

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 587 232**

51 Int. Cl.:

C07D 403/12 (2006.01) **C07D 251/48** (2006.01)

A01N 43/54 (2006.01)

A01N 43/68 (2006.01)

A01N 43/84 (2006.01)

C07D 405/12 (2006.01)

C07D 239/49 (2006.01)

C07D 409/12 (2006.01)

C07D 239/48 (2006.01)

C07D 401/12 (2006.01)

C07D 413/12 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **20.07.2011 PCT/US2011/044675**

87 Fecha y número de publicación internacional: **26.01.2012 WO12012528**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **20.07.2011 E 11743699 (8)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **22.06.2016 EP 2595965**

54 Título: **Triazinas y pirimidinas insecticidas**

30 Prioridad:

20.07.2010 US 365924 P

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

21.10.2016

73 Titular/es:

**VESTARON CORPORATION (100.0%)
4717 Campus Drive Suite 1200
Kalamazoo, MI 49008, US**

72 Inventor/es:

**KENNEDY, ROBERT, M. y
STEINBAUGH, BRUCE, A.**

74 Agente/Representante:

VALLEJO LÓPEZ, Juan Pedro

ES 2 587 232 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

Triazinas y pirimidinas insecticidas

5 **Antecedentes de la invención**

Existe una gran necesidad de nuevos insecticidas y acaricidas. Los insectos y los ácaros están desarrollando resistencia a los insecticidas y acaricidas conocidos. Al menos 400 especies de artrópodos son resistentes a uno o más insecticidas. El desarrollo de resistencia a algunos de los insecticidas más antiguos, tales como DDT, los carbamatos, y los organofosfatos, es bien conocido. Incluso se ha desarrollado resistencia a algunos de los insecticidas y acaricidas piretroides más nuevos. Por lo tanto existe una necesidad de nuevos insecticidas y acaricidas, y, particularmente, de compuestos que tienen modos de acción nuevos o atípicos.

Los documentos US 2009/0093480 A1 and US 2009/0093481 A1 describen insecticidas que son compuestos con un núcleo de pirimidina sustituidos con una arilamina y una arilenhidrazina. En el caso de este último documento, el núcleo es un resto de triazina. El documento WO 00/47579 A1 describe benzotizolilalquilamino-1,3,5-triazinas sustituidas como herbicidas.

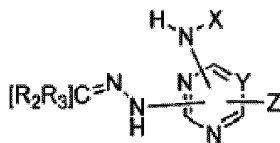
La presente invención proporciona nuevos compuestos con actividad de amplio espectro contra insectos.

20 **Sumario de la invención**

La presente invención describe nuevas triazinas y sus pirimidinas relacionados y su uso en el control de insectos. Esta invención también incluye nuevos procedimientos de síntesis, productos intermedios para preparar los compuestos, composiciones pesticidas que contienen los compuestos y métodos de control de insectos usando los compuestos.

La presente invención describe compuestos útiles para el control de insectos. Más específicamente, la invención se refiere a compuestos de la Fórmula I

30



Fórmula I

en la que un compuesto de Fórmula I, incluyendo sus sales fisiológicamente aceptables, composiciones de materia y formulaciones adecuadas para el control de insectos, en la que:

35

Y es N o CR₁;

R₁, es -H, halo o alquilo -C₁-C₄;

40

Z es -arilo, -alquilarilo C₁-C₈, -cicloalquilo C₃-C₈, alquilo C₁-C₆cicloalquiloC₆- heterocíclico, -alquilo C₁-C₈ heterocíclico;

X, es -H, -alquilo C₁-C₈, -arilo, -alquilarilo C₁-C₈, -cicloalquilo C₃-C₈, -alquilo C₁-C₈ cicloalquilo C₃-C₈, heterocíclico, -alquilo C₁-C₈ heterocíclico, -NRⁱR^j o -alquilo C₁-C₈ NRⁱR^j;

R₂ y R₃ son independientemente -H, -alquilo C₁-C₈, -arilo, -alquilarilo C₁-C₈, -cicloalquilo C₃-C₈, -alquilo C₁-C₈ cicloalquilo C₃-C₈, heterocíclico, -alquilo C₁-C₈ heterocíclico y -alquilo C₁-C₈ NRⁱR^j, pero R₂ y R₃ no son ambos H;

45

Rⁱ y R^j son independientemente -H, o -alquilo C₁-C₈;

en los que heterocíclico es un resto de anillo cicloalifático -C₁-C₈ saturado o aromático, cíclico o bicíclico de 5-10 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de N, O o S; en los que arilo, cicloalquilo -C₃-C₈ y heterocíclico están opcionalmente e independientemente sustituidos con de uno a cinco sustituyentes seleccionados de -halo, -CN, -OH, -OCH₂CH=CHCl, -alquilo C₁-C₆, -O-alquilo C₁-C₆ o -S-alquilo C₁-C₆; y cada vez el alquilo está sustituido opcionalmente con 1-5 halo, -CN, o -OH.

50

Los compuestos de Fórmula I en la que los sustituyentes del anillo de triazina tienen las posiciones mostradas en la Fórmula XVI.

documento WO 2009/048751 A1, publicado el 16 de abril de 2009, solicitante Dow Agrosiences LLC US 2009-0093480 A1.

5 Como se describe en el presente documento, los compuestos de la invención pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes, tal como se ha ilustrado en general anteriormente, o como se ejemplifica mediante clases, subclases y especies de la invención.

En el presente documento, todas las temperaturas se dan en grados Celsius y todos los porcentajes son porcentajes en peso a menos que se indique lo contrario.

10 Como se usa en el presente documento, los términos "heterocíclico" y "heterociclo" se refieren a un heterocicloalifático opcionalmente sustituido o un heteroarilo opcionalmente sustituido. Un heterociclo puede estar condensado a un anillo de fenilo para proporcionar un heteroarilo bicíclico (por ejemplo, indolina o indolinilo), o un heterociclo puede estar condensado a un anillo heteroarilo para proporcionar un heteroarilo bicíclico (por ejemplo, 2,3-dihidro-1H-pirrolo [2,3-b] piridina o 2,3-dihidro-1H-pirrolo [2,3-b] piridina-ilo).

Tal como se utiliza el presente documento, el término "alifático" abarca los términos alquilo, alquenilo, alquinilo, estando cada uno de los cuales opcionalmente sustituido como se establece a continuación.

20 Como se usa en el presente documento, un grupo "alquilo" se refiere a un grupo hidrocarburo alifático saturado que contiene de 1 a 12 (por ejemplo, 1-8, 1-6 o 1-4) átomos de carbono. Un grupo alquilo puede ser lineal o ramificado. Los ejemplos de grupos alquilo incluyen, pero no se limitan a, metilo, etilo, propilo, isopropilo, butilo, isobutilo, sec-butilo, terc-butilo, n-pentilo, n-heptilo o 2-etilhexilo. Un grupo alquilo puede estar sustituido (es decir, opcionalmente sustituido) con uno o más sustituyentes tales como halo; cicloalifático [por ejemplo, cicloalquilo o cicloalquenilo]; heterocicloalifático [por ejemplo, heterocicloalquilo o heterocicloalquenilo]; arilo; heteroarilo; alcoxi; aroilo; heteroaróilo; acilo [por ejemplo, (alifático)carbonilo, (cicloalifático)carbonilo o (heterocicloalifático)carbonilo]; nitro; ciano; amido [por ejemplo, (cicloalquilalquilo)carbonilamino, arilcarbonilamino, aralquilcarbonilamino, (heterocicloalquil)carbonilamino, (heterocicloalquilalquilo)carbonilamino, heteroarilcarbonilamino, heteroaralquilcarbonilamino alquilaminocarbonilo, cicloalquilaminocarbonilo, heterocicloalquilaminocarbonilo, arilaminocarbonilo o heteroarilaminocarbonilo]; amino [por ejemplo, amino alifático, amino cicloalifático o amino heterocicloalifático]; sulfonilo [por ejemplo, alifático-S(O)₂-]; sulfinilo; sulfanilo; sulfoxi; urea; tiourea; sulfamoilo; sulfamida; oxo; carboxi; carbamoilo; alcoxi cicloalifático; alcoxi heterocicloalifático; ariloxi; heteroariloxi; aralquiloxi; heteroarilalcoxi; alcoxycarbonilo; alquilcarboniloxi; o hidroxil. Sin limitaciones, algunos ejemplos de alquilos sustituidos incluyen carboxialquilo (tal como, HOOC-alquilo, alcoxycarbonilalquilo, y alquilcarboniloxialquilo); cianoalquilo; hidroxialquilo; alcoxialquilo; acilalquilo; aralquilo; (aril alcoxi)alquilo; (sulfonilamino)alquilo (tal como, alquil-S(O)₂-aminoalquilo); aminoalquilo; amidoalquilo; alquilo (cicloalifático); o haloalquilo.

40 A menos que se limite específicamente lo contrario, el término "alquilo", así como términos derivados tales como "alcoxi" y "tioalquilo", como se usa en el presente documento, incluyen dentro de su alcance, restos de cadena lineal, de cadena ramificada y cíclicos.

45 Como se usa en el presente documento, un grupo "alquenilo" se refiere a un grupo de carbono alifático que contiene 2-8 (por ejemplo, 2-6 o 2-4) átomos de carbono y al menos un doble enlace. Como un grupo alquilo, un grupo alquenilo puede ser lineal o ramificado. Los ejemplos de un grupo alquenilo incluyen, pero no se limitan a, alilo, isoprenilo, 2-butenilo y 2-hexenilo. Un grupo alquenilo puede estar sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes tales como halo; cicloalifático [por ejemplo, cicloalquilo o cicloalquenilo]; heterocicloalifático [por ejemplo, heterocicloalquilo o heterocicloalquenilo]; arilo; heteroarilo; alcoxi; aroilo; heteroaróilo; acilo [por ejemplo, (alifático)carbonilo, (cicloalifático)carbonilo o (heterocicloalifático)carbonilo]; nitro; ciano; amido [por ejemplo, (cicloalquilalquilo)carbonilamino, arilcarbonilamino, aralquilcarbonilamino, (heterocicloalquil)carbonilamino, (heterocicloalquilalquilo)carbonilamino, heteroarilcarbonilamino, heteroaralquilcarbonilamino alquilaminocarbonilo, cicloalquilaminocarbonilo, heterocicloalquilaminocarbonilo, arilaminocarbonilo o heteroarilaminocarbonilo]; amino [por ejemplo, amino alifático, amino cicloalifático, amino heterocicloalifático o sulfonilamino alifático]; sulfonilo [por ejemplo, alquil-S(O)₂-, cicloalifático-S(O)₂-, o aril-S(O)₂-]; sulfinilo; sulfanilo; sulfoxi; urea; tiourea; sulfamoilo; sulfamida; oxo; carboxi; carbamoilo; alcoxi cicloalifático; alcoxi heterocicloalifático; ariloxi; heteroariloxi; aralquiloxi; heteroaralcoxi; alcoxycarbonilo; alquilcarboniloxi; o hidroxil. Sin limitaciones, algunos ejemplos de alquenos sustituidos incluyen cianoalquenilo, alcoxialquenilo, acilalquenilo, hidroxialquenilo, aralquenilo, (alcoxiarilo)alquenilo, (sulfonilamino)alquenilo (tal como (alquil-S(O)₂-aminoalquenilo), aminoalquenilo, amidoalquenilo, (cicloalifático) alquenilo o haloalquenilo.

60 Como se usa en el presente documento, un grupo "alquinilo" se refiere a un grupo de carbono alifático que contiene 2-8 (por ejemplo, 2-6 o 2-4) átomos de carbono y tiene al menos un triple enlace. Un grupo alquinilo puede ser lineal o ramificado. Los ejemplos de un grupo alquinilo incluyen, pero no se limitan a, propargilo y butinilo. Un grupo alquinilo puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes tales como aroilo; heteroaróilo; alcoxi; cicloalquiloxi; heterocicloalquiloxi; ariloxi; heteroariloxi; aralquiloxi; nitro; carboxi; ciano; halo; hidroxil; sulfo; mercapto; sulfanilo [por ejemplo, alifático-S- o cicloalifático-S-]; sulfinilo [por ejemplo, alifático-S(O) - o cicloalifático-S (O) -]; sulfonilo [por ejemplo, alifático-S(O)₂ -, amino alifático-S(O)₂ -, o cicloalifático-S(O)₂-]; amido [por ejemplo,

aminocarbonilo, alquilaminocarbonilo, alquilcarbonilamino, cicloalquilaminocarbonilo, heterocicloalquilaminocarbonilo, cicloalquilcarbonilamino, arilaminocarbonilo, arilcarbonilamino, aralquilcarbonilamino, (heterocicloalquil)carbonilamino, (cicloalquilalquilo)carbonilamino, heteroaralquilcarbonilamino, heteroarilcarbonilamino o heteroarilaminocarbonilo]; urea; tiourea; sulfamoilo; sulfamida; alcoxycarbonilo; alquilcarboniloxi; cicloalifático; heterocicloalifático; arilo; heteroarilo; acilo [por ejemplo, (cicloalifático)carbonilo o (heterocicloalifático)carbonilo]; amino [por ejemplo, amino alifático]; sulfoxi; oxo; carbamoilo; (cicloalifático)oxi; (heterocicloalifático)oxi; o (heteroaril) alcoxi.

Como se usa en el presente documento, un "amido" abarca tanto "aminocarbonilo" como "carbonilamino". Estos términos cuando se usan solos o en conexión con otro grupo, se refiere a un grupo amido tal como $-N(R^i)-C(O)-R^j$ o $-C(O)-N(R^i)_2$, cuando se utilizan en los extremos, y $-C(O)-N(R^i)-$ o $-N(R^i)-C(O)-$ cuando se usan internamente, en los que R^i y R^j se definen a continuación. Los ejemplos de grupos amido incluyen alquilamido (tales como, alquilcarbonilamino o alquilaminocarbonilo), (heterocicloalifático)amido, (heteroaralquilo)amido, (heteroaril)amido, (heterocicloalquil)alquilamido, arilamido, aralquilamido, (cicloalquil)alquilamido o cicloalquillamido.

Como se usa en el presente documento, un grupo "amino" se refiere a $-NR^iR^j$, en el que cada uno de R^i y R^j es independientemente hidrógeno, alquilo, (cicloalifático)alifático, arilo, aralifático, (heterocicloalifático)alifático, heteroarilo, carboxi, sulfanilo, sulfinilo, sulfonilo, (alifático)carbonilo, (cicloalifático)carbonilo, ((cicloalifático)alifático)carbonilo, arilcarbonilo, (aralifático)carbonilo, (heterocicloalifático)carbonilo, ((heterocicloalifático)alifático)carbonilo, (heteroaril)carbonilo, o (heteroaralifático)carbonilo, estando cada uno de los cuales definido en el presente documento y estando opcionalmente sustituido. Los ejemplos de grupos amino incluyen alquilamino, dialquilamino o arilamino. Cuando el término "amino" no es el grupo terminal (por ejemplo, alquilcarbonilamino), está representado por $-NR^i-$. R^i tiene el mismo significado que se ha definido anteriormente.

Tal como se usa en el presente documento, un grupo "arilo" usado solo o como parte de un resto mayor como en "aralquilo", "aralcoxi", o "ariloxialquilo" se refiere a sistemas de anillos monocíclicos (por ejemplo, fenilo); bicíclicos (por ejemplo, indenilo, naftalenilo, tetrahidronaftilo, tetrahidroindenilo); y tricíclicos (por ejemplo, fluorenilo tetrahidrofluorenilo, o tetrahidroantraceno, antraceno) en los que el sistema de anillo monocíclico es aromático o al menos uno de los anillos en un sistema de anillo bicíclico o tricíclico es aromático. Los grupos bicíclicos y tricíclicos incluyen anillos carbocíclicos de 2-3 miembros condensados con benceno. Por ejemplo, un grupo benzocondensado incluye fenilo condensado con dos o más restos carbocíclicos C_{4-8} . Un grupo arilo está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes que incluyen alifático [por ejemplo, alquilo, alqueno, o alquino]; cicloalifático; (cicloalifático)alifático; heterocicloalifático; (heterocicloalifático)alifático; arilo; heteroarilo; alcoxi; (cicloalifático)oxi; (heterocicloalifático)oxi; ariloxi; heteroariloxi; (aralifático)oxi; (heteroaralifático)oxi; aroilo; heteroaroiilo; amino; oxo (sobre un anillo carbocíclico no aromático de un arilo bicíclico o tricíclico benzocondensado); nitro; carboxi; amido; acilo [por ejemplo, carbonilo alifático, (cicloalifático)carbonilo, ((cicloalifático)alifático)carbonilo, (aralifático)carbonilo, (heterocicloalifático)carbonilo, ((heterocicloalifático)alifático)carbonilo o (heteroaralifático)carbonilo]; sulfonilo [por ejemplo, alifático- $S(O)_2-$ o amino- $S(O)_2-$]; sulfinilo [por ejemplo, alifático- $S(O)-$ o cicloalifático- $S(O)-$]; sulfanilo [por ejemplo, alifático- $S-$]; ciano; halo; hidroxilo; mercapto; sulfoxi; urea; tiourea; sulfamoilo; sulfamida; o carbamoilo. Como alternativa, un arilo puede estar no sustituido.

Los ejemplos no limitantes de arilos sustituidos incluyen [por ejemplo, mono-, di (tal como p,m-dihaloarilo), y (trihalo)arilo]; (carboxi)arilo [por ejemplo, (alcoxycarbonil)arilo, ((aralquil)carboniloxi)arilo y (alcoxycarbonil)arilo]; (amido)arilo [por ejemplo, (aminocarbonil)arilo, ((alquiloamino)alquil)aminocarbonil)arilo, (alquilocarbonil)aminoarilo, (arilaminocarbonil)arilo, y (((heteroaril)amino)carbonil)arilo]; aminoarilo [por ejemplo, ((alquilsulfonil)amino)arilo o ((dialquil)amino)arilo]; (cianoalquil)arilo; (alcoxi)arilo; (sulfamoil)arilo [por ejemplo, (aminosulfonil)arilo]; (alquilsulfonil)arilo; (ciano)arilo; (hidroxialquil)arilo; ((alcoxi)alquil)arilo; (hidroxil)arilo, ((carboxi)alquil)arilo; (((dialquil)amino)alquil)arilo; (nitroalquil)arilo; (((alquilosulfonil)amino)alquil)arilo; ((heterocicloalifático)carbonil)arilo; ((alquilsulfonil)alquil)arilo; (cianoalquil)arilo; (hidroxialquil)arilo; (alquilcarbonil)arilo; alquilarilo; (trihaloalquil)arilo; p-amino-m-alcoxycarbonilarilo; p-amino-m-cianoarilo; p-halo-m-aminoarilo; o (m-(heterocicloalifático)-o-(alquil))arilo.

Como se usa en el presente documento, un "aralifático", tal como un grupo "aralquilo", se refiere a un grupo alifático (por ejemplo, un grupo alquilo C_{1-4}) que está sustituido con un grupo arilo. "Alifático", "alquilo" y "arilo" se definen en el presente documento. Un ejemplo de un aralifático, tal como un grupo aralquilo, es bencilo.

Como se usa en el presente documento, un grupo "aralquilo" se refiere a un grupo alquilo (por ejemplo, un grupo alquilo C_{1-4}) que está sustituido con un grupo arilo. Tanto "alquilo" como "arilo" se han definido anteriormente. Un ejemplo de un grupo aralquilo es bencilo. Un aralquilo está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes, tales como alifático [por ejemplo, alquilo, alqueno, o alquino, incluyendo carboxialquilo, hidroxialquilo, o haloalquilo tal como trifluorometilo]; cicloalifático [por ejemplo, cicloalquilo o cicloalqueno]; (cicloalquil)alquilo; heterocicloalquilo; (heterocicloalquil)alquilo; arilo; heteroarilo; alcoxi; cicloalquiloxi; heterocicloalquiloxi; ariloxi; heteroariloxi; aralquiloxi; heteroaralquiloxi; aroilo; heteroaroiilo; nitro; carboxi; alcoxycarbonilo; alquilcarboniloxi; amido [por ejemplo, aminocarbonilo, alquilcarbonilamino, cicloalquilcarbonilamino, (cicloalquilalquil)carbonilamino, arilcarbonilamino, aralquilcarbonilamino, (heterocicloalquil)carbonilamino, (heterocicloalquilalquilo)carbonilamino, heteroarilcarbonilamino, o heteroaralquilcarbonilamino]; ciano; halo; hidroxilo; acilo; mercapto; alquilsulfanilo; sulfoxi; urea; tiourea; sulfamoilo; sulfamida; oxo; o carbamoilo.

Como se usa en el presente documento, un grupo "cicloalifático" abarca un grupo "cicloalquilo" y un grupo "cicloalquenilo", cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido como se establece a continuación.

- 5 Como se usa en el presente documento, un grupo "cicloalquilo" se refiere a un anillo carbocíclico monocíclico o saturado (condensado o con puentes) de 3-10 átomos de carbono (por ejemplo, 5-10) átomos de carbono. Los ejemplos de grupos cicloalquilo incluyen ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo, adamantilo, norbornilo, cubilo, octahidro-indenilo, decahidro-naftilo, biciclo [3.2.1]octilo, biciclo [2.2.2] octilo, biciclo [3.3.1] nonilo, biciclo [3.3.2.] decilo, biciclo [2.2.2] octilo, adamantilo, azacicloalquilo o ((aminocarbonil)cicloalquil)cicloalquilo.
- 10 Un grupo "cicloalquenilo", como se usa en el presente documento, se refiere a un anillo carbocíclico no aromático de 3-10 (por ejemplo, 4-8) átomos de carbono que tienen uno o más dobles enlaces. Los ejemplos de grupos cicloalquenilo incluyen ciclopentenilo, 1, 4-ciclohexa-di-enilo, cicloheptenilo, ciclooctenilo, hexahidro-indenilo, octahidro-naftilo, ciclohexenilo, ciclopentenilo, biciclo [2.2.2] octenilo, o biciclo [3.3.1] nonenilo.
- 15 Un grupo cicloalquilo o cicloalquenilo puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes tales como alifático [por ejemplo, alquilo, alquenilo, o alquinilo]; cicloalifático; (cicloalifático) alifático ; heterocicloalifático; (heterocicloalifático)alifático; arilo; heteroarilo; alcoxi; (cicloalifático)oxi; (heterocicloalifático)oxi; ariloxi; heteroariloxi; (aralifático)oxi; (heteroaralifático)oxi; aróilo; heteroaróilo; amino; amido [por ejemplo, (alifático)carbonilamino, (cicloalifático)carbonilamino, ((cicloalifático)alifático)carbonilamino, (aril)carbonilamino, (aralifático)carbonilamino, (heterocicloalifático)carbonilamino, ((heterocicloalifático)alifático)carbonilamino, (heteroaril)carbonilamino o (heteroaralifático)carbonilamino]; nitro; carboxi [por ejemplo, HOOC-, alcoxycarbonilo o alquilcarboniloxi]; acilo [por ejemplo, (cicloalifático)carbonilo, ((cicloalifático)alifático)carbonilo, (aralifático)carbonilo, (heterocicloalifático)carbonilo, ((heterocicloalifático)alifático)carbonilo o (heteroaralifático)carbonilo]; ciano; halo; hidroxilo; mercapto; sulfonilo [por ejemplo, alquil-S(O)₂ - y aril-S(O)₂-]; sulfínico [por ejemplo, alquil-S(O)-]; sulfanilo [por ejemplo, alquilo-S-]; sulfoxi; urea; tiourea; sulfamóilo; sulfamida; oxo; o carbamóilo.
- 20
- 25

Como se usa en el presente documento, el término "heterocicloalifático" abarca un grupo heterocicloalquilo y un grupo heterocicloalquenilo, estando cada uno de los cuales opcionalmente sustituido como se establece a continuación.

- 30 Como se usa en el presente documento, un grupo "heterocicloalquilo" se refiere a una estructura de anillo saturada de 3-10 miembros monocíclico o bicíclico (condensado o con puente) (por ejemplo, de 5 - 10 miembros monocíclico o bicíclico), en la que uno o más de los átomos del anillo es un heteroátomo (por ejemplo, N, O, S, o combinaciones de los mismos). Ejemplos de un grupo heterocicloalquilo incluyen piperidilo, piperazilo, tetrahidropirano, tetrahidrofurilo, 1,4-dioxolanilo, 1,4-ditianilo, 1,3-dioxolanilo, oxazolidinilo, isoxazolidinilo, morfolinilo, tiomorfolinilo, octahidrobenzofurilo, octahidrocromenilo, octahidrotiencromenilo, octahidroindolilo, octahidropiridinilo, decahidroquinolinilo, octahidrobenzo[b]tiofenilo, 2-oxa-biciclo[2.2.2]octilo, 1-aza-biciclo[2.2.2]octilo, 3-aza-biciclo[3.2.1]octilo y 2,6-dioxa-triciclo[3.3.1.0^{3,7}]nonilo. Un grupo heterocicloalquilo monocíclico puede estar condensado con un resto fenilo, tal como tetrahidroisoquinolina para producir un grupo heteroarilo.
- 35
- 40 Un grupo "heterocicloalquenilo", como se usa en el presente documento, se refiere a una estructura de anillo no aromático monocíclico o bicíclico (por ejemplo, monocíclico o bicíclico de 5 a 10 miembros) que tiene uno o más dobles enlaces y en el que uno o más de los átomos del anillo es un heteroátomo (por ejemplo, N, O o S).

- 45 Los heteroalifáticos monocíclicos y bicíclicos están numerados de acuerdo con la nomenclatura química estándar.

- Un grupo heterocicloalquilo o heterocicloalquenilo puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes tales como alifático [por ejemplo, alquilo, alquenilo, o alquinilo]; cicloalifático; (cicloalifático) alifático ; heterocicloalifático; (heterocicloalifático)alifático; arilo; heteroarilo; alcoxi; (cicloalifático)oxi; (heterocicloalifático)oxi; ariloxi; heteroariloxi; (aralifático)oxi; (heteroaralifático)oxi; aróilo; heteroaróilo; amino; amido [por ejemplo, (alifático)carbonilamino, (cicloalifático)carbonilamino, ((cicloalifático)alifático)carbonilamino, (aril)carbonilamino, (aralifático)carbonilamino, (heterocicloalifático)carbonilamino, ((heterocicloalifático)alifático)carbonilamino, (heteroaril)carbonilamino o (heteroaralifático)carbonilamino]; nitro; carboxi [por ejemplo, HOOC-, alcoxycarbonilo o alquilcarboniloxi]; acilo [por ejemplo, (cicloalifático)carbonilo, ((cicloalifático)alifático)carbonilo, (aralifático)carbonilo, (heterocicloalifático)carbonilo, ((heterocicloalifático)alifático)carbonilo o (heteroaralifático)carbonilo]; nitro; ciano; halo; hidroxilo; mercapto; sulfonilo [por ejemplo, alquilsulfonilo o arilsulfonilo]; -sulfínico [por ejemplo, alquilsulfínico]; sulfanilo [por ejemplo, alquilsulfanilo]; sulfoxi; urea; tiourea; sulfamóilo; sulfamida; oxo; o carbamóilo.
- 50
- 55

- Un grupo "heteroarilo", como se usa en el presente documento, se refiere a un sistema de anillo monocíclico, bicíclico o tricíclico que tiene de 4 a 15 átomos en el anillo en el que uno o más de los átomos del anillo es un heteroátomo (por ejemplo, N, O, S, o combinaciones de los mismos) y en el que el sistema de anillo monocíclico es aromático o al menos uno de los anillos en los sistemas de anillo bicíclico o tricíclico es aromático. Un grupo heteroarilo incluye un sistema de anillo benzocondensado que tiene de 2 a 3 anillos. Por ejemplo, un grupo benzocondensado incluye benzo condensado con uno o dos restos heterocicloalifáticos de 4 a 8 miembros (por ejemplo, indolizililo, indolilo, isoindolilo, 3H-indolilo, indolinilo, benzo[b]furilo, benzo[b]tiofenilo, quinolinilo o isoquinolinilo). Algunos ejemplos de heteroarilo son azetidínico, piridilo, 1H-indazolilo, furilo, pirrolilo, tienilo, tiazolilo,
- 60
- 65

oxazolilo, imidazolilo, tetrazolilo, benzofurilo, isoquinolinilo, benzotiazolilo, xanteno, tioxanteno, fenotiazina, dihidroindol, benzo [1,3]dioxol, benzo[b]furilo, benzo[b]tiofenilo, indazolilo, bencimidazolilo, benzotiazolilo, purilo, cinnolilo, quinolilo, quinazolilo, cinnolilo, ftalazilo, quinazolilo, quinoxalilo, isoquinolilo, 4H-quinolizilo, benzo-1,2,5-tiadiazolilo o 1,8-naftiridilo.

5 Sin limitación, los heteroarilos monocíclicos incluyen furilo, tiofenilo, 2H-pirrolilo, pirrolilo, oxazolilo, tiazolilo, imidazolilo, pirazolilo, isoxazolilo, isotiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 2H-piranilo, 4-H-pranilo, piridilo, piridazilo, pirimidilo, pirazolilo, pirazilo o 1,3,5-triazilo. Los heteroarilos monocíclicos están numerados de acuerdo con la nomenclatura química estándar.

10 Sin limitación, los heteroarilos bicíclicos incluyen indolizilo, indolilo, isoindolilo, 3H-indolilo, indolinilo, benzo [b] furilo, benzo [b]tiofenilo, quinolinilo, isoquinolinilo, indolizilo, isoindolilo, indolilo, benzo[b]furilo, bexo[b]tiofenilo, indazolilo, bencimidazilo, benzotiazolilo, purinilo, 4H-quinolizilo, quinolilo, isoquinolilo, cinnolilo, ftalazilo, quinazolilo, quinoxalilo, 1,8-naftiridilo, o pteridilo. Los heteroarilos bicíclicos están numerados de acuerdo con la nomenclatura química estándar.

15 Un heteroarilo está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes, tales como alifático [por ejemplo, alquilo, alqueno, o alquino]; cicloalifático; (cicloalifático)alifático; heterocicloalifático; (heterocicloalifático)alifático; arilo; heteroarilo; alcoxi; (cicloalifático)oxi; (heterocicloalifático)oxi; ariloxi; heteroariloxi; (aralifático)oxi; (heteroaralifático)oxi; aroilo; heteroaróilo; amino; oxo (sobre un anillo carbocíclico o heterocíclico no aromático de un heteroarilo bicíclico o tricíclico benzocondensado); carboxi; amido; acilo[por ejemplo, carbonilo alifático, (cicloalifático)carbonilo, ((cicloalifático)alifático)carbonilo, (aralifático)carbonilo, (heterocicloalifático)carbonilo, ((heterocicloalifático)alifático)carbonilo o (heteroaralifático)carbonilo]; sulfonilo[por ejemplo, alifático-S(O)₂- o amino-S(O)₂-]; sulfonilo[por ejemplo, alifático-S(O)-]; sulfanilo[por ejemplo, alifático-S-]; nitro; ciano; halo; hidroxilo; mercapto; sulfoxi; urea; tiourea; sulfamoilo; sulfamida; o carbamoilo. Como alternativa, un heteroarilo puede estar no sustituido.

20 Los ejemplos no limitantes de heteroarilos sustituidos incluyen (halo)heteroarilo[por ejemplo, mono- y di-(halo)heteroarilo]; (carboxi)heteroarilo[por ejemplo, (alcoxicarbonil)heteroarilo]; cianoheteroarilo; aminoheteroarilo[por ejemplo, ((alquilsulfonil)amino)heteroarilo y ((dialquil)amino)heteroarilo]; (amido)heteroarilo[por ejemplo, aminocarbonilheteroarilo, ((alquilcarbonil)amino)heteroarilo, (((alquil)amino)alquil)aminocarbonilheteroarilo, (((heteroaril)amino)carbonil)heteroarilo, ((heterocicloalifático)carbonil)heteroarilo, y ((alquilcarbonil)amino)heteroarilo]; (cianoalquilo)heteroarilo; (alcoxi)heteroarilo; (sulfamoil)heteroarilo[por ejemplo, (aminosulfonil)heteroarilo]; (sulfonil)heteroarilo[por ejemplo, (alquilsulfonil)heteroarilo]; (hidroxialquil)heteroarilo; (alcoxialquil)heteroarilo; (hidroxil)heteroarilo; ((carboxi)alquil)heteroarilo; ((dialquil)amino)alquil]heteroarilo; (heterocicloalifático)heteroarilo; (cicloalifático)heteroarilo; (nitroalquil)heteroarilo; ((alquilsulfonil)amino)alquil]heteroarilo; ((alquilsulfonil)alquil)heteroarilo; (cianoalquilo)heteroarilo; (acil)heteroarilo[por ejemplo, (alquilcarbonil)heteroarilo]; (alquil)heteroarilo y (haloalquil)heteroarilo[por ejemplo, trihaloalquilheteroarilo].

30 Un "heteroalifático" (tal como un grupo heteroaralquilo), como se usa en el presente documento, se refiere a un grupo alifático (por ejemplo, un grupo alquilo C₁₋₄) que está sustituido con un grupo heteroarilo. "Alifático", "alquilo" y "heteroarilo" se han definido anteriormente.

35 Un grupo "heteroaralquilo", como se usa en el presente documento, se refiere a un grupo alquilo (por ejemplo, un grupo alquilo C₁₋₄) que está sustituido con un grupo heteroarilo. Tanto "alquilo" como "heteroarilo" se han definido anteriormente. Un heteroaralquilo está opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes, tales como alquilo (por ejemplo, carboxialquilo, hidroxialquilo y haloalquilo, tal como trifluorometilo); alqueno; alquino; cicloalquilo; (cicloalquil)alquilo; heterocicloalquilo; (heterocicloalquil)alquilo; arilo; heteroarilo; alcoxi; cicloalquiloxi; heterocicloalquiloxi; ariloxi; heteroariloxi; aralquiloxi; heteroaralquiloxi; aroilo; heteroaróilo; nitro; carboxi; alcoxicarbonilo; alquilcarboniloxi; aminocarbonilo; alquilcarbonilamino; cicloalquilcarbonilamino; (cicloalquilalquil)carbonilamino; arilcarbonilamino; aralquilcarbonilamino; (heterocicloalquil)carbonilamino; (heterocicloalquilalquil)carbonilamino; heteroarilcarbonilamino; heteroaralquilcarbonilamino; ciano; halo; hidroxilo; acilo; mercapto; alquilsulfanilo; sulfoxi; urea; tiourea; sulfamoilo; sulfamida; oxo; o carbamoilo.

40 Como se usa en el presente documento, un grupo "acilo" se refiere a un grupo formilo o R^x-C(O)- (tale como -alquil-C(O)-, también conocido como "alquilcarbonilo") en el que R^x y "alquilo" se han definido anteriormente. Acetilo y pivaloilo son ejemplos de grupos acilo.

45 Como se usa en el presente documento, un "aróilo" o "heteroaróilo" se refiere a un aril-C(O)- o un heteroaril-C(O)-. La porción arilo y heteroarilo del aróilo o heteroaróilo está opcionalmente sustituida como se ha definido anteriormente.

50 Como se usa en el presente documento, un grupo "alcoxi" se refiere a un grupo alquil-O- en el que "alquilo" se ha definido anteriormente.

60 Como se usa en el presente documento, un grupo "carbamoilo" se refiere a un grupo que tiene la estructura -O-CO-NR^xR^y OR -NR^x-CO-O-R^z en la que R^x y R^y se han definido anteriormente y R^z puede ser alifático, arilo,

aralifático, heterocicloalifático, heteroarilo o heteroaralifático.

Como se usa en el presente documento, un grupo "carboxi" se refiere a $-\text{COOH}$, $-\text{COOR}^{\text{X}}$, $-\text{OC(O)H}$, $-\text{OC(O)R}^{\text{X}}$ cuando se utiliza como un grupo terminal; o $-\text{OC(O)-}$ o $-\text{C(O)O-}$ cuando se utiliza como grupo interno.

5

Como se usa en el presente documento, un grupo "mercapto" se refiere a $-\text{SH}$.

Como se usa en el presente documento, un grupo "sulfo" se refiere a $-\text{SO}_3\text{H}$ o $-\text{SO}_3\text{R}^{\text{X}}$ cuando se usa en los extremos o $-\text{S(O)}_3-$ cuando se usa internamente.

10

Tal como se usa en el presente documento, un grupo "sulfamida" se refiere a la estructura $-\text{NR}^{\text{X}}-\text{S(O)}_2-\text{NR}^{\text{Y}}\text{R}^{\text{Z}}$ cuando se usa en los extremos y $-\text{NR}^{\text{X}}-\text{S(O)}_2-\text{NR}^{\text{Y}}-$ cuando se usa internamente, en la que R^{X} , R^{Y} y R^{Z} se han definido anteriormente.

15

Tal como se usa en el presente documento, un grupo "sulfamoilo" se refiere a la estructura $-\text{S(O)}_2-\text{NR}^{\text{X}}\text{R}^{\text{Y}}$ OR $-\text{NR}^{\text{X}}-\text{S(O)}_2-\text{NR}^{\text{Z}}$ cuando se usa en los extremos; OR $-\text{S(O)}_2-\text{NR}^{\text{X}}$ OR $-\text{NR}^{\text{X}}-\text{S(O)}_2-$ cuando se usa internamente, en la que R^{X} , R^{Y} y R^{Z} se han definido anteriormente.

20

Tal como se usa en el presente documento un grupo "sulfanilo" se refiere a $-\text{S}-\text{R}^{\text{X}}$ cuando se usa en los extremos y $-\text{S}-$ cuando se usa internamente, en la que R^{X} se ha definido anteriormente. Entre los ejemplos de sulfanilos se incluyen alifático-S-, cicloalifático-S-, aril-S-, o similares.

25

Tal como se usa en el presente documento un grupo "sulfinilo" se refiere a $-\text{S(O)}-\text{R}^{\text{X}}$ cuando se usa en los extremos y $-\text{S(O)}-$ cuando se usa internamente, en el que R^{X} se ha definido anteriormente. Entre los ejemplos de grupos sulfinilo se incluyen alifático-S(O)-, aril-S(O)-, (cicloalifático(alifático))-S(O)-, cicloalquilo-S(O)-, heterocicloalifático-S(O)-, heteroaril-S(O)- o similares.

30

Tal como se usa en el presente documento un grupo "sulfonilo" se refiere a $-\text{S(O)}_2-\text{R}^{\text{X}}$ cuando se usa en los extremos y $-\text{S(O)}_2-$ cuando se usa internamente, en el que R^{X} se ha definido anteriormente. Entre los ejemplos de grupos sulfonilo se incluyen alifático-S(O)₂-, aril-S(O)₂-, (cicloalifático(alifático))-S(O)₂-, cicloalifático-S(O)₂-, heterocicloalifático-S(O)₂-, heteroaril-S(O)₂-, (cicloalifático(amido(alifático)))-S(O)₂- o similares.

35

Tal como se usa en el presente documento un grupo "sulfoxi" se refiere a $-\text{O}-\text{SO}-\text{R}^{\text{X}}$ o $-\text{SO}-\text{O}-\text{R}^{\text{X}}$, cuando se usa en los extremos y $-\text{O}-\text{S(O)}-$ o $-\text{S(O)}-\text{O}-$ cuando se usa internamente, en el que R^{X} se ha definido anteriormente.

40

Como se usa en el presente documento, un grupo "halógeno" o "halo" se refiere a flúor, cloro, bromo o yodo. Se proporcionan muchos ejemplos de los halógenos flúor y cloro particularmente útiles.

