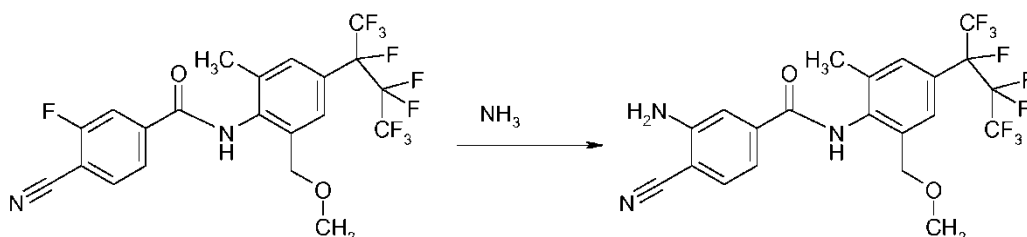
Para preparar los siguientes compuestos se usaron procedimientos análogos:

3-Amino-4-ciano-*N*-[2,6-dietil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-2-fluoro-benzamida. ¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃): 8,73 (1H, d), 7,42 - 7,32 (4H, m), 4,7 (2H, s), 4,70 (2H, s), 2,70 (4H, q), 1,23 (6H, t) ppm.

3-Amino-4-ciano-2-fluoro-*N*-[2-metoximetil-6-metil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-benzamida. ¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃): 8,82 (1H, d), 7,52 (1H, s), 7,43 - 7,32 (3H, m), 4,7 (2H, s), 4,5 (2H, s), 3,40 (3H, s), 2,37 (3H, s) ppm.

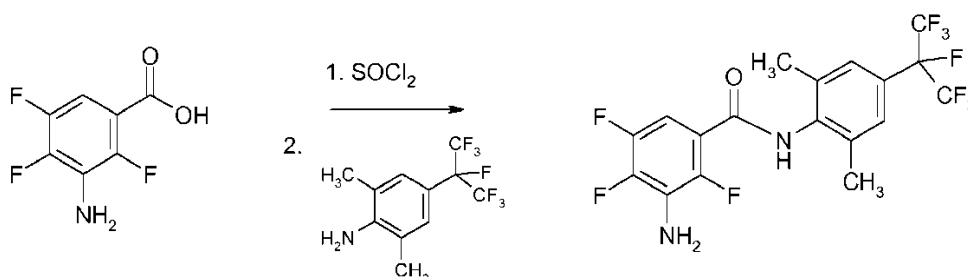
De forma similar, como una síntesis alternativa, se preparó 3-amino-*N*-[2-bromo-6-etil-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluorometil-propil)-fenil]-4-ciano-benzamida a partir de *N*-[2-bromo-6-etil-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluorometil-propil)-fenil]-4-ciano-3-fluoro-benzamida (Ejemplo 11).

Ejemplo I13: Preparación de 3-amino-4-ciano-*N*-[2-metoximetil-6-metil-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluorometil-propil)-fenil]-benzamida



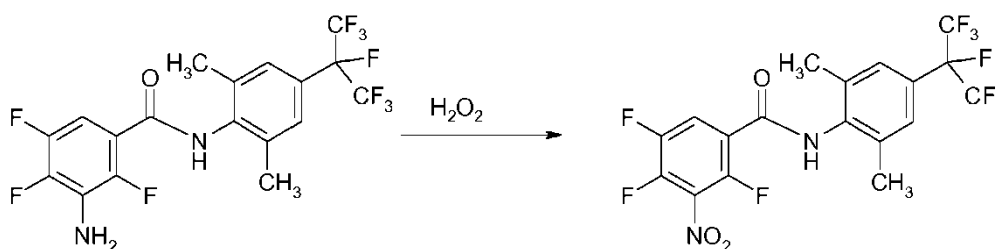
Se añadió amoníaco gaseoso durante 30 minutos a una disolución de 4-ciano-3-fluoro-*N*-[2-metoximetil-6-metil-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluorometil-propil)-fenil]-benzamida (0,981 g, 1,90 mmoles) (Ejemplo 11) en dimetilsulfóxido (20 ml). La mezcla de reacción se calentó hasta 100°C durante 16 horas. La mezcla de reacción se dejó enfriar hasta la temperatura ambiente, y se añadió más amoníaco gaseoso. La mezcla de reacción se calentó hasta 100°C durante otras 16 horas. La mezcla de reacción se dejó enfriar hasta la temperatura ambiente y después se repartió entre agua y acetato de etilo. La fase acuosa se extrajo 3 veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (eluyente: ciclohexano/acetato de etilo 3:1) para dar 3-amino-4-ciano-*N*-[2-metoximetil-6-metil-4-(1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-trifluorometil-propil)-fenil]-benzamida (640 mg, 66% de rendimiento). ¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃): 8,77 (s, 1H), 7,51 (m, 2H), 7,37 (m, 2H), 7,18 (d, 1H), 4,63 (s, 2H), 4,49 (s, 2H), 3,37 (s, 3H), 2,36 (s, 3H) ppm.

Ejemplo I14: Preparación de 3-amino-*N*-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-2,4,5-trifluoro-benzamida



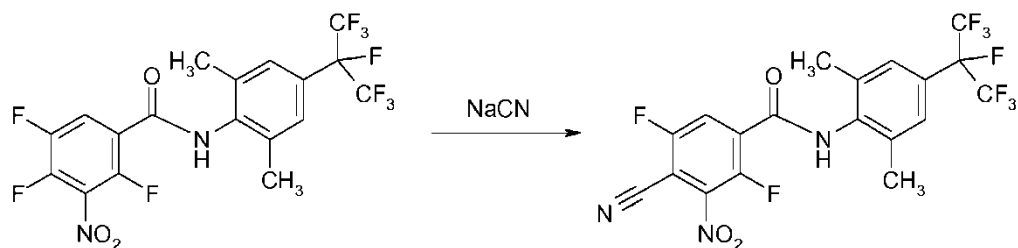
Se calentó ácido 3-amino-2,4,5-trifluoro-benzoico (comercialmente disponible) (12,5 g, 65,50 mmoles) con cloruro de tionilo (110 ml) a 90°C durante 2 horas en una atmósfera de nitrógeno. El exceso de cloruro de tionilo se eliminó a vacío. A una disolución del residuo (13,37 g, 52,30 mmoles) en diclorometano (218 ml) en una atmósfera de nitrógeno se añadió una disolución de 2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)anilina (preparada según el documento EP 1.006.102) (15,12 g, 52,30 mmoles) en piridina (4,2 ml, 52,30 mmoles). La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas y después se extrajo con ácido clorhídrico acuoso (1M). La fase acuosa se extrajo dos veces con diclorometano. Las fases orgánicas combinadas se lavaron con hidrogenocarbonato de sodio acuoso (1M), se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (eluyente: ciclohexano/acetato de etilo 7:3) para dar 3-amino-*N*-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-2,4,5-trifluoro-benzamida (18,4 g, 76% de rendimiento). ¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃): 2,35 (6H, s), 4,07 (2H, s), 7,3 - 7,35 (1H, m), 7,36 (2H, s), 7,83 (1H, d) ppm.

Ejemplo I15: Preparación de *N*-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-3-nitro-2,4,5-trifluoro-benzamida



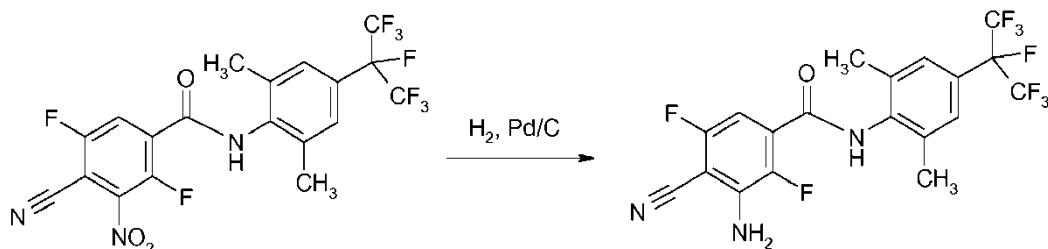
A una disolución de 3-amino-*N*-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-2,4,5-trifluoro-benzamida (32,8 g, 71 mmoles) (Ejemplo I14) y ácido trifluoroacético (237 ml) en cloroformo (118 ml) se añadió gota a gota peróxido de hidrógeno acuoso (67 ml) (35% p/v). La mezcla de reacción se mantuvo a aproximadamente 50°C con enfriamiento externo. La mezcla de reacción se agitó a 55°C durante 30 minutos, después se vertió en una mezcla de hielo y agua. La mezcla se extrajo dos veces con diclorometano. Las fases orgánicas combinadas se lavaron con hidrogenocarbonato de sodio acuoso (1M), se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (eluyente: ciclohexano/acetato de etilo 7:3) para dar *N*-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-3-nitro-2,4,5-trifluoro-benzamida (23,94 g, 68,5% de rendimiento). ¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃): 2,35 (6H, s), 7,38 (2H, s), 7,68 (1H, d), 8,25 (1H, m) ppm.

Ejemplo I16: Preparación de 4-ciano-2,5-difluoro-*N*-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-3-nitro-benzamida



A una disolución de *N*-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-3-nitro-2,4,5-trifluoro-benzamida (6,77 g, 13,75 mmoles) (Ejemplo I15) en *N,N*-dimetilformamida (137 ml) a 0°C se añadió cianuro de sodio (740 mg, 15,13 mmoles). La mezcla de reacción se agitó a 0°C durante una hora y después a temperatura ambiente durante 16 horas. La mezcla de reacción se concentró, y el residuo se repartió entre agua y diclorometano. Las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (eluyente: ciclohexano/acetato de etilo 8:2) para dar 4-ciano-2,5-difluoro-*N*-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-3-nitro-benzamida (3,2 g, 46,6% de rendimiento). ¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃): 2,35 (6H, s), 7,38 (2H, s), 7,83 (1H, d), 8,29 (1H, m) ppm.

10 **Ejemplo I17: Preparación de 3-amino-4-ciano-2,5-difluoro-*N*-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-benzamida**



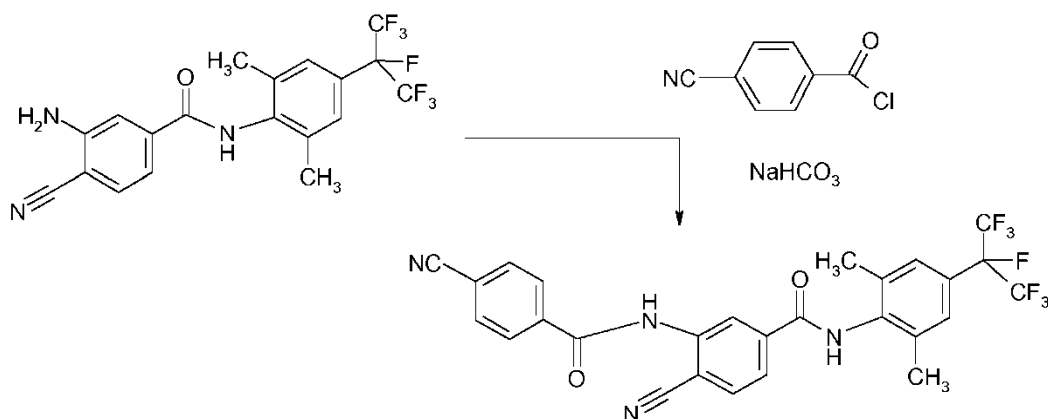
Una disolución de 4-ciano-2,5-difluoro-*N*-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-3-nitro-benzamida (5,99 g, 12 mmoles) (Ejemplo I16) en metanol se hizo reaccionar con hidrógeno durante 16 horas en presencia de paladio al 10% sobre carbono (40 bares, 40°C). La mezcla de reacción se filtró para eliminar el catalizador, y el filtrado se concentró. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (eluyente: ciclohexano/acetato de etilo 7:3) para dar 3-amino-4-ciano-2,5-difluoro-*N*-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-benzamida (0,953 g, 17% de rendimiento). ¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃): 2,36 (6H, s), 4,82 (2H, s a), 7,12 (1H, m), 7,38 (2H, s), 7,78 (1H, d) ppm.

