

OFICINA ESPAÑOLA DE PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11) Número de publicación: 2 640 646

51 Int. Cl.:

C07D 401/14 (2006.01) C07D 401/04 (2006.01) A01N 43/40 (2006.01) A01N 43/50 (2006.01) A01N 43/56 (2006.01) A01N 43/653 (2006.01) A61K 31/4427 (2006.01) A61P 33/10 (2006.01)

(12)

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

(86) Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: 25.08.2014 PCT/EP2014/067998

(87) Fecha y número de publicación internacional: 05.03.2015 WO15028427

Fecha de presentación y número de la solicitud europea: 25.08.2014 E 14755375 (4)

(97) Fecha y número de publicación de la concesión europea: 02.08.2017 EP 3039018

(54) Título: Derivados de piridil carboxamida con actividad plaguicida

(30) Prioridad:

26.08.2013 EP 13181692

Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente: **03.11.2017**

(73) Titular/es:

BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT (100.0%)

Alfred-Nobel-Strasse 50 40789 Monheim, DE

(72) Inventor/es:

FÜSSLEIN, MARTIN; DECOR, ANNE; GREUL, JÖRG NICO; SCHWARZ, HANS-GEORG; PORTZ, DANIELA; ILG, KERSTIN; MALSAM, OLGA; LÜMMEN, PETER; GÖRGENS, ULRICH; WELZ, CLAUDIA; KÖHLER, ADELINE Y BÖRNGEN, KIRSTEN

(74) Agente/Representante:

CARPINTERO LÓPEZ, Mario

DESCRIPCIÓN

Derivados de piridil carboxamida con actividad plaguicida

5

10

15

25

30

La presente invención se refiere a ciertos derivados de piridil carboxamida como a procedimientos para su preparación, a composiciones que comprenden esos compuestos y su uso en la agricultura y campos veterinarios y campos que dependen del control de plagas. Los compuestos son activos para controlar plagas dañinas para las plantas; son activos en particular para el control de nematodos. Además, los compuestos actúan como agentes antihelmínticos contra endoparásitos en animales y seres humanos.

Los nematodos provocan una pérdida sustancial de los productos agrícolas incluidos los alimentos y los cultivos industriales y se combaten con compuestos químicos que tienen actividad nematicida. Estos compuestos deben tener alta actividad, actividad de amplio espectro contra diferentes cepas de nematodos y no debe ser tóxico para los organismos no diana.

La aparición de resistencias contra todos los antihelmínticos comerciales parece ser un problema creciente en el área de la medicina veterinaria. Por lo tanto, los endoparasiticidas con nuevos modos moleculares de acciones se desean con urgencia. Los nuevos principios activos se deben llevar a cabo con una excelente eficacia contra un amplio espectro de helmintos y nematodos, sin efectos tóxicos adversos en el organismo vertebrado tratado. Los endoparasiticidas son productos farmacéuticos para el combate o la supresión de endoparásitos en animales o seres humanos.

El uso de determinados derivados de N-2-(piridilo)etil-carboxamida para el control de nematodos se describe en los documentos WO2007/108483 A1 y EP 2 132 987 A1.

20 El uso de ciertas carboxamidas como parasiticidas se describe en los documentos WO2012/118139 A1 y WO2013/0676230 A1.

Además, ciertas carboxamidas se describen como pesticidas en los documentos WO2013/064518 A1, WO2013/064519 A1, WO2013/064520 A1, WO2013/064521 A1 o como nematicidas en los documentos WO2013/064460 A1 y WO2013/064461 A1. Ademas, las carboxamidas adicionales que comprenden un anillo heterocíclico de 5 miembros ligado a un anillo de 6 miembros se desvela en el documento WO2014/004064 A1.

Un objetivo de la presente invención es proporcionar compuestos que se pueden usar como nematicidas con una actividad nematicida satisfactoria o mejorada, en especial a tasas de aplicación relativamente bajas, con una alta selectividad y alta compatibilidad en cultivos de cultivos de plantas. Otro objetivo de la presente invención es proporcionar compuestos que se pueden usar como endoparasiticidas con una actividad antihelmíntica satisfactoria o mejorada contra un amplio espectro de helmintos y nematodos, en particular a dosis relativamente bajas, sin efectos tóxicos adversos en el organismo vertebrado tratado.

La presente invención se refiere a un compuesto de fórmula (I)

$$\begin{array}{c|c}
Q & X_n \\
B^2 & R^4 & O \\
R^1 & R^2 & R^5
\end{array}$$
(I)

en la que (realización 2-2)

n

40

45

35 B¹, B² representan C-X o N, en el que por lo menos B¹ o B² es N,

es 1 o 2, limitado por el número de posiciones disponibles en el anillo al que un sustituyente X se puede conectar,

cada X se selecciona independientemente entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, nitro, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquenilo C₂-C₄, alquilamino C₁-C₄, di-(alquilo C₁-C₄)amino, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C₂-C₄, haloalqueniloxi C₂-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquiniloxi C₃-C₄, haloalquiniloxi C₃-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilcarbonilo C₁-C₄, haloalquilcarbonilo C₁-C₄, haloalquilcarbonilo C₁-C₄, cON(alquilo C₁-C₄), -CON(Oalquilo C₁-C₄), alcoxicarbonilo

 $C_1\text{-}C_4$, haloalcoxicarbonilo $C_1\text{-}C_4$ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilcarboniloxi $C_1\text{-}C_4$, haloalquilcarboniloxi $C_1\text{-}C_4$ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilcarbonilamino $C_1\text{-}C_4$, haloalquilcarbonilamino $C_1\text{-}C_4$ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -OCONH(alquilo $C_1\text{-}C_4$), -OCON(alquilo $C_1\text{-}C_4$), -OCON(alquilo $C_1\text{-}C_4$), -OCON(alquilo $C_1\text{-}C_4$), -S-alquilo $C_1\text{-}C_4$, -S-haloalquilo $C_1\text{-}C_4$ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)-alquilo $C_1\text{-}C_4$, -S(O)-haloalquilo $C_1\text{-}C_4$ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)_2-alquilo $C_1\text{-}C_4$, -S(O)_2-haloalquilo $C_1\text{-}C_4$ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alcoxiimino $C_1\text{-}C_4$)-alquilo $C_1\text{-}C_4$, (alqueniloxiimino $C_2\text{-}C_6$)-alquilo $C_1\text{-}C_4$, (alqueniloxiimino $C_3\text{-}C_6$)-alquilo $C_1\text{-}C_4$, (benciloxiimino)-alquilo $C_1\text{-}C_6$, benciloxi, -S-bencilo, bencilamino, fenoxi, -S-fenilo y fenilamino,

representa un anillo heteroaromático opcionalmente mono o polisustituido del grupo que consiste en Q-41, Q-42, Q-43, Q-44, Q-45, Q-46, Q-47, Q-48, Q-49, Q-50, Q-51, Q-52, Q-53 y Q-57

15 con

20

25

30

35

m

5

10

Q

es 0, 1 o 2, limitado por el número de posiciones disponibles en Q al que un sustituyente Y se puede conectar, y

cada Y

se selecciona independientemente entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, nitro, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, alquilamino C₁-C₄, di-(alquilo C₁-C₄)amino, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C2-C4, haloalqueniloxi C2-C4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquiniloxi C₃-C₄, haloalquiniloxi C₃-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilcarbonilo C₁-C₄, haloalquilcarbonilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -CONH(alquilo C₁-C₄), -CON(alquilo C_1 - C_4)₂,-CONH(Oalquilo C_1 - C_4), -CON(Oalquilo C_1 - C_4)(alquilo C_1 - C_4), alcoxicarbonilo C₁-C₄, haloalcoxicarbonilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilcarboniloxi C₁-C₄, haloalquilcarboniloxi C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilcarbonilamino C₁-C₄, haloalquilcarbonilamino C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -OCONH(alquilo C₁-C₄), -OCON(alquilo C_1 - C_4)₂, -OCONH(Oalquilo C_1 - C_4), -OCO(Oalquilo C_1 - C_4), -S-alquilo C_1 - C_4 , -Shaloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)-alquilo C₁-C₄, -S(O)-haloalquilo C₁-C4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)2-alquilo C1-C4, -S(O)2-haloalquilo C1-C4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -CH₂-S-alquilo C₁-C₄, -CH₂-S(O)-alquilo C₁-C₄, -CH₂-S(O)₂-alquilo C₁-C₄, (alcoxiimino C₁-C₄)-alquilo C₁-C₄, (alqueniloxiimino C₂-C₆)-alquilo C₁-C₄, (alquiniloxiimino C₃-C₆)-alquilo C₁-C₄, (benciloxiimino)-alquilo C₁-C₆, benciloxi, -S-bencilo, bencilamino, fenoxi, -S-fenilo y fenilamino,

 R^{1} , R^{2} , R^{3} y R^{4}

son iguales o diferentes y se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxi, amino, -CHO, -COOH, -CONH₂, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, alquilamino C₁-C₄, di-(alquilo C₁-C₄)amino, alcoxi C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, haloalcoxi C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C₂-C₄,

haloalqueniloxi C₂-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquiniloxi C₃-C₄, haloalquiniloxi C₃-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₃, halocicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₃ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilcarbonilo C₁-C₄, haloalquilcarbonilo C₁-C₄ que tiene de 1 5 a 5 átomos de halógeno, CONH(alquilo C₁-C₄), -CON(alquilo C₁-C₄)₂, -CONH(Oalquilo C₁-C₄), CON(Oalquilo C₁-C₄)(alquilo C₁-C₄), alcoxicarbonilo C₁-C₄, haloalcoxicarbonil C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno,-OC(O)-alquilo C₁-C₄, -OC(O)-haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -NHC(O)-alquilo C1-C4, -NHC(O)-haloalquilo C1-C4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -OCONH(alquilo C₁-C₄),-OCON(alquilo C₁-C₄)₂, -OCONH(Oalquilo C₁-C₄), OCO(Oalquilo C₁-C₄), -S- alquilo C₁-C₄, -S-haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)-alquilo 10 C₁-C₄, -S(O)-haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)₂-alquilo C₁-C₄, -S(O)₂-haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, bencilo, benciloxi, -S-bencilo, -S(O)-bencilo, -S(O)₂-bencilo, bencilamino, fenoxi, -S-fenilo, S(O)-fenilo, -S(O)₂-fenilo, fenilamino, fenilcarbonilamino, 2.6-diclorofenilcarbonilamino, 2-clorofenil-carbonilamino y fenilo, o R1 y R2 15 junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un carbociclo de 4 o 5 miembros y R3 y R⁴ son iguales o diferentes y se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxi, amino, -CHO, -COOH, -CONH2, alquillo C1-C4, alquenilo C2-C4, alquinilo C2-C4, alquilamino C₁-C₄, di-(alquilo C₁-C₄)amino, alcoxi C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, haloalcoxi C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C₂-C₄, 20 haloalqueniloxi C₂-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquiniloxi C₃-C₄, haloalquiniloxi C₃-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₃, halocicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₃ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilcarbonilo C₁-C₄, haloalquilcarbonilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -CONH(alquilo C₁-C₄), -CON(alquilo C₁-C₄)₂, -CONH(Oalquilo C₁-C₄), -CON(Oalquilo C₁-C₄)(alquilo C₁-C₄), alcoxicarbonilo C₁-C₄, haloalcoxicarbonilo C₁-C₄ que tiene de 25 1 a 5 átomos de halógeno, -OC(O)-alquilo C_1 - C_4 , -OC(O)-haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno,-NHC(O)-alquilo C₁-C₄, -NHC(O)-haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, $-OCONH(alquilo C_1-C_4)$, $-OCON(alquilo C_1-C_4)$, $-OCONH(Oalquilo C_1-C_4)$, OCO(Oalquilo C₁-C₄), -S-alquilo C₁-C₄,-S-haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, 30 -S(O)-alquilo C₁-C₄, -S(O)-haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)₂-alquilo C₁-C₄, -S(O)₂-haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, bencilo, benciloxi, -Sbencilo, -S(O)-bencilo, -S(O)₂-bencilo, bencilamino, fenoxi, -S-fenilo, -S(O)-fenilo, -S(O)₂-fenilo, fenilamino, fenilcarbonilamino, 2,6-diclorofenil-carbonilamino, 2-clorofenil-carbonilamino y fenilo, o $R^3 v R^4$ junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un carbociclo de 3, 4 o 5 miembros y R1 35 y R² son iguales o diferentes y se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxi, amino, -CHO, -COOH, -CONH2, alquilo C1-C4, alquenilo C2-C4, alquinilo C2-C4, alquilamino C₁-C₄, di-(alquilo C₁-C₄)amino, alcoxi C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, haloalcoxi C1-C4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C2-C4, haloalqueniloxi C₂-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquiniloxi C₃-C₄, haloalquiniloxi C₃-40 C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₃, halocicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₃ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilcarbonilo C₁-C₄, haloalquilcarbonilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -CONH(alquilo C₁-C₄), -CON(alquilo C₁-C₄)₂, -CONH(Oalquilo C₁-C₄), -CON(Oalquilo C₁-C₄)(alquilo C₁-C₄), alcoxicarbonilo C₁-C₄, haloalcoxicarbonil C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -OC(O)-alquilo C1-C4, -OC(O)-haloalquilo C1-C4 que tiene de 1 a 5 45 átomos de halógeno,-NHC(O)-alquilo C₁-C₄, -NHC(O)-haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos halógeno, $-OCONH(alquilo C_1-C_4)$, $-OCON(alquilo C_1-C_4)_2$, $-OCONH(Oalquilo C_1-C_4)$, OCO(Oalquilo C₁-C₄), -S- alquilo C₁-C₄,-S-haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)-alquilo C_1-C_4 , -S(O)-haloalquilo C_1-C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, $-S(O)_2$ -alquilo 50 C₁-C₄, -S(O)₂-haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, bencilo, benciloxi, -Sbencilo, -S(O)-bencilo, -S(O)₂-bencilo, bencilamino, fenoxi, -S-fenilo, -S(O)-fenilo, -S(O)₂-fenilo, fenilamino, fenilcarbonilamino, 2,6-diclorofenil-carbonilamino, 2-clorofenil-carbonilamino y fenilo, o $R^4 v R^2$ junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un carbociclo no aromático de 3, 4 o 5 miembros opcionalmente sustituido con sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en 55 uno a cuatro grupos alquilo C₁-C₄ y uno a cuatro átomos de halógeno, y R

, R

, son iguales o diferentes y se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxi, amino, -CHO, -COOH, -CONH2, alquillo C1-C4, alquenilo C2-C4, alquinilo C2-C4, alquinilo C2-C4, alquinilo C3-C4, alquinilo C3di-(alquilo C₁-C₄)amino, alcoxi C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, haloalcoxi C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C₂-C₄, haloalqueniloxi C₂-C₄ 60 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquiniloxi C₃-C₄, haloalquiniloxi C₃-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, cicloalquilo C3-C6, halocicloalquilo C3-C6 que tiene de 1 a 5 átomos de $hal\'{o}geno,\ cicloalquil\ C_3-C_6-alquilo\ C_1-C_3,\ halocicloalquil\ C_3-C_6-alquilo\ C_1-C_3\ que\ tiene\ de\ 1\ a\ 5$ átomos de halógeno, alquilcarbonilo C₁-C₄, haloalquilcarbonilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de $hal\'{o}geno, -CO\~NH (alquilo~C_1-C_4), -CON (alquilo~C_1-C_4)_2, -CONH (Oalquilo~C_1-C_4), -CON (Oalquilo~C_1-C_4)_2, -CONH (Oalquilo~C_1-C_$ C₄)(alquilo C₁-C₄), alcoxicarbonilo C₁-C₄, haloalcoxicarbonilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de 65 halógeno, -OC(O)-alquilo C₁-C₄, -OC(O)-haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno,

5

 R^1 y R^3

10

15

20

25

R⁵

35

en la que

cada R

40

45

50

A representa un heterociclo de la fórmula (Het-1)

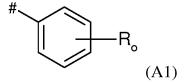
-NHC(O)-alquilo C₁-C₄, -NHC(O)-haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -OCONH(alquilo C₁-C₄), -OCON(alquilo C₁-C₄)₂,-OCONH(Oalquilo C₁-C₄), OCO(Oalquilo C₁-C₄), -Salquilo C₁-C₄, -S-haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)-alquilo C₁-C₄, -S(O)-haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, $-S(O)_2$ -alquilo C_1 - C_4 , $-S(O)_2$ haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, bencilo, benciloxi,-S-bencilo, -S(O)bencilo, -S(O)₂-bencilo, bencilamino, fenoxi, -S-fenilo, -S(O)-fenilo, -S(O)₂-fenilo, fenilamino, fenilcarbonilamino, 2,6-diclorofenil-carbonilamino, 2-clorofenil-carbonilamino y fenilo, o junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un carbociclo no aromático de 3, 4 o 5 miembros opcionalmente sustituido con sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en uno a cuatro grupos alquilo C₁-C₄ y uno a cuatro átomos de halógeno, y R² y R⁴ son iguales o diferentes y se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxi, amino, -CHO, -COOH, -CONH₂, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, alquilamino C₁-C₄, di-(alquilo C₁-C₄)amino, alcoxi C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, haloalcoxi C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C₂-C₄, haloalqueniloxi C₂-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquiniloxi C₃-C₄, haloalquiniloxi C₃-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, cicloalquil C_3 - C_6 -alquilo C_1 - C_3 , halocicloalquil C_3 - C_6 -alquilo C_1 - C_3 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilcarbonilo C₁-C₄, haloalquilcarbonilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -CONH(alquilo C₁-C₄), -CON(alquilo C₁-C₄)₂, -CONH(Oalquilo C₁-C₄), -CON(Oalquilo C₁-C₄)(alquilo C₁-C₄), alcoxicarbonilo C₁-C₄, haloalcoxicarbonilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de

halógeno, -OC(O)-alquilo C_1 - C_4 , -OC(O)-haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -NHC(O)-alquilo C_1 - C_4 , -NHC(O)-haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, $-OCONH(alquilo C_1$ - $C_4)$, $-OCON(alquilo C_1$ - $C_4)$, $-OCONH(Oalquilo C_1$ - $C_4)$, $-OCONH(Oalquilo C_1$ - $C_4)$, $-OCONH(Oalquilo C_1$ - C_4), $-OCONH(Oalquilo C_1$ - C_4), $-OCONH(Oalquilo C_1$ - C_4 , $-OCONH(Oalquilo C_1$ - C_4), $-OCONH(Oalquilo C_1$ - C_4 , $-OCONH(Oalquilo C_1$ - C_4), $-OCONH(Oalquilo C_1$ - C_4 , $-OCONH(Oalquilo C_1$ - C_4), $-OCONH(Oalquilo C_1$ - C_4 , $-OCONH(Oalquilo C_1$ - C_4), $-OCONH(Oalquilo C_1$ - C_4 , $-OCONH(Oalquilo C_1$ - C_4), $-OCONH(Oalquilo C_1$ - C_4 , $-OCONH(Oalquilo C_1$ - C_4), $-OCONH(Oalquilo C_1$ - C_4 , $-OCONH(Oalquilo C_1$ - C_4), $-OCONH(Oalquilo C_1$ - $-OCONH(Oalquilo C_$

haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, bencilo, benciloxi,-S-bencilo, -S(O)-bencilo, -S(O)₂-bencilo, bencilamino, fenoxi, -S-fenilo, -S(O)-fenilo, -S(O)₂-fenilo, fenilamino,

fenilcarbonilamino, 2,6-diclorofenil-carbonilamino, 2-clorofenil-carbonilamino y fenilo,

se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, -CHO, -OH, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxi C_1 - C_4 , haloalcoxi C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, cicloalquilo C_3 - C_6 , halocicloalquilo C_3 - C_6 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquenilo C_2 - C_4 , alquinilo C_2 - C_4 , alcoxi C_1 - C_4 -alquilo C_1 - C_4 , cicloalquil C_3 - C_6 -alquilo C_1 - C_3 , ciano-alquilo C_1 - C_4 , aminoalquilo C_1 - C_4 , alquilamino C_1 - C_4 -alquilo C_1 - C_4 , di-(alquilo C_1 - C_4) amino-alquilo C_1 - C_4 , alquilcarbonilo C_1 - C_4 , haloalquilcarbonilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxicarbonilo C_1 - C_4 , benciloxi- carbonilo, alcoxi C_1 - C_4 -alquilcarbonilo C_1 - C_4 , $-S(O)_2$ -alquilo C_1 - C_4 , y- $S(O)_2$ -haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, A representa un grupo fenilo de fórmula (A1)



es 0, 1 o 2, y

se selecciona independientemente entre el grupo que consiste en halógeno, nitro, -OH, CHO, OCHO, NHCHO,, ciano, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquenilo C_2 - C_4 , alquinilo C_2 - C_4 , cicloalquilo C_3 - C_6 , -S-alquilo C_1 - C_4 , -S-haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxi C_1 - C_4 , haloalcoxi C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilo C_2 - C_4 , alcoxicarbonilo C_1 - C_4 , haloalquiloarboniloxi C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquiloarboniloxi C_1 - C_4 , haloalquiloarboniloxi C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)-alquilo C_1 - C_4 , -S(O)-haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)2-alquilo C_1 - C_4 , -S(O)2-haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilsulfonamida C_1 - C_4 , -NH(alquilo C_1 - C_4), N(alquilo C_1 - C_4)2, fenilo (opcionalmente sustituido con alcoxi C_1 - C_4) y fenoxi, o dos R unidos a átomos de carbono adyacentes, representan juntos -O(C_1 - C_2 - C_3 - C_4 -

$$\mathbb{R}^{7}$$
 \mathbb{R}^{6}
 \mathbb{R}^{6}
 \mathbb{R}^{6}
(Het-1)

en la que

 $R^6 y R^7$ pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan de entre el grupo que consiste en hidrógeno,

halógeno, nitro, alquilo C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, y

 R^8 se selecciona de entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄ y haloalquilo 5

C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, o

A representa un heterociclo de la fórmula (Het-2)

$$R^{10}$$
 R^{10}
 R^{10}
 R^{10}
 R^{10}
 R^{10}
 R^{10}

en la que

10 R^9 se selecciona de entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alguilo C₁-C₄ y haloalquilo

C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, y

 $R^{10} y R^{11}$ pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan de entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, fenilo sustituido

de forma opcional por halógeno o alquilo C₁-C₄), o

15 A representa un heterociclo de la fórmula (Het-4)

en la que

20

R14 v R15 pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan de entre el grupo que consiste en hidrógeno,

halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S-alquilo C₁-C₄, -S(O)₂alquilo C₁-C₄, fenilo (sustituido de forma opcional por halógeno o alquilo C1-C4) y piridilo

(sustituido de forma opcional por halógeno o alquilo C1-C4), y

 R^{16} se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno y haloalcoxi C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de

halógeno, o

25 A representa un heterociclo de la fórmula (Het-5)

en la que

 $R^{17} v R^{18}$ pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan de entre el grupo que consiste en hidrógeno,

halógeno, alquilo C₁-C₄, alquiloxi C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno,

У

 R^{19} se selecciona de entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C_1 - C_4 y haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos, o

A representa un heterociclo de la fórmula (Het-6)

en la que

5

10

R²⁰ se selecciona de entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄ y

haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, y

R²¹ y R²³ pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan de entre el grupo que consiste en hidrógeno,

halógeno, alquilo C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, y

 R^{22} se selecciona de entre el grupo que consiste en hidrógeno, ciano, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4

que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ o

A representa un heterociclo de la fórmula (Het-7)

$$R^{27}$$
 R^{26}
 R^{25}
 R^{24}
(Het-7)

15 en la que

20

R²⁴ se selecciona de entre el grupo que consiste en hidrógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxi C₁-C₄-alquilo -C₁-C₄, alquilcarbonilo C₁-C₆ o

benzoílo (sustituido de forma opcional por halógeno o alquilo C₁-C₄), y

R²⁵, R²⁶ y R²⁷ pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan de entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno y

alquilcarbonilo C₁-C₄, o

A representa Un heterociclo de la fórmula (Het-9)

en la que

$$R^{30}$$
 R^{31}
(Het-9)

25 R³⁰ se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno y alquilo C₁-C₄, y

R³¹ se selecciona entre el grupo que consiste en halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno y fenilo (opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo C₁-C₄), o

A representa un heterociclo de la fórmula (Het-10)

en la que

 R^{32}

se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, amino, ciano, alquilamino C_1 - C_4 , di-(alquilo C_1 - C_4)amino, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno y fenilo (opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo C_1 - C_4), y

 R^{33}

5

se selecciona entre el grupo que consiste en halógeno, alquilo C_1 - C_4 y haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, haloalcoxi C_1 - C_5 que comprende de 1 a 9 átomos de halógeno, amino, alquilamino C_1 - C_5 sustituido o no sustituido o di-(alquilo C_1 - C_5)-amino sustituido o no sustituido. o

10 A representa un heterociclo de la fórmula (Het-11)

en la que

 R^{34}

se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilamino C_1 - C_4 , di-(alquilo C_1 - C_4)amino, alquilo C_1 - C_4 y haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, y

15 R³⁵

se selecciona entre el grupo que consiste en halógeno, alquilo C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, o

A representa un heterociclo de la fórmula (Het-12)

en la que

20 R³⁶

se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, cicloalquilo C_3 - C_6 , alcoxi C_1 - C_4 , haloalcoxi C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S- alquilo C_1 - C_4 , -S(O)-alquilo C_1 - C_4 y -S-haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, y

R³⁷ 25

se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo C_1 - C_4 , alcoxi C_1 - C_4 y -S-alquilo C_1 - C_4 , -S(O)-alquilo C_1 - C_4 , -S(O)₂-alquilo C_1 - C_4 , y

 R^{38}

se selecciona entre el grupo que consiste en fenilo, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, hidroxi-alquilo C_1 - C_4 , alquenilo C_2 - C_6 , cicloalquilo C_3 - C_6 , alquiltio C_1 - C_4 -alquilo C_1 - C_4 , alquil C_1 - C_4 -alquilo C_1 - C_4 , haloalquiltio C_1 - C_4 -alquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxi C_1 - C_4 -alquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, o

30

A representa un heterociclo de la fórmula (Het-13)

en la que

 R^{39}

5

10

15

se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, cicloalquilo C_3 - C_6 , alcoxi C_1 - C_4 , haloalcoxi C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S- alquilo C_1 - C_4 , -S(O)-alquilo C_1 - C_4 , -S-haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos, aminocarbonilo y aminocarbonil-alquilo C_1 - C_4 , y

 R^{40}

se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C_1 - C_4 , alcoxi C_1 - C_4 , haloalcoxi C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno,-S-alquilo C_1 - C_4 , -S(O)-alquilo C_1 - C_4 , y -S(O)₂-alquilo C_1 - C_4 , y

 R^{41}

se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, hidroxi-alquilo C_1 - C_4 , alquenilo C_2 - C_6 , cicloalquilo C_3 - C_6 , alquiltio C_1 - C_4 -alquilo C_1 - C_4 , alquil C_1 - C_4 -alquilo C_1 - C_4 , alquil C_1 - C_4 -alquilo C_1 - C_4 , haloalquiltio C_1 - C_4 -alquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxi C_1 - C_4 -alquilo C_1 - C_4 , haloalcoxi C_1 - C_4 -alquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno y fenilo opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C_1 - C_4 , alcoxi C_1 - C_4 -alquilo C_1 - C_4 o nitro, o

A representa un heterociclo de la fórmula (Het-14)

en la que

R⁴³ R⁴² N N N N (Het-14)

20 R⁴²

se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, cicloalquilo C_3 - C_6 , alcoxi C_1 - C_4 , haloalcoxi C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S-alquilo C_1 - C_4 , -S(O)-alquilo C_1 - C_4 , y -S(O)₂-alquilo C_1 - C_4 , -S-haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, aminocarbonilo y aminocarbonil-alquilo C_1 - C_4 , y

25 R45

30

se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C_1 - C_4 , alcoxi C_1 - C_4 , -S-alquilo C_1 - C_4 , -S(O)-alquilo C_1 - C_4 , y -S(O)₂-alquilo C_1 - C_4 , y haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, y

 R^{44}

se selecciona entre el grupo que consiste en fenilo, bencilo, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, hidroxi-alquilo C_1 - C_4 , alquenilo C_2 - C_6 , cicloalquilo C_3 - C_6 , alquiltio C_1 - C_4 -alquilo C_1 - C_4 , alquil C_1 - C_4 -alquilo C_1 - C_4 , alquil C_1 - C_4 , alquil C_1 - C_4 -alquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxi C_1 - C_4 -alquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, o

A representa un heterociclo de la fórmula (Het-15)

$$R^{46}$$
 R^{45}
(Het-15)

35 en la que

R⁴⁵ y R⁴⁶ pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno,

halógeno, alquilo C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, o

A representa un heterociclo de la fórmula (Het-16)

en la que

 $5 R^{47} y R^{48}$

pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, fenilo (opcionalmente sustituido con halógeno o un alquilo C_1 - C_4), o heterociclilo como piridilo, pirimidinilo y tiadiazolilo (opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo C_1 - C_4), o

A representa un heterociclo de la fórmula (Het-17)

10 en la que

R⁴⁹ y R⁵⁰

pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C_1 - C_4 y haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, o

A representa un heterociclo de la fórmula (Het-19)

15

20

en la que

 R^{52}

se selecciona entre el grupo que consiste en halógeno, alquilo C_1 - C_4 y haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, y

 R^{53}

se selecciona entre el grupo que consiste en alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno y fenilo (opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo C_1 - C_4), o

A representa un heterociclo de la fórmula (Het-20)

en la que

R^s

25

se selecciona entre el grupo que consiste en halógeno, alquilo C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, o

A representa un heterociclo de la fórmula (Het-21)

en la que

R⁵⁵

5

10

se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxi C_1 - C_4 , -S-alquilo C_1 - C_4 , -S-haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno y haloalcoxi C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, y

R⁵⁶, R⁵⁷ v R⁵⁸,

que pueden ser los mismos o diferentes, se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxi C_1 - C_4 , -S- alquilo C_1 - C_4 , -S(O)-alquilo C_1 - C_4 , haloalcoxi C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)-alquilo C_1 - C_4 y -S(O)₂-alquilo C_1 - C_4 , o

A representa un heterociclo de la fórmula (Het-22)

en la que

 R^{59}

15

25

se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, hidroxi, ciano, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, C_1 - C_4 alcoxi, -S-alquilo C_1 - C_5 , -S(O)-alquilo C_1 - C_4 ,-S(O)₂-alquilo C_1 - C_4 , -S-alquenilo C_2 - C_5 , -S-haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, haloalcoxi C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, feniloxi (opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo C_1 - C_4) y -S-fenilo (opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo C_1 - C_4), y

20 R⁶⁰

se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxi C_1 - C_4 , -S-alquilo C_1 - C_4 , -S(O)-alquilo C_1 - C_4 , N-morfolina (opcionalmente sustituida con halógeno o alquilo C_1 - C_4) y tienilo (opcionalmente sustituido con halógeno o un alquilo C_1 - C_4), y

R⁶¹ y R⁶²,

que pueden ser los mismos o diferentes, se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxi C_1 - C_4 , -S-alquilo C_1 - C_4 , haloalcoxi C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)-alquilo C_1 - C_4 , S(O)₂-alquilo C_1 - C_4 , N-morfolina (opcionalmente sustituida con o alquilo C_1 - C_4) y tienilo (opcionalmente sustituido con halógeno o un alquilo C_1 - C_4), o

A representa un heterociclo de la fórmula (Het-23)

30

35

en la que

R⁶³, R⁶⁴, R⁶⁵ y R⁶⁶, que pueden ser los mismos o diferentes, se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, hidroxi, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxi C₁-C₄, -S-alquilo C₁-C₄, -S-haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, haloalcoxi C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)-alquilo C₁-C₄ y -S(O)₂-alquilo C₁-C₄, o

A representa un heterociclo de la fórmula (Het-24)

en la que

R⁶⁷ se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄

que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, y

5 R⁶⁸ se selecciona entre el grupo que consiste en alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5

átomos de halógeno, alcoxicarbonilo C_1 - C_6 , bencilo (opcionalmente sustituido con 1 a 3 átomos de halógeno), benciloxicarbonilo (opcionalmente sustituido con 1 a 3 átomos de halógeno) y heterociclilo como pirimidinilo, (opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo

C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno), o

10 A representa un heterociclo de la fórmula (Het-25)

en la que

R⁶⁹ se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄ que tiene

de 1 a 5 átomos de halógeno, y

15 R^{70} se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene

de 1 a 5 átomos de halógeno y bencilo, o

A representa un heterociclo de la fórmula (Het-26)

$$R^{73}$$
 X^{1} # R^{72} X^{1} X^{1}

en la que

20 X¹ se selecciona entre el grupo que consiste en azufre, -SO-, o -SO₂-, y

R⁷¹ se selecciona entre el grupo que consiste en alquilo C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5

átomos de halógeno, y

R⁷² y R⁷³ pueden ser las mismas o diferentes y se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno y

alquilo C₁-C₄, o

25 A representa un heterociclo de la fórmula (Het-29)

en la que

R⁷⁶ se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

30 En las fórmulas (Het-1) a (Het-29) # representa el enlace que conecta la A al resto C(O)-NR⁵ en los compuestos de

ES 2 640 646 T3

la fórmula (I). Por lo general, en la presente solicitud de # representa el enlace que conecta del elemento estructural, a menos que se indique lo contrario.

Cualquiera de los compuestos de acuerdo con la invención pueden existir en una o más formas de isómeros ópticos o quirales, dependiendo del número de centros asimétricos en el compuesto. La invención se refiere igualmente a todos los isómeros ópticos y sus mezclas racémicas o escalémicas (el término "escalémica" denota una mezcla de enantiómeros en diferentes proporciones), y a las mezclas de todos los posibles estereoisómeros, en todas las proporciones. Los diastereoisómeros y/o los isómeros ópticos se pueden separar de acuerdo con los procedimientos que son conocidos *per se* por aquéllos expertos en la materia.

5

10

15

20

25

30

35

La invención se refiere también a las sales, N-óxidos, complejos metálicos y complejos metaloides de los compuestos de la fórmula (I) y los usos de los mismos.

Los compuestos de la presente invención también pueden existir en una o más formas de isómeros geométricos dependiendo del número de dobles enlaces en el compuesto, en especial todos los isómeros syn/anti (o cis/trans) y de todas las mezclas syn/anti (o cis/trans) posibles. La invención se refiere igualmente a todos los isómeros geométricos y a todas las mezclas posibles, en todas las proporciones. Los isómeros geométricos se pueden separar de acuerdo con procedimientos generales, que son conocidos *per se* por el experto en la materia.

Los compuestos de la fórmula (I) se pueden hallar en su forma tautómera resultante del cambio de protón de un grupo hidroxi, sulfanilo o amino. Tales formas tautoméricas de tales compuestos también son parte de la presente invención. Más por lo general, todas las formas tautómeras de los compuestos de la fórmula (I), así como las formas tautómeras de los compuestos que se pueden usar de forma opcional como intermediarios en los procesos de preparación y que se definirá en la descripción de estos procesos, también son parte de la presente invención.

Además, esta invención se refiere a composiciones que comprenden compuestos de la invención y su uso para controlar un nematodo. Esta invención también proporciona una composición que comprende un compuesto de la fórmula (I), o un N-óxido, o una sal del mismo, y por lo menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos. En una realización, esta invención proporciona una composición tal que comprende además por lo menos un principio activo adicional, preferentemente un producto de mezcla de acuerdo con lo descrito a continuación.