45

El término "haloalquilo" se refiere a grupos alquilo sustituidos con de uno hasta el número máximo posible de átomos de halógeno. Los términos "haloalcoxi" y "halotioalquilo" se refieren a grupos alcoxi y tioalquilo sustituidos con de uno a cinco átomos de halógeno.

50

Tal como se usa en el presente documento, un "alcoxicarbonilo", que está contenido en el término carboxi, utilizado solo o en conexión con otro grupo, se refiere a un grupo tal como alquilo-O-C(O)-.

55

Tal como se usa en el presente documento, un grupo "alcoxialquilo" se refiere a un grupo alquilo tal como alquil-O-alquilo, en el que el alquilo se ha definido anteriormente.

60

Tal como se usa en el presente documento, un "carbonilo" se refiere a $-\text{C(O)}-$.

Tal como se usa en el presente documento, un "oxo" se refiere a $=\text{O}$.

Como se usa en el presente documento, un "aminoalquilo" se refiere a la estructura $(\text{R}^{\text{X}})_2\text{N}$ -alquil-.

55

Tal como se usa en el presente documento, un "cianoalquilo" se refiere a la estructura (NC) -alquil-.

60

Tal como se usa en el presente documento, un grupo "urea" se refiere a la estructura $-\text{NR}^{\text{X}}-\text{CO}-\text{NR}^{\text{Y}}\text{R}^{\text{Z}}$ y un grupo "tiourea" se refiere a la estructura $-\text{NR}^{\text{X}}-\text{CS}-\text{NR}^{\text{Y}}\text{R}^{\text{Z}}$ cuando se usa en los extremos y $-\text{NR}^{\text{X}}-\text{CO}-\text{NR}^{\text{Y}}-$ o $-\text{NR}^{\text{X}}-\text{CS}-\text{NR}^{\text{Y}}-$ cuando se usa internamente, en la que R^{X} , R^{Y} y R^{Z} se han definido anteriormente.

65

Los términos "en los extremos" e "internamente" se refieren a la ubicación de un grupo dentro de un sustituyente. Un grupo es terminal cuando el grupo está presente en el extremo del sustituyente no unido además al resto de la estructura química. Carboxialquilo, es decir, $\text{R}^{\text{X}}\text{O(O)C}$ -alquilo es un ejemplo de un grupo carboxi utilizado en los extremos. Un grupo es interno cuando el grupo está presente en el medio de un sustituyente hacia el extremo del sustituyente unido al resto de la estructura química. Alquilcarboxi (por ejemplo, alquil-C(O)O- o alquil-OC(O)-) y alquilcarboxiarilo (por ejemplo, alquil-C(O)O-arilo- o alquil-O(CO)-aril-) son ejemplos de grupos carboxi utilizados

internamente.

La frase "opcionalmente sustituido" se usa indistintamente con la frase "sustituido o no sustituido." Tal como se describe en el presente documento, los compuestos de la invención pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes, tal como se ha ilustrado en general anteriormente, o como se ejemplifica mediante clases, subclases y especies de la invención. Tal como se describe en el presente documento, las variables R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, R₆, R₇, R₈, R₉, R₁₀, R₁₁, R₁₂, R₁₃, R₂₀, R₂₁, R₂₂, R₂₃ y otras variables contenidas en el mismo abarcan grupos específicos, tales como alquilo y arilo. A menos que se indique lo contrario, cada uno de los grupos específicos para las variables R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, R₆, R₇, R₈, R₉, R₁₀, R₁₁, R₁₂, R₁₃, R₂₀, R₂₁, R₂₂, R₂₃ y otras variables contenidas en el mismo pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes descritos en el presente documento. Cada sustituyente de un grupo específico está además opcionalmente sustituido con de uno a tres de halo, ciano, oxoalcoxi, hidroxi, amino, nitro, arilo, haloalquilo y alquilo. Por ejemplo, un grupo alquilo puede estar sustituido con alquilsulfanilo y el alquilsulfanilo puede estar opcionalmente sustituido con de uno a tres de halo, ciano, oxoalcoxi, hidroxi, amino, nitro, arilo, haloalquilo y alquilo. Como ejemplo adicional, la porción cicloalquilo de un (cicloalquil)carbonilamino puede estar opcionalmente sustituido con de uno a tres de halo, ciano, alcoxi, hidroxi, nitro, haloalquilo y alquilo. Cuando dos grupos alcoxi están unidos al mismo átomo o átomos adyacentes, los dos grupos alcoxi pueden formar un anillo junto con el átomo o los átomos a los que están unidos.

En general, el término "sustituido", ya sea precedido por el término "opcionalmente" o no, se refiere a la sustitución de radicales hidrógeno en una estructura dada con el radical de un sustituyente especificado. Los sustituyentes específicos se han descrito anteriormente en las definiciones y más adelante en la descripción de los compuestos y ejemplos de los mismos. A menos que se indique lo contrario, un grupo opcionalmente sustituido puede tener un sustituyente en cada posición sustituible del grupo y cuando más de una posición en cualquier estructura dada puede estar sustituida con más de un sustituyente seleccionado de un grupo especificado, el sustituyente puede ser el mismo o diferente en cada posición. Un sustituyente del anillo, tal como un heterocicloalquilo, puede estar unido a otro anillo, tal como un cicloalquilo, para formar un sistema de anillo espiro-bicíclico, por ejemplo, ambos anillos comparten un átomo común. Como un experto en la técnica reconocerá, las combinaciones de sustituyentes abarcadas en la presente invención son las combinaciones que dan lugar a la formación de compuestos estables o químicamente factibles.

La frase "estable o químicamente factible", como se usa en el presente documento, se refiere a compuestos que no se alteran sustancialmente cuando se someten a condiciones para permitir su producción, detección y, preferentemente, su recuperación, purificación y uso para uno o más de los propósitos descritos en el presente documento. En algunas realizaciones, un compuesto estable o compuesto químicamente factible es uno que no se altera sustancialmente cuando se mantiene a una temperatura de 40 °C o menos, en ausencia de humedad u otras condiciones químicamente reactivas, durante al menos una semana.

A menos que se indique lo contrario, también se pretende que las estructuras representadas en el presente documento incluyan todas las formas isoméricas (por ejemplo, enantioméricas, diastereoméricas y geométricas (o conformacionales)) de la estructura; por ejemplo, las configuraciones R y S para cada centro asimétrico, los isómeros de doble enlace (Z) y (E) y los isómeros conformacionales (Z) y (E). Por lo tanto, los isómeros estereoquímicos sencillos, así como mezclas enantioméricas, diastereoméricas, y geométricas (o conformacionales) de los presentes compuestos están dentro del alcance de la invención.

A menos que se indique lo contrario, todas las formas tautómeras de los compuestos de la invención están dentro del alcance de la invención.

Adicionalmente, a menos que se indique lo contrario, también se pretende que las estructuras representadas en el presente documento incluyan compuestos que difieren solo en presencia de uno o más átomos enriquecidos isotópicamente. Por ejemplo, los compuestos que tienen las presentes estructuras a excepción de la sustitución de hidrógeno por deuterio o tritio, o la sustitución de un carbono por un carbono enriquecido ¹³C- o ¹⁴C están dentro del alcance de la presente invención. Tales compuestos son útiles, por ejemplo, como herramientas analíticas o sondas en ensayos biológicos.

"Disolventes apróticos dipolares" son disolventes orgánicos polares que no contienen un hidrógeno intercambiable. Entre estos se encuentran: tetrahidrofurano, N, N-dimetilformamida, dimetilsulfóxido y 1,4-dioxano. Obtención y preparación de los materiales de partida

Los materiales de partida utilizados para fabricar los compuestos de la Fórmula (I) están ampliamente disponibles. Los compuestos de fórmula (I) se pueden sintetizar de acuerdo con los procesos químicos indicados en los Esquemas A-B a continuación.

En el presente documento se proporcionan referencias que pueden ser útiles en la realización de algunas de las reacciones, tal como cloruro cianúrico mediante acoplamiento con un compuesto organometálico. Véase, "Rapid Synthesis of Triazine Inhibitors of Inosine Monophosphate Dehydrogenase" de Pitts, William J.; Guo, Junqing, Dhar, T. G. Murali; Shen, Zhongqi; Gu, Henry, H.; Watterson, Scott H.; Bednarz, Mark S.; Chen, Bang-Chi; Barrish, Joel C.;

Bassoline, Donna; Cheney, Daniel; Fleener, Catherine A.; Rouleau, Katherine A.; Hollenbaugh, Diena L.; Iwanowicz, Edwin J; *Biog. & Med. Chem. Letters* 12 (2002) p. 2137-2140. A esto le puede seguir la adición escalonada de nucleófilos. Véase, "Triazine Antiviral Compounds" Arenas, Jaime, E.; Fleming, Elizabeth, S.; publicación de solicitud internacional WO 9936410, "Triazine Antiviral Compounds" Arenas, Jaime, E.; Fleming, Elizabeth, S; Xiang, Yi, B.; patente de Estados Unidos n.º 6.335.339 B1 y "Inhibitors of IL-12 Production" Ono, Mitsunori, Wada, Yumiko, Brunkhorst, Beatrice, Warchol, Tadeusz, Wrona, Wojciech, Zhou, Dan, Vo, Nha, H. publicación de solicitud internacional WO 0078757 A1. Para la preparación de éteres fenoxi véase: "Phenols Reactions with 1,1-Difluoroethene, 1,2-Di(fluorochloro)ethane, and Trifluorochloroethene" de M. M. Kremlev; A. I. Mushta y L. I. Moklyarchuk; *Russian Journal of Organic Chemistry*, (2003), 39(8), 1196-1200. Los métodos de síntesis de compuestos relacionados también se pueden encontrar en el documento WO 2009/048750 A2, publicado el 16 de abril de 2009, solicitante Dow Agrosiences LLC US 2009-0093481 A1, y el documento WO 2009/048751 A1, publicado el 16 de abril de 2009, solicitante Dow Agrosiences LLC US 2009-0093480 A1.

Método de preparación

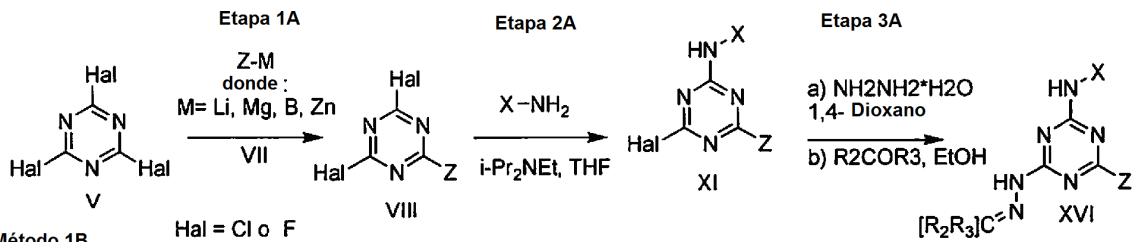
Se proporcionan los siguientes esquemas generales con la fórmula: esquema general A, con los métodos 1A, 1B y 1C; esquema general B con los métodos 2, 3 y 4; esquema de ejemplo 1 para el ejemplo 1.

Esquema general A y el método 1

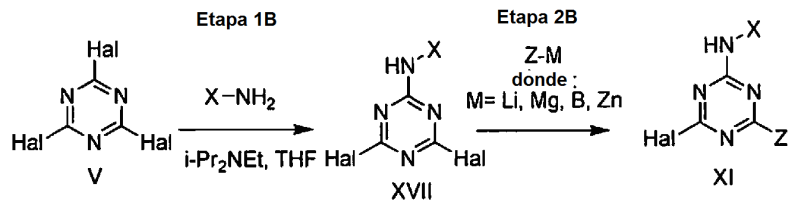
El esquema general A proporciona varias rutas para fabricar los compuestos insecticidas descritos en el presente documento. Los compuestos se preparan en tres etapas a partir de compuestos conocidos. El método 1, etapas 1A, 2A y 3^a, es la ruta preferente para la preparación de compuestos en los que Y es N.

Esquema A- Método 1A, 1B y 1C y Esquema B- método 2, método 3 y método 4

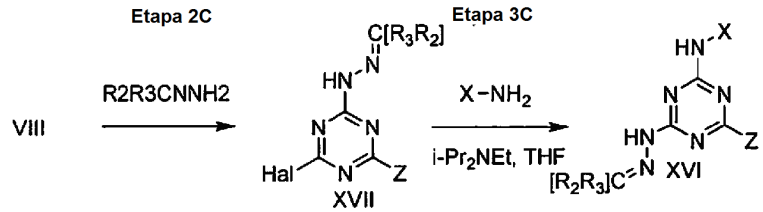
Método 1A



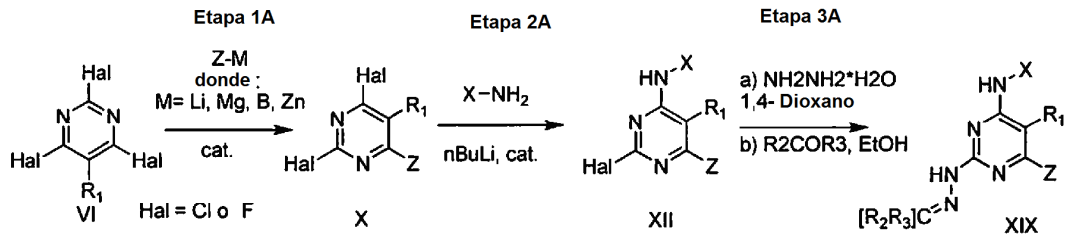
Método 1B



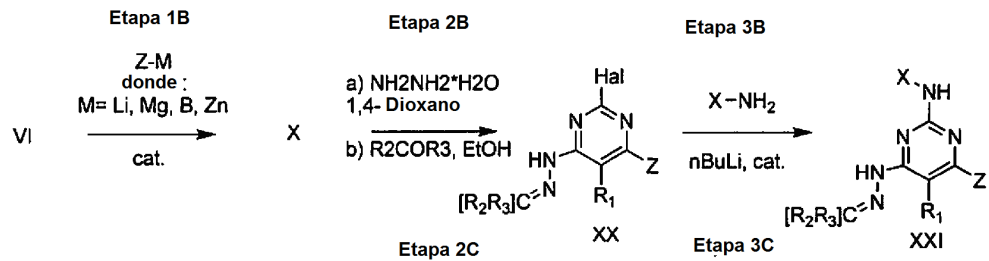
Método 1C



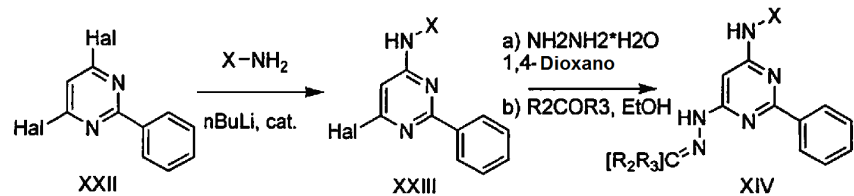
Método 2



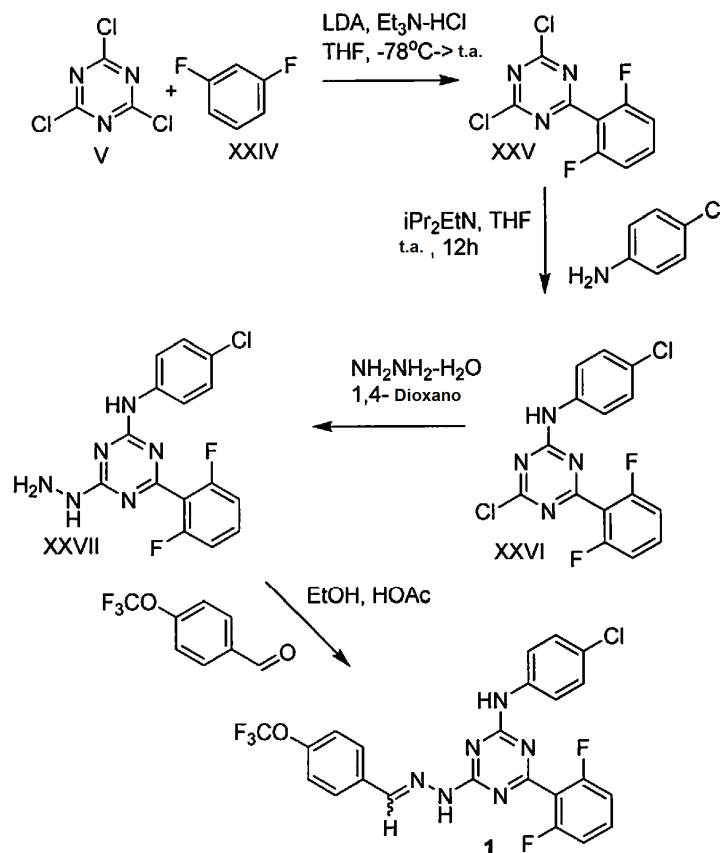
Método 3



Método 4



Esquema de ejemplo 1 (ejemplo 1)



5 Descripción general para la preparación de los compuestos, esquemas y ejemplos

En Método general 1, Etapa 1A. Los compuestos de la fórmula V se condensan con un equivalente de un compuesto organometálico de la fórmula (VII) en un disolvente aprótico polar para dar el derivado de ariltriazina de la fórmula (VIII). El metal preferente es litio o magnesio, pero también se pueden utilizar otros metales, incluyendo, pero sin limitaciones, potasio, sodio, boro, cinc y estaño. La reacción se deja proceder a mediante la catálisis de paladio u otros catalizadores de acoplamiento conocidos por los expertos en la síntesis orgánica.

En Método general 1, Etapa 2A. La 2-aryl-4,6-dicloro-1,3,5-triazina de la fórmula (VIII) se trata con un alquilo primario, arilo o heteroarilamina en un disolvente aprótico polar para proporcionar el compuesto de la fórmula (XI). La base preferida y el disolvente preferentes para la reacción de aminas X-NH₂ son i-Pr₂, EtN y THF, respectivamente, aunque se pueden utilizar otras bases y disolventes apróticos polares.

En el Método general 1, Etapa 3A (a-b). El derivado de triazina de la fórmula (XI) se trata primero con un exceso de monohidrato de hidrazina en 1,4-dioxano, para dar un derivado de 1,3,5-triazina hidrazina intermedio (XVIII - estructura no mostrada). En la mayoría de los casos el producto no se aísla sino que se recoge mediante una simple filtración y secado.

En el método general 1, la última etapa. El derivado intermedio de hidrazina 1,3,5-triazina (XVIII - estructura no mostrada) se trata con un aldehído o cetona en etanol o una mezcla de etanol y otro disolvente tal como tetrahidrofurano o diclorometano, para dar la arilamino-1,3,5-triazonohidrazona de la fórmula XVI. Mientras que las etapas 1-3 representan una secuencia particular, las etapas 1 y 2 se puede realizar en cualquier orden. No obstante, es preferible llevar a cabo la Etapa 3 después de que han finalizado las etapas 1 y 2.

Los compuestos de fórmula (XVI) también se pueden preparar mediante el tratamiento de la trihalotriazina de partida (V) o los dihaloheterociclos formados secundariamente (VIII) con la hidrazona preformada, R₂R₃C=NNH₂ en presencia de una base en un disolvente aprótico, tal como 1,4-dioxano, para formar haloheterociclos como se muestra en las etapas 2C y 3C del método general 1C. La arilhidrazona de la fórmula, R₂R₃C=NNH-, se pueden preparar a partir del aldehído o cetona correspondiente (J. Org. Chem. 1966, 31, 677). Los compuestos finales de fórmula (I) pueden completarse mediante la adición de aminas primarias X-NH₂ en las condiciones descritas anteriormente.

35

No hay posibilidades regioisoméricas con los productos centrales de triazina (XVI) y se prefiere la secuencia descrita anteriormente en el método 1A. A veces es deseable cambiar el orden de adición de los sustituyentes Z y XNH-, como se ilustra en las etapas 1B y 2B del método 1B. El orden de adición de los grupos a los compuestos trihalo de partida es fuertemente determinante del regio posicionamiento relativo de los grupos colgantes en las pirimidinas de las fórmulas (I) y la consiguiente colocación en clases estructurales (II-IV). Con el fin de preparar los regioisómeros de pirimidina II-IV, el orden de unión de los grupos colgantes Z, X-NH₂ y la hidrazona debe cambiarse. Esto se ilustra en los métodos 2, 3 y 4, a continuación.

Método General 1A, etapa 1A.1. También el ejemplo 1. Para este método general, los inventores también proporcionan un ejemplo detallado específico, es decir, el ejemplo 1, que es el compuesto denominado N-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina(1). Véase también el esquema de ejemplo 1, anteriormente. Gota a gota se añadió una solución de diisopropilamina de litio en tetrahidrofurano (THF) (15 ml, 2 M, 30 mmol) a una suspensión agitada a temperatura ambiente de clorhidrato de trietilamina (0,25 g, 1,8 mmol) en tetrahidrofurano seco (THF; 10 ml). Cuando la mezcla se volvió homogénea, la solución se enfrió a -78 °C en un baño de hielo seco / acetona. Gota a gota se añadió 1,3-difluorobenceno (3 ml, 30,4 mmol) y la solución se agitó durante 15 minutos. La solución a -78 °C se vertió rápidamente en una solución a -78 °C de cloruro cianúrico (5,5 g, 30 mmol) en THF seco (25 ml). Se retiró el baño frío de hielo seco/acetona y la mezcla se dejó llegar a la temperatura ambiente. Una vez a temperatura ambiente, la mezcla de color rojo anaranjado se vertió en 100 ml de solución de bicarbonato acuoso saturado. La mezcla se dejó reposar durante 15 minutos. Se añadieron hexanos (100 ml) y después a de una mezcla a fondo, la capa orgánica se separó de la capa acuosa. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio y después se filtró para eliminar el sulfato de magnesio. La solución se concentró en un evaporador rotatorio para dar un aceite. El aceite se disolvió en una cantidad mínima de cloruro de metileno y se cargó en 100 g de gel de sílice. El gel de sílice se eluyó con acetato de etilo al 10 % en hexanos. El eluyente orgánico se concentró en un evaporador rotatorio y el producto precipitó en cloruro de metileno y hexano, para dar 0,7 g de 2,4-dicloro-6-(2,6-difluorofenil)-1,3,5-triazina (XXV). IEP/EM 261,9, 263,9, 265,8 (M+H).

Método General 1A, etapa 1A.2. Paso. Gota a gota se añadió una solución de n-BuLi (15 ml, 2 M, 30 mmol) en ciclohexano a una suspensión agitada a temperatura ambiente de clorhidrato de trietilamina (0,25 g, 1,8 mmol). Cuando la mezcla se volvió homogénea, la solución se enfrió a -78 °C en un baño de hielo seco / acetona y se añadieron 20 ml de THF anhidro. Gota a gota se añadió 1,3-difluorobenceno (3 ml, 30,4 mmol) y la solución se agitó durante 15 minutos. La solución a -78 °C se transfirió a través de una cánula a una solución a -78 °C de cloruro cianúrico a -78 °C (5,5 g, 30 mmol) en THF seco (25 ml). Se retiró el baño frío de hielo seco/acetona y la mezcla se dejó llegar a la temperatura ambiente. Una vez a temperatura ambiente, la mezcla de color rojo anaranjado se vertió en 100 ml de solución de bicarbonato acuoso semisaturada. La mezcla se dejó reposar durante 15 minutos. Se añadieron hexanos (100 ml) y después a de una mezcla a fondo, la capa orgánica se separó de la capa acuosa. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio y después se filtró para eliminar el sulfato de magnesio. La solución se concentró en un evaporador rotatorio para dar un aceite. El aceite se disolvió en una cantidad mínima de cloruro de metileno y se cargó en 100 g de gel de sílice. El gel de sílice se eluyó con acetato de etilo al 10 % en hexanos. El eluyente orgánico se concentró en un evaporador rotatorio y el producto precipitó en cloruro de metileno y hexano, para dar 0,7 g de 2,4-dicloro-6-(2,6-difluorofenil)-1,3,5-triazina (XXV). IEP/EM 262,0, 263,9, 265,9 (M+H).

Método general 1A, etapa 1A.3. Una solución de cloruro cianúrico (3,69 g, 20 mmol) en THF seco (20 ml) en nitrógeno se trató, gota a gota, con una solución de bromuro de 3-metoxifenilmagnesio en THF (20 ml, 1M, 20 mmol). La solución se calentó y se agitó durante 30 minutos a temperatura ambiente, seguido de agitación durante la noche a 40 ~ °C. La reacción se vertió en una mezcla de bicarbonato de sodio saturado (50 ml) y agua (50 ml), formando un sólido. La mezcla se agitó durante 20 minutos y se separaron las capas. Se extrajo la fase acuosa con acetato de etilo (EtOAc) dos veces. Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de magnesio, se filtraron y se concentraron en un evaporador rotatorio, para dar un sólido de color tostado. El sólido se disolvió en cloroformo y se cargó en 100 g de gel de sílice. El gel de sílice se eluyó con acetato de etilo al 10 % / hexanos, seguido de 20 % de acetato de etilo / hexanos. Las fracciones apropiadas se concentraron en un evaporador rotatorio, para dar 2,4-dicloro-6-(3-metoxifenil)-1,3,5-triazina (VIII) como un sólido blanco (0,52 g, 4,50 g). IEP/EM 256,1, 258,1, 260,1 (M+H).

Método general 1A, etapa 1A.4. Una solución de 1-yodo-2-fluorobenceno (2,22 g, 10 mmol) en THF (15 ml) se enfrió en un baño de hielo seco / acetona y después se trató gota a gota con una solución de nBuLi en ciclohexano (5 ml, 2 M, 10 mmol) en atmósfera de nitrógeno. La mezcla se agitó en frío durante 30 minutos y después se transfirió mediante una cánula a una solución de cloruro cianúrico (1,84 g, 10 mmol) en THF (20 ml) junto con un aclarado con THF (5 ml). La mezcla se agitó en frío durante 10 minutos y después se dejó calentar a temperatura ambiente durante 2 horas. La reacción se vertió en una mezcla de bicarbonato de sodio saturado (25 ml) y agua (25 ml) y se agitó durante 15 minutos. Se trató con hexanos (50 ml), se agitó en un embudo de separación y se separaron las capas. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio, se filtraron y se concentraron en un evaporador rotatorio, para dar un aceite amarillo. El aceite se diluyó con una cantidad pequeña de diclorometano y se cargó en 100 g de gel de sílice. El gel de sílice se eluyó con acetato de etilo al 10 % / hexanos. Las fracciones apropiadas se concentraron en un evaporador rotatorio, para dar aceite ligeramente amarillo. El aceite se diluyó con cloroformo y se cargó en 100 g de gel de sílice. El gel de sílice se eluyó con acetato de etilo / hexanos (2,5 %, 5 %, 7,5 %). Las

fracciones apropiadas se concentraron en un evaporador rotatorio, para dar 2,4-dicloro-6- (2-fluorofenil)-1,3,5-triazina (VIII) como un sólido blanco (0,842 g). IEP/EM 244,0, 246,0, 248,0 (M+H).

4-cloro-N-(4-clorofenil)-6-(2,6-difluorofenil)-1,3,5-triazin-2-amina (XXVI)

5 Método general 1A, etapa 2A.1. A una solución de 262 mg (1 mmol) de (2,4-dicloro-6- (2,6-difluorofenil) -1,3, 5-triazina (XXV) en 3 ml de THF seco se añadieron a temperatura ambiente 129 mg (1 mmol) de *i*Pr₂Net (base de Hunig) en 0,5 ml de THF seco. A esto se añadió, gota a gota, una solución de 127 mg (1 mmol) de 4-cloroanilina en 1,5 ml de THF seco. La reacción se agitó durante 12 horas a temperatura ambiente y se vertió en una mezcla de acetato de etilo y bicarbonato de sodio acuoso saturado. Se separaron las capas. La capa acuosa se extrajo dos veces con acetato de etilo adicional y las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de magnesio. La filtración y evaporación proporcionó una película viscosa. El material se volvió a disolver en diclorometano y se cargó en un pequeño tapón de gel de sílice en un embudo de filtro. El gel de sílice se eluyó con acetato de etilo al 10 % en hexanos y después con acetato de etilo al 20 % en hexanos, para proporcionar 140 mg del producto deseado (XXVI). IEP/EM 353,0, 354,9, 356,9 (M+H), 351,0, 353,0, 355,0 (M-H).

20 Método general 1A, etapa 2A.2. A una solución de 2 mmol de la 2,4-dicloro-6- (2-cloro-6-fluorofenil) -1,3,5-triazina en 10 ml de cloruro de metileno se añadieron 2 mmol de la 4-cloroanilina, seguido de 300 mg de trietilamina. La solución llegó a reflujo de forma espontánea. Después de llegar a la temperatura ambiente, se repartió el material entre bicarbonato de sodio acuoso saturado y acetato de etilo. Las capas orgánicas se secaron sobre sulfato de magnesio, se concentraron a presión reducida para proporcionar material que se sometió a cromatografía en gel de sílice. Después de cargar sobre un tapón de gel de sílice en un embudo de filtro, el gel de sílice se eluyó con acetato de etilo al 10 % / hexanos, para proporcionar 80 mg del producto deseado 4-cloro-6- (2-cloro-6-fluorofenil) -N - (4-clorofenil) -1,3,5-triazin-2-amina (XI) precipitado en una mezcla de acetato de etilo y hexanos. IEP/EM 369,0, 371,0, 372,9 (M+H), 367,0, 369,0, 371,0 (M-H).

30 Método general 1A, etapa 2A.3. Una solución de 2-amino-5-cloropiridina (46,28 mg, 0,36 mmol) en THF seco (3 ml) se enfrió en un baño de hielo seco baño / acetona y después se trató gota a gota con una solución de *n*BuLi en ciclohexano (0,2 ml, 2 M, 0,4 mmol) en atmósfera de nitrógeno. La mezcla se agitó en frío durante 15 minutos y después se trató gota a gota con una solución de 2,4-dicloro-6-(2-cloro-6-fluorofenil)-1,3,5-triazina (VIII) (100 mg, 0,36 mmol) en THF seco (2 ml). La mezcla se agitó en frío durante 10 minutos y después durante la noche a temperatura ambiente. La reacción se vertió en una mezcla de bicarbonato de sodio saturado y acetato de etilo. Después de separar las capas, la capa acuosa se extrajo dos veces con acetato de etilo. Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de magnesio, se filtraron y se concentraron en un evaporador rotatorio, para dar una película de color naranja. La película de color naranja se disolvió en una pequeña cantidad de cloroformo y se cargó en una pequeña columna de gel de sílice. El gel de sílice se eluyó con acetato de etilo / hexanos (10 %, 20 %, 30 %) y las fracciones apropiadas se concentraron en un evaporador rotatorio, para dar 4-cloro-6-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(5-cloropiridin-2-il)-1,3,5-triazin-2-amina (XI) como un sólido de color amarillo (19,81 mg). IEP/EM 369,9, 371,9, 373,9 (M+H), 367,9, 369,9, 372,0 (M-H). N-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-6-hidrazinil-1,3,5-triazin-2-amina (XXVII)

45 Método General 1A, etapa 3A.1 la parte a. A una solución de 151 mg (0,4 mmol) de triazina (XXVI) en 4 ml de 1,4-dioxano se añadieron rápidamente 100 μ l (2 mmol) de hidrazina monohidrato. La reacción se agitó a temperatura ambiente durante 12 horas y se añadieron 30 ml de agua, y la mezcla se agitó durante 30 minutos adicionales. El sólido resultante se recogió mediante filtración y se lavó con varias porciones de agua. El sólido blanco se secó durante la noche para dar 231 mg de N-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-6-hidrazinil-1,3,5-triazin-2-amina (XXVII). Si la hidrazina no se formó un sólido que pudiera filtrarse, la mezcla se extrajo tres veces con acetato de etilo. Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de magnesio, se filtraron y se concentraron en un evaporador rotatorio, para dar el intermedio hidrazina.

50 N-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-6--(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina (1)

55 Método general 1A, etapa 3 A.1, parte b. A una suspensión de 1,16 g de hidrazina húmeda (XXVII) (1,4 mmol) en 15 ml de etanol absoluto se añadieron 540 mg (2,84 mmol) de 4-trifluorometoxibenzaldehído en 3 ml de THF. Se añadieron seis gotas de ácido acético glacial y la mezcla se agitó durante 12 horas. A la mezcla agitada se añadieron 30 ml de agua y se agitó 30 minutos adicionales. Se añadió una porción adicional 20 ml de agua y la mezcla se agitó durante 30 minutos. La mezcla se extrajo con tres porciones de igual volumen de acetato de etilo. Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de magnesio, se filtraron y se concentraron en un evaporador rotatorio, para dar 720 ml de una espuma. La espuma se volvió a disolver en cloroformo y se cargó en un pequeño tapón de gel de sílice en un embudo de filtro. El gel de sílice se eluyó con acetato de etilo al 10 % / hexanos, seguido de 30 % y 50 % de acetato de etilo / hexanos. Las fracciones que contenían la hidrazona 1 se concentraron para dar 675 mg (1,3 mmol, 93 %) de (1) como un sólido amorfo. IEP/EM 520,8.521,2.523,0 (M+H), 519,2 (M-H).

65 Método general 1A, etapa 3A.2. A una solución de 0,14 mmol de 4-cloro-6(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(4-clorofenil)-1,3,5-triazin-2-amina en 1 ml de cloruro de metileno se añadieron 0,27 mmol de la hidrazona preformada, (4-

(trifluorometoxi)benciliden)hidrazina. La mezcla se agitó durante la noche y se sometió a cromatografía sobre gel de sílice para dar la hidrazona de triazina final. Véase el ejemplo 4. 1,3,5-triazina-2-amina de 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(4-clorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden) hidrazinilo). IEP/EM 537,1, 539,0, 541,0 (M+H), 535,1, 537,0 (M-H).

5 La hidrazona preformada, (4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazina anterior se preparó según lo siguiente: Una solución de monohidrato de hidrazina (17,0 ml, 350,5 mmol) en etanol (20 ml) se trató gota a gota con 4-trifluorometoxibenzaldehído (5,0 ml, 35 mmol). Se trató con etanol absoluto (4 ml) y se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas. La reacción se concentró en un evaporador rotatorio. El residuo se suspendió en éter dietílico y se lavó con agua. La capa acuosa se extrajo tres veces con éter dietílico. Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de magnesio, se filtraron y se concentraron en un evaporador rotatorio, para dar (4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazina como un líquido (7,04 g). IEP/EM 205,2 (M+H).

15 Método general 1C, etapa 2C. Una solución de 2,4-dicloro-6-(2-cloro-6-fluorofenil)-1,3, 5-triazina (VIII) (1,5 g, 5,39 mmol) en 1,4-dioxano (30 ml) se trató con una solución de iPr_2NEt (1,04 g, 8,08 mmol) en 1,4-dioxano (5 ml). La mezcla se trató con hidrazina (4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazina (1,1 g, 5,39 mmol) en 1,4-dioxano (15 ml). La reacción se agitó durante la noche a temperatura ambiente. La reacción se concentró en un evaporador rotatorio para dar un aceite espeso, que se suspendió en éter dietílico y se lavó con salmuera. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio, se filtraron y se concentraron en un evaporador rotatorio, para dar una espuma. La espuma se disolvió en una cantidad pequeña de cloroformo y se cargó en 100 g de gel de sílice. El gel de sílice se eluyó con acetato de etilo / hexanos (10 %, 20 %, 30 %, 50 %). Las fracciones apropiadas se concentraron en un evaporador rotatorio para dar 2-cloro-4-(2-cloro-6-fluorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazina (XVII) como una espuma / película (2,347 g). IEP/EM 446,1, 448,1, 450,1 (M+H), 444,2, 446,2 (M-H).

20 Método general 1C, etapa 3C. Una solución de 2-cloro-4-(2-cloro-6-fluorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazina (XVII) (250 mg, 0,56 mmol) en 1,4-dioxano (2 ml) se trató con una solución de iPr_2NEt (144,8 mg, 1,12 mmol) en 1,4-dioxano (1 ml). La mezcla se trató con una solución de 5-aminometil-2-cloropiridina (80,37 mg, 0,564 mmol) en 1,4-dioxano (1 ml). La reacción se agitó durante la noche a temperatura ambiente. La reacción se concentró en un evaporador rotatorio y el residuo se suspendió en acetato de etilo y se lavó con salmuera. Se extrajo la fase acuosa con acetato de etilo dos veces. Las capas orgánicas se secaron sobre sulfato de magnesio, se filtraron y se concentraron en un evaporador rotatorio, para dar un sólido de color blanco. El sólido se suspendió en cloroformo y se cargó en 100 g de gel de sílice. El gel de sílice se eluyó con acetato de etilo / hexanos (30 %, 40 %, 50 %, 70 %). Las fracciones apropiadas se concentraron en un evaporador rotatorio para dar 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-((6-cloropiridin-3-il)metil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina (ejemplo 22) como un sólido blanco (305 mg). IEP/EM 552,3, 554,2 (M+H), 550,4, 552,4 (M-H).

35 Método general 2, etapa 1A.2. A una solución a -78 °C de 5 mmol de 1-cloro-3-fluorobenceno en 10 ml de THF seco se añadieron 5 mmol (2 ml, 2,5 M) de $nBuLi$. Después de 15 minutos se añadió una solución en THF seco de 5 mmol de 2,4-dicloropirimidina. La solución se dejó llegar a temperatura ambiente. El material de partida había desaparecido mediante análisis TLC. La mezcla de reacción se vertió en una mezcla bifásica de ácido acético al 0,1 % en agua y acetato de etilo. La capa orgánica se separó y se enfrió en un baño de hielo. A la solución de acetato de etilo enfriada se añadieron 5 mmol de DDQ y se agitó durante 15 minutos. Un nuevo producto emergido fue visible mediante análisis por TLC (acetato de etilo al 5 % / hexanos). La reacción se diluyó con una porción igual de hexanos y se filtró a través de gel de sílice. El eluyente resultante se concentró a presión reducida y se sometió a cromatografía sobre gel de sílice con acetato de etilo al 5 % / hexanos, para proporcionar 280 mg de 2,4-dicloro-6-(2-cloro-6-fluorofenil)pirimidina (X) como un sólido de color blanco. IEP/EM 276,9901 (M+H).

45 Método general 2, etapa 1A.3 Una mezcla de 2,4,6-tricloropirimidina (1,834 g, 10 mmol) y dicloruro de bis(trifenilfosfina) paladio (II) (60 mg, 0,085 mmol) en THF seco (20 ml) en nitrógeno se trató gota a gota con una solución de $PhMgBr$ en THF (11 ml, 1 M, 11 mmol), que generó algo de calor. La mezcla se agitó durante 1 hora y después se repartió entre bicarbonato de sodio saturado y acetato de etilo. Se separaron las capas y la capa acuosa se extrajo dos veces con acetato de etilo. Las capas orgánicas se secaron sobre sulfato de magnesio, se filtraron y se concentraron en un evaporador rotatorio, para dar una película (2,32 g). La película se suspendió en cloroformo y se cargó en 100 g de gel de sílice. El gel de sílice se eluyó con acetato de etilo / hexanos (2 %, 2,5 %, 3 %, 5 %). Las fracciones apropiadas se concentraron en un evaporador rotatorio, para dar un sólido blanco. El sólido se trituró con hexanos, se filtró y se lavó con más hexanos para producir 2,4-dicloro-6-fenilpirimidina (X) como un sólido blanco (382,97 mg). IEP/EM 225,0, 227,0, 229,0 (M+H).