20 Para preparar los siguientes compuestos se usaron procedimientos análogos:

3-Amino-4-ciano-*N*-[2,6-dietil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-2,5-difluoro-benzamida. ¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃): 1,22 (6H, t), 2,68 (4H, q), 4,85 (2H, s), 7,12 (1H, m), 7,41 (2H, s), 7,77 (1H, d) ppm.

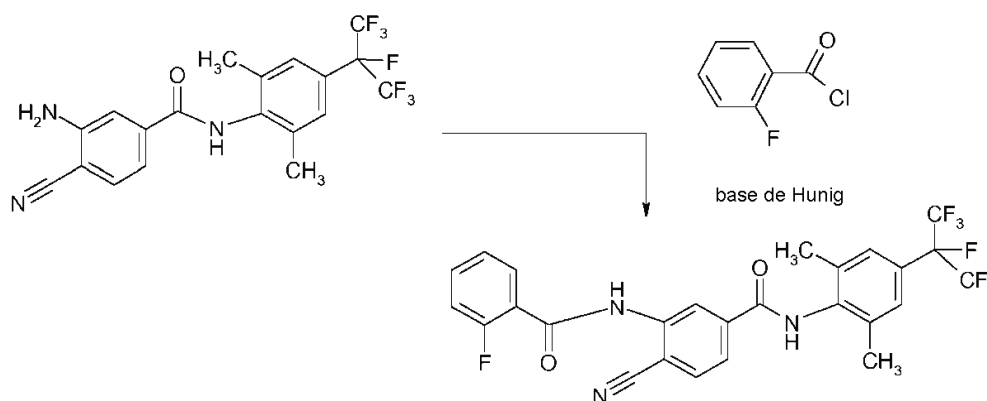
3-Amino-4-ciano-2,5-difluoro-*N*-[2-metoximetil-6-metil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-benzamida. ¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃): 2,35 (3H, s), 3,41 (3H, s), 4,49 (2H, s), 4,84 (2H, s), 7,12 (1H, m), 7,41 (1H, s), 7,52 (1H, s), 8,89 (1H, d) ppm.

25 **Ejemplo P1: Preparación de 4-ciano-3-(4'-ciano-benzoilamino)-*N*-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-benzamida (Compuesto n° A1 de la Tabla A)**



- 5 Se disolvió 3-amino-4-ciano-*N*-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-benzamida (65 mg, 0,15 mmoles) (Ejemplo I2) en una mezcla bifásica de acetato de etilo (3 ml) e hidrogenocarbonato de sodio acuoso (1N) (3 ml). Se añadió cloruro de 4-ciano-benzoilo (50 mg, 0,30 mmoles) bajo agitación vigorosa. La mezcla de reacción se agitó durante 3 horas a temperatura ambiente. Las fases se separaron. La fase orgánica se secó sobre sulfato de sodio y se concentró. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (eluyente: ciclohexano/acetato de etilo 2:1) para dar el Compuesto nº A1 de la Tabla A (81,5 mg, 97% de rendimiento). ¹H-RMN (400 MHz, CHCl₃): 9,15 (s, 1H), 8,5 (s, 1H), 8,05 (m, 2H), 7,88 (m, 4H), 7,7 (s, 1H), 7,4 (m, 2H), 2,4 (s, 6H) ppm.

Ejemplo P2: Método general para la acilación de una amino-benzamida en paralelo

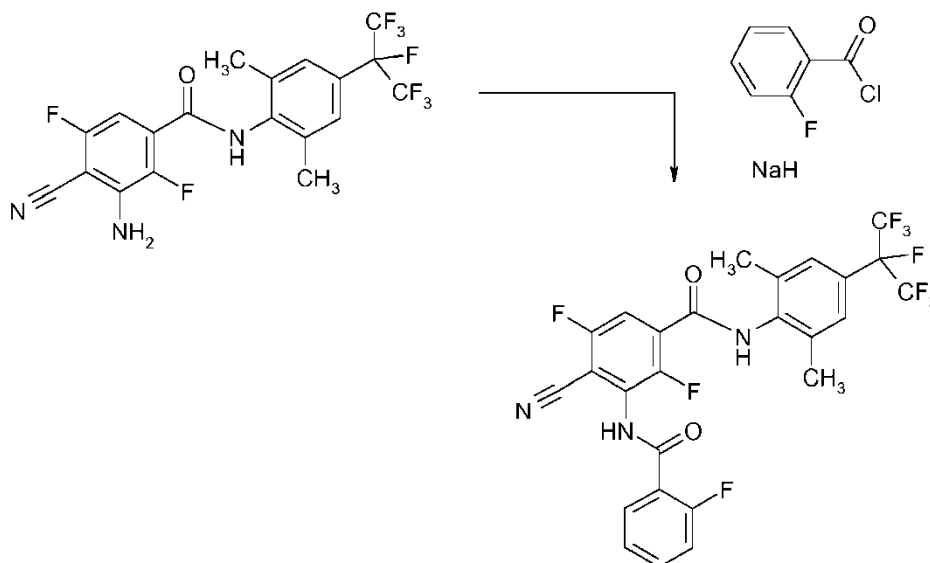


- 10 La Disolución A se preparó disolviendo la amino-benzamida (0,65 mmoles), 3-amino-4-ciano-*N*-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-benzamida (Ejemplo I2) en el caso del Compuesto nº A3 de la Tabla A, en tolueno (7,8 ml). La Disolución B se preparó disolviendo el cloruro de ácido (1,0 moles), cloruro de 2-fluorobenzoilo en el caso del Compuesto nº A3 de la Tabla A, en tolueno (8 ml).

- 15 La Disolución A (0,3 ml, 25 µmoles) se puso en un pocillo, y se añadieron sucesivamente Disolución B (0,4 ml, 50 µmoles) y diisopropiletilamina (Base de Hunig) (30 µl, 150 µmoles). La mezcla se agitó a 55°C durante 16 horas. La mezcla se diluyó con una mezcla de acetonitrilo (0,6 ml) y *N,N*-dimetilacetamida (0,2 ml) y después se purificó mediante HPLC para dar el compuesto deseado.

Este método general se usó para preparar un número de compuestos (Compuesto nº A3 a A220 de la Tabla A, Compuesto nº B2 a B15 de la Tabla B, Compuesto nº D1 a D56 de la Tabla D) en paralelo.

- 20 **Ejemplo P3: Un método general adicional para la acilación de una amino-benzamida en paralelo**

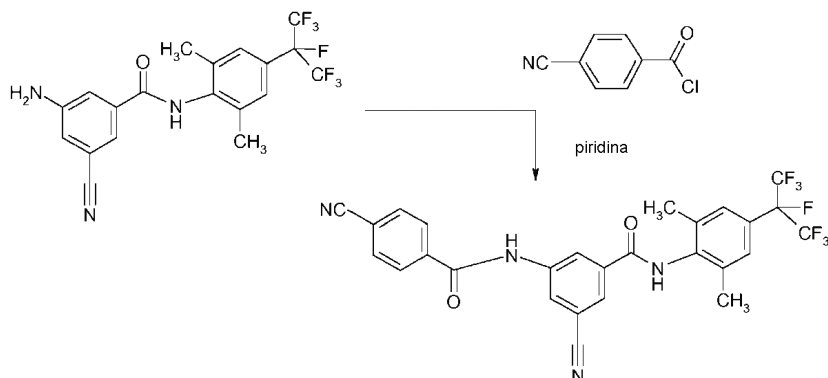


- 25 La Disolución A se preparó disolviendo la amino-benzamida (0,65 mmoles), 3-amino-4-ciano-2,5-difluoro-*N*-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-benzamida (Ejemplo I16) en el caso del Compuesto nº E43 de la Tabla E, en *N,N*-dimetilacetamida (18,2 ml). La Disolución B se preparó añadiendo hidruro de sodio en polvo (9,6 mg, 0,4 mmoles) en *N,N*-dimetilacetamida (2 ml). La Disolución C se preparó disolviendo el cloruro de ácido (0,025 moles), cloruro de 2-fluorobenzoilo en el caso del Compuesto nº E43 de la Tabla E, en *N,N*-dimetilacetamida (0,2 ml).

La Disolución A (0,7 ml, 25 μ moles) se puso en un pocillo, y se añadió la Disolución B (0,5 ml, 100 μ moles). La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 30 minutos. Después se añadió Disolución C (0,2 ml, 25 μ moles), y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas. La mezcla se diluyó con agua y se extrajo tres veces con diclorometano. Las fases orgánicas se combinaron, se filtraron y se concentraron. El residuo se purificó mediante HPLC para dar el compuesto deseado.

Este método general se usó para preparar un número de compuestos (Compuesto n° E1 a E59 de la Tabla E) en paralelo.

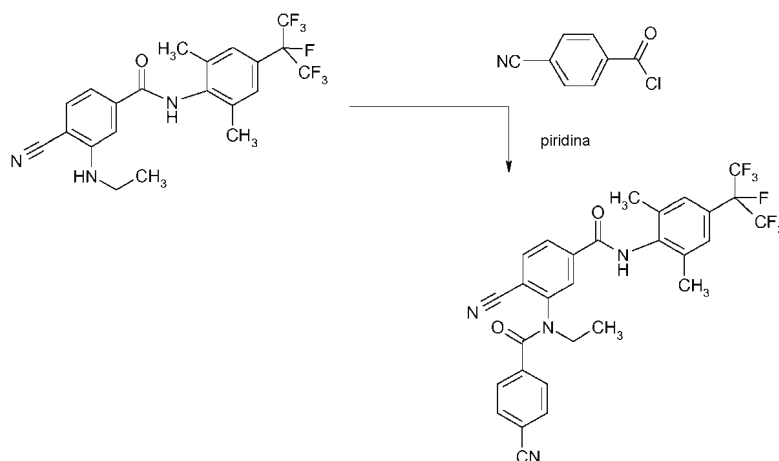
Ejemplo P4: Preparación de 3-ciano-5-(4'-ciano-benzoilamino)-N-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-benzamida (Compuesto n° B1 de la Tabla B)



A una disolución de 5-amino-3-ciano-N-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-benzamida (0,199 mg, 0,46 mmoles) (Ejemplo I9) en tetrahidrofurano (3 ml) se añadieron sucesivamente piridina (0,117 ml, 1,45 mmoles) y cloruro de 4-ciano-benzoilo (80 mg, 0,48 mmoles). La mezcla de reacción se agitó durante 2 horas a temperatura ambiente. Se añadió hidrogenocarbonato de sodio acuoso (saturado), y las fases se separaron. La fase acuosa se extrajo dos veces con acetato de etilo. Los extractos orgánicos combinados se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (eluyente: ciclohexano/acetato de etilo 2:1) para dar el Compuesto n° B1 de la Tabla B (0,186 g, 71,9% de rendimiento). $^1\text{H-RMN}$ (400 MHz, CHCl_3): 8,45 (s, 1H), 8,36 (s, 1H), 8,27 (s, 1H), 8,00 (m, 3H), 7,84 (m, 2H), 7,63 (s, 1H), 7,37 (s, 2H), 2,34 (s, 6H) ppm.