Además, esta invención se refiere al uso de compuestos y/o composiciones de la invención para controlar plagas animales, en especial nematodos, en la protección de cultivos o en el sector veterinario. Esta invención también proporciona un procedimiento para controlar un nematodo que comprende poner en contacto el nematodo o su entorno con una cantidad efectiva para uso biológico de un compuesto de la fórmula (I), o un N-óxido, o una sal del mismo (por ejemplo, tales como una composición descrita en el presente documento). Esta invención también se refiere a dicho procedimiento en el que el nematodo o su entorno se pone en contacto con una composición que comprende una cantidad efectiva para uso biológico de un compuesto de la fórmula (I), un N-óxido o una sal del mismo, y por lo menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos, dicha composición comprende de forma opcional además una cantidad efectiva para uso biológico de por lo menos un principio activo adicional, preferentemente un socio de mezcla de acuerdo con lo descrito a continuación. En una realización, los procedimientos de acuerdo con la invención no comprenden procedimientos para el tratamiento del cuerpo humano o animal por medio de cirugía o terapia y procedimientos de diagnóstico practicados en el cuerpo humano o animal.

Esta invención también proporciona un procedimiento para proteger una semilla de un nematodo comprende poner en contacto la semilla con una cantidad efectiva para uso biológico de un compuesto de la fórmula (I), o un N-óxido, o una sal del mismo (por ejemplo, tales como una composición descrita en el presente documento). Esta invención también se relaciona con una semilla obtenida por dicho procedimiento.

Como se usa en el presente documento los términos "comprende", "que comprende", "incluye", "que incluye", "tiene",

"que tiene", "contiene", "que contiene", "caracterizado por" o cualquier otra variación del mismo, tienen por objetivo
cubrir una inclusión no exclusiva, sujeta a cualquier limitación indicada de forma expresa. Por ejemplo, una
composición, mezcla, proceso o procedimiento que comprende una lista de elementos no se limita necesariamente
solo a esos elementos, pero pueden incluir otros elementos no enumerados expresamente o inherentes a dicha
composición, mezcla, proceso o procedimiento.

La frase de transición "que consiste en" excluye cualquier elemento, etapa o componente no especificado. Si en las reivindicaciones, tal cerraría la reivindicación a la inclusión de materiales que no sean los indicados excepto las impurezas normalmente asociadas con el mismo. Cuando la frase "que consiste en" aparece en una cláusula del cuerpo de una reivindicación, en lugar de inmediatamente después de la exposición del preámbulo, limita solo el elemento establecido en esta cláusula; otros elementos no están excluidos de la reivindicación en su conjunto.

La frase de transición "que consiste esencialmente en" se usa para definir una composición o procedimiento que incluye materiales, pasos, características, componentes o elementos, además de las que se describen literalmente, a condición de que estos materiales, pasos adicionales, características, componentes o elementos no lo hacen afectar materialmente las características básicas y novedosas de la invención reivindicada. La expresión "que

ES 2 640 646 T3

consiste esencialmente en" ocupa una posición intermedia entre el "que comprende" y "que consiste en".

Cuando los solicitantes han definido una invención o una porción de la misma con un plazo indefinido, como "que comprende", se debe comprender con facilidad que (a menos que se indique lo contrario) la descripción se debe interpretar para describir también tal invención, por el uso de las expresiones "que consiste esencialmente en" o "que consiste en".

Además, a menos que se indique expresamente lo contrario, "o" se refiere a un integrador o no a un o exclusivo. Por ejemplo, una condición A o B se satisface por cualquiera de los siguientes: A es verdadero (o está presente) y B es falso (o no está presente), A es falso (o no presente) y B es verdadero (o está presente), y tanto A como B son verdaderos (o están presentes).

- También, los artículos indefinidos "un" y "una" precediendo a un elemento o componente de la invención están destinados a no ser restrictivos respecto al número de casos (es decir, de ocurrencias) del elemento o componente. Por lo tanto "un" o "una" se debe leer como que incluye uno o por lo menos uno, y la forma de la palabra singular del elemento o componente también incluye el plural a menos que el número tenga, obviamente, la intención de ser singular.
- En las recitaciones anteriores, el término "alquilo", usado solo o en palabras compuestas tales como "haloalquilo" incluye de cadena lineal o ramificada, tal como, metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, o los diferentes isómeros de butilo, pentilo o hexilo. "Alquenilo" incluye alquenos de cadena lineal o ramificada, tales como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, y los diferentes isómeros de butenilo, pentenilo y hexenilo. "Alquenilo" también incluye polienos tales como 1,2-propadienilo y 2,4-hexadienilo. "Alquinilo" incluye alquinos de cadena lineal o ramificada tales como etinilo, 1-propinilo, 2-propinilo y los diferentes isómeros de butinilo, pentinilo y hexinilo. "Alquinilo" también puede incluir restos compuestos por múltiples triples enlaces tales como 2,5-hexadiinilo.
- "Cicloalquilo" incluye, por ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo. El término "cicloalquilalquilo" denota una sustitución de cicloalquilo sobre un resto alquilo. Los ejemplos de "cicloalquilalquilo" incluyen ciclopropilmetilo, ciclopentiletilo, y otros restos de cicloalquilo unidos a grupos alquilo de cadena lineal o ramificada. "Cicloalquenilo" incluye grupos tales como ciclopentenilo y ciclohexenilo, así como grupos con más de 10 dobles enlaces tales como 1,3- y 1,4-ciclohexadienilo. El término "cicloalquilcicloalquilo" denota una sustitución de cicloalquilo sobre otro anillo de cicloalquilo, en donde cada anillo de cicloalquilo tiene de forma independiente de 3 a 7 miembros del anillo de átomos de carbono. Los ejemplos de cicloalquilcicloalquilo incluyen ciclopropilo(tal como 1,1'-biciclopropil-1-ilo, 1,1'-biciclopropil-2-ilo), ciclohexilciclopentilo (tal como 4-ciclopentilciclohexilo) y ciclohexilciclohexilo (tal como 1,1'-biciclohexil-1-ilo), y los diferentes isómeros cis e isómeros trans, cicloalquilo (tales como (1R, 2S)-1,1 '-biciclopropil-2-ilo y (1R, 2R)-1,1'-biciclopropil-2-ilo).
- El término "halógeno", ya sea solo o en palabras compuestas tales como "haloalquilo", o cuando se usa en descripciones tales como "alquilo sustituido con halógeno" incluye flúor, cloro, bromo o yodo. Además, cuando se usa en palabras compuestas tales como "haloalquilo", o cuando se usa en descripciones tales como "alquilo sustituido con halógeno" dicho alquilo puede estar parcial o totalmente sustituido con átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes. Los ejemplos de "haloalquilo" o "alquilo sustituido con halógeno" incluyen F₃C, CICH₂, CF₃CH₂ y CF₃CCl₂. Los términos "haloalcoxi", "haloalquenilo", "haloalquinilo", y similares, se definen de forma análoga al término "haloalquilo". Los ejemplos de "haloalcoxi" incluyen CF₃O, CCl₃CH₂O, HCF₂CH₂CH₂O y CF₃CH₂O. Los ejemplos de "haloalquenilo" incluyen (Cl)₂C=CHCH₂ y CF₃CH₂CH=CHCH₂. Los ejemplos de "haloalquinilo" incluyen HC≡CCHCl, CF₃C≡C, CCl₃C≡C y FCH₂C≡CCH₂.□
- La abreviatura química C(O) como se usa en el presente documento representa un resto carbonilo. Por ejemplo, C(O)CH₃ representa un grupo acetilo. Las abreviaturas químicas CO₂ y C(O)O, como se usan en el presente documento representan un resto éster. Por ejemplo, CO₂Me y C(O)OMe representan un éster de metilo. CHO representa un resto aldehído.
 - "OCN" significa -OC≡N, y "SCN" significa -SC≡N.

5

- El número total de átomos de carbono en un grupo sustituyente se indica por medio del prefijo "Ci-Cj", en donde i y j son números del 1 a 14. alcoxialquilo C2 designa CH3OCH2; alcoxialquilo C3 designa, por ejemplo, CH3CH(OCH3), CH3OCH2CH2 o CH3CH2OCH2; y alcoxialquilo C4 designa los diversos isómeros de un grupo alquilo sustituido con un grupo alcoxi que contiene un total de cuatro átomos de carbono, que incluyen los ejemplos CH3CH2CH2OCH2 y CH3CH2OCH2CH2.
- Cuando un compuesto está sustituido con un sustituyente que lleva un subíndice que indica que el número de dichos sustituyentes puede exceder 1, dichos sustituyentes (cuando exceden 1) se seleccionan de forma independiente de entre el grupo de sustituyentes definidos, por ejemplo, n = 0, 1, 2, 3 o 4 Cuando un grupo contiene un sustituyente que puede ser hidrógeno, por ejemplo R² o R³, después, cuando este sustituyente se toma como hidrógeno, se

reconoce que esto es equivalente a que dicho grupo no está sustituido.

5

10

15

20

A menos que se indique lo contrario, un "anillo" o "sistema de anillos" como un componente de la fórmula (I) es carbocíclico o heterocíclico. La expresión "sistema de anillos" se refiere a dos o más anillos condensados. La expresión "anillo heterocíclico" indica un anillo en el que por lo menos un átomo que forma la columna vertebral del anillo no es carbono, por ejemplo nitrógeno, oxígeno o azufre. De forma típica, un anillo heterocíclico no contiene más de 4 nitrógenos, no más de 2 oxígenos y no más de 2 azufres. A menos que se indique lo contrario, un anillo heterocíclico puede ser un anillo saturado, parcialmente insaturado, o totalmente insaturado. La expresión "sistema de anillo heterocíclico" se refiere a un sistema de anillo en el que por lo menos un anillo del sistema de anillo es un anillo heterocíclico. A menos que se indique lo contrario, los anillos y sistemas de anillos heterocíclicos pueden estar unidos a través de cualquier carbono o nitrógeno disponible por medio de la sustitución de un hidrógeno sobre dicho carbono o nitrógeno.

Como se usa en el presente documento las siguientes definiciones se aplicarán si no se indica lo contrario. La expresión "sustituido de forma opcional" se usa indistintamente con la frase "sustituido o no sustituido" o con el término "(no) sustituido". La expresión "sustituido de forma opcional que tiene de 1 a 4 sustituyentes" significa que ningún sustituyente está presente (es decir, no sustituido) o que 1, 2, 3 o 4 sustituyentes están presentes (limitado por el número de posiciones de unión disponibles). A menos que se indique lo contrario, un grupo sustituido de forma opcional puede tener un sustituyente en cada posición sustituible del grupo, y cada sustitución es independiente de la otra.

En otro aspecto individual de la realización 2-2, R1 es flúor. En otro aspecto individual de la realización 2-2, R2 es flúor. En otro aspecto individual de la realización 2-2, R1 es flúor y R2 es flúor. En otro aspecto individual de la realización 2-2, la combinación R¹/R² es flúor/metilo.

Sustituientes a intervales más senscíficos de los elementos estructurales mencionados en los compuestos de

	Sustituyentes o intervalos más específicos de los elementos estructurales mencionados en los compuestos de fórmula (I) se explican a continuación (realización 3-2).	
	B ¹ , B ²	representan C-X o N, en el que por lo menos B¹ o B² es N,
25	n	es 1,
	X	se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, nitro, ciano, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxi C_1 - C_4 , haloalcoxi C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno,
30	Q	representa un anillo heteroaromático mono o polisustituido del grupo que consiste en Q-41, Q-42 y Q-53, con
	m	es 0, 1 o 2, limitado por el número de posiciones disponibles en ${\tt Q}$ al que un sustituyente Y se puede conectar, y
35	cada Y	se selecciona independientemente entre el grupo que consiste en hidrógeno, -CF $_3$, -CH $_2$ CF $_3$, metilo, etilo, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, -OCH $_3$, -OCH $_2$ CH $_3$, -OCH(CH $_3$) $_2$, -OCH $_2$ CF $_3$, -CH $_2$ -S(O) $_2$ -CH $_3$, dimetilamino,
	R ¹ y R ²	son iguales o diferentes y se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxi, alquilo C_1 - C_4 , alquenilo C_2 - C_4 , alquinilo C_2 - C_4 , alcoxi C_1 - C_4 , cicloalquil C_3 - C_6 -alquilo C_1 - C_3 , alcoxicarbonilo C_1 - C_4 , -OC(O)-alquilo C_1 - C_4 , -NHC(O)-alquilo C_1 - C_4 , 2,6-diclorofenil-carbonilamino, 2-clorofenil-carbonilamino y fenilo,
40	R³ y R⁴	son iguales o diferentes y se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, -COOH, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 alcoxi C_1 - C_4 , hidroxi-alquilo C_1 - C_4 , alcoxi C_1 - C_4 - alquilo C_1 - C_4 , y fenilo, o
45	R ¹ y R ²	junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un carbociclo de 4 o 5 miembros, y R^3 y R^4 son iguales o diferentes y se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno,-COOH, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 alcoxi C_1 - C_4 , hidroxi-alquilo C_1 - C_4 , alcoxi C_1 - C_4 -alquilo C_1 - C_3 , -CONH(alquilo C_1 - C_4), alcoxicarbonilo C_1 - C_4 , -OC(O)-alquilo C_1 - C_4 , y fenilo, preferentemente R^1 y R^2 junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un ciclopentilo, o
50	R³ y R⁴	junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un carbociclo de 3, 4 o 5 miembros, y R^1 y R^2 son iguales o diferentes y se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxi, alquilo C_1 - C_4 , alquenilo C_2 - C_4 , alquinilo C_2 - C_4 , alcoxi C_1 - C_4 , cicloalquil C_3 - C_6 -alquilo

carbonilamino, 2-clorofenil-carbonilamino y fenilo,

o un ciclobutilo, o

C₁-C₃, alcoxicarbonilo C₁-C₄, -OC(O)-alquilo C₁-C₄, -NHC(O)-alquilo C₁-C₄, 2,6-diclorofenil-

preferentemente R3 y R4 junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un ciclopropilo

 R^2 y R^4

5

10

15

20

25

junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un carbociclo no aromático de 3, 4 o 5 miembros opcionalmente sustituido con sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en uno a cuatro grupos alquilo C_1 - C_3 y uno a dos átomos de halógeno, y R^1 se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxi, alquilo C_1 - C_4 , alquenilo C_2 - C_4 , alquenilo C_2 - C_4 , alcoxi C_1 - C_4 , cicloalquil C_3 - C_6 -alquilo C_1 - C_3 , alcoxicarbonilo C_1 - C_4 , -OC(O)-alquilo C_1 - C_4 , C_1 - C_2 -alquilo C_1 - C_4 , C_1 - C_4 -alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 -alquilo C_1 - C_4 , hidroxi-alquilo C_1 - C_4 , alcoxi C_1 - C_4 -alquilo C_1 - C_4 , -OC(O)-alquilo C_1 - C_4 , y fenilo,

preferentemente R² y R⁴ junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un ciclopropilo, ciclobutilo o ciclopentilo, o

 $R^1 v R^3$

junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un carbociclo no aromático de 3, 4 o 5 miembros opcionalmente sustituido con sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en uno a cuatro grupos alquilo C_1 - C_3 y de uno a dos átomos de halógeno, preferentemente ciclopropilo, ciclobutilo o ciclopentilo, y R^2 se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxi, alquilo C_1 - C_4 , alquenilo C_2 - C_4 , alquinilo C_2 - C_4 , alcoxi C_1 - C_4 , cicloalquil C_3 - C_6 -alquilo C_1 - C_3 , alcoxicarbonilo C_1 - C_4 , -OC(O)-alquilo C_1 - C_4 , -NHC(O)-alquilo C_1 - C_4 , 2,6-diclorofenil-carbonilamino, 2-clorofenil-carbonilamino y fenilo, y R^4 se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, -COOH, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 alcoxi C_1 - C_4 , hidroxi-alquilo C_1 - C_4 , alcoxi C_1 - C_4 -alquilo C_1 - C_4 , -OC(O)-alquilo C_1 - C_4 , y fenilo,

preferentemente R¹ y R³ junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un ciclopropilo, ciclobutilo o ciclopentilo,

R⁵

se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, cicloalquilo C_3 - C_6 , alquilcarbonilo C_1 - C_4 , alcoxicarbonilo C_1 - C_4 ,

Α

representa un grupo fenilo de fórmula (A1)

en la que

o es 0, 1 o 2, y

30 cada R

se selecciona independientemente entre el grupo que consiste en halógeno, nitro, -OH, ciano, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, cicloalquilo C_3 - C_6 , alcoxi C_1 - C_4 , alcoxicarbonilo C_1C_1 - C_4 , -NH(alquilo C_1 - C_4), fenilo (opcionalmente sustituido con alcoxi C_1 - C_4) y fenoxi, o

A representa un heterociclo de la fórmula (Het-1)

$$\mathbb{R}^{7}$$
 \mathbb{R}^{8}
 \mathbb{R}^{6}
 \mathbb{R}^{6}
 \mathbb{R}^{6}
 \mathbb{R}^{6}
 \mathbb{R}^{6}
 \mathbb{R}^{6}
 \mathbb{R}^{6}

en la que

35

R⁶ y R⁷ pueden ser los mismos o diferentes y se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, nitro, alquilo C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, y

R⁸ se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, o

A representa un heterociclo de la fórmula (Het-2)

en la que

R⁹ se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, y

5 R^{10} y R^{11} pueden ser los mismos o diferentes y se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C_1 - C_4 y haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, fenilo opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo C_1 - C_4), o

A representa un heterociclo de la fórmula (Het-4)

10 en la que

 R^{14} y R^{15} pueden ser los mismos o diferentes y se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S-alquilo C_1 - C_4 , -S(O)₂-alquilo C_1 - C_4 , fenilo (opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo C_1 - C_4), y

se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno y haloalcoxi C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, o

A representa un heterociclo de la fórmula (Het-5)

20 en la que

25

30

R¹⁷ y R¹⁸

pueden ser los mismos o diferentes y se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C_1 - C_4 , alquiloxi C_1 - C_4 y haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, y

R¹⁹ se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos, o

A representa un heterociclo de la fórmula (Het-6)

$$R^{20}$$
 # R^{21} R^{23} (Het-6)

en la que

se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C_1 - C_4 y haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, y

R²¹ y R²³ pueden ser los mismos o diferentes y se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno,

halógeno, alquilo C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, y

 R^{22}

se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, ciano, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxi C_1 - C_4 -alquilo C_1 - C_4 , o

A representa un heterociclo de la fórmula (Het-10)

5

en la que

 R^{32}

se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, amino, ciano, alquilamino C_1 - C_4 , di-(alquilo C_1 - C_4)amino, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno y fenilo (opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo C_1 - C_4), y

10 R³³

se selecciona entre el grupo que consiste en halógeno, alquilo C_1 - C_4 y haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, haloalcoxi C_1 - C_5 que comprende de 1 a 9 átomos de halógeno, amino, alquilamino C_1 - C_5 sustituido o no sustituido o di-(alquilo C_1 - C_5)-amino sustituido o no sustituido, o

A representa un heterociclo de la fórmula (Het-21)

15

en la que

 R^{55}

se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxi C_1 - C_4 , -S-alquilo C_1 - C_4 , -S-haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno y haloalcoxi C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, y

20

R⁵⁶, R⁵⁷ v R⁵⁸,

que pueden ser los mismo o diferentes, se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxi C_1 - C_4 , -S-alquilo C_1 - C_4 , haloalcoxi C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)-alquilo C_1 - C_4 y -S(O)₂-alquilo C_1 - C_4 , o

25 A representa un heterociclo de la fórmula (Het-22)

$$R^{61}$$
 R^{62}
 R^{60}
 R^{59}
(Het-22)

en la que

 R^{59}

se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, hidroxi, ciano, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, C_1 - C_4 alcoxi, -S-alquilo C_1 - C_5 , -S(O)-alquilo C_1 - C_4 , -S(O)₂-alquilo C_1 - C_4 , -S-alquenilo C_2 - C_5 , -S-haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, haloalcoxi C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, feniloxi (opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo C_1 - C_4) y -S-fenilo (opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo C_1 - C_4), y

30

se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxi C_1 - C_4 , -S-alquilo C_1 - C_4 , -S(O)-alquilo C_1 - C_4 , -

R⁶⁰

 $S(O)_2$ -alquilo C_1 - C_4 , N-morfolina (opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo C_1 - C_4) y tienilo (opcionalmente sustituido con halógeno o un alquilo C_1 - C_4), y

 R^{61} y R^{62} ,

5

que pueden ser los mismos o diferentes, se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxi C_1 - C_4 , -S-alquilo C_1 - C_4 , haloalcoxi C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)-alquilo C_1 - C_4 , -S(O)₂-alquilo C_1 - C_4 , N-morfolina (opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo C_1 - C_4) y tienilo (opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo C_1 - C_4), o

A representa un heterociclo de la fórmula (Het-29)

10 en la que

15

R⁷⁶ se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

En otro aspecto individual de la realización 3-2, R¹ es flúor. En otro aspecto individual de la realización 3-2, R² es flúor. En otro aspecto individual de la realización 3-2, R¹ es flúor y R² es flúor. En otro aspecto individual de la realización 3-2, la combinación RVR² es flúor/metilo.

Los sustituyentes o intervalos especialmente preferidos de los elementos estructurales mencionados en los compuestos de fórmula (I) se explican a continuación (realización 4-2).

B¹ representa N,

B² representa CH,

20 n es 1,

X se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, nitro, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno,

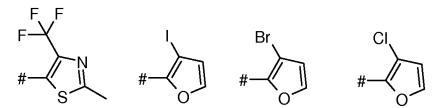
Q se selecciona entre:

R¹ y R² son iguales o diferentes y se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, metilo, etilo, metoxi, etoxi o flúor,

30 R³ y R⁴ son iguales o diferentes y se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, metilo o etilo,

R⁵ es hidrógeno,

A se selecciona entre:



En otro aspecto individual de la realización 4-2, R1 es flúor. En otro aspecto individual de la realización 4-2, R2 es flúor. En otro aspecto individual de la realización 4-2, R1 es flúor y R2 es flúor. En otro aspecto individual de la 4-2, la combinación R¹/R² es flúor/metilo.

- 5 Como alternativa, los sustituyentes o intervalos especialmente preferidos de los elementos estructurales mencionados en los compuestos de fórmula (I) se explican a continuación (realización 4-4).
 - B^1 representa N,
 - B^2 representa CH,
 - n es 1,

15

- 10 se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, nitro, ciano, alquilo C1-C4, Χ haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno,
 - Q se selecciona entre:

se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, metilo, etilo, metoxi, etoxi o flúor,

se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, metilo o etilo,

R³ R² y R⁴ R⁵ junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un ciclobutano,

20

es hidrógeno, se selecciona entre:

10 En otro aspecto individual de la realización 4-4, R¹ es flúor.

En un aspecto muy específico (realización 5-2) de los sustituyentes o intervalos especialmente preferidos de los elementos estructurales mencionados en los compuestos de fórmula (I),

ES 2 640 646 T3

- B¹ representa N, B² representa CH,
- n es 1,
- X se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno o cloro,
- 5 Q se selecciona entre:

 ${\sf R}^1$ y ${\sf R}^2$ son independientemente hidrógeno, metilo o flúor,

10 R^3 , R^4 y R^5 son hidrógeno,

A es

0

15 o

En otro aspecto muy específico (realización 5-4) de los sustituyentes o intervalos especialmente preferidos mencionados en los compuestos de fórmula (I),

- $\begin{array}{ccc} & B^1 & & \text{representa N,} \\ 20 & B^2 & & \text{representa CH,} \end{array}$
 - n es 1
 - X se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno o cloro;
 - X se selecciona entre Q se selecciona entre:

$$\# \longrightarrow \mathbb{R} \qquad \# \longrightarrow \mathbb{R} \qquad \mathbb{R} \qquad \# \longrightarrow \mathbb{R} \qquad \mathbb{R} \qquad \# \longrightarrow \mathbb{R} \qquad \mathbb{R}$$

 R^1 R^3 y R^5 es hidrógeno, metilo o flúor,

son hidrógeno,

 $5 R^2 y R^4$

junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un ciclobutano,

0

10 o

20

25

30

En otro aspecto individual de la realización 5-2, R^1 es flúor. En otro aspecto individual de la realización 5-2, R^2 es flúor. En otro aspecto individual de la realización 5-2, R^1 es flúor y R^2 es flúor. En otro aspecto individual de la realización 5-2, la combinación R^1/R^2 es flúor/metilo.

15 En otro aspecto individual de la realización 5-4, R¹ es flúor. En otro aspecto individual de la realización 5-4, R¹ es metilo.

Las definiciones de radicales, y explicaciones, que se presentaron con anterioridad de manera general o en intervalos de preferencia se pueden combinar de forma arbitraria entre sí, para incluir de este modo combinaciones entre los respectivos intervalos y los intervalos de preferencia. Las definiciones y explicaciones se aplican a los productos finales y también para los precursores e intermedios en consecuencia.

De acuerdo con la invención se prefieren los compuestos de la fórmula (I) en la que hay una combinación de las definiciones dadas con anterioridad como preferidos (preferentemente), en el que cada realización descrita con anterioridad como preferida constituye una combinación individual.

De acuerdo con la invención se prefieren más, los compuestos de la fórmula (I) en la que hay una combinación de las definiciones dadas con anterioridad de manera más preferida (más preferentemente), en el que cada realización descrita con anterioridad, como más preferido constituye una combinación individual.

De acuerdo con la invención se prefieren en especial los compuestos de la fórmula (I) en la que hay una combinación de las definiciones dadas con anterioridad de manera preferida en especial (de forma especialmente preferente), en donde cada realización descrita con anterioridad como preferida en especial constituye una combinación individual.

Otro aspecto muy específico de acuerdo con la invención son los compuestos de la fórmula (I) en la que hay una

combinación de las definiciones dadas con anterioridad como un segundo aspecto muy específico (realización 5-2) de los sustituyentes o intervalos preferidos en especial de los elementos estructurales.

Otro aspecto muy específico de acuerdo con la invención son los compuestos de la fórmula (I) en la que hay una combinación de las definiciones dadas con anterioridad como un cuarto aspecto muy específico (realización 5-4) de los sustituyentes o intervalos preferidos en especial de los elementos estructurales.

Los radicales hidrocarburos saturado o insaturados tales como alquilo, alcanodiilo o alquenilo pueden ser en cada caso, tanto solos como en combinación con heteroátomos, tales como en alcoxi, por ejemplo, cuando sea posible, tanto de cadena lineal o ramificada.

Cualquier radical sustituido puede, a menos que se indique lo contrario, estar sustituido una o más veces, y los sustituyentes en el caso de múltiples sustituciones pueden ser iguales o diferentes.

En las definiciones de los radicales que se indican como preferidos, halógeno (halo) es fluoro, cloro, bromo y yodo, muy preferentemente flúor, cloro y bromo, y de forma especialmente preferente flúor y cloro.

Otras realizaciones específicas de la invención se describen a continuación en el presente documento.

Otra realización específica (realización 7-2) de la invención es un compuesto de la fórmula (I-1)

 $\begin{array}{c|c}
Q & Xn & O \\
\hline
B_1 & N & A \\
R^2 & H & (I-1)
\end{array}$

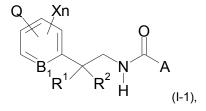
15

5

10

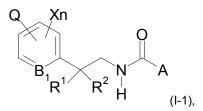
en la que B¹ es N y R¹, R², Q, X, n y A son como se definen anteriormente en la realización 2-2.

Otra realización específica (realización 8-2) de la invención es un compuesto de la fórmula (I-1)



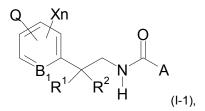
en la que B¹ es N y R¹, R², Q, X, n y A son como se definen anteriormente en la realización 3-2.

20 Otra realización específica (realización 9-2) de la invención es un compuesto de la fórmula (I-1)



en la que B1 es N y R1, R2, Q, X, n y A son como se definen anteriormente en la realización 4-2.

Otra realización específica (realización 9-4) de la invención es un compuesto de la fórmula (I-1)



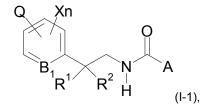
en la que B¹ es N y R¹, R², Q, X, n y A son como se definen anteriormente en la realización 4-4.

Otra realización específica (realización 10-2) de la invención es un compuesto de la fórmula (I-1)

$$\begin{array}{c|c}
 & Xn \\
 & O \\
 & B_{1} \\
 & R^{2} \\
 & H
\end{array}$$
(I-1),

en la que B1 es N y R1, R2 Q, X, n y A son como se definen anteriormente en la realización 5-2.

Otra realización específica (realización 10-4) de la invención es un compuesto de la fórmula (I-1)



5 en la que B¹ es N y R¹, R² Q, X, n y A son como se definen anteriormente en la realización 5-4.

En una realización 2-2, así como en cada aspecto individual de dicha realización, Q está preferentemente en posición para-.

En una realización 3-2, así como en cada aspecto individual de dicha realización, Q está preferentemente en posición para-.

10 En una realización 4-2, así como en cada aspecto individual de dicha realización, Q está preferentemente en posición para-.

En una realización 4-4, así como en cada aspecto individual de dicha realización, Q está preferentemente en posición para-.

En una realización 5-2, así como en cada aspecto individual de dicha realización, Q está preferentemente en posición para-.

En una realización 5-4, así como en cada aspecto individual de dicha realización, Q está preferentemente en posición para-.

En una realización 7-2, así como en cada aspecto individual de dicha realización, Q está preferentemente en posición para-.

20 En una realización 8-2, así como en cada aspecto individual de dicha realización, Q está preferentemente en posición para-.

En una realización 9-2, así como en cada aspecto individual de dicha realización, Q está preferentemente en posición para-.

En una realización 9-4, así como en cada aspecto individual de dicha realización, Q está preferentemente en posición para-.

En una realización 10-2, así como en cada aspecto individual de dicha realización, Q está preferentemente en posición para-.

En una realización 10-4, así como en cada aspecto individual de dicha realización, Q está preferentemente en posición para-.

30 Procedimientos y procedimientos

15

25

35

La síntesis de los compuestos de la fórmula (I) se puede llevar a cabo de acuerdo con o en analogía con el esquema 1 o el esquema 2. Los materiales de partida requeridos son conocidos o accesibles a través de procedimientos por lo general conocidos que se describen en más detalle en los documentos WO A1 2001/011965 (P1), WO 2005/058828 A1 (P2), WO2005/014545 A2 (P3), WO 2005/103004 A1 (P4), WO 2006/122952 A1 (P5), EP 2 289 880 A1 (P6), WO 2006/08191 A1 (P7), WO 2006/008192 A1 (P8), WO 2004/074280 A1 (P9), WO 2005/058833 A2 (P10), WO 2005/085238 A1 (P11), WO 2005/103006 A1 (P12), WO 2006/122955 A1 (P13), WO 2006/008194 A1 (P14), WO 2006/008193 A1 (P15), WO 2006/067103 A2 (P16) y en caso de que $\mathbb{R}^1 = \mathbb{R}^2 = \text{flúor WO 2013/064460}$.

La diclorobromopiridina (VI) se sintetizó a partir de 2-hidroxi-5-nitroanilina (II) por el uso el procedimiento descrito en

el documento US2004/242644 A y Síntesis 1990, 499 La síntesis del nitrilo (VIII) se realiza de acuerdo con lo descrito en el documento EP1674455 A1 o EP1548007 A1, seguido por la reducción a la amina protegida con BOC (IX) con borohidruro de sodio en presencia de cloruro de níquel y anhídrido de BOC. (IX) se escinde después con cloruro de hidrógeno en metanol a la amina-clorhidrato de (X). La síntesis de la amina (XVII) se realiza en analogía con el procedimiento descrito en el documento WO 2013/064460 A1 (referido como los intermedios IIa-14 y IIa-15).

El clorhidrato de amina (X) o la amina (XVII) se acopla después con el ácido apropiado y un reactivo de acoplamiento tal como HOBT-EDC para producir, por ejemplo, la amida (XI) o (XVIII), en el que B³ representa N o CH y R₀ se define de acuerdo con lo descrito con anterioridad.

Los compuestos de la fórmula (Ia) o (Ib) se sintetizan por medio de una reacción de acoplamiento. En el caso de los azoles Q = N-enlazados, se puede usar un proceso mediado por cobre con óxido de cobre (I), saliciladoxima como ligando en un disolvente tal como acetonitrilo en presencia de una base como carbonato de cesio. En el caso de que Q = heterociclos unidos a carbono, se puede usar un acoplamiento de tipo Suzuki con el ácido borónico o éster apropiado en presencia de un catalizador de paladio y una base.

Otros compuestos con Q = triazol de la fórmula (I) son accesibles a través de la conversión de la amina (V) a la hidracina correspondiente a través de diazotación - reducción y posterior formación de triazol de acuerdo con lo descrito en el documento US2011/77410 A1. Los compuestos con Q = tetrazol son accesibles a través de la conversión de la amina (V) en el nitrilo correspondiente por medio de diazotación - cianación y posterior cicloadición con azida.

Esquema 1:

5

Esquema 2:

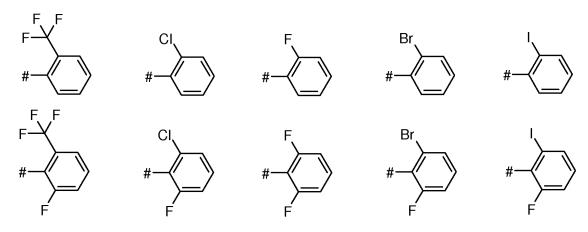
De particular interés son los intermedios de los procedimientos y métodos descritos en el presente documento, en especial los compuestos de la fórmula (XIX) de acuerdo con lo descrito a continuación. Tales compuestos de la fórmula (XIX) comprenden o están en analogía a compuestos de la fórmula (XVIII) en el esquema 2. Estos intermedios son otras realizaciones individuales de la invención.

Por lo tanto, otra realización de la invención es un compuesto de la fórmula (XIX)

en la que

5

10 A se selecciona de:



El compuesto de acuerdo con la presente invención se puede preparar de acuerdo con los procesos descritos con anterioridad. No obstante, se comprende que, sobre la base de su conocimiento general y de las publicaciones disponibles, aquéllos expertos en la materia experiencia serán capaces de adaptar este procedimiento de acuerdo con las características específicas de cada uno de los compuestos, que se desea sintetizar.

10 Los compuestos de la invención se pueden usar como nematicidas y/o como endoparasiticidas.

5

Un "nematicida" de acuerdo como se usa en el presente documento significa que el compuesto es capaz de controlar los nematodos.

El "control de nematodos", de acuerdo con la invención se comprenderá para matar a los nematodos o para prevenir su desarrollo o crecimiento. La eficacia de las composiciones o combinaciones de acuerdo con la invención se

evalúa por medio de la comparación de la mortalidad de los nematodos, el desarrollo de agallas, la formación de quistes, la concentración de nematodos por unidad de volumen de suelo, de los quistes, la concentración de nematodos por raíz, la número de huevos de nematodos por volumen de suelo, la motilidad de los nematodos entre una planta, una planta o parte de la tierra tratada con una composición o combinación de acuerdo con la invención y la planta sin tratar, la parte de planta o el suelo (100 %). Se prefiere una reducción de 25 a 50 % en comparación con la planta sin tratar, parte de planta o el suelo, se prefiere más una reducción de 51 a 79 %, y se prefiere en particular la muerte completa y la prevención completa del desarrollo o crecimiento de una reducción de 80 % a 100 % en comparación con la planta sin tratar, parte de planta o el suelo.

El "control de los nematodos", de acuerdo con la invención se comprenderá asimismo el control de la reproducción de los nematodos (por ejemplo, desarrollo de quistes o huevos). Los compuestos y composiciones de acuerdo con la invención se pueden usar para mantener las plantas sanas y puede ser usado de forma curativa, preventiva o sistémicamente para el control de nematodos.

La expresión "cantidad efectiva para uso biológico" en el contexto de la aplicación de un compuesto químico para controlar un nematodo refiere a una cantidad del compuesto que es suficiente para controlar el nematodo.