60 Método general 2, etapa 2A.1. Se enfrió una solución de 5-amino-2-cloropiridina (218,55 mg, 1,7 mmol) en THF seco (4,3 ml) en un baño de hielo seco / acetona seco en atmósfera de nitrógeno. La mezcla se trató con una solución de $nBuLi$ en hexanos (0,68 ml, 2,5 M, 1,7 mmol) gota a gota y se agitó en frío durante 10 minutos. Se dejó calentar a temperatura ambiente y, gota a gota, se añadieron ~ 1,7 ml de la mezcla a una solución de 2,4-dicloro-6-fenilpirimidina (X) (190 mg, 0,844 mmol) en THF seco (2 ml). La mezcla se agitó durante 15 minutos y se trató con ~ 0,3 ml adicionales de la solución de aniluro de litio y se agitó durante otros 15 minutos. La reacción se vertió en una mezcla de bicarbonato de sodio saturado y acetato de etilo. Las capas se separaron y la capa acuosa se extrajo dos veces con acetato de etilo. Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de magnesio, se filtraron y se concentraron para dar una película. La película se suspendió en cloroformo y se cargó en 100 g de gel de sílice. El

gel de sílice se eluyó con acetato de etilo / hexanos (10 %, 20 %, 30 %, 40 %). Las fracciones adecuadas se concentraron en un evaporador rotatorio, para dar 2-cloro-N-(6-cloropiridin-3-il)-6-fenilpirimidin-4-amina (XII) como una película (41,15 mg). IEP/EM 317,0756, 319,0810 (M+H).

- 5 Método general 2, etapa 2A.2. A 1 mmol de 2,4-dicloro-6-fenilpirimidina (X) y 4-cloroanilina en 4 ml de THF seco se añadió 1 mmol (0,5 ml, 2 M en THF heptano / etilbenceno) de diisopropilamida de litio. La reacción se siguió mediante TLC (acetato de etilo al 30 % / hexano). La mezcla de reacción se repartió entre acetato de etilo y bicarbonato de sodio acuoso saturado, y las capas orgánicas se secaron sobre sulfato de magnesio y se concentraron a presión reducida. La mezcla se purificó mediante cromatografía en gel de sílice con elución acetato
10 de etilo al 30 % /hexanos, para proporcionar 70 mg de 2-cloro-N-(4-clorofenil)-6-fenilpirimidin-4-amina (XII) como un sólido amorfo. IEP/EM 315.883, 317.915 (M+H).

- Método general 2, Etapa 3A. Una solución de 2-cloro-N-(6-cloropiridin-3-il)-6-fenilpirimidin-4-amina (XII) (41 mg, 0,13 mmol) en 1,4-dioxano (2 ml) se trató con monohidrato de hidrazina (50 ul, 1,03 mmol) y se agitó a temperatura ambiente durante 30 minutos. La reacción se trató con monohidrato de hidrazina adicional (50 ul, 1,03 mmol) y se agitó a ~ 40 °C durante 30 minutos y después a ~ 50 °C durante 2 horas. La reacción se trató con agua (10 ml) y se extrajo 3 veces con acetato de etilo. Las capas orgánicas se secaron sobre sulfato de magnesio, se filtraron y se concentraron en un evaporador rotatorio, para dar un sólido (26,7 mg). El sólido (26,7 mg, 0,085 mmol) se trató con etanol absoluto (1,5 ml) y, después, una solución de 4-trifluorometoxibenzaldehído (40 mg, 0,21 mmol) en etanol absoluto (1,5 ml). La reacción se trató con 2 gotas de ácido acético y se agitó durante la noche a temperatura ambiente. La reacción se trató con agua (10 ml) y se agitó durante 30 minutos. La mezcla se extrajo 3 veces con acetato de etilo. Las capas orgánicas se secaron sobre sulfato de magnesio, se filtraron y se concentraron en un evaporador rotatorio, para dar una película. La película se suspendió en cloroformo y se cargó en una columna pequeña de gel de sílice. El gel de sílice se eluyó con acetato de etilo (10 %, 30 %, 50 %). Las fracciones apropiadas se concentraron en un evaporador rotatorio para dar N-(6-cloropiridin-3-il)-6-fenil-2-(2-(4-(trifluorometoxi)encilideno)hidrazinil)pirimidin-4-amina (ejemplo 47) como un sólido de color blanquecino (34,87 mg). IEP/EM 485,2.487,2 (M+H), 483,0.485,0 (M-H).

- Método general 3, Etapa 2B. A una solución de 2,4-dicloro-6-fenilpirimidina (224 mg, 1 mmol) en 1 ml de 1,4-dioxano se añadieron 300 ul de hidrato de hidrazina. Se continuó la agitación a temperatura ambiente y se monitorizó la reacción mediante cromatografía en capa fina (acetato de etilo al 30 %/ hexanos). Cuando se consumió el material de partida, se añadieron 2 ml de agua y el precipitado resultante se recogió en un filtro para proporcionar 2-cloro-4-hidrazinil-6-fenilpirimidina como un sólido de color amarillo. El sólido húmedo se suspendió en 2 ml de etanol, al que se añadieron 220 mg de 4-trifluorometoxibenzaldehído. En un plazo de 5 minutos la solución se volvió transparente y luego se volvió a precipitar el material. El producto, 2-cloro-4-fenil-6-(2-(4-(trifluorometoxi)encilideno)hidrazinil)pirimidina (XX), se recogió por filtración y se secó, para dar 150 mg de un sólido. IEP/EM 392.973, 395.002 (M+H).

- Método general 3, etapa 2C. A una solución en THF a -78 °C de 4-cloroanilina se añadió 1 equivalente de nBuLi para preparar la aniluro de litio. La solución se dejó llegar a temperatura ambiente en atmósfera de nitrógeno. Se añadieron alícuotas de la aniluro de litio en porciones a una solución en THF de 2-cloro-4-fenil-6-(2-(4-(trifluorometoxi)encilideno)hidrazinil)pirimidina (XX) que contiene 0,05 equivalentes (en relación a (XX)) de dicloruro de bis(trifenilfosfina)paladio (II). La reacción se siguió mediante cromatografía en capa fina. Cuando se consumió el material de partida XX, la reacción se vertió en una solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio y se extrajo con acetato de etilo. Las capas orgánicas se secaron sobre sulfato de magnesio, se filtraron y se concentraron a presión reducida. El producto, N-(4-clorofenil)-4-fenil-6-(2-(4-(trifluorometoxi)encilideno)hidrazinil)pirimidin-2-amina (Ejemplo 58) se obtuvo como un sólido. IEP/EM 483,9728.485,9988 (M+H).

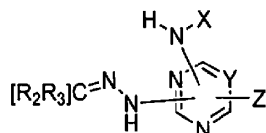
- Método general 4, etapa 2C. Una solución de 4-cloroanilina (127,6 mg, 1 mmol) en THF seco (2 ml) se enfrió en un baño de hielo seco / acetona y se trató gota a gota con una solución de nBuLi en ciclohexano (0,5 ml, 2M, 1 mmol). La mezcla se trató con THF seco adicional (2 ml) y se dejó calentar ligeramente (~ 15 minutos) hasta que el material entró en solución. A continuación, el material se transfirió mediante una cánula a una solución de fenclorim (XXII) (225 mg, 1 mmol) y dicloruro de bis(trifenilfosfina)paladio (II) (35 mg, 0,05 mmol) en THF seco (2 ml). Se aclaró con THF seco (2 ml) y se agitó a temperatura ambiente durante 30 minutos. La reacción se repartió entre bicarbonato de sodio saturado y acetato de etilo. Se añadió salmuera para ayudar a aclarar una emulsión. Se separaron las capas y la capa acuosa se extrajo dos veces con acetato de etilo. Las capas orgánicas se secaron sobre sulfato de magnesio, se filtraron y se concentraron en un evaporador rotatorio, para dar una película. La película se suspendió en cloroformo y se cargó en 100 g de gel de sílice. El gel de sílice se eluyó con acetato de etilo al 10 % / hexanos, seguido de 20 % de acetato de etilo / hexanos. Las fracciones adecuadas se concentraron para producir 6-cloro-N-(4-clorofenil)-2-fenilpirimidin-4-amina (XXIII) como una película (161,87 mg). IEP/EM 315,9, 317,9 (M+H), 314,0, 316,0 (M-H).

- Método general 4, etapa 3C. Una solución de 6-cloro-N-(4-clorofenil)-2-fenilpirimidin-4-amina (XXIII) (161,87 mg, 0,51 mmol) en 1,4-dioxano (5 ml) se trató con monohidrato de hidrazina (120 ul, 2,47 mmol) y se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora. La reacción se agitó después a 40 °C durante 135 minutos y se trató con monohidrato de hidrazina adicional (300 ul, 6,18 mmol). Se agitó con calor durante 30 minutos y se trató con monohidrato de

hidrazina adicional (700 ul, 14,43 mmol). Se agitó con calor durante 30 minutos y se trató con monohidrato de hidrazina adicional (1,5 ml, 30,9 mmol) y se agitó durante 15 minutos. Se trató con monohidrato de hidrazina (500 ul, 10,3 mmol, botella nueva) y se agitó durante la noche a ~ 50 °C. La reacción se enfrió y se repartió entre agua y diclorometano. La capa orgánica se concentró en un evaporador rotatorio para dar una película (229,26 mg). La película (que se supone 0,51 mmol) se trató con etanol absoluto (5 ml). La mezcla se trató con una solución de 4-trifluorometoxibenzaldehído (194,7 mg, 1,02 mmol) en etanol absoluto (3 ml). La mezcla se trató con 3 gotas de ácido acético y se agitó a temperatura ambiente durante 3 horas. La reacción se trató con agua (35 ml) y se agitó durante 30 minutos. Se extrajo la solución acuosa 3 veces con acetato de etilo. Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de magnesio, se filtraron y se concentraron para dar una película. La película se suspendió en cloroformo y se cargó en 100 g de gel de sílice. El gel de sílice se eluyó con acetato de etilo / hexanos (10 %, 15 %, 20 %, 30 %). Las fracciones adecuadas se concentraron, para dar N-(4-clorofenil)-4-fenil-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benzidilideno)hidrazinil)pirimidin-2-amina (Ejemplo 46) como una película (233,6 mg). IEP/EM 483,6.485,9 (M+H), 482,0.484,0 (M-H).

La presente invención comprende todos los compuestos, procedimientos y usos de estos compuestos que se describen en el presente documento. Los compuestos de la presente invención pueden describirse en términos generales o genéricos o de especificidad variable, así como con ejemplos específicos. Los términos y expresiones se describen con particularidad a continuación en varias combinaciones y con varias fórmulas descriptivas. A continuación se expone una descripción:

Un compuesto de fórmula (I),



Fórmula I

incluyendo su sal fisiológicamente aceptable, en la que:

Y es N o CR₁; R₁, es halo o alquilo -C₁-C₄; Z es -arilo, alquilarilo -C₁-C₈, alquil C₁-C₆cicloalquilo C₆, -cicloalquilo C₃-C₈, alquilheterocíclico -C₁-C₈, X, es -H, -alquilo C₁-C₈, -arilo, -alquilarilo C₁-C₈, -cicloalquilo C₃-C₈, -alquilo C₁-C₈ cicloalquilo C₃-C₈, heterocíclico, -alquilheterocíclico C₁-C₈, -NRⁱRⁱ o -alquilo C₁-C₈ NRⁱRⁱ; R₂ y R₃ son independientemente -H o -alquilo C₁-C₈, -arilo, -alquilarilo C₁-C₈, -cicloalquilo C₃-C₈, -alquilo C₁-C₈ cicloalquilo C₃-C₈, heterocíclico, -alquilheterocíclico C₁-C₈ y -alquilo C₁-C₈ NRⁱRⁱ, pero R₂ y R₃ no son ambos H

Rⁱ y Rⁱ son independientemente -H o -alquilo C₁-C₈, en el que heterocíclico es un resto de anillo cicloalifático aromático o saturado cíclico o bicíclico de 5-10 miembros que contiene 1, 2, o 3 heteroátomos seleccionados de N, O, o S; en el que el arilo, el -cicloalquilo C₃-C₈ y el heterocíclico están opcionalmente independientemente sustituidos con de uno a cinco sustituyentes seleccionados independientemente de --halo, -CN, -OH, -OCH₂CH=CHCl, -alquilo C₁-C₆, -O-alquilo C₁-C₆ o -S-alquilo C₁-C₆;

y en cada aparición, el alquilo está opcionalmente sustituido con 1-5 halo, -CN u -OH.

El sistema de anillos de seis miembros mostrado en la fórmula I y varias otras fórmulas en el presente documento se denomina "resto del núcleo." El resto del núcleo tiene dos formas, un anillo con 3 átomos de nitrógeno (N) y 3 átomos de carbono (C) o un anillo con 2 átomos de nitrógeno (N) y 4 átomos de carbono (C). La primera forma en el presente documento se denomina triazina y la última forma un anillo de pirimidina. Estas descripciones no se limitan a los isómeros de posición, aunque para mayor claridad y especificidad también se describen. Haciendo referencia a la fórmula I, las triazinas tienen Y es N, y las pirimidinas tener Y es CR₁, por lo tanto se describen dos grupos diferentes de compuestos. Gran parte de la descripción en el presente documento se refiere a las triazinas y hay muchos ejemplos de triazinas que se proporcionan con datos. No obstante, cabe que señalar que las pirimidinas también se describen completamente, preparan y reivindican, y muchos ejemplos de estas también están provistos de datos. Debe entenderse y un experto en la técnica entenderá que los sustituyentes y las sustituciones descritas en el presente documento para las triazinas pueden aplicarse fácilmente y deben aplicarse tan fácilmente a las pirimidinas.

El resto del núcleo generalmente tiene tres puntos diferentes de unión para otros cuatro restos principales, que pueden unirse al núcleo en tres locus generales. Estos cuatro restos se denominan en el presente documento Z, X, R₂ y R₃. Mientras que los puntos de unión al núcleo y la especificidad de los grupos se proporcionan en varios ejemplos principalmente con las triazinas y en su mayoría con compuestos aromáticos, se debe entender y apreciar que también se describen, y con tanta particularidad y énfasis, las pirimidinas, también se proporcionan los muchos ejemplos de pirimidinas. También se describen los sistemas de anillos alifáticos saturados relacionados pero diferentes, ejemplos de los cuales también se proporcionan.

Se muestra un compuesto de fórmula I, en la que Y es CR₁, en el presente documento pirimidinas.. R₁ puede ser H, halógeno, -alquilo C₁-C₄ opcionalmente sustituido con 1-5 halo, -CN u-OH. Se prefiere R₁, como H, metilo o -CF₃. Los compuestos alifáticos saturados e insaturados, como el arilo de fórmula I, se describen con particularidad. Por ejemplo, los inventores describen compuestos de fórmula I en la que Y es N. Se describe una triazina con diversos sustituyentes en 1, 2 o 3 átomos de C, tal como cuando los restos unidos son R₁, es -H, halo o -alquilo C₁-C₄; Z es -arilo, -alquilarilo C₁-C₈, -cicloalquilo C₃-C₈, -alquil C₁-C₆ cicloalquilo C₆, heterocíclico, -alquilheterocíclico C₁-C₈, X, es -H, -alquilo C₁-C₈, -arilo, -alquilarilo C₁-C₈, -cicloalquilo C₃-C₈, -alquil C₁-C₈ cicloalquilo C₃-C₈, heterocíclico, -alquilheterocíclico C₁-C₈, -NRⁱR^j o -alquilo C₁-C₈ NRⁱR^j; R₂ y R₃ son independientemente -H o -alquilo C₁-C₈, -arilo, -alquilarilo C₁-C₈, -cicloalquilo C₃-C₈, -alquil C₁-C₈ cicloalquilo C₃-C₈, heterocíclico, -alquilheterocíclico C₁-C₈ y -alquilo C₁-C₈ NRⁱR^j, pero R₂ y R₃ no son ambos H; Rⁱ y R^j son independientemente -H, o -alquilo C₁-C₈; en el que heterocíclico es un resto de anillo cicloalifático -C₁-C₈ aromático o saturado cíclico de 5-10 miembros que contiene 1, 2, o 3 heteroátomos seleccionados de N, O o S; en la que arilo, -cicloalquilo C₃-C₈ y heterocíclico están opcionalmente sustituidos independientemente con de uno a cinco sustituyentes seleccionados independientemente de -halo, -CN, -OH, -OCH₂CH=CHCl, -alquilo C₁-C₆, -O-alquilo C₁-C₆ o -S-alquilo C₁-C₆; y en cada aparición el alquilo está opcionalmente sustituido con 1-5 halo, -CN u -OH.

En la descripción y en las reivindicaciones, los grupos químicos estén enumerados independientemente o como una definición de una variable, pueden reemplazar o depender uno del otro en cualquier combinación, de manera que se describen grupos genéricos de tamaño decreciente y menos sustituciones opcionales.

Una heterocíclico unido puede estar compuesto por un anillo de 5,6 o 10 miembros, en el que los heteroátomos se seleccionan de N, O o S. Cuando se utiliza el término "arilo" se define como anteriormente y un ejemplo específico incluye arilos que tienen un anillo opcionalmente sustituido de 6 o 10 miembros. El halo o halógeno como se ha mencionado puede ser flúor o fluoruro (F), cloro o cloruro de (Cl), yodo o yoduro (I), o bromo o bromuro (Br) o diversas formas de cada uno de los mismos, pero en los ejemplos se usan con más frecuencia F y Cl. Alquilos y grupos alcoxi sustituidos con F y Cl, tales como -CCl₃ y -CF₃, -CH₁₋₂F₁₋₂, -CH₁₋₂Cl₁₋₂, -CHClF, -CH₂-CCl₃, -CH₂-CF₃, -CHCl-CF₃, -CHF-CF₃, -CHCl-CF₃, CHF-CF₃, -CHCl-CHF₂, -CHF-CHF₂, -CHCl-CHCl₂, -CHF-CHCl₂, incluyendo -CHF₁₋₂CH₁₋₂F₁₋₂, -CHCl -CH₁₋₂F₁₋₂, -CHF -CH₁₋₂Cl₁₋₂, -CHCl -CH₁₋₂Cl₁₋₂, -CHCl-CH₁₋₂F₁₋₂, -CHF-CHFCl, y las versiones alcoxi, es decir -O-CCl₃, -O-CF₃, -O-CH₁₋₂F₁₋₂, -O-CH₁₋₂Cl₁₋₂, -O-CHClF, -O-CH₂Cl, -O-CH₂F, -O-CCl₃, -O-CH₂-CF₃, -O-CHCl-CF₃, -O-CHF-CF₃, -O-CHCl-CCl₃, -O-CHF-Cl₃, -O-CHCl-CHF₂, -O-CHF-CHF₂, se prefieren -O-CF₂-CHF₂ y O-CF₂-CHFCl, y alcoxis relacionados tales como -O-CHCl-CHCl₂, -O-CHF-CHCl₂, -O-CHF -CH₁₋₂F₁₋₂, -O-CHCl -CH₁₋₂F₁₋₂, -O-CHF -CH₁₋₂Cl₁₋₂, -O-CH₁₋₂Cl₁₋₂, -CH₁₋₂Cl₁₋₂, -O-CHCl -O-CH₁₋₂F₁₋₂, -O-CH₁₋₂F₁₋₂, -CHFCl, es decir -alquilo C₁-C₈ y -O- -alquilo C₁-C₈ y todas las sustituciones halo. Incluyendo -C₀₋₈ F₁₋₅ y -C₀₋₈ Cl₁₋₅ y todas las combinaciones de los mismos de F, Cl, Br y I. Los arilos, tales como fenilo y naftilo, tanto no sustituidos como sustituidos con halo, especialmente con F y Cl están bien descritos. Los anillos tanto aromáticos como insaturados, como arilos y anillos alifáticos o saturados como cicloalquilos pueden tener estos sustituyentes. Un ejemplo es un sistema de anillos saturados tales como cicloalquilo C₆, con o sin un halo

Los compuestos en los que Rⁱ y R^j son independientemente -H, o -alquilo C₁-C₈ se describen en cualquier combinación y con cualquier otro compuesto. Se prefieren los compuestos en los que Rⁱ y R^j son independientemente -H, o alquilo C₁-C₂. Rⁱ y R^j son independientemente H o alquilo C₁-C₄, H o alquilo C₁-C₆, H o alquilo C₁-C₈.

Para los compuestos en toda la solicitud, cada aparición de "alquilo" cuando se especifica puede ser alquilo C₁-C₂, alquilo C₁-C₄, alquilo C₁-C₆, alquilo C₁-C₈, alquilo C₁-C₁₀ o alquilo C₁-C₁₂ lineal o ramificado. Del mismo modo, los siguientes términos pueden usarse en el presente documento en cualquier combinación y en cualquier lugar en el que se usan los términos cicloalquilo o arilo, pueden especificarse cada aparición de cicloalquilo como -cicloalquilo C₃-C₁₂, -cicloalquilo C₃-C₁₁, - cicloalquilo C₃-C₁₀, -cicloalquilo C₃-C₉, -cicloalquilo C₃-C₈, -cicloalquilo C₃-C₇, -cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquilo C₃-C₅, -cicloalquilo C₃-C₄, -cicloalquilo C₅-C₉, -cicloalquilo C₅-C₈, cicloalquilo C₅-C₇, cicloalquilo C₅-C₆, cicloalquilo C₆-C₈, cicloalquilo C₈-C₁₂, cicloalquilo -C₃, -cicloalquilo C₄, -cicloalquilo C₅, -cicloalquilo C₆, -cicloalquilo C₇, -cicloalquilo C₈, -cicloalquilo C₉, -cicloalquilo C₁₀, -cicloalquilo C₁₁, y -cicloalquilo C₁₂ y cada aparición de cicloalquilo o arilo puede ser -cicloalquilo C₃-C₁₂ o -arilo C₃-C₁₂, -cicloalquilo C₃-C₁₀ o -arilo C₃-C₁₀, -cicloalquilo C₃-C₈ o -arilo C₃-C₈, -cicloalquilo C₃-C₆, -cicloalquilo C₅-C₁₂, -cicloalquilo C₅-C₁₀ o -arilo C₅-C₁₀, -cicloalquilo C₅-C₈, -cicloalquilo C₅-C₆, cicloalquilo C₃-C₅, -cicloalquilo C₃, -cicloalquilo C₅, -cicloalquilo C₆, -cicloalquilo C₇, -cicloalquilo C₈, -cicloalquilo C₉, -cicloalquilo C₁₀, -cicloalquilo C₁₂, -arilo C₆, arilo C₁₀.

Las variables R₂ and R₃ son independientemente -H o -alquilo C₁-C₈, -arilo, -alquilarilo C₁-C₈, -cicloalquilo C₃-C₈, -alquil C₁-C₈ cicloalquilo C₃-C₈, heterocíclico, -alquilheterocíclico C₁-C₈ y -alquilo C₁-C₈ NRⁱR^j, y en algunas realizaciones y grupos de reivindicaciones debe tenerse en cuenta que R₂ y R₃ no son ambos H; se describen compuestos en los que cuando R₂ es -H o -alquilo C₁-C₈, R₃ es -alquilo C₁-C₈, -arilo, -alquilarilo C₁-C₈, -cicloalquilo C₃-C₈, -alquil C₁-C₈ cicloalquilo C₃-C₈, heterocíclico, -alquilheterocíclico C₁-C₈ y -alquilo C₁-C₈ NRⁱR^j; y se describen compuestos en los que cuando R₃ es -H o -alquilo C₁-C₈, R₂ es -alquilo C₁-C₈, - arilo, -alquilarilo C₁-C₈, -cicloalquilo C₃-C₈, -alquil C₁-C₈ cicloalquilo C₃-C₈, -heterocíclico, -alquilheterocíclico C₁-C₈ y -alquilo C₁-C₈ NRⁱR^j. También debe entenderse que con algunas realizaciones de la invención, R₂ y R₃ pueden ser independientemente -H o -alquilo C₁-C₈, -arilo, -alquilarilo C₁-C₈, -cicloalquilo C₃-C₈, -alquil C₁-C₈ cicloalquilo C₃-C₈, heterocíclico, -alquilheterocíclico C₁-

C₈ y -alquilo C₁-C₈ NRⁱR^j; pero cuando uno de R₂ y R₃ son-arilo, -alquiloarilo C₁-C₈, -cicloalquilo C₃-C₈, -alquil C₁-C₈ cicloalquilo C₃-C₈, heterocíclico, -alquilheterocíclico C₁-C₈ y -alquilo C₁-C₈ NRⁱR^j el otro de cualquiera de R₂ o R₃ es independientemente -H o -alquilo C₁-C₈.

- 5 Los términos "heterocíclico" o "alquilheterocíclico" se refieren a un anillo opcionalmente sustituido aromático e insaturado además de hacer referencia a un anillo opcionalmente sustituido no aromático y saturado en el que el heteroátomo puede ser N, O, S o cualquier combinación de éstos átomos, pero los heteroátomos más preferidos son N y O, se prefieren heteroátomos no adyacentes. Los sustituyentes del resto de núcleo que tienen un grupo morfolino unido, sustituido o no sustituidos son preferentes. Se favorece a los sustituyentes heterocíclicos
- 10 aromáticos y se describen muchos ejemplos de heteroátomos, en particular sustituyentes X, que tienen un átomo N en el anillo en un anillo aromático de 6 miembros. Un sustituyente del resto del núcleo puede tener dos o tres heteroátomos, con un heterocíclico y, por ejemplo, se describen dos átomos no adyacentes como N y N o N y O.

- 15 Los inventores describen con particularidad compuestos en los que el resto del núcleo, triazinas, pirimidinas o ambas, tienen uniones arilo alifáticas o aromáticas y que no contienen grupos "heterocíclico" o "alquilheterocíclico", tales como, por ejemplo, en los que Z es -arilo, -alquilarilo C₁-C₈, -cicloalquilo C₃-C₈ o alquil C₁-C₆ cicloalquilo C₆-. X es -H, -alquilo C₁-C₈, -arilo, -alquiloarilo C₁-C₈, -cicloalquilo C₃-C₈, -alquil C₁-C₈ cicloalquilo C₃-C₈, -NRⁱR^j o -alquilo C₁-C₈ NRⁱR^j; cuando R₂ es -H o -alquilo C₁-C₈ R₃ es -C₁-C₈ alquilo, -arilo, -alquilarilo C₁-C₈, -cicloalquilo C₃-C₈, -alquil C₁-C₈ cicloalquilo C₃-C₈ y -alquilo C₁-C₈ NRⁱR^j; y cuando R₃ es -H o -alquilo C₁-C₈ R₂ es -alquilo C₁-C₈, -arilo, -
- 20 alquilarilo C₁-C₈, -cicloalquilo C₃-C₈, -alquil C₁-C₈ cicloalquilo C₃-C₈ y -alquilo C₁-C₈ NRⁱR^j; Rⁱ y R^j son independientemente -H, o -alquilo C₁-C₈; los siguientes ejemplos son de este tipo, 1-7, 10-11, 14, 17-21, 23, 27-35, 37-39, 41, 43-44, 46, 48, 52, 57-58, y 60-61. Ejemplos de pirimidina son 46, 52, 57, 58 y 61.

- 25 En estos ejemplos y descripciones, las variables Z, X, y R₃ y R₂ pueden ser como se ha descrito y se consideran un resto colgante. En algunas realizaciones, particularmente del tipo que se acaba de describir anteriormente, opcionalmente puede haber 1, 2 o 3 sustituyentes en el resto del núcleo, triazinas, pirimidinas o ambos, y los sustituyentes, Z, X, R₃ and R₂ pueden ser como se ha descrito anteriormente solo cuando cada caso de arilo es fenilo y el fenilo está opcionalmente sustituido independientemente con 1, 2 o 3 -halo, -CN, -OH, -OCH₂CH=CHCl, -
- 30 alquilo C₁-C₈, -alquilo C₁-C₆, -alquilo C₁-C₄, -O-alquilo C₁-C₈ o -S-alquilo C₁-C₈; y en cada aparición el alquilo está opcionalmente sustituido con 1-5 halo, -CN u -OH. Ejemplos de esto incluyen los ejemplos 1-7, 10-11, 14, 17-21, 23, 27-35, 37-39, 41, 43-44, 46, 48, 52, 57-58, 60 y 61. Los ejemplos de pirimidina son 46, 52, 57, 58 y 61. El fenilo o -
- 35 alquilfenilo C₁-C₈ están opcional e independientemente sustituidos con 1 o 2 -halo, -CN, -OH, -OCH₂CH=CHCl, -alquilo C₁-C₆, -O-alquilo C₁-C₆ o -S-alquilo C₁-C₆; ; y en cada aparición el alquilo está opcionalmente sustituido con 1-5 halo, -CN u -OH. Ejemplos 1-7, 10-11, 14, 17-21, 23, 28-35, 37-39, 41, 43-44, 46, 48, 52, 57, 58, 60 y 61. Los ejemplos de pirimidina son 46, 52, 57, 58 y 61. El fenilo o -alquilfenilo C₁-C₈ están opcional e independientemente sustituidos con 1 o 2 -halo, -CN, -OH, -OCH₂CH=CHCl, -alquilo C₁-C₈, -O-alquilo C₁-C₈ o -S-alquilo C₁-C₈; ; y en cada aparición el alquilo está opcionalmente sustituido con 1-5 halo, -CN u -OH. Ejemplos 2-3, 29-31, 33, 44, 46, 57-58 y 61. Los ejemplos de pirimidina son 46, 57, 58 y 61.

- 40 A veces uno o dos sustituyentes seleccionados de Z, X, R₃ y R₂ estará sustituido con un solo sustituyente al mismo tiempo, el otro sustituyente tendrá dos o más uniones, así que, por ejemplo, se describen compuestos en los que X está opcionalmente sustituido independientemente con 1-halo, -CN, -OH, -OCH₂CH=CHCl, -alquilo C₁-C₈, -O-alquilo C₁-C₈ o -S-alquilo C₁-C₈; R₂ o R₃ está opcionalmente sustituido independientemente con 1 -halo, -CN, - OH, -
- 45 OCH₂CH=CHCl, -alquilo C₁-C₈, -O-alquilo C₁-C₈ o -S-alquilo C₁-C₈; Z está opcionalmente sustituido independientemente con 2 -halo, -CN, -OH, -OCH₂CH=CHCl, -alquilo C₁-C₈, -O-alquilo C₁-C₈ o -S-alquilo C₁-C₈; y en cada aparición el alquilo está opcionalmente sustituido con 1-5 halo, - CN u -OH. Los ejemplos de estos tipos de compuestos se proporcionan mediante los ejemplos 11, 2, 4, 6, 7, 10, 11, 14, 17, 18, 19, 20, 21, 23, 28, 32, 37, 41, 43, 52, 57, 58, 60 y 61. Los ejemplos de pirimidina de este tipo son los ejemplos 46, 52, 57, 58 y 61.

- 50 Se describen compuestos en los que algunos restos tienen dos sustituyentes unidos a un anillo y otros anillos tienen solo un sustituyente, por ejemplo, en los que X está opcionalmente sustituido independientemente con 1 o 2 -halo, - CN, -OH, -OCH₂CH=CHCl, -alquilo C₁-C₈, -O-alquilo C₁-C₈ o -S-alquilo C₁-C₈; R₂ o R₃ está opcionalmente sustituido independientemente con 1 -halo, -CN, - OH, -OCH₂CH=CHCl, -alquilo C₁-C₈, -O-alquilo C₁-C₈ o -S-alquilo C₁-C₈; Z está opcionalmente sustituido independientemente con 1 o 2 -halo, -CN, -OH, -OCH₂CH=CHCl, -alquilo C₁-C₈, -O-
- 55 alquilo C₁-C₈ o -S-alquilo C₁-C₈; y en cada aparición el alquilo está opcionalmente sustituido con 1-5 halo, - CN u -OH. Y cuando X está opcionalmente sustituido independientemente con 1 -halo, -CN, -OH, -OCH₂CH=CHCl, -alquilo C₁-C₈, -O-alquilo C₁-C₈ o -S-alquilo C₁-C₈; R₂ o R₃ está opcionalmente sustituido independientemente con 1 o 2 -halo, -CN, - OH, -OCH₂CH=CHCl, -alquilo C₁-C₈, -O-alquilo C₁-C₈ o -S-alquilo C₁-C₈; Z está opcionalmente sustituido independientemente con 1 -halo, -CN, -OH, -OCH₂CH=CHCl, -alquilo C₁-C₈, -O-alquilo C₁-C₈ o -S-alquilo C₁-C₈; y en cada aparición el alquilo está opcionalmente sustituido con 1-5 halo, - CN u -OH.
- 60

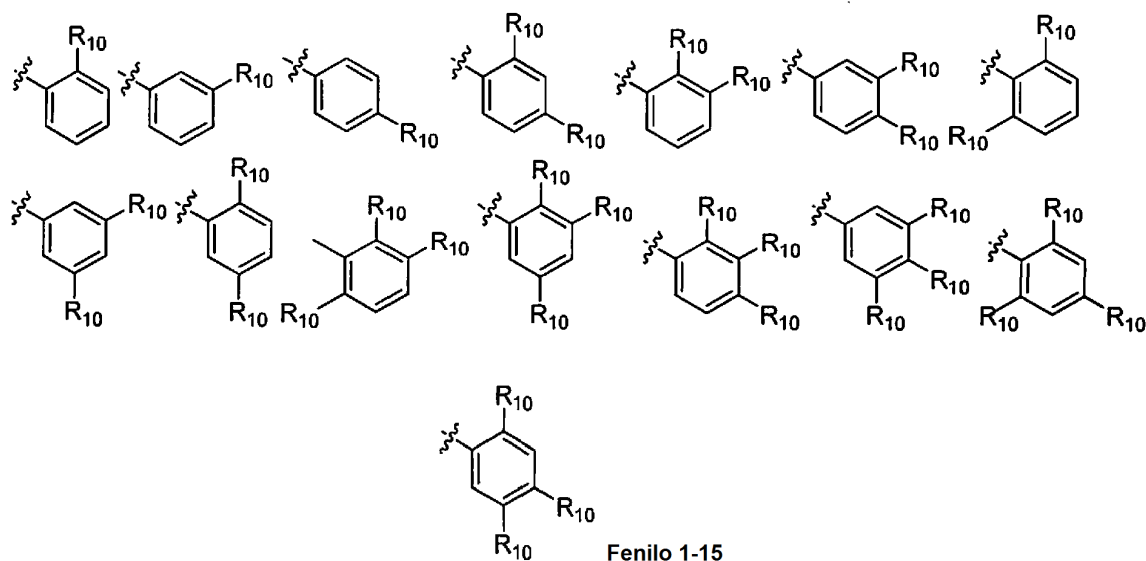
- Específicamente, los inventores describen compuestos del tipo descrito anteriormente en el que arilo puede tener 1, 2 o 3 sustituciones de acuerdo con los compuestos, la fórmula y las posiciones indicadas para cualquiera de la fórmula siguiente. En la siguiente fórmula, R es -halo, -CN, -OH, -OCH₂CH=CHCl, -alquilo C₁-C₆, -O-alquilo C₁-C₆ o -
- 65 S-alquilo C₁-C₆ y en cada aparición el alquilo o -alquilo C₁-C₆, está opcionalmente sustituido independientemente con 1-5 halo, CN u -OH. Se proporcionan ejemplos generales y específicos.

El arilo como fenilo con 1-3 grupos unidos están representados por las estructuras siguientes, en las que R₁₀ se selecciona independientemente de -halo, -CN, -OH, -OCH₂CH=CHCl, -alquilo C₁-C₆, -O-alquilo C₁-C₆ o -S-alquilo C₁-C₆; y en cada aparición el alquilo está opcionalmente sustituido con 1-5 halo, -CN u -OH. R_{het} se selecciona de N, O y S. N y O son preferentes.

5 El presente documento tiene varias tablas. En las tablas, R₁₀ puede ser cualquier sustituyente tal como se describe en el presente documento y en otras tablas, incluyendo independientemente seleccionados de -halo, -CN, -OH, -OCH₂CH=CHCl, -alquilo C₁-C₆, -O-alquilo C₁-C₆ o -S-alquilo C₁-C₆; y en cada aparición el alquilo está opcionalmente sustituido con 1-5 halo, -CN u -OH. R_{het} es N, O o S. N y O son preferentes.

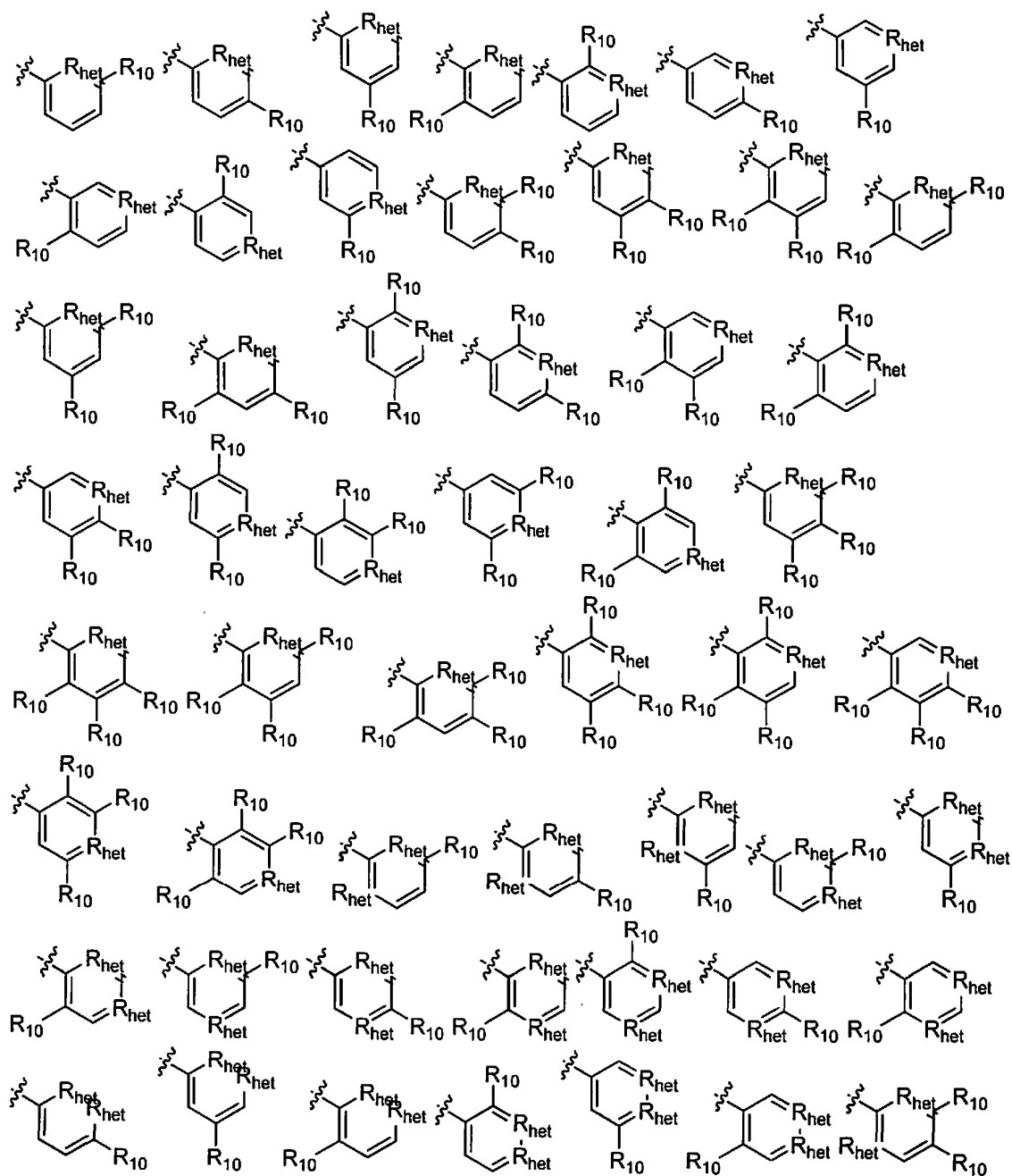
10 Se describen compuestos en los que arilo es fenilo y sustituido como se muestra a continuación en la tabla 1, fórmulas fenilo 1-15.