Para preparar los siguientes compuestos se usaron procedimientos análogos: Compuesto n° F1 y F2 de la Tabla F y Compuesto n° G1 a G3 de la Tabla G.

Ejemplo P5: Preparación de 4-ciano-3-[(4'-ciano-benzoil)-etil-amino]-N-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil)-fenil]-benzamida (Compuesto n° C43 de la Tabla C)

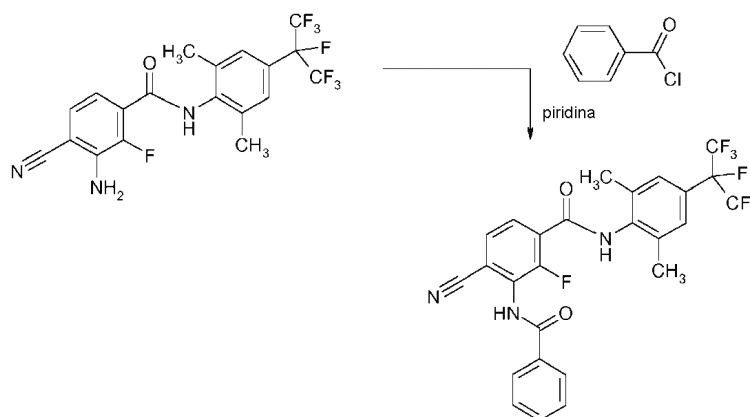


A una disolución de 4-ciano-N-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-3-etilamino-benzamida (198 mg, 0,43 mmoles) (Ejemplo I4) en tetrahidrofurano (5 ml) se añadieron sucesivamente piridina (0,138 ml, 1,72 mmoles) y cloruro de 4-ciano-benzoilo (0,214 mg, 1,29 mmoles). La mezcla de reacción se calentó hasta 50°C durante 16 horas. La mezcla de reacción se dejó enfriar hasta la temperatura ambiente. Se añadieron una segunda porción de cloruro de 4-ciano-benzoilo (0,107 mg, 0,645 mmoles), piridina (0,138 ml, 1,72 mmoles), y el calentamiento se repitió a 90°C durante 2 horas. La mezcla de reacción se dejó enfriar hasta la temperatura ambiente y después se repartió entre hidrogenocarbonato de sodio acuoso (1M) y acetato de etilo. La fase acuosa

se extrajo dos veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (eluyente: acetato de etilo/ciclohexano 1:4) para dar el Compuesto n° C43 de la Tabla C (0,24 g, 94% de rendimiento).

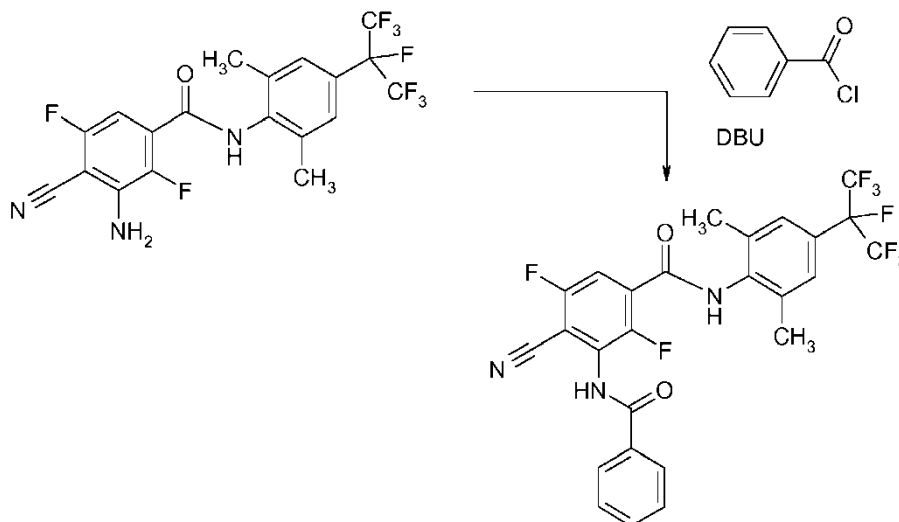
5 Para preparar los siguientes compuestos se usaron procedimientos análogos: Compuesto n° C41 y C42 de la Tabla C.

Ejemplo P6: Preparación alternativa de 3-benzoilamino-4-ciano-N-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-2-fluoro-benzamida (Compuesto n° D 15 de la Tabla D)



10 A una disolución de 3-amino-4-ciano-N-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-2-fluoro-benzamida (68 mg, 0,15 mmoles) (Ejemplo I12) en tetrahidrofurano (2 ml) se añadieron piridina (36 μ l, 0,45 mmoles) y cloruro de benzoilo (21 μ l, 0,18 mmoles). La mezcla de reacción se calentó en un microondas a 140°C durante 30 minutos. La mezcla de reacción se dejó enfriar hasta la temperatura ambiente. Se añadió una segunda porción de cloruro de benzoilo (21 μ l, 0,18 mmoles), y el calentamiento se repitió a 140°C durante 30 minutos. La mezcla de reacción se dejó enfriar hasta la temperatura ambiente y después se repartió entre hidrogenocarbonato de sodio (1M) y acetato de etilo. La fase acuosa se extrajo dos veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron. El residuo se purificó mediante cromatografía de fase inversa (eluyente: ácido trifluoroacético/agua/acetonitrilo 1:4:5 hasta 1:1:8) para dar el Compuesto n° D15 de la Tabla D (0,024 g, 28% de rendimiento). $^1\text{H-RMN}$ (400 MHz, CDCl_3): 2,28 (6H, s), 7,33 (2H, s), 7,45 - 7,96 (9H, m) ppm.

20 **Ejemplo P7: Preparación alternativa de 3-benzamido-4-ciano-2,5-difluoro-N-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-benzamida (Compuesto n° E36 de la Tabla E)**



25 A una disolución de 3-amino-4-ciano-2,5-difluoro-N-[2,6-dimetil-4-(1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil-etil)-fenil]-benzamida (70 mg, 0,15 mmoles) (Ejemplo I16) en cloroformo (0,75 ml) se añadieron 1,8-diazabicycloundec-7-eno ("DBU") (49 μ l, 0,33 mmoles) y cloruro de benzoilo (17 μ l, 0,15 mmoles). La mezcla de reacción se calentó en un microondas hasta 140°C durante 30 minutos. Se añadieron dos porciones adicionales de cloruro de benzoilo (17 μ l, 0,15 mmoles), y el calentamiento se continuó a 140°C durante 30 minutos cada vez. La mezcla de reacción se repartió entre agua y cloroformo. La fase acuosa se extrajo dos veces con cloroformo. Las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron. El residuo se purificó mediante cromatografía de

fase inversa (eluyente: ácido trifluoroacético/agua/acetonitrilo 1:4:5 hasta 1:1:8) para dar el Compuesto n° E36 de la Tabla E (0,013 g, 15% de rendimiento) como un sólido blancuzco. P.f. 245-248°C. ¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃): 2,28 (6H, s), 7,38 (2H, s), 7,15 - 8,1 (8H, m) ppm.

Para el análisis de HPLC-MS se usaron los métodos siguientes:

- 5 Método A: método (Water Alliance 2795 LC) con las siguientes condiciones de gradiente de HPLC (Disolvente A: 0,1% de ácido fórmico en agua/acetonitrilo (9:1) y Disolvente B: 0,1% de ácido fórmico en acetonitrilo).

Tiempo (minutos)	A (%)	B (%)	Caudal (ml/min)
0	90	10	1,7
2,5	0	100	1,7
2,8	0	100	1,7
2,9	90	10	1,7

Tipo de columna: Water Atlantis dc18; longitud de columna: 20 mm; diámetro interior de la columna: 3 mm; tamaño de partículas: 3 micrómetros; temperatura: 40°C.

- 10 Método B: Método (Agilent, Serie 1100er) con las siguientes condiciones de gradiente de HPLC (Disolvente A: 0,1% de ácido fórmico en agua/acetonitrilo (9:1); Disolvente B: 0,1% de ácido fórmico en acetonitrilo; Disolvente C: 0,1% de ácido fórmico en agua; Disolvente D: 0,1% de ácido fórmico en agua).

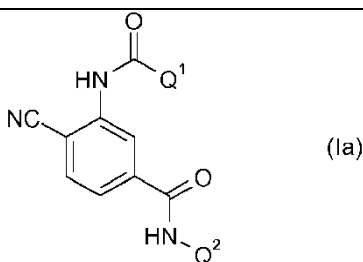
Tiempo (minutos)	A (%)	B (%)	C (%)	D (%)	Caudal (ml/min)
0	90	10	0	0	1,7
2,5	0	100	0	0	1,7
2,8	0	100	0	0	1,7
2,9	90	10	0	0	1,7

Tipo de columna: Water Atlantis dc18; longitud de columna: 20 mm; diámetro interior de la columna: 3 mm; tamaño de partículas: 3 micrómetros; temperatura: 40°C.

- 15 Los valores característicos obtenidos para cada compuesto eran el tiempo de retención ("RT", registrado en minutos) y el ion molecular, típicamente el catión MH⁺, como se enumeran en las Tablas A y B.