- Los expertos conocen procedimientos para determinar la mortalidad de los nematodos, el desarrollo de agallas, la formación de quistes, la concentración de nematodos por unidad de volumen de suelo, de los quistes, la concentración de nematodos por raíz, el número de huevos de nematodos por volumen de suelo, la motilidad de los nematodos entre una planta, una parte de la planta o el suelo. El tratamiento de acuerdo con la invención reduce los daños provocados por los nematodos a la planta y conduce a un aumento del rendimiento.
- Los "nematodos" de acuerdo con lo usado en el presente documento abarcan todas las especies del filo Nematoda y en especies particulares que son parásitos o provocan problemas de salud a la planta o a los hongos (por ejemplo, especies de los órdenes *Aphelenchida*, Meloidogyne, *Tylenchida* y otros) o para los seres humanos y animales (por ejemplo especies de los órdenes Trichinellida, Tylenchida, Rhabditina, y Spirurida), así como otros helmintos parásitos.
- Los "nematodos" como se usan en el presente documento, se refiere a los nematodos de plantas que significa todos 25 los nematodos que provocan daño a las plantas. Los nematodos de las plantas comprenden nemátodos y nematodos que viven en el suelo. Los nematodos parásitos de plantas incluyen parásitos de plantas, pero no se limitan a, ectoparásitos tales como Xiphinema spp., Longidorus spp., y Trichodorus spp.; semiparásitos tales como Tylenchulus spp.; endoparásitos migratorios tales como Pratylenchus spp., Radopholus spp., y Scutellonerna spp.; parásitos sedentarios tales como Heterodera spp., Globodera spp., y Meloidogyne spp., y de tallos y hojas 30 endoparásitos tales como Ditylenchus spp., Aphelenchoides spp., y Hirshmaniella spp.. Los nematodos del suelo en especial dañinos de la raíz parasitaria son los nematodos de formación de quistes de los géneros Heterodera o Globodera, y/o los nematodos de los nudos de la raíz del género Meloidogyne. Las especies nocivas de estos géneros son, por ejemplo Meloidogyne incognita, Heterodera glycines (nematodo guiste de la soja), Globodera 35 pallida y Globodera rostochiensis (nematodo del quiste de la patata), dichas especies se controlan eficazmente con los compuestos descritos en el presente documento. Sin embargo, el uso de los compuestos descritos en el presente documento en ningún modo se restringe a estos géneros o especies, sino que también se extiende de la misma manera a otros nemátodos.
- Los nematodos de las plantas incluyen, pero no se limitan a, por ejemplo Aglenchus agricola, Anguina tritici, 40 Aphelenchoides arachidis, Aphelenchoides Fragaria y endoparásitos de tallo y hojas Aphelenchoides spp. por lo general, Belonolaimus gracilis, longicaudatus Belonolaimus, Belonolaimus nortoni, Bursaphelenchus cocophilus, Bursaphelenchus eremus, Bursaphelenchus xylophilus y Bursaphelenchus spp. por lo general, Cacopaurus pestis, Criconemella curvata, Criconemella onoensis, Criconemella ornata, rusium Criconemella, Criconemella xenoplax (= Mesocriconema xenoplax) y Criconemella spp. por lo general, Criconemoides ferniae, onoense Criconemoides, Criconemoides ornatum y Criconemoides spp. por lo general, Ditylenchus destructor, Ditylenchus dipsaci, 45 Ditylenchus myceliophagus y endoparásitos de tallo y hojas Ditylenchus spp. por lo general, Heterocephalus Dolichodorus, Globodera pallida (= Heterodera pallida), Globodera rostochiensis (nematodo del quiste de la patata), Globodera solanacearum, Globodera tabacum, Globodera virginia y el sedentarismo, formando parásitos Globodera spp quiste por lo general, digonicus Helicotylenchus, Helicotylenchus dihystera, Helicotylenchus érythrine, Helicotylenchus multicinctus, Helicotylenchus nannus, Helicotylenchus pseudorobustus y Helicotylenchus spp. por lo 50 general, Hemicriconemoides, Hemicycliophora arenaria, Hemicycliophora NuData, Hemicycliophora Parvana, Heterodera avenae, Heterodera crucíferas, Heterodera glycines (nematodo del quiste de soja), Heterodera oryzae, Heterodera schachtii, Heterodera zeae y los parásitos sedentarios de formación de quistes Heterodera spp. por lo general, Hirschmaniella gracilis, Hirschmaniella oryzae Hirschmaniella spinicaudata y endoparásitos de tallo y hojas Hirschmaniella spp. por lo general, aegyptii Hoplolaimus, californicus Hoplolaimus, Hoplolaimus columbus, 55 Hoplolaimus galeatus, Hoplolaimus indicus, Hoplolaimus magnistylus, Hoplolaimus pararobustus, Longidorus africanus, breviannulatus Longidorus, Longidorus elongatus, Longidorus laevicapitatus, Longidorus vineacola y los ectoparásitos Longidorus spp. por lo general, Meloidogyne acronea, Meloidogyne africana, Meloidogyne arenaria, Meloidogyne arenaria thamesi, Meloidogyne artiella, Meloidogyne chitwoodi, Meloidogyne coffeicola, Meloidogyne ethiopica, Meloidogyne exigua, Meloidogyne fallax, Meloidogyne graminicola, graminis Meloidogyne, Meloidogyne 60 hapla, Meloidogyne incognita, acrita Meloidogyne incognita, Meloidogyne javanica, Meloidogyne kikuyensis,

Meloidogyne minor, Meloidogyne naasi, Meloidogyne paranaensis, Meloidogyne thamesi y los parásitos sedentarios Meloidogyne spp. por lo general, Meloinema spp., Nacobbus aberrans, Neotylenchus vigissi, Paraphelenchus pseudoparietinus, Paratrichodorus allius, Paratrichodorus lobatus, Paratrichodorus minor, Paratrichodorus nanus, Paratrichodorus porosus, teres Paratrichodorus y Paratrichodorus spp. por lo general, Paratylenchus hamatus, Paratylenchus minutus, Paratylenchus Projectus y Paratylenchus spp. por lo general, Pratylenchus agilis, Pratylenchus alleni, Pratylenchus andinus, brachyurus Pratylenchus, cerealis Pratylenchus, Pratylenchus coffeae, Pratylenchus crenatus, Pratylenchus delattrei, Pratylenchus giibbicaudatus, Pratylenchus goodeyi, Pratylenchus hamatus, Pratylenchus hexincisus, Pratylenchus loosi, Pratylenchus neglectus, Pratylenchus penetrans, Pratylenchus pratensis, Pratylenchus scribneri, teres Pratylenchus, Pratylenchus thornei, Pratylenchus vulnus, Pratylenchus zeae y los endoparásitos migratorios Pratylenchus spp. por lo general, minutus Pseudohalenchus, magnidens Psilenchus, Psilenchus tumidus, Punctodera chalcoensis, Quinisulcius acutus, Radopholus citrophilus, Radopholus similis, los endoparásitos migratorios Radopholus spp. por lo general, borealis Rotylenchulus, Rotylenchulus parvus, reniformis Rotylenchulus y Rotylenchulus spp. por lo general, Rotylenchus laurentinus, Rotylenchus macrodoratus, Rotylenchus robustus, uniformis Rotylenchus y Rotylenchus spp. por lo general, brachyurum Scutellonema, bradys Scutellonema, Scutellonema clathricaudatum y los endoparásitos migratorios Scutellonema spp. por lo general, Subanguina radiciola, Tetylenchus nicotianae, Trichodorus cylindricus, Trichodorus minor, Trichodorus primitivus, proximus Trichodorus, Trichodorus similis, Trichodorus sparsus y los ectoparásitos Trichodorus spp. por lo general, Tylenchorhynchus agro, Tylenchorhynchus brassicae, Tylenchorhynchus Clarus, Tylenchorhynchus claytoni, Tylenchorhynchus digitatus, ebriensis Tylenchorhynchus, Tylenchorhynchus maximus, Tylenchorhynchus nudus, Tylenchorhynchus vulgaris y Tylenchorhynchus spp. por lo general, Tylenchulus semipenetrans y los semiparásitos Tylenchulus spp., americanum Xiphinema, Xiphinema brevicolle, Xiphinema dimorphicaudatum, índice general Xiphinema y los ectoparásitos Xiphinema spp. por lo general.

10

15

20

25

30

35

40

45

50

55

60

Los ejemplos de nematodos a los cuales es aplicable un nematicida de la presente invención incluyen, pero no se limitan a, los nematodos del género Meloidogyne, tales como el nematodo del sur de la raíz (Meloidogyne incognita), javanés nematodo agallador (Meloidogyne javanica), nematodo agallador del norte (Meloidogyne hapla), y nematodo agallador del maní (Meloidogyne arenaria); nematodos del género Ditylenchus tales como el nematodo de pudrición de la patata (Ditylenchus destructor) y los nematodos del bulbo y el tallo (Ditylenchus dipsaci); nematodos del género Pratylenchus, tales como el nematodo de lesión de la raíz de la mazorca (Pratylenchus penetrans), nematodo de la lesión de la raíz del crisantemo (Pratylenchus fallax), nematodo de la lesión del café (Pratylenchus coffeae), nematodo de la lesión del té (Pratylenchus loosi), y nematodo de la lesión del nogal (Pratylenchus vulnus); nematodos del género Globodera tales como el nematodo dorado (Globodera rostochiensis) y nematodo del quiste de la patata (Globodera pallida); nematodos del género Heterodera, tales como el nematodo del quiste de la soja (Heterodera glycines) y nematodo del quiste de la remolacha (Heterodera schachtii); nematodos del género Aphelenchoides tales como los nematodos de punta blanca del arroz (Aphelenchoides besseyi), el nematodo foliar del crisantemo (Aphelenchoides ritzemabosi), y el nematodo de la fresa (Aphelenchoides fragariae); nematodos del género Aphelenchus, tales como el nematodo micrófago (Aphelenchus avenae); nematodos del género Radopholus, tales como el nematodo barrenador (Radopholus similis); nematodos del género Tylenchulus, tales como el nematodo de los cítricos (Tylenchulus semipenetrans); nematodos del género Rotylenchulus, tales como el nematodo reniforme (Rotylenchulus reniformis); nematodos que se producen en los árboles, tales como el nematodo de la madera del pino (Bursaphelenchus xylophilus), y similares.

Las plantas para las cuales se puede usar un nematicida de la presente invención no están limitadas en particular; se pueden mencionar, por ejemplo, las plantas, tales como los cereales (por ejemplo, arroz, cebada, trigo, centeno, avena, maíz, y similares), judías (soja, judías azuki, habas, guisantes, cacahuetes y similares), árboles frutales/frutos (manzanas, especies de cítricos, peras, uvas, melocotones, albaricoques japoneses, cerezas, nueces, almendras, plátanos, fresas y similares), hortalizas (repollo, tomate, espinaca, brócoli, lechuga, cebolla, cebolleta, el pimiento y similares), cultivos de raíces (zanahoria, patata, camote, rábano, raíz de loto, nabo y similares), cultivos industriales (algodón, cáñamo, morera de papel, mitsumata, colza, remolacha, hop, caña de azúcar, remolacha azucarera, oliva, caucho, palmas, café, tabaco, té y similares), pepos (calabaza, pepino, sandía, melón y similares), plantas de pasto (pasto ovillo, sorgo, thimosy, trébol, alfalfa y similares), hierbas del césped (hierba Mascareñas, agrostis y similares), cultivos de aromas, etc. (lavanda, romero, tomillo, perejil, pimienta, jengibre y similares), y plantas de flor (crisantemo, rosa, orquídeas y similares).

Los compuestos y las composiciones que comprenden los compuestos de la presente invención son útiles en particular en el control de nematodos en el café que pertenecen a por lo menos una especie seleccionada de entre el grupo de los nematodos fitoparásitos que consisten en *Pratylenchus brachyurus, Pratylenchus coffeae, Meloidogyne exigua, Meloidogyne incognita, Meloidogyne coffeicola, Helicotylenchus* spp. y también consisten en *paranaensis Meloidogyne, Rotylenchus* spp., *Xiphinema* spp., *Tylenchorhynchus* spp., *Scutellonema* spp.

Los compuestos y las composiciones que comprenden los compuestos de la presente invención son útiles en particular en el control de nematodos en la patata que pertenecen a por lo menos una especie seleccionada de entre el grupo de los nematodos fitoparásitos que consisten en *Pratylenchus brachyurus, Pratylenchus pratensis, Pratylenchus scribneri, Pratylenchus penetrans, Pratylenchus coffeae, Ditylenchus dipsaci* y también consisten en *Pratylenchus alleni, Pratylenchus andinus, Pratylenchus cerealis, Pratylenchus crenatus, Pratylenchus hexincisus, Pratylenchus loosi, Pratylenchus neglectus, Pratylenchus teres, Pratylenchus thornei, Pratylenchus vulnus, Belonolaimus longicaudatus, Trichodorus cylindricus, Trichodorus primitivus, Trichodorus proximus, Trichodorus*

ES 2 640 646 T3

similis, Trichodorus sparsus, Paratrichodorus minor, Paratrichodorus allius, Paratrichodorus nanus, Paratrichodorus teres, Meloidogyne arenaria, Meloidogyne fallax, Meloidogyne hapla, Meloidogyne thamesi, Meloidogyne incognita, Meloidogyne chitwoodi, Meloidogyne javanica, Nacobbus aberrans, Globodera rostochiensis, Globodera pallida, Ditylenchus destructor, Radopholus similis, Rotylenchulus reniformis, Neotylenchus vigissi, Paraphelenchus pseudoparietinus, Aphelenchoides fragariae, Meloinema spp.

Los compuestos y las composiciones que comprenden los compuestos de la presente invención son útiles en particular en el control de nematodos en el tomate que pertenecen a por lo menos una especie seleccionada de entre el grupo de los nematodos fitoparásitos que consisten en *Meloidogyne arenaria, Meloidogyne hapla, Meloidogyne javanica, Meloidogyne incognito, Pratylenchus penetrans* y también consisten en *Pratylenchus brachyurus, Pratylenchus coffeae, Pratylenchus scribneri, Pratylenchus vulnus, Paratrichodorus minor, Meloidogyne exigua, Nacobbus aberrans, Globodera solanacearum, Dolichodorus heterocephalus, Rotylenchulus reniformis.*

10

15

45

50

55

Los compuestos y las composiciones que comprenden los compuestos de la presente invención son útiles en particular en el control de nematodos en las cucurbitáceas que pertenecen a por lo menos una especie seleccionada de entre el grupo de los nematodos fitoparásitos que consisten en *Meloidogyne arenaria*, *Meloidogyne incognita*, *Rotylenchulus reniformis* y también consisten en *Pratylenchus thornei*.

Los compuestos y las composiciones que comprenden los compuestos de la presente invención son útiles en particular en el control de nematodos en el algodón que pertenecen a por lo menos una especie seleccionada de entre el grupo de los nematodos fitoparásitos que consisten en *Belonolaimus longicaudatus, Meloidogyne incognita, Hoplolaimus columbus, Hoplolaimus galeatus, Rotylenchulus reniformis.*

20 Los compuestos y las composiciones que comprenden los compuestos de la presente invención son útiles en particular en el control de nematodos en el maíz que pertenecen a por lo menos una especie seleccionada de entre el grupo de los nematodos fitoparásitos, en especial que consisten en Belonolaimus longicaudatus, Paratrichodorus minor y también consisten en Pratylenchus brachyurus, Pratylenchus delattrei, Pratylenchus hexincisus, Pratylenchus penetrans, Pratylenchus zeae, (Belonolaimus gracilis), Belonolaimus nortoni, Longidorus breviannulatus, Meloidogyne arenaria, Meloidogyne arenaria thamesi, Meloidogyne graminis, Meloidogyne incognita, 25 Meloidogyne incognita acrita, Meloidogyne javanica, Meloidogyne naasi, Heterodera avenae, Heterodera oryzae, Heterodera zeae, Punctodera chalcoensis, Ditylenchus dipsaci, Hoplolaimus aegyptii, Hoplolaimus magnistylus, Hoplolaimus galeatus, Hoplolaimus indicus, Helicotylenchus digonicus, Helicotylenchus dihystera, Helicotylenchus pseudorobustus, Xiphinema americanum, Dolichodorus heterocephalus, Criconemella ornata, Criconemella 30 onoensis, Radopholus similis, Rotylenchulus borealis, Rotylenchulus parvus, Tylenchorhynchus agri, Tylenchorhynchus clarus, Tylenchorhynchus claytoni, Tylenchorhynchus maximus, Tylenchorhynchus nudus, Tylenchorhynchus vulgaris, Quinisulcius acutus, Paratylenchus minutus, Hemicycliophora parvana, Aglenchus agricola, Anguina tritici, Aphelenchoides arachidis, Scutellonema brachyurum, Subanguina radiciola.

Los compuestos y las composiciones que comprenden los compuestos de la presente invención son útiles en particular en el control de nematodos en la soja que pertenecen a por lo menos una especie seleccionada de entre el grupo de los nematodos fitoparásitos, en especial que consisten en *Pratylenchus brachyurus, Pratylenchus pratensis, Pratylenchus penetrans, Pratylenchus scribneri, Belonolaimus longicaudatus, Heterodera glycines, Hoplolaimus columbus* y también consisten en *Pratylenchus coffeae, Pratylenchus hexincisus, Pratylenchus neglectus, Pratylenchus crenatus, Pratylenchus alleni, Pratylenchus agilis, Pratylenchus zeae, Pratylenchus vulnus, (Belonolaimus gracilis), Meloidogyne arenaria, Meloidogyne incognita, Meloidogynejavanica, Meloidogyne hapla, Hoplolaimus columbus, Hoplolaimus galeatus, Rotylenchulus reniformis.*

Los compuestos y las composiciones que comprenden los compuestos de la presente invención son útiles en particular en el control de nematodos en el tabaco que pertenecen a por lo menos una especie seleccionada de entre el grupo de los nematodos fitoparásitos, en especial que consisten en *Meloidogyne incognita, Meloidogyne javanica* y también consisten en *Pratylenchus brachyurus, Pratylenchus pratensis, Pratylenchus hexincisus, Pratylenchus penetrans, Pratylenchus neglectus, Pratylenchus crenatus, Pratylenchus thornei, Pratylenchus vulnus, Pratylenchus zeae, Longidorus elongatu, Paratrichodorus lobatus, Trichodorus spp., Meloidogyne arenaria, Meloidogyne hapla, Globodera tabacum, Globodera solanacearum, Globodera virginiae, Ditylenchus dipsaci, Rotylenchus spp., Helicotylenchus spp., Xiphinema americanum, Criconemella spp., Rotylenchulus reniformis, Tylenchorhynchus claytoni, Paratylenchus spp., Tetylenchus nicotianae.*

Los compuestos y las composiciones que comprenden los compuestos de la presente invención son útiles en particular en el control de nematodos en los cítricos que pertenecen a por lo menos una especie seleccionada de entre el grupo de los nematodos fitoparásitos, en especial que consisten en *Pratylenchus coffeae* y también consisten en *Pratylenchus brachyurus*, *Pratylenchus vulnus*, *Belonolaimus longicaudatus*, *Paratrichodorus minor*, *Paratrichodorus porosus*, *Trichodorus*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne incognita acrita*, *Meloidogyne javanica*, *Rotylenchus macrodoratus*, *Xiphinema americanum*, *Xiphinema brevicolle*, *Xiphinema index*, *Criconemella* spp., *Hemicriconemoides*, *Radopholus similisrespectively Radopholus citrophilus*, *Hemicycliophora arenaria*, *Hemicycliophora nudata*, *Tyleuchulus semipenetrans*.

Los compuestos y las composiciones que comprenden los compuestos de la presente invención son útiles en

particular en el control de nematodos en el plátano que pertenecen a por lo menos una especie seleccionada de entre el grupo de los nematodos fitoparásitos, en especial que consisten en *Pratylenchus coffeae, Radopholus similis* y también consisten en *Pratylenchus giibbicaudatus, Pratylenchus loosi, Meloidogyne* spp., *Helicotylenchus multicinctus, Helicotylenchus dihystera, Rotylenchulus* spp.

- Los compuestos y las composiciones que comprenden los compuestos de la presente invención son útiles en particular en el control de nematodos en la piña que pertenecen a por lo menos una especie seleccionada de entre el grupo de los nematodos fitoparásitos, en especial que consisten en *Pratylenchus zeae, Pratylenchuspratensis, Pratylenchus brachyurus, Pratylenchus goodeyi., Meloidogyne* spp., *Rotylenchulus reniformis* y también consisten en *Longidorus elongatus, Longidorus laevicapitatus, Trichodorus primitivus, Trichodorus manor, Heterodera* spp.,
 Ditylenchus myceliophagus, Hoplolaimus californicus, Hoplolaimus pararobustus, Hoplolaimus indicus, Helicotylenchus dihystera, Helicotylenchus nannus, Helicotylenchus multicinctus, Helicotylenchus erythrine, Xiphinema dimorphicaudatum, Radopholus similis, Tylenchorhynchus digitatus, Tylenchorhynchus ebriensis, Paratylenchus minutes, Scutellonema clathricaudatum, Scutellouema bradys, Psilenchus tumidus, Psilenchus magnidens, Pseudohalenchus minutus, Criconemoides ferniae, Criconemoides onoense, Criconemoides ornatum.
- Los compuestos y las composiciones que comprenden los compuestos de la presente invención son útiles en particular en el control de nematodos en las uvas que pertenecen a por lo menos una especie seleccionada de entre el grupo de los nematodos fitoparásitos, en especial que consisten en *Pratylenchus vulnus, Meloidogyne arenaria, Meloidogyne incognita, Meloidogyne javanica, Xiphinema americanum, Xiphinema index* y también consisten en *Pratylenchus pratensis, Pratylenchus scribneri, Pratylenchus neglectus, Pratylenchus brachyurus, Pratylenchus thornei, Tylenchulus semipenetrans.*

Los compuestos y las composiciones que comprenden los compuestos de la presente invención son útiles en particular en el control de nematodos en los cultivos de árboles - frutas de pepita, que pertenecen a por lo menos una especie seleccionada de entre el grupo de los nematodos fitoparásitos, en especial consisten en *Pratylenchus penetrans* y también consisten en *Pratylenchus vulnus, Longidorus elongatus, Meloidogyne incognita, Meloidogyne hapla.*

Los compuestos y las composiciones que comprenden los compuestos de la presente invención son útiles en particular en el control de nematodos en los cultivos de árboles - frutas de hueso, que pertenecen a por lo menos una especie seleccionada de entre el grupo de los nematodos fitoparásitos, en especial consisten en *Pratylenchus penetrans, Pratylenchus vulnus, Meloidogyne arenaria, Meloidogyne hapla, Meloidogyne javanica, Meloidogyne incognita, Criconemella xenoplax* y también consisten en *Pratylenchus brachyurus, Pratylenchus coffeae, Pratylenchus scribneri, Pratylenchus zeae, Belonolaimus longicaudatus, Helicotylenchus dihystera, Xiphinema americanum, Criconemella curvata, Tylenchorhynchus claytoni, Paratylenchus hamatus, Paratylenchus projectus, Scutellonema brachvurum. Hoplolaimus galeatus.*

Los compuestos y las composiciones que comprenden los compuestos de la presente invención son útiles en particular en el control de nematodos en los cultivos de árboles - nueces, que pertenecen a por lo menos una especie seleccionada de entre el grupo de los nematodos fitoparásitos, en especial consisten en *Trichodorus* spp., *Criconemella rusium* y también consisten en *Pratylenchus vulnus, Paratrichodorus* spp., *Meloidogyneincognita, Helicotylenchus* spp., *Tylenchorhynchus* spp., *Cacopaurus pestis*.

De manera similar, los "nematodos" como se usan en el presente documento, se refieren a los nematodos que provocan daños a los seres humanos o los animales.

Las especies de nematodos específicos perjudiciales para los seres humanos o los animales son:

Trichinellida por ejemplo:. Trichuris spp., Capillaria spp., Trichomosoides spp., Trichinella spp.

Del orden de los Tylenchida por ejemplo: Micronema spp., Strongyloides spp.

25

30

40

55

Del orden de los Rhabditina por ejemplo: Strongylus spp., Triodontophorus spp., Oesophagodontus spp.,

Trichonema spp., Gyalocephalus spp., Cylindropharynx spp., Poteriostomum spp., Cyclococercus spp.,

Cylicostephanus spp., Oesophagostomum spp., Chabertia spp., Stephanurus spp., Ancylostoma spp., Uncinaria
spp., Bunostomum spp., Globocephalus spp., Syngamus spp., Cyathostoma spp., Metastrongylus spp.,

Dictyocaulus spp., Muellerius spp., Protostrongylus spp., Neostrongylus spp., Cystocaulus spp.,

Pneumostrongylus spp., Spicocaulus spp., Elaphostrongylus spp. Parelaphostrongylus spp., Crenosoma spp.,

Paracrenosoma spp., Angiostrongylus spp., Aelurostrongylus spp., Filaroides spp., Parafilaroides spp.,

Trichostrongylus spp., Haemonchus spp., Ostertagia spp., Marshallagia spp., Cooperia spp., Nematodirus spp.,

Hyostrongylus spp., Obeliscoides spp., Amidostomum spp., Ollulanus spp.

Del orden de los Spirurida por ejemplo: Oxiuris spp., Enterobius spp., Passalurus spp., Syphacia spp., Aspiculuris spp., Heterakis spp.; Ascaris spp., Toxascaris spp., Toxocara spp., Baylisascaris spp., Parascaris spp., Anisakis spp., Ascaridia spp.; Gnathostoma spp., Physaloptera spp., Thelazia spp., Gongylonema spp., Habronema spp., Parabronema spp., Draschia spp., Dracunculus spp.; Stephanofilaria spp., Parafilaria spp., Setaria spp., Loa spp., Dirofilaria spp., Litomosoides spp., Brugia spp., Wuchereria spp., Onchocerca spp.

Muchos nematicidas conocidos son igualmente activos contra otros helmintos parásitos y por lo tanto se usan para controlar los gusanos parásitos seres humanos y animales, que no necesariamente pertenecen al grupo de los nematodos. Por lo tanto, se prevé por la presente invención que los compuestos descritos en el presente documento también se pueden usar como fármacos antihelmínticos en un sentido más general. Los helmintos endoparásitos patógenos incluyen platyhelmintha (por ejemplo monogeneos, cestodos y trematodos), acanthocephala y pentastoma. Los siguientes helmintos se pueden mencionar a modo de ejemplo y a modo de preferencia - pero sin limitación alguna:

Monogenea: por ejemplo: Gyrodactylus spp., Dactylogyrus spp., Polystoma spp.

5

10

25

35

40

Cestodes: Del orden de los Pseudophyllidea por ejemplo: *Diphyllobothrium* spp., *Spirometra* spp., *Schistocephalus* spp., *Ligula* spp., *Bothridium* spp., *Diplogonoporus* spp.

Del orden de los Cyclophyllida por ejemplo: *Mesocestoides* spp., *Anoplocephala* spp., *Paranoplocephala* spp., *Moniezia* spp., *Thysanosoma* spp., *Thysaniezia* spp., *Avitellina* spp., *Stilesia* spp., *Cittotaenia* spp., *Andyra* spp., *Bertiella* spp., *Taenia* spp., *Echinococcus* spp., *Hydatigera* spp., *Davainea* spp., *Raillietina* spp., *Hymenolepis* spp., *Echinocotyle* spp., *Diorchis* spp., *Dipylidium* spp., *Joyeuxiella* spp., *Diplopylidium* spp.

Trematodes: Del orden de los digeneos por ejemplo: Diplostomum spp., Posthodiplostomum spp., Schistosoma spp., Trichobilharzia spp., Ornithobilharzia spp., Austrobilharzia spp., Gigantobilharzia spp., Leucochloridium spp., Brachylaima spp., Echinostoma spp., Echinoparyphium spp., Echinochasmus spp., Hypoderaeum spp., Fasciola spp., Fasciolides spp., Fasciolopsis spp., Cyclocoelum spp., Typhlocoelum spp., Paramphistomum spp., Calicophoron spp., Cotylophoron spp., Gigantocotyle spp., Fischoederius spp., Gastrothylacus spp., Notocotylus spp., Catatropis spp., Plagiorchis spp., Prosthogonimus spp., Dicrocoelium spp., Eurytrema spp., Troglotrema spp., Paragonimus spp., Collyriclum spp., Nanophyetus spp., Opisthorchis spp., Clonorchis spp., Metorchis spp., Heterophyes spp., Metagonimus spp.

Acantocephala: Del orden de los Oligacanthorhynchida z.B:. *Macracanthorhynchus* spp., *Prosthenorchis* spp.; del orden de los Polymorphida por ejemplo: *Filicollis* spp.; del orden de los Moniliformida por ejemplo: *Moniliformis* spp.,

Del orden de los Echinorhynchida por ejemplo *Acanthocephalus* spp., *Echinorhynchus* spp., *Leptorhynchoides* spp.

Pentastoma: Del orden de los Porocephalida por ejemplo *Linguatula* spp.

En el campo veterinario y en la cría de animales, la administración de los compuestos activos de acuerdo con la invención se lleva a cabo de la manera conocida directa o por vía enteral, parenteral, dérmica o nasal de forma de preparaciones adecuadas. La administración se puede llevar a cabo de forma profiláctica o terapéutica.

Un aspecto adicional de la invención son composiciones nematicidas, que comprenden una cantidad efectiva de por lo menos un compuesto de acuerdo con lo definido en el presente documento y por lo menos uno de los siguientes: un tensioactivo, un diluyente sólido o líquido, caracterizado porque el agente tensioactivo o el diluyente se usa normalmente en composiciones de nematicidas. En una realización, dicha composición comprende por lo menos dos compuestos de acuerdo con lo definido en el presente documento.

Un aspecto relacionado de la invención es un procedimiento para preparar una composición nematicida de acuerdo con lo descrito en el presente documento, que comprende la etapa de mezclar por lo menos un compuesto de acuerdo con lo descrito en el presente documento con un agente tensioactivo o diluyente usado normalmente en las composiciones nematicidas. En una realización, dicho procedimiento comprende la mezcla de por lo menos dos compuestos de acuerdo con lo definido en el presente documento con un agente tensioactivo o diluyente usado normalmente en las composiciones nematicidas.

En particular, la presente invención se refiere a una composición nematicida desarrollada para ser usado en la agricultura u horticultura. Estas composiciones nematicidas se pueden preparar de una manera conocida *per se*.

En el campo de la salud animal, es decir, en el campo de la medicina veterinaria, los compuestos activos de acuerdo con la presente invención son activos contra parásitos de los animales, en los ectoparásitos o endoparásitos particulares. El término incluye endoparásitos en helmintos y protozoos particulares, tales como coccidios. Los ectoparásitos son de forma típica y preferentemente artrópodos, en particular, insectos y ácaros. Los compuestos de la fórmula (I) son preferentemente activos contra helmintos.

50 En el campo de la medicina veterinaria de los compuestos de acuerdo con la invención son adecuados, con una toxicidad sangre caliente favorable, para el control de parásitos que se producen en la cría de animales y la cría de animales en la ganadería, la cría, zoológico, de laboratorio, experimental y los animales domésticos. Son activos contra todas o específicas etapas del desarrollo de los parásitos.

Los animales agrícolas incluyen, por ejemplo mamíferos, tales como, ovejas, cabras, caballos, asnos, camellos,

búfalos, conejos, renos, gamos, y en particular, el ganado y los cerdos; o aves tales como pavos, patos, gansos, y en particular pollos; o pescado o crustáceos, por ejemplo, en la acuicultura; o como el caso puede ser insectos, tales como las abejas.

Los animales domésticos incluyen, por ejemplo mamíferos, tales como hámsteres, cobayas, ratas, ratones, chinchillas, hurones o en particular perros, gatos; aves de jaula; reptiles; anfibios o peces de acuario.

De acuerdo con una realización preferida, los compuestos de acuerdo con la invención se administran a mamíferos.

De acuerdo con otra realización preferida, los compuestos de acuerdo con la invención se administran a las aves, a saber, aves de jaula o en particular las aves de corral.

Por el uso de los productos activos de acuerdo con la invención para controlar parásitos en animales, se pretende reducir o prevenir la enfermedad, los casos de muertes y reducciones de rendimiento (en el caso de la carne, leche, lana, pieles, huevos, miel y similares), por lo que es posible un mantenimiento de los animales más económico y sencillo y un mejor bienestar animal es alcanzable.

El término "control" o "controlador" como se usa en el presente documento con respecto al campo de la salud animal, significa que los compuestos activos son eficaces en la reducción de la incidencia del respectivo parásito en un animal infectado con dichos parásitos a niveles inocuos. De forma más específica, el "controlador", como se usa en el presente documento, significa que el compuesto activo es eficaz para matar el parásito respectivo, para inhibir su crecimiento, o para inhibir su proliferación.

Los artrópodos representativos incluyen:

5

15

35

40

del orden de los Anoplurida, por ejemplo Haematopinus spp., Linognathus spp., Pediculus spp., Phtirus spp., Solenopotes spp.; Del orden de los Mallophagida y los subórdenes Amblycerina y Ischnocerina, por ejemplo Trimenopon spp., Menopon spp., Trinoton spp., Bovicola spp., Werneckiella spp., Lepikentron spp., Damalina spp., Trichodectes spp., Felicola spp.; Del orden de los dípteros y de los subórdenes Nematocerina y Brachycerina, por ejemplo Aedes spp., Anopheles spp., Culex spp., Simulium spp., Eusimulium spp., Phlebotomus spp., Lutzomyia spp., Culicoides spp., Chrysops spp., Odagmia spp., Wilhelmia spp., Hybomitra spp., Atylotus spp., Tabanus spp., Haematopota spp., Philipomyia spp., Braula spp., Musca spp., Hydrotaea spp., Stomoxis spp., Haematobia spp., Morellia spp., Fannia spp., Glossina spp., Calliphora spp., Lucilia spp., Chrysomyia spp., Wohlfahrtia spp., Sarcophaga spp., estro spp., Hypoderma spp., Gasterophilus spp., Hippobosca spp., Lipoptena spp., Melophagus spp., Rhinoestrus spp., Tipula spp.; Del orden de los Siphonapterida, por ejemplo Pulex spp., Ctenocephalides spp., Tunga spp., Xenopsylla spp., Ceratophyllus spp.; así como plagas molestas del orden de los Blattarida.

Además, entre los artrópodos, los siguientes ácaros se pueden mencionar a modo de ejemplo:

de la subclase de la Acari (Acarina) y el orden de la Metastigmata, por ejemplo de la familia de Argasidae como Argas spp., Ornithodorus spp., Otobius spp., de la familia de Ixodidae como Ixodes spp., Amblyomma spp., Rhipicephalus (Boophilus) Dermacentor spp., Haemophysalis spp., Hyalomma spp., Rhipicephalus spp. (el género original del anfitrión de varias garrapatas); desde el fin de Mesostigmata como Dermanyssus spp., Ornithonyssus spp., Pneumonyssus spp., Raillietia spp., Pneumonyssus spp., Sternostoma spp., Varroa spp., Acarapis spp.; Del orden de los Actinedida (Prostigmata), por ejemplo Acarapis spp., Cheyletiella spp., Ornithocheyletia spp., Myobia spp., Psorergates spp., Demodex spp., Trombicula spp., Neotrombiculla spp., Listrophorus spp.; y del orden de los Acaridida (Astigmata), por ejemplo Acarus spp., Tyrophagus spp., Caloglyphus spp., Hypodectes spp., Pterolichus spp., Psoroptes spp., Chorioptes spp., Otodectes spp., Sarcoptes spp., Notoedres spp., Knemidocoptes spp., Cytodites spp., Laminosioptes spp.