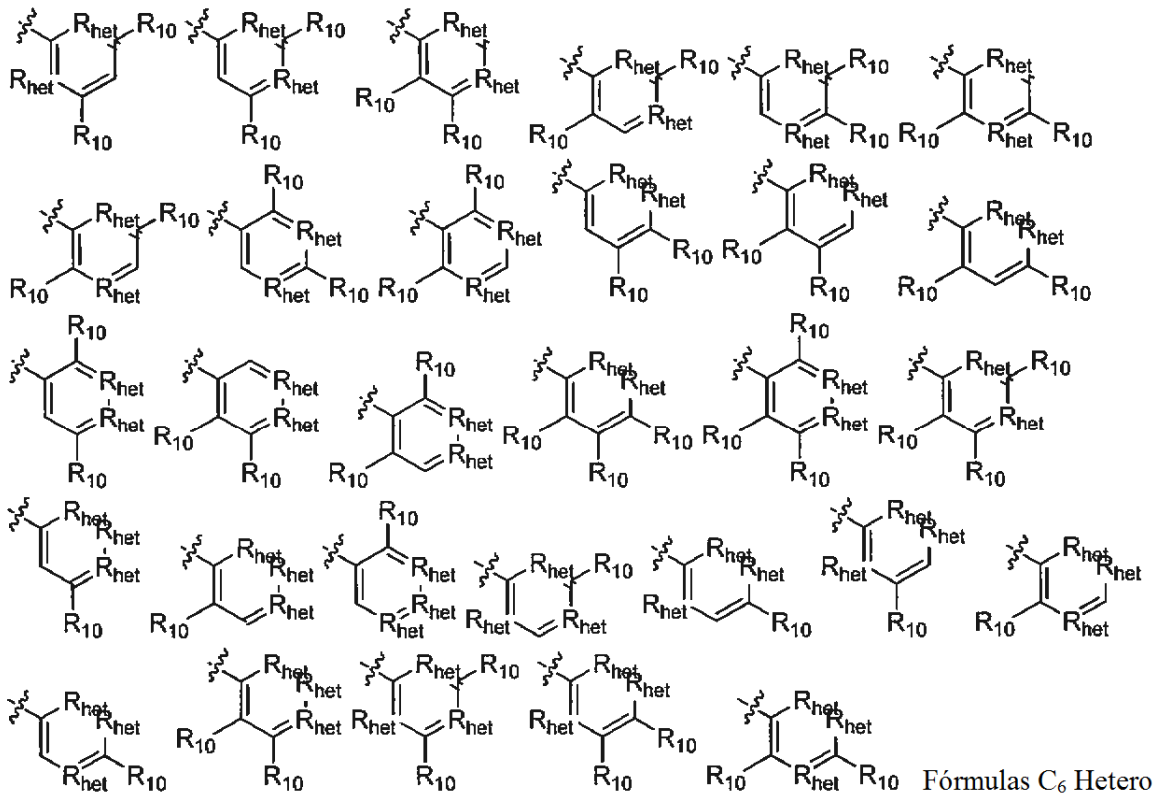
TABLA 1.



20 En la tabla 2 se describen compuestos en los que el heterocíclico es un anillo cíclico de 5, 6, o 10 miembros como se muestra en las siguientes fórmulas. Compuestos en los que el heterocíclico es un anillo cíclico de 6 miembros. Fórmulas C₆ Hetero 1-83.

TABLA 2.



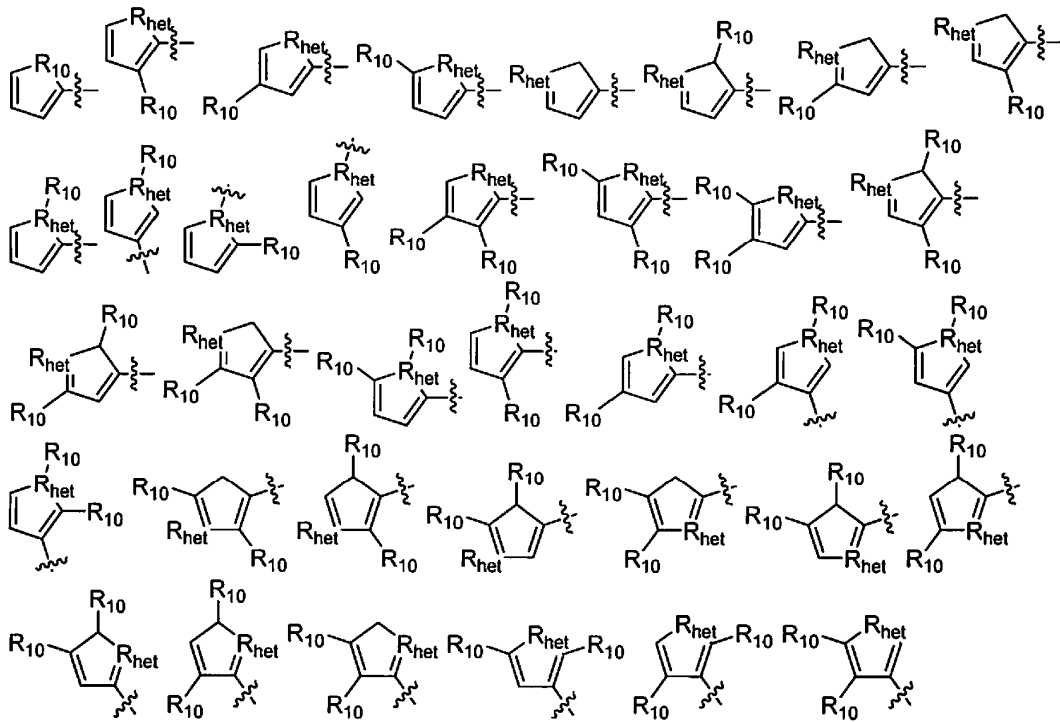


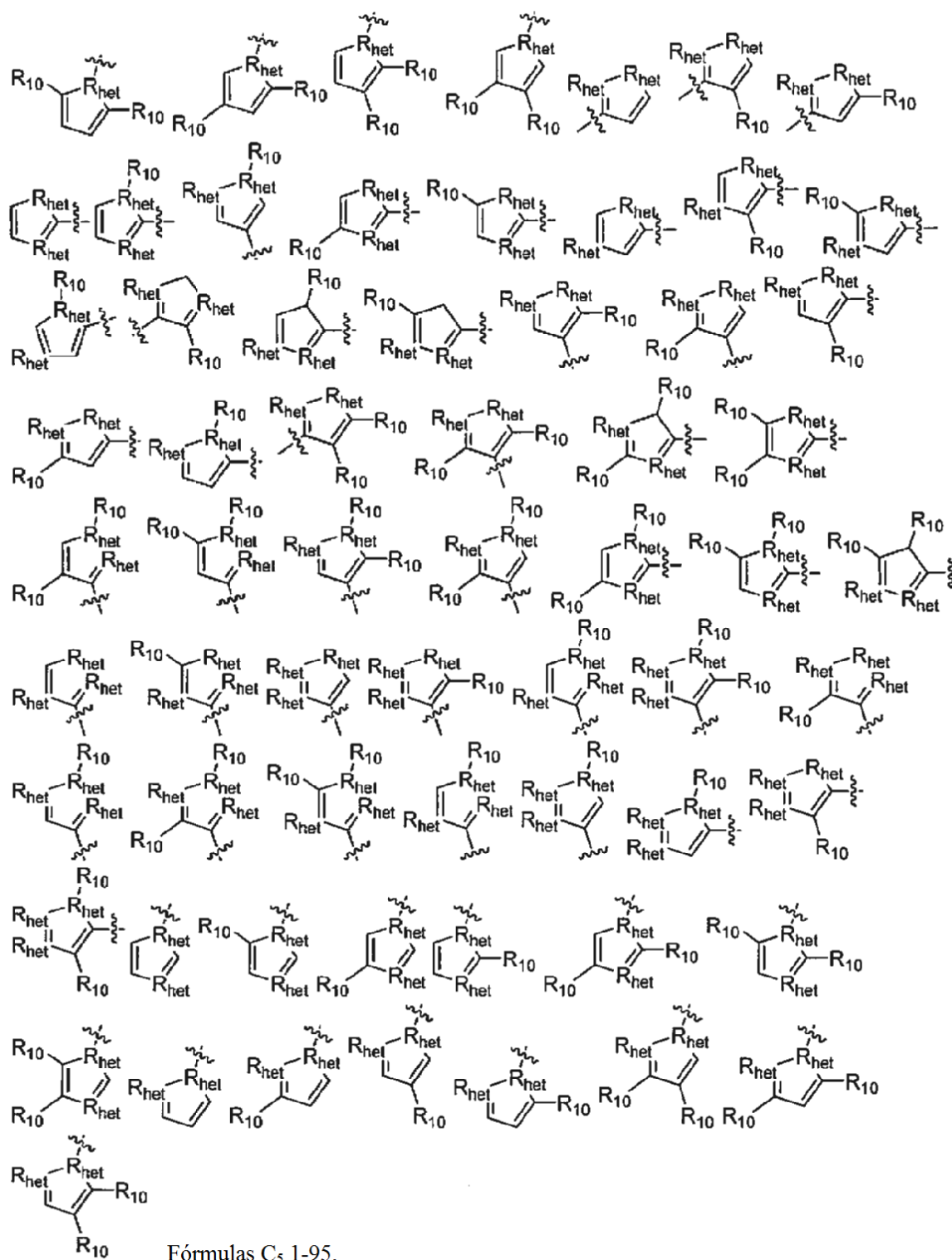
1-83.

Los compuestos en los que el heterocíclico es un anillo cíclico de 5 miembros se describen a continuación en la Tabla 3. Fórmulas C₅ Hetero 1-95.

5

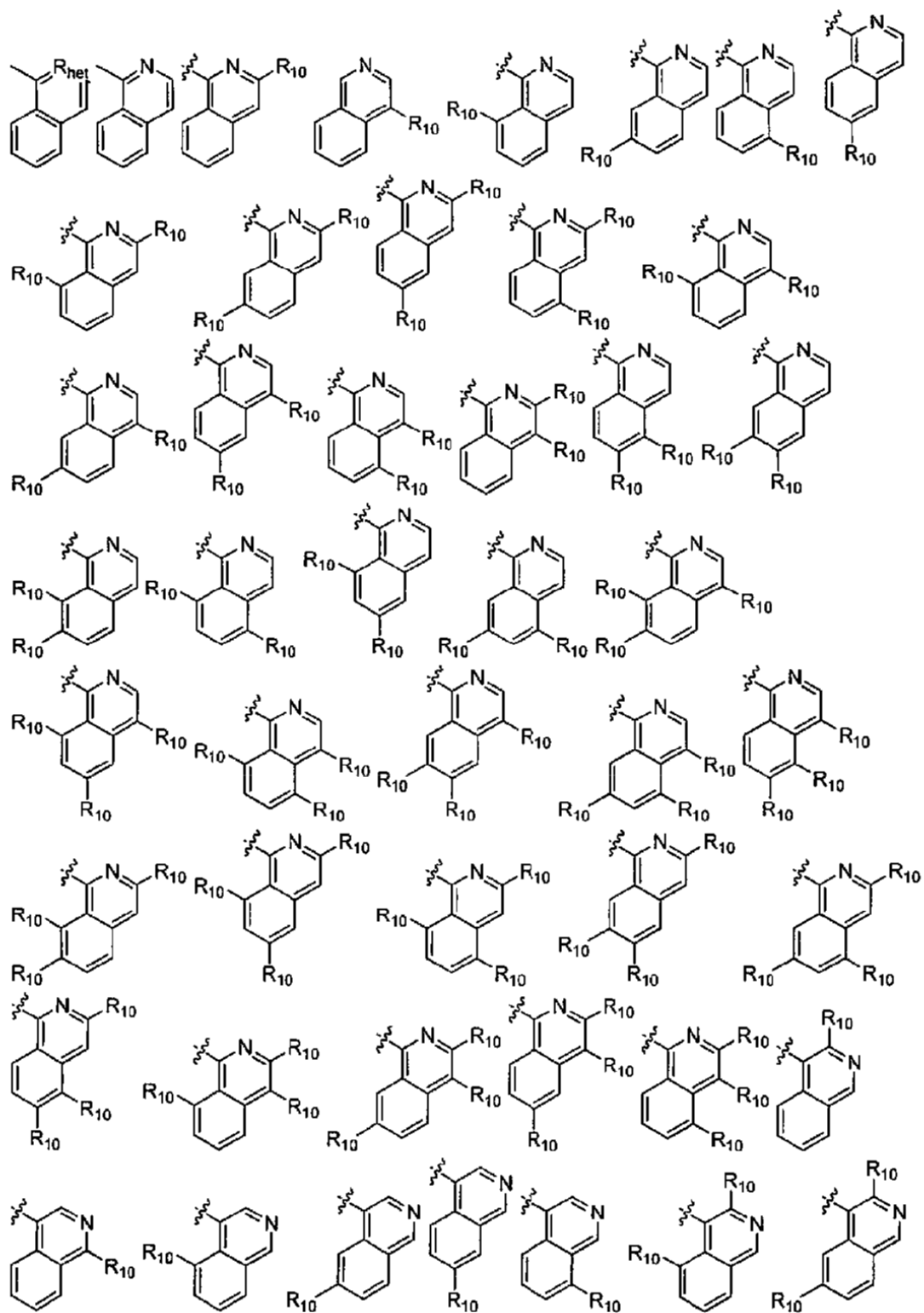
TABLA 3.

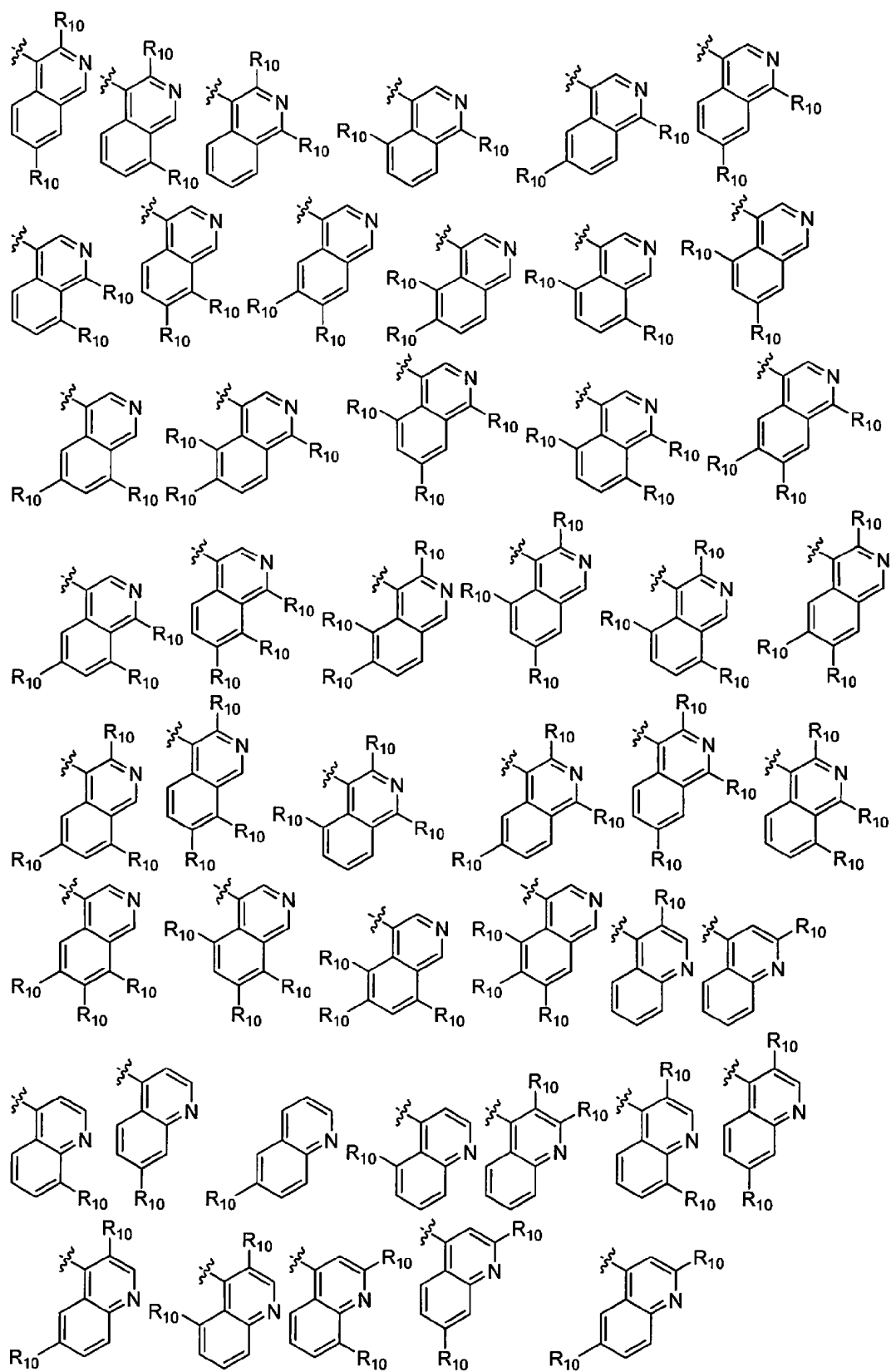


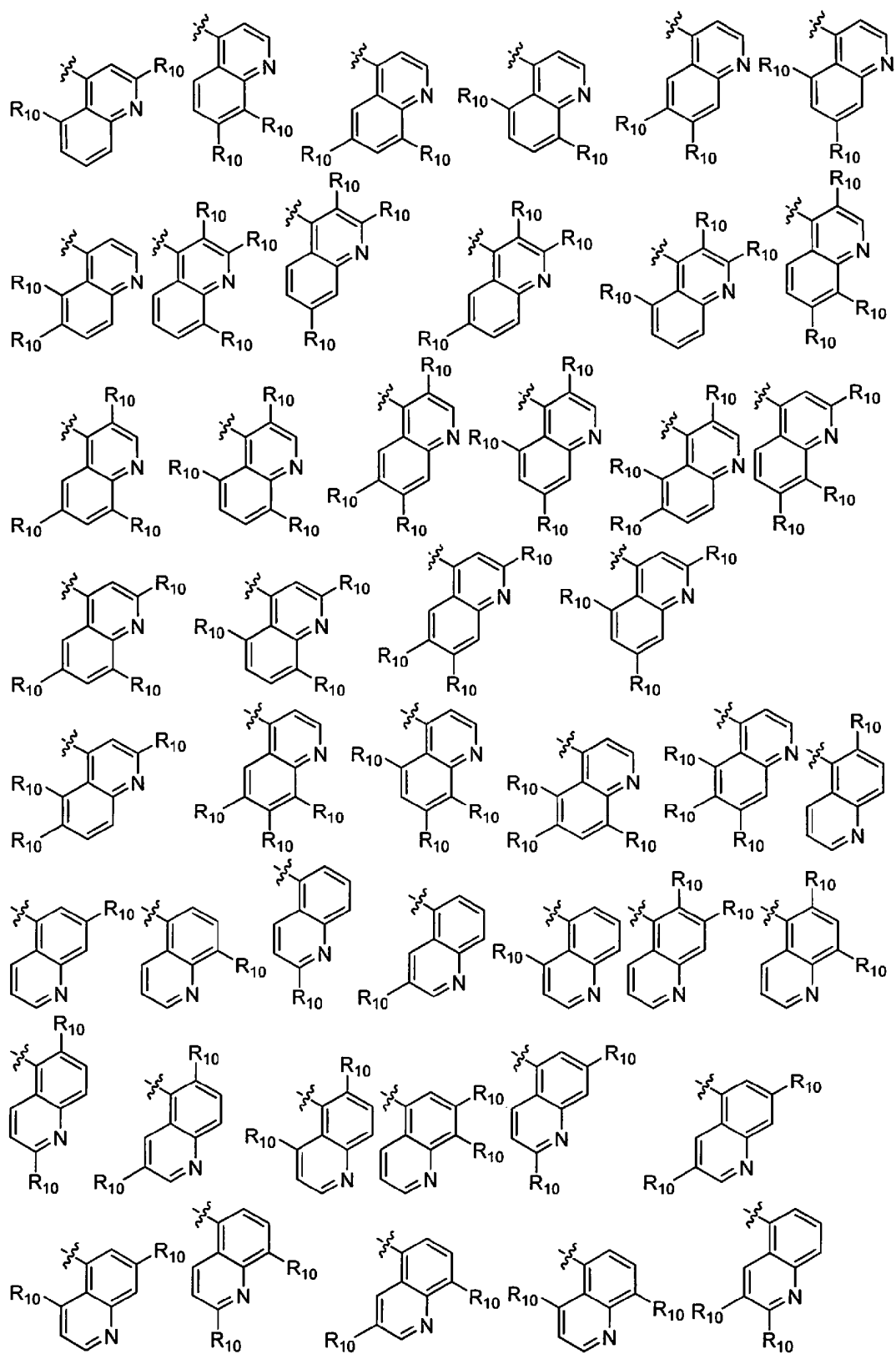


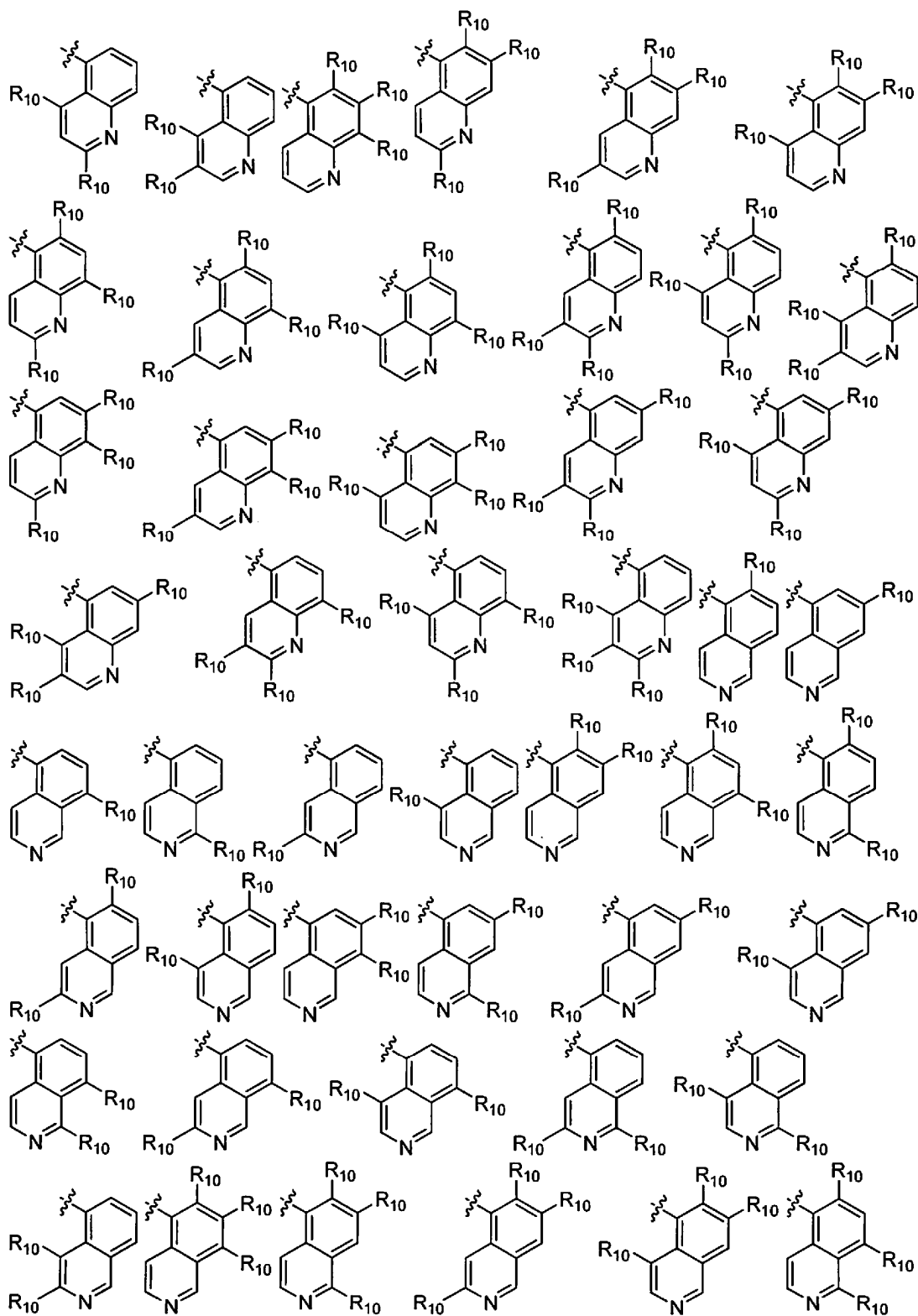
Los compuestos en los que el heterocíclico es un anillo cíclico de 10 miembros se describen a continuación en la Tabla 4. Fórmulas C₁₀ Hetero 1-283. N puede ser R_{het} en las figuras siguientes.

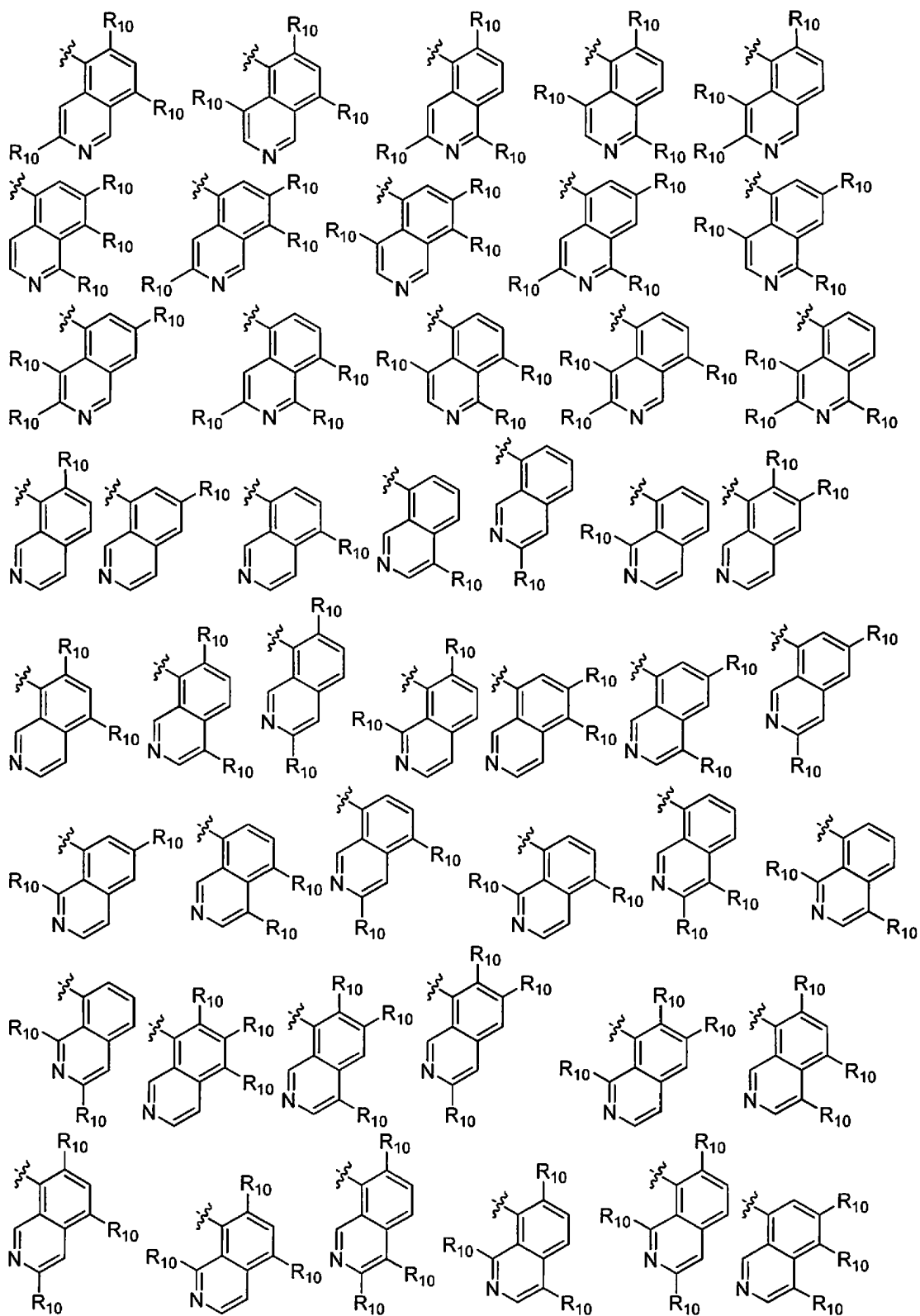
TABLA 4.

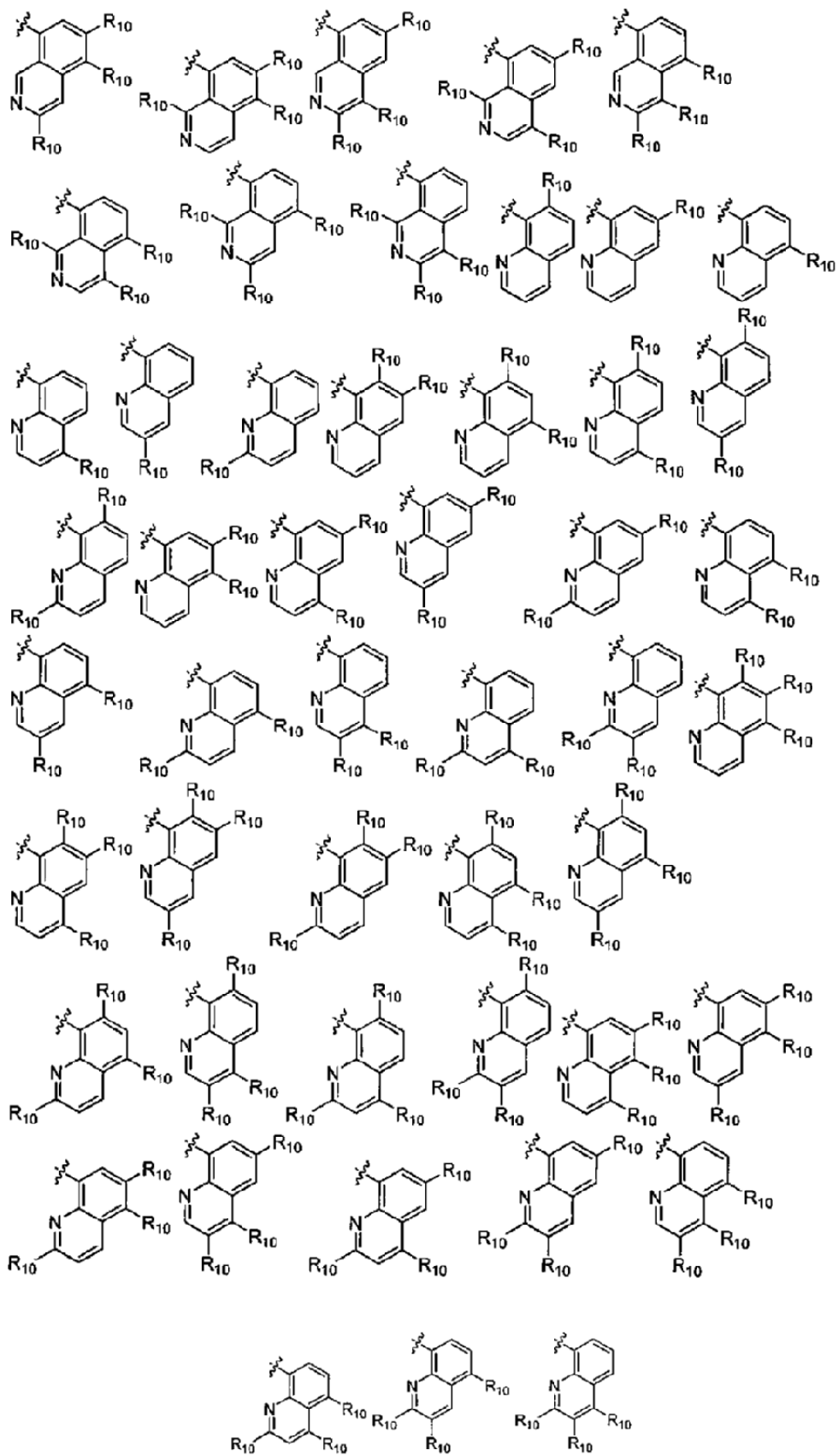












Fórmulas C10 Hetero 1-283

Arilo como naftilo con 1-3 grupos unidos están representados por las estructuras anteriores. Los inventores describen con detalle y muestran la posición de todos y cada uno de los sustituyentes, tal como se enseña en el presente documento, en los que un grupo fenilo, naftilo o anillo C₆ o C₁₀ saturado o insaturado o un grupo piridilo o un anillo C₅ saturado pueden tener 1, 2 o 3 heteroátomos con 1, 2, o 3 sustituyentes se muestran en las figuras y la fórmula en el presente documento. En la fórmula anterior, cuando R está en el anillo es un heteroátomo, R_{het}, de lo contrario, R se puede seleccionar independientemente de -H, -halo, -CN, -OH, -OCH₂CH=CHCl, -alquilo C₁-C₆, -O-alquilo C₁-C₆ o -S-alquilo C₁-C₆, también marcado R₁₀; y en cada aparición el alquilo está opcionalmente sustituido con 1-5 halo, -CN u -OH. Aunque las estructuras anteriores se muestran como aromáticas, se debe entender que también representan sistemas de anillos saturados. En las estructuras anteriores, N también puede representar R_{het}, o un heteroátomo, preferiblemente N y O, pero también incluye S.

Aunque las estructuras anteriores son aromáticas, se debe entender que también representan sistemas de anillos saturados. Una versión saturada de estos compuestos también se describe y reivindica.

importante reconocer que muchos heterocíclicos se incluyen en la presente invención. Los inventores describen compuestos en los que hasta 1, 2 o 3 de X, Z, y R₂ o R₃ es, independientemente, un anillo heterocíclico o alquilheterocíclico opcionalmente sustituido saturado o insaturado de 5 o 6 miembros, que está opcionalmente sustituido como anteriormente. Mientras que el heteroátomo puede ser N, O o S, en muchos casos, el heterocíclico tiene solo uno o dos N o un N y O, como en un morfolino, o simplemente un O, especialmente dentro de un anillo de 5 miembros. Se incluyen ejemplos de morfolino y furano. Cuando un anillo tiene 2 o más heteroátomos, los inventores prefieren que no estén adyacentes y proporcionan, como ejemplo, N y O no adyacentes.

Los compuestos pueden tener el resto del núcleo en el que un sustituyente, Z, X o R₃ o R₂ es heterocíclico y los otros dos arilo. Por lo tanto, los inventores describen compuestos en los que uno (1) de cualquiera de X, Z o R₂ o R₃ es independientemente un anillo heterocíclico o alquilheterocíclico opcionalmente sustituido saturado o insaturado de 6 miembros; en el que el heteroátomo es N u O, en el que si X, Z, y R₂ o R₃ no es heterocíclico, entonces es alifático o arilo, y el heteroátomo es N u O. Un compuesto en el que uno (1) cualquiera de X, Z, y R₂ o R₃ está sustituido opcional e independientemente con 1, 2 o 3 -H, -halo, -CN, -OH, -OCH₂CH=CHCl, -alquilo C₁-C₆, -O-alquilo C₁-C₆ o -S-alquilo C₁-C₆; en los que en cada aparición, cualquier -alquilo C₁-C₆ está sustituido opcional e independientemente con 1-5 -halo, -CN u -OH, y el heteroátomo es N u O. Un compuesto en el que dos (2) cualquiera de X, Z, y R₂ o R₃ está sustituido opcional e independientemente como anteriormente y el heteroátomo es N u O. Las descripciones son las siguientes: Un compuesto en el que Z es -arilo, -alquilarilo C₁-C₈, -cicloalquilo C₃-C₈ o alquil C₁-C₆cicloalquilo C₆-; X es heterocíclico o -alquilheterocíclico C₁-C₈; cuando R₂ es -H o -alquilo C₁-C₈, R₃ es -alquilo C₁-C₈, -arilo, -alquilarilo C₁-C₈, -cicloalquilo C₃-C₈, -alquil C₁-C₈ cicloalquilo C₃-C₈ y -alquilo C₁-C₈ NRⁱR^j; cuando R₃ es -H o -alquilo C₁-C₈, R₂ es -alquilo C₁-C₈, -arilo, -alquilarilo C₁-C₈, -cicloalquilo C₃-C₈, -alquil C₁-C₈ cicloalquilo C₃-C₈ y -alquilo C₁-C₈ NRⁱR^j; ejemplos de compuestos de este tipo son los ejemplos 8, 9, 12, 13, 15, 16, 22, 24, 26, 36, 40, 42, 45, 47, 49- 51, 53-55, 56 y 59. Los ejemplos de pirimidinas son 47, 49, 56 y 59. El arilo puede ser fenilo. Puede ser, por ejemplo, que el sustituyente Z es heterocíclico y los otros alifático o arilo como cuando Z es heterocíclico o -alquilheterocíclico C₁-C₈, X es -H, -alquilo C₁-C₈, -arilo, -alquilarilo C₁-C₈, -cicloalquilo C₃-C₈, -alquil C₁-C₈ cicloalquilo C₃-C₈, -NRⁱR^j o -alquilo C₁-C₈ NRⁱR^j; cuando R₂ es -H o -alquilo C₁-C₈, R₃ es -alquilo C₁-C₈, -arilo, -alquilarilo C₁-C₈, -cicloalquilo C₃-C₈, -alquil C₁-C₈ cicloalquilo C₃-C₈ y -alquilo C₁-C₈ NRⁱR^j; y cuando R₃ es -H o -alquilo C₁-C₈, R₂ es -alquilo C₁-C₈, -arilo, -alquilarilo C₁-C₈, -cicloalquilo C₃-C₈, -alquil C₁-C₈ cicloalquilo C₃-C₈ y -alquil C₁-C₈ cicloalquilo C₃-C₈ y -alquil C₁-C₈ NRⁱR^j. Puede ser por ejemplo que el sustituyente R₂ o R₃ es heterocíclico y los otros alifático o arilo como cuando Z es -arilo, -alquilarilo C₁-C₈, -cicloalquilo C₃-C₈ o alquil C₁-C₆cicloalquilo C₆-; X es -H, -alquilo C₁-C₈, -arilo, -alquilarilo C₁-C₈, -cicloalquilo C₃-C₈, -alquil C₁-C₈ cicloalquilo C₃-C₈, -NRⁱR^j o -alquilo C₁-C₈ NRⁱR^j; R₂ es -H o -alquilo C₁-C₈, cuando R₃ es heterocíclico y -alquilheterocíclico C₁-C₈; R₃ es -H o -alquilo C₁-C₈, cuando R₂ es -heterocíclico y -alquilheterocíclico C₁-C₈. En estos ejemplos, por supuesto, arilo puede ser fenilo y -alquilo C₁-C₈ puede ser -alquilo C₁-C₆ o -alquilo C₁-C₄.