Tabla A: Compuestos de fórmula (Ia):

Comp. n°	Q ¹	Q ²	RT (método) min	MH+	P.f. (°C)
A1	4-ciano-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	-	-	-
A3	2-fluorofenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,07 (B)	556,1	-
A4	2-metilfenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,0 (B)	552,1	-
A5	2-clorofenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,0 (B)	572,1	-



ES 2 572 155 T3

Comp. n°	Q ¹	Q ²	RT (método)	min	MH+	P.f. (°C)
A6	4-nitro-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,01 (B)		583,1	-
A7	2-metiltio-4-trifluorometil-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,2 (B)		652,1	-
A8	4-N,N-dimetil-amino-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,1 (B)		581,2	-
A9	5-cloro-2-fluoro-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,17 (B)		590,1	-
A10	furan-2-il-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,9 (B)		528,1	-
A11	4-trifluorometoxi-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,18 (B)		622,1	-
A12	4-fluoro-3-trifluorometil-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,17 (B)		624,1	-
A13	4-trifluorometil-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,15 (B)		606,1	-
A14	2-metoxi-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,4 (B)		568,1	-
A15	fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,0 (B)		538,1	-
A16	4-fluorofenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,02 (B)		556,1	-
A17	2-trifluorometil-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,02 (B)		606,1	-
A18	2,3-difluorofenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,07 (B)		574,1	-
A19	4-metoxi-carbonil-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,0 (B)		596,1	-
A20	2-fluoro-5-trifluorometilo-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,19 (B)		624,1	-
A23	2-fluorofenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,19 (B)		584,2	-
A24	2-metilfenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,2 (B)		580,2	-
A25	2-clorofenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,2 (B)		600,1	-
A26	4-nitro-fenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,1 (B)		611,1	-
A27	2-metiltio-4-trifluorometilo-fenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,3 (B)		680,1	-
A28	5-cloro-2-fluoro-fenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,3 (B)		618,1	-
A29	furan-2-ilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,0 (B)		556,1	-
A30	4-trifluoro-metoxifenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,3 (B)		650,1	-
A31	4-fluoro-3-trifluorometilo-fenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,3 (B)		652,1	-

ES 2 572 155 T3

Comp. n°	Q ¹	Q ²	RT (método) min	MH+	P.f. (°C)
A32	4-trifluorometilo-fenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,3 (B)	634,1	-
A33	fenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,1 (B)	566,2	-
A34	4-fluorofenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,1 (B)	584,2	-
A35	2-trifluorometilo-fenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,1 (B)	634,1	-
A36	4-metil-1,2,3-tiadiazol-5-ilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,0 (B)	588,1	-
A37	2,3-difluorofenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,2 (B)	602,1	-
A38	4-metoxi-carbonil-fenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,1 (B)	624,2	-
A39	2-fluoro-5-trifluorometilo-fenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,3 (B)	652,1	-
A41	2-fluorofenilo-	2,6-dietil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,3 (A)	634,1	-
A42	2-metilfenilo-	2,6-dietil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,2 (A)	630,2	-
A43	2-clorofenilo-	2,6-dietil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,2 (A)	650,1	-
A44	4-ciano-fenilo-	2,6-dietil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,1 (A)	641,2	-
A45	furan-2-ilo-	2,6-dietil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,1 (A)	606,1	-
A46	4-trifluoro-metoxifenilo-	2,6-dietil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,3 (A)	700,1	-
A47	4-fluoro-3-trifluorometilo-fenilo-	2,6-dietil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,3 (A)	702,1	-
A48	4-trifluorometilo-fenilo-	2,6-dietil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,3 (A)	684,1	-
A49	2-trifluoro-metoxifenilo-	2,6-dietil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,3 (A)	700,1	-
A50	2-metoxi-fenilo-	2,6-dietil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,4 (A)	646,2	-
A51	fenilo-	2,6-dietil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,2 (A)	616,2	-
A52	4-fluorofenilo-	2,6-dietil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,2 (A)	634,1	-
A53	2-trifluorometilo-fenilo-	2,6-dietil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,2 (A)	684,1	-
A54	2-cloro-4-fluoro-fenilo-	2,6-dietil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,2 (A)	668,1	-
A55	4-metil-1,2,3-tiadiazol-5-ilo-	2,6-dietil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,1 (A)	638,1	-
A56	2,3-difluorofenilo-	2,6-dietil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,3 (A)	652,1	-
A57	4-metoxi-carbonil-fenilo-	2,6-dietil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,2 (A)	674,2	-
A58	2-fluoro-5-trifluorometilo-fenilo-	2,6-dietil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,4 (A)	702,1	-
A61	2-fluorofenilo-	2-etil-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,2 (A)	620,1	-
A62	2-clorofenilo-	2-etil-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,2 (A)	636,1	-
A63	4-ciano-fenilo-	2-etil-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,1 (A)	627,1	-
A64	2-cloro-4-nitro-fenilo-	2-etil-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,3 (A)	654,1	-

ES 2 572 155 T3

Comp. n°	Q ¹	Q ²	RT (método) min	MH+	P.f. (°C)
A65	furan-2-ilo-	2-etil-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,0 (A)	592,1	-
A66	4-trifluoro-metoxifenilo-	2-etil-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,3 (A)	686,1	-
A67	4-fluoro-3-trifluorometil-fenilo-	2-etil-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,3 (A)	688,1	-
A68	4-trifluorometilo-fenilo-	2-etil-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,3 (A)	670,1	-
A69	2-trifluoro-metoxifenilo-	2-etil-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,2 (A)	686,1	-
A70	2-metoxi-fenilo-	2-etil-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,4 (A)	632,2	-
A71	fenilo-	2-etil-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,1 (A)	602,1	-
A72	4-fluorofenilo-	2-etil-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,1 (A)	620,1	-
A73	2-trifluorometilo-fenilo-	2-etil-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,2 (A)	670,1	-
A74	2-cloro-4-fluoro-fenilo-	2-etil-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,2 (A)	654,1	-
A75	4-metil-1,2,3-tiadiazol-5-ilo-	2-etil-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,0 (A)	624,1	-
A76	2,3-difluorofenilo-	2-etil-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,2 (A)	638,1	-
A77	4-metoxi-carbonil-fenilo-	2-etil-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,1 (A)	660,1	-
A78	2-fluoro-5-trifluorometilo-fenilo-	2-etil-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,3 (A)	688,1	-
A80	2-fluoro-5-trifluorometil-fenilo-	2-bromo-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,2 (B)	688	-
A81	2-fluorofenilo-	2-bromo-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,1 (B)	620	-
A82	2-metilfenilo-	2-bromo-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,1 (B)	616	-
A83	2-clorofenilo-	2-bromo-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,1 (B)	636	-
A84	4-ciano-fenilo-	2-bromo-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,0 (B)	627	-
A85	4-nitro-fenilo-	2-bromo-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,0 (B)	647	-
A86	5-cloro-2-fluoro-fenilo-	2-bromo-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,2 (B)	654	-
A87	2-cloro-4-nitro-fenilo-	2-bromo-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,1 (B)	681	-

ES 2 572 155 T3

Comp. n°	Q ¹	Q ²	RT (método) min	MH+	P.f. (°C)
A88	furan-2-ilo-	2-bromo-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,9 (B)	592	-
A89	4-trifluoro-metoxifenilo-	2-bromo-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,2 (B)	686	-
A90	4-fluoro-3-trifluorometil-fenilo-	2-bromo-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,2 (B)	688	-
A91	4-trifluorometil-fenilo-	2-bromo-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,2 (B)	670	-
A92	2-trifluoro-metoxifenilo-	2-bromo-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,1 (B)	686	-
A93	2-metoxi-fenilo-	2-bromo-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,27 (B)	632	-
A94	fenilo-	2-bromo-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,02 (B)	602	-
A95	4-fluorofenilo-	2-bromo-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,0 (B)	620	-
A96	2-trifluorometil-fenilo-	2-bromo-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,1 (B)	670	-
A97	2-cloro-4-fluoro-fenilo-	2-bromo-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,1 (B)	654	-
A98	4-metil-1,2,3-tiadiazol-5-ilo-	2-bromo-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,9 (B)	624	-
A99	2,3-difluorofenilo-	2-bromo-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,1 (B)	638	-
A100	4-metoxi-carbonil-fenilo-	2-bromo-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,0 (B)	660	-
A101	2-fluorofenilo-	2-bromo-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,2 (B)	670	-
A102	2-metilfenilo-	2-bromo-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,2 (B)	666	-
A103	2-clorofenilo-	2-bromo-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,2 (B)	686	-
A104	4-ciano-fenilo-	2-bromo-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,1 (B)	677	-
A105	4-nitro-fenilo-	2-bromo-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,1 (B)	697	-
A106	5-cloro-2-fluoro-fenilo-	2-bromo-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,3 (B)	704	-
A107	2-cloro-4-nitro-fenilo-	2-bromo-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,3 (B)	731	-
A108	furan-2-ilo-	2-bromo-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,0 (B)	642	-
A109	4-trifluoro-metoxifenilo-	2-bromo-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,3 (B)	736	-

ES 2 572 155 T3

Comp. n°	Q ¹	Q ²	RT (método)	min	MH+	P.f. (°C)
A110	4-fluoro-3-trifluorometil-fenilo-	2-bromo-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,3 (B)		738	-
A111	4-trifluorometil-fenilo-	2-bromo-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,3 (B)		720	-
A112	2-trifluoro-metoxifenilo-	2-bromo-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,2 (B)		736	-
A113	2-metoxi-fenilo-	2-bromo-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,35 (B)		682	-
A114	fenilo-	2-bromo-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,1 (B)		652	-
A115	4-fluorofenilo-	2-bromo-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,1 (B)		670	-
A116	2-cloro-4-fluoro-fenilo-	2-bromo-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,2 (B)		704	-
A117	4-metil-1,2,3-tiadiazol-5-ilo-	2-bromo-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,0 (B)		674	-
A118	2,3-difluorofenilo-	2-bromo-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,2 (B)		688	-
A119	4-metoxi-carbonil-fenilo-	2-bromo-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,13 (B)		710	-
A120	2-fluoro-5-trifluorometil-fenilo-	2-bromo-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,3 (B)		738	-
A121	2-fluorofenilo-	2-bromo-6-etil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,2 (B)		634	-
A122	2-metilfenilo-	2-bromo-6-etil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,1 (B)		630,1	-
A123	2-clorofenilo-	2-bromo-6-etil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,1 (B)		650	-
A124	4-ciano-fenilo-	2-bromo-6-etil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,1 (B)		641	-
A125	4-nitro-fenilo-	2-bromo-6-etil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,1 (B)		661	-
A126	5-cloro-2-fluoro-fenilo-	2-bromo-6-etil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,3 (B)		668	-
A127	2-cloro-4-nitro-fenilo-	2-bromo-6-etil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,1 (B)		695	-
A128	furan-2-ilo-	2-bromo-6-etil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,0 (B)		606	-
A129	4-trifluoro-metoxifenilo-	2-bromo-6-etil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,3 (B)		700	-
A130	4-fluoro-3-trifluorometil-fenilo-	2-bromo-6-etil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,25 (B)		702	-
A131	4-trifluorometil-fenilo-	2-bromo-6-etil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,23 (B)		684	-