Los protozoos parasitarios representativos incluyen:

Mastigóforos (Flagellata), tales como, por ejemplo, Trypanosomatidae, por ejemplo, Trypanosoma b. brucei, T.B. gambiense, T.B. rhodesiense, T. congolense, T. cruzi, T. evansi, T. equinum, T. lewisi, T. percae, T. simiae, T. vivax, Leishmania brasiliensis, L. donovani, L. tropica, tales como, por ejemplo, Trichomonadidae, por ejemplo, Giardia lamblia, G. canis.

Sarcomastigóforos (Rhizopoda), tales como Entamoebidae, por ejemplo, Entamoeba histolytica, Hartmanellidae, por ejemplo, Acanthamoeba sp., Harmanella sp.

Apicomplexa (Sporozoa), tales como Eimeridae, por ejemplo, Eimeria acervulina, E. adenoides, E. alabamensis, E. anatis, E. anserina, E. arloingi, E. Ashata, E. auburnensis, E. bovis, E. brunetti, E. canis, E. chinchillae, E. clupearum, E. columbae, E. contorta, E. crandalis, E. debliecki, E. dispersa, E. ellipsoidales, E. falciformis, E. Faurei, E. flavescens, E. gallopavonis, E. Hagani, E. intestinalis, E. iroquoina, E. irresidua, E. labbeana, E. leucarti, E. magna, E. maxima, E. medios, E. Meleagridis, E. meleagrimitis, E. mitis, E. necatrix, E. ninakohlyakimovae, E. ovis, E. parva, E. pavonis, E. perforans, E. phasani, E. piriforme, E. praecox, E. residua, E. scabra, E. spec., E. stiedai, E. suis, E.

tenella, E. truncata, E. truttae, E. zuernii, Globidium spec., Isospora belli, I. canis, I. felis, I. ohioensis, I. rivolta, I. spec., I. suis, Cystisospora spec, Cryptosporidium spec, en particular C. parvum..; tales como Toxoplasmadidae, por ejemplo, Toxoplasma gondii, Hammondia heydornii, Neospora caninum, besnoitii Besnoitia; tales como Sarcocystidae, por ejemplo, Sarcocystis bovicanis, S. bovihominis, S. ovicanis, S. ovifelis, S. neurona, S. spec., S. suihominis, tales como Leucozoidae, por ejemplo, Leucozytozoon simondi, tales como, por Plasmodiidae ejemplo, Plasmodium berghei, P. falciparum, P. malariae, P. ovale, P. vivax, P. spec., tales como Piroplasmea, por ejemplo, Babesia Argentina, B. bovis, B. canis, B. spec,. Theileria parva, Theileria spec., tales como Adeleina, por ejemplo, Hepatozoon canis, H. spec.

Los endoparásitos patógenos representativos, que son los helmintos, incluyen platyhelmintha (por ejemplo monogeneos, cestodos y trematodos), nematodos, acanthocephala y pentastoma. Los helmintos representativos adicionales incluyen:

Monogenea: por ejemplo: Gyrodactylus spp., Dactylogyrus spp., Polystoma spp.

5

40

45

Cestodes: Del orden de los Pseudophyllidea por ejemplo: Diphyllobothrium spp., Spirometra spp., Schistocephalus spp., Ligula spp., Bothridium spp., Diplogonoporus spp.

Del orden de los Cyclophyllida por ejemplo: Mesocestoides spp., Anoplocephala spp., Paranoplocephala spp., Moniezia spp., Thysanosoma spp., Thysaniezia spp., Avitellina spp., Stilesia spp., Cittotaenia spp., Andyra spp., Bertiella spp., Taenia spp., Echinococcus spp., Hydatigera spp., Davainea spp., Raillietina spp., Hymenolepis spp., Echinolepis spp., Echinocotyle spp., Diorchis spp., Dipylidium spp., Joyeuxiella spp., Diplopylidium spp.

Trematodes: Del orden de los digeneos por ejemplo: Diplostomum spp., Posthodiplostomum spp., Schistosoma spp., Trichobilharzia spp., Ornithobilharzia spp., Austrobilharzia spp., Gigantobilharzia spp., Leucochloridium spp., Brachylaima spp., Echinostoma spp., Echinoparyphium spp., Echinochasmus spp., Hypoderaeum spp., Fasciola spp., Fasciolides spp., Fasciolopsis spp., Cyclocoelum spp., Typhlocoelum spp., Paramphistomum spp., Calicophoron spp., Cotylophoron spp., Gigantocotyle spp., Fischoederius spp., Gastrothylacus spp., Notocotylus spp., Catatropis spp., Plagiorchis spp., Prosthogonimus spp., Dicrocoelium spp., Eurytrema spp., Troglotrema spp., Paragonimus spp., Collyriclum spp., Nanophyetus spp., Opisthorchis spp., Clonorchis spp. Metorchis spp., Heterophyes spp., Metagonimus spp.

Los nematodos: Trichinellida por ejemplo: Trichuris spp., Capillaria spp., Trichomosoides spp., Trichinella spp.

Del orden de los Tylenchida por ejemplo: Micronema spp., Strongyloides spp.

Del orden de los Rhabditina por ejemplo: Strongylus spp., Triodontophorus spp., Oesophagodontus spp.,

Trichonema spp., Gyalocephalus spp., Cylindropharynx spp., Poteriostomum spp., Cyclococercus spp.,

Cylicostephanus spp., Oesophagostomum spp., Chabertia spp., Stephanurus spp., Ancylostoma spp., Uncinaria spp., Bunostomum spp., Globocephalus spp., Syngamus spp., Cyathostoma spp., Metastrongylus spp.,

Dictyocaulus spp., Muellerius spp., Protostrongylus spp., Neostrongylus spp., Cystocaulus spp.,

Pneumostrongylus spp., Spicocaulus spp., Elaphostrongylus spp. Parelaphostrongylus spp., Crenosoma spp.,

Paracrenosoma spp., Angiostrongylus spp., Aelurostrongylus spp., Filaroides spp., Parafilaroides spp.,

Trichostrongylus spp., Haemonchus spp., Ostertagia spp., Marshallagia spp., Cooperia spp., Nematodirus spp.,

Hyostrongylus spp., Obeliscoides spp., Amidostomum spp., Ollulanus spp.

Del orden de los Spirurida por ejemplo: Oxiuris spp., Enterobius spp., Passalurus spp., Syphacia spp., Aspiculuris spp., Heterakis spp.; Ascaris spp., Toxascaris spp., Toxocara spp., Baylisascaris spp., Parascaris spp., Anisakis spp., Ascaridia spp.; Gnathostoma spp., Physaloptera spp., Thelazia spp., Gongylonema spp., Habronema spp., Parabronema spp., Draschia spp., Dracunculus spp.; Stephanofilaria spp., Parafilaria spp., Setaria spp., Loa spp., Dirofilaria spp., Litomosoides spp., Brugia spp., Wuchereria spp., Onchocerca spp.

Acantocephala: Del orden de los Oligacanthorhynchida z.B.: Macracanthorhynchus spp., Prosthenorchis spp.; del orden de los Polymorphida por ejemplo: Filicollis spp.; del orden de los Moniliformida por ejemplo: Moniliformis spp.,

Del orden de los Echinorhynchida por ejemplo Acanthocephalus spp., Echinorhynchus spp., Leptorhynchoides spp.

Pentastoma: Del orden de los Porocephalida por ejemplo Linguatula spp.

En el campo veterinario y en la cría de animales, la administración de los compuestos activos de acuerdo con la invención se lleva a cabo por procedimientos por lo general conocidos en la técnica, tales como por vía enteral, parenteral, dérmica o nasal de forma de preparaciones adecuadas. La administración se puede llevar a cabo de forma profiláctica o terapéutica.

Por lo tanto, una realización de la presente invención se refiere a compuestos de acuerdo con la invención para uso como un medicamento.

Otro aspecto se refiere a compuestos de acuerdo con la invención para uso como un agente antiendoparasitical, en particular un agente helminticidal o agente antiprotozoairo. Por ejemplo, los compuestos de acuerdo con la invención para uso como un agente antiendoparasitical, en particular un agente helminticidal o agente antiprotozoairo, por ejemplo, en la cría de animales, en la cría de animales, en el alojamiento de animales, en el sector de la higiene.

- Sin embargo, otro aspecto se refiere a compuestos de acuerdo con la invención para uso como un agente antiectoparasitical, en particular un agente artropodicida tal como un agente insecticida o agente acaricida. Por ejemplo, los compuestos de acuerdo con la invención para uso como un agente antiectoparasitical, en particular un agente artropodicida tal como un agente insecticida o acaricida agente, por ejemplo, en la cría de animales, en la cría de animales, en el alojamiento de animales, en el sector de la higiene.
- La presente invención proporciona además formulaciones y formas de aplicación preparadas a partir de ellos, tales como agentes de protección de cultivos y/o agentes pesticidas, tales como licores de drenaje, goteo y pulverización para rociar, que comprende por lo menos uno de los compuestos activos de la invención. Las formas de aplicación pueden comprender otros agentes de protección de cultivos y/o agentes pesticidas, y/o adyuvantes que mejoran la actividad tales como penetrantes, siendo ejemplos aceites vegetales tales como, por ejemplo, aceite de colza, aceite de girasol, aceites minerales tales como, por ejemplo, parafinas líquidas, ésteres de alquilo de ácidos grasos vegetales, tales como aceite de colza o ésteres metílicos de aceite de soja, o alcoxilatos de alcanol, y/o esparcidores tal como, por ejemplo, siloxanos y/o sales, siendo ejemplos sales de amonio o de fosfonio orgánicos o inorgánicos, siendo ejemplos los promotores de sulfato de amonio o hidrógeno fosfato de diamonio, y/o de retención, tales como sulfosuccinato de dioctilo o polímeros hidroxipropilguar y/o humectantes tales como glicerol y/o fertilizantes, tales como fertilizantes de amonio, potasio o fósforo, por ejemplo.

Los ejemplos de formulaciones típicas incluyen líquidos solubles en agua (SL), concentrados emulsionables (EC), emulsiones en agua (EW), concentrados en suspensión (SC, SE, SF, OD), gránulos dispersables en agua (WG), gránulos (GR) y concentrados en cápsula (SC); estos y otros posibles tipos de formulación se describen, por ejemplo, en Crop Life International y en especificaciones de plaguicidas, Manual sobre el desarrollo y uso de la FAO y la OMS para plaguicidas, Papeles de Producción Vegetal de la FAO y Protección - 173, preparado por la FAO/OMS Reunión Conjunta sobre Especificaciones de Plaguicidas, 2004, ISBN: 9251048576. Las formulaciones pueden comprender compuestos agroquímicos activos distintos de uno o más compuestos activos de la invención.

25

30

40

45

50

Las formulaciones o formularios de solicitud en cuestión comprenden preferentemente auxiliares, tales como diluyentes, disolventes, promotores espontaneidad, portadores, emulsionantes, dispersantes, protectores de la helada, biocidas, espesantes y/u otros auxiliares, tales como adyuvantes, por ejemplo. Un adyuvante en este contexto es un componente que aumenta el efecto biológico de la formulación, sin el componente en sí tiene un efecto biológico. Los ejemplos de adyuvantes son agentes que promueven la retención, difusión, fijación a la superficie de la hoja, o la penetración.

Estas formulaciones se preparan de una manera conocida, por ejemplo por medio de mezclado de los compuestos activos con auxiliares tales como, por ejemplo, diluyentes, disolventes y/o portadores sólidos y/o otras sustancias auxiliares, tales como, por ejemplo, tensioactivos. Las formulaciones se preparan en plantas adecuadas o bien antes o durante la aplicación.

Adecuadas para su uso como auxiliares son las sustancias que son adecuadas para impartir a la formulación del compuesto activo o de las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones (tales como, por ejemplo, agentes de protección de cultivos que pueden usarse, tales como caldos de pulverización o tratamiento de semillas) propiedades particulares tales como ciertas propiedades físicas, técnicas y/o biológicas.

Los extensores adecuados son, por ejemplo, agua, líquidos químicos orgánicos polares y no polares, por ejemplo de las clases de los hidrocarburos aromáticos y no aromáticos (como parafinas, alquilbencenos, alquilhaftalenos, clorobencenos), los alcoholes y polioles (que, si es apropiado, también pueden estar sustituidos, eterificados y/o esterificados), las cetonas (tales como acetona, ciclohexanona), ésteres (que incluyen grasas y aceites) y (poli) éteres, las aminas sustituidos y no sustituidos, amidas, lactamas (como N alquilpirrolidonas) y lactonas, las sulfonas y sulfóxidos (tales como dimetilsulfóxido).

Si el extensor usado es agua, también es posible emplear, por ejemplo, disolventes orgánicos como disolventes auxiliares. Como disolventes líquidos entran en consideración: los hidrocarburos aromáticos, tales como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, compuestos aromáticos clorados e hidrocarburos alifáticos clorados, tales como clorobencenos, cloroetilenos o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos tales como ciclohexano o parafinas, por ejemplo fracciones de petróleo, aceites minerales y vegetales, alcoholes tales como butanol o glicol, así como sus éteres y ésteres, cetonas tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona, o ciclohexanona, los disolventes fuertemente polares tales como dimetilformamida y dimetilsulfóxido, y también agua.

En principio es posible usar todos los disolventes adecuados. Los disolventes adecuados son, por ejemplo, hidrocarburos aromáticos, tales como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, por ejemplo, hidrocarburos clorados aromáticos o alifáticos, tales como clorobenceno, cloroetileno o cloruro de metileno, por ejemplo, hidrocarburos alifáticos, tales como ciclohexano, por ejemplo, parafinas, fracciones de petróleo, aceites minerales y vegetales,

ES 2 640 646 T3

alcoholes, tales como metanol, etanol, isopropanol, butanol o glicol, por ejemplo, y también sus éteres y ésteres, cetonas tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona, o ciclohexanona, por ejemplo, disolventes fuertemente polares, tales como dimetilsulfóxido, y el agua.

En principio se pueden usar todos los portadores adecuados. Los portadores adecuados son, en particular: por ejemplo, sales de amonio y los minerales naturales, tales como caolines, arcillas, talco, creta, cuarzo, atapulgita, montmorillonita o tierra de diatomeas, y minerales sintéticos molidos, tales como ácido silícico altamente disperso, óxido de aluminio y silicatos naturales o sintéticos, resinas, ceras y/o fertilizantes sólidos. Asimismo se pueden usar mezclas de tales portadores. Los portadores adecuados para gránulos incluyen lo siguiente: por ejemplo, triturado y minerales naturales fraccionados, tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita, y gránulos también sintéticos de harinas inorgánicas y orgánicas, así como granulados de materiales orgánicos, tales como serrines, papel, cáscaras de coco, mazorcas de maíz y tallos de tabaco.

5

10

35

40

45

50

También se pueden usar diluyentes o disolventes gaseosos licuados. En particular adecuados son los diluyentes o portadores que a temperatura normal y a presión normal son gaseosos, siendo ejemplos los propelentes de aerosoles, tales como hidrocarburos halogenados, así como butano, propano, nitrógeno y dióxido de carbono.

- Los ejemplos de emulsionantes y/o espumantes, dispersantes o agentes humectantes que tienen propiedades iónicos o no iónicos, o mezclas de estas sustancias de superficie activa, son sales de ácido poliacrílico, sales de ácido lignosulfónico, sales de ácido fenolsulfónico o ácido naftalenosulfónico, policondensados de óxido de etileno con alcoholes grasos o con ácidos grasos o con aminas grasas, fenoles sustituidos con (preferentemente alquilfenoles o arilfenoles), sales de ésteres de sulfosuccínico, derivados de taurina (preferentemente alquiltauratos), ésteres fosfóricos de alcoholes o fenoles polietoxilados, ésteres de ácidos grasos de polioles, y derivados de los compuestos que contienen sulfatos, sulfonatos y fosfatos, siendo ejemplos poliglicoléteres de alquilarilo, alquilsulfonatos, alquilsulfatos, arilsulfonatos, hidrolizados de proteínas, lignina-sulfito y metilcelulosa licores residuales. La presencia de una sustancia de superficie activa es ventajosa si uno de los compuestos activos y/o uno de los portadores inertes no es soluble en agua y si la aplicación se lleva a cabo en agua.
- Otros auxiliares que pueden estar presentes en las formulaciones y en las formas de aplicación derivados de ellos incluyen colorantes tales como pigmentos inorgánicos, siendo ejemplos de óxido de hierro, óxido de titanio, azul Prusia y colorantes orgánicos, tales como colorantes de alizarina, colorantes azoicos y colorantes de ftalocianina metálicos, y nutrientes y nutrientes en trazas, tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y zinc.
- También pueden estar presentes estabilizadores, tales como estabilizadores de baja temperatura, conservantes, antioxidantes, estabilizadores de la luz u otros agentes que mejoran la estabilidad química y/o física. Adicionalmente pueden estar presentes generadores de espuma o antiespumantes.
 - Además, las formulaciones y formas de aplicación derivados de ellas pueden comprender también, tales como auxiliares adicionales, adhesivos tales como carboximetilcelulosa, polímeros naturales y sintéticos en polvo, gránulo o de forma de látex, tales como goma árabe, alcohol polivinílico, acetato de polivinilo, y también fosfolípidos naturales, tales como cefalina y lecitina, y fosfolípidos sintéticos. Además posibles auxiliares se incluyen los aceites minerales y vegetales.
 - Posiblemente puede haber otros productos auxiliares presentes en las formulaciones y los formularios de solicitud derivados de ellos. Los ejemplos de tales aditivos incluyen fragancias, coloides protectores, adhesivos, aglutinantes, espesantes, sustancias tixotrópicas, penetrantes, promotores de retención, estabilizantes, secuestrantes, agentes formadores de complejos, humectantes y difusores. En términos generales, los compuestos activos se pueden combinar con cualquier aditivo sólido o líquido usado comúnmente para los propósitos de formulación.
 - Los promotores de retención adecuados incluyen todas aquellas sustancias que reducen la tensión superficial dinámica, tal como dioctil sulfosuccinato, o aumentan la viscoelasticidad, tales como polímeros hidroxipropilguar, por ejemplo.
 - Los penetrantes adecuados en el presente contexto incluyen todas aquellas sustancias que se usan de forma típica para mejorar la penetración de los compuestos activos agroquímicos en plantas. Penetrantes en este contexto se definen en que, a partir del licor de aplicación (por lo general acuosa) y/o desde el revestimiento por pulverización, que son capaces de penetrar la cutícula de la planta y por lo tanto aumentar la movilidad de los compuestos activos en la cutícula. Esta propiedad puede ser determinada por el uso del procedimiento descrito en la bibliografía (Baur y col., 1997, Pesticide Science 51, 131 a 152). Los ejemplos incluyen alcoxilatos de alcohol tales como etoxilatos de grasa de coco (10) o etoxilato de isotridecilo (12), ésteres de ácidos grasos tales como ésteres de colza o de soja metílico de aceite, alcoxilatos de aminas grasas, tales como etoxilato de amina de sebo (15), o amonio y/o sales de fosfonio tales como sulfato de amonio o fosfato de hidrógeno diamónico, por ejemplo.
- Las formulaciones comprenden preferentemente entre 0,00000001 % y 98 % en peso de compuesto activo o, de forma en especial preferente, entre 0,01 % y 95 % en peso de compuesto activo, más preferentemente entre 0,5 % y 90 % en peso de compuesto activo, basado en el peso de la formulación.

El contenido en producto activo de las formas de aplicación (productos fitosanitarios) preparados a partir de las formulaciones puede variar dentro de amplios intervalos. La concentración de compuesto activo de las formas de aplicación puede estar situada de forma típica entre 0,00000001 % y 95 % en peso de compuesto activo, preferentemente entre 0,00001 % y 1 % en peso, basado en el peso de la forma de aplicación. La aplicación se lleva a cabo en una forma usual adaptada a las formas de aplicación.

Las plantas preferidas son las del grupo de las plantas útiles, ornamentales, céspedes, árboles de uso general que se emplean como plantas ornamentales en los sectores públicos y domésticos, y los árboles forestales. Los árboles forestales comprenden árboles para la producción de madera, celulosa, papel y productos hechos a partir de piezas de los árboles.

10 El término plantas útiles, de acuerdo con lo usado en el presente contexto se refiere a plantas de cultivo que se emplean como plantas para la obtención de productos alimenticios, piensos, combustibles o para fines industriales.

5

15

20

30

35

45

55

Las plantas útiles que se pueden mejorar por medio de la aplicación de los compuestos de la fórmula (I) incluyen, por ejemplo, los siguientes tipos de plantas: césped, vides, cereales, por ejemplo trigo, cebada, centeno, avena, arroz, maíz y mijo/sorgo; la remolacha, la remolacha ejemplo remolacha azucarera y forrajera; frutas, por ejemplo, frutas de pepita, frutales de hueso y frutos blandos, por ejemplo manzanas, peras, ciruelas, melocotones, almendras, cerezas y bayas, por ejemplo fresas, frambuesas, moras; legumbres, por ejemplo, los judías, las lentejas, los guisantes y las habas de soja; cultivos oleaginosos, por ejemplo semillas oleaginosas colza, mostaza, amapola, aceitunas, girasol, coco, ricino, cacao y maní; cucurbitáceas, por ejemplo calabaza/zapallo, pepinos y melones; plantas de fibra, por ejemplo, algodón, lino, cáñamo y yute; los cítricos, por ejemplo, naranjas, limones, pomelos y mandarinas; hortalizas, por ejemplo, espinacas, lechuga, espárragos, especies de col, zanahorias, cebollas, tomates, patatas y pimientos; Lauraceae, por ejemplo aguacate, canela, alcanfor, o plantas de otra persona, tales como el tabaco, nueces, café, berenjenas, caña de azúcar, té, pimienta, vides, lúpulo, plátanos, plantas de látex y plantas ornamentales, por ejemplo, flores, arbustos, árboles de hoja caduca y árboles de coníferas. Esta enumeración no es limitación alguna.

Las siguientes plantas se consideran cultivos diana adecuados en particular: algodón, berenjena, césped, frutales de pepita, frutales de hueso, fruta suave, maíz, trigo, cebada, pepino, tabaco, vid, el arroz, los cereales, pera, habas, soja, semillas oleaginosas colza, tomate, pimiento, melón, col, patata y manzana.

Los ejemplos de árboles que se pueden mejorar de acuerdo con el procedimiento de acuerdo con la invención son: Abies sp., Eucalyptus sp., Picea sp., Pinus sp., Aesculus sp., Platanus sp., Tilia sp., Acer sp., Tsuga sp., Fraxinus sp., Sorbus sp., Betula sp., Crataegus sp., Ulmus sp., Quercus sp., Fagus sp., Salix sp., Populus sp.

Los árboles preferidos que se pueden mejorar de acuerdo con el procedimiento de acuerdo con la invención son: a partir de las especies de árboles Aesculus: A. hippocastanum, A. pariflora, A. carnea; de las especies de árboles Platanus: P. aceriflora, P. occidentalis, P. racemosa; de las especies de árboles abies: P. abies; de las especies de árboles de Pinus: P. radiata, P. ponderosa, P. contorta, P. sylvestre, P. elliottii, P. montecola, P. albicaulis, P. resinosa, P. palustris, P. taeda, P. flexilis, P. jeffregi, P. baksiana, P. strobus; de las especies de árboles de eucalipto: E. grandis, E. globulus, E. camadentis, E. nitens, E. obliqua, E. regnans, E. pilularus.

Los árboles en especial preferidos que se pueden mejorar de acuerdo con el procedimiento de acuerdo con la invención son: a partir de las especies de árboles de Pinus: P. radiata, P. ponderosa, P. contorta, P. sylvestre, P. strobus; de las especies de árboles de eucalipto: E. grandis, E. globulus, E. camadentis.

40 Los árboles preferidos muy en particular que se pueden mejorar de acuerdo con el procedimiento de acuerdo con la invención son: castaño de Indias, Platanaceae, tilo, árbol de arce.

La presente invención también se puede aplicar a cualquier hierba de césped, que incluyen hierbas de césped de estación fría y hierbas de césped de estación cálida. Los ejemplos de los céspedes de temporada fría son pasto azul (*Poa* spp.), tales como pasto azul de Kentucky (*Poa pratensis* L.), Poa (*Poa trivialis* L.), pasto azul de Canadá (*Poa compressa* L.), pasto azul anual (*Poa annua* L.), pasto azul de tierras altas (*Poa glaucantha Gaudin*), pasto azul de la madera (*Poa nemoralis* L.) y pasto azul bulboso (*Poa bulbosa* L.); bentgrasses (*Agrostis* spp.) como bentgrass (*Agrostis palustris* Huds.), bentgrass colonial (*Agrostis tenuis* Sibth.), bentgrass de terciopelo (*Agrostis canina* L.), bentgrass mixto del sur de Alemania (*Agrostis* spp. que incluyen *Agrostis tenuis* Sibth., *Agrostis canina* L., y *Agrostis palustris* Huds), y redtop (*Agrostis alba* L.).;

Las festucas (Festuca spp.), tales como festuca roja (Festuca rubra L. spp. rubra), festuca rastrera (Festuca rubra L.), festuca de masticaciones (Festuca rubra commutata Gaud.), festuca de las ovejas (Festuca ovina L.), festuca dura (Festuca longifolia Thuill.), festuca del pelo (Festucu capillata Lam.), festuca alta (Festuca arundinacea Schreb.) y festuca (Festuca elanor L.);

Raigrás (Lolium spp.), tales como raigrás anual (Lolium multiflorum Lam.), raigrás perenne (Lolium perenne L.) y raigrás italiano (Lolium multiflorum Lam.);

y wheatgrasses (*Agropyron* spp.), tales como wheatgrass fairway (*Agropyron cristatum* (L.) Gaertn.), agropiro crestado (*Agropyron desertorum* (Fisch.) Schult.) y wheatgrass occidental (*Agropyron smithii* Rydb.).

Los ejemplos de otros céspedes de estación fría son el barrón (Ammophila breviligulata Fern.), Cebadilla suave

(Bromus inermis Leyss.), Espadañas como Timoteo (Phleum pratense L.), totora arena (Phleum subulatum L.), pasto ovillo (Dactylis glomerata L.), alkaligrass (Puccinellia distans (L.) Parl.) y cola de perro crestada (Cynosurus cristatus L.).

Los ejemplos de céspedes de estación cálida son pasto Bermuda (*Cynodon* spp. LC Rich), hierba zoysia (*Zoysia* spp. Willd.), Hierba de San Agustín (*Stenotaphrum secundatum* Walt Kuntze), hierba ciempiés (*Eremochloa ophiuroides* Munro Hack.), Carpetgrass (*Axonopus affinis* Chase), pasto Bahía (*Paspalum notatum* Flugge), pasto kikuyo (*Pennisetum clandestinum* Hochst. ex Chiov.), hierba de búfalo (*Buchloe dactyloids* (Nutt.) Engelm.), navajita (*Bouteloua gracilis* (H.B.K.) Lag. ex Griffiths), Paspalum de la orilla del mar (*Paspalum vaginatum* Swartz) y pasto banderita (*Bouteloua curtipendula* (Michx. Torr.). Las hierbas de césped de temporada fría por lo general se prefieren para el uso de acuerdo con la invención. En especial se prefieren el pasto azul, benchgrass y redtop, y festucas raigrás. Bentgrass se prefiere en especial.

Todas las plantas y partes de plantas se pueden tratar de acuerdo con la invención. En el contexto actual, las plantas comprenden todas las plantas y poblaciones de plantas, tales como plantas silvestres deseadas y no deseadas o plantas de cultivo (que incluyen plantas de cultivo de origen natural). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que se pueden obtener por procedimientos de mejoramiento y de optimización tradicionales o por procedimientos biotecnológicos y recombinantes, o combinaciones de estos procedimientos, que incluyen las plantas transgénicas e que incluyen las variedades de plantas capaces o no de ser protegidos por los derechos de obtentor. Las partes de la planta comprenden todas las partes y órganos aéreos y subterráneos de las plantas, tales como brotes, hojas, flores y raíces, los ejemplos que se pueden mencionar hojas, agujas, tallos, troncos, flores, cuerpos fructíferos, frutos y semillas, así como raíces, tubérculos y rizomas. Las partes de la planta también incluyen material de cultivo y material de propagación vegetativa y generativa, por ejemplo esquejes, tubérculos, rizomas, resbalones y semillas.

15

20

25

30

El control de las plagas animales por tratamiento de la semilla de las plantas ha sido conocido durante mucho tiempo y es un objeto de mejoras continuas. Sin embargo, el tratamiento de la semilla conlleva una serie de problemas que no siempre se pueden resolver de manera satisfactoria. Por lo tanto, es deseable desarrollar procedimientos para proteger la semilla y la planta en germinación que eliminan la necesidad de, o por lo menos reducir significativamente, la entrega adicional de composiciones de protección de cultivos en el curso de almacenamiento, después de la siembra o después de la emergencia de las plantas. Es deseable, además, para optimizar la cantidad de principio activo empleado de tal manera como para proporcionar la mejor protección posible a la semilla y la planta en germinación del ataque de plagas animales, pero sin provocar daño a la planta misma por el activo componente empleado. En particular, los procedimientos para el tratamiento de semillas también debería tener en cuenta el insecticida intrínseca y/o propiedades nematicidas de plantas transgénicas resistentes o tolerantes a las plagas, con el fin de lograr una protección óptima de la semilla y de la planta en germinación con un uso mínimo de composiciones de protección de cultivos.

La presente invención por lo tanto también se refiere en particular a un procedimiento para proteger la semilla y la germinación de las plantas del ataque de plagas, por medio del tratamiento de la semilla con un compuesto de la fórmula (I).

La invención se refiere igualmente al uso del compuesto de la fórmula (I) para el tratamiento de semillas con el propósito de proteger la semilla y la planta resultante contra las pestes animales.

40 La invención se refiere, además, a las semillas que para la protección contra plagas animales se ha tratado con un compuesto de la fórmula (I).

Además, la invención se refiere a las semillas que, después del tratamiento con un compuesto de la fórmula (I) de la invención, se someten a un proceso de recubrimiento de película con el fin de evitar la abrasión del polvo de la semilla.

Una de las ventajas de la presente invención es que, debido a las propiedades sistémicas particulares de las composiciones de la invención, el tratamiento de la semilla con estas composiciones proporciona protección contra plagas animales no solo a la semilla en sí, sino también a las plantas procedentes de la semilla, después de que han surgido. De esta manera, puede no ser necesario tratar el cultivo directamente en el momento de la siembra o poco después.

50 Una ventaja adicional se puede observar en el hecho de que, a través del tratamiento de la semilla con un compuesto de la fórmula (I) de la invención, la germinación y la emergencia de las semillas tratadas se puede promover.

Asimismo se considera que es ventajoso que el compuesto de la fórmula (I) también se puede usar, en particular, sobre las semillas transgénicas.

También se indica que un compuesto de la fórmula (I) se puede usar en combinación con agentes de la tecnología de señalización, como resultado de lo cual, por ejemplo, la colonización con simbiontes se mejora, tales como rhizobium, micorrizas y/o bacterias endofíticas, por ejemplo, se ha mejorado, y/o la fijación de nitrógeno se optimiza.

Las composiciones de la invención son adecuadas para la protección de semillas de cualquier variedad de planta que se usa en la agricultura, en invernaderos, en la silvicultura o en la horticultura. Más en particular, la semilla en cuestión es la de los cereales (por ejemplo trigo, cebada, centeno, avena y mijo), maíz, algodón, soya, arroz, patatas, girasol, café, tabaco, canola, colza de semillas oleaginosas, la remolacha (por ejemplo, remolacha azucarera y remolacha forrajera), cacahuetes, hortalizas (por ejemplo, tomate, pepino, frijol, género Brassica, cebolla y lechuga), frutas plantas, césped y plantas ornamentales. En particular importante es el tratamiento de las semillas de cereales (como el trigo, la cebada, el centeno y la avena) de maíz, soja, algodón, canola, colza de semillas oleaginosas y el arroz.

Como ya se ha mencionado con anterioridad, el tratamiento de la semilla transgénica con un compuesto de la fórmula (I) es en particular importante. La semilla en cuestión en el presente documento es la de las plantas que contienen, por lo por lo general por lo menos un gen heterólogo que controla la expresión de un polipéptido que tiene, en particular, insecticida y/o propiedades nematicidas. Estos genes heterólogos en semilla transgénica pueden proceder de microorganismos tales como *Bacillus, Rhizobium, Pseudomonas, Serratia, Trichoderma, Clavibacter, Glomus* o *Gliocladium*. La presente invención es en particular adecuada para el tratamiento de semilla transgénicas que contienen por lo menos un gen heterólogo de Bacillus sp. Con especial preferencia, el gen heterólogo en cuestión proviene de Bacillus thuringiensis.

Para los fines de la presente invención, el compuesto de la fórmula (I) de la invención se aplica sola o en una formulación adecuada a la semilla. La semilla se trata preferentemente en una condición en la que su estabilidad es tal, que no se produzcan daños en el curso del tratamiento. En términos generales, la semilla se puede tratar en cualquier punto en el tiempo entre la cosecha y la siembra. De forma típica, se usa semilla que se ha separado de la planta y ha tenido mazorcas, cáscaras, tallos, cáscaras, pelo o pulpa eliminado. Así, por ejemplo, se puede usar una semilla que se ha cosechado, limpiado y secado hasta un contenido de humedad de menos del 15 % en peso. De forma alternativa, las semillas también se pueden usar después del secado que se ha tratado con agua, por ejemplo, y después se seca de nuevo.

20

40

45

50

55

- En el tratamiento de semillas es necesario, por lo general, asegurar que la cantidad de la composición de la invención, y/o de otros aditivos, que se aplica a la semilla se seleccione de manera tal que la germinación de la semilla no se vea afectada negativamente, y/o que la planta que emerge de la semilla no esté dañada. Este es el caso en particular con componentes activos que pueden mostrar efectos fitotóxicos a determinadas cantidades de aplicación.
- Las composiciones de la invención se pueden aplicar directamente, en otras palabras sin comprender componentes adicionales y sin haber sido diluida. Como regla general, es preferente aplicar las composiciones de forma de una formulación adecuada a la semilla. Las formulaciones y procedimientos para el tratamiento de semillas adecuados son conocidos para aquéllos expertos en la materia y se describen en, por ejemplo, los siguientes documentos: US 4.272.417 A, US 4.245.432 A, US 4.808.430 A, US 5.876.739 A, US 2003/0176428 A1, WO 2002/080 675 A1, WO 2002/028186 A2.

El compuesto de la fórmula (I) que se puede usar de acuerdo con la invención se puede convertir en las formulaciones desinfectantes usuales, tales como soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, espumas, suspensiones u otras composiciones de recubrimiento para semillas, y también formulaciones ULV.

Estas formulaciones se preparan de una manera conocida, mezclando el compuesto de la fórmula (I) con adyuvantes habituales, tales como, por ejemplo, diluyentes habituales y también disolventes o diluyentes, colorantes, humectantes, dispersantes, emulsionantes, antiespumantes, conservantes, espesantes secundarios, adhesivos, giberelinas, y también agua.

Los colorantes que pueden estar presentes en las formulaciones desinfectantes que se pueden usar de acuerdo con la invención incluyen todos los colorantes que son habituales para tales fines. En este contexto, es posible usar no solo pigmentos, que son de baja solubilidad en agua, pero también colorantes solubles en agua. Los ejemplos incluyen los colorantes conocidos bajo las denominaciones Rhodamin B, C.I. Pigmento Rojo 112 y C.I. Rojo Disolvente 1.

Los humectantes que pueden estar presentes en las formulaciones desinfectantes que se pueden usar de acuerdo con la invención incluyen todas las sustancias que promueven humectantes y que son habituales en la formulación de componentes agroquímicos activos. El uso puede ser preferentemente de alquilnaftalenosulfonatos, tales como diisopropil- o diisobutil-naftalenosulfonatos.