Los compuestos pueden tener el resto del núcleo en el que 2 de los sustituyentes Z, X o R₃ o R₂ es heterocíclico y el otro arilo. Las descripciones son las siguientes: Un compuesto en el que X es heterocíclico o -alquilheterocíclico C₁-C₈; Z es heterocíclico, -alquilheterocíclico C₁-C₈; cuando R₂ es -H o -alquilo C₁-C₈, R₃ es -alquilo C₁-C₈, -arilo, -alquilarilo C₁-C₈, -cicloalquilo C₃-C₈, -alquil C₁-C₈ cicloalquilo C₃-C₈ y -alquilo C₁-C₈ NRⁱR^j; y cuando R₃ es -H o -alquilo C₁-C₈, R₂ es -alquilo C₁-C₈, -arilo, -alquilarilo C₁-C₈, -cicloalquilo C₃-C₈, -alquil C₁-C₈ cicloalquilo C₃-C₈ y -alquilo C₁-C₈ NRⁱR^j. Se describen compuestos en los que Z es -arilo, -alquilarilo C₁-C₈, -cicloalquilo C₃-C₈ o alquil C₁-C₆cicloalquilo C₆-; X es heterocíclico o -alquilheterocíclico C₁-C₈; cuando R₂ es -H o -alquilo C₁-C₈, R₃ es heterocíclico y -alquilheterocíclico C₁-C₈; y cuando R₃ es -H o -alquilo C₁-C₈, R₂ es -heterocíclico y -alquilheterocíclico C₁-C₈. Se describen compuestos en los que Z es heterocíclico, -alquilheterocíclico C₁-C₈; X es -H, -alquilo C₁-C₈, -arilo, -alquilarilo C₁-C₈, -cicloalquilo C₃-C₈, -alquil C₁-C₈ cicloalquilo C₃-C₈, -NRⁱR^j o -alquilo C₁-C₈ NRⁱR^j; cuando R₂ es -H o -alquilo C₁-C₈, R₃ es heterocíclico y -alquilheterocíclico C₁-C₈; y cuando R₃ es -H o -alquilo C₁-C₈, R₂ es -heterocíclico y -alquilheterocíclico C₁-C₈. Se describen compuestos en los que 1, 2 o 3 de X, Z, y R₂ o R₃ es independientemente un anillo -cicloalquilo C₁-C₆, -alquil C₁-C₆ cicloalquilo C₆, arilo C₆, -alquil C₁-C₆arilo C₆ o heterocíclico C₆ o -alquil C₁-C₆ heterocíclico C₆-opcionalmente sustituido, saturado o insaturado, en el que X, Z, y R₂ o R₃ está opcionalmente sustituido independientemente con 1,2 o 3, de -H, -halo, -CN, -OH, -OCH₂CH=CHCl, -alquilo C₁-C₆, -O-alquilo C₁-C₆ o -S-alquilo C₁-C₆; en el que en cada aparición, cualquiera de -alquilo C₁-C₆, está opcionalmente sustituido independientemente con 1-5 -halo, -CN o -OH. Estos compuestos pueden, por supuesto,

tener un anillo que es fenilo. Los compuestos pueden tener el resto del núcleo en el que dos sustituyentes están heterocíclico, tal como en los que uno o dos de X, Z, y R₂ o R₃ son heterocíclico y ninguno de los sustituyentes son alifático o arilo, tal como cuando Z es heterocíclico, -alquilheterocíclico C₁-C₈, X es -H, heterocíclico, -alquilheterocíclico C₁-C₈, -NR^RI o -alquilo C₁-C₈ NR^RI; cuando R₂ es -H o -alquilo C₁-C₈, R₃ es heterocíclico y -alquilheterocíclico C₁-C₈; y cuando R₃ es -H o -alquilo C₁-C₈, R₂ es -heterocíclico y -alquilheterocíclico C₁-C₈.

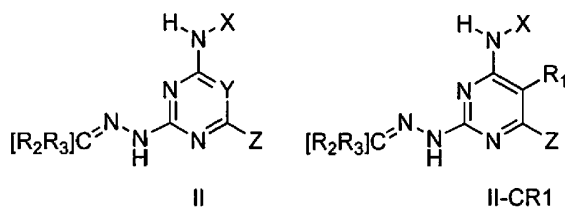
También pueden existir otras combinaciones, por ejemplo, cuando cualquier 3 de X, Z y R₂ o R₃ es heterocíclico o un anillo -alquilheterocíclico C₁-C₆ opcionalmente sustituido, saturado o insaturado, de 6 miembros, en el que X, Z, y R₂ o R₃ no es heterocíclico, es alifático o arilo, y el heteroátomo es N u O. Un compuesto en el que cualquiera 2 de X, Z, y R₂ o R₃ está opcionalmente independientemente sustituido como anteriormente, y el heteroátomo es N u O. Un compuesto en el que cualquier 1 de X, Z, y R₂ o R₃ está opcionalmente sustituido independientemente como anteriormente y el heteroátomo es N u O. Se describen compuestos en los que 1, 2 y 3 de X, Z, y R₂ o R₃ son, independientemente, un heterocíclico o un anillo -alquilheterocíclico C₁-C₆ opcionalmente sustituido saturado o insaturado de 6 miembros, en el que X, Z, y R₂ o R₃ está opcionalmente independientemente sustituido como anteriormente. En cada caso, arilo puede ser fenilo.

Un compuesto en el que las sustituciones de halógeno pueden estar unidos a cualquier carbono o como se especifica en cualquiera de los siguientes alquilo o alcoxi C₁ con 1, 2 o 3 halo, -alquilo o alcoxi C₁ con 1,2 o 3 halo, en el que el halo es Cl, Br o F, -alquilo o alcoxi C₁₋₂ con 1-5 halo en los que halo es Cl, Br o F, -alquilo o alcoxi C₁₋₂ con 1-5 halo en los que el halo es F o Cl, -alquilo o alcoxi C₁₋₂ con 1-5 halo en los que halo es Br, -alquilo o alcoxi C₁₋₂ con 1-5 halo en los que el halo es Cl, -alquilo o alcoxi C₁₋₂ con 1-5 halo en los que el halo es F, -alquilo o alcoxi C₁₋₂ con 1-4 halo en los que el halo es cualquier combinación de Br, F o Cl, -alquilo o alcoxi C₁₋₂ con 1-4 halo en los que el halo es cualquier combinación de F o Cl, -alquilo o alcoxi C₁₋₂ con 4 halo en los que el halo es 3 Cl y F, -alquilo o alcoxi C₁₋₂ con 4 halo en los que el halo es Cl y 3F, -alquilo o alcoxi C₁₋₂ con 4 halo en los que el halo es 2 Cl y 2F, -alquilo o alcoxi C₁₋₃ con 1-6 halo en los que el halo es cualquier combinación de Cl, Br o F, -alquilo o alcoxi C₁₋₃ con 1-6 halo en los que el halo es cualquier combinación de F o Cl, -alquilo o alcoxi C₁₋₃ con 1-6 halo en los que el halo es 1-3 Cl y 1-3 F, -alquilo o alcoxi C₁₋₃ con 2-4 halo en los que el halo es 1-3 F con 1 Cl, -alquilo o alcoxi C₁₋₃ con 2-4 halo en los que el halo es 1 F con 1-3 Cl, -alquilo o alcoxi C₁₋₃ con 1-5 halo en los que el halo es F o Cl, -alquilo o alcoxi C₁₋₃ con 1-4 halo en los que el halo es cualquier combinación de F o Cl, -alquilo o alcoxi C₁₋₃ con 1-4 halo en los que el halo es 1-3 F con 1 Cl, -alquilo o alcoxi C₁₋₃ con 1-4 halo en los que el halo es 1 F con 1-3 Cl, -alquilo o alcoxi C₁₋₃ con 1-2 halo en los que el halo es Cl y o F, -alquilo o alcoxi C₁₋₄ con 1-6 halo en los que el halo es Cl, Br o F, -C₁₋₄ alquilo o alcoxi con 1-6 halo en los que el halo es F o Cl, -C₁₋₄ alquilo o alcoxi con 1-3 halo en los que el halo es Br, -C₁₋₄ alquilo o alcoxi con 1-6 halo en los que el halo es Cl, -C₁₋₄ alquilo o alcoxi con 1-6 halo en los que el halo es F, -alquilo o alcoxi C₁₋₄ con 1-6 halo en los que el halo es 1-3 Cl y 1-3 F, -alquilo o alcoxi C₁₋₄ con 2-4 halo en los que el halo es 1-3 F con 1 Cl, -alquilo o alcoxi C₁₋₄ con 2-4 halo en los que el halo es 1 F con 1-3 Cl, -alquilo o alcoxi C₁₋₄ con 1-5 halo en los que el halo es F o Cl, -alquilo o alcoxi C₁₋₄ con 1-4 halo en los que el halo es F o Cl, -alquilo o alcoxi C₁₋₄ con 1-4 halo en los que el halo es 1-3 F con 1 Cl, -alquilo o alcoxi C₁₋₄ con 1-4 halo en los que el halo es 1 F con 1-3 Cl, -alquilo o alcoxi C₁₋₄ con 1-2 halo en los que el halo es Cl y o F, -alquilo o alcoxi C₁₋₅ con 1-6 halo en los que el halo es Cl, Br o F, -alquilo o alcoxi C₁₋₅ con 1-6 halo en los que el halo es F o Cl, -alquilo o alcoxi C₁₋₅ con 1-3 halo en los que el halo es Br, -alquilo o alcoxi C₁₋₅ con 1-6 halo en los que el halo es Cl, -alquilo o alcoxi C₁₋₅ con 1-6 halo en los que el halo es F, -C₁₋₅ con 1-6 halo en los que el halo es 1-3 Cl y 1-3 F, -alquilo o alcoxi C₁₋₅ con 2-4 halo en los que el halo es 1-3 F con 1 Cl, -alquilo o alcoxi C₁₋₅ con 2-4 halo en los que el halo es 1 F con 1-3 Cl, -alquilo o alcoxi C₁₋₄ con 1-5 halo en los que el halo es F o Cl, -alquilo o alcoxi C₁₋₅ con 1-4 halo en los que el halo es F o Cl, -alquilo o alcoxi C₁₋₅ con 1-4 halo en los que el halo es 1-3 F con 1 Cl, -C₁₋₅ con 1-4 halo en los que el halo es 1 F con 1-3 Cl, -alquilo o alcoxi C₁₋₅ con 1-2 halo en los que el halo es Cl y o F, -alquilo o alcoxi C₁₋₆ con 1-6 halo en los que el halo es Cl, Br o F, -alquilo o alcoxi C₁₋₆ con 1-6 halo en los que el halo es F o Cl, -alquilo o alcoxi C₁₋₆ con 1-3 halo en los que el halo es Br, -alquilo o alcoxi C₁₋₆ con 1-6 halo en los que el halo es Cl, -alquilo o alcoxi C₁₋₆ con 1-6 halo en los que el halo es F, -alquilo o alcoxi C₁₋₆ con 1-6 halo en los que el halo es 1-3 Cl y 1-3 F, -alquilo o alcoxi C₁₋₆ con 2-4 halo en los que el halo es 1-3 F con 1 Cl, -alquilo o alcoxi C₁₋₆ con 2-4 halo en los que el halo es 1 F con 1-3 Cl, -alquilo o alcoxi C₁₋₄ con 1-5 halo en los que el halo es F o Cl, -alquilo o alcoxi C₁₋₆ con 1-4 halo en los que el halo es F o Cl, -alquilo o alcoxi C₁₋₆ con 1-4 halo en los que el halo es 1-3 F con 1 Cl, -alquilo o alcoxi C₁₋₆ con 1-4 halo en los que el halo es 1 F con 1-3 Cl, -alquilo o alcoxi C₁₋₆ con 1-2 halo en los que el halo es Cl y o F.

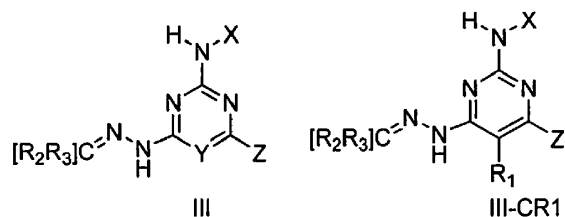
Los inventores describen con detalle haloalquilo y haloalcoxi. Los compuestos en los que las sustituciones de I, F, Cl o Br se seleccionan de y pueden ser sustituidas por cualquier de los halógenos específicos descritos en el presente documento: -CH₂F, -CHF₂, -CF₃, -CH₂CH₂F, -CHFCH₂F, -CH₂CHF₂, -CF₂CH₃, -CH₂CF₃, -CH₂CH₂CH₂F, -CHFCH₂CH₃, -CH₂CHFCH₃, -CH₂CH₂CHF₂, -CHFCH₂CH₂F, -CF₂CH₂CH₃, -CH₂CH₂CF₃, -CH₂CHFCH₂F, -CHFCH₂CH₂F, -CH₂CH₂CF₃, -CH₂CHFCH₂F, -CHFCH₂CH₂F, -CH₂CF₂CH₂F, -CHFCH₂CH₂F, -CF₂CH₂CH₃, -CH₂CF₂CH₃, -CF₂CHFCH₃, -CH₂CHFCH₃, -CHFCH₂CF₃, -CF₂CHFCH₂F, -CH₂CF₂CH₂F, -CF₂CH₂CF₃, -CH₂Cl, -CHCl₂, -CCl₃, -CH₂CH₂Cl, -CHClCH₂Cl, -CH₂CHCl₂, -CCl₂CH₃, -CH₂CCl₃, -CH₂CH₂CH₂Cl, -CHClCH₂CH₃, -CH₂CHClCH₃, -CH₂CH₂CHCl₂, -CHClCH₂CH₂Cl, -CH₂CHClCH₂Cl, -CH₂CH₂CCl₃, -CH₂CHClCHCl₂, -CHClCH₂CHCl₂, -CHClCHClCHCl₂, -CHClCHClCH₂Cl, -CCl₂CHClCH₃, -CH₂CHClCCl₃, -CHClCH₂CCl₃, -CH₂CCl₂CHCl₂, -CCl₂CH₂CHCl₂, -CCl₂CCl₂CH₃, -CHClF, -CClF₂, -CCl₂F, -CHClCH₂F, -CCl₂CH₂F, -CF₂CH₂Cl, -CHClCHF₂, -CHFCHCl₂, -CCl₂CHF₂, -CH₂CH₂CClF₂, -CH₂CH₂CFCl₂, -CH₂CHFCHClF, -CH₂CHClCHClF, -CH₂CF₂CH₂Cl, -CH₂CCl₂CH₂F, -CF₂CHClCH₃, -CF₂CH₂CH₂Cl, -CHFCHClCH₂F, -CHFCHClCHCl₂, -CF₂CHClCH₂F, -CF₂CCl₂CH₃, -CCl₂CF₂CH₃, -CF₂CHFCH₂Cl, -CCl₂CHFCH₂F, -CHClCH₂CHF₂, -CHClCHClCHF₂, -CF₂CH₂CHCl₂, -CF₂CHClCH₂Cl, -CH₂CCl₂CHFCl, -CH₂CF₂CHFCl, -CH₂CF₂CCl₃, -CHFCHCl₃, -CF₂CH₂CCl₃ -

5 CH₂CClFCF₃, -CH₂CCl₂CF₃, -CCl₂CH₂CF₃, -CHCICH₂CF₃, -O-CH₂F, -O-CHF₂, -O-CF₃, -O-CH₂CH₂F, -O-CHFCH₂F, -
 O-CH₂CHF₂, -O-CF₂CH₃, -O-CH₂CF₃, -O-CH₂CH₂CH₂F, -O-CHFCH₂CH₃, -O-CH₂CHFCH₃, -O-CH₂CH₂CHF₂, -O-
 CHFCH₂CH₂F, -O-CF₂CH₂CH₃, -O-CH₂CHFCH₂F, -O-CH₂CH₂CF₃, -O-CH₂CHFCHF₂, -O-CHFCH₂CHF₂, -O-
 CH₂CF₂CH₂F, -O-CHF₂CF₂CH₃, -O-CF₂CHFCH₃, -O-CH₂CHF₂CF₃, -O-CHFCH₂CF₃, -O-CF₂CHFCH₂F -O-
 10 CH₂CF₂CHF₂, -O-CF₂CH₂CF₃, -O-CH₂Cl, -O-CHCl₂, -O-CCl₃, -O-CH₂CH₂Cl, -O-CHCICH₂Cl, -O-CH₂CHCl₂ -O-
 CCl₂CH₃, -O-CH₂CCl₃, -O-CH₂CH₂CH₂Cl, -O-CHCICH₂CH₃, -O-CH₂CHCICH₃, -O-CH₂CH₂CHCl₂, -O-CHCICH₂CH₂Cl,
 -O-CH₂CHCICH₂Cl, -O-CH₂CH₂CCl₃, -O-CH₂CHCICHCl₂, -O-CHCICH₂CHCl₂, -O-CH₂CHCICHCl₂, -O-
 CHCICH₂CHCl₂, -O-CCl₂CHCICH₃, -O-CH₂CHCICCl₃, -O-CHCICH₂CCl₃, -O-CH₂CCl₂CHCl₂, -O-CCl₂CH₂CHCl₂, -O-
 CCl₂CCl₂CH₃, -O-CHCIF, -O-CCIF₂, -O-CCl₂F, -O-CHCICH₂F, -O-CCl₂CH₂F, -CF₂CH₂Cl, -CHCICHF₂, -O-CHFCHCl₂, -
 15 O-CCl₂CHF₂ -O-CH₂CH₂CCIF₂, -O-CH₂CH₂CFCl₂, -O-CH₂CHFCHCIF, -O-CH₂CHCICHCIF, -O-CH₂CF₂CH₂Cl, -O-
 CH₂CCl₂CH₂F, -O-CF₂CHCICH₃, -O-CF₂CH₂CH₂Cl, -O-CHFCHCICHF₂, -O-CHFCHCICHCl₂, -O-CF₂CHCICHF₂, -O-
 CF₂CCl₂CH₃, -O-CCl₂CF₂CH₃, -O-CF₂CHFCH₂Cl, -O-CCl₂CHFCH₂F, -O-CHCICHFCHF₂, -O-CHCICHCICHF₂, -O-
 CF₂CH₂CHCl₂, -O-CF₂CHCICH₂Cl, -O-CH₂CCl₂CHFCl, -O-CH₂CF₂CHFCl, -O-CH₂CF₂CCl₃, -O-CHF₂CF₂CCl₃, -O-
 CF₂CH₂CCl₃ -O-CH₂CClFCF₃, -O-CH₂CCl₂CF₃, -O-CCl₂CH₂CF₃, -O-CHCICH₂CF₃.

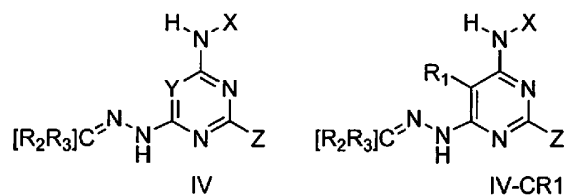
20 Todos los compuestos descritos como triazinas también se pueden describir como pirimidinas, por lo tanto, se hace referencia a las descripciones anteriores, en las que Y es CR₁ y la fórmula I se sustituye con las fórmulas II, II-CR₁, III, III-CR₁ y IV, IV-CR₁, como se describe a continuación.



Fórmula II y fórmula II-CR1



Fórmula III y fórmula III-CR1



Fórmula IV y fórmula IV-CR1

30 Los inventores observan con detalle los siguientes compuestos y tipos de compuestos que se describen y proporcionan muchos ejemplos.

35 Los ejemplos de la fórmula IV se pueden encontrar en el ejemplo 46. El ejemplo 58 muestra un compuesto de Fórmula III. Se proporcionan numerosos ejemplos en los que el sustituyente X es heterocíclico unido a un compuesto descrito por la fórmula II, tales como los ejemplos 47, 49, 56 y 59. Los procedimientos para elaborar estos compuestos se han descrito anteriormente. Una vez hechos con los procedimientos descritos, el experto en la técnica sabrá cómo elaborar cualquiera de los sustituyentes de las triazinas y colocarlos en cualquier compuesto y en cualquier posición en las pirimidinas, como se muestra en las Fórmulas II, III y IV. Estos restos y descripciones específicas también se proporcionan en la tabla siguiente, en la que cada grupo, Z, X y R₂ y R₃ se describe como capaz de poder utilizarse en cualquier otra posición, usando los procedimientos descritos en el presente documento.

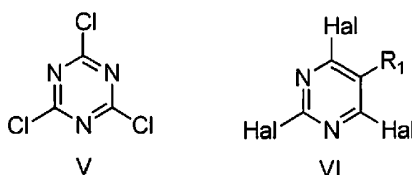
45 Por lo tanto, los inventores describen y proporcionan específicamente ejemplos en los que: X es -alquilo C₁-C₆, fenilo, arilalquilo y heterocicloalquilo, y N-bisalquilo. Los anillos arilo y heterocíclicos pueden estar sustituidos con de uno a cinco sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en hidrógeno, halo, CN, OCH₂CH=CHCl, alquilo C₁-C₆ (halo opcional, -OH, -CN), alcoxi C₁-C₆ (halo opcional, -OH, -CN) y tialquilo C₁-C₆ (halo opcional, -OH, -CN). Y

es CR₁ o N. Z es arilo, fenilo o heterocíclico. Los anillos arilo y heterocíclicos pueden estar sustituidos con de uno a cinco sustituyentes independientes seleccionados de los anteriores. R₁ es H, halo y alquilo C₁-C₄ (halo opcional). R₂ y R₃ representan independientemente H, alquilo C₁-C₆ arilo y heterocíclico. Los sustituyentes alquilo pueden estar sustituidos con de uno a cinco halos. Los anillos arilo y heterocíclicos pueden estar sustituidos con de uno a cinco sustituyentes independientes seleccionados del grupo anterior. Específicamente, los inventores identifican lo siguiente: Un compuesto en el que Z es un anillo arilo sustituido. Un compuesto en el que X es un anillo arilo o piridilo sustituido. Un compuesto en el que R₂ es H y R₃ es un anillo de arilo sustituido. Un compuesto en el que X es un anillo arilo o piridilo sustituido. Un compuesto en el que R₂ es H y R₃ es un anillo de arilo sustituido. Un compuesto en el que los sustituyentes del anillo heteroaromático de fórmula (I) tienen las posiciones mostradas en las Fórmula II, III, y IV mostradas anteriormente. Un compuesto en el que Z es un anillo fenilo sustituido. Un compuesto en el que X es un anillo fenilo o piridilo sustituido. Un compuesto en el que R₂ es H y R₃ es un anillo de arilo sustituido. Un compuesto en el que Y es N y X es un anillo fenilo o piridilo sustituido. Un compuesto en el que R₂ es H y R₃ es un anillo de arilo sustituido. Un compuesto en el que Y es N. Un compuesto en el que Y es N y Z es un anillo fenilo sustituido. Un compuesto en el que R₂ es H y R₃ es un anillo de arilo sustituido. Un compuesto en el que R₂ es un anillo arilo sustituido y H es R₃. Un compuesto en el que X es un anillo fenilo o piridilo sustituido y R₂ es H y R₃ es un anillo arilo sustituido. Un compuesto en el que X es un anillo fenilo o piridilo sustituido y R₂ es un anillo arilo sustituido y R₃ es H. Un compuesto en el que X es un anillo fenilo o piridilo sustituido. Un compuesto en el que Z es un anillo fenilo sustituido, R₂ es H y R₃ es un anillo fenilo sustituido. Un compuesto en el que Z es un anillo fenilo sustituido con otro-halo. Un compuesto en el que R₂ o R₃ es un anillo arilo sustituido con para-haloalcoxi. Cualquiera de estas variables y combinaciones se pueden hacer con otras variables o combinaciones para proporcionar diversos ámbitos o tamaños de grupos de compuestos reivindicados.

Una composición para controlar insectos, que comprende cualquiera de los compuestos descritos en el presente documento y un vehículo fitológicamente aceptable.

Un proceso para la preparación de un compuesto de fórmula (I) que comprende:

(a) poner en contacto cloruro cianúrico (fórmula V), una 2,4,6-tricloropirimidina (fórmula VI) o 2,4,6-triazolopirimidina (fórmula VI) en la que Hal es independientemente Cl o F.



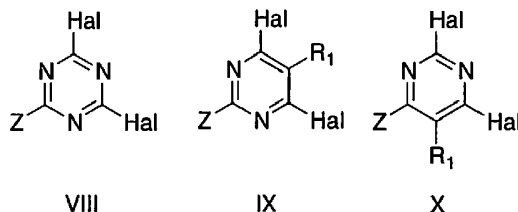
con un compuesto organometálico mostrado en la

fórmula VII Z-M

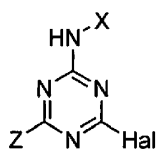
en la que:

M= Li, Mg, B, Zn

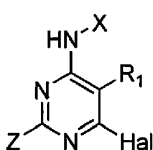
en un disolvente aprótico polar para proporcionar triazinas y pirimidinas sustituidas con arilo y heterocíclico de las fórmulas VIII-X.



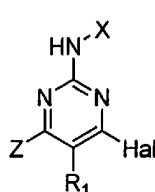
(b) poner en contacto un compuesto de las fórmulas VIII, IX, X con un nucleófilo amino primario (X-NH₂) en un disolvente aprótico polar en presencia de una base, para proporcionar un compuesto de las fórmulas XI, XV, XIII, XII;



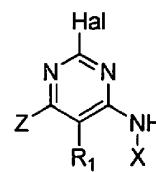
XI



XV

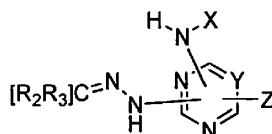


XIII



XII

- (c) poner en contacto los compuestos de las fórmulas XI, XV, XIII, XII con hidrazina en un disolvente aprótico polar, para proporcionar compuestos de hidrazina que se añaden después a compuestos ceto para elaborar compuestos de fórmula I, en la que Y es N o CR₁, como se ha descrito anteriormente.



Fórmula 1

- 10 Los compuestos siguientes se describen de forma individual o en cualquier combinación de más de uno, y agrupados con cualquier descripción genérica proporcionada en el presente documento, cuando los compuestos se seleccionan de:

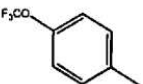
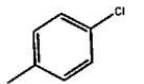
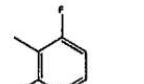
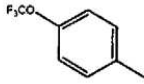
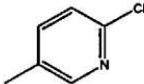
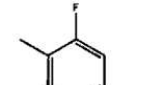
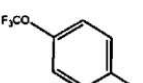
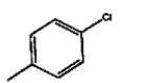
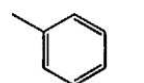
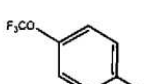
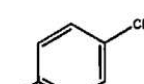
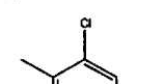
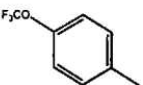
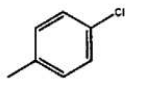
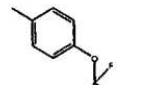
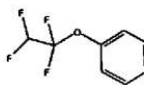
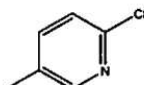
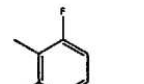
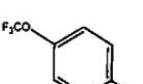
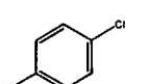
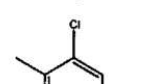
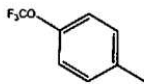
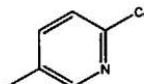
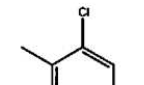
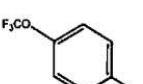
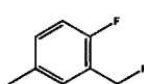
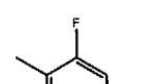
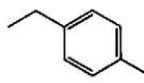
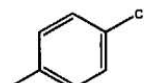
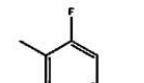
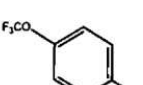
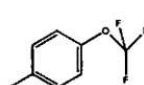
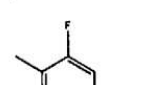
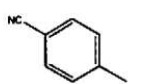
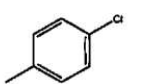
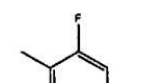
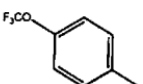
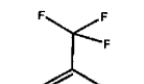
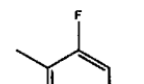
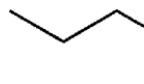
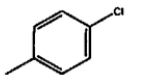
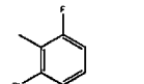
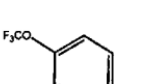
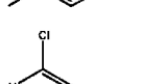
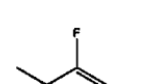
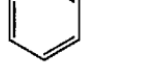
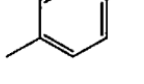
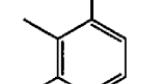

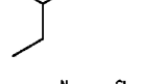
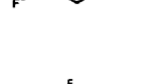
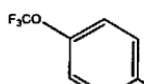
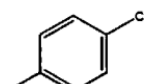
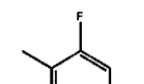
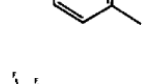
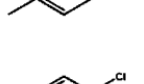
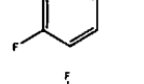
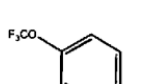
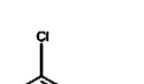
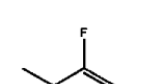
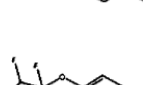
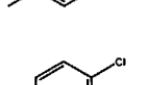
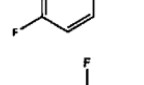
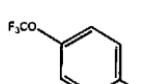
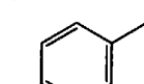
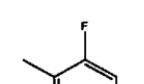
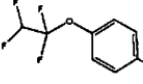
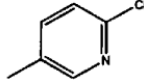
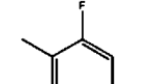


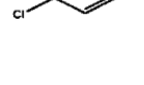
- 15 N-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina; N-(4-clorofenil)-4-fenil-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina; 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(4-clorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina; N-((6-cloropiridin-3-il)metil)-4-(2,6-difluorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina; N-(6-cloropiridin-3-il)-4-(2,6-difluorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina; N-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-6-(2-(4-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina; 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(4-clorofenil)-6-(2-(4-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina; 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(6-cloropiridin-3-il)-6-(2-(4-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina; 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(6-cloropiridin-3-il)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina; N-(6-cloropiridin-3-il)-4-(2,6-difluorofenil)-6-(2-(4-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina; N-(6-cloropiridin-3-il)-4-(2,6-diclorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina; 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(4-clorofenil)-6-(2-(4-etilbenciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina; 4-((2-(4-(2-cloro-6-fluorofenil)-6-((4-clorofenil)amino)-1,3,5-triazin-2-il)hidrazono)metil)benzonitrilo; 4-(2-butilidenehidrazinil)-6-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(4-clorofenil)-1,3,5-triazin-2-amina; 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(4-clorofenil)-6-(2-(2-feniletilidene)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina; 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(4-clorofenil)-6-(2-(1-(4-(trifluorometoxi)fenil)etiliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina; 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-((6-cloropiridin-3-il)metil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina; 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(p-tolil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina; 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(2-morfolinoetil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina; 2-(2-cloro-6-fluorofenil)-4-(2,2-dimetilhidrazinil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina; N-(3-cloro-4-fluorofenil)-4-(2-cloro-6-fluorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina; 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina; 4-(2-(4-(2-cloro-1,1,2-trifluoroetoxi)benciliden)hidrazinil)-6-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(6-cloropiridin-3-il)-1,3,5-triazin-2-amina; 4-(2-(4-(2-cloro-1,1,2-trifluoroetoxi)benciliden)hidrazinil)-6-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(4-clorofenil)-1,3,5-triazin-2-amina; 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(3,4-diclorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina; 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(3,5-diclorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina; 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(2-clorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina; N-(6-cloropiridin-3-il)-4-(2-fluorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina; 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-metil-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina; N-(4-clorofenil)-4-(2-fluorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina; N-(4-clorofenil)-2-fenil-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)pirimidin-4-amina; 4-(2-(2-cloro-6-fluorobenciliden)hidrazinil)-N-(4-clorofenil)-6-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1,3,5-triazin-2-amina; 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(6-cloropiridin-3-il)-6-(2-(4-(trifluorometil)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina; 6-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(4-clorofenil)-2-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)pirimidin-4-amina; 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(6-cloropiridin-3-il)-6-(2-(4-metilbenciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina; 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(6-cloropiridin-3-il)-6-(2-(4-metoxibenciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina; 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(6-cloropiridin-3-il)-6-(2-(3-fluoro-4-(trifluorometil)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina; N-((6-cloropiridin-3-il)metil)-6-fenil-2-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)pirimidin-4-amina; N-(4-clorofenil)-6-fenil-2-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)pirimidin-4-amina; N-(4-clorofenil)-4-fenil-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)pirimidin-2-amina; 6-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(6-cloropiridin-3-il)-2-(2-(4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(4-clorobencil)-6-(2-(4-

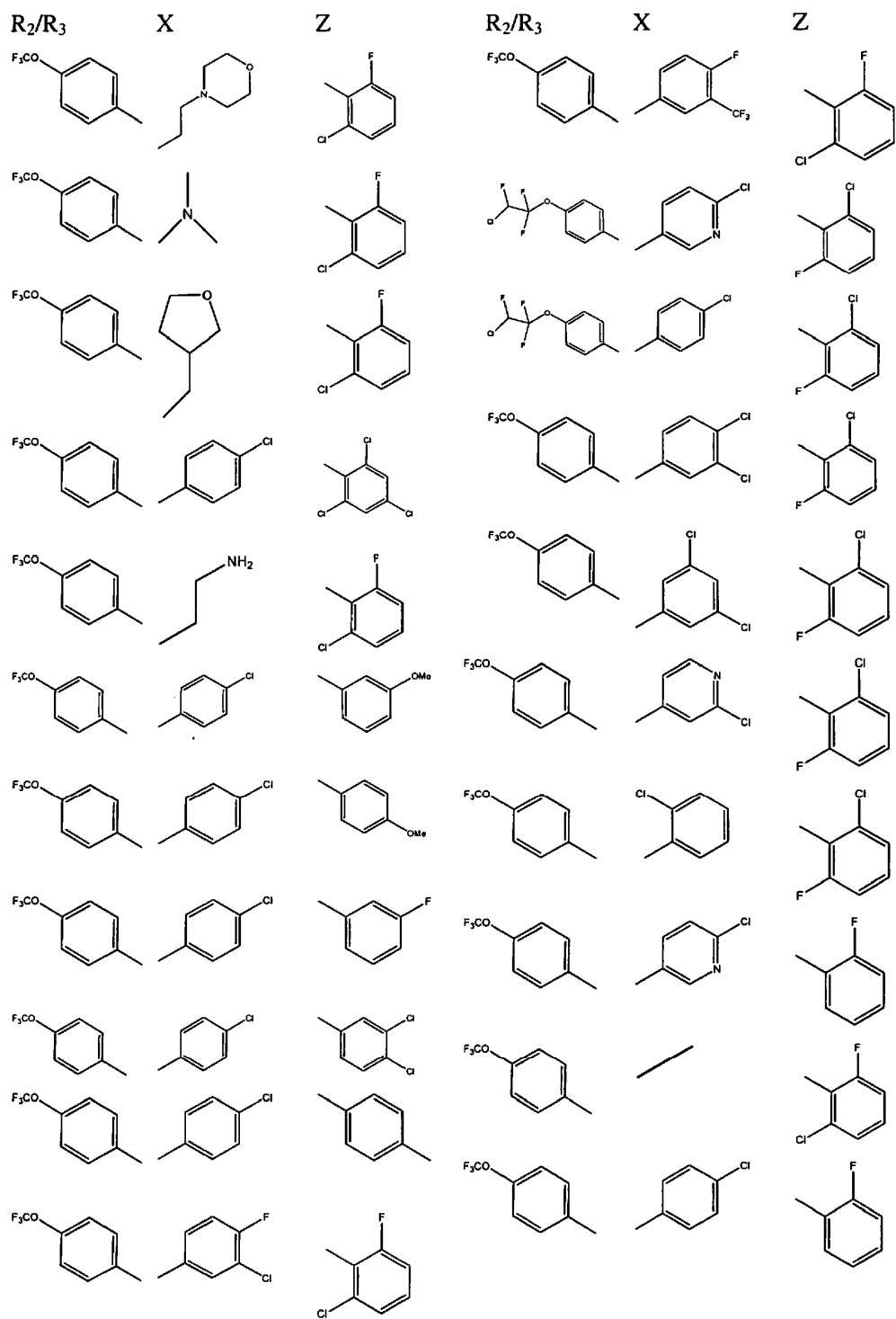
(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina;N-(4-clorobencil)-6-fenil-2-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)pirimidin-4-amina; N-(4-clorofenil)-4-(2,6-diclorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina; N-(4-clorofenil)-4-(3-fluorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina;N-(4-clorofenil)-4-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-6-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1,3,5-triazin-2-amina; 4-(2,6-difluorofenil)-N-(4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina; 4-(2,6-difluorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-N-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1,3,5-triazin-2-amina; 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(2-cloropiridin-4-il)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina; 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(5-cloropiridin-2-il)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina.

En el presente documento, en ocasiones se hará referencia a las variables R_1 , R_2 , R_3 , Z y X como "grupos colgantes". Los grupos colgantes son restos químicos unidos al resto de núcleo. En algún momento, los grupos colgantes están unidos al resto del núcleo en posiciones colgantes preferidas, como se muestra en las fórmulas XVI, II, III, y IV. En el presente documento se proporcionan tablas de diversos grupos colgantes, tanto específicos como genéricos, véanse las tablas 1, 2, 3, 4, 5, 6 y 7. En la tabla 7 se muestran los grupos colgantes reales a medida que se colocan en los ejemplos con datos. En la tabla 5 se muestran los grupos colgantes de los ejemplos con los datos y debe entenderse que cada grupo se puede utilizar en diferentes posiciones como diferentes sustituyentes en el resto del núcleo. En la tabla 6 se proporcionan ejemplos teóricos de compuestos que se pueden elaborar usando los procedimientos descritos en el presente documento y la capacidad de un experto ordinario en la técnica. Se espera que sean altamente activos. En la tabla 6 se muestran grupos colgantes en sus posiciones preferentes, pero que podrían usarse en combinación con cualquiera de los otros grupos colgantes de cualquiera de las tablas 1-5, en cualquier posición y, preferentemente, en las posiciones colgantes. Los compuestos de la invención se pueden elaborar con cualquier grupo colgante, colocado en cualquier posición de grupo colgante. Los solicitantes han descubierto que la actividad de estos compuestos aumenta si los grupos colgantes X y R_2 o R_3 tienen sustituyentes en la posición para. Además, los solicitantes han descubierto que las sustituciones en la posición del grupo colgante Z son más activas cuando el grupo Z tiene sustituyentes orto. Se pueden encontrar muchos ejemplos de esto, por ejemplo, los ejemplos 1, 4, 8-13 y otros. Sorprendentemente, los inventores también han encontrado que se pueden generar niveles altos de actividad en un compuesto cuando un "sustituyente en la posición para" como el del ejemplo r en la posición R_2/R_3 se mueve a la "posición Z" y el "sustituyente en posición orto" en la posición Z en el ejemplo r se mueve a la posición R_2/R_3 . Un ejemplo de este fenómeno de transferencia del resto de valor alto de actividad alta se puede encontrar en el ejemplo 48. Ambos ejemplos 4 y 48 tienen niveles "A" de actividad. El ejemplo 4 tiene un grupo colgante R_2/R_3 sustituido en la posición para y un grupo colgante Z sustituido en la posición orto. El ejemplo 4 es muy activo y, sin embargo, cuando se da a Z el sustituyente para-trifluorometoxifenilo y se da a R_2/R_3 el sustituyente orto dihalofenilo, como en el ejemplo 48, el ejemplo 48 también muestra niveles altos de actividad.