ES 2 572 155 T3

Comp. n°	Q ¹	Q ²	RT (método)	min	MH+	P.f. (°C)
A132	2-trifluoro-metoxifenilo-	2-bromo-6-etil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,2 (B)		700	-
A133	2-metoxi-fenilo-	2-bromo-6-etil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,33 (B)		646	-
A134	fenilo-	2-bromo-6-etil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,1 (B)		616	-
A135	4-fluorofenilo-	2-bromo-6-etil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,1 (B)		634	-
A136	2-trifluorometil-fenilo-	2-bromo-6-etil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,1 (B)		684	-
A137	2-cloro-4-fluoro-fenilo-	2-bromo-6-etil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,2 (B)		668	-
A138	4-metil-1,2,3-tiadiazol-5-ilo-	2-bromo-6-etil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,0 (B)		638	-
A139	2,3-difluorofenilo-	2-bromo-6-etil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,16 (B)		652	-
A140	4-metoxi-carbonil-fenilo-	2-bromo-6-etil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,1 (B)		674	-
A141	2-fluoro-5-trifluorometil-fenilo-	2-bromo-6-etil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,28 (B)		702	-
A142	2-metilfenilo-	2-bromo-6-etil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,2 (B)		680,1	-
A143	2-clorofenilo-	2-bromo-6-etil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,2 (B)		700	-
A144	4-ciano-fenilo-	2-bromo-6-etil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,1 (B)		691	-
A145	4-nitro-fenilo-	2-bromo-6-etil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,19 (B)		711	-
A146	5-cloro-2-fluoro-fenilo-	2-bromo-6-etil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,3 (B)		718	-
A147	2-cloro-4-nitro-fenilo-	2-bromo-6-etil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,2 (B)		745	-
A148	furan-2-ilo-	2-bromo-6-etil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,1 (B)		656	-
A149	4-trifluoro-metoxifenilo-	2-bromo-6-etil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,3 (B)		750	-
A150	4-fluoro-3-trifluorometil-fenilo-	2-bromo-6-etil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,3 (B)		752	-
A151	4-trifluorometil-fenilo-	2-bromo-6-etil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,3 (B)		734	-
A152	2-trifluoro-metoxifenilo-	2-bromo-6-etil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,29 (B)		750	-
A153	2-metoxi-fenilo-	2-bromo-6-etil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,4 (B)		696	-

ES 2 572 155 T3

Comp. n°	Q ¹	Q ²	RT min (método)	MH+	P.f. (°C)
A154	fenilo-	2-bromo-6-etil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,18 (B)	666	-
A155	4-fluorofenilo-	2-bromo-6-etil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,2 (B)	684	-
A156	2-trifluorometil-fenilo-	2-bromo-6-etil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,2 (B)	734	-
A157	2-cloro-4-fluoro-fenilo-	2-bromo-6-etil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,2 (B)	718	-
A158	4-metil-1,2,3-tiadiazol-5-ilo-	2-bromo-6-etil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,1 (B)	688	-
A159	2,3-difluorofenilo-	2-bromo-6-etil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,2 (B)	702	-
A160	4-metoxi-carbonil-fenilo-	2-bromo-6-etil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,2 (B)	724	-
A161	2-fluoro-5-trifluorometil-fenilo-	2-bromo-6-etil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,4 (B)	752	-
A162	2-fluorofenilo-	2-bromo-6-etil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,3 (B)	684	-
A163	2-fluorofenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,9 (A)	586,1	-
A164	2-metilfenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,8 (A)	582,2	-
A165	2-clorofenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,8 (A)	602,1	-
A166	4-ciano-fenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,8 (A)	613,1	-
A167	4-nitro-fenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,9 (A)	582,2	-
A168	2-metil-4-fluoro-fenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,9 (A)	600,1	-
A169	5-cloro-2-fluoro-fenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,0 (A)	620,1	-
A170	furan-2-ilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,7 (A)	558,1	-
A171	4-trifluoro-metoxifenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,0 (A)	652,1	-
A172	4-trifluorometil-fenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,0 (A)	636,1	-
A173	2-trifluoro-metoxifenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,9 (A)	652,1	-
A174	2-metoxi-fenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,1 (A)	598,1	-
A175	2-trifluorometil-fenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,9 (A)	636,1	-

ES 2 572 155 T3

Comp. n°	Q ¹	Q ²	RT (método)	min	MH+	P.f. (°C)
A176	2-cloro-4-fluoro-fenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,9 (A)		620,1	-
A177	4-metil-1,2,3-tiadiazol-5-ilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,7 (A)		590,1	-
A178	2,3-difluorofenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,9 (A)		604,1	-
A179	2,4-difluorofenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,9 (A)		604,1	-
A180	2-fluoro-5-trifluorometil-fenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,0 (A)		654,1	-
A181	2,6-dicloro-5-fluoro-pirid-3-ilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	-		-	126
A182	2-fluoro-4-ciano-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	-		-	197
A183	2,3-diclorofenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	-		-	110
A184	2-fluoro-pirid-3-ilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	-		-	189
A185	2,3,4,5,6-pentafluorofenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	-		-	261
A186	2,3,5,6-tetrafluoro-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	-		-	190
A187	2-fluoro-4-ciano-fenilo-	2-etil-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	-		-	198
A188	2-metil-3-cloro-fenilo-	2-etil-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	-		-	135
A189	4-ciano-fenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	-		-	192
A190	2-cloro-pirid-3-ilo-	2-etil-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	-		-	119
A191	3-clorofenilo-	2-etil-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	-		-	206
A192	pirid-3-ilo-	2-etil-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	-		-	122
A193	3,5-diclorofenilo-	2-etil-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	-		-	164
A194	2-fluoro-pirid-3-ilo-	2-etil-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	-		-	192
A195	2-metil-pirid-3-ilo-	2-etil-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	-		-	120
A196	3,5-difluorofenilo-	2-etil-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	-		-	173
A197	3,5-dimetilfenilo-	2-etil-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	-		-	138

ES 2 572 155 T3

Comp. n°	Q ¹	Q ²	RT (método)	min	MH+	P.f. (°C)
A198	6-ciano-pirid-3-ilo-	2-etil-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	-	-	-	151
A199	4-ciano-fenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	-	-	-	269
A200	2-cloro-pirid-3-ilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	-	-	-	195
A201	2-metoxi-pirid-3-ilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	-	-	-	238
A202	5-bromo-pirid-3-ilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	-	-	-	235
A203	5,6-dicloro-pirid-3-ilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	-	-	-	253
A204	2,3,5-triiodo-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	-	-	-	182,0
A205	2,3-dimetilfenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	-	-	-	209,0
A206	2-metil-3-cloro-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	-	-	-	196,0
A207	2,6-dicloro-pirid-3-ilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	-	-	-	132,0
A208	2,3,4,5-tetrafluoro-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	-	-	-	164,0
A209	2,3,4-trifluorofenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	-	-	-	233,0
A210	2-cloro-4-fluoro-fenilo-	2,6-dibromo-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	-	-	-	212,0
A211	4-fluorofenilo-	2,6-dibromo-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	-	-	-	249,0
A212	4-ciano-fenilo-	2,6-dibromo-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	-	-	-	226
A213	2-cloro-4-ciano-fenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(nonafluoro-but-2-il)-fenilo-	-	-	-	95
A214	2,3,6-trifluorofenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	-	-	-	126
A215	4-nitro-fenilo-	2,6-dietil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,19 (A)	-	661	-
A216	2-cloro-4-nitro-fenilo-	2,6-dietil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,23 (A)	-	695	-
A217	5-cloro-2-fluoro-fenilo-	2-etil-6-metil-4-(nonafluorobut-2-il)-fenilo-	2,3 (A)	-	654	-
A218	fenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	-	-	-	78
A219	4-fluorofenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	-	-	-	86
A220	4-metilfenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,9 (A)	-	582,2	-

Tabla B: Compuestos de fórmula (Ib):

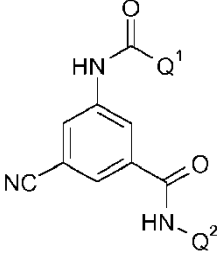
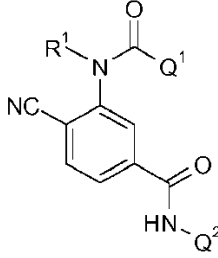
				
Comp. nº	Q ¹	Q ²	RT min (método)	MH+
B1	4-ciano-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	-	-
B2	2-fluorofenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,06 (B)	556,1
B3	2-metilfenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,1 (B)	552,1
B4	2-clorofenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,1 (B)	572,1
B5	2-metiltio-4-trifluorometil-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,2 (B)	652,1
B6	5-cloro-2-fluoro-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,2 (B)	590,1
B7	furan-2-il-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,9 (B)	528,1
B8	4-trifluoro-metoxifenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,2 (B)	622,1
B9	4-trifluorometil-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,2 (B)	606,1
B10	2-trifluoro-metoxifenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,1 (B)	622,1
B11	fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,1 (B)	538,1
B12	4-fluorofenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,1 (B)	556,1
B13	2-trifluorometil-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,1 (B)	606,1
B14	4-metoxi-carbonil-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,08 (B)	596,1
B15	2-fluoro-5-trifluorometil-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,2 (B)	624,1

Tabla C: Compuestos de fórmula (Ia'):

						
Comp. nº	R ¹	Q ¹	Q ²	RT min (método)	MH+	P.f. (°C)
C1	Me	2-fluorofenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,77 (A)	570,1	
C2	Me	2-metilfenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,9 (A)	566,2	

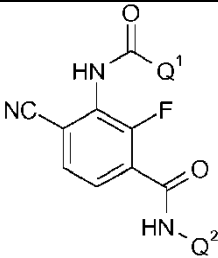
ES 2 572 155 T3

Comp. n°	R ¹	Q ¹	Q ²	RT (método)	min	MH+	P.f. (°C)
C3	Me	2-clorofenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,86 (A)		586,1	
C4	Me	4-ciano-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,8 (A)		577,1	
C5	Me	4-nitro-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,8 (A)		597,1	
C6	Me	2-metiltio-4-trifluorometil-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,0 (A)		666,1	
C8	Me	5-cloro-2-fluoro-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,92 (A)		604,1	
C9	Me	2-cloro-4-nitro-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,91 (A)		631,1	
C10	Me	furan-2-il-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,70 (A)		542,1	
C11	Me	4-trifluoro-metoxifenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,98 (A)		636,1	
C12	Me	4-fluoro-3-trifluorometilo-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,96 (A)		638,1	
C13	Me	4-trifluorometil-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,95 (A)		620,1	
C14	Me	2-trifluoro-metoxifenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,9 (A)		636,1	
C15	Me	2-metoxi-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,8 (A)		582,2	
C16	Me	fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,8 (A)		552,1	
C17	Me	4-fluorofenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,79 (A)		570,1	
C18	Me	2-trifluorometil-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,92 (A)		620,1	
C19	Me	2-cloro-4-fluoro-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,9 (A)		604,1	
C20	Me	4-metil-1,2,3-tia-diazol-5-il-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,8 (A)		574,1	
C21	Me	2,3-difluorofenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,9 (A)		588,1	
C23	Me	2-fluoro-5-trifluorometilo-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,96 (A)		638,1	
C24	Me	2-fluorofenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,9 (A)		598,2	
C25	Me	2-metilfenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,0 (A)		594,2	
C26	Me	2-clorofenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,0 (A)		614,1	