Los dispersantes y/o emulsionantes que pueden estar presentes en las formulaciones desinfectantes que se pueden usar de acuerdo con la invención incluyen todos los no iónicos, aniónicos y catiónicos dispersantes que son habituales en la formulación de componentes agroquímicos activos. El uso puede ser preferentemente de dispersantes no iónicos o aniónicos o mezclas de dispersantes no iónicos o aniónicos. Dispersantes no iónicos adecuados son, en particular, polímeros de etileno-óxido de propileno de bloque de óxido de alquilfenol, éteres de poliglicol y también tristririlfenol éteres de poliglicol, y los derivados fosfatados o sulfatados de estos. Los dispersantes aniónicos adecuados son, en particular, los lignosulfonatos, sales de ácido poliacrílico, y condensados

de formaldehído arilsulfonato.

5

15

30

35

40

45

50

55

Los antiespumantes que pueden estar presentes en las formulaciones desinfectantes que se pueden usar de acuerdo con la invención incluyen todos los inhibidores de espuma que son habituales en la formulación de componentes agroquímicos activos. El uso puede ser preferentemente de antiespumantes de silicona y estearato de magnesio.

Los conservantes que pueden estar presentes en las formulaciones desinfectantes que se pueden usar de acuerdo con la invención incluyen todas las sustancias que se pueden emplear para tales propósitos en composiciones agroquímicas. Los ejemplos incluyen diclorofeno y hemiformal alcohol bencilo.

Los espesantes secundarios que pueden estar presentes en las formulaciones desinfectantes que se pueden usar de acuerdo con la invención incluyen todas las sustancias que pueden ser usados para tales fines en agentes agroquímicos. Las contempladas con preferencia incluyen derivados de celulosa, derivados del ácido acrílico, xantana, arcillas modificadas y altamente dispersa sílice.

Los adhesivos que pueden estar presentes en las formulaciones desinfectantes que se pueden usar de acuerdo con la invención incluyen todos los aglutinantes usuales, que se pueden usar en productos desinfectantes. Se puede hacer una mención preferida a polivinilpirrolidona, acetato de polivinilo, alcohol polivinílico y tilosa.

Las giberelinas que pueden estar presentes en las formulaciones desinfectantes que se pueden usar de acuerdo con la invención incluyen preferentemente las giberelinas A1, A3 (= ácido giberélico), A4 y A7, el ácido giberélico se usa con especial preferencia. Las giberelinas son conocidas (compárese R. Wegler, "Chemie der Pflanzenschutz- und Schädlingsbekämpfungsmittel", Volumen 2, Springer Verlag, 1970, pág. 401 a 412).

Las formulaciones desinfectantes que se pueden usar de acuerdo con la invención se pueden usar, ya sea directamente o después de la dilución previa con agua, para tratar la semilla de cualquiera de una amplia variedad de tipos. En consecuencia, los concentrados o las preparaciones que se pueden obtener a partir de ellas por medio de dilución con agua se pueden emplear para vestir a la semilla de cereales, tales como trigo, cebada, centeno, avena y triticale, y también la semilla de maíz, arroz, semillas oleaginosas colza, guisantes, judías, algodón, girasol y remolacha, o de lo contrario la semilla de cualquiera de una amplia variedad de hortalizas. Las formulaciones desinfectantes que se pueden usar de acuerdo con la invención, o sus preparaciones diluidas, también se pueden usar para revestir a las semillas de plantas transgénicas. En ese caso, los efectos sinérgicos adicionales pueden ocurrir en la interacción con las sustancias formadas a través de la expresión.

Para el tratamiento de semilla con las formulaciones desinfectantes que se pueden usar de acuerdo con la invención, o con los preparados producidos a partir de ellos por medio de la adición de agua, equipo de mezclado adecuado incluye todos los equipos tales que de forma típica se puede emplear para el revestimiento de semillas. Más en particular, el procedimiento cuando se lleva a cabo la desinfección de semillas es colocar la semilla en un mezclador, añadir la cantidad deseada en particular de las formulaciones de desinfectantes, ya sea como tal o después de la dilución con agua de antemano, y para llevar a cabo mezclando hasta que la distribución de los la formulación sobre la semilla es uniforme. Esto puede ser seguido por una operación de secado.

La tasa de aplicación de las formulaciones desinfectantes que se pueden usar de acuerdo con la invención puede variar dentro de un intervalo relativamente amplio. Está guiado por la cantidad particular del compuesto de la fórmula (I) en las formulaciones, y por la semilla. Las tasas de aplicación con respecto al compuesto de la fórmula (I) están situadas por lo general entre 0,001 y 50 g por kilogramo de semillas, preferentemente entre 0,01 y 15 g por kilogramo de semillas.

Como ya se mencionó con anterioridad, es posible tratar todas las plantas y sus partes de acuerdo con la invención. En una realización preferida, se tratan las especies de plantas silvestres y variedades de plantas, o las obtenidas por procedimientos convencionales de mejoramiento biológicos, como el cruce o fusión de protoplastos, así como sus partes,. En una realización preferida adicional, se tratan las plantas transgénicas y variedades de plantas obtenidas por ingeniería genética, si es apropiado en combinación con procedimientos convencionales (organismos modificados genéticamente), y sus partes. Los términos "partes" o "partes de plantas" o "partes de plantas" se han explicado con anterioridad.

Más preferentemente, las plantas de las variedades de plantas que están cada una comercialmente disponibles o en uso se tratan de acuerdo con la invención. Las variedades de plantas comprenden las plantas con nuevas propiedades ("rasgos") y que han sido obtenidas por medio de procedimientos convencionales, por mutagénesis o por técnicas de ADN recombinante. Pueden ser cultivares, biotipos y genotipos.

Dependiendo de la especie de planta o variedad de planta, y la ubicación y las condiciones de crecimiento (suelos, clima, período de vegetación, la dieta) de la misma, el tratamiento de la invención también puede dar lugar a más efectos aditivos ("sinérgicos"). Por ejemplo, las posibilidades incluyen la reducción de tasas y/o ampliación del espectro de actividad y/o un aumento en la actividad de los compuestos y composiciones que pueden usarse de acuerdo con la invención de aplicación, mejor crecimiento de las plantas, mayor tolerancia a altas o bajas temperaturas, aumento de la tolerancia a la seguía o los niveles de agua o la salinidad del suelo, mejora de

rendimiento de floración, cosecha facilitada, aceleramiento de la maduración, mayores rendimientos, mayor calidad y/o mayor valor nutritivo de los productos recolectados, mayor vida de almacenamiento y/o procesabilidad de los productos recolectados, los cuales superar los efectos normalmente se espera.

5

10

15

20

25

30

35

40

55

60

Las plantas transgénicas o cultivares de plantas (los obtenidos por ingeniería genética) que se van a tratar con preferencia de acuerdo con la invención incluyen todas las plantas que, a través de la modificación genética, recibieron material genético que confiere propiedades ventajosas particulares útiles ("rasgos") a estas plantas. Los ejemplos de tales propiedades son mejores crecimiento de las plantas, mayor tolerancia a altas o bajas temperaturas, el aumento de la tolerancia a la seguía o de los niveles de agua o la salinidad del suelo, mejorar el rendimiento de floración, recolección facilitada, acelerado la maduración, mayores rendimientos, mayor calidad y/o una mayor valor nutritivo de los productos recolectados, mayor vida y/o procesabilidad de los productos cosechados de almacenamiento. Otros ejemplos y en particular enfatizados de tales propiedades son una defensa mejorada de las plantas contra las plagas microbianas, tales como contra insectos, ácaros, hongos fitopatógenos, bacterias y/o virus de los animales y, y también aumentó la tolerancia de las plantas a ciertos componentes activos como herbicidas. Los ejemplos de plantas transgénicas incluyen las plantas de cultivo importantes como cereales (trigo, arroz), maíz, soja, patatas, remolacha, tomates, guisantes y otros tipos de hortalizas, algodón, tabaco, colza de semillas oleaginosas, así como plantas frutales (con la frutos de manzanas, peras, cítricos y uvas), está dando un énfasis particular al maíz, soja, patatas, algodón, tabaco y colza de semillas oleaginosas. Los rasgos que se destacan en especial son la defensa mejorada de las plantas contra insectos, arácnidos, nematodos y caracoles, babosas por toxinas formadas en las plantas, en especial las formadas en las plantas por el material genético de Bacillus thuringiensis (por ejemplo por medio de los genes CrylA (a), CrylA (b), CrylA (c), CrylIA, CrylIIA, CrylIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb y CryIF, y también combinaciones de los mismos) (denominado en lo sucesivo como "plantas Bt"). Los rasgos que también se destacan en especial la defensa mejorada de las plantas contra hongos, bacterias y virus por medio de resistencia sistémica adquirida (SAR), sistemina, fitoalexinas, elicitores así como genes de resistencia y proteínas y toxinas expresadas correspondientemente. Los rasgos que se destacan en especial, además, son la mayor tolerancia de las plantas frente a determinados herbicidas componentes activos, por ejemplo imidazolinonas, sulfonilureas, glifosato o fosfinotricina (por ejemplo el gen "PAT"). Los genes que confieren los rasgos deseados en cuestión también pueden estar presentes en combinaciones entre sí en las plantas transgénicas. Los ejemplos de "plantas Bt" incluyen variedades de maíz, variedades de algodón, variedades de soja y variedades de patata que se venden bajo los nombres comerciales YIELD GARD® (por ejemplo, maíz, algodón, soja), KnockOut® (por ejemplo, maíz), StarLink® (por ejemplo, maíz), Bollgard® (algodón), Nucotn® (algodón) y NewLeaf® (patata). Los ejemplos de plantas tolerantes a los herbicidas incluyen variedades de maíz, variedades de algodón y variedades de soja que se venden bajo los nombres comerciales Roundup Ready ® (tolerancia a glifosato, por ejemplo, maíz, algodón, soja), Liberty Link ® (tolerancia a fosfinotricina, por ejemplo semillas oleaginosas colza), IMI® (tolerancia frente a imidazolinonas) y STS® (tolerancia frente a sulfonilureas, por ejemplo, maíz). Las plantas resistentes a los herbicidas (plantas criadas de manera convencional para la tolerancia a herbicidas) que se pueden mencionar son las variedades que se venden bajo el nombre Clearfield® (por ejemplo, maíz). Por supuesto, estas indicaciones son válidas también para sembrar cultivares que tienen estos rasgos genéticos o rasgos genéticos que están todavía por desarrollar y se desarrollarán y/o comercializarán en el futuro.

Las plantas indicadas se pueden tratar de acuerdo con la invención de una manera ventajosa en particular con los compuestos de la fórmula general (I) y/o las mezclas de principios activos de acuerdo con la invención. Los intervalos preferidos indicados con anterioridad para los principios activos o mezclas también se aplican al tratamiento de estas plantas. Se hace especial hincapié en el tratamiento de las plantas con los compuestos o mezclas que se mencionan de forma específica en el presente texto.

El tratamiento de las plantas y partes de plantas con los compuestos de la fórmula (I) se lleva a cabo directamente o actuando sobre el espacio de entorno, hábitat o de almacenamiento por medio de procedimientos de tratamiento habituales, por ejemplo por inmersión, pulverización, atomización, vaporización, evaporación, formación de polvo, nebulizado, esparcido, la formación de espuma, la pintura en, extensión, inyección, empatata,ndo, riego por goteo y, en el caso de material de propagación, en particular en el caso de las semillas, además, por el procedimiento de tratamiento de semillas en seco, el procedimiento de tratamiento de semillas húmedo, el procedimiento de tratamiento de purines, por incrustantes, por recubrimiento con una o varias capas y similares. Además, es posible la aplicación de las sustancias activas por el procedimiento de volumen ultra bajo o inyectar la preparación de la sustancia activa o la propia sustancia activa en el suelo.

Un tratamiento directo preferido de las plantas es el tratamiento de aplicación de la hoja, es decir, compuestos de la fórmula (I) o composiciones que los contienen se aplican al follaje, siendo posible que la frecuencia de tratamiento y la tasa de aplicación para ser adaptada a la presión de la infección.

En el caso de los compuestos activos por vía sistémica, los compuestos de la fórmula (I) o composiciones de acuerdo con la invención llegan a las plantas a través del sistema radicular. En este caso, el tratamiento de las plantas se efectúa permitiendo que los compuestos de la fórmula (I) o composiciones de acuerdo con la invención para actuar sobre el medio ambiente de la planta. Esto puede hacerse, por ejemplo empapando, la incorporación en el suelo o en la solución de nutrientes, es decir, la ubicación de la planta (por ejemplo, los sistemas de suelo o hidropónicos) se impregna con una forma líquida de compuestos de la fórmula (I) o composiciones de acuerdo a la invención, o por aplicación en el suelo, es decir, los compuestos de la fórmula (I) o composiciones de acuerdo con la

invención se incorporan en la ubicación de las plantas de forma sólida (por ejemplo de forma de gránulos). En el caso de cultivos de arrozales, esto también se puede hacer por medio de la dosificación de los compuestos de la fórmula (I) o composiciones de acuerdo con la invención en un campo de arroz inundado en una forma sólida uso (por ejemplo de forma de gránulos).

- El principio activo de la invención se puede presentar en sus formulaciones comercialmente disponibles y en las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones, tales como una mezcla con otros componentes activos, tales como reguladores de insecticidas, cebos, esterilizantes, bactericidas, acaricidas, nematicidas, fungicidas, crecimiento, herbicidas, antídotos, fertilizantes o semioquímicos. Las mezclas obtenidas de ese modo tienen un espectro amplio de la actividad.
- Las mezclas con fungicidas son ventajosas en particular. Los ejemplos de socios de mezcla de fungicidas adecuados se pueden seleccionar de la lista que consiste en:

15

20

25

30

35

40

45

50

55

- 1) Inhibidores de la biosíntesis de ergosterol, por ejemplo (1.1) aldimorf, (1.2) azaconazol, (1.3) bitertanol, (1.4) bromuconazol, (1.5) ciproconazol, (1.6) diclobutrazol, (1.7) difenoconazol, (1.8) diniconazol, (1.9) diniconazol-M, (1.10) dodemorf, (1.11) acetato de dodemorf, (1.12) epoxiconazol, (1.13) etaconazol, (1.14) fenarimol, (1.15) fenbuconazol, (1.16) fenhexamid, (1.17) fenpropidin, (1.18) fenpropimorf, (1.19) fluquinconazol, (1.20) flurprimidol, (1.21) flusilazol, (1.22) flutriafol, (1.23) furconazol, (1.24) furconazol-cis, (1.25) hexaconazol, (1.26) imazalilo, (1.27) sulfato de imazalilo, (1.28) imibenconazol, (1.29) ipconazol, (1.30) metconazol, (1.31) miclobutanilo, (1.32) naftifina, (1.33) nuarimol, (1.34) oxpoconazol, (1.35) paclobutrazol, (1.36) pefurazoato, (1.37) penconazol, (1.38) piperalin, (1.39) procloraz, (1.40) propiconazol, (1.41) protioconazol, (1.42) piributicarb, (1.43) pirifenox, (1.44) quinconazol, (1.45) simeconazol, (1.46) espiroxamina, (1.47) tebuconazol, (1.48) terbinafina, (1.49) tetraconazol, (1.50) triadimefón, (1.51) triadimenol, (1.52) tridemorf, (1.53) triflumizol, (1.54) triforina, (1.55) triticonazol, (1.56) uniconazol, (1.57) uniconazol-p, (1.58) viniconazol, (1.59) voriconazol, (1.60), 1-(4-clorofenil) -2 (1H-1.2,4-triazol-1-il) cicloheptanol, (1.61) 1-(2,2-dimetil-2,3-dihidro-1H-inden-1-il)-1H-imidazol-5-carboxilato de metilo, (1.62) N'-{5-(difluorometil)-2-metil-4-[3-(trimetilsilil)propoxi]fenil}N-etil-N-metilimidoformamida, (1.63) N-etil-N-metil-N'-{2-metil-5-(trifluorometil)-4-[3-(trimetilsilil)propoxi]fenil}imidoformamida, (1.64) 1H-imidazol-1-carbotioato de O-[1-(4-metoxifenoxi)-3,3-dimetilbutan-2-ilo], (1.65) Pirisoxazol.
- 2) inhibidores de la cadena respiratoria en el complejo I o II, por ejemplo (2.1) bixafen, (2.2) boscalid, (2.3) carboxin, (2.4) diflumetorim, (2.5) fenfuram, (2.6) fluopiram, (2.7) flutolanilo, (2.8) fluxapiroxad, (2.9) furametpir, (2.10) furmeciclox, (2.11) isopirazam (mezcla de racemato syn-epimérica 1RS, 4SR, 9RS y anti-epimérica racemato 1RS, 4SR, 9SR), (2.12) isopirazam (anti-racemato epimérica 1RS, 4SR, 9SR), (2.13) isopirazam (enantiómero anti-epimérica 1R, 4S, 9S), (2.14) isopirazam (enantiómero anti-epimérica 1S, 4R, 9R), (2.15) isopirazam (syn racemato epimérica 1RS, 4SR, 9RS), (2.16) isopirazam (enantiómero-syn epimérica 1R, 4S, 9R), (2.17) isopirazam (syn-epimérica enantiómero 1S, 4R, 9S), (2.18) mepronilo, (2.19) oxicarboxin, (2.20) penflufeno, (2.21) pentiopirad, (2.22) sedaxano, (2.23) tifluzamida, (2.24) 1-metil-N-[2(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil]-3(trifluorometil)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.25) 3 (difluorometil) -1-metil-N-[2 (1,1,2,2-tetrafluoroetoxi) fenil]-1H-3-(difluorometil)-N-[4-fluoro-2-(1,1,2,3,3,3-hexafluoropropoxi)fenil]-1-metil-1Hpirazol-4-carboxamida. (2.26)pirazol-4-carboxamida, (2.27) N-[1-(2.4-diclorofenil)-1-metoxipropan-2-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-5,8-difluoro-N-[2 (2-fluoro-4-{[4(trifluorometil)piridin-2-il]oxi}fenil)etil]quinazolin-4-amina, carboxamida, (2.28)N-[(1S,4R)-9-(diclorometileno)-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il]-3benzovindiflupir, (2.30)(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.31) N-[(1R,4S)-9-(diclorometileno)-1,2,3,4-tetrahidro-1,4metanonaftalen-5-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.32) 3-(difluorometil)-1-metil-N-(1,1,3trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.33) 1,3,5-trimetil-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.33) 1,3,5-trimetil-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-inden-4-il)-1H-inden-4-il inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.34) 1-metil-3-(trifluorometil)-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1-metil-3-(trifluorometil)-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.35)pirazol-4-carboxamida, (2.36) 1-metil-3-(trifluorometil)-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.37)3-(difluorometil)-1-metil-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-3-(difluorometil)-1-metil-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4carboxamida, (2.38)carboxamida, (2.39) 1,3,5-trimetil-N-[(3R) 1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-4-carboxamida 1H-pirazol, (2.40) 1,3,5-trimetil-N - [(3S) 1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.41) benodanilo, carboxamida. (2.42) 2-cloro-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il) piridina-3-carboxamida, (2.43) Isofetamid.
- 3) inhibidores de la cadena respiratoria en el complejo III, por ejemplo (3.1) ametoctradina, (3.2) amisulbrom, (3.3) azoxistrobina, (3.4) ciazofamida, (3.5) coumetoxistrobin, (3.6) coumoxistrobin, (3.7) dimoxistrobina, (3.8) enoxastrobin, (3.9) famoxadona, (3.10) fenamidona, (3.11) flufenoxistrobin, (3.12) fluoxastrobina, (3.13) cresoxim-metilo, (3.14) metominostrobina, (3.15) orisastrobina, (3.16) picoxistrobin, (3.17) piraclostrobin, (3.18) pirametostrobin, (3.19) piraoxistrobin, (3.20) piribencarb, (3.21) triclopiricarb, (3.22) trifloxistrobin, (3.23) (2E)-2-(2-{[6-(3-cloro-2-metilfenoxi)-5-fluoropirimidin-4-il]oxi}fenil)-2-(metoxiimino)-N-metilacetamida, (3.24) (2E)-2-(metoxiimino)-N-metil-2-(2-[[((1E)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etilideno}amino)oxi]metil]fenil]acetamida, (3.26) (2E)-2-(2-[(([(1E)-1-[3-(trifluoro-2-fenilvinil]oxi}fenil)-2-(metoxiimino)-N-metilacetamida, (3.27) Fenaminostrobin, (3.28) 5-metoxi-2-metil-4-(2-[[((1E)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etilideno}amino)oxi]metil]fenil]-2,4-dihidro-3H-1.2,4-triazol-3-ona, (3.29) (2E)-2{2-[((ciclopropil[(4-metoxifenil)imino]metil]sulfanil)metil]fenil}-3-metoxiacrilato de metilo, (3.30) N-(3-etil-3,5,5-trimetilciclohexilo)-3-formamido-2-hidroxibenzamida, (3.31) 2-{2-

- [(2,5-dimetilfenoxi)metil]fenil}-2-metoxi-N-metilacetamida, (3.32) 2-{2-[(2,5-dimetilfenoxi)metil]fenil}-2-metoxi-N-metilacetamida.
- 4) Inhibidores de la mitosis y la división celular, por ejemplo (4.1) benomilo, (4.2) carbendazim, (4.3) clorfenazol, (4.4) dietofencarb, (4.5) etaboxam, (4.6) fluopicolida, (4.7) fuberidazol, (4.8) pencicurón, (4.9) tiabendazol, (4.10) tiofanato-metilo, (4.11) tiofanato, (4.12) zoxamida, (4.13) 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil) [1.2.4]triazol[1.5-a]pirimidina, (4.14) 3-cloro-5-(6-cloropiridin-3-il)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorofenil)piridazina.

5

10

20

25

35

45

50

- 5) Compuestos capaces de tener una acción multisitio, por ejemplo (5.1) mezcla de burdeos, (5.2) captafol, (5.3) captan, (5.4) clorotalonilo, (5.5) hidróxido de cobre, (5.6) naftenato de cobre, (5.7) óxido de cobre, (5.8) oxicloruro de cobre, (5.9) de cobre (2 +) sulfato, (5.10) diclofluanid, (5.11) ditianon, (5.12) dodina, (5.13) base libre dodina, (5.14) ferbam, (5.15) fluorofolpet, (5.16) folpet, (5.17) guazatina, (5.18) acetato guazatina, (5.19) iminoctadina, (5.20) albesilato iminoctadina, (5.21) triacetato iminoctadina, (5.22) mancobre, (5.23) mancozeb, (5.24) maneb, (5.25) metiram, (5.26) metiram zinc, (5.27) oxina-cobre, (5.28) propamidina, (5.29) propineb, (5.30) de azufre y azufre preparados incluidos polisulfuro de calcio, (5.31) tiram, (5.32) tolilfluanida, (5.33) zineb, (5.34) ziram, (5.35) anilazina.
- 15 6) Los compuestos capaces de inducir una defensa del huésped, por ejemplo (6.1) acibenzolar-S-metilo, (6.2) isotianilo, (6.3) probenazol, (6.4) tiadinilo, (6.5) laminarina.
 - 7) Inhibidores de los aminoácidos y/o la biosíntesis de proteínas, por ejemplo (7.1) andoprim, (7.2) blasticidina-S, (7.3) ciprodinilo, (7.4) kasugamicina, (7.5), clorhidrato de kasugamicina hidrato (7.6) mepanipirim, (7.7) pirimetanilo, (7.8) 3 (5-fluoro-3.3,4.4-tetrametil-3.4-dihidroisoquinolin-1-il) quinolina, (7.9) oxitetraciclina, (7.10) estreptomicina.
 - 8) inhibidores de la producción de ATP, por ejemplo (8.1) acetato de fentina, (8.2) de cloruro de fentin, (8.3) de hidróxido de fentina, (8.4) siltiofam.
 - 9) inhibidores de la síntesis de la pared celular, por ejemplo (9.1) bentiavalicarbo, (9.2) dimetomorf, (9.3) flumorf, (9.4) iprovalicarbo, (9.5) mandipropamid, (9.6) polioxinas, (9.7) polioxorim, (9.8) validamicina A, (9.9) valifenalato, (9.10) polioxina B.
 - 10) inhibidores de la síntesis de lípidos y la membrana, por ejemplo (10.1) bifenilo, (10.2) cloroneb, (10.3) dicloran, (10.4) edifenfos, (10.5) etridiazol, (10.6) iodocarb, (10.7) iprobenfos, (10.8) isoprotiolano, (10.9) propamocarb, (10.10) clorhidrato de propamocarb, (10.11) protiocarb, (10.12) pirazofos, (10.13) quintozeno, (10.14) tecnaceno, (10.15) tolclofos-metilo.
- 11) inhibidores de la biosíntesis de melanina, por ejemplo (11.1) carpropamid, (11.2) diclocimet, (11.3) fenoxanilo, (11.4) ftalida, (11.5) piroquilon, (11.6) triciclazol, (11.7) 2.2,2-trifluoroetilo {3-metil-1 [(4-metil-benzoil) amino] butan-2-il} carbamato.
 - 12) inhibidores de la síntesis de ácido nucleico, por ejemplo (12.1) benalaxilo, (12.2) benalaxil-M (kiralaxil), (12.3) bupirimato, (12.4) clozilacon, (12.5) dimetirimol, (12.6) etirimol, (12.7) furalaxilo, (12.8) himexazol, (12.9) metalaxilo, (12.10) metalaxil-M (mefenoxam), (12.11) ofurace, (12.12) oxadixilo, (12.13) ácido oxolínico, (12.14) octilinona.
 - 13) inhibidores de la transducción de señales, por ejemplo (13.1) clozolinato, (13.2) fenpiclonilo, (13.3) fludioxonilo, (13.4) iprodiona, (13.5) procimidona, (13.6) quinoxifeno, (13.7) vinclozolina, (13.8) proquinazid.
- 14) Los compuestos capaces de actuar como un desacoplador, por ejemplo (14.1) binapacrilo, (14.2) dinocap, (14.3) ferimzona, (14.4) fluazinam, (14.5) meptildinocap.
 - 15) Compuestos adicionales, por ejemplo (15.1) bentiazol, (15.2) betoxazin, (15.3) capsimicina, (15.4) carvona, (15.5) quinometionato, (15.6) piriofenona (chlazafenona), (15.7) cufraneb, (15.8) ciflufenamida, (15.9) cimoxanilo, (15.10) ciprosulfamida, (15.11) dazomet, (15.12) debacarb, (15.13) diclorofeno, (15.14) diclomezina, (15.15) difenzoquat, (15.16) metilsulfato de difenzoquat, (15.17) difenilamina, (15.18) ecomate, (15.19) fenpirazamina, (15.20) flume-tover, (15.21) fluoroimida, (15.22) flusulfamida, (15.23) flutianilo, (15.24) fosetil-aluminio, (15.25) fosetil-calcio, (15.26) fosetil-sodio, (15.27) hexaclorobenceno, (15.28) irumamicina, (15.29) metasulfocarb, (15.30) isotiocianato de metilo, (15.31) metrafenona, (15.32) mildiomicina, (15.33) natamicina, (15.34) dimetilditiocarbamato de níquel, (15.35) nitrotal-isopropilo, (15.37) oxamocarb, (15.38) oxifentiin, (15.39) pentaclorofenol y sales, (15.40) fenotrina, (15.41) ácido fosforoso y sus sales, (15.42) propamocarb-fosetilato, (15.43) propanosina-sodio, (15.44) pirimorph, (15.45) (2E)-3-(4-terc-butilfenil)-3-(2-cloropiridin-4-il)-1-(morfolin-4il)prop-2-en-1-ona, (15.46) (2Z)-3-(4-terc-butilfenil)-3-(2-cloropiridin-4-il)-1-(morfolin-4-il)prop-2-en-1-ona, (15.47) pirrol-nitrina, (15.48) tebufloquin, (15.49) tecloftalam, (15.50) tolnifanida, (15.51) triazóxido, (15.52) trichlamida, (15.54) 2-metilpropanoato de (3S,6S,7R,8R)-8-bencil-3-[({3-[(isobutiriloxi)metoxi]-4metoxipiridin-2-il}carbonil)amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-ilo, (15.55) 1-(4-{4-](5R)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona, (15.56) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-

```
(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona, (15.57) 1-(4-{4-[5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-
                         il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona, (15.58) 1H-imidazol-1-carboxilato de 1-(4-
                         metoxifenoxi)-3,3-dimetilbutan-2-ilo, (15.59) 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)piridina, (15.60) 2,3-dibutil-6-
                                                                                                                      (15.61)
                         clorotieno[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona,
                                                                                                                                            2,6-dimetil-1H,5H-[1,4]ditiino[2,3-c:5,6-c']dipirrol-1,3,5,7(2H,6H)-
   5
                                                                       2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(5R)-5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-
                         tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona, (15.63) 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(5S)-5-fenil-4,5-dihidro-
                          1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona, (15.64) 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-{4-[4-(5-
                         fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il)-1,3-tiazol-2-il]pip-eridin-1-il}etanona, (15.65) 2-butoxi-6-yodo-3-propil-4H-cromen-
                         4-ona, (15.66) 2-cloro-5-[2-cloro-1-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-4-metil-1H-imidazol-5-il]piridina, (15.67) 2-fenilfenol
10
                         y sales, (15.68) 3-(4,4,5-tri-fluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina, (15.69) 3,4,5-tricloropiridina-2,6-
                         dicarbonitrilo, (15.70) 3-cloro-5-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-6-metilpiridazina, (15.71) 4-(4-clorofenil)-5-(2,6-difluorofenil)-6-metilpiridazina, (15.71) 4-(4-clorofenil)-5-(2,6-difluorofenil)-6-metilpiridazina, (15.71) 4-(4-clorofenil)-6-(2,6-difluorofenil)-6-metilpiridazina, (15.71) 4-(4-clorofenil)-6-(2,6-difluorofenil)-6-metilpiridazina, (15.71) 4-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6-(4-clorofenil)-6
                         difluorofenil)-3,6-dimetilpiridazina, (15.72) 5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-tiol, (15.73) 5-cloro-N'-fenil-N'-(prop-2-in-1-il)tiofeno-2-sulfonohidrazida, (15.74) 5-fluoro-2-[(4-fluorobencil)oxi]pirimidin-4-amina, (15.75) 
                         metilbencil)oxi]pirimidin-4-amina, (15.76) 5-metil-6-octil[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-amina, (15.77) etil (2Z)-3-
                                                                                                                            N'-(4-{[3-(4-clorobencil)-1,2,4-tiadiazol-5-il]oxi}-2,5-dimetilfenil)-N-etil-N-
15
                         amino-2-ciano-3-fenilacrilato,
                                                                                                     (15.78)
                         metilimidoformamida, (15.79) N-(4-clorobencil)-3-[3-metoxi-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenillpropanamida, (15.80) N-[(4-clorobencil)-3-[3-metoxi-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenillpropanamida, (15.80) N-[(4-clorobencil)-3-[3-metoxi-4-(prop-2-in
                         clorofenil)(ciano)metil]-3-[3-metoxi-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]propanamida, (15.81) N-[(5-bromo-3-cloropiridin-2-
                         il)metil]-2,4-dicloronicotinamida, (15.82) N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2,4-dicloronicotinamida, (15.83) N-
                         [1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2-fluoro-4-yodonicotinamida,
                                                                                                                                                                                         (15.84)
                                                                                                                                                                                                                     N-{(E)-[(ciclopropilmetoxi)imino][6-
20
                          (difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil}-2-fenilacetamida,
                                                                                                                                                                                  (15.85)
                                                                                                                                                                                                                      N-{(Z)-[(ciclopropilmetoxi)imino][6-
                          (difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil]-2-fenilacetamida, (15.86) N'-{4-[(3-terc-butil-4-ciano-1,2-tiazol-5-il)oxi]-2-
                                                                                                                                                                             N-metil-2-(1-{[5-metil-3-(tnfluorometil)-1H-pirazol-1-
                         cloro-5-metilfenil}-N-etil-N-metilimidoformamida,
                                                                                                                                                    (15.87)
                         illacetil\pipendin-4-il)-N-(1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il)-1,3-tiazol-4-carboxamida, (15.88) N-metil-2-(1-{[5-metil-3-
                          (trifluor-ometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il]-1,3-tiazol-4-
                         carboxamida, (15.89) N-metil-2-(1-{[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-N-[(1S)-1,2,3,4-
25
                                                                                                                                                                                                                                      {6-[({[(1-metil-1H-tetrazol-5-
                                                                                                                                                                                 (15.90)
                         tetrahidronaftalen-1-il]-1,3-tiazol-4-carboxamida,
                         il)(fenil)metileno]amino]oxi)metil|piridin-2-il}carbamato de pentilo, (15.91) ácido fenazina-1-carboxílico, (15.92)
                                                                                                                                                                                                          (15.94)
                                                                                                                                                                                                                                      {6-[({[(1-metil-1H-tetrazol-5-
                         quinolin-8-ol.
                                                                   (15.93)
                                                                                               sulfato
                                                                                                                         de
                                                                                                                                          quinolin-8-ol
                                                                                                                                                                                  (2:1),
                         il)(fenil)metileno]amino}oxi)metil]piridin-2-il}carbamato de terc-butilo,
                                                                                                                                                                                                        (15.95)
                                                                                                                                                                                                                                1-metil-3-(tπfluorometil)-N-[2'-
                                                                                                                                                        (15.96) N-(4'-clorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-
30
                         (tπfluorometil)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida,
                                                                                                              N-(2',4'-diclorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida,
                         pirazol-4-carboxamida,
                                                                                       (15.97)
                                                  3-(difluorometil)-1-metil-N-[4'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida,
                         difluorobifenil-2-il)-1-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.100)
                                                                                                                                                                                                                               3-(difluorometil)-1-metil-N-[4'-
                          (prop-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida. (15.101) 5-fluoro-1,3-dimetil-N-[4'-(prop-1-in-1-il)bifenil-2-il]-
35
                          1H-pirazol-4-carboxamida, (15.102) 2-cloro-N-[4'-(prop-1-in-1-il)bifenil-2-il]nicotinamida, (15.103) 3-(difluorometil)-
                         il)bifenil-2-il]-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida,
                                                                                                                                                                            (15.105)
                                                                                                                                                                                                        3-(difluorometil)-N-(4'-etinilbifenil-2-il)-1-
                                                                                                          (15.106) N-(4'-etinilbifenil-2-il)-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida,
                         metil-1H-pirazol-4-carboxamida,
                                                     2-cloro-N-(4'-etinilbifenil-2-il)nicotinamida,
                                                                                                                                                                                            2-cloro-N-[4'-(3,3-dimetilbut-1-in-1-il)bifenil-2-
                                                                                                                                                                (15.108)
                         il]nicotinamida, (15.109) 4-(difluorometil)-2-metil-N-[4'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1,3-tiazol-5-carboxamida, (15.110)
40
                         5-fluoro-N-[4'-(3-hidroxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.111) 2-cloro-N-
                         1-il)bifenil-2-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.113) 5-fluoro-N-[4'-(3-metoxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-
                          1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.114) 2-cloro-N-[4'-(3-metoxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]nicotinamida,
                         (15.115) (5-bromo-2-metoxi-4-metilpiridin-3-il)(2,3,4-trimetoxi-6-metilfenil)metanona,
                                                                                                                                                                                                                                                                      N-[2-(4-{[3-(4-
45
                                                                                                                                                                                                                                          (15.116)
                         clorofenil)prop-2-in-1-il]oxi}-3-metoxifenil)etil]-N2-(metilsulfonil)valinamida.
                                                                                                                                                                                                                   (15.117)
                                                                                                                                                                                                                                                   ácido
                                                                                                                                                                                                                                                                            4-oxo-4-[(2-
                                                                                                                           {6-[({[(Z)-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metileno]amino}oxi)metil]piridin-2-
                         feniletil)amino]butanoico,
                                                                                              (15.118)
                                                                                                            (15.119) 4-amino-5-fluoropirimidin-2-ol (forma tautomérica: 4-amino-5-
                         il}carbamato de but-3-in-1-ilo,
                         fluoropirimidin-2(1H)-ona), (15.120) 3,4,5-trihidroxibenzoato de propilo, (15.121) 1,3-dimetil-N-(1,1,3-trimetil-2,3-
                         dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.122) 1,3-dimetil-N-[(3R)-1,1,3-tri-metil-2,3-dihidro-1H-inden-
50
                         4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.123) 1,3-dimetil-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-
                         carboxamida, (15.124) [3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (15.125)
                         (S)-[3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2.4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol.
                                                                                                                                                                                                                                    (15.126)
                                                                                                                                                                                                                                                               (R)-[3-(4-cloro-2-
                         fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](pirid-in-3-il)metanol,
                                                                                                                                                                                                                                           2-{[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-
                                                                                                                                                                                                        (15.127)
                         difluorofenil)oxiran-2-il]metil}-2,4-dihidro-3H-1,2,4-tri-azol-3-tiona, (15.128) tiocianato de 1-{[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-dihidro-3H-1,2,4-tri-azol-3-tiona, (15.128) tiocianato de 1-{[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-tiona)-2-(2,4-tiona)-2-(2,4-tiona)-2-(2,4-tiona)-2-(2,4-tiona)-2-(2,4-tiona)-2-(2,4-tiona)-2-(2,4-tiona)-2-(2,4-tiona)-2-(2,4-tiona)-2-(2,4-tiona)-2-(2,4-tiona)-2-(2,4-tiona)-2-(2,4-tiona)-2-(2,4-tiona)-
55
                                                                                                                                                                                                          5-(alilsulfanil)-1-{[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-
                         difluorofenil)oxiran-2-il]metil}-1H-1,2,4-triazol-5-ilo,
                                                                                                                                                                   (15.129)
                         difluorofenil)oxiran-2-il]metil}-1H-1,2,4-triazol, (15.130)
                                                                                                                                                                   2-[1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-
                         2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.131) 2-{[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil}-
                         2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona,
                                                                                                                 (15.132) 2-{[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil}-
                                                                                                                                                                                                                  1-{[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-
60
                         2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona,
                                                                                                                         (15.133)
                                                                                                                                                          tiocianato
                                                                                                                                                                                              de
                         difluorofenil)oxiran-2-il]metil}-1H-1,2,4-triazol-5-ilo, (15.134) tiocianato de 1-{[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-
                         \label{eq:diffuorofenil} $$ diffuorofenil) oxiran-2-il \end{array} $$ diffuorofenil) oxiran-2-il \end{array} $$ metil -1,2,4-triazol-5-ilo, (15.135) 5-(alilsulfanil)-1-{[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-diffuorofenil)oxiran-2-il] metil} -1+1,2,4-triazol, (15.136) 5-(alilsulfanil)-1-{[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-diffuorofenil)-2-(2,4-diffuorofenil)-2-(2,4-diffuorofenil)-1+1,2,4-triazol, (15.136) 5-(alilsulfanil)-1+1,2,4-triazol, (15.136) 5-(alilsulfanil)-
                         ofenil)oxiran-2-il]metil}-1H-1,2,4-triazol, (15.137) 2-[(2S,4S,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-tri-metilheptan-
                         4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.138) 2-[(2R,4S,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-
65
                         4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.139) 2-[(2R,4R,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-
```