La siguiente tabla 5 se proporciona para describir adicionalmente los compuestos de la invención y para mostrar y dar a conocer la forma en que los sustituyentes Z, X y R_2 y R_3 pueden sustituirse por diversos grupos y uno por otro. Las variables se toman de los sustituyentes en los compuestos de la tabla 8. En la tabla 5 se muestran los sustituyentes de los compuestos mostrados en la tabla 8 en el mismo orden que los compuestos se presentan en la tabla 8.

TABLA 5

R₂/R₃	X	Z	R₂/R₃	X	Z
					
					
					
					
					
					
					
					
					
					
					
					



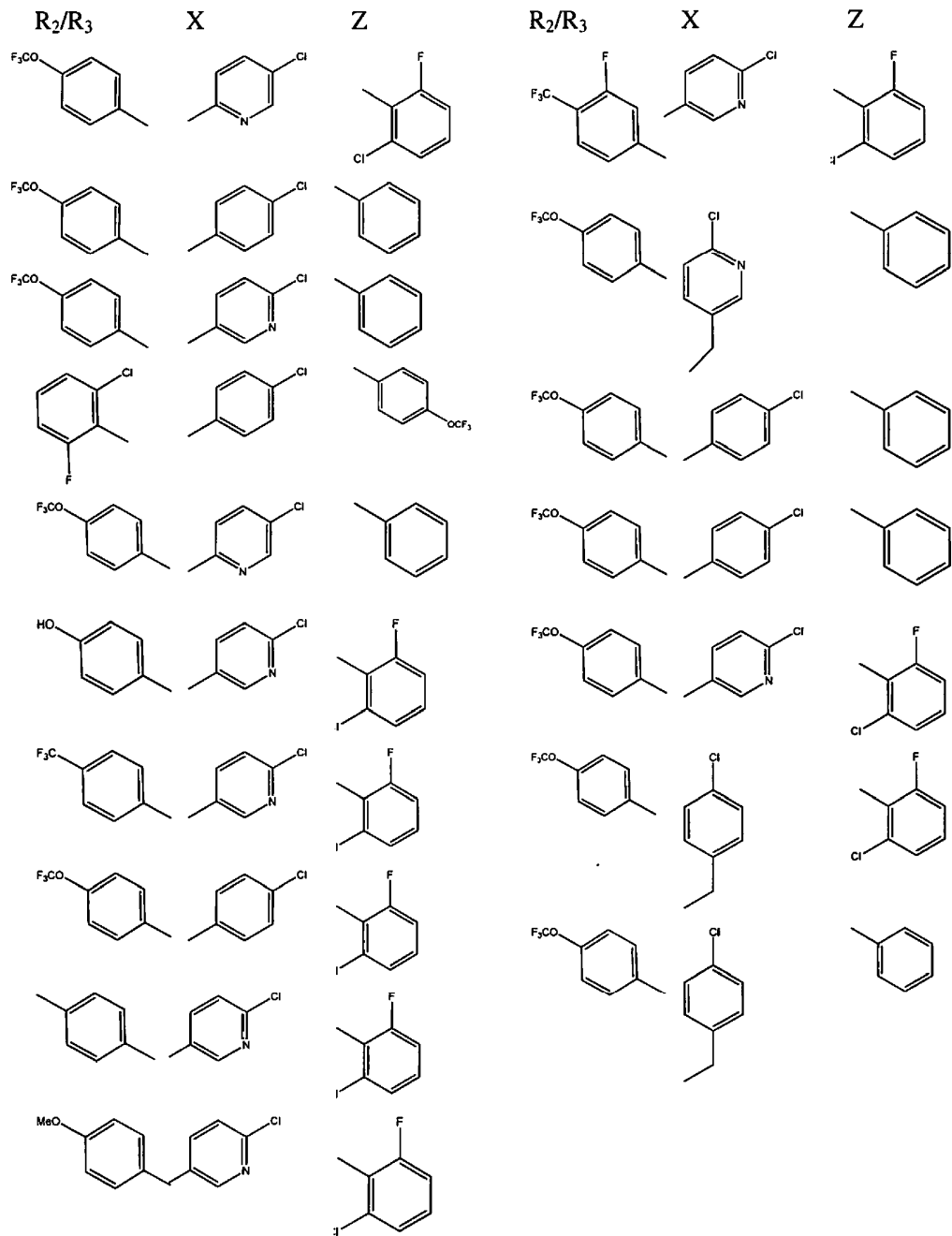
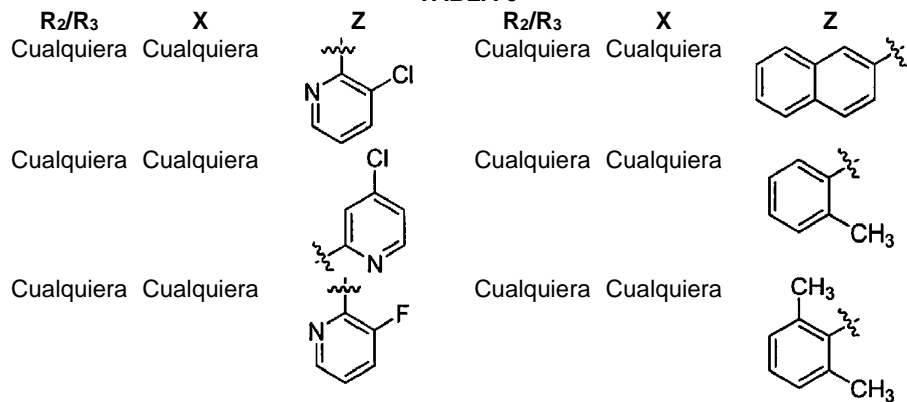
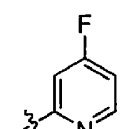
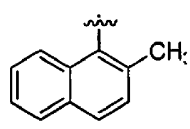
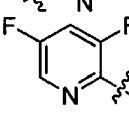
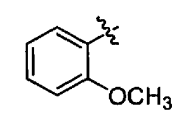
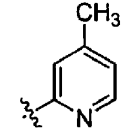
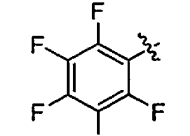
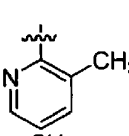
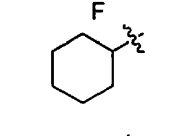
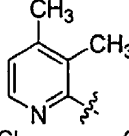
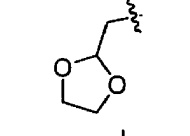
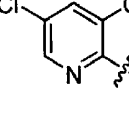
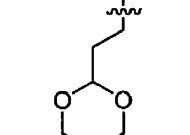
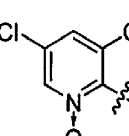
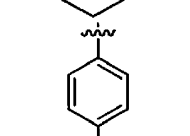
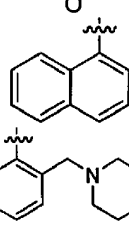
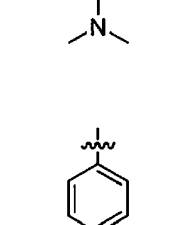

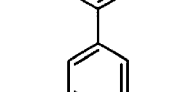
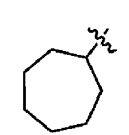
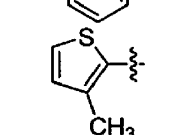
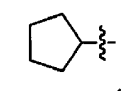
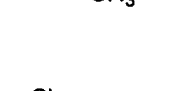
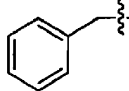
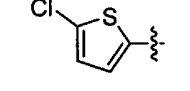
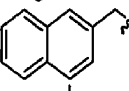
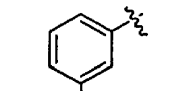
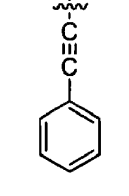
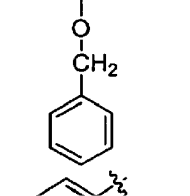


TABLA 6



Cualquiera	Cualquiera		Cualquiera	Cualquiera	
Cualquiera	Cualquiera		Cualquiera	Cualquiera	
Cualquiera	Cualquiera		Cualquiera	Cualquiera	
Cualquiera	Cualquiera		Cualquiera	Cualquiera	
Cualquiera	Cualquiera		Cualquiera	Cualquiera	
Cualquiera	Cualquiera		Cualquiera	Cualquiera	
Cualquiera	Cualquiera		Cualquiera	Cualquiera	
Cualquiera	Cualquiera		Cualquiera	Cualquiera	
Cualquiera	Cualquiera		Cualquiera	Cualquiera	
Cualquiera	Cualquiera		Cualquiera	Cualquiera	
Cualquiera	Cualquiera		Cualquiera	Cualquiera	
Cualquiera	Cualquiera		Cualquiera	Cualquiera	
Cualquiera	Cualquiera		Cualquiera	Cualquiera	
Cualquiera	Cualquiera		Cualquiera	Cualquiera	

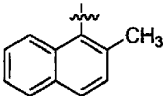

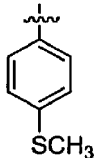
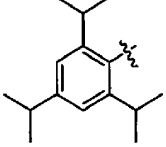
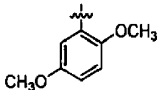
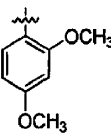
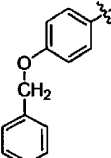

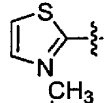
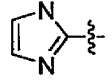
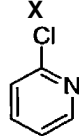
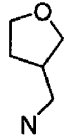
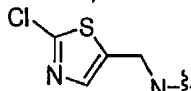
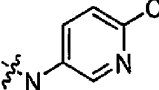
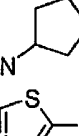
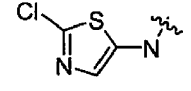
Cualquiera	Cualquiera			
Cualquiera	Cualquiera		Cualquiera	Cualquiera
Cualquiera	Cualquiera		Cualquiera	Cualquiera
Cualquiera	Cualquiera		Cualquiera	Cualquiera
				
				
				
			Cualquiera	Cualquiera
Cualquiera	Cualquiera		Cualquiera	Cualquiera
				
				

TABLA 7

R ₂ /R ₃	X	Z
Cualquiera		Cualquiera
Cualquiera		Cualquiera
Cualquiera		Cualquiera
Cualquiera		Cualquiera
Cualquiera		Cualquiera
Cualquiera		Cualquiera

Ejemplos

5 Con los ejemplos proporcionados en el presente documento se pretende ilustrar y no limitar la invención. Los datos de espectros de masa se obtuvieron utilizando espectroscopia de masas de cromatografía líquida (CL-EM). Las

masas son detectadas usando ionización por electropulverización (IEP) y se indican como iones molares (M+H, M-H).

5 El ejemplo 1 N-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)enciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina (1) se preparó usando el método 1A: etapas 1A.1, 2A.1 y 3A.1 para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 520,8, 521,2, 523,0 (M+H), 519,2, 537,0 (M-H).

10 El ejemplo 2 N-(4-clorofenil)-4-fenil-6-(2-(4-(trifluorometoxi)enciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina (2) se preparó usando el método 1A: etapas 1A0,3, 2A.1 y 3A.1 para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 484,9.487 (M+H), 483,0, 485,0 (M-H).

15 El ejemplo 3 N-(4-clorofenil)-4-(2-(4-(trifluorometoxi)enciliden)hidrazinil)-6-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1,3,5-triazin-2-amina (3) se preparó usando el método 1A: etapas 1A0,3, 2A.1 y 3A.1 para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 568,5, 570,8 (M+H), 567,0, 569,0 (M-H).

El ejemplo 4 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(4-clorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)enciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina (4) se preparó usando el método 1A: etapas 1A.2, 2A.2 y 3A.2 para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 537,1, 539,0, 541,0 (M+H), 535,1, 537,0 (M-H).

20 El ejemplo 5 4-(2,6-difluorofenil)-N-(4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)enciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina (5) se preparó usando el método 1A: etapas 1A.1, 2A.1 y 3A.1 para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 572,6 (M+H), 571,1 (M-H).

25 El ejemplo 6 4-(2,6-difluorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)enciliden)hidrazinil)-N-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1,3,5-triazin-2-amina (6) se preparó usando el método 1A: etapas 1A.1, 2A.1 y 3A.1 para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 570,5 (M+H), 569,0 (M-H).

El ejemplo 7 4-(2,6-difluorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)enciliden)hidrazinil)-N-(3-(trifluorometil)fenil)-1,3,5-triazin-2-amina (7) se preparó usando el método 1A: etapas 1A.1, 2A.1 y 3A.1 para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 554,5 (M+H), 553 (M-H).

30 El ejemplo 8 N-((6-cloropiridin-3-il)metil)-4-(2,6-difluorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)enciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina (8) se preparó usando el método 1A: etapas 1A.1, 2A.1 y 3A.1 para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 535,6, 537,8 (M+H), 534,0, 536,0 (M-H).

35 El ejemplo 9 N-((6-cloropiridin-3-il)-4-(2,6-difluorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)enciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina (9) se preparó usando el método 1A: etapas 1A.1, 2A.1 y 3A.1 para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 521,5, 523,7 (M+H), 520,0, 521,9 (M-H).

40 El ejemplo 10 N-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-6-(2-(4-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)enciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina (10) se preparó usando el método 1A: etapas 1A.1, 2A.1 y 3A.1 para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 553,1, 554,9 (M+H), 551,1, 553,1 (M-H).

45 El ejemplo 11 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(4-clorofenil)-6-(2-(4-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)enciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina (11) se preparó usando el método 1A: etapas 1A0,2, 2A0,2 y 3A.1 para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 569,1, 571,1, 573,1 (M+H), 567,1, 569,1 (M-H).

El ejemplo 12 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(6-cloropiridin)-6-(2-(4-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)enciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina (12) se preparó usando el método 1A: etapas 1A0,2, 2A.1 y 3A.1 para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 570,1, 572 (M+H), 568,1, 570 (M-H).

50 El ejemplo 13 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(6-cloropiridin-3-il)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)enciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina (13) se preparó usando el método 1A: etapas 1A0,2, 2A.1 y 3A.1 para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 538, 539,8 (M+H), 536,1, 538 (M-H).

55 El ejemplo 14 N-(4-clorofenil)-4-(2,6-diclorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)enciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina (14) se preparó usando el método 1A: etapas 1A0,2, 2A.1 y 3A.1 para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 553, 555, 556,9 (M+H), 551, 553,1, 555,1 (M-H).

60 El ejemplo 15 N-((6-cloropiridin-3-il)-4-(2,6-difluorofenil)-6-(2-(4-(1,1,2,2-tetrafluorometoxi)enciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina (15) se preparó usando el método 1A: etapas 1A0,2, 2A.1 y 3A.1 para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 554.556,1, 558,1 (M+H), 552.554,2.556,2 (M-H).

65 El ejemplo 16 N-(6-cloropiridin-3-il)-4-(2,6-diclorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)enciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina (16) se preparó usando el método 1A: etapas 1A.2, 2A.1 y 3A para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 554, 556,1, 558,1 (M+H), 552, 554,2, 556,2 (M-H).

El ejemplo 17 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(4-clorofenil)-6-(2-(4-(etilenciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina (17) se

- preparó usando el método 1A: etapas 1A.2, 2A.1 y 3A.1 para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 481,3, 483,3 (M+H), 479,30,4810,3 (M-H).
- 5 El ejemplo 18 4-((2-(4-(2-cloro-6-fluorofenil)-6-((4-clorofenil)amino)-1,3,5-triazin-2-il)hidrazono)metil)benzotrilo (18) se preparó usando el método 1A: etapas 1A.2, 2A.1 y 3A.1 para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 478,2, 480,1 (M+H), 476,20,478,2 (M-H).
- 10 El ejemplo 19 4-(2-butilidenedihidrazinil)-6-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(4-(clorofenil)-1,3,5-triazin-2-amina (19) se preparó usando el método 1A: etapas 1A.2, 2A.1 y 3A.1 para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 419,2, 421,2 (M+H), 417,3, 419,2 (M-H).
- 15 El ejemplo 20 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(4-clorofenil)-6-(2-(2-(feniletilidenedihidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina (20) se preparó usando el método 1A: etapas 1A.2, 2A.1 y 3A.1 para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 467,4, 469,4 (M+H).
- 20 El ejemplo 21 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(4-clorofenil)-6-(2-(1-(4-(trifluorometoxi)fenil)etilidenedihidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina (21) se preparó usando el método 1A: etapas 1A.2, 2A.1 y 3A.1 para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 551,3, 553,2 (M+H), 549,4, 551,4 (M-H).
- 25 El ejemplo 22 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-((6-cloropiridin-3-il)metil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)encilidenedihidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina (22) se preparó usando el método 1C: etapas 1A.2, 2C y 3C para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 552,3, 554,2 (M+H), 550,4, 552,4 (M-H).
- El ejemplo 23 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(p-tolil)-6-(2-(23-(trifluorometoxi)encilidenedihidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina (4) se preparó usando el método 1C: etapas 1A.2, 2C y 3C para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 517,3, 519,3 (M+H), 515,3, 517,6 (M-H).
- 30 El ejemplo 24 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(2-morfolinoetil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)encilidenedihidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina (4) se preparó usando el método 1C: etapas 1A.2, 2C y 3C para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 540,4, 542,4 (M+H), 538,5, 540,4 (M-H).
- 35 El ejemplo 25 2-(2-cloro-6-fluorofenil)-4-(2,2-dimetilhidrazinil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)encilidenedihidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina (25) se preparó usando el método 1C: etapas 1A.2, 2C y 3C para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 470,3, 472,3 (M+H), 468,40,4700,4 (M-H).
- 40 El ejemplo 26 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-((tetrahidrofuran-3-il)metil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)encilidenedihidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina (26) se preparó usando el método 1C: etapas 1A.2, 2C y 3C para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 511,3, 513,4 (M+H), 509,4, 511,4 (M-H).
- 45 El ejemplo 27 N-(4-clorofenil)-4-(2,4,6-triclorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)encilidenedihidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina (27) se preparó usando el método 1A: etapas 1A.2, 2A.1 y 3A.1 para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 586,9, 588,9, 590,8, 592,9 (M+H), 585,0, 587,0, 588,9, 591,0 (M-H).
- El ejemplo 28 N1-4-(2-cloro-6-fluorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)encilidenedihidrazinil)-1,3,5-triazin-2-il)etano-1,2-diamina (28) se preparó usando el método 1C: etapas 1A.2, 2C y 3C para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 470,20,4720,2 (M+H), 468,30,4700,3 (M-H).
- 50 El ejemplo 29 N-(4-clorofenil)-4-(3-metoxifenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)encilidenedihidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina (29) se preparó usando el método 1A: etapas 1A.3, 2A.1 y 3A.1 para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 515,5, 517,5 (M+H), 513,6, 515,5 (M-H).
- 55 El ejemplo 30 N-(4-clorofenil)-4-(4-metoxifenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)encilidenedihidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina (30) se preparó usando el método 1A: etapas 1A.3, 2A.1 y 3A.1 para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 515,4, 517,2 (M+H), 513,3, 515,3 (M-H).
- 60 El ejemplo 31 N-(4-clorofenil)-4-(3-fluorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)encilidenedihidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina (31) se preparó usando el método 1A: etapas 1A.3, 2A.1 y 3A.1 para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 503,4, 505,4 (M+H), 501,5 (M-H).
- 65 El ejemplo 32 N-(4-clorofenil)-4-(3,4-diclorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)encilidenedihidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina (32) se preparó usando el método 1A: etapas 1A.3, 2A.1 y 3A.1 para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 553,1, 555,1, 557,1 (M+H), 551,2, 553,2, 555,2 (M-H).
- El ejemplo 33 N-(4-clorofenil)-4-(p-tolil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)encilidenedihidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina (33) se preparó usando el método 1A: etapas 1A.3, 2A.1 y 3A.1 para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 499,4, 501,2 (M+H), 497,2, 499,2 (M-H).

- 5 El ejemplo 34 N-(3-cloro-4-fluorofenil)-4-(2-cloro-6-fluorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina (34) se preparó usando el método 1A: etapas 1A.2, 2A.1 y 3A.1 para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 555,1, 557,1 (M+H), 553,2, 555,1 (M-H).
- 10 El ejemplo 35 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina (35) se preparó usando el método 1A: etapas 1A.2, 2A.1 y 3A.1 para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 589,2, 591,1 (M+H), 587,2, 589,2 (M-H).
- 15 El ejemplo 36 4-(2-(4-(2-cloro-1,1,2-trifluoroetoxi)benciliden)hidrazinil)-6-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(6-cloropiridin-3-il)-1,3,5-triazin-2-amina (36) se preparó usando el método 1A: etapas 1A.2, 2A.1 y 3A.1 para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 586,0, 587,9, 589,9 (M+H), 584,0, 586,0, 588,0 (M-H).
- 20 El ejemplo 37 4-(2-(4-(2-cloro-1,1,2-trifluoroetoxi)benciliden)hidrazinil)-6-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(4-clorofenil)-1,3,5-triazin-2-amina (37) se preparó usando el método 1A: etapas 1A.2, 2A.1 y 3A.1 para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 585,0, 587,0, 589,0 (M+H), 583,1, 585,1, 587,1 (M-H).
- 25 El ejemplo 38 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(3,4-diclorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina (38) se preparó usando el método 1A: etapas 1A.2, 2A.1 y 3A.1 para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 570,9, 572,9, 574,8 (M+H), 569,0, 571,0, 573,0 (M-H).
- 30 El ejemplo 39 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(3,5-diclorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina (39) se preparó usando el método 1A: etapas 1A.2, 2A.1 y 3A.1 para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 571,0, 573,0, 574,9 (M+H), 569,1, 571,1, 573,0 (M-H).
- 35 El ejemplo 40 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(2-cloropiridin-4-il)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina (40) se preparó usando el método 1A: etapas 1A.2, 2A.1 y 3A.1 para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 538,1, 540,0, 542,0 (M+H), 536,1, 538,1 (M-H).
- 40 El ejemplo 41 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(4-clorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina (41) se preparó usando el método 1A: etapas 1A.2, 2A.1 y 3A.1 para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 537,1, 539,1 (M+H), 535,1, 537,1 (M-H).
- 45 El ejemplo 42 N-(6-cloropiridin-3-il)-4-(2-fluorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina (42) se preparó usando el método 1A: etapas 1A.0, 2A.1 y 3A.1 para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 503,9, 505,9 (M+H), 5502,0, 504,0 (M-H).
- 50 El ejemplo 43 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-metil-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina (43) se preparó usando el método 1A: etapas 1A.3, 2A.1 y 3A.1 para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 440,6, 443,0 (M+H), 439,0, 441,0 (M-H).
- 55 El ejemplo 44 N-(4-clorofenil)-4-(2-fluorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina (44) se preparó usando el método 1A: etapas 1A.0, 2A.1 y 3A.1 para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 503,0, 504,9 (M+H), 501,1, 503,1 (M-H).
- 60 El ejemplo 45 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(5-cloropiridin-2-il)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina (45) se preparó usando el método 1A: etapas 1A.2, 2A.3 y 3A.1 para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 537,862, 539,879 (M+H).
- 65 El ejemplo 46 N-(4-clorofenil)-2-fenil-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)pirimidin-4-amina (46) se preparó usando el método 4: etapas 2C y 3C para obtener la pirimidina como un sólido amorfo. IEP/EM 483,60, 4850,9 (M+H), 482,0, 484,0 (M-H).
- El ejemplo 47 N-(6-cloropiridin-3-il)-6-fenil-2-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)pirimidin-4-amina (47) se preparó usando el método 2: etapas 1A.3, 2A.1 y 3A para obtener la pirimidina como un sólido amorfo. IEP/EM 485,2, 487,2 (M+H), 483,00, 4850,0 (M-H).
- El ejemplo 48 4-(2-(2-cloro-6-fluorobenciliden)hidrazinil)-N-(4-(clorofenil)-6-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1,3,5-triazin-2-amina (48) se preparó usando el método 1A: etapas 1A.3, 2A.1 y 3A.1 para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 537,0, 539,0 (M+H), 535,0, 537,0 (M-H).
- El ejemplo 49 N-(5-cloropiridin-2-il)-6-fenil-2-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)pirimidin-4-amina (49) se preparó usando el método 2: etapas 1A.3, 2A.1 y 3A para obtener la pirimidina como un sólido amorfo. IEP/EM 485,1, 486,9 (M+H), 483,1, 485,1 (M-H).
- El ejemplo 50 4-((2-(4-(2-cloro-6-fluorofenil)-6-((6-cloropiridin-3-il)amino)-1,3,5-triazin-2-il)hidrazono)metil)fenol (50)

se preparó usando el método 1A: etapas 1A0,2, 2A.1 y 3A.1 para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 470,2, 472,0 (M+H), 468,1, 470,1 (M-H).

5 El ejemplo 51 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(6-cloropiridin-3-il)-6-(2-(4-(trifluorometil)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina (51) se preparó usando el método 1A: etapas 1A.2, 2A.1 y 3A.1 para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 522,1, 524,1 (M+H), 520,1, 522,1 (M-H).

10 El ejemplo 52 6-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(4-clorofenil)-2-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)pirimidin-4-amina (52) se preparó usando el método 2: etapas 1A.2, 2A.1 y 3A para obtener la pirimidina como un sólido amorfo. IEP/EM 536,1, 538,1 (M+H), 534,1, 536,1 (M-H).

15 El ejemplo 53 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(6-cloropiridin-3-il)-6-(2-(4-metilbenciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina (53) se preparó usando el método 1A: etapas 1A.2, 2A.1 y 3A.1 para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 468,1, 470,1 (M+H), 466,1, 468,1 (M-H).

El ejemplo 54 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(6-cloropiridin-3-il)-6-(2-(4-metoxibenciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina (54) se preparó usando el método 1A: etapas 1A.2, 2A.1 y 3A.1 para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 484,00,486,0 (M+H), 482,1, 484,1 (M-H).

20 El ejemplo 55 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(6-cloropiridin-3-il)-6-(2-(3-fluoro-4-(trifluorometil)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina (55) se preparó usando el método 1A: etapas 1A.2, 2A.1 y 3A.1 para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 540,0, 542,0 (M+H), 538,0, 540,0 (M-H).

25 El ejemplo 56 N-(6-cloropiridin-3-il)metil-6-fenil-2-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)pirimidin-4-amina (56) se preparó usando el método 2: etapas 1A.3, 2A.1 y 3A para obtener la pirimidina como un sólido amorfo. IEP/EM 499,0, 501,0 (M+H), 497,1, 499,1 (M-H).

30 El ejemplo 57 N-(4-clorofenil)-6-fenil-2-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)pirimidin-4-amina (57) se preparó usando el método 2: etapas 1A.3, 2A.2 y 3A para obtener la pirimidina como un sólido amorfo. IEP/EM 483,966, 486,030 (M+H).

35 El ejemplo 58 N-(4-clorofenil)-4-fenil-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)pirimidin-2-amina (58) se preparó usando el método 3: etapas 1A.3, 2B y 3B para obtener la pirimidina como un sólido amorfo. IEP/EM 483,9728, 485,9988 (M+H).

El ejemplo 59 6-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(6-cloropiridin-3-il)-2-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)pirimidin-4-amina (59) se preparó usando el método 2: etapas 1A0,2, 2A0,1 y 3A para obtener la pirimidina como un sólido amorfo. IEP/EM 537,0, 538,9 (M+H), 535,1, 537,0 (M-H).

40 El ejemplo 60 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(4-clorobencil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina (60) se preparó usando el método 1A: etapas 1A.2, 2A.1 y 3A.1 para obtener la triazina como un sólido amorfo. IEP/EM 551,3, 553,3 (M+H), 549,2, 551,2 (M-H).

45 El ejemplo 61 N-(4-clorobencil)-6-fenil-2-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)pirimidin-4-amina (61) se preparó usando el método 2: etapas 1A.3, 2A0,1 y 3A para obtener la pirimidina como un sólido amorfo. IEP/EM 498,3, 500,1 (M+H), 496,3, 498,3 (M-H).

Ensayos de insecticidas

50 Los compuestos identificados en la tabla 8 se prepararon de acuerdo con los métodos anteriores y se analizaron contra el gusano soldado de la remolacha y el gusano elotero del siguiente modo:

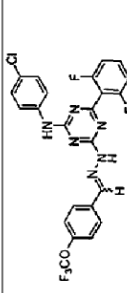
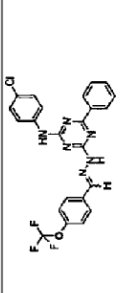
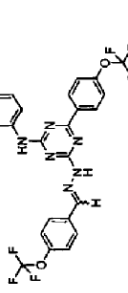
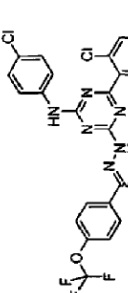
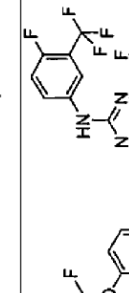
Ensayo de insecticida para el gusano soldado de la remolacha (*Spodoptera Exigua*).

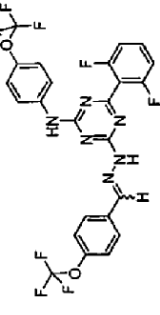
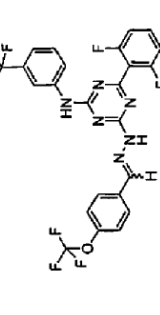
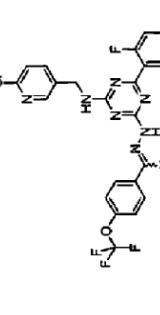
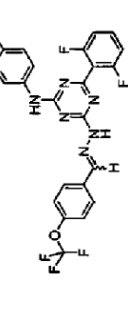
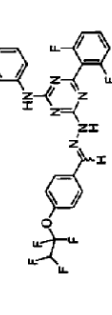
55 Para preparar la solución de ensayo, el compuesto de ensayo se formuló a 3499 ppm en solución como 5 mg del compuesto 5 mg / 1.429 ml de 9 partes de acetona: 1 parte de H₂O desionizada y se agitó en vórtex para homogeneizar. 50 µl de la solución de ensayo a 3.499 ppm (equivalente a 100 µg/cm² de dosis en la superficie de la dieta) se pipeteó sobre la superficie de 1 ml de dieta del gusano soldado de la remolacha de Southland Products Incorporated fría solidificada (201 Stuart Island Road Lake Village, Arkansas 71653) utilizando un Eppendorf Repeater Plus con una punta de pipeta de 1 ml. Todo el pipeteo de los tratamientos se realizó en una campana de Labconco. Se dejaron treinta minutos para la acetona se evaporara dejando una dosis de 100 µg/cm² sobre la superficie de la dieta artificial. Dos larvas del gusano soldado de la remolacha (*Spodoptera exigua*) en primer estadio de 24 horas se introdujeron en cada pocillo de las bandejas de 128 pocillos Bio-BA 128 Bioassay (CD International, Pitman, NJ, 08071, EE.UU.) usando un pincel de pelo de camello n.º 0. Las bandejas para bioensayo se dividieron en grupos de tratamiento de 8 con 16 duplicados por grupo de tratamiento (32 insectos por tratamiento). Las bandejas que contenían la dieta tratada y las larvas se cubrieron con una cubierta de Bio-CV-16 (CD International,

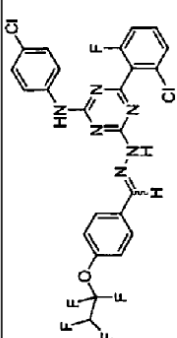
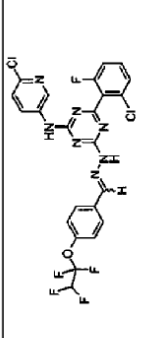
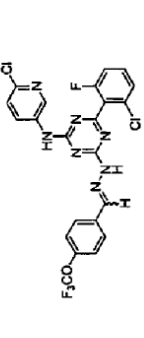
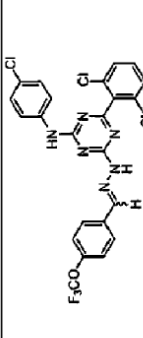
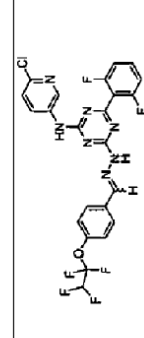
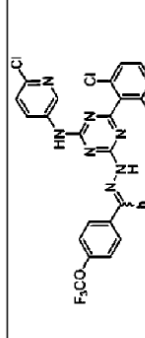
ES 2 587 232 T3

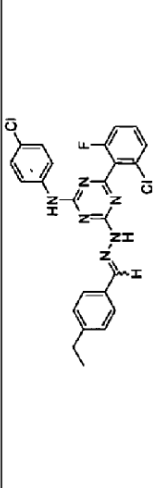
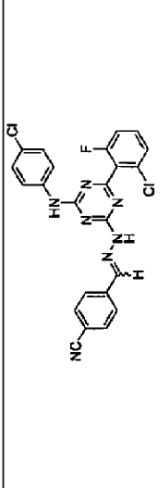
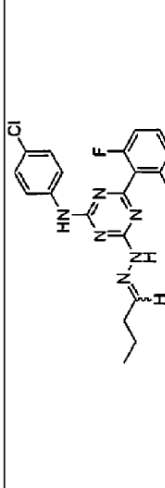
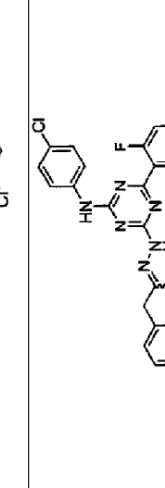
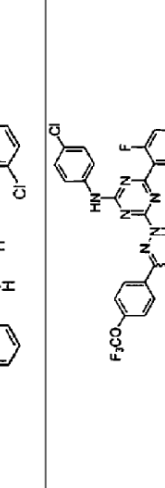
- Pitman, NJ, 08071, EE.UU.) y después se colocaron en una gradilla bajo luz fluorescentes a 27 °C, una humedad relativa (HR) del 20 % en la estancia y 16 h de luz: 8 h de oscuridad durante 96 horas. Las observaciones se realizaron 24, 48 y 96 horas después del tratamiento y la infestación. Se contó el número de insectos muertos de los 32 insectos en total por tratamiento y los resultados se dan en la tabla como un porcentaje de mortalidad a una dosis de 100 µg/cm². Una vez finalizado, la bandeja se movió al congelador a -5 °C y se dejó durante 24 horas para asegurar la mortalidad de los restantes *S. exigua*. Después de 24 horas, tirar la totalidad de la bandeja en el cubo para desechos.
- 5
- 10 Claves para la tabla: Mortalidad se refiere a la actividad contra el gusano soldado de la remolacha (*Spodoptera Exigua*) como se ha definido anteriormente a la concentración de 100 µg/cm² (A = 76-100 % de mortalidad, B = 51 - 75 % de mortalidad, C = 26 - 50 % de mortalidad y D = 0 - 25 % de mortalidad).