ES 2 572 155 T3

Comp. n°	R ¹	Q ¹	Q ²	RT (método) min	MH+	P.f. (°C)
C27	Me	4-nitro-fenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,96 (A)	625,2	
C28	Me	4- <i>N,N</i> -dimetil-amino-fenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,2 (A)	623,2	
C29	Me	5-cloro-2-fluoro-fenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,0 (A)	632,1	
C30	Me	2-cloro-4-nitro-fenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,0 (A)	659,1	
C31	Me	4-trifluoro-metoxifenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,09 (A)	664,2	
C32	Me	4-trifluorometil-fenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,07 (A)	648,2	
C33	Me	2-trifluoro-metoxifenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,0 (A)	664,2	
C34	Me	2-metoxi-fenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,9 (A)	610,2	
C35	Me	fenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,92 (A)	580,2	
C36	Me	4-fluorofenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,92 (A)	598,2	
C37	Me	2-trifluorometil-fenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,0 (A)	648,2	
C38	Me	2-cloro-4-fluoro-fenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,04 (A)	632,1	
C39	Me	2,3-difluorofenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,0 (A)	616,2	
C40	Me	4-metoxi-carbonil-fenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,91 (A)	638,2	
C41	Me	4-ciano-fenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	-	-	187
C42	Et	4-fluorofenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	-	-	93
C43	Et	4-ciano-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	-	-	124

Tabla D: Compuestos de fórmula (Ie):

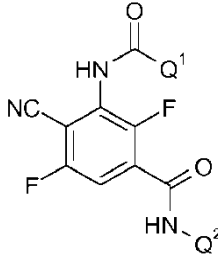
Comp. n°	Q ¹	Q ²	RT (método)	min	MH+
 (Ie)					
D1	2-fluorofenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,81 (A)		572,1
D2	2-metilfenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,8 (A)		568,1
D3	2-clorofenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,8 (A)		588,1
D4	4-ciano-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,8 (A)		579,1
D5	4-nitro-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,8 (A)		599,1
D6	2-metiltio-4-trifluorometilfenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,01 (A)		668,1
D7	4-N,N-dimetilaminofenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,9 (A)		597,2
D8	5-cloro-2-fluoro-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,9 (A)		606,1
D9	2-cloro-4-nitro-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,9 (A)		633,1
D10	furan-2-ilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,7 (A)		544,1
D11	4-trifluoro-metoxifenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,0 (A)		638,1
D12	4-fluoro-3-trifluorometilfenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,97 (A)		640,1
D13	4-trifluorometil-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,0 (A)		622,1
D14	2-trifluoro-metoxifenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,9 (A)		638,1
D15	fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,8 (A)		554,1
D16	4-fluorofenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,83 (A)		572,1
D17	2-trifluorometil-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,9 (A)		622,1
D18	2-cloro-4-fluoro-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,8 (A)		606,1
D19	2,3-difluorofenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,85 (A)		590,1
D20	4-metoxi-carbonil-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,8 (A)		612,1
D21	2-fluoro-5-trifluorometilfenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,0 (A)		640,1
D22	2-fluorofenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,96 (A)		600,1
D23	2-clorofenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,0 (A)		616,1
D24	4-ciano-fenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,9 (A)		607,1
D25	4-nitro-fenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,0 (A)		627,1
D26	2-metiltio-4-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,1 (A)		696,1

ES 2 572 155 T3

Comp. nº	Q ¹	Q ²	RT (método) min	MH+
	trifluorometilfenilo-			
D27	4- <i>N,N</i> -dimetilaminofenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,01 (A)	625,2
D28	5-cloro-2-fluoro-fenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,07 (A)	634,1
D29	2-cloro-4-nitro-fenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,0 (A)	661,1
D30	furan-2-ilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,83 (A)	572,1
D31	4-trifluorometil-fenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,1 (A)	650,1
D32	2-trifluoro-metoxifenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,06 (A)	666,1
D33	2-metoxi-fenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,0 (A)	612,2
D34	fenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,94 (A)	582,2
D35	2-trifluorometil-fenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,0 (A)	650,1
D36	2-cloro-4-fluoro-fenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,0 (A)	634,1
D37	4-metoxi-carbonil-fenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,97 (A)	640,2
D38	2-fluoro-5-trifluorometilfenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,1 (A)	668,1
D39	2-fluorofenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,01 (B)	602,1
D40	2-metilfenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,05 (B)	598,1
D41	2-clorofenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,0 (B)	618,1
D42	4-ciano-fenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,0 (B)	609,1
D43	4-nitro-fenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,0 (B)	629,1
D44	4-metilfenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,07 (B)	598,1
D45	5-cloro-2-fluoro-fenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,13 (B)	636,1
D46	furan-2-ilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,88 (B)	574,1
D47	4-trifluoro-metoxifenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,18 (B)	668,1
D48	4-fluoro-3-trifluorometilfenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,15 (B)	670,1
D49	4-trifluorometil-fenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,16 (B)	652,1
D50	2-trifluoro-metoxi-fenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,11 (B)	668,1
D51	2-metoxi-fenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,1 (B)	614,1

D52	fenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,0 (B)	584,1
Comp. n°	Q ¹	Q ²	RT (método) min	MH+
D53	4-fluorofenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,03 (B)	602,1
D54	2-trifluorometil-fenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,1 (B)	652,1
D55	2-cloro-4-fluoro-fenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoro-prop-2-il)-fenilo-	2,1 (B)	636,1
D56	2-fluoro-5-trifluorometilfenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoro-prop-2-il)-fenilo-	2,16 (B)	670,1

Tabla E: Compuestos de fórmula (If):

 <p>(If)</p>				
Comp. n°	Q ¹	Q ²	RT (método) min	MH+
E1	2-fluorofenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,2 (B)	618,1
E2	2-metilfenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,3 (B)	614,2
E3	2-clorofenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,2 (B)	634,1
E4	4-ciano-fenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,2 (B)	625,1
E5	4-nitro-fenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,23 (B)	645,1
E6	4-metilfenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,3 (B)	614,2
E7	4-fluoro-2-metil-fenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,3 (B)	632,1
E8	5-cloro-2-fluoro-fenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,33 (B)	652,1
E9	2-cloro-4-nitro-fenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,27 (B)	679,1
E10	furan-2-ilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,12 (B)	590,1
E11	4-trifluoro-metoxifenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,4 (B)	684,1
E12	4-fluoro-3-trifluorometilfenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,3 (B)	686,1
E13	4-trifluorometil-fenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,35 (B)	668,1
E14	2-trifluoro-metoxifenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,3 (B)	684,1
E15	2-metoxi-fenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,2 (B)	600,1
E16	fenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,2 (B)	618,1

ES 2 572 155 T3

E17	4-fluorofenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,3 (B)	668,1
E18	2-trifluorometil-fenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,3 (B)	652,1
Comp. n°	Q ¹	Q ²	RT (método) min	MH+
E19	2-cloro-4-fluoro-fenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,16 (B)	622,1
E20	4-metil-[1,2,3]-tiadiazol-5-il	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,3 (B)	636,1
E21	2,3-difluorofenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,3 (B)	636,1
E22	2,4-difluorofenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,3 (B)	686,1
E23	2-fluorofenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,9 (A)	590,1
E24	2-metilfenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,9 (A)	586,1
E25	2-clorofenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,9 (A)	606,1
E26	4-ciano-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,9 (A)	597,1
E27	4-metilfenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,0 (A)	586,1
E28	4-fluoro-2-metil-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,0 (A)	604,1
E29	5-cloro-2-fluoro-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,01 (A)	624,1
E30	2-cloro-4-nitro-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,0 (A)	651,1
E31	furan-2-ilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,76 (A)	562,1
E32	4-trifluoro-metoxifenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,07 (A)	656,1
E33	4-fluoro-3-trifluorometilfenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,0 (A)	658,1
E34	4-trifluorometil-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,05 (A)	640,1
E35	2-trifluoro-metoxifenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,95 (A)	656,1
E36	fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,9 (A)	572,1
E37	4-fluorofenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,9 (A)	590,1
E38	2-trifluorometil-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,0 (A)	640,1
E39	2-cloro-4-fluoro-fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,9 (A)	624,1
E40	2,3-difluorofenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,9 (A)	608,1
E41	2,4-difluorofenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,9 (A)	608,1
E42	2-fluoro-5-trifluorometilfenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,04 (A)	658,1
E43	2-fluorofenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,9 (A)	620,1
E44	2-metilfenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,9 (A)	616,1
E45	4-ciano-fenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,9 (A)	627,1
E46	4-metilfenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,94 (A)	616,1

E47	4-fluoro-2-metil-fenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,97 (A)	634,1
E48	5-cloro-2-fluoro-fenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,01 (A)	654,1
Comp. n°	Q ¹	Q ²	RT (método)	min MH+
E49	2-cloro-4-nitro-fenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,0 (A)	681,1
E50	furan-2-ilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,75 (A)	592,1
E51	4-trifluoro-metoxifenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,06 (A)	686,1
E52	4-trifluorometil-fenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,04 (A)	670,1
E53	2-trifluoro-metoxifenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,99 (A)	686,1
E54	fenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,9 (A)	602,1
E55	4-fluorofenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,9 (A)	620,1
E56	2-cloro-4-fluoro-fenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,0 (A)	654,1
E57	2,3-difluorofenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,93 (A)	638,1
E58	2,4-difluorofenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	1,9 (A)	638,1
E59	2-fluoro-5-trifluorometilfenilo-	2-metoximetil-6-metil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	2,05 (A)	688,1

Tabla F: Compuestos de fórmula (Ic):

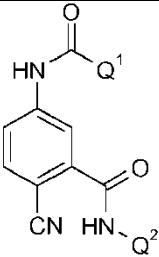
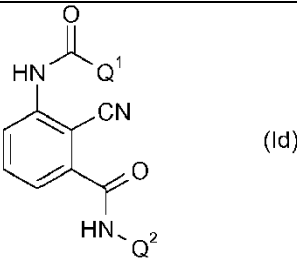
 (Ic)			
Comp. n°	Q ¹	Q ²	P.f. (°C)
F1	fenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	252
F2	4-fluorofenilo-	2,6-dimetil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	217

Tabla G: Compuestos de fórmula (Id):

			
Comp. nº	Q ¹	Q ²	P.f. (°C)
G1	fenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	191
G2	4-fluorofenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	207
G3	4-ciano-fenilo-	2,6-dietil-4-(heptafluoroprop-2-il)-fenilo-	206

Ejemplos biológicos

Este Ejemplo ilustra las propiedades plaguicidas/insecticidas de compuestos de fórmula (I). Los ensayos se realizaron como sigue:

5 *Spodoptera littoralis* (oruga de las hojas de algodón egipcio)

Se pusieron discos de hojas de algodón sobre agar en una placa de microtitulación de 24 pocillos y se pulverizaron con disoluciones de ensayo a una tasa de aplicación de 200 ppm. Después del secado, los discos de hojas se infestaron con 5 larvas L1. Las muestras se comprobaron en cuanto a mortalidad, comportamiento de alimentación, y regulación del crecimiento 3 días después del tratamiento (DAT).