4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.140) 2-[(2S,4R,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.141) 2-[(2S,4S,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.142) 2-[(2R,4S,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-tria-zole-3-tiona, (15.143)2-[(2R,4R,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.144) 2-[(2S,4R,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-5 (15.145) 2-fluoro-6-(trifluorometil)-N-(1,1,3-trimetil-2,3trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, 2-(6-bencilpiridin-2-il)quinazolina, (15.147) dihidro-1H-in-den-4-il)benzamida, (15.146) 2-[6-(3-fluoro-4metoxifenil)-5-metilpiridin-2-il]quinazolina, (15.148) 3-(4,4-difluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina, (15.149) Ácido absícico, (15.150)3-(difluorometil)-N-metoxi-1-metil-N-[1-(2,4,6-triclorofenil)propan-2-il]-1Hpirazol-4-carboxamida, N'-[5-bromo-6-(2,3-dihidro-1H-inden-2-iloxi)-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-10 (15.151)metilimidoformamida, (15.152)N'-{5-bromo-6-[1-(3,5-difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridin-3-il}-N-etil-N-metil-(15.153)N'-{5-bromo-6-[(1R)-1-(3,5-difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridin-3-il}-N-etil-Nimidoformamida. N'-{5-bromo-6-[(1S)-1-(3,5-difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridin-3-il}-N-etil-Nmetilimidoformamida. (15.154)metilimidoformamida. N'-{5-bromo-6-f(cis-4-isopropilciclohexil)oxil-2-metilpiridin-3-il}-N-etil-N-(15.155)metilimidoformamida, (15.156)N'-{5-bromo-6-[(trans-4-isopropilciclohexil)oxi]-2-metilpiridin-3-il}-N-etil-N-15 (15.157) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4metilimidoformamida, carboxamida. (15.158)N-ciclopropil-N-(2-ciclopropilbencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-N-(2-terc-butilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4carboxamida. (15.159)N-(5-cloro-2-etilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4carboxamida, (15.160)(15.161) N-(5-cloro-2-isopropilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-20 carboxamida. carboxamida, (15.162)N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-5-fluorobencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4carboxamida, (15.163) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(5-fluoro-2-isopropil-bencil)-1-metil-1H-pirazol-4carboxamida, (15.164) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropil-5-fluorobencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4carboxamida, (15.165) N-(2-ciclopentil-5-fluorobencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4carboxamida, (15.166) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-fluoro-6-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-25 carboxamida, (15.167)N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-5-metilbencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-(15.168) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropil-5-metilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4carboxamida, carboxamida, (15.169) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropil-5-metilbencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-(15.170) N-(2-terc-butil-5-metilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4carboxamida, 30 carboxamida, (15.171) N-[5-cloro-2-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-N-[5-metil-2-(trifluorometil)bencil]-1H-4-carboxamida. (15.172)pirazol-4-carboxamida, (15.173) N-[2-cloro-6-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.174) N-[3-cloro-2-fluoro-6-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.175)N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-4,5-dimetilbencil)-5fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.176) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropilbencil)-1-35 metil-1H-pirazol-4-carbotioamida, (15.177) 3-(difluorometil)-N-(7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.178) 3-(difluorometil)-N-[(3R)-7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.179) 3-(difluorometil)-N-[(3S)-7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamidà, (15.180) N'-(2,5-dimetil-4-fènoxifenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (15.181) 40 N'-{4-[(4,5-dicloro-1,3-tiazol-2-il)oxi]-2,5-dimetilfenil}-N-etil-N-metilimidoformamida, N-(4-cloro-2,6-(15.182)difluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina.

Las mezclas con insecticidas también son ventajosas en particular. Los ejemplos de socios de mezcla de insecticidas adecuados se pueden seleccionar de la lista que consiste en:

45

50

55

- (1) inhibidores de la acetilcolinesterasa (AChE), por ejemplo carbamatos, por ejemplo, Alanicarb, Aldicarb, Bendiocarb, Benfuracarb, butocarboxim, Butoxicarboxim, carbaril, carbofurano, Carbosulfan, Etiofencarb, fenobucarb, Formetanato, Furatiocarb, Isoprocarb, metiocarb, metomilo, metolcarb, Oxamilo, Pirimicarb, propoxur, tiodicarb, Tiofanox, Triazamato, trimetacarb, XMC y xililcarb o organofosfatos, por ejemplo, Acefato, Azametifos, Azinfos-etilo, azinfos-metilo, Cadusafos, cloretoxifos, Clorfenvinfos, clormefos, clorpirifos, clorpirifos-metilo, Coumafos, cianofós, Demeton-S-metilo, diazinon, diclorvos/DDVP, Dicrotofós, Dimetoato, dimetilvinfos, Disulfotón, EPN, etión, Etoprofos, Famphur, Fenamifos, Fenitrotión, Fentión, Fostiazato, heptenofos, Imicyafos, isofenfos, isopropílico O- (metoxiaminotio-fosforil) salicilato, isoxatión, Malation, Mecarbam, metamidofos, Metidatión, Mevinfós monocrotofos, naled, Ometoato, oxidemetonmetilo, paratión, paratión-metilo, Fentoato, Forato, Fosalona, Fosmet, Fosfamidón, Foxim, pirimifosmetilo, Profenofos, Propetamfos, Protiofos, piraclofos, piridafentión, Quinalfos, Sulfotep, tebupirimfos, Temefos, Terbufós, Tetraclorvinfos, tiometón, Triazofos, Triclorfón y Vamidotión.
- (2) antagonistas de los canales de cloruro GABA-bloqueados, por ejemplo organoclorados ciclodieno, por ejemplo, El clordano y el endosulfán o fenilpirazoles (fiproles), por ejemplo, Etiprol y fipronil.
- (3) moduladores del canal de sodio/bloqueadores de los canales de sodio dependientes de voltaje, por ejemplo, piretroides, por ejemplo, Acrinathrin, aletrina, d-cis-trans aletrina, d-trans aletrina, Bifentrina, Bioaletrina, isómero Bioaletrina S-ciclopentenilo, Biorresmetrina, cicloprotrin, ciflutrina, beta-ciflutrina, Cihalotrin, lambdacialotrina, gamma-cihalotrina, cipermetrina, alfa Cipermetrina, beta-cipermetrina, theta-cipermetrina, zeta-cipermetrina, cifenotrina [(1R) -trans isómeros], deltametrina, empentrina [(EZ) (1R) isómeros), Esfenvalerato, Etofenprox, Fenpropatrina, Fenvalerato, Flucitrinato, Flumetrina, tau-fluvalinato, halfenprox, Imiprotrin, kadetrina, permetrina,

ES 2 640 646 T3

- fenotrina [(1R) trans isómero), Praletrina, piretrina (piretro), resmetrina, silafluofeno, teflutrina, tetrametrina, tetrametrina [(1R) isómeros)], y Tralometrina o transflutrina DDT o metoxicloro.
- (4) del receptor de acetilcolina nicotínico (nAChR) agonistas, por ejemplo, los neonicotinoides, por ejemplo, Acetamiprid, clotianidina, dinotefuran, Imidacloprid, nitenpiram, tiacloprid y tiametoxam o nicotina o sulfoxaflor.
- 5 (5) receptor de acetilcolina nicotínico (nAChR) activadores alostéricos, por ejemplo espinosinas, por ejemplo, Spinetoram y Spinosad.
 - (6) activadores del canal de cloruro, por ejemplo avermectinas/milbemicinas, por ejemplo, La abamectina, emamectina benzoato, lepimectina y Milbemectina.
 - (7) imitadores de la hormona juvenil, por ejemplo análogos juveniles de Hormonas, por ejemplo, Hidropreno, Kinopreno y metopreno o Fenoxicarb o Piriproxifeno.
 - (8) inhibidores misceláneos no específicos (multi-sitio), por ejemplo halogenuros de alquilo, por ejemplo, bromuro de metilo y otros haluros de alquilo; o cloropicrina o fluoruro de sulfurilo o bórax o tártaro emético.
 - (9) bloqueadores de alimentación selectiva homópteros, por ejemplo, Pimetrozina o flonicamid.
 - (10) inhibidores del crecimiento de ácaros, por ejemplo, Clofentezina, Hexitiazox y Diflovidazin o Etoxazol.
- (11) disruptores microbianos de las membranas del intestino medio de insectos, por ejemplo, Subespecies de Bacillus thuringiensis israelensis, Bacillus sphaericus, Bacillus thuringiensis subespecie aizawai, Bacillus thuringiensis subespecie kurstaki, Bacillus thuringiensis subespecie tenebrionis y proteínas de cultivos BT: Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry2Ab, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb, Cry34/35Ab1.
 - (12) inhibidores de la ATP sintasa mitocondrial, por ejemplo diafentiurón o acaricidas orgánicos de estaño, por ejemplo, Azociclotin, Cihexatin y óxido Fenbutatin o Propargita o Tetradifon.
 - (13) Desacopladores de fosforilación oxidativa a través de la interrupción del gradiente de protones, por ejemplo clorfenapir, DNOC y sulfluramida.
 - (14) bloqueadores de los canales del receptor nicotínico de acetilcolina (nAChR), por ejemplo Bensultap, clorhidrato Cartap, Tiociclam y tiosultap en sodio.
 - (15) inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 0, por ejemplo bistriflurón, Clorfluazuron, Diflubenzurón, flucicloxuron, Flufenoxuron, Hexaflumuron, Lufenurón, Novalurón, noviflumurón, Teflubenzuron y Triflumurón.
 - (16) inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 1, por ejemplo Buprofezina.
 - (17) disruptores mudos, por ejemplo Ciromazina.

10

20

25

30

35

- (18) agonistas del receptor de ecdisona, por ejemplo Cromafenozida, halofenozida, Metoxifenozida y Tebufenozida.
 - (19) agonistas del receptor de octopamina, por ejemplo Amitraz.
 - (20) inhibidores del transporte de electrones del complejo mitocondrial III, por ejemplo Hidrametilnona o Acequinocilo o fluacripirim.
- (21) inhibidores del transporte de electrones del complejo mitocondrial I, por ejemplo acaricidas METI, por ejemplo, Fenazaquin, Fenpiroximato, pirimidifen, Piridaben, Tebufenpirad y tolfenpirad o rotenona (Derris).
 - (22) Bloqueadores de los canales de sodio dependientes de voltaje, por ejemplo, Indoxacarbo o Metaflumizona.
 - (23) inhibidores de la acetil CoA carboxilasa, por ejemplo derivados del ácido tetrónico y tetrámico, por ejemplo, Spirodiclofen, Spiromesifen y Espirotetramat.
- (24) inhibidores del transporte de electrones del complejo mitocondrial IV, por ejemplo, fosfinas, por ejemplo, Fosfuro de aluminio, fosfuro de calcio, fosfina y fosfuro de cinc o cianuro.
 - (25) inhibidores del transporte de electrones del complejo mitocondrial II, por ejemplo Cienopirafen y ciflumetofeno.
 - (28) Moduladores del receptor de rianodina, por ejemplo, diamidas, por ejemplo, Clorantraniliprol, Ciantraniliprol y Flubendiamida.
- Otros componentes activos con el modo desconocido o incierto de la acción, por ejemplo Afidopiropen, azadiractina, Benclotiaz, benzoximato, Bifenazato, Bromopropilato, quinometionato, criolita, dicofol, Diflovidazin, Fluensulfona,

Flometoquin, Flufenerim, Flufenoxistrobin, Flufiprol, fluopiram, Flupiradifurona, Fufenozida, Heptaflutrin, Imidaclotiz, iprodiona, Meperflutrin, Paichongding, Piflubumide, Pirifluquinazon, Piriminostrobin, Tetrametilfluthrin y Yodometano; Además los productos basados en Bacillus firmus (que incluyen pero no limitado a la cepa CNCM I-1582, tal como, por ejemplo, Votivo TM, BioNem) o uno de los siguientes conocida activa compounds:3-bromo-N-{2-bromo-4-cloro-6-5 [(1-ciclopropiletil)carbamoil]fenil}-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocido a partir del documento 1-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoretil)sulfinil]fenil}-3-(trifluorometil)-1H-1,2,4-triazol-5-amina WO2005/077934) (conocido a partir del documento WO2006/043635), {1'-[(2E)-3-(4-clorofenil)prop-2-en-1-il]-5-fluorospiro[indol-3,4'piperidin]-1(2H)-il](2-cloropiridin-4-il)metanona (conocido a partir del documento WO2003/106457), 2-cloro-N-[2-{1-[(2E)-3-(4-clorofenil)prop-2-en-1-il]piperidin-4-il}-4-(trifluorometil)fenil]isonicotinamida (conocido 10 documento WO2006/003494), 3-(2,5-dimetilfenil)-4-hidroxi-8-metoxi-1,8-diazaespiro[4,5]dec-3-en-2-ona (conocido a partir del documento WO2009/049851), carbonato de 3-(2,5-dimetilfenil)-8-metoxi-2-oxo-1,8-diazaespiro[4,5]dec-3en-4-ilo de etilo (conocido a partir del documento WO2009/049851), 4 (but-2-in-1-iloxi)-6 (3,5-dimetilpiperidin-1-il)-5fluoropirimidina (conocido a partir del documento WO2004/099160), 4-(but-2-in-1-iloxi)-6-(3-clorofenil)pirimidina (n.º de reg. CAS 1204776-60-2) (conocido a partir del documento WO2003/076415), PF1364, 4-I5-(3.5-diclorofenil)-5-15 (trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-2-metil-N-{2-oxo-2-[(2,2,2-trifluoroetil)amino]etil}benzamida (conocido partir del documento WO2005/085216), 4-{5-[3-cloro-5-(trifluorometil)fenil]-5-(trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3il}-N-{2-oxo-2-[(2,2,2-trifluoroetil)amino]etil}-1-naftamida (conocido a partir del documento WO2009/002809), metilo 2-[2-({[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil}amino)-5-cloro-3-metilbenzoil]-2-metilhidrazinacarboxilato (coñocido a partir del documento WO2005/085216), 2-[2-({[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5illcarbonil\amino)-5-ciano-3-metilbenzoil\u00e4-2-etilhidrazinacarboxilato de metilo (conocido a partir del documento 20 WO2005/085216), 2-[2-({[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil}amino)-5-ciano-3-metilbenzoil]-2metilhidrazinacarboxilato de metilo (conocido a partir del documento WO2005/085216), 2-[3,5-dibromo-2-({[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil}amino)benzoil]-2-etilhidrazinacarboxilato de metilo (conocido a partir del documento WO2005/085216), 1-(3-cloropiridin-2-il)-N-[4-ciano-2-metil-6-(metilcarbamoil)fenil]-3-{[5-(trifluorometil)-2H-tetrazol-2-il]metil}-1H-pirazol-5-carboxamida (conocido a partir del documento WO2010/069502), N-[2-(5-amino-2-metil-6-(metilcarbamoil)fenil]-3-{[5-(trifluorometil)-2H-tetrazol-2-il]metil}-1H-pirazol-5-carboxamida (conocido a partir del documento WO2010/069502), N-[2-(5-amino-2-metil-6-(metilcarbamoil)fenil]-3-{[5-(trifluorometil)-2-il]metil}-1H-pirazol-5-carboxamida (conocido a partir del documento WO2010/069502), N-[2-(5-amino-2-metil-6-(metilcarbamoil)fenil]-3-{[5-(trifluorometil)-2-il]metil}-1H-pirazol-5-carboxamida (conocido a partir del documento WO2010/069502), N-[2-(5-amino-2-metil-6-(metilcarbamoil)fenil]-3-{[5-(trifluorometil)-2-il]metil}-1H-pirazol-5-carboxamida (conocido a partir del documento WO2010/069502), N-[2-(5-amino-2-metil-6-(metilcarbamoil)fenil]-3-{[5-(trifluorometil-6-(metilcarbamoil)fenil-6-(metilcarbamoil)fenil]-3-{[5-(trifluorometil-6-(metilcarbamoil)fen 25 1,3,4-tiadiazol-2-il)-4-cloro-6-metilfenil]-3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocido a partir del CN102057925), 3-cloro-N-(2-cianopropan-2-il)-N-[4-(1,1,1,2,3,3,3-heptafluoropropan-2-il)-2metilfenil]ftalamida (conocido a partir del documento WO2012/034472), 8-cloro-N-[(2-cloro-5-metoxifenil)sulfonil]-6-(trifluorometil)imidazo[1,2-a]piridina-2-carboxamida (conocido a partir del documento WO2010/129500), 8-cloro-N-30 [(2-cloro-5-metoxifenil)sulfonil]-6-(trifluorometil)imidazo[1,2-a]piridina-2-carboxamida (conocido partir WO2009/080250). N-[(2E)-1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]piridin-2(1H)-ilideno]2,2 2-trifluoroacetamida (conocido a partir del documento WO2012/029672), 1-[(2-cloro-1,3-tiazol-5-il)metil]-4-oxo-3-fenil-4H-pirido[1,2a]pirimidin-1-io-2-olato (conocido a partir del documento WO2009/099929), 1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]-4-oxo-3-fenil-4H-pirido[1,2-a]pirimidin-1-io-2-olato (conocido a partir del documento WO2009/099929), (5S,8R)-1-[(6-cloropiridin-3il)metil]-9-nitro-2,3,5,6,7,8-hexahidro-1H-5,8-epoxiimidazo[1,2-a]azepina (conocido a partir del 35 documento WO2010/069266), (2E)-1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]N'-nitro-2-pentilidenohidrazinacarboximidamida (conocido a partir WO2010/060231), 4-(3-{2.6-dicloro-4-[(3.3-dicloroprop-2-en-1-il)oxi]fenoxi}propoxi)-2-metoxi-6-(trifluorometil)pirimidina (Conocido a partir del documento CN101337940), N-[2-(terc-butilcarbamoil)-4-cloro-6metilfenil]-1-(3-cloropiridin-2-il)-3-(fluorometoxi)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocido a partir del documento 40 WO2008/134969).

En particular, las mezclas con nematicidas también son ventajosas. Los ejemplos de socios de mezcla nematicidas adecuados se pueden seleccionar de la lista que consiste en:

Dicloropropeno, metam sodio, metam potasio, cloropicrina, Oxamilo, carbofurano, Fostiazato, Aldicarb, Fenamifos, Cadusafos, Abamectina, cianamida, Dazomet, metilbromuro, Terbufós, Etoprofos, dibromuro de etileno, Forato, Metilisotiocianato, tiodicarb, tetratiocarbonato sodio, iprodiona, Fluensulfona, Imicyafos, dimetil disulfuro, espirotetramato, fluopiram, 1-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]fenil}-3-(trifluorometil)-1H-1,2,4-triazol-5-amins, 8-cloro-N-[(2-cloro-5-metoxifenil)sulfonil]-6-(trifluorometil)imidazo[1,2-a]piridina-2-carboxamida, 8-cloro-N-[(4-ciano-2,5-dimetilfenil)sulfonil]-6-(trifluorometil)imidazo[1,2-a]piridina-2-carboxamida, 2-(4-clorofenil) -5 (2-tienil) -1,3,4-oxadiazol, 5-fenil-2-(2-tienil) -1,3-oxazol, 5 (4-clorofenil) -2 (2-tienil) -1,3-oxazol, 5 (4-clorofenil) -2

Para el campo de la salud animal, en particular las mezclas con antihelmínticos también son ventajosas.

Los socios de mezcla representativos incluyen:

45

50

55

Activos antihelmínticos, que incluyen activos trematicidas y cestocidas:

De la clase de las lactonas macrocíclicas, por ejemplo:

abamectina, doramectina, emamectina, eprinomectina, ivermectina, milbemicina, moxidectina, nemadectina, selamectina;

de la clase de bencimidazoles y probencimidazoles, por ejemplo:

albendazol, sulfóxido de albendazol, cambendazol, ciclobendazol, febantel, fenbendazol, flubendazol,

ES 2 640 646 T3

mebendazol, netobimina, oxfendazol, oxibendazol, parbendazol, tiabendazol, tiofanato, triclabendazol;

de la clase de ciclooctadepsipéptidos, por ejemplo:

emodepside, PF1022;

de la clase de los derivados de aminoacetonitrilo, por ejemplo:

5 monepantel;

de la clase de tetrahidropirimidinas, por ejemplo:

morantel, pirantel, oxantel;

de la clase de imidazotiazoles, por ejemplo:

butamisol, levamisol, tetramisol;

de la clase de salicilanilidas, por ejemplo:

bromoxanida, brotianida, clioxanida, closantel, niclosamida, Oxiclozanida, rafoxanida, tribromsalan;

de la clase de parahercuamidas, por ejemplo:

derquantel, parahercuamida;

de la clase de aminofenilamidines, por ejemplo:

amidantel, amidantel desacilado (dAMD), tribendimidina;

de la clase de los fosfatos orgánicos, por ejemplo:

coumafos, crufomato, diclorvos, haloxon, naftalofos, triclorfon;

de la clase de fenoles sustituidos, por ejemplo:

bitionol, disofenol, hexaclorofeno, niclofolan, meniclofolan, nitroxinil;

de la clase de piperazinonas, por ejemplo:

praziquantel, epsiprantel;

25

30

35

40

de diversas otras clases, tales como por ejemplo:

amoscanato, befenio, bunamidina, clonazepam, clorsulon, diamfenetida, diclorofeno, dietilcarbamazina, emetina, hetolin, hicantona, lucantona, miracilo, mirasan, niclosamida, niridazol, nitroxinil, nitroscanato, oltipraz, omfalotina, oxamniquina, paromomicina, piperazina, resorantel.

Todos los componentes de mezcla con nombre pueden, si sus grupos funcionales permiten esto, de manera opcional formar sales con bases o ácidos adecuados.

Los componentes activos especificados en el presente documento por su "nombre común" son conocidos y se describen, por ejemplo, en el Manual de Pesticidas ("The Pesticide Manual", 14ª ed., British Crop Protection Council 2006) o se puede buscar en la Internet (por ejemplo, http://www.alanwood.net/pesticides).

Las sustancias activas, combinaciones de sustancias activas o composiciones de acuerdo con la invención también se pueden combinar con microbios.

Los microbios de acuerdo con la invención, en combinación con buena tolerancia de las plantas y toxicidad favorable para los animales de sangre caliente y que son bien tolerados por el entorno, son adecuados para la protección de plantas y órganos de plantas, para aumentar los rendimientos de cosecha, para mejorar la calidad de la cosecha materiales y para el control de plagas animales, en particular los insectos, los arácnidos, los helmintos, nematodos y moluscos, que se presentan en agricultura, la horticultura, la cría de animales, en los bosques, en los jardines e instalaciones de ocio, en la protección de productos almacenados y de materiales, y en el sector de la higiene. Preferentemente se pueden emplear como agentes fitosanitarios. Son activos frente a especies normalmente sensibles y resistentes así como contra todos o algunos estados de desarrollo. Los microbios citados con anterioridad incluyen:

Microbios de las bacterias de dominio, microbios de los Hongos de dominio, microbios insecticidas de dominio protozoos, microbios insecticidas de los dominios virus y microbios desde el dominio de los nematodos entomopatógenos.

Los diversos aspectos de la invención se ilustrarán a continuación con referencia a los siguientes ejemplos de producción y de uso de una manera no limitante.

Ejemplos de preparación

Datos de RMN 1H

- 5 Los datos de RMN ¹H se determinaron con un espectrómetro Bruker Avance 400 equipado con una celda de flujo (60 μl de volumen) o con un AVIII Bruker 400 equipado con un cabezal de sonda crio-CPTCI de 1,7 mm o con un Bruker AVII 600 (600,13 MHz) equipado con un cabezal de sonda crio-TCI o con un Bruker AVIII 600 (601,6 MHz) equipado con un cabezal de sonda crio-CPMNP con tetrametilsilano como referencia (0,0) y los disolventes CD₃CN, CDCl₃, D₆-DMSO.
- Los datos de la RMN de los ejemplos seleccionados se enumeran en el formato clásico (el desplazamiento químico δ, la multiplicidad, el número de átomos de hidrógeno) o como listas de picos de las RMN.

Los espectros de RMN de los pasos del ejemplo de preparación 1 y los espectros de RMN de los ejemplos 1 a 5 se han medido en un Varian 400 MHz Mercury Plus.

Ejemplo de Preparación 1:

15 **Paso 1:**

20

25

Síntesis de (5-bromo-3-cloropiridin-2-il)-(ciano)acetato de etilo

A una suspensión de NaH (4,0 g, 1,5 equiv.) en DMF (45 ml) a 0 °C, se le añadió cianoacetato de etilo (10,6 ml, 1,5 equiv.) y se agitó a temperatura ambiente durante 30 minutos. Después se añadió 5-bromo-2,3-dicloropiridina (15.0 g, 1,0 equiv.) en DMF (30 ml) a la mezcla de reacción a temperatura ambiente y se agitó a 80 °C durante 4 horas. Después de la terminación de la reacción, la mezcla de reacción se diluyó con agua y se extrajo con acetato de etilo. Las capas orgánicas combinadas se lavaron con agua, salmuera, se secaron sobre sulfato de sodio anhidro y el disolvente se retiró a presión reducida. El producto en bruto se purificó sobre gel de sílice (malla 100 a 200) por cromatografía en columna por medio de la elución con EtOAc al 5 %/éter de pet., esto produjo 10,0 g (49,8 %). CLEM: (M + H): 303

RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃); δ 1,3 (t, 3H), 4,3 (c, 2H), 5,3 (s, 1H), 8,0 (s, 1H), 8,6 (s, 1H).

Paso 2

Síntesis de (5-bromo-3-cloropiridin-2-il) acetonitrilo

A una solución de (5-bromo-3-cloropiridin-2-il)-(ciano)acetato de etilo (10,0 g, 1,0 equiv.) en DMSO (30 ml) y agua (5 ml) a temperatura ambiente, se le añadió NaCl (636 mg, 0,33 equiv) y la mezcla de reacción se agitó a 170 °C durante una hora. Después de la terminación de la reacción, la mezcla de reacción se diluyó con agua y se extrajo con acetato de etilo. Las capas orgánicas combinadas se lavaron con agua, salmuera, se secaron sobre sulfato de sodio anhidro y el disolvente se retiró a presión reducida. El producto en bruto se purificó sobre gel de sílice (malla 100 a 200) por cromatografía en columna por medio de la elución con EtOAc al 3 %/éter de pet. para producir 7,0 g (91.8 %).

CLEM: (M-H): 228,8

RMN 1 H (400 MHz, CDCl₃); 4 δ (s, 2H) 7,9 (s, 1H), 8,6 (s, 1H).

Paso 3:

Síntesis de [2-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]carbamato de terc-butilo

A la solución de (5-bromo-3-cloropiridin-2-il)acetonitrilo (2 x 3,5 g, 1,0 equiv.) en metanol (2 x 28 ml) a 0 °C, se le añadieron anhídrido BOC (2 x 3,5 ml, 1,1 equiv), NiCl $_2$.6H $_2$ O (2 x 1,08 g, 0,3 equiv.), NaBH $_4$ (2 x 1,72 g, 3,0 equiv.), y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 30 minutos. Después de la terminación de la reacción, la mezcla de reacción se concentró a presión reducida, el residuo se diluyó con agua y se extrajo con acetato de etilo. Las capas orgánicas combinadas se lavaron con agua, salmuera, se secaron sobre sulfato de sodio anhidro y el disolvente se retiró a presión reducida. El producto en bruto se purificó sobre gel de sílice (malla 100 a 200) por cromatografía en columna por medio de la elución con EtOAc al 10 %/éter de pet. a para dar 5,0 g (49,2 %). CLEM: (M + H): 335

RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃); δ 1,4 (s, 9H), 3,1 (m, 2H), 3,6 (m, 2H), 5,1 (a, 1H), 7,8 (s, 1H), 8,5 (s, 1H).

Paso 4:

Síntesis de clorhidrato de 2-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etanamina

15

20

5

10

A la solución de [2-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]carbamato de *terc*-butilo (5,0 g, 1,0 equiv.) en metanol (30 ml) a temperatura ambiente, se le añadió HCl metanólico (50 ml) y la mezcla de reacción se agitó a 70 °C durante una hora. Después de la terminación de la reacción, la mezcla de reacción se concentró a presión reducida. El producto en bruto se purificó por medio de lavados con acetato de etilo para producir 3,0 g (74 %). CLEM: (M + H): 235

RMN ¹H (400 MHz, D₆-DMSO); δ: 3,2 (m, 4H), 8,2 (a, 2H), 8,4 (s, 1H), 8,6 (s, 1H).

Paso 5:

Síntesis de N-[2-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2-(trifluorometil)benzamida

30

25

A una solución de clorhidrato de 2-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etanamina (3,0 g, 1,0 equiv.) en THF (30 ml) a temperatura ambiente, se le añadieron TEA (4,6 ml, 3,0 equiv.), ácido 2-trifluorometil benzoico (2,3 g, 1,1 equiv.), EDC.HCl (3,16 g, 1,5 equiv.) y se agitó durante 15 minutos. Después se añadió HOBT (2,23 g, 1,5 equiv.) a la mezcla de reacción y continuó la reacción a la misma temperatura durante cuatro horas. Después de la terminación de la reacción, la mezcla de reacción se diluyó con HCl 2 N y se extrajo con acetato de etilo. Las capas orgánicas combinadas se lavaron con solución de Na₂CO₃, salmuera, se secaron sobre sulfato de sodio anhidro y el disolvente se retiró a presión reducida para dar 3,0 g, (68,2 %).

CLEM: (M + H): 407

RMN 1 H (400 MHz, CDCl₃); δ 3,2 (m, 2H), 4 (m, 2H), 6,6 (a, 1H), 7,5 a 7,6 (m, 3H), 7,7 (m, 1H), 7,8 (s, 1H), 8,4 (s, 1H).

Paso 6:

10

Síntesis de N-{2-[3-cloro-5-(1H-pirazol-1-il)piridin-2-il]etil}-2-(trifluorometil)benzamida (expl. 4)

A una solución en agitación de N-[2-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2-(trifluorometil)benzamida (300 mg, 1,0 equiv.) en acetonitrilo (6 ml) a temperatura ambiente, se añadieron pirazol (60 mg, 1,2 equiv.), óxido de cobre (I) (11 mg, 0,1 equiv.), salicilaldoxima (20 mg, 0,2 equiv.) de carbonato de cesio (480 mg, 2,0 equiv.) y la mezcla de reacción se calentó a 75 °C durante 24 horas. Después de la terminación de la reacción, la mezcla de reacción se diluyó con acetato de etilo y se filtró. El filtrado se concentró a presión reducida. El producto en bruto se purificó por medio de HPLC preparativa para producir 90 mg (31 %).

RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃); CDCl₃ δ: 3,3 (m, 2H), 4 (m, 2H), 6,5 (s, 1H), 6,8 (a, 1H), 7,5 a 7,6 (m, 3H), 7,7 (m, 1H), 7,8 (s, 1H), 7,9 (s, 1H), 8,1 (s, 1H), 8,8 (s, 1H).

Ejemplo de Preparación 2:

Síntesis de N-{2-[5-cloro-6'-(trifluorometil)-3,3'-bipiridin-6-il]etil}-2-(trifluorometil) benzamida (expl. 7)

Se disolvieron 114 mg (0,28 mmol) de N-[2-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2-(trifluorometil)benzamida (del paso 5) y 53,5 mg (0,28 mmol) de ácido [6-(trifluorometil)piridin-3-il]borónico en 4 ml de dioxano. A partir de después, se añadieron 20,7 mg (0,02 mmol) de paladio de dicloro-bis (triciclohexilfosfina) (II) y 182,5 mg (0,56 mmol) de carbonato de cesio en 4 ml de agua y se trató en un vial de microondas cerrado herméticamente en un horno microondas Biotage (iniciador) a 100 °C durante 20 minutos. La mezcla de reacción se filtró sobre un cartucho de gel de sílice - sulfato de sodio, se evaporaron los disolventes y el producto en bruto se purificó por cromatografía en gel de sílice (gradiente de ciclohexano/acetato de etilo) para proporcionar 87 mg (65,6 %) del compuesto del título de forma de sólido de color blanguecino.

RMN 1 H (400 MHz, d6-DMSO); δ 9,21 (s, 1H), 8,99 (s, 1H), 8,64 (t, 1H, NH), 8,53 a 8,51 (d, 1H), 8,46 (s, 1H), 8,6 a 8,4 (d, 1H), 7,78 - 7,51 (m, 4H), 3,72 a 3,67 (c, 2 H), 3,22 a 3,19 (t, 2H).