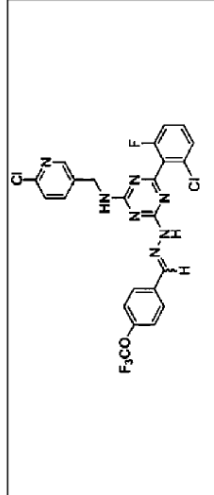
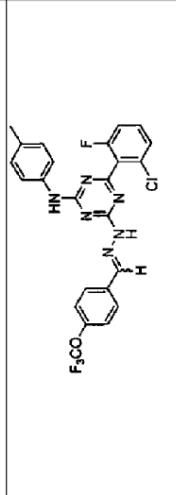
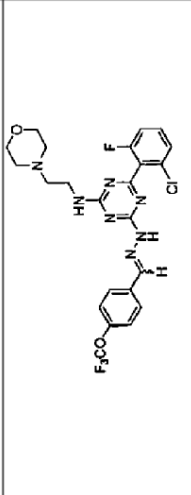
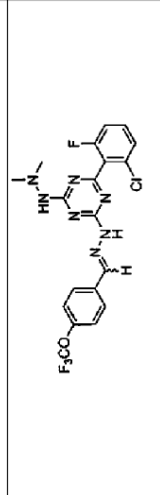
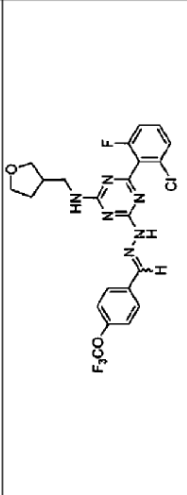
TABLA 8

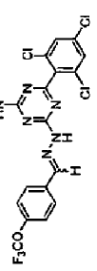
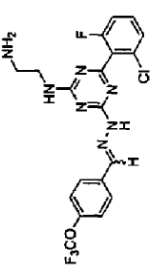
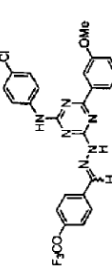
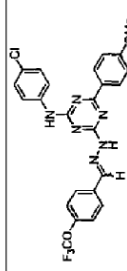
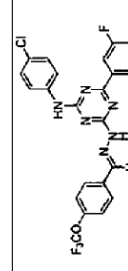
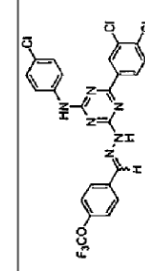
Ej.	Estructura	Aspecto	Mortalidad	Conc.	Nombre
1		Vidrio Espuma	A	100	N-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benzociliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina
2		Película	A	100	N-(4-clorofenil)-4-fenil-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benzociliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina
3		Sólido blanco	C	100	N-(4-clorofenil)-4-(2-(4-(trifluorometoxi)benzociliden)hidrazinil)-6-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1,3,5-triazin-2-amina
4		Sólido blanco	A	100	4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(4-clorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benzociliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina
5		Sólido Película Vidrio	C	100	4-(2,6-difluorofenil)-N-(4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benzociliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina

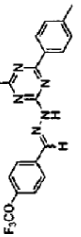
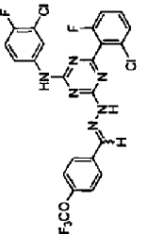
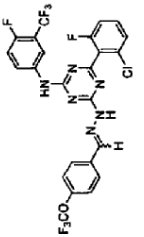
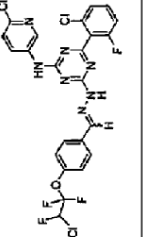
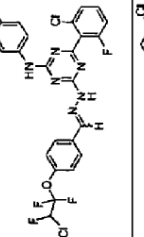
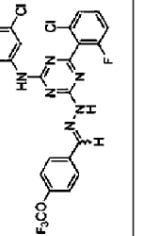
6		Sólido blanco	C	100	4-(2,6-difluorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1,3,5-triazin-2-amina)benziliden)hidrazinil)-N-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1,3,5-triazin-2-amina
7		Espuma Película	D	100	4-(2,6-difluorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1,3,5-triazin-2-amina)benziliden)hidrazinil)-N-(3-(trifluorometil)fenil)-1,3,5-triazin-2-amina
8		Película	A	100	N-((6-cloropiridin-3-il)metil)-4-(2,6-difluorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benziliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina
9		Sólido	A	100	N-(6-cloropiridin-3-il)-4-(2,6-difluorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benziliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina
10		Cristal	A	100	N-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-6-(2-(4-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)benziliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina


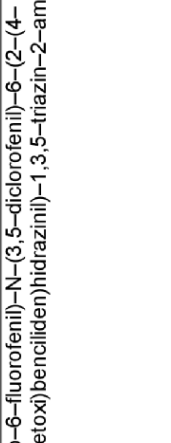



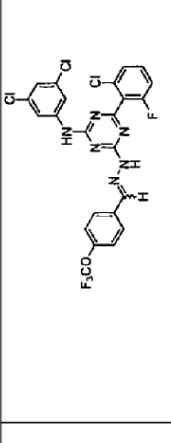
11		Película	A	100	4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(4-clorofenil)-6-(2-(4-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)encilideno)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina
12		Película	A	100	4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(6-cloropiridin-3-il)-6-(2-(4-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)encilideno)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina
13		Sólido Vidrio	A	100	4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(6-cloropiridin-3-il)-6-(2-(4-(trifluoroetoxi)encilideno)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina
14		Sólido	B	100	N-(4-clorofenil)-4-(2,6-diclorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)encilideno)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina
15		Espuma Sólido	A	100	N-(6-cloropiridin-3-il)-4-(2,6-difluorofenil)-6-(2-(4-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)encilideno)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina
16		Sólido amarillo	A	100	N-(6-cloropiridin-3-il)-4-(2,6-diclorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)encilideno)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina

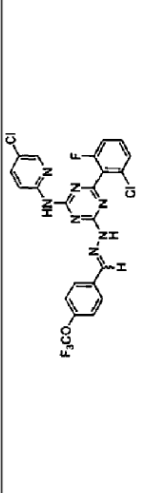
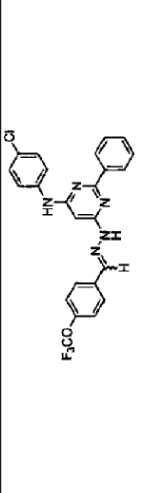
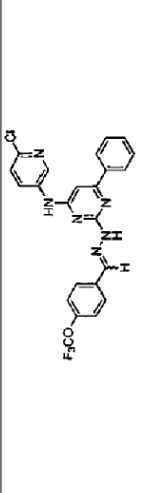
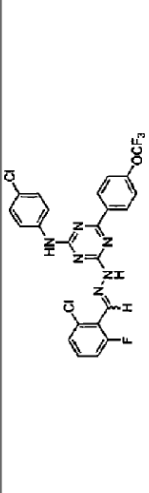
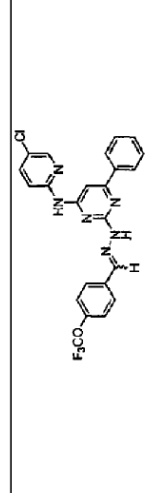
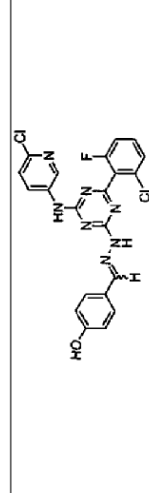
17		Vidrio	A	100	4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(4-clorofenil)-6-(2-(4-etilbenziliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina
18		Sólido blanco	A	100	4-((2-(4-(2-cloro-6-fluorofenil)-6-((4-clorofenil)amino)-1,3,5-triazin-2-ii)hidrazono)metil)benzocitrilo
19		Vidrio	A	100	4-(2-butilidenehidrazinil)-6-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(4-(clorofenil)-1,3,5-triazin-2-amina
20		Sólido amarillo	A	100	4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(4-clorofenil)-6-(2-(2-feniletiliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina
21		Vidrio	A	100	4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(4-clorofenil)-6-(2-(1-(4-(trifluorometoxi)fenil)etiliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina

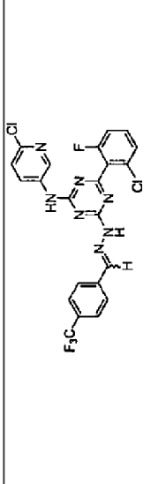
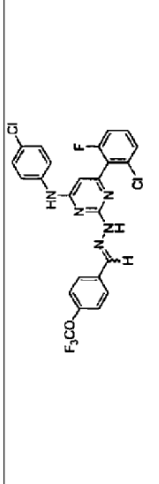
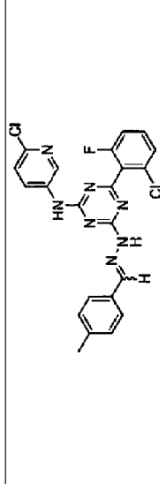
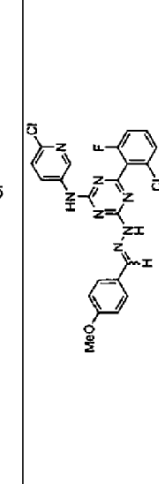
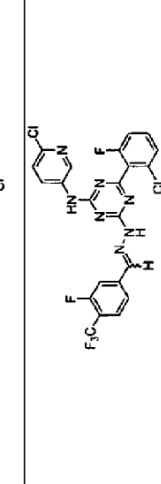
22		Sólido blanco	A	100	4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-((6-cloropiridin-3-il)metil)-6-(2-(4-trifluorometoxi)enciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina
23		Película	A	100	4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(p-tolil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)enciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina
24		Película	A	100	4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(2-morfolinoetil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)enciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina
25		Película	A	100	2-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(2,2-dimetilhidrazinil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)enciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina
26		Película	D	100	4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-((tetrahidrofuran-3-il)metil)-6-(2-(4-trifluorometoxi)enciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina

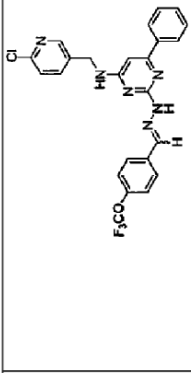
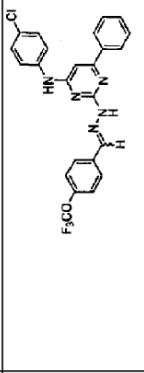
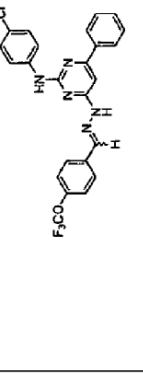
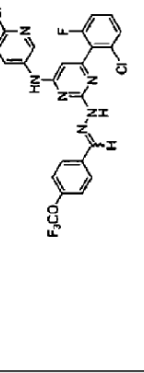
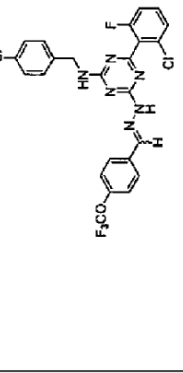
27		Sólido blanco	D	100	N-(4-clorofenil)-4-(2,4,6-triclorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benzilden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina
28		Sólido blanco	D	100	N1-(4-(2-cloro-6-fluorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benzilden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-il)etano-1,2-diamina
29		Sólido	D	100	N-(4-clorofenil)-4-(3-metoxifenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benzilden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina
30		Sólido tostado	D	100	N-(4-clorofenil)-4-(4-metoxifenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benzilden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina
31		Espuma	B	100	N-(4-clorofenil)-4-(3-fluorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benzilden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina
32		Sólido amarillo	D	100	N-(4-clorofenil)-4-(3,4-diclorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benzilden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina

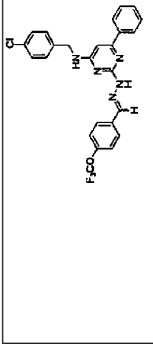
33		Sólido blanco	D	100	N-(4-clorofenil)-4-(p-tolil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benzileden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina
34		Vidrio	A	100	N-(3-cloro-4-fluorofenil)-4-(2-cloro-6-fluorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benzileden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina
35		Sólido blanco	A	100	4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benzileden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina
36		Vidrio	A	100	4-(2-(4-(2-cloro-1,1,2-trifluoroetoxi)benzileden)hidrazinil)-6-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(6-cloropiridin-3-il)-1,3,5-triazin-2-amina
37		Sólido blanco	A	100	4-(2-(4-(2-cloro-1,1,2-trifluoroetoxi)benzileden)hidrazinil)-6-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(4-clorofenil)-1,3,5-triazin-2-amina
38		Vidrio	A	100	4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(3,4-diclorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benzileden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina

39		Vidrio	A	100	4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(3,5-diclorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)enciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina
40		Sólido blanco	C	100	4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(2-cloropiridin-4-il)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)enciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina
41		Película	A	100	4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(2-clorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)enciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina
42		Película	A	100	N-(6-cloropiridin-3-il)-4-(2-fluorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)enciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina
43		Sólido blanco	A	100	4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-metil-6-(2-(4-(trifluorometoxi)enciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina
44		Película	A	100	N-(4-clorofenil)-4-(2-fluorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)enciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina

45		Sólido amarillo	C	100	4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(5-cloropiridin-2-il)-6-(2-(4-trifluoroetoxi)enciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina
46		Película	A	100	N-(4-clorofenil)-2-fenil-6-(2-(4-(trifluorometoxi)enciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-4-amina
47		Sólido blanquecino	D	100	N-(6-cloropiridin-3-il)-6-fenil-2-(2-(4-(trifluorometoxi)enciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-4-amina
48		Sólido blanco	A	100	4-(2-(2-cloro-6-fluorobenciliden)hidrazinil)-N-(4-clorofenil)-6-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1,3,5-triazin-2-amina
49		Sólido	D	100	N-(5-cloropiridin-2-il)-6-fenil-2-(2-(4-(trifluorometoxi)enciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-4-amina
50		Sólido blanco	D	100	4-((2-(4-(2-cloro-6-fluorofenil)-6-((6-cloropiridin-3-il)amino)-1,3,5-triazin-2-il)hidrazono)metil)fenol

51		Pellicula	A	100	4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(6-cloropiridinil-3-il)-6-(2-(4-(trifluorometil)benzileden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina
52		Vidrio	A	100	6-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(4-clorofenil)-2-(2-(4-(trifluorometoxi)benzileden)hidrazinil)pirimidin-4-amina
53		Pellicula	A	100	4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(6-cloropiridinil-3-il)-6-(2-(4-(metilbenzileden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina
54		Pellicula	A	100	4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(6-cloropiridinil-3-il)-6-(2-(4-(metoxibenzileden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina
55		Pellicula	A	100	4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(6-cloropiridinil-3-il)-6-(2-(4-(3-fluoro-4-(trifluorometil)benzileden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina

56		Película	A	100	N-((6-cloropiridin-3-il)metil)-6-fenil-2-(2-(4-(trifluorometoxi)bencliden)hidrazinil)pirimidin-4-amina
57		Sólido	A	100	N-(4-clorofenil)-6-fenil-2-(2-(4-(trifluorometoxi)bencliden)hidrazinil)pirimidin-4-amina
58		Sólido	A	100	N-(4-clorofenil)-4-fenil-6-(2-(4-(trifluorometoxi)bencliden)hidrazinil)pirimidin-2-amina
59		Sólido	A	100	6-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(6-cloropiridin-3-il)-2-(2-(4-(trifluorometoxi)bencliden)hidrazinil)pirimidin-4-amina
60		Vidrio	A	100	4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(4-clorobencil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)bencliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina

61	 <p>The chemical structure shows a central pyrimidine ring. At the 2-position, there is a hydrazinyl group (-NH-NH-) connected to a benzylidene group (-CH=CH-Ph). At the 4-position, there is another hydrazinyl group (-NH-NH-) connected to a benzylidene group (-CH=CH-Ph). At the 6-position, there is a benzyl group (-CH2-Ph). At the 4-position of the benzylidene group, there is a trifluoromethoxy group (-OCF3). At the 4-position of the other benzylidene group, there is a chlorine atom (-Cl).</p>	Película	A	100	N-(4-clorobencil)-6-fenil-2-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)pirimidin-4-amina
----	---	----------	---	-----	--

Utilidad del insecticida

Los compuestos de la invención son útiles para el control de invertebrados, incluyendo insectos. Por lo tanto, la presente invención también se refiere a un método para inhibir un insecto, que comprende aplicar una cantidad

5 inhibidora de insectos de un compuesto de fórmula (I) a un locus del insecto, al área que se va a proteger o directamente sobre el insecto que se desea controlar. Los compuestos de la invención también se pueden usar para controlar otras plagas de invertebrados, tales como ácaros y nematodos.

El "locus" de los insectos u otras plagas es un término usado en el presente documento para hacer referencia al

10 ambiente en el que los insectos u otras plagas viven o donde están presentes sus huevos, incluyendo el aire que los rodea, la comida que comen o los objetos con los que entran en contacto. Por ejemplo, los insectos que comen, dañan o contactan con plantas comestibles, de lujo, ornamentales, césped o pasto pueden controlarse mediante la aplicación de los compuestos activos a la semilla de la planta antes de la plantación, a la plántula, o el esqueje que se planta, hojas, tallos, frutos, granos y / o raíces, o al suelo u otro medio de crecimiento antes o después de plantar

15 el cultivo. La protección de estas plantas contra enfermedades producidas por virus, hongos o bacterias también puede conseguirse indirectamente mediante el control de plagas que se alimentan de savia, tales como la mosca blanca, saltamontes, áfidos y ácaro araña. Tales plantas incluyen las que se cultivan mediante abordajes convencionales y que están genéticamente modificadas usando biotecnología moderna para obtener rasgos de resistencia a insectos, resistencia a herbicidas, potenciación de la nutrición y / o cualquier otro rasgo beneficioso.

Se contempla que los compuestos también podrían ser útiles para proteger materiales textiles, papel, granos almacenados, semillas y otros productos alimenticios, casas y otros edificios que pueden ser ocupados por seres humanos y / o animales de compañía, de granja, de rancho, de zoo, u otros animales, aplicando un compuesto activo

20 en o cerca de tales objetos. Los animales domésticos, edificios o seres humanos podrían protegerse con los compuestos mediante el control de plagas de invertebrados y / o nematodos que son parásitos o son capaces de transmitir enfermedades infecciosas. Dichas plagas incluyen, por ejemplo, niguas, garrapatas, piojos, mosquitos, moscas, pulgas y gusanos del corazón. Las aplicaciones no agronómicas incluyen también el control de plagas de invertebrados en bosques, patios, a lo largo de los lados de la carretera y derechos de pasos para vías férreas.

término "inhibir un insecto" se refiere a una disminución del número de insectos vivos o una disminución del número de huevos de insectos viables. La extensión de la reducción conseguida por un compuesto depende, por supuesto, de la tasa de aplicación del compuesto, el compuesto en concreto usado y la especie de insecto objetivo. Se debe utilizar una cantidad inactivadora. La expresión "cantidad inactivadora de insectos" se utiliza para describir la

30 cantidad que es suficiente para causar una reducción mensurable en la población de insectos tratada. Generalmente se utiliza una cantidad en el intervalo de aproximadamente 1 a aproximadamente 3.500 ppm en peso de compuesto activo.

Por ejemplo, los insectos u otras plagas que pueden inhibirse incluyen

40 Los lepidópteros más preferentes: *Heliothis* spp., *Helicoverpa* spp., *Spodoptera* spp., *Mythimna unipuncta*, *Agrotis ipsilon*, *Earias* spp., *Euxoa auxiliaris*, *Trichoplusia ni*, *Anticarsia gemmatalis*, *Rachiplusia nu*, *Plutella xylostella*, *Chilo* spp., *Scirpophaga incertulas*, *Sesamia inferens*, *Cnaphalocrocis medinalis*, *Ostrinia nubilalis*, *Cydia pomonella*, *Carposina niponensis*, *Adoxophyes orana*, *Archips argyrospilus*, *Pandemis heparana*, *Epinotia aporema*, *Eupoecilia ambiguella*, *Lobesia botrana*, *Polychrosis viteana*, *Pectinophora gossypiella*, *Pieris rapae*, *Phyllonorycter* spp.,

45 *Leucoptera malifoliella*, *Phyllocnistis citrella*.

Coleópteros: *Diabrotica* spp., *Leptinotarsa decemlineata*, *Oulema oryzae*, *Anthonomus grandis*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Agriotes* spp., *Melanotus communis*, *Popillia japonica*, *Cyclocephala* spp., *Tribolium* spp.

50 Dípteros: *Liriomyza* spp., *Musca domestica*, *Aedes* spp., *Culex* spp., *Anopheles* spp., *Fannia* spp., *Stomoxys* spp., *Mayetiola destructor*.

Blatodeos (cucarachas): *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Periplaneta americana*, *Supella longipalpa*, *Periplaneta australasiae*, *Periplaneta brunnea*, *Parcoblatta pennsylvanica*, *Periplaneta fuliginosa*, *Pycnoscelus surinamensis*.

55 Himenópteros preferentes: *Iridomyrmex humilis*, *Solenopsis* spp., *Monomorium pharaonis*, *Atta* spp., *Pogonomyrmex* spp., *Camponotus* spp., *Monomorium* spp., *Tapinoma sessile*, *Tetramorium* spp., *Xylocopa* spp., *Vespula* spp., *Polistes* spp.

60 Isópteros--*Reticulitermes flavipes*, *Coptotermes formosanus*, *Reticulitermes virginicus*, *Heterotermes aureus*, *Reticulitermes hesperus*, *Coptotermes frenchii*, *Shedorchinotermes* spp., *Reticulitermes santonensis*, *Reticulitermes grassei*, *Reticulitermes banyulensis*, *Reticulitermes speratus*, *Reticulitermes hageni*, *Reticulitermes tibialis*, *Zootermopsis* spp., *Incisitermes* spp., *Marginitermes* spp., *Macrotermes* spp., *Microcerotermes* spp., *Microtermes* spp.

65

Ortópteros (saltamontes, grillos): *Melanoplus* spp., *Locusta migratoria*, *Schistocerca gregaria*, Gryllotalpidae (grillo cebollero).

5 También se identifican: Homópteros: *Aphis* spp., *Myzus persicae*, *Rhopalosiphum* spp., *Dysaphis plantaginea*, *Toxoptera* spp., *Macrosiphum euphorbiae*, *Aulacorthum solani*, *Sitobion avenae*, *Metopolophium dirhodum*, *Schizaphis graminum*, *Brachycolus noxius*, *Nephotettix* spp., *Nilaparvata lugens*, *Sogatella furcifera*, *Laodelphax striatellus*, *Bemisia tabaci*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Aleurodes proletella*, *Aleurothrixus floccosus*, *Quadraspidiotus perniciosus*, *Unaspis yanonensis*, *Ceroplastes rubens*, *Aonidiella aurantii*.

10 Hemípteros: *Lygus* spp., *Eurygaster maura*, *Nezara viridula*, *Piezodorus guildingi*, *Leptocorisa varicornis*, *Cimex lectularius*, *Cimex hemipterus*.

Tisanópteros--*Frankliniella* spp., *Thrips* spp., *Scirtothrips dorsalis*.

15 Mallophaga (piojos masticadores).

Anopluros (piojos succinadores)--*Pthirus pubis*, *Pediculus* spp.

20 Sifonápteros--*Ctenophalides* spp., *Pulex irritans*.

Ácaros: *Tetranychus* spp., *Panonychus* spp., *Eotetranychus carpini*, *Phyllocoptruta oleivora*, *Aculus pelekassi*, *Brevipalpus phoenicis*, *Boophilus* spp., *Dermacentor variabilis*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Amblyomma americanum*, *Ixodes* spp., *Notoedres cati*, *Sarcoptes scabiei*, *Dermatophagoides* spp.

25 Nematodos: *Dirofilaria immitis*, *Meloidogyne* spp., *Heterodera* spp., *Hoplolaimus columbus*, *Belonolaimus* spp., *Pratylenchus* spp., *Rotylenchus reniformis*, *Criconemella ornata*, *Ditylenchus* spp., *Aphelenchoides besseyi*, *Hirschmanniella* spp.

Composiciones

30 Los compuestos de la presente invención se aplican en forma de composiciones que son realizaciones importantes de la invención y que comprenden un compuesto de la presente invención y un vehículo inerte fitológicamente aceptable. El control de las plagas se logra mediante la aplicación de los compuestos de la invención en forma de aerosoles, tratamiento tópico, geles, revestimientos de semillas, microencapsulaciones, captación sistémica, cebos, marcadores auriculares, bolos, nebulizadores, aerosoles fumigantes, polvos y muchos otros. Las composiciones se son formulaciones sólidas o líquidas concentradas que se dispersan en agua para su aplicación, o son formulaciones en polvo o granulares que se aplican sin tratamiento adicional. Las composiciones se preparan de acuerdo con procedimientos y fórmulas que son convencionales en la técnica química agrícola, pero que son nuevas e importantes debido a la presencia en ellas de los compuestos de la presente invención. No obstante, se dará alguna descripción de la formulación de las composiciones, para asegurar que los químicos agrícolas pueden preparar fácilmente cualquier composición deseada.

45 Las dispersiones en las que se aplican los compuestos son las suspensiones o emulsiones acuosas más frecuentes preparadas a partir de formulaciones concentradas de los compuestos. Dichas formulaciones emulsionables o suspendibles en agua hidrosolubles son sólidos, conocidos normalmente como polvos humectables, o líquidos conocidos normalmente como concentrados emulsionables o suspensiones acuosas. Los polvos humectables, que se pueden compactar para formar gránulos dispersables en agua, comprenden una mezcla íntima del compuesto activo, un vehículo inerte y tensioactivos. La concentración del compuesto activo es normalmente de aproximadamente 10 % a aproximadamente 90 % en peso. El vehículo inerte se elige generalmente de entre las arcillas de atapulgita, las arcillas de montmorillonita, las tierras de diatomeas o los silicatos purificados. Los tensioactivos eficaces, que comprenden de aproximadamente 0,5 % a aproximadamente 10 % del polvo humectable, se encuentran entre las ligninas sulfonadas, los naftalenosulfonatos condensados, los naftalenosulfonatos, los alquilbencenosulfonatos, los sulfatos de alquilo y los tensioactivos no iónicos, tales como aductos de óxido de etileno de alquil fenoles.

55 Los concentrados emulsionables de los compuestos comprenden una concentración conveniente de un compuesto, tal como de aproximadamente 50 a aproximadamente 500 gramos por litro de líquido, equivalente a de aproximadamente 10 % a aproximadamente 50 %, disueltos en un vehículo inerte que es o bien un disolvente miscible en agua o una mezcla de disolvente orgánico no miscible en agua y emulsionantes. Los disolventes orgánicos útiles incluyen aromáticos, especialmente los xilenos, y las fracciones de petróleo, especialmente las porciones naftalénicas y olefínicas de alto punto de ebullición, tal como nafta aromática pesada. También se pueden usar otros disolventes orgánicos, tales como los disolventes terpénicos que incluyen derivados de colofonia, cetonas alifáticas, tales como ciclohexanona, y alcoholes complejos tales como 2-etoxietanol. Los emulsionantes adecuados para concentrados emulsionables se eligen de tensioactivos aniónicos y/o no iónicos convencionales, tales como los tratados anteriormente.

65

- Las suspensiones acuosas comprenden suspensiones de compuestos insolubles en agua de la presente invención, dispersados en un vehículo acuoso a una concentración en el intervalo de aproximadamente 5 % a aproximadamente 50 % en peso. Las suspensiones se preparan moliendo finamente el compuesto, y mezclándolo enérgicamente en un vehículo comprendido por agua y tensioactivos elegidos entre los mismos tipos tratados
- 5 anteriormente. También pueden añadirse ingredientes inertes, tales como sales inorgánicas y gomas sintéticas o naturales, para aumentar la densidad y la viscosidad del vehículo acuoso. A menudo es más eficaz triturar y mezclar el compuesto al mismo tiempo preparando la mezcla acuosa y homogeneizándola en un utensilio, tal como un molino de arena, molino de bolas u homogeneizador de tipo pistón.
- 10 Los compuestos también se pueden aplicar como composiciones granulares, que son particularmente útiles para aplicaciones en el suelo. Las composiciones granulares normalmente contienen de aproximadamente 0,5 % a aproximadamente 10 % en peso del compuesto, dispersadas en un vehículo inerte que consiste totalmente o en gran parte en arcilla o una sustancia barata similar. Tales composiciones se preparan normalmente disolviendo el compuesto en un disolvente adecuado y aplicándolo a un vehículo granular que se ha preformado hasta el tamaño
- 15 de partícula apropiado, en el intervalo de aproximadamente 0,5 a 3 mm. Tales composiciones también se pueden formular haciendo una masa o pasta del portador y el compuesto y triturando y secando para obtener el tamaño de partícula granular deseado.
- Los polvos que contienen los compuestos se preparan simplemente mezclando íntimamente el compuesto en forma de polvo con un vehículo agrícola en polvo adecuado, tal como arcilla de caolín, roca volcánica molida y similares. Los polvos pueden contener adecuadamente de aproximadamente 1 % a aproximadamente 10 % del compuesto.
- 20 Es igualmente práctico, cuando sea deseable por cualquier razón, aplicar el compuesto en forma de una solución en un disolvente orgánico apropiado, normalmente un aceite de petróleo suave, tal como los aceites de pulverización, que son ampliamente utilizados en la química agrícola.
- 25 Los insecticidas y acaricidas se aplican generalmente en forma de una dispersión del ingrediente activo en un vehículo líquido. Es convencional referirse a las tasas de aplicación en términos de la concentración del ingrediente activo en el vehículo. El vehículo más utilizado es agua.
- 30 Los compuestos de la invención también se pueden aplicar en forma de una composición en aerosol. En tales composiciones el compuesto activo se disuelve o se dispersa en un vehículo inerte, que es una mezcla de propelente que genera presión. La composición de aerosol se envasa en un recipiente desde el que se dispensa la mezcla a través de una válvula atomizadora. Las mezclas de propelentes comprenden halocarburos de punto de ebullición bajo, que pueden mezclarse con disolventes orgánicos o suspensiones acuosas presurizadas con gases inertes o hidrocarburos gaseosos.
- 35 La cantidad real de compuesto que se va a aplicar a los loci de los insectos y ácaros no es crucial y los expertos en la materia pueden determinarla fácilmente a la vista de los ejemplos anteriores. En general, cabe esperar que las concentraciones de 10 ppm a 5.000 ppm en peso del compuesto proporcionen un buen control. Con muchos de los compuestos, las concentraciones de 100 a 1.500 ppm serán suficientes.
- 40 El locus en el que se aplica un compuesto puede ser cualquier locus habitado por un insecto o ácaro, por ejemplo, cultivos vegetales, árboles frutales y nogales, viñas, plantas ornamentales, animales domésticos, las superficies interiores o exteriores de edificios, y el suelo alrededor de edificios.
- 45 Debido a la capacidad única de los huevos de insectos para resistir la acción tóxica, pueden ser deseables las aplicaciones repetidas para controlar larvas recién emergidas, como es el caso de otros insecticidas y acaricidas conocidos.
- 50 El movimiento sistémico de los compuestos de la invención en las plantas se puede utilizar para controlar las plagas en una porción de la planta mediante la aplicación de los compuestos a una parte diferente de la misma. Por ejemplo, el control de los insectos de alimentación foliar puede controlarse mediante riego por goteo o aplicación en surco, o tratando la semilla antes de la siembra. El tratamiento de las semillas se puede aplicar a todos los tipos de semillas, incluyendo aquellas a partir de las que las plantas que están transformadas genéticamente para expresar rasgos especializados germinarán. Los ejemplos representativos incluyen los que expresan proteínas tóxicas para plagas de invertibrados, tales como *Bacillus thuringiensis* u otras proteínas insecticidas, los que expresan resistencia a herbicidas, tales como semillas "Roundup Ready, RTM." o aquellos con genes extraños "apilados" genes que expresan proteínas insecticidas, resistencia a herbicidas, potenciación de la nutrición y / o cualquier otro rasgo beneficioso.
- 55 60 Se puede usar una composición de cebo insecticida que consiste en compuestos de la presente invención y atrayentes y / o estimulantes de la alimentación para aumentar la eficacia de los insecticidas contra plagas de insectos en un dispositivo tal como una trampa, una estación de cebo, y similares. La composición de cebo es, generalmente, una matriz de cebo sólida, semisólida (incluyendo un g el) o líquida, que incluye los estimulantes y uno o más insecticidas no microencapsulados o microencapsulados en una cantidad eficaz para actuar como
- 65

agentes de destrucción.

Los compuestos de la presente invención (fórmula I) se aplican a menudo junto con uno o más de otros insecticidas o fungicidas o herbicidas para obtener el control de una mayor diversidad de enfermedades producidas por plagas y malas hierbas. Cuando se usa junto con otros insecticidas o fungicidas o herbicidas, los compuestos reivindicados en el presente documento pueden formularse con los otros insecticidas o fungicidas o herbicidas, mezclarse en tanque con los otros insecticidas o fungicidas o herbicidas, o aplicarse secuencialmente con los otros insecticidas o fungicidas o herbicidas.

Algunos de los insecticidas que se pueden emplear beneficiosamente en combinación con los compuestos de la presente invención incluyen: insecticidas antibióticos tales como alosamidin y turingiensina; insecticidas de lactona macrocíclicos tales como espinosad, espinetoram, y otras espinosinas incluyendo las espinosinas 21-butenilo y sus derivados; insecticidas de avermectina tales como abamectina, doramectina, emamectina, eprinomectina, ivermectina y selamectina; insecticidas de milbemicina tales como lepimectina, milbemicina oxima y moxidectina; insecticidas arsenicales tales como arseniato de calcio, acetoarsenito de cobre, arseniato de cobre, arseniato de plomo, arsenito potásico y arsenito de sodio; insecticidas biológicos tales como *Bacillus popilliae*, *B. sphaericus*, *B. thuringiensis* subsp. *aizawai*, *B. thuringiensis* subsp. *kurstaki*, *B. thuringiensis* subsp. *tenebrionis*, *Beauveria bassiana*, virus de la granulosis por *Cydia pomonella*, NPV de la polilla del abeto Douglas, NPV de la polilla gitana, NPV de *Helicoverpa zea*, virus de la granulosis de la polilla de la harina india, *Metarhizium anisopliae*, *Nosema locustae*, *Paecilomyces fumosoroseus*, *P. lilacinus*, *Photorhabdus luminescens*, *Spodoptera Exigua* NPV, factor oostático modulador de la tripsina, *Xenorhabdus nematophilus*, y *X. bovienii*, insecticidas protectores incorporados en plantas tales como Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1A.105, Cry2Ab2, Cry3A, mir Cry3A, Cry3Bb1, Cry34, Cry35, y VIP3A; insecticidas botánicos tales como anabasina, azadirachtina, d-limoneno, nicotina, piretrinas, cinerinas, cinerina I, cinerina II, jasmolina I, jasmolina II, piretrina I, piretrina II, Cuassia, rotenona, ryania y sabadilla; insecticidas de carbamato tales como bendiocarb y carbarilo; insecticidas de metilcarbamato de benzofuranilo tales como benfuracarb, carbofurán, carbosulfán, decarbofurán y furathiocarb; insecticidas de dimetilcarbamato dimitán, dimetilán, hiquincarb y pirimicarb; insecticidas de carbamato de oxima tales como alanicarb, aldicarb, aldoxicarb, butocarboxim, butoxicarboxim, metomilo, nitrilacarb, oxamilo, tazimcarb, tiocarboxima, tiodicarb y tiofanox; insecticidas de metilcarbamato de metilo tales como alixicarb, aminocarb, bufencarb, butacarb, carbanolato, cloetocarb, dicresilo, dioxacarb, EMPC, etiofencarb, fenetacarb, fenobucarb, isoprocarb, metiocarb, metolcarb, mexacarbato, promacilo, promecarb, propoxur, trimetacarb, XMC y xililcarb; insecticidas de dinitrofenol tales como dinex, dinoprop, dinosam y DNOC; insecticidas de flúor tales como hexafluorosilicato de bario, criolita, fluoruro de sodio, hexafluorosilicato de sodio y sulfluramid; insecticidas de formamida tales como amitraz, clordimeform, formetanato y formparanato; insecticidas fumigantes tales como acrilonitrilo, disulfuro de carbono, tetracloruro de carbono, cloroformo, cloropicrina, para-diclorobenceno, 1,2-dicloropropano, formiato de etilo, dibromuro de etileno, dicloruro de etileno, óxido de etileno, cianuro de hidrógeno, yodometano, bromuro de metilo, metilcloroformo, cloruro de metileno, naftaleno, fosfina, fluoruro de sulfurilo y tetracloroetano; insecticidas inorgánicos tales como bórax, polisulfuro de calcio, oleato de cobre, cloruro mercurioso, tiocianato de potasio y tiocianato de sodio; inhibidores de la síntesis de quitina tales como bistriflurón, buprofezina, clorfluazurón, ciromazina, diflubenzurón, flucicloxurón, flufenoxurón, hexaflumurón, lufenurón, novalurón, noviflumurón, penflurón, teflubenzurón y triflumurón; miméticos de la hormona juvenil tales como epofenonano, fenoxicarb, hidropreno, kinopreno, metopreno, piriproxifeno y tripreno; hormonas juveniles tales como la hormona juvenil I, la hormona juvenil II y la hormona juvenil III; agonistas de la hormona de la muda tales como cromafenoazida, halofenoazida, metoxifenoazida y tebufenoazida; hormonas de la muda tales como alfa-ecdisona y ecdisterona; inhibidores de la muda tales como diofenolán; precocenos tales como precoceno I, precoceno II y precoceno III; reguladores del crecimiento de insectos sin clasificar, tales como diciclanilo; insecticidas análogos de nereistoxina tales como bensultap, cartap, tiociclam y tiosultap; insecticidas nicotinoides tales como flonicamid; insecticidas de nitroguanidina tales como clotianidina, dinotefurán, imidacloprid y tiametoxam; insecticidas de nitrometileno tales como nitenpiram y nitiazina; insecticidas de piridilmetilamina tales como acetamiprid, imidacloprid, nitenpiram y tiacloprid; insecticidas organoclorados tales como bromo-DDT, camfeclor, DDT, pp'-DDT, etil-DDD, HCH, gamma-HCH, lindano, metoxiclor, pentaclorofenol y TDE; insecticidas de ciclodieno tales como aldrin, bromocicleno, clorbicicleno, clordano, clordecona, dieldrin, dilor, endosulfán, endrin, HEOD, heptaclor, HHDN, isobenzán, isodrin, kelevan y mirex; insecticidas organofosforados tales como bromfenvinfos, clorfenvinfos, crotóxifos, diclorvos, dicrotofos, dimetilvinfos, fospirato, heptenofos, methocrotofos, mevinfos, monocrotofos, naled, naftalofos, fosfamidón, propafos, TEPP y tetraclorvinfos; insecticidas de organotiofosfatos tales como dioxabenzofos, fosmetilan y fentoato; insecticidas de organotiofosfatos alifáticos tales como acetión, amiton, cadusafos, cloretoxifos, clormefos, demefon, demefion-O, demefion-S, demeton, demeton-O, demeton-S, demeton-metil, demeton-O-metil, demeton-S-metil, demeton-S-metilsulfón, disulfotón, etiión, etoprofos, IPSP, isotioato, malatión, metacrifos, oxidemeton-metil, oxideprofos, oxidisulfotón, forato sulfotep, terbufos y tiometón; insecticidas organotiofosfatos de amida alifáticos tales como amiditió, ciantoato, dimetoato, etoato-metil, formotió, mecarbam, ometoate, prothoato, sofamida y vamidotió; insecticidas de organotiofosfato de oxima tales como clorfoxim, foxim y foxim-metil; insecticidas de organotiofosfato heterocíclicos tales como azametifos, coumafos, coumitoato, dioxatió, endotió, menazón, morfotió, fosalona, piraclofos, piridafentió y quinotió; insecticidas de organotiofosfatos de benzotipiran tales como diticrofos y ticrofos; insecticidas organotiofosfatos de benzotriazina tales como azinfos-etil y azinfos-metil; insecticidas de organotiofosfatos de isoindol tales como dialifos y fosmet; insecticidas de organotiofosfatos de isoxazol tales como isoxatió y zolapropfos; insecticidas de organotiofosfatos de pirazolopirimidina tales como clorprazofos y pirazofos; insecticidas organotiofosfatos de piridina tales como

clorpirifos y clorpirifosmetil; insecticidas organotiofosfatos de pirimidina tales como butatiofós, diazinón, etrimfos, lirimfos, pirimifos-etil, pirimifos-metil, primidofos, pirimitato y tebupirimfos; insecticidas organotiofosfatos de quinoxalina tales como quinalfos y quinalfos-metil; insecticidas organotiofosfatos de tiadiazol tales como atidation, litidation, metidation y protidation; insecticidas organotiofosfatos de triazol tales como isazofos y triazofos; 5 insecticidas organotiofosfatos de fenilo tales como azotoato, bromofos, bromofos-etil, carbofenotion, clortiofos, cianofos, citioato, dicaptón, diclofentión, etafos, famphur, fenchlorphos, fenitrothion fensulfthion, fenthion, fenthion-ethyl, heterophos, jodfenphos, mesulfenfos, paratión, paratión-metil, fenkapton, fosniclor, profenofos, protiofos, sulprofos, temefos, tricloremetafos-3 y trifenofos; insecticidas de fosfonato tales como butonato y triclorfón; insecticidas de fosfonotioato tales como mecarfón; insecticidas de etilfosfonotioato de fenilo tales como fonofos y 10 tricloronat; insecticidas de fenilfosfonotioato de fenilo tales como cianofenfos, EPN y leptofos; insecticidas de fosforamidato tales como crufomato, fenamifos, fostietán, mefosfolán, fosfolan y pirimetafos; insecticidas de fosforamidotioato tales como acefato, isocarbofos, isofenfos, metamidofos y propetamfos; insecticidas de fosforodiamida tales como dimefox, mazidox, mipafox y schradan; insecticidas de oxadiazina tales como indoxacarb; insecticidas de ftalimida tales como dialifos, fosmet y tetrametrina; insecticidas de pirazol tales como acetoprol, 15 etiprol, fipronilo, pirafuprol, pipiprol, tebufenpirad, tolfenpirad y vaniliprol; insecticidas de éster de pyrethroid, tales como acrinathrin, allethrin, bioallethrin, barthrin, bifenthrin, bioetanometrina, cicetrina, cicloprotrina, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, gamma-cihalotrina, lambda-cihalotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, beta-cipermetrina, teta-cipermetrina, zeta-cipermetrina, cifenotrina, deltametrina, dimeflutrina, dimetrina, empentrina, fenflutrina, fenpiritrina, fenpropatrina, fenvalerato, esfenvalerato, flucitrinato, fluvalinato, tau-fluvalinato, furetrina, imiprotrina, metoflutrina, 20 permetrina, biopermetrina, transpermetrina, fenotrina, praletrina, proflutrina, piresmetrina, resmetrina, bioresmetrina, cismetrina, teflutrina, tereletrina, tetrametrina, tralometrina y transflutrina; insecticidas de éter de piretroides tales como etofenprox, flufenprox, halfenprox, protrifenbutate y silafluofén; insecticidas de pirimidinamina tales como flufenerim y pirimidifen; insecticidas de pirrol tales como clorfenapir; insecticidas de ácido tetrónico tales como espiroclorfen, espiromesifén y espirotetramat; insecticidas de tiourea tales como diafentiuron; insecticidas de urea 25 tales como flucofurón y sulcofurón; e insecticidas sin clasificar tales como AKD-3088, closantel, crotamiton, ciflumetofen, E2Y45, EXD, fenazaflor, fenazaquin, fenoxacrim, fenpiroximato, FKI-1033, flubendiamida, HGW86, hidrametilnon, IKI-2002, isoprotiolano, malonoben, metaflumizona, metoxadiazona, nifluridida, NNI-9850, NNI-0101, pimetrozina, piridaben, piridalilo, qcide, rafoxanida, rinaxipir, SYJ-159, triarateno y triazamata y cualquier combinación de los mismos.