10 Los compuestos siguientes dieron al menos 80% de control de *Spodoptera littoralis*: A1, A3, A4, A5, A6, A7, A9, A10, A11, A12, A13, A15, A16, A17, A18, A20, A23, A24, A25, A26, A28, A29, A30, A32, A33, A34, A35, A36, A37, A41, A42, A43, A44, A45, A46, A47, A48, A49, A51, A52, A53, A54, A55, A56, A57, A58, A61, A62, A63, A64, A65, A66, A67, A68, A69, A71, A72, A73, A74, A75, A76, A77, A78, A81, A82, A83, A84, A85, A86, A87, A88, A89, A90, A91, A94, A95, A96, A97, A98, A99, A101, A102, A103, A104, A105, A106, A107, A108, A109, A110, A111, A112, A114, A115, A116, A117, A118, A120, A121, A122, A123, A124, A125, A126, A127, A128, A134, A135, A136, A137, A138, A139, A142, A143, A144, A145, A146, A147, A148, A151, A152, A154, A155, A156, A157, A158, A159, A162, A163, A164, A165, A166, A167, A168, A169, A175, A176, A178, A179, A180, A182, A183, A184, A186, A187, A188, A189, A190, A191, A192, A194, A195, A196, A197, A198, A199, A200, A205, A206, A209, A210, A211, A212, A213, A214, A215, A216, A217, A218, A219, A220, B1, B3, C1, C2, C3, C4, C5, C6, C8, C9, C10, C11, C12, C13, C14, C15, C16, C17, C18, C19, C21, C24, C25, C26, C27, C29, C30, C34, C35, C36, C37, C38, C39, C40, C41, C42, C43, D1, D2, D3, D4, D5, D6, D8, D9, D10, D11, D12, D13, D15, D16, D17, D18, D19, D21, D22, D23, D24, D25, D28, D29, D30, D34, D36, D39, D42, E4, E16, E26, E36, E45, E54, G3.

Heliothis virescens (oruga de los brotes del tabaco):

25 Se pusieron huevos (0-24 h desde la puesta) en placas de microtitulación de 24 pocillos sobre dieta artificial, y se trataron con disoluciones de ensayo a una tasa de aplicación de 200 ppm (concentración en pocillo 18 ppm) por pipeteado. Después de un periodo de incubación de 4 días, las muestras se comprobaron respecto a mortalidad de los huevos, mortalidad de las larvas, y regulación del crecimiento.

30 Los siguientes compuestos dieron al menos 80% de control de *Heliothis virescens*: A1, A4, A9, A13, A16, A20, A23, A25, A32, A33, A34, A35, A36, A37, A41, A42, A43, A44, A45, A46, A47, A48, A49, A51, A52, A53, A54, A55, A56, A57, A58, A61, A62, A63, A64, A65, A66, A67, A68, A69, A71, A72, A73, A74, A75, A76, A77, A78, A80, A81, A82, A83, A84, A85, A86, A87, A88, A89, A90, A91, A92, A94, A95, A96, A97, A98, A99, A100, A101, A102, A103, A104, A105, A106, A107, A108, A109, A110, A111, A112, A113, A114, A115, A116, A117, A118, A120, A121, A122, A123, A124, A125, A126, A127, A128, A129, A131, A132, A134, A135, A136, A137, A138, A139, A141, A142, A143, A144, A145, A146, A147, A148, A151, A152, A154, A155, A156, A157, A158, A159, A160, A161, A162, A163, A164, A165, A166, A167, A168, A169, A170, A171, A172, A173, A175, A176, A177, A178, A179, A180, A182, A183, A184, A186, A187, A188, A189, A190, A191, A192, A193, A194, A195, A196, A197, A198, A199, A200, A202, A203, A204, A205, A206, A207, A209, A210, A211, A212, A213, A214, A215, A216, A217, A218, A219, A220, B1, B2, B3, B4, B6, B9, B11, B12, C1, C2, C3, C4, C5, C8, C9, C10, C11, C12, C13, C14, C15, C16, C17, C18, C19, C20, C21, C23, C24, C25, C26, C27, C29, C30, C31, C32, C34, C35, C36, C37, C38, C39, C40, C41, C42, C43, D1, D2, D3, D4, D5, D8, D9, D10, D11, D13, D15, D16, D17, D18, D19, D20, D21, D22, D23, D24, D25, D27, D28, D29, D30, D31, D34, D35, D36, D37, D38, D39, D40, D41, D42, D43, D44, D45, D46, D47, D48, D49, D50, D52, D53, D55, E4, E16, E26, E36, E45, E54.

Plutella xilostella (polilla de dorso adamantado):

5 Se trataron placas de microtitulación de 24 pocillos (MTP) que contenían una dieta artificial con disoluciones de ensayo a una tasa de aplicación de 200 ppm (concentración en pocillo 18 ppm) por pipeteado. Después del secado, las MTP se infestaron con larvas L2 (7-12 por pocillo). Después de un periodo de incubación de 6 días, las muestras se comprobaron respecto a mortalidad de las larvas, y regulación del crecimiento.

10 Los siguientes compuestos dieron al menos 80% de control de *Plutella xilostella*: A1, A3, A4, A5, A6, A7, A8, A9, A11, A12, A13, A15, A16, A17, A18, A20, A23, A24, A25, A26, A29, A30, A31, A32, A33, A34, A35, A36, A37, A41, A42, A43, A44, A45, A46, A47, A48, A50, A51, A52, A53, A54, A55, A56, A58, A61, A62, A63, A64, A65, A66, A67, A68, A69, A71, A72, A73, A74, A75, A76, A77, A78, A81, A82, A83, A84, A85, A87, A88, A89, A90, A91, A94, A95, A96, A97, A98, A99, A101, A102, A103, A104, A105, A106, A107, A108, A109, A110, A111, A112, A114, A115, A116, A117, A118, A121, A122, A123, A124, A125, A126, A127, A128, A129, A131, A132, A134, A135, A136, A137, A138, A139, A141, A142, A143, A144, A145, A146, A147, A148, A149, A151, A152, A154, A155, A156, A157, A158, A159, A160, A161, A162, A163, A164, A165, A166, A167, A168, A169, A171, A172, A175, A176, A177, A178, A179, A180, A182, A183, A186, A187, A188, A189, A190, A191, A192, A193, A194, A195, A196, A197, A198, A199, A200, A202, A203, A205, A206, A207, A209, A210, A211, A212, A213, A214, A215, A216, A217, A218, A219, A220, B1, B2, B3, B11, B12, C1, C2, C3, C4, C5, C6, C8, C9, C11, C12, C13, C16, C17, C18, C19, C20, C21, C24, C25, C26, C27, C29, C30, C31, C32, C33, C34, C35, C36, C37, C38, C39, C41, C42, C43, D1, D2, D3, D4, D5, D8, D9, D11, D12, D13, D15, D16, D17, D18, D19, D21, D22, D23, D24, D25, D27, D28, D29, D30, D31, D34, D36, D38, D47, D48, D49, D52, D53, D55, D56, E4, E16, E26, E36, E45, E54.

20 *Diabrotica balteata* (gusano de las raíces del maíz):

Una placa de microtitulación (MTP) de 24 pocillos con dieta artificial se trató con disoluciones de ensayo a una tasa de aplicación de 200 ppm (concentración en pocillo 18 ppm) por pipeteado. Después de secarlas, las MTP se infestaron con larvas (L2) (6-10 por pocillo). Después de un periodo de incubación de 5 días, las muestras se comprobaron respecto a mortalidad de las larvas y regulación del crecimiento.

25 Los compuestos siguientes dieron al menos 80% de control de *Diabrotica balteata*: A1, A3, A4, A5, A6, A8, A9, A11, A12, A13, A15, A16, A17, A18, A20, A23, A24, A25, A26, A28, A29, A30, A31, A32, A33, A34, A35, A36, A37, A41, A42, A43, A44, A46, A47, A48, A51, A52, A53, A54, A55, A56, A58, A61, A62, A63, A64, A65, A66, A67, A68, A69, A71, A72, A73, A74, A75, A76, A77, A78, A80, A81, A82, A83, A84, A85, A86, A87, A89, A90, A91, A92, A94, A95, A96, A97, A98, A99, A100, A101, A102, A103, A104, A105, A106, A107, A108, A109, A110, A111, A112, A114, A115, A116, A117, A118, A120, A121, A122, A123, A124, A125, A126, A127, A128, A129, A131, A132, A134, A135, A136, A137, A138, A139, A141, A142, A143, A144, A145, A146, A147, A148, A149, A151, A152, A154, A155, A156, A157, A158, A159, A162, A162, A163, A164, A165, A166, A167, A168, A169, A171, A172, A175, A176, A177, A178, A179, A180, A181, A182, A183, A186, A187, A188, A189, A190, A191, A192, A193, A194, A196, A198, A199, A200, A202, A206, A207, A210, A211, A212, A213, A214, A215, A216, A217, A218, A219, B1, B4, B6, B9, B11, B12, C1, C2, C4, C5, C6, C8, C9, C11, C12, C13, C16, C17, C19, C21, C23, C24, C26, C27, C28, C29, C30, C31, C32, C33, C34, C35, C36, C37, C38, C39, C40, C41, C42, C43, D1, D2, D3, D4, D5, D8, D9, D11, D12, D15, D16, D17, D18, D19, D22, D23, D24, D25, D27, D28, D29, D31, D34, D36, D38, D42, D45, D47, D49, D52, D53, D55, E4, E16, E26, E36, E45, E54.

35 *Myzus persicae* (áfido del melocotón verde):

40 Se colocaron discos foliares de girasol en agar en una placa de microtitulación de 24 pocillos y se pulverizaron con disoluciones de ensayo a una tasa de aplicación de 200 ppm. Después de secar, los discos foliares se infestaron con una población de áfidos de varias edades. Tras un periodo de incubación de 6 DAT, las muestras se comprobaron para determinar la mortalidad.

45 Los siguientes compuestos dieron al menos 80% de control de *Myzus persicae*: A1, A41, A42, A43, A44, A45, A46, A48, A51, A52, A53, A54, A55, A58, A62, A63, A64, A66, A68, A71, A72, A74, A75, A76, A81, A103, A104, A105, A114, A122, A142, A143, A154, A176, A189, A190, A192, A194, A195, A210, A211, A212, A213, A215, A216, A218, C41.

50 *Thrips tabaci* (trips de la cebolla):

50 Se colocaron discos de hojas de girasol sobre agar en una placa de microtitulación de 24 pocillos y se pulverizaron con disoluciones de ensayo a una tasa de aplicación de 200 ppm. Después de secar, los discos de hojas se infestaron con una población de trips de varias edades. Después de un periodo de incubación de 7 días, las muestras se comprueban para determinar la mortalidad.