25 Ejemplo de preparación 3:

Paso 1:

La síntesis de 2-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)-2,2-difluoroetanamina se realizó de manera análoga al documento WO 2013/064460 A1 (denominado como los intermedios IIa-14 y IIa-15).

30 RMN 1 H (400 MHz, d6-DMSO); δ 8,78 (d, J = 1,6 Hz, 1H), 8,52 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 3,37 (t, J = 14,8 Hz, 2H), 1,72 (s, 2H).

Paso 2:

Síntesis de N-[2-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)-2,2-difluoroetilo]-2-(trifluorometil)benzamida

A una solución de 2-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)-2,2-difluoroetanamina (2,56 g, 1,03 equiv.) en diclorometano (50 ml) a temperatura ambiente, se le añadieron TEA (3,38 ml, 3,0 equiv.) y cloruro de ácido 2-trifluorometilbenzoico (1,68 g, 1,0 equiv.) y se agitó durante la noche. Después de la terminación de la reacción, la mezcla de reacción se diluyó con agua y se extrajo con diclorometano. El disolvente de las capas orgánicas combinadas se evaporó a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía en gel de sílice (ciclohexano/acetato de etilo) para dar 2,86 g (68,5 %) de forma de sólido de color blanquecino.

 $\dot{R}M\dot{N}$ $^{1}H\dot{I}$ (400 MHz, d6-DMSO); δ 8,97 (t, $\dot{I}H$, NH), 8,80 (d, 1H), 8,56 (d, 1H), 7,77 a 7,63 (m, 3 H), 7,45 (d, 1H), 4,28 a 4,19 (m, 2H).

Paso 3:

5

10

15

20

Síntesis de N-{2-[5-cloro-6'-(trifluorometil)-3,3'-bipiridin-6-il]-2,2-difluoroetil}-2-(trifluorometil) benzamida (expl. 11)

Se disolvieron 100 mg (0,22 mmol) de N-[2-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)-2,2-difluoroetilo]-2-(trifluorometil) benzamida (del paso 2) y 47,3 mg (0,24 mmol) de ácido [6-(trifluorometil) piridin-3-il]borónico en 3 ml de dioxano. A partir de después, se añadieron 16,5 mg (0,02 mmol) de complejo de 1,1'-bis-(difenilfosfino)-ferrocen)-paladio-diclorometano y 1,12 ml (2,23 mmol) de una solución de carbonato de sodio acuoso 2 M y se trató en un vial de microondas cerrado herméticamente en un horno microondas Biotage (iniciador) a 100 °C durante 20 minutos. La mezcla de reacción se filtró sobre un cartucho de gel de sílice - sulfato de sodio, se evaporaron los disolventes y el producto en bruto se purificó por HPLC preparativa para proporcionar 54,3 mg (42,95 %) del compuesto del título de forma de sólido de color blanquecino.

RMN ¹H (400 MHz, d6-DMSO); δ 9,27 (s, 1H), 9,13 (s, 1H), 9,03 (t, 1H, NH), 8,68 (s, 1H), 8,60 (d, 1H), 8,11 (s, 1H), 7,79 a 7,64 (m, 3H), 7,49 (d, 1H), 4,37 a 4,28 (m, 2H).

De acuerdo con los procedimientos descritos con anterioridad, se han preparado los siguientes compuestos de fórmula general (I).

Tabla 1

Compuestos de fórmula (I-1)

$$\begin{array}{c|c}
\hline
Q & Xn & O \\
\hline
B_{1}^{1} & R^{2} & A \\
\hline
\end{array}$$

R¹, R², B¹, Q, X, n, A de acuerdo con lo definido por cada estructura individual, en la que los compuestos de acuerdo con la invención son aquellos compuestos en los que Q <u>representa</u> un anillo heteroaromático opcionalmente mono o polisustituido del grupo que consiste en Q-41, Q-42, Q-43, Q-44, Q-45, Q-46, Q-47, Q-48, Q-49, Q-50, Q-51, Q-52, Q-53 y Q-57 como se ha definido anteriormente,

ejemplo n.º	Fórmula	logP 1)	(M+)+1	RMN ¹ H
ojempio ni.	Tomala	(HCOOH)	(CL/EM)	
1	CI F F F	1,21	395,0	CDCl ₃ : 3,3 (m, 2H), 4 (m, 2H), 6,5 (s, 1H), 6,8 (a, 1H), 7,5-7,6 (m, 3H), 7,7 (m, 1H), 7,8 (s, 1H), 7,9 (s, 1H), 8,1 (s, 1H), 9,8 (s, 1H)
2		3,65	463,0	CDCl ₃ : 3,3 (m, 2H), 4 (m, 2H), 6,7 (a, 1H), 7,5 (m, 3H), 7,7 (m, 1H), 7,9 (s, 1H), 8,1 (s, 1H), 8,2 (s, 1H), 8,8 (s, 1H)
3	F F F	3,68	463,0	CDCl ₃ : 3,2 (m, 2H), 3,7 (m, 2H), 7,2 (s, 1H), 7,5 (m, 1H), 7,6-7,8 (m, 3H), 8,5 (s, 1H), 8,6 (m, 1H), 8,9 (s, 1H), 9,1 (s, 1H)
4	CI FFF	2,69	395,1	CDCl ₃ : 3,3 (m, 2H), 4 (m, 2H), 6,5 (s, 1H), 6,8 (a, 1H), 7,5-7,6 (m, 3H), 7,7 (m,, 1H), 7,8 (s, 1H), 7,9 (s, 1H), 8,1 (s, 1H), 8,8 (s, 1H)
5		2,06	396,1	D6-DMSO: 3,2 (m, 2H), 3,7 (m, 2H), 7,5 (m, 1H), 7,6 (m, 1H), 7,7-7,8 (m, 2H),8,3 (s, 1H), 8,5 (s, 1H), 8,7 (m, 1H), 9,1 (s, 1H), 9,4 (s, 1H)
6		3,0	440,0; 442,0	lista de picos de la RMN

ejemplo n.º	Fórmula	logP ¹⁾ (HCOOH)	(M+)+1 (CL/EM)	RMN ¹ H
7	F T N T T T T T T T T T T T T T T T T T	3,29	474,1	lista de picos de la RMN
8	CI N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	3,21	431,2	lista de picos de la RMN
9		3,53	445,2	lista de picos de la RMN
10	F C C F H F F F F F F F F F F F F F F F	2,84	460,2	lista de picos de la RMN
11	F CI	3,42	510,2	lista de picos de la RMN
12		3,21	476,2	lista de picos de la RMN
13		1,86	456,2	lista de picos de la RMN

ES 2 640 646 T3

ejemplo n.º	Fórmula	logP ¹⁾ (HCOOH)	(M+)+1 (CL/EM)	RMN ¹ H
14	N CO	3,0	476,2	lista de picos de la RMN
15	CI CI CI PIE PE	3,17	476,2	lista de picos de la RMN
16	F N C C C F F F F F F F F F F F F F F F	3,02	460,0	lista de picos de la RMN
17		4,15	500,3	lista de picos de la RMN
18		3,68	512,2	lista de picos de la RMN
19		2,27	442,2	lista de picos de la RMN
20		3,94	540,2	lista de picos de la RMN

ES 2 640 646 T3

ejemplo n.º	Fórmula	logP ¹⁾ (HCOOH)	(M+)+1 (CL/EM)	RMN ¹ H
21	CI OF THE PERSON	2,88	476,2	lista de picos de la RMN
22		2,0	442,2	lista de picos de la RMN
23	F CI CI F F F F F F F F F F F F F F F F	2,96	460,2	lista de picos de la RMN
24		3,17	476,1	lista de picos de la RMN
25		3,84	512,1	lista de picos de la RMN
26				
27	F H H F F H F F F F F F F F F F F F F F			

ejemplo n.º	Fórmula	logP ¹⁾ (HCOOH)	(M+)+1 (CL/EM)	RMN ¹ H
28		3,62	499,0	D6-DMSO: 9,45 (s, 1H), 9,21 (s, 1H), 9,01 (t, 1H, NH), 8,69 (d, 1H), 8,34 (s, 1H), 7,78-7,63 (m, 3H), 7,47 (d, 1H), 4,34-4,25 (m, 2H)
29	F CI	2,57	460,9	lista de picos de la RMN
30	F CI N N F F N N N N N N N N N N N N N N N	2,75	461,9	lista de picos de la RMN
31	F N CI F F	3,94	455,0; 456,0	lista de picos de la RMN
32	F N N F F F	2,66	457,0	lista de picos de la RMN
33	CI N F F	3,26	472,7	lista de picos de la RMN
34	CI N F F F	2,77	473,0	lista de picos de la RMN
35	F F F F F	3,55 (neutral)	506,1	CDCl ₃ : 8,94 (d, 1H), 8,69 (d, 1H), 8,07 (dd, 1H), 7,98 (m, 1H), 7,85 (d, 1H), 7,69 (d, 1H), 7,58 (m, 3H), 6,48 (t, 1H, NH), 4,41-4,19 (m, 2H), 1,70 (d, 3H, CH3)

ejemplo n.º	Fórmula	logP ¹⁾ (HCOOH)	(M+)+1 (CL/EM)	RMN ¹ H
36	F F F F F F F F F F F F F F F F F F F	3,17	507,0	lista de picos de la RMN
37	CI F F F	3,79	452,0	lista de picos de la RMN
38	CI N F F F F F F F F F F F F F F F F F F	1,69	453,0	lista de picos de la RMN
39	F N H O F F	2,99	455,9	lista de picos de la RMN
40	F CI N F F F	2,49	456,9	lista de picos de la RMN
41	F HE F	3,28	478,0	D6-DMSO: 9,09 (s, 1H), 9,02 (t, 1H), 8,70 - 8,61 (m, 3H), 7,79 - 7,64 (m, 3H), 7,48 (d, 1H), 4,36 - 4,27 (m, 2H),
42		1,97	485,1	D6-DMSO: 8,97 (t, 1H), 8,94 (d, 1H), 8,64 (d, 1H), 8,37 (d, 1H), 8,05 - 8,02 (dd, 1H), 7,78 - 7,71 (m, 2H), 7,65 (dd, 1H), 7,49 (d, 1H), 6,78 (d, 1H), 4,29 - 4,28 (m, 2H), 3,10 (s, 6H),

Listas de picos de la RMN

Los datos de las RMN 1 H de ejemplos seleccionados se escriben de forma de listas de picos de RMN 1 H. El valor de δ en ppm y la intensidad de la señal se indican para cada pico de señal entre paréntesis. Entre los pares de intensidad del valor de δ y la señal se encuentran puntos y comas como delimitadores.

Por consiguiente, la lista de picos de un ejemplo tiene la forma:

 δ_1 (Intensidad₁); δ_2 (Intensidad₂);......; δ_i (Intensidad_i);......; δ_n (Intensidad_n)

La intensidad de las señales agudas se correlaciona con la altura de las señales en un ejemplo impreso de un espectro de RMN en cm y muestra las relaciones reales de las intensidades de señal. Se puede demostrar a partir de señales anchas varios picos o la media de la señal y su intensidad relativa en comparación con la señal más intensa en el espectro.

- 5 Se ha usado tetrametilsilano y/o el desplazamiento químico del disolvente usado, en especial en el caso de los espectros medidos en DMSO para la calibración. Por lo tanto, el pico de tetrametilsilano puede ocurrir pero no necesariamente en las listas de picos de RMN.
 - Las listas de picos de RMN ¹H son similares a las impresiones de RMN ¹H clásicas y contienen, por tanto, por lo general todos los picos, que se enumeran en la interpretación clásica de RMN.
- Además, se puede mostrar como las señales de impresiones de RMN ¹H clásicas de disolventes, los estereoisómeros de los compuestos diana, que también son un objetivo de la invención, y/o picos de impurezas.
 - Los picos habituales de disolventes, por ejemplo picos de DMSO en D₆-DMSO y el pico de agua, se dan en las listas de picos de RMN ¹H para mostrar señales de compuestos en el intervalo delta de disolventes y/o agua. Tienen por lo general, en promedio, una alta intensidad.
- Los picos de los estereoisómeros de los compuestos y/o picos de impurezas diana por lo general tienen en promedio una intensidad menor que los picos de compuestos diana (por ejemplo con una pureza > 90 %).
 - Tales estereoisómeros y/o impurezas pueden ser típicas para el proceso de preparación específico. Por lo tanto, sus picos pueden ayudar a reconocer la reproducción de nuestro proceso de preparación a través de "productos secundarios-huellas dactilares".
- 20 Un experto, que calcula los picos de los compuestos diana con procedimientos conocidos (MestreC, simulación ACD, sino también con valores esperados evaluados de forma empírica) puede aislar los picos de los compuestos diana como sea necesario de forma opcional por el uso de filtros de intensidad adicionales. Este aislamiento sería similar al del pico correspondiente a la recolección de interpretación clásica de RMN ¹H.
- Más detalles de la descripción de datos de RMN con las listas de picos se encuentran en la publicación "Cita de Datos de Lista de Picos de RMN dentro de las Solicitudes de Patentes" de la Base de Datos de la Desvelación de Investigación Número 564.025.

Tabla con Listas de Picos de RMN

Ejemplo 6: RMN 1H(400,0 MHz, DMSO):

 $\bar{\delta}$ = 8,923 (15.2); 8,918 (15.5); 8,869 (12,3); 8,862 (12,3); 8,651 (3,4); 8,637 (6,9); 8,623 (3,4); 8,371 (16,0); 8,365 (15.8); 8,319 (8,0); 8,313 (7,8); 8,298 (8,5); 8,292 (8,4); 7,775 (6,9); 7,755 (9,3); 7,737 (3,1); 7,719 (7,8); 7,701 (5,6); 7,679 (12,9); 7,658 (13,6); 7,633 (7,1); 7,614 (2,7); 7,528 (8,3); 7,509 (6,9); 6,579 (0,5); 4,038 (0,5); 4,020 (0,5); 3,700 (4,0); 3,683 (9,0); 3,667 (9,2); 3,650 (4,7); 3,324 (76,3); 3,202 (8,8); 3,184 (14,3); 3,166 (7,6); 3,147 (0,4);

3,128 (0,3); 2,676 (0,9); 2,671 (1,2); 2,667 (0,9); 2,608 (0,4); 2,541 (1,0); 2,524 (3,8); 2,511 (66,7); 2,507 (130,6); 2,502 (171,1); 2,498 (125,3); 2,494 (61,7); 2,333 (0,8); 2,329 (1,1); 2,325 (0,8); 1,989 (2,0); 1,397 (0,9); 1,271 (1,2); 1,259 (2,2); 1,244 (1,6); 1,237 (1,2); 1,193 (0,6); 1,175 (1,5); 1,169 (3,6); 1,157 (0,6); 0,008 (0,6); 0,000 (14,0); -0,009 (0,5)

Ejemplo 7: RMN 1H(400,0 MHz, DMSO):

 δ = 9,213 (10,8); 9,208 (10,6); 8,998 (15.2); 8,993 (15.0); 8,663 (3,3); 8,648 (6,5); 8,634 (3,2); 8,532 (5,6); 8,527 (5,4); 8,511 (6,1); 8,506 (6,0); 8,458 (16,0); 8,453 (15.2); 8,316 (1,2); 8,058 (11,2); 8,038 (10,3); 7,777 (6,9); 7,757 (9,2); 7,739 (3,0); 7,721 (7,8); 7,702 (5,5); 7,654 (5,4); 7,635 (7,0); 7,616 (2,6); 7,532 (8,2); 7,514 (6,9); 4,319 (0,4); 4,038 (0,4); 4,020 (0,4); 3,716 (3,9); 3,699 (8,9); 3,683 (9,2); 3,666 (4,5); 3,322 (131,2); 3,224 (8,7); 3,206 (14,2); 3,188 (7,5); 2,675 (1,6); 2,671 (2,1); 2,667 (1,5); 2,541 (1,3); 2,524 (6,4); 2,510 (127,0); 2,506 (243,7); 2,502 (313,6); 2,497 (228,6); 2,493 (112,2); 2,333 (1,6); 2,329 (2,2); 2,324 (1,6); 1,989 (1,5); 1,360 (2,2); 1,193 (0,4); 1,175 (0,8); 1,157 (0,4); 0,008 (0,9); 0,000 (23,2); -0,008 (0,9)

Ejemplo 8: RMN ¹H(400,0 MHz, DMSO):

ō = 8,985 (3,3); 8,971 (6,8); 8,955 (3,6); 8,942 (14,3); 8,938 (14,6); 8,523 (15.6); 8,492 (0,3); 8,412 (14,2); 8,408 (13,9); 8,317 (0,8); 7,936 (0,3); 7,857 (9,5); 7,853 (16,0); 7,849 (9,9); 7,799 (0,4); 7,781 (7,3); 7,761 (10,0); 7,747 (3,3); 7,729 (8,2); 7,710 (5,7); 7,668 (5,8); 7,649 (7,3); 7,630 (2,8); 7,472 (8,6); 7,453 (7,6); 7,215 (13,2); 7,212 (13,1); 4,326 (3,3); 4,310 (3,3); 4,289 (7,5); 4,273 (7,3); 4,251 (3,9); 4,235 (3,5); 3,345 (159,1); 3,219 (0,4); 3,205 (0,3); 2,996 (0,5); 2,711 (0,5); 2,676 (1,8); 2,672 (2,3); 2,667 (1,7); 2,542 (130,3); 2,507 (297,5); 2,503 (386,0); 2,498 (282,1); 2,434 (0,7); 2,427 (0,6); 2,406 (0,3); 2,376 (0,3); 2,368 (0,7); 2,334 (1,8); 2,329 (2,3); 2,325 (1,8); 2,292 (0,5); 2,048 (0,4); 1,259 (0,5); 1,235 (2,1); 0,146 (0,5); 0,008 (3,8); 0,000 (101,9); -0,008 (3,8); -0,021 (0,4); -0,150 (0,6)

Ejemplo 9: RMN 1H(400,0 MHz, DMSO):

 $\begin{array}{l} 5 = 8,994 \ (3,3); \ 8,979 \ (7,2); \ 8,963 \ (3,3); \ 8,757 \ (14,2); \ 8,753 \ (14,1); \ 8,439 \ (0,4); \ 8,317 \ (1,0); \ 8,177 \ (14,4); \ 8,172 \ (14,0); \ 7,872 \ (0,4); \ 7,855 \ (0,5); \ 7,782 \ (7,1); \ 7,762 \ (9,7); \ 7,750 \ (3,4); \ 7,731 \ (7,9); \ 7,713 \ (5,8); \ 7,684 \ (15.7); \ 7,680 \ (16,0); \ 7,669 \ (6,1); \ 7,650 \ (7,2); \ 7,631 \ (2,8); \ 7,569 \ (0,3); \ 7,553 \ (0,7); \ 7,533 \ (0,5); \ 7,520 \ (0,4); \ 7,504 \ (0,5); \ 7,483 \ (8,2); \ 7,464 \ (7,2); \ 6,953 \ (14,6); \ 6,948 \ (14,3); \ 4,340 \ (3,1); \ 4,325 \ (3,4); \ 4,303 \ (7,3); \ 4,288 \ (7,0); \ 4,266 \ (3,7); \ 4,251 \ (3,4); \ 3,338 \ (161,3); \ 3,229 \ (0,5); \ 3,170 \ (0,5); \ 2,712 \ (0,4); \ 2,676 \ (1,7); \ 2,671 \ (2,5); \ 2,542 \ (112,1); \ 2,507 \ (320,9); \ 2,503 \ (392,5); \ 2,498 \ (281,0); \ 2,494 \ (136,2); \ 2,447 \ (0,8); \ 2,418 \ (0,5); \ 2,395 \ (0,4); \ 2,367 \ (0,7); \ 2,346 \ (0,6); \ 2,334 \ (1,7); \ 2,329 \ (2,3); \ 2,325 \ (1,8); \ 2,291 \ (0,5); \ 2,271 \ (0,4); \ 2,186 \ (0,4); \ 1,740 \ (0,4); \ 1,685 \ (0,3); \ 1,258 \ (0,5); \ 1,235 \ (1,9); \ 0,146 \ (0,4); \ 0,008 \ (4,2); \ 0,000 \ (95,8); \ -0,008 \ (3,4); \ -0,150 \ (0,5) \end{array}$

Ejemplo 10: RMN 1H(400,0 MHz, DMSO):

5 = 11,825 (0,4); 9,108 (15.4); 9,103 (15.5); 9,036 (3,5); 9,020 (7,3); 8,998 (9,8); 8,993 (16,0); 8,989 (9,2); 8,737 (1,3); 8,732 (1,6); 8,720 (14,4); 8,713 (14,8); 8,637 (15.9); 8,632 (15.6); 8,566 (0,4); 8,470 (1,2); 8,465 (1,2); 8,363 (4,6); 8,358 (6,1); 8,352 (4,4); 8,338 (4,9); 8,331 (6,0); 8,326 (4,5); 8,317 (2,4); 7,786 (7,5); 7,766 (10,1); 7,756 (4,0); 7,737 (8,3); 7,718 (6,0); 7,673 (6,2); 7,654 (7,8); 7,635 (3,0); 7,576 (0,4); 7,551 (0,6); 7,530 (0,7); 7,487 (8,7); 7,468 (7,7); 7,448 (1,0); 7,429 (1,0); 7,202 (0,4); 7,074 (0,4); 6,945 (0,6); 4,360 (3,2); 4,345 (3,3); 4,323 (7,5); 4,308 (7,1); 4,285 (4,1); 4,271 (3,7); 4,250 (0,9); 4,233 (0,8); 4,213 (0,5); 4,197 (0,4); 3,693 (0,4); 3,602 (0,4); 3,561 (0,5); 3,536 (0,4); 3,520 (0,6); 3,475 (0,7); 3,343 (423,4); 3,197 (0,6); 3,193 (0,6); 3,141 (0,5); 3,132 (0,4); 3,098 (0,4); 3,044 (0,5); 2,996 (0,9); 2,712 (0,7); 2,676 (4,0); 2,671 (5,4); 2,667 (4,1); 2,576 (0,7); 2,564 (0,9); 2,542 (177,9); 2,525 (13,8); 2,511 (354,3); 2,507 (712,0); 2,502 (925,0); 2,498 (662,6); 2,493 (317,2); 2,450 (1,2); 2,409 (0,7); 2,392 (0,7); 2,367 (0,9); 2,334 (4,1); 2,329 (5,4); 2,325 (3,9); 2,292 (1,1); 2,253 (0,5); 2,243 (0,4); 2,075 (0,4); 1,299 (0,4); 1,259 (0,9); 1,235 (3,8); 0,854 (0,5); 0,146 (0,7); 0,008 (6,7); 0,000 (191,1); -0,009 (6,0); -0,150 (0,9); -3,686 (0,4)

Ejemplo 11: RMN ¹H(400,0 MHz, DMSO):

 $\delta = 9,268 \ (11,5); \ 9,263 \ (11,1); \ 9,127 \ (15.1); \ 9,122 \ (14,9); \ 9,043 \ (3,5); \ 9,028 \ (7,3); \ 9,012 \ (3,4); \ 8,678 \ (16,0); \ 8,673 \ (14,9); \ 8,601 \ (5,6); \ 8,596 \ (5,5); \ 8,581 \ (6,2); \ 8,576 \ (6,1); \ 8,317 \ (1,0); \ 8,111 \ (11,7); \ 8,090 \ (10,8); \ 7,787 \ (7,0); \ 7,767 \ (9,6); \ 7,756 \ (3,3); \ 7,737 \ (7,9); \ 7,718 \ (5,6); \ 7,674 \ (5,6); \ 7,655 \ (7,1); \ 7,636 \ (2,6); \ 7,491 \ (8,4); \ 7,472 \ (7,3); \ 4,371 \ (3,1); \ 4,356 \ (3,1); \ 4,334 \ (7,1); \ 4,318 \ (6,8); \ 4,296 \ (3,5); \ 4,281 \ (3,3); \ 3,477 \ (0,3); \ 3,464 \ (0,4); \ 3,449 \ (0,4); \ 3,432 \ (0,5); \ 3,346 \ (284,9); \ 3,270 \ (0,8); \ 2,996 \ (1,2); \ 2,712 \ (0,4); \ 2,677 \ (1,7); \ 2,672 \ (2,2); \ 2,668 \ (1,6); \ 2,542 \ (87,5); \ 2,525 \ (6,4); \ 2,512 \ (151,6); \ 2,507 \ (295,7); \ 2,503 \ (376,8); \ 2,498 \ (265,0); \ 2,494 \ (123,3); \ 2,437 \ (0,4); \ 2,368 \ (0,3); \ 2,334 \ (1,7); \ 2,330 \ (2,2); \ 2,325 \ (1,6); \ 2,293 \ (0,6); \ 1,259 \ (0,4); \ 1,235 \ (2,0); \ 0,008 \ (2,7); \ 0,000 \ (64,8); \ -0,008 \ (2,0)$

Ejemplo 12: RMN 1H(400,0 MHz, DMSO):

 $\bar{\delta}$ = 9,059 (12,7); 9,054 (12,7); 9,027 (3,2); 9,012 (6,4); 8,996 (3,1); 8,937 (11,6); 8,930 (11,2); 8,737 (0,3); 8,732 (0,3); 8,595 (13,1); 8,591 (12,6); 8,391 (6,9); 8,384 (6,6); 8,370 (7,3); 8,363 (7,2); 8,317 (0,8); 7,785 (6,2); 7,765 (8,7); 7,753 (3,1); 7,731 (16,0); 7,710 (12,3); 7,672 (5,2); 7,653 (6,4); 7,634 (2,4); 7,485 (7,5); 7,466 (6,5); 4,356 (2,8); 4,340 (2,8); 4,319 (6,4); 4,303 (6,0); 4,282 (3,3); 4,266 (3,1); 4,235 (0,3); 3,482 (0,3); 3,448 (0,5); 3,346 (398,2); 3,279 (1,0); 3,224 (0,4); 2,996 (1,1); 2,712 (0,4); 2,676 (1,7); 2,672 (2,2); 2,667 (1,6); 2,565 (0,5); 2,542 (91,2); 2,507 (294,0); 2,503 (376,0); 2,498 (269,3); 2,434 (0,4); 2,418 (0,4); 2,368 (0,5); 2,329 (2,3); 2,325 (1,8); 2,292 (0,7); 1,298 (0,3); 1,258 (0,4); 1,235 (2,1); 0,008 (2,0); 0,000 (42,2); -0,008 (1,5)

Ejemplo 13: RMN ¹H(400,0 MHz, DMSO):

 $\begin{array}{l} \overline{o} = 9,037\ (0,8);\ 9,021\ (1,7);\ 9,006\ (0,8);\ 8,715\ (3,4);\ 8,710\ (3,3);\ 8,577\ (1,8);\ 8,568\ (1,7);\ 8,564\ (1,6);\ 8,317\ (0,5);\\ 8,289\ (3,5);\ 8,284\ (3,3);\ 7,786\ (2,2);\ 7,767\ (2,7);\ 7,751\ (0,8);\ 7,733\ (1,9);\ 7,714\ (1,4);\ 7,673\ (1,4);\ 7,655\ (1,7);\\ 7,636\ (0,7);\ 7,487\ (2,0);\ 7,469\ (1,8);\ 7,427\ (1,0);\ 7,414\ (1,2);\ 7,408\ (1,1);\ 7,395\ (0,9);\ 4,377\ (0,8);\ 4,361\ (0,8);\\ 4,340\ (1,7);\ 4,324\ (1,6);\ 4,303\ (0,9);\ 4,287\ (0,8);\ 3,492\ (0,4);\ 3,345\ (169,4);\ 2,995\ (0,7);\ 2,712\ (0,4);\ 2,676\ (1,1);\\ 2,672\ (1,4);\ 2,667\ (1,0);\ 2,542\ (91,8);\ 2,507\ (182,7);\ 2,503\ (233,5);\ 2,498\ (169,2);\ 2,464\ (16,0);\ 2,368\ (0,5);\ 2,334\ (1,1);\ 2,329\ (1,5);\ 2,325\ (1,1);\ 1,235\ (1,4);\ 0,000\ (21,0) \end{array}$

Ejemplo 14: RMN ¹H(400,0 MHz, DMSO):

 $\begin{array}{l} \overline{o} = 9,050\ (3,7);\ 9,035\ (7,3);\ 9,019\ (3,7);\ 8,992\ (0,6);\ 8,977\ (1,1);\ 8,963\ (0,6);\ 8,794\ (15.7);\ 8,790\ (16,0);\ 8,737\ (2,0);\ 8,732\ (2,0);\ 8,554\ (9,2);\ 8,549\ (9,8);\ 8,542\ (9,6);\ 8,537\ (9,4);\ 8,492\ (0,3);\ 8,468\ (1,9);\ 8,463\ (1,9);\ 8,380\ (15.8);\ 8,376\ (15.3);\ 8,316\ (1,5);\ 8,243\ (0,3);\ 8,062\ (8,7);\ 8,058\ (8,9);\ 8,043\ (9,8);\ 8,039\ (9,1);\ 7,973\ (0,3);\ 7,842\ (0,4);\ 7,824\ (0,4);\ 7,787\ (7,9);\ 7,767\ (10,6);\ 7,748\ (3,9);\ 7,730\ (9,6);\ 7,711\ (7,0);\ 7,674\ (6,8);\ 7,654\ (8,3);\ 7,636\ (11,8);\ 7,624\ (9,0);\ 7,618\ (8,6);\ 7,605\ (8,2);\ 7,583\ (0,3);\ 7,569\ (0,4);\ 7,525\ (0,4);\ 7,522\ (0,4);\ 7,478\ (9,2);\ 7,459\ (8,1);\ 7,430\ (1,2);\ 7,074\ (0,5);\ 6,947\ (0,4);\ 4,400\ (0,4);\ 4,382\ (3,4);\ 4,366\ (3,6);\ 4,343\ (8,0);\ 4,328\ (7,6);\ 4,306\ (4,0);\ 4,289\ (3,9);\ 4,271\ (0,8);\ 4,250\ (1,2);\ 4,234\ (1,2);\ 4,213\ (0,7);\ 4,198\ (0,8);\ 3,822\ (0,4);\ 3,810\ (0,3);\ 3,711\ (0,4);\ 3,684\ (0,4);\ 3,653\ (0,4);\ 3,620\ (0,4);\ 3,611\ (0,4);\ 3,595\ (0,5);\ 3,569\ (0,5);\ 3,494\ (0,8);\ 3,473\ (1,3);\ 3,344\ (1078,2);\ 3,203\ (0,5);\ 3,187\ (0,4);\ 3,167\ (0,4);\ 3,105\ (0,4);\ 2,996\ (1,5);\ 2,712\ (1,8);\ 2,676\ (3,5);\ 2,672\ (4,8);\ 2,667\ (3,6);\ 2,368\ (1,7);\ 2,348\ (0,4);\ 2,329\ (4,6);\ 2,303\ (0,4);\ 2,292\ (1,0);\ 2,279\ (0,4);\ 2,075\ (0,4);\ 1,589\ (0,4);\ 1,298\ (0,6);\ 1,258\ (0,9);\ 1,235\ (4,3);\ 0,853\ (0,5);\ 0,008\ (2,4);\ 0,000\ (57,9) \end{array}$

Ejemplo 15: RMN ¹H(400,0 MHz, DMSO):

Ejemplo 16: RMN ¹H(400,0 MHz, DMSO):

 $\begin{array}{l} \overline{\delta} = 9,175\ (0,6);\ 9,170\ (0,6);\ 9,046\ (15.5);\ 9,041\ (15.7);\ 9,029\ (3,6);\ 9,013\ (7,1);\ 8,998\ (3,5);\ 8,980\ (0,5);\ 8,910\ (0,4);\ 8,802\ (0,6);\ 8,796\ (0,6);\ 8,773\ (10,5);\ 8,766\ (10,6);\ 8,737\ (0,8);\ 8,732\ (0,8);\ 8,574\ (16,0);\ 8,569\ (15.5);\ 8,534\ (4,0);\ 8,528\ (3,8);\ 8,513\ (5,8);\ 8,508\ (5,5);\ 8,507\ (5,4);\ 8,494\ (4,1);\ 8,487\ (4,0);\ 8,468\ (0,8);\ 8,463\ (0,7);\ 8,338\ (0,5);\ 8,316\ (0,9);\ 8,307\ (0,8);\ 8,302\ (0,8);\ 7,786\ (6,9);\ 7,766\ (9,6);\ 7,755\ (3,7);\ 7,736\ (8,1);\ 7,717\ (5,9);\ 7,697\ (0,4);\ 7,673\ (5,7);\ 7,654\ (7,3);\ 7,635\ (2,8);\ 7,487\ (8,2);\ 7,469\ (7,3);\ 7,449\ (0,6);\ 7,440\ (0,5);\ 7,432\ (0,5);\ 7,414\ (6,7);\ 7,408\ (6,9);\ 7,393\ (6,6);\ 7,386\ (6,6);\ 7,361\ (0,4);\ 7,355\ (0,4);\ 7,340\ (0,4);\ 7,334\ (0,3);\ 4,359\ (3,1);\ 4,343\ (3,1);\ 4,322\ (7,3);\ 4,306\ (7,0);\ 4,284\ (4,0);\ 4,268\ (3,7);\ 4,251\ (0,6);\ 4,236\ (0,5);\ 3,461\ (0,3);\ 3,438\ (0,5);\ 3,347\ (514,5);\ 2,997\ (1,2);\ 2,713\ (1,0);\ 2,682\ (0,7);\ 2,677\ (1,3);\ 2,672\ (1,7);\ 2,668\ (1,2);\ 2,575\ (0,3);\ 2,567\ (0,3);\ 2,543\ (310,0);\ 2,526\ (4,3);\ 2,512\ (116,7);\ 2,508\ (235,4);\ 2,503\ (304,9);\ 2,499\ (214,6);\ 2,494\ (99,4);\ 2,369\ (1,1);\ 2,339\ (0,8);\ 2,334\ (1,4);\ 2,330\ (1,9);\ 2,325\ (1,4);\ 2,321\ (0,7);\ 2,295\ (0,5);\ 1,258\ (0,4);\ 1,234\ (1,7);\ 0,008\ (0,8);\ 0,000\ (21,2);\ -0,009\ (0,6) \end{array}$

Ejemplo 17: RMN ¹H(400,0 MHz, DMSO):

 \bar{o} = 9,012 (0,7); 8,996 (1,4); 8,985 (2,9); 8,981 (3,1); 8,680 (2,2); 8,673 (2,2); 8,467 (2,6); 8,462 (2,4); 8,211 (1,4); 8,204 (1,3); 8,189 (1,4); 8,183 (1,3); 7,784 (1,2); 7,764 (1,7); 7,753 (0,6); 7,734 (1,4); 7,716 (1,0); 7,671 (1,0); 7,652 (1,3); 7,633 (0,5); 7,486 (1,5); 7,467 (1,3); 6,913 (2,2); 6,892 (2,2); 5,353 (0,4); 5,337 (1,1); 5,322 (1,5); 5,306 (1,1); 5,291 (0,4); 4,349 (0,6); 4,334 (0,6); 4,312 (1,2); 4,296 (1,2); 4,275 (0,6); 4,259 (0,6); 3,344 (125,5); 2,677 (0,4); 2,672 (0,5); 2,668 (0,4); 2,543 (48,1); 2,508 (71,1); 2,503 (88,8); 2,499 (63,0); 2,335 (0,4); 2,330 (0,5); 2,326 (0,4); 1,335 (16,0); 1,319 (15.9); 1,302 (0,3); 1,235 (0,5); 0,008 (0,5); 0,000 (10,5); -0,008 (0,4)

Ejemplo 18: RMN 1H(400,0 MHz, DMSO):