30 Algunos de los fungicidas que se pueden emplear beneficiosamente en combinación con los compuestos de la presente invención incluyen: 2-(tiocianatometil)-benzotiazol, 2-fenilfenol, 8sulfato de 8-hidroxiquinolina, Ampelomyces, quisqualis, azaconazol, azoxistrobina, Bacillus subtilis, benalaxilo, benomilo, bentiavalicarboisopropilo, sal sulfonato de bencilaminobenceno (BABS), bicarbonatos, bifenilo, bismertiazol, bitertanol, blasticidin-S, 35 borax, mezcla de Bordeaux, boscalid, bromuconazol, bupiramol, polisulfuro de calcio, captafol, captán, carbendazim, carboxin, carpropamid, carvona, cloroneb, clorotalonil, clozolinol, Coniocytrium minitans, hidróxido de cobre, octanoato de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato de cobre, sulfato de cobre (tribásico), óxido cuproso, ciazofamida, ciflufenamid, cimoxanil, ciproconazol, ciprodinilo, cimoxanilo, ciproconazol, ciprodinilo, dazomet, debacarb, etilenbis diamónico-(ditiocarbamato), diclofluanid, diclorofen, diclocimet, diclomezina, diclorán, 40 dietofencarb, difenoconazol, difenzoquat ion, diflufometrim, dimetomorf, dimoxistrobina, diniconazol, diniconazol-M, dinobuton, dinocap, difenilamina, ditianon, dodemorf, acetato de dodemorf, dodina, base libre de dodina, edifenfos, epoxiconazol, etaboxam, etoxiquina, etridiazol, famoxadona, fenamidona, fenarimol, fenbuconazol, fenfuram, fenhexamid, fenoxanilo, fenciclonilo, fenpiclonilo, fenpropimorf, fentina, acetato de fentina, hidróxido de fentina, ferbam, ferimzona, fluazinam, fludioxonil, flumorf, fluopicolida, fluoroimida, fluoxastrobina, fluquinconazol, flusilazol, 45 flusulfamida, flutolanil, flutriafol, folpet, formaldehído, fosetilo, fosetil-alumino, fuberidazol, furalaxilo, furametpir, guazatina, acetatos de guazatina, GY-81, hexaclorobenceno, hexaconazol, himexazol, imazalilo, sulfato de imazalilo, imibenconazol, iminoctadina, triacetato de iminoctadina, iminoctadina tris(albesilato), ipconazol, iprobenfos, iprodiona, iprovalicarb, isoprotiolano, kasugamicina, clorhidrato de kasugamicina hidrato, kresoxim-metil, mancopper, mancozeb, maneb, mepanipirim, mepronilo, cloruro mercúrico, óxido mercúrico, cloruro mercurioso, metalaxilo, 50 mefenoxam, metalaxil-M, metam, metam-amonio, metam-potasio, metamsodio, metconazol, metasulfocarb, yoduro de metilo, isotiocianato de metilo, metiram, metominostrobina, metrafenona, mildiomicina, miclobutanol, nabam, nitrotal-isopropilo, nuarimol, octilinona, ofurace, ácido oleico (ácidos grasos), orisastrobina, oxadixilo, oxina-cobre, fumarato de oxpoconazol, oxicarboxin, pefurazoato, penconazol, pencicuron, pentaclorofenol, laurato de pentaclorofenilo, pentiopirad, acetato de fenilmercurio, ácido fosfónico, ftalida, picoxistrobina, polioxina B, polioxinas, polyoxorim, bicarbonato de potasio, sulfato de hidroxiquinolina potasio, procloraz, procimidona, propamocarb, 55 clorhidrato de propamocarb, propiconazol, propineb, proquinazid, protioconazol, piraclostrobina, pirazofos, piributicarb, pirifenox, pirimetanil, piroquilon, quinoclamina, quinoxifeno, quintoceno, extracto de Reynoutria sacalinensis, siltiofam, simeconazol, 2-fenilfenóxido de sodio, bicarbonato de sodio, pentaclorofenóxido de sodio, espiroxamina, azufre, SYP-Z071, aceites de alquitrán, tebuconazol, tecnazeno, tetraconazol, tiabendazol, 60 tifluzamida, tiofanato-metilo, tiram, tiadinilo, tolclorfen-metilo, tolilfluanid, triadimefón, triadimenol, triazóxido, triciclazol, tridemorf, trifloxistrobina, triflumizol, triforina, triticonazol, validamicina, vinclozolina, zineb, ziram, zoxamida, Candida oleofila, Fusarium oxysporum, Gliocladium spp., Flebiopsis gigantean, Streptomyces griseoviridis, Tricoderma spp., (RS)-N-(3,5-diclorofenil)-2-(metoximetil)-succinimida, 1,2-dicloropropano, 1,3-dicloro-1,1,3,3-tetrafluoroacetona hidrato, 1-cloro-2,4-dinitronaftaleno, 1-cloro-2-nitropropano, 1,1,4,4-tetraóxido de 2-(2-heptadecil-2-imidazolin-1-il)etanol, 2,3-dihidro-5-fenil-1,4-diti-ina, acetato de 2-metoxietilmercurio, cloruro de 2-metoxietilmercurio, silicato de 2-metoxietilmercurio, 3-(4-clorofenil)-5-metilrodanina, tiocanato de 4-(2-nitroprop-1-enil)fenilo: ampropilfos, anilazina,

azitiram, polisulfuro de bario, Bayer 32394, benodanil, benquinox, bentalurón, benzamacrilo; benzamacrilo-isobutilo, benzamorf, binapacrilo, sulfato de bis(metilmercurio), óxido de bis(tributilestaño), butiobato, sulfato cromato de cadmio calcio cobre cinc, carbamorf, CECA, clobentiazona, cloraniformetan, clorfenazol, clorquinox, climbazol, bis(3-fenilsalicilato) de cobre, cromato de cobre cinc, cufraneb, sulfato de hidrazinio cúprico, cuprobam, ciclafuramid, 5 cependazol, ciprofuram, decafeutin, diclona, diclozolina, diclobutrazol, dimetirimol, dinocton, dinosulfón, dinoterbon, dipiritiona, ditalimfos, dodicin, drazoxolón, EBP, ESBP, etaconazol, etem, etirim, fenaminosulf, fenapanilo, fenitropan, flotrimitazol, furcarbanilo, furconazol, furconazol-cis, furmeciclox, furofanato, gliodina, griseofulvina, halacrinato, Hercules 3944, hexiltiofos, ICIA0858, isopamfos, isovalediona, mebenilo, mecarbinzid, metazoxolón, metfuroxam, 10 diciandiamida de metilmercurio, metsulfovax, milneb, anhídrido mucoclorico, miclozolina, N-3,5-diclorofenil-succinimida, N-3-nitrofenilitaconimida, natamicina, N-etilmercurio-4-toluenesulfonanilida, bis(dimetilditiocarbamato) de níquel, OC, dimetilditiocarbamato de fenilmercurio, nitrato de fenilmercurio, fosdifen, protiocarb; clorhidrato de protiocarb, piracarbolid, piridinil, piroxiclor, piroxifur, quinacetol; sulfato de quinacetol, quinazamid, quinconazol, rabenzazol, salicilanilida, SSF-109, sultropen, tecoram, tiadifluor, ticiofen, tioclorfenfem, tiofanato, tioquinox, tioximid, triamifos, triarimol, triazbutil, triclamida, urbacid, XRD-563 y zarilamid, y cualquier combinación de los mismos.

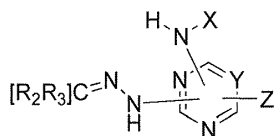
15 Algunos de los herbicidas que se pueden emplear junto con los compuestos de la presente invención incluyen: herbicidas de amida tales como alidoclor, beflubutamid, benzadox, benzipram, bromobutida, cafenstrol, CDEA, clortiamid, ciprazol, dimetenamid, dimetenamid-P, difenamid, epronaz, etnipromid, fentrazamida, flupoxam, fomesafen, halosafen, isocarbamid, isoxaben, napropamida, naptalam, petoxamid, propizamida, quinonamid y 20 tebutam; herbicidas de aniluro tales como cloranocril, cisanilida, clomeprop, cipromid, diflufenican, etobenzanid, fenasulam, flufenacet, flufenican, mefenacet, mefluidida, metamifop, monalida, naproanilida, pentanoclor, picolinafen y propanilo; herbicidas de arilalanina tales como benzoilprop, flampropand y flamprop-M; herbicidas de cloroacetanilida tales como acetoclor, alaclor, butaclor, butenaclor, delaclor, dietatil, dimetaclor, metazaclor, metolaclor, S-metolaclor, pretilaclor, propaclor, propisoclor, prinacclor, terbuclor, teniclor y xilaclor; herbicidas de 25 sulfonanilida tales como benzofluor, perfluidona, pirimisulfan y profluazol; herbicidas de sulfonamida tales como asulam, carbasulam, fenasulam y orizalina; herbicidas antibióticos tales como bilanafos; herbicidas de ácido benzoico tales como cloramben, dicamba, 2,3,6-TBA y tricamba; herbicidas de ácido pirimidiniloxibenzoico tales como bispiribac y piriminobac; herbicidas de ácido pirimidiniltiobenzoico tales como piritiobac; herbicidas de ácido ftálico tales como clortal; herbicidas de ácido picolínico tales como aminopirialid, clopiralid y picloram; herbicidas de 30 ácido quinolincarboxílico tales como quinclorac y quinmerac; herbicidas de arsénico tales como ácido cacodílico, CMA, DSMA, hexaflurato, MAA, MAMA, MSMA, arsenito potásico y arsenito sódico; herbicidas de benzoilciclohexanodiona tales como mesotriona, sulcotriona, tefuriltriona y tembotriona; herbicidas de alquilsulfonato de benzofuranilo tales como benfuresato y etofumesato; herbicidas de carbamato tales como asulam, carboxazol clorprocarb, diclormato, fenasulam, carbutilato y terbucarb; herbicidas de carbanilato tales como barban, BCPC, 35 carbasulam, carbetamida, CEPC, clorbufam, clorprofam, CPPC, desmedifam, fenisofam, fenmedifam, fenmedifam-etilo, profam y swep; herbicidas de ciclohexeno oxima tales como aloxidim, butroxidim, cletodim, cloproxidim, cicloxidim, profoxidim, setoxidim, tepraloxidim y tralkoxidim; herbicidas de ciclopropilisoxazol tales como isoxaclortol e isoxaflutol; herbicidas de dicarboximida tales como benzfendizona, cinidonetilo, flumezin, flumiclorac, flumioxazin y flumipropin; herbicidas de dinitroanilina tales como benfluralina, butralina, dinitramina, etalfuralina, flucloralina, 40 isopropalina, metalpropalina, nitalina, orizalina, pendimetalina, prodiamina, profluralina y trifluralina; herbicidas de dinitrofenol tales como dinofenato, dinoprop, dinosam, dinoseb, dinoterb, DNOC, etinofeno y medinoterb; herbicidas de éter de difenilo tales como etoxifen; herbicidas de nitrofenil tales como acifluorfen, aclonifen, bifenox, clometoxifen, clornitrofen, etnipromid, fluorodifen, fluoroglicofen, fluoronitrofen, fomesafen, furiloxifen, halosafen, lactofen, nitrofen, nitrofluorfen y oxifluorfen; herbicidas de ditiocarbamato tales como dazomet y metam; herbicidas 45 alifáticos halogenados tales como alorac, cloropon, dalapon, flupropanato, hexacloroacetona, yodometano, bromuro de metilo, ácido monocloroacético, ácido monocloroacético, SMA y TCA; herbicidas de imidazolinona tales como imazametabenz, imazamox, imazapic, imazapir, imazaquin e imazetapir; herbicidas inorgánicos tales como sufamato amónico, borax, clorato cálcico, sulfato de cobre, sulfato ferroso, azida potásica, cianato potásico, azida sódica, clorato sódico y ácido sulfúrico; herbicidas de nitrilo tales como bromobonil, bromoxinil, cloroxinil, diclobenil, 50 yodobonil, ioxinil y piraclonil; herbicidas de organofósforo tales como amiprofos-metilo, anilofos, bensulida, bilanafos, butamifos, 2,4-DEP, DMPA, EBEP, fosamina, glufosinato, glifosato y piperofos; herbicidas fenoxi tales como bromofenoxim, clomeprop, 2,4-DEB, 2,4-DEP, difenopenten, disul, erbon, etnipromid, fenteracol y trifopsima; herbicidas de fenoxiacético tales como 4-CPA, 2,4-D, 3,4-DA, MCPA, MCPA-tioetilo y 2,4,5-T; herbicidas de fenoxibutírico tales como 4-CPB, 2,4-DB, 3,4-DB, MCPB y 2,4,5-TB; herbicidas de fenoxipropiónico tales como 55 cloprop, 4-CPP, diclorprop, diclorprop-P, 3,4-DP, fenoprop, mecopropand mecoprop-P; herbicidas de ariloxifenoxipropiónico tales como clorazifop, clodinafop, clofop, cihalofop, diclofop, fenoxaprop, fenoxaprop-P, fentiaprop, fluzafop, fluzafop-P, haloxifop, haloxifop-P, isoxapirifop, metamifop, propaquizafop, quizalofop, quizalofop-P y trifop; herbicidas de fenilendiamina tales como dinitramina y prodiamina; herbicidas de pirazolilo tales como benzofenap, pirazolinato, pirasulfotol, pirazoxifen, piroxasulfona y topramezona; herbicidas de pirazolifenilo 60 tales como fluazolato y piraflufen; herbicidas de piridazina tales como credazina, piridafol y piridato; herbicidas de piridazinona tales como brompirazon, cloridazon, dimidazon, flufenpir, metflurazon, norflurazon, oxapirazon y pidanon; herbicidas de piridina tales como aminopirialid, clidinato, clopiralid, ditiopir, fluoroxipir, haloxidina, picloram, picolinafen, pirioclor, tiazopir y triclopir; herbicidas de pirimidindiamina tales como iprimidam y tioclorim; herbicidas de amonio cuaternario tales como ciperquat, dietamquat, difenzoquat, diquat, morfamquat y paraquat; herbicidas de 65 tiocarbamato tales como butilato, cicloato, di-alato, EPTC, esprocarb, etiolato, isopolinato, metiobencarb, molinato, orbencarb, pebulato, prosulfocarb, piributicarb, sulfalato, tiobencarb, tiocarbazil, trialato y vernolato; herbicidas d

tiocarbonato tales como dimexano, EXD y proxan; herbicidas de tiourea tales como metiuron; herbicidas de triazina tales como dipropetrina, triaziflam y trihidroxitriazina; herbicidas de clorotriazina tales como atrazina, clorazina, cianazina, ciprazina, eglinazina, ipazina, mesoprazina, procirozina, proglinazina, propazina, sebutilazina, simazina, terbutilazina y trietazina; herbicidas de metoxitriazina tales como atraton, metometon, prometon, secbumeton, simeton y terbumeton; herbicidas de metiltiotriazina tales como ametrina, aziprotrina, cianatrina, desmetrina, dimetametrina, metoprotrin, prometrina, simetrina y terbutrina; herbicidas de triazinona tales como ametrindiona, amibuzin, hexazinona, isometiozin, metamitrón y metribuzina; herbicidas de triazol tales como amitrol, cafenstrol, epronaz y flupoxam; herbicidas de triazolona tales como amicarbazona, bencarbazona, carfentrazona, flucarbazona, propoxicarbazona, sulfentrazona y tiencarbazona-metilo; herbicidas de triazolopirimidina tales como cloransulam, diclosulam, florasulam, flumetsulam, metosulam, penoxsulam y piroxsulam; herbicidas de uracilo tales como butafenacilo, bromacilo, flupropacilo, isocilo, lenacilo y terbacilo; 3-feniluracilos; herbicidas de urea tales como benztiázurón, cumilurón, ciclurón, dicloralurea, diflufenzopir, isonorurón, isourón, metabenztiázurón, monisourón y norurón; herbicidas de fenilurea tales como anisurón, buturón, clorbromurón, cloreturón, clorotolurón, cloroxurón, daimurón, difenoxurón, dimefurón, diurón, fenurón, fluometurón, fluotiurón, isoproturón, linurón, metiurón, metildimurón, metobenzurón, metobromurón, metoxurón, monolinurón, monurón, neburón, parafluorón, fenobenzurón, sidurón, tetrafluorón y tidiazurón; herbicidas de pirimidinilsulfonilurea tales como amidosulfurón, azimsulfurón, bensulfurón, clorimurón, ciclosulfamurón, etoxisulfurón, flazasulfurón, flucetosulfurón, flupirsulfurón, foramsulfurón, halosulfurón, imazosulfurón, mesosulfurón, nicosulfurón, ortosulfamurón, oxasulfurón, primisulfurón, pirazosulfurón, rimsulfurón, sulfometurón, sulfosulfurón y trifloxisulfurón; herbicidas de triazinilsulfonilurea tales como clorsulfurón, cinosulfurón, etametsulfurón, yodosulfurón, metsulfurón, prosulfurón, tifensulfurón, triasulfurón, tribenurón, triflusulfurón y tritosulfurón; herbicidas de tiadiazolilurea tales como butiurón, etidimurón, tebutiurón, tiazafuorón y tidiazurón; y herbicidas no clasificados tales como acroleína, alcohol alílico, aminociclopiraclor, azafenidina, benazolina, bentazona, benzobiciclón, butidazol, cianamida cálcica, cambendiclor, clorfenaco, clorfenprop, clorflurazol, clorflurenol, cinmetilina, clomazona, CPMF, cresol, orto-diclorobenceno, dimepiperato, endotal, fluoromidina, fluridona, fluorocloridona, flurtamona, flutiacet, indanofan, indaziflam, metazol, isotiocianato de metilo, nipiraclofeno, OCH, oxadiargil, oxadiazon, oxaziclomefona, pentaclorofenol, pentoxazona, acetato de fenilmercurio, pinoxaden, prosulfalina, piribenzoxim, piriftalid, quinoclamina, rodetanilo, sulglicapina, tidiazimina, tridifane trimeturón, tripropindan y tritac.

30

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula (I),



5

Fórmula I

incluyendo su sal fisiológicamente aceptable, en la que:

- 10 Y es N o CR₁;
 R₁, es -H, halo o alquilo -C₁-C₄;
 Z es -arilo, -alquilarilo C₁-C₈, -cicloalquilo C₃-C₈, alquil C₁-C₆ cicloalquilo C₆, heterocíclico, -alquilheterocíclico C₁-C₈,
 15 X, es -H, -alquilo C₁-C₈, -arilo, -alquilarilo C₁-C₈, -cicloalquilo C₃-C₈, -alquilo C₁-C₈ cicloalquilo C₃-C₈, heterocíclico, -alquilo C₁-C₈ heterocíclico, -NRⁱR^j o -alquil C₁-C₈-NRⁱR^j;
 R₂ y R₃ son independientemente -H, -alquilo C₁-C₈, -arilo, -alquilarilo C₁-C₈, -cicloalquilo C₃-C₈, -alquilo C₁-C₈ cicloalquilo C₃-C₈, heterocíclico, -alquilo C₁-C₈ heterocíclico y -alquilo C₁-C₈-NRⁱR^j,
 pero R₂ y R₃ no son ambos H;
 Rⁱ y R^j son independientemente -H o -alquilo C₁-C₈;
 20 en donde heterocíclico es un resto del anillo cicloalifático -C₁-C₈ aromático o saturado, cíclico o bicíclico, de 5-10 miembros, que contiene 1, 2, o 3 heteroátomos seleccionados de N, O o S;
 en donde arilo, -cicloalquilo C₃-C₈ y heterocíclico están opcionalmente sustituidos independientemente con de uno a cinco sustituyentes seleccionados independientemente de -halo, -CN, -OH, -OCH₂CH=CHCl, -alquilo C₁-C₆, -O-alquilo C₁-C₆ o -S-alquilo C₁-C₆; y
 25 en cada aparición, el alquilo está opcionalmente sustituido con 1-5 halo, -CN u -OH.

2. Un compuesto de la reivindicación 1, en el que Y es CR₁.

3. Un compuesto de la reivindicación 1, en el que Y es N.

30

4. Un compuesto de las reivindicaciones 1-3, en el que heterocíclico es un anillo de 5, 6 o 10 miembros en el que los heteroátomos se seleccionan de N, O o S.

5. Un compuesto de las reivindicaciones 1-3, en el que arilo es un anillo de 6 o 10 miembros opcionalmente sustituido.

35

6. Un compuesto de la reivindicación 1, en el que;

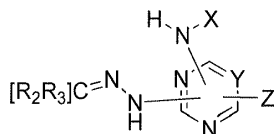
halo es Cl o F;

40 Rⁱ y R^j son H o alquilo C₁-C₂; y

R₂ y R₃ son independientemente -H o -alquilo C₁-C₈, -arilo, -alquiloarilo C₁-C₈, -cicloalquilo C₃-C₈, -alquil C₁-C₈ cicloalquilo C₃-C₈, heterocíclico, -alquilheterocíclico C₁-C₈ y -alquilo C₁-C₈ NRⁱR^j; pero cuando uno de R₂ y R₃ son -arilo, -alquiloarilo C₁-C₈, -cicloalquilo C₃-C₈, -alquil C₁-C₈ cicloalquilo C₃-C₈, heterocíclico, -alquilheterocíclico C₁-C₈ y -alquilo C₁-C₈-NRⁱR^j entonces el otro de cualquiera de R₂ o R₃ es independientemente -H o -alquilo C₁-C₈.

45

7. Un compuesto de la reivindicación 1 de fórmula (I),



Fórmula I

50 en la que:

Y es N;

Z es -arilo, -alquilarilo C₁-C₈;

X es -H, -alquilo C₁-C₈, -arilo, -alquilarilo C₁-C₈, -cicloalquilo C₃-C₈, -alquilo C₁-C₈ cicloalquilo C₃-C₈, heterocíclico, -alquilo C₁-C₈ heterocíclico, -NRⁱR^j o -alquilo C₁-C₈ NRⁱR^j;

55

R₂ y R₃ son independientemente -H, -alquilo C₁-C₈, -arilo, -alquilarilo C₁-C₈, -cicloalquilo C₃-C₈, -alquilo C₁-C₈ cicloalquilo C₃-C₈, heterocíclico, -alquilo C₁-C₈ heterocíclico y -alquilo C₁-C₈ NRⁱRⁱ, pero R₂ y R₃ no son ambos H; Rⁱ y Rⁱ son independientemente -H o -alquilo C₁-C₈;

en donde heterocíclico es un resto del anillo cicloalifático C₁-C₈ aromático o saturado, cíclico o bicíclico, de 5-10 miembros, que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de N, O o S;

en donde arilo, -cicloalquilo C₃-C₈ y heterocíclico están opcionalmente sustituidos independientemente con de uno a cinco sustituyentes seleccionados independientemente de -halo, -CN, -OH, -OCH₂CH=CHCl, -alquilo C₁-C₆, -O-alquilo C₁-C₆ o -S-alquilo C₁-C₆; y en cada aparición el alquilo está opcionalmente sustituido con 1-5 halo, -CN u -OH.

8. Un compuesto de las reivindicaciones 1 o 7, en el que

1 o 2 de X y R₂ o R₃ son independientemente un -cicloalquilo C₁-C₆, -alquil C₁-C₆ cicloalquilo C₆, -arilo C₆, -alquil C₁-C₆ arilo C₆ o heterocíclico C₆ o -alquil C₁-C₆ heterocíclico C₆ o un anillo saturado o insaturado opcionalmente sustituido, en donde

Z es -arilo C₆ o -alquil C₁-C₈ arilo -C₆;

X, Z y o bien R₂ o R₃ están opcionalmente sustituidos independientemente con 1, 2 o 3 de -H, -halo, -CN, -OH, -OCH₂CH=CHCl, -alquilo C₁-C₆, -O-alquilo C₁-C₆ o -S-alquilo C₁-C₆; y

en cada aparición, cualquier -alquilo C₁-C₆ está opcionalmente sustituido independientemente con 1-5 halo, -CN u -OH.

9. Un compuesto de la reivindicación 8, en el que

1 o 2 de X, y R₂ o R₃ son, independientemente, un anillo heterocíclico o alquiheterocíclico -C₁-C₆ saturado o insaturado de 6 miembros opcionalmente sustituido, en donde

Z es fenilo;

X, Z y R₂ o R₃ están opcionalmente sustituidos independientemente con 1 o 2 -H, -halo, -CN, -OH, -OCH₂CH=CHCl, -alquilo C₁-C₆, -O-alquilo C₁-C₆ o -S-alquilo C₁-C₆; y

en cada aparición, cualquier -alquilo C₁-C₆ está opcionalmente sustituido independientemente con 1-5 halo, -CN u -OH.

10. Un compuesto de la reivindicación 8, en el que

1, o 2 de X y o bien R₂ o R₃ son independientemente un -cicloalquilo C₁-C₆, -alquil C₁-C₆-cicloalquilo C₆, -arilo C₆, -alquil C₁-C₆-arilo C₆;

en el que

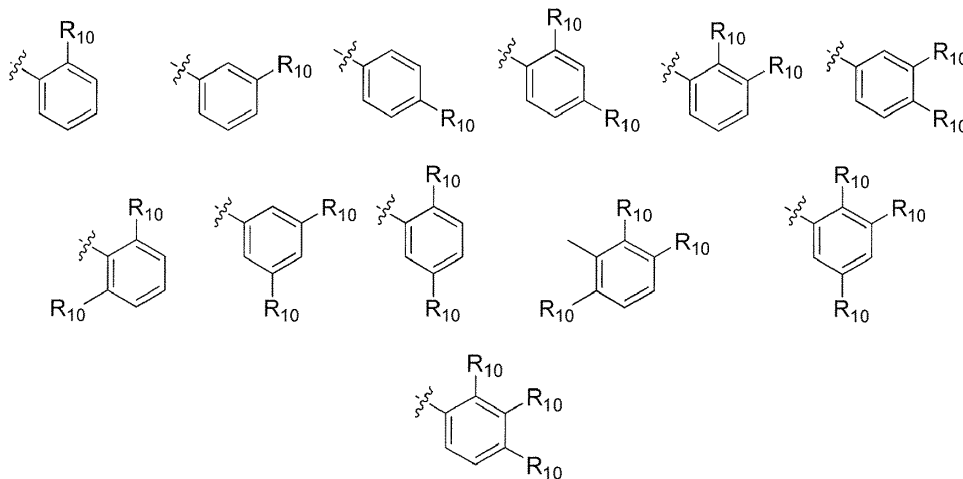
Z es fenilo;

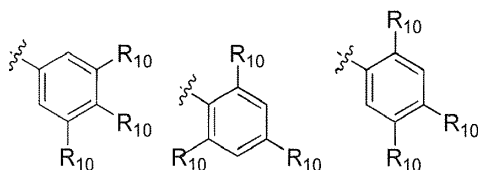
X, Z y o bien R₂ o R₃ están opcionalmente sustituidos independientemente con 1 -H, -halo, -CN, -OH, -OCH₂CH=CHCl, -alquilo C₁-C₆, -O-alquilo C₁-C₆ o -S-alquilo C₁-C₆;

en el que, en cada aparición, cualquier -alquilo C₁-C₆, está opcionalmente sustituido independientemente con 1-5 halo, -CN u -OH.

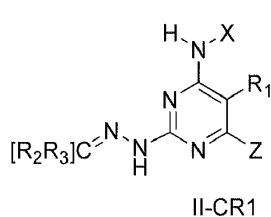
11. Un compuesto de las reivindicaciones 1-10, en el que el arilo es fenilo y el fenilo está opcionalmente sustituido con 1-3 R₁₀, en cualquiera de las posiciones de cualquiera de las siguientes fórmulas; y

R₁₀ está seleccionado opcionalmente sustituido independientemente con de uno a cinco sustituyentes seleccionados independientemente de -halo, -CN, -OH, -OCH₂CH=CHCl, -alquilo C₁-C₆, -O-alquilo C₁-C₆ o -S-alquilo C₁-C₆; y en cada aparición, el alquilo está opcionalmente sustituido con 1-5 halo, -CN u -OH.

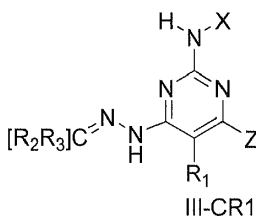




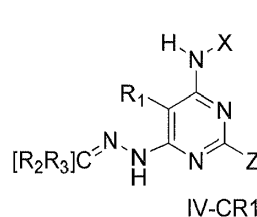
12. Un compuesto de la reivindicación 1, en el que 1, 2 o 3 de X, Z, y o bien R₂ o R₃ son, independientemente, un anillo heterocíclico o alquilheterocíclico opcionalmente sustituido, saturado o insaturado de 5, 6 o 10 miembros.
 5 Opcionalmente sustituido independientemente con 1, 2 o 3 de -H, -halo, -CN, -OH, -OCH₂CH=CHCl, -alquilo C₁-C₆, -O-alquilo C₁-C₆ o -S-alquilo C₁-C₆; en el que en cada aparición, cualquier -alquilo C₁-C₆ está opcionalmente sustituido independientemente con 1-5 halo, -CN u -OH.
- 10 13. Un compuesto de la reivindicación 12, en el que Z es -arilo, -alquilarilo C₁-C₈, -cicloalquilo C₃-C₈ o alquil C₁-C₆ cicloalquilo C₆; X es heterocíclico o alquilheterocíclico -C₁-C₈; cuando R₂ es -H o -alquilo C₁-C₈, entonces R₃ es -alquilo C₁-C₈, -arilo, -alquilarilo C₁-C₈, -cicloalquilo C₃-C₈, -alquil C₁-C₈ cicloalquilo C₃-C₈ y -alquilo C₁-C₈NRⁱR^j;
 15 cuando R₃ es -H o -alquilo C₁-C₈, entonces R₂ es -alquilo C₁-C₈, -arilo, -alquilarilo C₁-C₈, -cicloalquilo C₃-C₈, -alquil C₁-C₈ cicloalquilo C₃-C₈ y -alquilo C₁-C₈ NRⁱR^j.
14. Un compuesto de la reivindicación 12, en el que Z es heterocíclico o alquilheterocíclico -C₁-C₈,
 20 X es -H, -alquilo C₁-C₈, -arilo, -alquilarilo C₁-C₈, -cicloalquilo C₃-C₈, -alquil C₁-C₈ cicloalquilo C₃-C₈, -NRⁱR^j o -alquil C₁-C₈-NRⁱR^j; cuando R₂ es -H o -alquilo C₁-C₈, entonces R₃ es -alquilo C₁-C₈, -arilo, -alquilarilo C₁-C₈, -cicloalquilo C₃-C₈, -alquil C₁-C₈ cicloalquilo C₃-C₈ y -alquilo C₁-C₈ NRⁱR^j; y
 25 cuando R₃ es -H o -alquilo C₁-C₈, entonces R₂ es -alquilo C₁-C₈, -arilo, -alquilarilo C₁-C₈, -cicloalquilo C₃-C₈, -alquil C₁-C₈ cicloalquilo C₃-C₈ y -alquilo C₁-C₈ NRⁱR^j.
15. Un compuesto de la reivindicación 12, en el que Z es -arilo, -alquilarilo C₁-C₈, -cicloalquilo C₃-C₈ o alquil C₁-C₆ cicloalquilo C₃₋₈;
 30 X es -H, -alquilo C₁-C₈, -arilo, -alquilarilo C₁-C₈, -cicloalquilo C₃-C₈, -alquil C₁-C₈ cicloalquilo C₃-C₈, -NRⁱR^j o -alquilo C₁-C₈ NRⁱR^j; R₂ es -H o -alquilo C₁-C₈, cuando R₃ es heterocíclico y -alquilheterocíclico C₁-C₈; R₃ es -H o -alquilo C₁-C₈, cuando R₂ es heterocíclico y -alquilheterocíclico C₁-C₈.
16. Un compuesto de la reivindicación 1, en el que Y es CR₁ y la fórmula I se selecciona de las fórmulas II-CR1, III-CR1 y IV-CR1,
 35



Fórmula II-CR1



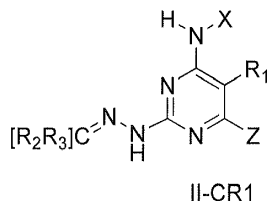
Fórmula III-CR1



Fórmula IV-CR1

40 y sales farmacéuticamente aceptables del mismo.

17. Un compuesto de la reivindicación 1, en donde el compuesto se selecciona de

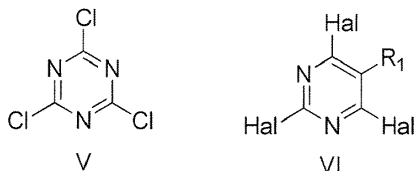


Fórmula II-CR1.

45

18. Un proceso para la preparación de un compuesto de fórmula I que comprende:

(a) poner en contacto cloruro cianúrico (fórmula V), una 2,4,6-tricloropirimidina (fórmula VI) o una 2,4,6-triazolopirimidina (fórmula VI) en donde Hal es independientemente Cl o F.



con un organometálico mostrado en la fórmula VII

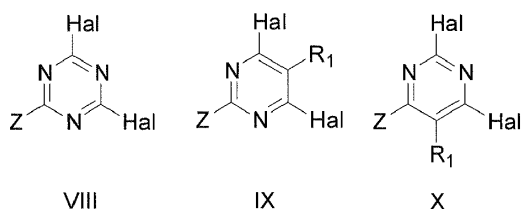


en la que:

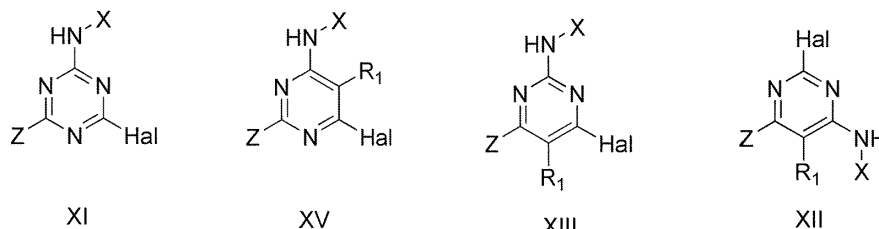


Fórmula VII

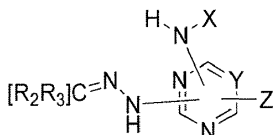
en un disolvente aprótico polar para proporcionar triazinas y pirimidinas sustituidas con arilo y heterocíclico de las fórmulas VIII-X.



(b) poner en contacto un compuesto de las fórmulas VIII, IX, X con un nucleófilo amino primario (X-NH₂) en un disolvente aprótico polar en presencia de una base, para proporcionar un compuesto de las fórmulas XI, XV, XIII, XII;



(c) poner en contacto los compuestos de las fórmulas XI, XV, XIII, XII con hidrazina en un disolvente aprótico polar, para proporcionar compuestos de hidrazina que se añaden después a compuestos ceto para elaborar compuestos de fórmula I



Fórmula I

en la que Y es N o CR₁, como se ha descrito anteriormente.

19. El compuesto de las reivindicaciones 1, 6, 7, 8 y 9 seleccionado de:

- N-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina;
- N-(4-clorofenil)-4-fenil-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina;
- 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(4-clorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina;
- N-((6-cloropiridin-3-il)metil)-4-(2,6-difluorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina;
- N-(6-cloropiridin-3-il)-4-(2,6-difluorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina;

- N-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-6-(2-(4-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina;
 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(4-clorofenil)-6-(2-(4-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina;
 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(6-cloropiridin-3-il)-6-(2-(4-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina;
- 5 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(6-cloropiridin-3-il)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina;
 N-(6-cloropiridin-3-il)-4-(2,6-difluorofenil)-6-(2-(4-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina;
 N-(6-cloropiridin-3-il)-4-(2,6-diclorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina;
 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(4-clorofenil)-6-(2-(4-etilbenciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina;
- 10 4-((2-(4-(2-cloro-6-fluorofenil)-6-((4-clorofenil)amino)-1,3,5-triazin-2-il)hidrazono)metil)benzocitrilo;
 4-(2-butiliden)hidrazinil)-6-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(4-clorofenil)-1,3,5-triazin-2-amina;
 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(4-clorofenil)-6-(2-(2-feniletiliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina;
 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(4-clorofenil)-6-(2-(1-(4-(trifluorometoxi)fenil)etiliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina;
 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-((6-cloropiridin-3-il)metil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina;
- 15 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(p-tolil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina;
 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(2-morfolinoetil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina;
 2-(2-cloro-6-fluorofenil)-4-(2,2-dimetil)hidrazinil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina;
 N-(3-cloro-4-fluorofenil)-4-(2-cloro-6-fluorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina;
- 20 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina;
 4-(2-(4-(2-cloro-1,1,2-trifluoroetoxi)benciliden)hidrazinil)-6-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(6-cloropiridin-3-il)-1,3,5-triazin-2-amina;
 4-(2-(4-(2-cloro-1,1,2-trifluoroetoxi)benciliden)hidrazinil)-6-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(4-clorofenil)-1,3,5-triazin-2-amina;
- 25 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(3,4-diclorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina;
 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(3,5-diclorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina;
 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(2-clorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina;
 N-(6-cloropiridin-3-il)-4-(2-fluorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina;
- 30 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-metil-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina;
 N-(4-clorofenil)-4-(2-fluorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina;
 4-(2-(2-cloro-6-fluorobenziliden)hidrazinil)-N-(4-clorofenil)-6-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1,3,5-triazin-2-amina;
 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(6-cloropiridin-3-il)-6-(2-(4-(trifluorometil)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina;
 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(6-cloropiridin-3-il)-6-(2-(4-metilbenciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina;
- 35 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(6-cloropiridin-3-il)-6-(2-(4-metoxibenciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina;
 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(6-cloropiridin-3-il)-6-(2-(3-fluoro-4-(trifluorometil)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina;
 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(4-clorobencil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina;
 N-(4-clorofenil)-4-(2,6-diclorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina;
- 40 N-(4-clorofenil)-4-(3-fluorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina;
 N-(4-clorofenil)-4-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-6-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1,3,5-triazin-2-amina;
 4-(2,6-difluorofenil)-N-(4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina;
 4-(2,6-difluorofenil)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-N-(4-(trifluorometoxi)fenil)-1,3,5-triazin-2-amina;
- 45 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(2-cloropiridin-4-il)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina; y
 4-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(5-cloropiridin-2-il)-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)-1,3,5-triazin-2-amina.

20. El compuesto de la reivindicación 1, seleccionado de:

- 50 N-(4-clorofenil)-2-fenil-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)pirimidin-4-amina;
 6-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(4-clorofenil)-2-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)pirimidin-4-amina;
 N-((6-cloropiridin-3-il)metil)-6-fenil-2-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)pirimidin-4-amina;
 N-(4-clorofenil)-6-fenil-2-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)pirimidin-4-amina;
 N-(4-clorofenil)-4-fenil-6-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)pirimidin-2-amina;
- 55 6-(2-cloro-6-fluorofenil)-N-(6-cloropiridin-3-il)-2-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)pirimidin-4-amina; y
 N-(4-clorobencil)-6-fenil-2-(2-(4-(trifluorometoxi)benciliden)hidrazinil)pirimidin-4-amina.

21. Un método de control de insectos usando los compuestos de Fórmula I.