55 Los siguientes compuestos dieron al menos 80% de control de *Thrips tabaci*: A3, A4, A15, A24, A25, A26, A32, A33, A34, A35, A41, A42, A43, A44, A45, A46, A47, A48, A51, A52, A53, A54, A55, A57, A61, A62, A63, A64, A65, A66, A67, A68, A71, A72, A73, A74, A75, A76, A77, A82, A83, A85, A87, A91, A94, A95, A97, A98, A99, A102, A103, A104, A105, A107, A108, A109, A111, A114, A115, A116, A117, A118, A122, A123, A124, A125, A127, A134, A135, A137, A138, A142, A143, A144, A145, A146, A147, A148, A149, A151, A154, A155, A156, A157, A158, A160, A162,

A162, A167, A168, A176, A182, A183, A187, A188, A189, A190, A191, A192, A194, A195, A196, A197, A198, A199, A210, A211, A212, A213, A215, A216, A218, A219, C17, C24, C25, C26, C27, C29, C30, C35, C36, C38, C39, C41, D4, D5, D9, D22, D24, D25, D29, D34, D36, D39, D40, D44, D52, D53, E16, E54.

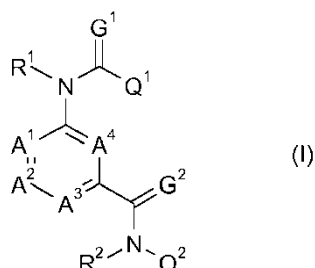
Tetranychus urticae (arañuela roja):

- 5 Discos de hojas de haba sobre agar en placas de microtitulación de 24 pocillos se pulverizaron con disoluciones de ensayo a una tasa de aplicación de 200 ppm. Después de secar, los discos de hojas se infestaron con poblaciones de ácaros de varias edades. 8 días después, los discos se comprueban para determinar la mortalidad de los huevos, la mortalidad larvaria, y la mortalidad de los adultos.

- 10 Los siguientes compuestos dieron al menos 80% de control de *Tetranychus urticae*: A1, A4, A5, A6, A11, A13, A16, A17, A18, A23, A24, A26, A34, A42, A43, A44, A52, A54, A55, A62, A63, A64, A65, A66, A68, A71, A72, A73, A74, A75, A77, A82, A83, A84, A85, A87, A88, A89, A91, A94, A95, A96, A97, A98, A99, A102, A103, A104, A105, A107, A108, A110, A114, A115, A116, A117, A122, A123, A124, A125, A127, A135, A137, A138, A142, A143, A144, A147, A155, A157, A158, A164, A165, A166, A167, A168, A171, A175, A176, A177, A179, A182, A183, A186, A187, A188, A189, A190, A191, A192, A194, A195, A197, A198, A199, A200, A205, A206, A207, A209, A210, A211, A212, A213, A214, A215, A216, A218, A219, A220, C5, C9, C25, C27, C30, C34, C36, C40, C42, C43, D1, D2, D3, D4, D5, D6, D8, D9, D17, D18, D24, D25, D29, D36, D42, D53, D55, E26, E36, E54.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula (I):



en la que

5 A^1 , A^2 , A^3 y A^4 son independientemente entre sí $C-R^3$, $C-R^5$ o nitrógeno, con la condición de que al menos uno de A^1 , A^2 , A^3 y A^4 sea $C-R^3$ y no más de dos de A^1 , A^2 , A^3 y A^4 sean nitrógeno;

10 R^1 y R^2 son, independientemente el uno del otro, hidrógeno, alquilo de C_1-C_4 , alquenoilo de C_2-C_4 , alquinilo de C_2-C_4 , alquilo de C_1-C_4 -carbonilo, hidroxilo, alquilo de C_1-C_4 -carboniloxi, arilcarboniloxi o arilcarboniloxi, en el que el anillo arilo está sustituido con uno a cinco sustituyentes independientemente seleccionados de halógeno, alquilo de C_1-C_4 , haloalquilo de C_1-C_4 , alcoxi de C_1-C_4 o haloalcoxi de C_1-C_4 ; G^1 y G^2 son, independientemente el uno del otro, oxígeno o azufre;

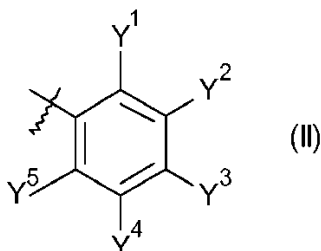
cada R^3 es ciano;

cada R^5 es independientemente hidrógeno, halógeno, alquilo de C_1-C_4 , haloalquilo de C_1-C_4 o alcoxi de C_1-C_4 ;

15 Q^1 es arilo o arilo sustituido con uno a cinco sustituyentes R^6 , que pueden ser iguales o diferentes, o Q^1 es heterociclilo o heterociclilo sustituido con uno a cinco sustituyentes R^6 , que pueden ser iguales o diferentes; en el que

20 cada R^6 es independientemente ciano, nitro, hidroxilo, halógeno, alquilo de C_1-C_6 , haloalquilo de C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_4 -alquilo de C_1-C_4 , alquenoilo de C_2-C_6 , haloalquenoilo de C_2-C_6 , alquinilo de C_2-C_6 , haloalquinilo de C_2-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_6 , halocicloalquilo de C_3-C_6 , alcoxi de C_1-C_6 , haloalcoxi de C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_4 -alcoxi de C_1-C_4 , alquilo de C_1-C_6 -tio, haloalquilo de C_1-C_6 -tio, alquilo de C_1-C_6 -sulfinilo, haloalquilo de C_1-C_6 -sulfinilo, alquilo de C_1-C_6 -sulfonilo, haloalquilo de C_1-C_6 -sulfonilo, *N*-alquilo de C_1-C_6 -amino, *N,N*-di-(alquilo de C_1-C_6)amino, *N,N*-di-(alquilo de C_1-C_6)aminocarbonilo, *N,N*-di-(alquilo de C_1-C_6)aminosulfonilo, alquilo de C_1-C_6 -carbonilo, alquilo de C_1-C_6 -carboniloxi, alcoxi C_1-C_6 -carbonilo, alquilo de C_1-C_6 -carbonilamino, arilo o arilo que está sustituido con uno a cinco sustituyentes independientemente seleccionados de ciano, nitro, hidroxilo, halógeno, alquilo de C_1-C_6 , haloalquilo de C_1-C_6 , alcoxi de C_1-C_6 o haloalcoxi de C_1-C_6 , o heteroarilo o heteroarilo que está sustituido con uno a cinco sustituyentes independientemente seleccionados de ciano, nitro, hidroxilo, halógeno, alquilo de C_1-C_6 , haloalquilo de C_1-C_6 , alcoxi de C_1-C_6 o haloalcoxi de C_1-C_6 ; y

Q^2 es un resto de fórmula (II)



30 en la que

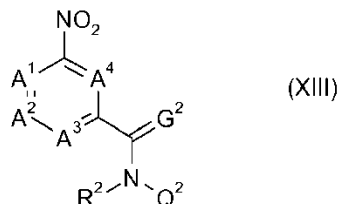
Y^1 y Y^5 son, independientemente el uno del otro, ciano, halógeno, alquilo de C_1-C_4 , haloalquilo de C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 -alquilo de C_1-C_4 , alquilo de C_1-C_3 -tio, haloalquilo de C_1-C_3 -tio, alquilo de C_1-C_3 -sulfinilo, haloalquilo de C_1-C_3 -sulfinilo, alquilo de C_1-C_3 -sulfonilo o haloalquilo de C_1-C_3 -sulfonilo;

35 Y^3 es perfluoroalquilo de C_2-C_6 , perfluoroalquilo de C_1-C_6 -tio, perfluoroalquilo de C_1-C_6 -sulfinilo o perfluoroalquilo de C_1-C_6 -sulfonilo;

Y^2 y Y^4 son, independientemente el uno del otro, hidrógeno, halógeno o alquilo de C_1-C_4 ;

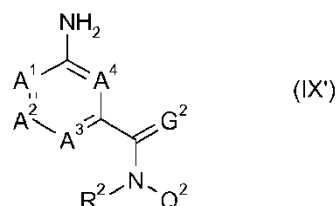
o una sal o *N*-óxido del mismo.

2. Un compuesto según la reivindicación 1, en el que A^1 es $C-R^3$ o $C-R^5$.
3. Un compuesto según la reivindicación 1 o reivindicación 2, en el que A^2 es $C-R^3$ o $C-R^5$.
4. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en el que A^3 es $C-R^3$ o $C-R^5$.
5. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, en el que A^4 es $C-R^3$ o $C-R^5$.
6. Un compuesto según una de las reivindicaciones 1 a 5, en el que uno, dos o tres de A^1 , A^2 , A^3 y A^4 son $C-R^3$.
7. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, en el que R^1 es hidrógeno, metilo, etilo, alilo, propargilo, acetilo hidroxilo, acetiloxi o benzoiloxi.
8. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7, en el que R^2 es hidrógeno, metilo, etilo, alilo, propargilo, acetilo hidroxilo, acetiloxi o benzoiloxi.
9. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, en el que G^1 es oxígeno.
10. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9, en el que G^2 es oxígeno.
11. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10, en el que cada R^3 es independientemente ciano, tiocianato o aminotiocarbonilo.
12. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11, en el que cada R^5 es independientemente hidrógeno, fluoro, cloro, bromo, metilo, trifluorometilo o metoxi.
13. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 12, en el que Q^1 es arilo o arilo sustituido con uno a cinco sustituyentes R^6 , que pueden ser iguales o diferentes, o Q^1 es heteroarilo o heteroarilo sustituido con uno a cinco sustituyentes R^6 , que pueden ser iguales o diferentes.
14. Un compuesto de fórmula (XIII)



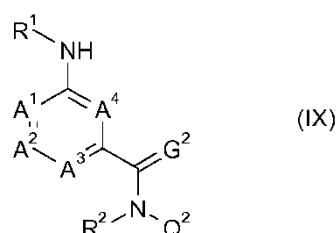
en la que A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , R^2 , G^2 y Q^2 son como se definen en la reivindicación 1; o una sal o *N*-óxido del mismo;

o un compuesto de fórmula (IX')



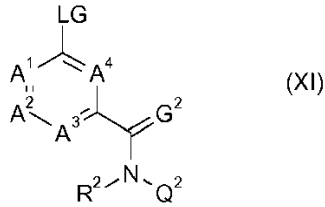
25. en la que A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , R^2 , G^2 y Q^2 son como se definen en la reivindicación 1; o una sal o *N*-óxido del mismo;

o un compuesto de fórmula (IX)



en la que A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , R^1 , R^2 , G^2 y Q^2 son como se definen en la reivindicación 1; o una sal o *N*-óxido del mismo; o

un compuesto de fórmula (XI)



5 en la que A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , R^2 , G^2 y Q^2 son como se definen en la reivindicación 1, y LG es un grupo saliente seleccionados de fluoro, cloro o sulfonato; o una sal o *N*-óxido del mismo.

10 15. Un método para combatir y controlar insectos, ácaros, nematodos o moluscos, que comprende aplicar a una plaga, a un sitio de acción de una plaga o a una planta susceptible de ser atacada por una plaga, una cantidad insecticida, acaricida, nematocida o molusquicidamente eficaz de un compuesto de fórmula (I) como se define en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 13, con la excepción de un método de tratamiento del cuerpo humano o animal mediante cirugía o terapia y métodos de diagnóstico realizados en el cuerpo humano o animal.

16. Una composición insecticida, acaricida o nematocida que comprende una cantidad insecticida, acaricida, o nematocidamente eficaz de un compuesto de fórmula (I) como se define en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 13.

15