 $\begin{array}{l} \overline{\delta} = 9,330 \ (0,4); \ 9,159 \ (2,0); \ 9,155 \ (1,9); \ 9,127 \ (0,5); \ 9,050 \ (3,0); \ 9,035 \ (6,2); \ 9,020 \ (3,3); \ 8,797 \ (12,7); \ 8,793 \ (12,5); \ 8,729 \ (0,3); \ 8,715 \ (2,0); \ 8,711 \ (1,9); \ 8,384 \ (13,3); \ 8,380 \ (12,5); \ 8,316 \ (2,0); \ 8,190 \ (1,3); \ 8,130 \ (13,6); \ 8,110 \ (15,6); \ 7,820 \ (0,9); \ 7,797 \ (16,0); \ 7,787 \ (7,3); \ 7,777 \ (15,2); \ 7,767 \ (9,5); \ 7,748 \ (2,7); \ 7,730 \ (7,1); \ 7,711 \ (5,0); \ 7,674 \ (5,6); \ 7,655 \ (6,9); \ 7,636 \ (2,6); \ 7,544 \ (0,4); \ 7,539 \ (0,4); \ 7,528 \ (0,5); \ 7,519 \ (0,8); \ 7,507 \ (0,6); \ 7,485 \ (2,1); \ 7,474 \ (7,8); \ 7,456 \ (7,0); \ 7,440 \ (1,0); \ 7,433 \ (1,1); \ 7,422 \ (0,4); \ 7,417 \ (0,5); \ 7,381 \ (1,1); \ 7,358 \ (0,8); \ 7,345 \ (0,8); \ 7,320 \ (0,4); \ 7,204 \ (0,4); \ 7,162 \ (0,7); \ 7,142 \ (1,0); \ 7,122 \ (0,6); \ 7,077 \ (0,4); \ 6,948 \ (0,5); \ 4,376 \ (2,6); \ 4,361 \ (2,9); \ 4,339 \ (6,1); \ 4,323 \ (6,2); \ 4,302 \ (3,3); \ 4,285 \ (3,0); \ 4,134 \ (0,4); \ 4,097 \ (0,5); \ 4,083 \ (0,7); \ 4,064 \ (0,6); \ 4,055 \ (0,6); \ 4,039 \ (0,5); \ 4,029 \ (0,4); \ 4,013 \ (0,4); \ 3,613 \ (0,3); \ 3,541 \ (0,3); \ 3,502 \ (0,5); \ 3,480 \ (0,8); \ 3,468 \ (0,6); \ 3,348 \ (1157,7); \ 3,264 \ (1,5); \ 3,237 \ (1,3); \ 3,207 \ (0,7); \ 3,168 \ (0,5); \ 3,139 \ (0,4); \ 3,125 \ (0,4); \ 2,996 \ (2,3); \ 2,713 \ (1,4); \ 2,676 \ (2,8); \ 2,672 \ (3,6); \ 2,395 \ (0,6); \ 2,369 \ (1,7); \ 2,334 \ (3,0); \ 2,329 \ (3,8); \ 2,325 \ (2,8); \ 2,294 \ (1,1); \ 2,270 \ (0,4); \ 2,075 \ (0,4); \ 1,298 \ (0,6); \ 1,259 \ (1,0); \ 1,235 \ (4,1); \ 0,854 \ (0,6); \ 0,008 \ (1,7); \ 0,000 \ (47,5); \ -0,008 \ (1,7); \ 0,000 \ (47,5); \ -0,008 \ (1,7); \ 0,000 \ (47,5); \ -0,008 \ (1,7); \ 0,000 \ (47,5); \ -0,008 \ (1,7); \ 0,000 \ (47,5); \ -0,008 \ (1,7); \ 0,000 \ (47,5); \ -0,008 \ (1,7); \ 0,000 \ (47,5); \ -0,008 \ (1,7); \ 0,000 \ (47,5); \ -0,008 \ (1,7); \ 0,000 \ (47,5); \ -0,008 \ (1,7); \ 0,000 \ (47,5); \ -0,008 \ (1,7); \ 0,000 \ (47,5); \ -0,008 \ (1,7); \ 0,000 \ (47,5); \ -0,008 \$

Ejemplo 19: RMN 1H(400,0 MHz, DMSO):

 $\begin{array}{l} \overline{o} = 9,080\ (12,1);\ 9,075\ (12,4);\ 9,055\ (15.8);\ 9,050\ (16,0);\ 9,028\ (3,6);\ 9,012\ (7,5);\ 8,997\ (3,6);\ 8,704\ (8,3);\ 8,701\ (8,7);\ 8,692\ (8,8);\ 8,689\ (8,7);\ 8,572\ (16,0);\ 8,567\ (15.5);\ 8,315\ (4,9);\ 8,311\ (6,6);\ 8,305\ (4,8);\ 8,295\ (5,1);\ 8,290\ (6,8);\ 8,285\ (4,8);\ 7,784\ (7,7);\ 7,765\ (10,6);\ 7,755\ (3,8);\ 7,736\ (8,7);\ 7,717\ (6,1);\ 7,672\ (6,1);\ 7,653\ (7,9);\ 7,634\ (3,0);\ 7,600\ (6,4);\ 7,588\ (6,4);\ 7,580\ (6,4);\ 7,568\ (6,0);\ 7,490\ (9,1);\ 7,471\ (8,0);\ 4,364\ (3,5);\ 4,348\ (3,5);\ 4,326\ (8,0);\ 4,311\ (7,7);\ 4,289\ (4,0);\ 4,273\ (3,7);\ 3,363\ (43,0);\ 2,996\ (0,8);\ 2,676\ (1,4);\ 2,672\ (2,0);\ 2,667\ (1,5);\ 2,542\ (42,8);\ 2,525\ (5,5);\ 2,511\ (128,3);\ 2,507\ (256,3);\ 2,503\ (332,5);\ 2,498\ (239,4);\ 2,469\ (0,8);\ 2,464\ (0,9);\ 2,444\ (0,4);\ 2,334\ (1,6);\ 2,329\ (2,1);\ 2,325\ (1,5);\ 2,292\ (0,6);\ 1,259\ (0,4);\ 1,235\ (1,7);\ 0,146\ (0,6);\ 0,008\ (4,5);\ 0,000\ (119,3);\ -0,009\ (4,7);\ -0,150\ (0,5) \end{array}$

Eiemplo 20: RMN ¹H(400.0 MHz, DMSO):

ō = 9,022 (13,0); 9,017 (14,1); 9,003 (5,9); 8,988 (2,7); 8,740 (9,9); 8,734 (9,8); 8,525 (11,8); 8,520 (11,6); 8,349 (6,3); 8,343 (6,0); 8,328 (6,6); 8,321 (6,5); 7,784 (5,5); 7,765 (7,6); 7,753 (2,5); 7,735 (6,2); 7,716 (4,4); 7,671 (4,4); 7,652 (5,6); 7,633 (2,1); 7,487 (6,6); 7,468 (5,7); 7,187 (9,9); 7,165 (9,6); 5,117 (4,7); 5,095 (15.3); 5,072 (16,0); 5,049 (5,5); 4,354 (2,4); 4,339 (2,4); 4,317 (5,5); 4,301 (5,2); 4,280 (2,7); 4,264 (2,6); 3,348 (120,7); 2,996 (0,5); 2,712 (0,6); 2,676 (1,2); 2,672 (1,6); 2,667 (1,2); 2,542 (181,5); 2,525 (4,7); 2,511 (108,5); 2,507 (214,1); 2,503 (276,4); 2,498 (197,6); 2,494 (94,7); 2,368 (0,7); 2,334 (1,3); 2,329 (1,7); 2,325 (1,2); 2,292 (0,4); 1,259 (0,4); 1,235 (1,5); 0,146 (0,4); 0,008 (3,5); 0,000 (88,9); -0,009 (3,0); -0,150 (0,3)

Ejemplo 21: RMN ¹H(400,0 MHz, DMSO):

 $\begin{array}{l} \overline{o} = 9,052\ (2,3);\ 9,037\ (4,8);\ 9,021\ (2,4);\ 8,813\ (10,2);\ 8,808\ (10,4);\ 8,717\ (15.0);\ 8,663\ (8,4);\ 8,650\ (8,6);\ 8,410\ (10,5);\ 8,406\ (10,3);\ 8,317\ (1,0);\ 7,781\ (11,1);\ 7,768\ (16,0);\ 7,749\ (2,2);\ 7,732\ (5,5);\ 7,713\ (4,0);\ 7,674\ (3,9);\ 7,654\ (4,9);\ 7,636\ (1,8);\ 7,482\ (5,8);\ 7,463\ (5,1);\ 4,385\ (2,1);\ 4,369\ (2,1);\ 4,347\ (4,9);\ 4,331\ (4,8);\ 4,309\ (2,5);\ 4,294\ (2,3);\ 3,489\ (0,4);\ 3,338\ (261,5);\ 3,158\ (0,5);\ 2,712\ (0,4);\ 2,676\ (2,0);\ 2,671\ (2,7);\ 2,667\ (2,0);\ 2,606\ (0,8);\ 2,590\ (0,4);\ 2,542\ (73,9);\ 2,525\ (7,5);\ 2,511\ (173,2);\ 2,507\ (346,8);\ 2,503\ (451,7);\ 2,498\ (324,5);\ 2,494\ (155,9);\ 2,462\ (0,9);\ 2,451\ (0,6);\ 2,334\ (2,0);\ 2,329\ (2,7);\ 2,325\ (2,0);\ 2,291\ (0,6);\ 1,297\ (0,3);\ 1,258\ (0,5);\ 1,235\ (2,2);\ 0,145\ (0,4);\ 0,008\ (3,2);\ 0,000\ (88,9);\ -0,009\ (3,0);\ -0,150\ (0,4) \end{array}$

Ejemplo 22: RMN ¹H(400,0 MHz, DMSO):

 $\begin{array}{l} \overline{o} = 9,106\ (11,4);\ 9,101\ (11,3);\ 9,030\ (2,6);\ 9,015\ (5,3);\ 8,999\ (2,5);\ 8,754\ (15.2);\ 8,750\ (9,8);\ 8,742\ (10,3);\ 8,738\ (16,0);\ 8,615\ (11,7);\ 8,610\ (11,2);\ 8,317\ (0,7);\ 7,931\ (15.6);\ 7,927\ (10,0);\ 7,920\ (9,9);\ 7,916\ (15.0);\ 7,782\ (5,3);\ 7,762\ (7,4);\ 7,754\ (2,6);\ 7,734\ (6,2);\ 7,716\ (4,4);\ 7,670\ (4,3);\ 7,651\ (5,5);\ 7,632\ (2,1);\ 7,483\ (6,3);\ 7,465\ (5,7);\ 4,361\ (2,4);\ 4,346\ (2,5);\ 4,324\ (5,6);\ 4,309\ (5,4);\ 4,287\ (2,8);\ 4,271\ (2,6);\ 3,475\ (0,4);\ 3,348\ (116,6);\ 2,996\ (1,7);\ 2,712\ (0,7);\ 2,676\ (1,2);\ 2,667\ (1,2);\ 2,542\ (220,2);\ 2,525\ (4,5);\ 2,512\ (110,6);\ 2,507\ (220,2);\ 2,503\ (284,7);\ 2,498\ (202,9);\ 2,494\ (95,6);\ 2,445\ (0,4);\ 2,433\ (0,4);\ 2,369\ (0,9);\ 2,334\ (1,4);\ 2,329\ (1,8);\ 2,325\ (1,3);\ 2,292\ (0,4);\ 1,259\ (0,4);\ 1,235\ (1,7);\ 0,008\ (2,0);\ 0,000\ (51,0);\ -0,009\ (1,7) \end{array}$

Ejemplo 23: RMN ¹H(400,0 MHz, DMSO):

 $\begin{array}{l} \overline{\delta} = 9,312\ (0,8);\ 9,152\ (15.1);\ 9,148\ (15.4);\ 9,038\ (3,6);\ 9,023\ (7,4);\ 9,007\ (3,5);\ 8,977\ (0,5);\ 8,935\ (0,6);\ 8,738\ (1,0);\ 8,733\ (1,0);\ 8,679\ (15.8);\ 8,674\ (15.5);\ 8,469\ (1,0);\ 8,464\ (1,0);\ 8,423\ (12,7);\ 8,410\ (13,5);\ 8,373\ (0,8);\ 8,360\ (0,8);\ 8,317\ (0,8);\ 7,958\ (0,6);\ 7,946\ (0,6);\ 7,922\ (8,2);\ 7,918\ (5,4);\ 7,913\ (5,1);\ 7,909\ (7,8);\ 7,835\ (1,1);\ 7,805\ (16,0);\ 7,783\ (7,5);\ 7,764\ (10,4);\ 7,754\ (4,3);\ 7,735\ (8,5);\ 7,717\ (6,4);\ 7,700\ (0,6);\ 7,672\ (6,2);\ 7,653\ (7,8);\ 7,634\ (3,0);\ 7,504\ (0,5);\ 7,482\ (8,7);\ 7,463\ (7,9);\ 7,449\ (1,2);\ 7,430\ (0,6);\ 7,360\ (0,9);\ 4,359\ (3,3);\ 4,344\ (3,4);\ 4,322\ (7,7);\ 4,306\ (7,4);\ 4,285\ (4,3);\ 4,270\ (3,9);\ 4,250\ (0,9);\ 4,236\ (0,7);\ 4,215\ (0,3);\ 4,197\ (0,4);\ 3,460\ (0,4);\ 3,455\ (0,4);\ 3,441\ (0,6);\ 3,347\ (477,2);\ 3,249\ (0,4);\ 3,243\ (0,5);\ 2,996\ (1,2);\ 2,712\ (1,2);\ 2,677\ (1,7);\ 2,672\ (2,4);\ 2,667\ (1,7);\ 2,571\ (0,7);\ 2,565\ (0,8);\ 2,542\ (310,6);\ 2,525\ (6,8);\ 2,512\ (150,2);\ 2,507\ (301,9);\ 2,503\ (394,3);\ 2,498\ (282,4);\ 2,494\ (135,5);\ 2,468\ (0,9);\ 2,457\ (0,6);\ 2,424\ (0,4);\ 2,368\ (1,4);\ 2,334\ (1,8);\ 2,330\ (2,3);\ 2,325\ (1,8);\ 2,293\ (0,6);\ 1,298\ (0,4);\ 1,259\ (0,6);\ 1,234\ (2,3);\ 0,008\ (1,9);\ 0,000\ (49,2);\ -0,008\ (1,7) \end{array}$

Ejemplo 24: RMN ¹H(400,0 MHz, DMSO):

 $\begin{array}{l} 5 = 10,952\ (1,2);\ 9,137\ (14,9);\ 9,133\ (14,2);\ 9,035\ (3,9);\ 9,021\ (7,6);\ 9,006\ (3,6);\ 8,978\ (1,0);\ 8,682\ (15.9);\ 8,677\ (14,8);\ 8,583\ (12,6);\ 8,570\ (13,2);\ 8,317\ (6,5);\ 8,119\ (15.7);\ 8,116\ (15.0);\ 7,968\ (10,6);\ 7,964\ (8,9);\ 7,954\ (9,7);\ 7,950\ (9,0);\ 7,784\ (7,4);\ 7,763\ (10,2);\ 7,752\ (3,5);\ 7,735\ (8,1);\ 7,716\ (6,3);\ 7,672\ (5,9);\ 7,653\ (7,7);\ 7,632\ (2,9);\ 7,494\ (1,2);\ 7,481\ (8,7);\ 7,463\ (7,6);\ 7,431\ (1,1);\ 7,201\ (1,4);\ 7,074\ (1,3);\ 6,946\ (1,4);\ 6,027\ (1,0);\ 5,587\ (1,0);\ 4,818\ (1,1);\ 4,356\ (3,6);\ 4,341\ (3,5);\ 4,318\ (7,3);\ 4,303\ (6,7);\ 4,279\ (4,3);\ 4,265\ (3,9);\ 4,233\ (1,2);\ 4,213\ (1,2);\ 4,019\ (1,1);\ 4,012\ (1,0);\ 3,831\ (1,2);\ 3,796\ (1,1);\ 3,758\ (1,0);\ 3,739\ (1,1);\ 3,721\ (1,3);\ 3,719\ (1,1);\ 3,710\ (1,2);\ 3,661\ (1,4);\ 3,639\ (1,3);\ 3,629\ (1,3);\ 3,600\ (1,4);\ 3,584\ (1,7);\ 3,576\ (1,7);\ 3,526\ (2,1);\ 3,501\ (2,6);\ 3,459\ (3,0);\ 3,346\ (2916,1);\ 3,268\ (3,1);\ 3,250\ (2,3);\ 3,243\ (2,8);\ 3,209\ (1,7);\ 3,076\ (1,1);\ 3,043\ (1,0);\ 2,995\ (2,0);\ 2,872\ (1,0);\ 2,711\ (3,1);\ 2,696\ (1,0);\ 2,676\ (11,7);\ 2,671\ (16,0);\ 2,667\ (11,6);\ 2,588\ (2,5);\ 2,571\ (4,1);\ 2,542\ (935,2);\ 2,525\ (45,6);\ 2,511\ (1037,1);\ 2,507\ (2048,7);\ 2,502\ (2630,7);\ 2,498\ (1866,0);\ 2,493\ (879,5);\ 2,396\ (1,8);\ 2,368\ (3,9);\ 2,334\ (11,3);\ 2,329\ (15.5);\ 2,325\ (11,6);\ 2,320\ (5,9);\ 2,292\ (3,5);\ 2,204\ (1,1);\ 1,298\ (2,2);\ 1,259\ (3,6);\ 1,235\ (13,3);\ 0,854\ (1,6);\ 0,145\ (1,0);\ 0,008\ (9,6);\ 0,000\ (279,5);\ -0,009\ (10,0);\ -0,017\ (1,5);\ -0,149\ (1,3);\ -3,117\ (1,1);\ -3,268\ (1,0) \end{array}$

Ejemplo 25: RMN 1H(400,0 MHz, DMSO):

 \bar{o} = 9,171 (3,4); 9,166 (3,4); 9,045 (0,8); 9,029 (1,7); 9,014 (0,8); 8,734 (3,5); 8,730 (3,4); 8,191 (16,0); 7,786 (1,8); 7,767 (2,4); 7,754 (0,8); 7,736 (2,0); 7,717 (1,4); 7,674 (1,4); 7,655 (1,8); 7,636 (0,7); 7,479 (2,0); 7,460 (1,8); 4,352 (0,8); 4,337 (0,8); 4,314 (1,8); 4,299 (1,6); 4,277 (0,9); 4,261 (0,8); 3,347 (188,4); 2,996 (0,6); 2,712 (0,4); 2,677 (0,6); 2,672 (0,8); 2,667 (0,6); 2,542 (100,9); 2,525 (2,2); 2,512 (51,3); 2,507 (101,9); 2,503 (131,5); 2,498 (93,5); 2,494 (44,2); 2,368 (0,4); 2,334 (0,6); 2,329 (0,8); 2,325 (0,6); 1,235 (0,7); 0,008 (0,5); 0,000 (12,9); -0,009 (0,4)

Eiemplo 28: RMN 1H(400.0 MHz, DMSO):

 $\begin{array}{l} \overline{0} = 9,522 \ (0,5); \ 9,471 \ (0,6); \ 9,453 \ (0,8); \ 9,439 \ (11,7); \ 9,328 \ (0,4); \ 9,214 \ (11,7); \ 9,208 \ (11,7); \ 9,156 \ (0,5); \ 9,094 \ (0,4); \ 9,028 \ (2,6); \ 9,012 \ (5,4); \ 8,997 \ (2,6); \ 8,970 \ (0,3); \ 8,953 \ (0,4); \ 8,847 \ (0,6); \ 8,785 \ (0,3); \ 8,715 \ (0,6); \ 8,710 \ (0,7); \ 8,689 \ (11,1); \ 8,684 \ (10,9); \ 8,429 \ (0,8); \ 8,399 \ (16,0); \ 8,316 \ (2,0); \ 8,173 \ (0,3); \ 8,109 \ (0,3); \ 7,992 \ (0,7); \ 7,960 \ (0,4); \ 7,938 \ (0,5); \ 7,879 \ (0,8); \ 7,856 \ (0,4); \ 7,841 \ (0,4); \ 7,817 \ (0,5); \ 7,801 \ (0,5); \ 7,780 \ (5,4); \ 7,759 \ (7,6); \ 7,732 \ (6,2); \ 7,714 \ (4,4); \ 7,670 \ (4,4); \ 7,650 \ (5,5); \ 7,631 \ (2,1); \ 7,523 \ (0,4); \ 7,517 \ (0,4); \ 7,500 \ (0,5); \ 7,473 \ (6,4); \ 7,454 \ (5,6); \ 5,757 \ (1,3); \ 4,338 \ (2,5); \ 4,322 \ (2,7); \ 4,301 \ (5,7); \ 4,286 \ (5,4); \ 4,264 \ (3,0); \ 4,249 \ (2,7); \ 4,033 \ (0,4); \ 4,009 \ (0,3); \ 3,551 \ (0,4); \ 3,483 \ (0,5); \ 3,463 \ (0,7); \ 3,447 \ (0,6); \ 3,438 \ (0,5); \ 3,424 \ (1,0); \ 3,406 \ (1,1); \ 3,390 \ (2,1); \ 3,339 \ (1821,8); \ 3,306 \ (2,8); \ 3,300 \ (2,3); \ 3,283 \ (0,7); \ 3,275 \ (0,8); \ 3,264 \ (1,0); \ 3,250 \ (1,0); \ 3,169 \ (0,3); \ 2,891 \ (0,9); \ 2,731 \ (0,8); \ 2,677 \ (2,5); \ 2,672 \ (3,5); \ 2,668 \ (2,5); \ 2,592 \ (0,3); \ 2,525 \ (9,1); \ 2,512 \ (212,0); \ 2,507 \ (427,4); \ 2,503 \ (558,1); \ 2,498 \ (396,7); \ 2,494 \ (186,4); \ 2,469 \ (1,1); \ 2,429 \ (0,4); \ 2,334 \ (2,6); \ 2,330 \ (3,4); \ 2,325 \ (2,5); \ 1,386 \ (1,9); \ 1,235 \ (0,6); \ 1,175 \ (0,7); \ 1,166 \ (1,2); \ 1,150 \ (0,6); \ 0,146 \ (2,0); \ 0,021 \ (0,7); \ 0,018 \ (1,0); \ 0,008 \ (20,0); \ 0,000 \ (511,9); \ -0,009 \ (17,4); \ -0,025 \ (0,5); \ -0,034 \ (0,4); \ -0,040 \ (0,4); \ -0,150 \ (2,0) \ (17,4); \ -0,025 \ (0,5); \ -0,034 \ (0,4); \ -0,040 \ (0,4); \ -0,150 \ (2,0) \ (17,4); \ -0,025 \ (0,5); \ -0,034 \ (0,4); \ -0,040 \ (0,4); \ -0,0150 \ (2,0) \ (17,4); \ -0,025 \ (0,5); \ -0,034 \ (0,4); \ -0,040 \ (0,4); \ -0,0150 \ (0,2); \ -0,0150 \ (0,2); \ -0,01$

Ejemplo 29: RMN ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO):

 $\delta = 9,202 \ (3,9); \ 9,187 \ (8,0); \ 9,172 \ (3,8); \ 9,048 \ (15.2); \ 9,043 \ (15.4); \ 8,810 \ (8,3); \ 8,798 \ (8,3); \ 8,776 \ (11,4); \ 8,770 \ (11,6); \ 8,584 \ (16,0); \ 8,580 \ (15.5); \ 8,538 \ (3,8); \ 8,531 \ (3,7); \ 8,517 \ (6,3); \ 8,511 \ (6,0); \ 8,497 \ (4,0); \ 8,490 \ (3,8); \ 7,952 \ (7,1); \ 7,934 \ (8,9); \ 7,807 \ (7,2); \ 7,795 \ (7,2); \ 7,788 \ (6,0); \ 7,776 \ (5,6); \ 7,418 \ (6,8); \ 7,411 \ (6,9); \ 7,397 \ (6,8); \ 7,390 \ (6,6); \ 4,393 \ (3,5); \ 4,377 \ (3,5); \ 4,355 \ (7,9); \ 4,339 \ (7,5); \ 4,317 \ (4,0); \ 4,302 \ (3,7); \ 4,056 \ (0,4); \ 4,038 \ (1,2); \ 4,021 \ (1,2); \ 4,003 \ (0,4); \ 3,331 \ (78,7); \ 2,677 \ (0,6); \ 2,673 \ (0,9); \ 2,668 \ (0,7); \ 2,508 \ (100,2); \ 2,504 \ (128,0); \ 2,499 \ (96,0); \ 2,335 \ (0,6); \ 2,330 \ (0,8); \ 2,326 \ (0,6); \ 1,990 \ (5,1); \ 1,194 \ (1,4); \ 1,176 \ (2,7); \ 1,158 \ (1,4); \ 0,146 \ (0,9); \ 0,007 \ (9,0); \ 0,000 \ (176,8); \ -0,008 \ (9,2); \ -0,150 \ (0,9)$

Ejemplo 33: RMN ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO):

```
\overline{0} = 9,279 (3,2); 9,264 (6,8); 9,248 (3,3); 9,039 (13,4); 9,034 (16,0); 9,024 (12,6); 8,976 (12,5); 8,970 (10,3); 8,776
(9,4); 8,770 (9,7); 8,595 (14,1); 8,590 (13,8); 8,539 (3,3); 8,532 (3,2); 8,518 (5,3); 8,512 (5,1); 8,498 (3,5); 8,491
(3,3); 7,420 (5,9); 7,413 (6,0); 7,399 (5,9); 7,392 (5,8); 4,446 (3,0); 4,430 (3,0); 4,408 (6,9); 4,392 (6,5); 4,370
(3.5): 4.354 (3.2): 4.056 (0.7): 4.038 (2.1): 4.021 (2.1): 4.003 (0.7): 3.331 (96.5): 2.678 (0.7): 2.673 (0.9): 2.668
(0,6); 2,526 (2,4); 2,512 (51,5); 2,508 (100,5); 2,504 (129,9); 2,499 (95,7); 2,335 (0,6); 2,331 (0,9); 2,326 (0,6);
1,990 (8,9); 1,194 (2,3); 1,176 (4,6); 1,158 (2,3); 0,146 (0,8); 0,008 (7,5); 0,000 (171,7); -0,008 (7,4); -0,150 (0,8)
Ejemplo 31: RMN <sup>1</sup>H (400,0 MHz, CDCl<sub>3</sub>):
\bar{0} = 8,604 (5,7); 8,600 (6,0); 7,908 (6,2); 7,903 (6,4); 7,791 (2,7); 7,691 (3,4); 7,672 (3,9); 7,596 (1,1); 7,579 (3,1); 7,555 (6,3); 7,550 (3,7); 7,542 (7,9); 7,533 (6,4); 7,521 (11,7); 7,504 (3,3); 7,314 (1,1); 7,306 (1,1); 7,297 (1,3);
7,291 (1,9); 7,284 (1,4); 7,275 (2,0); 7,262 (69,8); 7,211 (4,8); 7,190 (8,7); 7,169 (4,2); 6,998 (0,4); 6,833 (1,9);
6,824 (1,9); 6,811 (1,7); 6,802 (1,7); 6,584 (1,2); 6,570 (2,0); 6,557 (1,1); 5,516 (1,2); 4,376 (0,9); 4,361 (0,9);
4,341 (1,7); 4,326 (2,5); 4,310 (0,9); 4,291 (1,8); 4,274 (2,9); 4,257 (1,7); 4,236 (2,4); 4,220 (2,3); 4,200 (0,8);
4,185 (0,8); 1,956 (15.9); 1,902 (16,0); 1,571 (97,8); 1,299 (0,6); 1,282 (0,7); 1,266 (1,5); 1,250 (2,0); 0,000 (63,6)
Ejemplo 32: RMN <sup>1</sup>H (400,0 MHz, CDCl<sub>3</sub>):
\overline{o} = 8,761 (0,4); 8,749 (0,4); 8,617 (0,7); 8,613 (0,7); 8,441 (0,5); 8,435 (0,6); 7,942 (0,8); 7,937 (0,8); 7,920 (0,4);
7,901 (0,4); 7,570 (0,4); 7,558 (0,4); 7,550 (0,4); 7,538 (0,3); 7,264 (5,1); 7,111 (0,4); 7,104 (0,4); 7,090 (0,3);
7,083 (0,3); 1,960 (2,0); 1,907 (2,0); 1,602 (16,0); 0,000 (4,7)
Ejemplo 33: RMN <sup>1</sup>H (400,0 MHz, CDCl<sub>3</sub>):
\overline{0} = 8,632 (7,5); 8,630 (7,7); 8,610 (6,5); 8,607 (6,8); 7,931 (7,6); 7,855 (3,4); 7,851 (3,5); 7,849 (3,5); 7,834 (4,0);
[7,831 (4,0); 7,828 (3,9); 7,692 (3,9); 7,673 (4,9); 7,602 (1,3); 7,585 (3,6); 7,566 (4,4); 7,548 (3,9); 7,528 (9,7);
7,509 (4,7); 7,490 (6,2); 7,470 (5,4); 7,263 (50,1); 6,497 (2,9); 5,302 (0,6); 4,387 (1,0); 4,372 (1,0); 4,352 (1,8);
4,337 (2,6); 4,321 (1,1); 4,301 (1,9); 4,285 (1,8); 4,269 (1,8); 4,253 (1,9); 4,231 (2,6); 4,216 (2,6); 4,196 (1,1);
4,180 (1,0); 2,047 (1,1); 1,957 (15.8); 1,903 (16,0); 1,575 (65,2); 1,426 (2,9); 1,278 (0,7); 1,256 (1,8); 0,000 (47,8)
Ejemplo 34: RMN <sup>1</sup>H (400,0 MHz, CDCl<sub>3</sub>):
\delta = 8,762 (3,3); 8,751 (3,4); 8,625 (6,0); 8,620 (6,2); 8,611 (5,5); 8,605 (5,4); 7,948 (6,5); 7,943 (6,4); 7,919 (3,2);
7,899 (3,6); 7,854 (3,3); 7,848 (3,4); 7,834 (3,7); 7,827 (3,7); 7,568 (3,0); 7,557 (3,0); 7,549 (2,8); 7,537 (2,7);
7,521 (0,7); 7,493 (5,9); 7,473 (5,4); 7,262 (90,5); 6,998 (0,5); 6,592 (1,2); 6,578 (2,0); 6,565 (1,2); 5,302 (1,2);
4,397 (1,0); 4,381 (1,0); 4,362 (1,6); 4,346 (2,1); 4,329 (0,9); 4,309 (1,7); 4,293 (1,6); 4,273 (1,6); 4,258 (1,6);
4,238 (2,6); 4,223 (2,5); 4,203 (1,0); 4,188 (0,9); 4,131 (0,7); 4,113 (0,7); 2,047 (2,9); 1,957 (16,0); 1,904 (16,0);
1,843 (0,4); 1,558 (131,4); 1,278 (0,8); 1,260 (1,7); 1,242 (0,8); 0,146 (0,4); 0,000 (82,5); -0,008 (3,9); -0,150 (0,4)
Ejemplo 36: RMN <sup>1</sup>H (601,6 MHz, CDCl<sub>3</sub>):
5 = 19,961 (0,7); 8,941 (6,3); 8,761 (3,5); 8,754 (3,9); 8,680 (7,5); 8,067 (3,6); 8,054 (3,9); 8,000 (7,9); 7,919
(3,1); 7,907 (3,3); 7,848 (5,2); 7,835 (4,6); 7,567 (2,6); 7,555 (3,2); 7,547 (2,4); 7,436 (0,8); 7,265 (146,9); 7,089
(0,9); 6,592 (1,0); 4,388 (0,8); 4,375 (1,1); 4,363 (1,7); 4,353 (1,1); 4,340 (1,1); 4,328 (1,2); 4,269 (1,8); 4,259
(1,7); 4,245 (3,1); 4,235 (2,9); 4,222 (1,3); 4,211 (1,3); 2,580 (0,7); 1,960 (12,0); 1,925 (12,0); 1,697 (6,2); 1,690 (6,4); 1,678 (6,6); 1,673 (6,6); 1,665 (6,6); 1,653 (8,3); 1,627 (10,4); 1,619 (12,2); 1,608 (16,0); 1,431 (1,1); 1,396
(0,7); 1,254 (2,1); 0,069 (23,0); 0,067 (31,4); 0,065 (28,1); 0,000 (54,1); -0,002 (40,1); -0,005 (22,0)
Ejemplo 37: RMN <sup>1</sup>H (400,0 MHz, CDCl<sub>3</sub>):
\delta = 8,753 (2,0); 8,743 (2,0); 8,617 (3,6); 8,613 (3,6); 7,939 (3,9); 7,935 (3,8); 7,904 (1,9); 7,886 (2,1); 7,555 (1,7);
7,543 (1,8); 7,536 (1,7); 7,524 (1,6); 7,472 (4,6); 7,452 (5,9); 7,311 (4,9); 7,291 (3,9); 7,262 (45,2); 6,697 (0,7);
[6,685 (1,2); 6,670 (0,7); 5,301 (0,9); 4,380 (0,5); 4,364 (0,5); 4,345 (1,0); 4,329 (1,2); 4,312 (0,5); 4,292 (1,1);
4,277 (1,1); 4,270 (1,1); 4,254 (1,0); 4,236 (1,5); 4,221 (1,5); 4,202 (0,5); 4,186 (0,5); 2,436 (0,5); 2,417 (16,0);
1,956 (9,6); 1,903 (9,6); 1,555 (47,1); 0,000 (42,8)
Ejemplo 38: RMN <sup>1</sup>H (400,0 MHz, CDCl<sub>3</sub>):
\delta = 8,756 (1,7); 8,747 (1,6); 8,744 (1,6); 8,714 (2,7); 8,709 (2,6); 8,627 (3,1); 8,622 (3,0); 7,948 (3,5); 7,943 (3,3);
7,912 (1,6); 7,895 (1,7); 7,893 (1,7); 7,780 (1,7); 7,774 (1,7); 7,760 (1,9); 7,754 (1,8); 7,562 (1,6); 7,551 (1,6);
7,543 (1,5); 7,531 (1,3); 7,307 (2,5); 7,287 (2,3); 7,264 (14,4); 6,658 (0,6); 6,644 (1,0); 6,630 (0,6); 5,302 (1,6);
4,389 (0,5); 4,374 (0,5); 4,354 (0,9); 4,338 (1,1); 4,321 (0,5); 4,302 (0,9); 4,286 (0,9); 4,274 (0,9); 4,258 (0,8);
4,240 (1,3); 4,224 (1,3); 4,205 (0,5); 4,189 (0,4); 2,654 (0,5); 2,635 (16,0); 2,618 (0,4); 2,474 (0,9); 1,958 (8,6);
1,905 (8,6); 1,608 (3,8); 0,007 (0,8); 0,000 (13,7); -0,008 (0,5)
```

Ejemplo 39: RMN ¹H (400,0 MHz, CDCl₃):

 $\begin{array}{l} \overline{0} = 8,666\ (5,3);\ 8,660\ (6,3);\ 8,654\ (5,6);\ 8,575\ (4,6);\ 8,568\ (4,7);\ 7,960\ (6,1);\ 7,955\ (6,0);\ 7,693\ (2,8);\ 7,674\ (3,5);\ 7,617\ (1,9);\ 7,611\ (2,5);\ 7,606\ (2,6);\ 7,595\ (2,1);\ 7,588\ (5,0);\ 7,584\ (3,0);\ 7,569\ (3,0);\ 7,548\ (2,5);\ 7,530\ (7,3);\ 7,522\ (0,9);\ 7,512\ (2,7);\ 7,262\ (55,7);\ 6,513\ (0,9);\ 6,499\ (1,6);\ 6,484\ (0,9);\ 5,301\ (11,3);\ 4,391\ (0,8);\ 4,376\ (0,9);\ 4,356\ (1,6);\ 4,340\ (2,3);\ 4,324\ (0,9);\ 4,305\ (1,6);\ 4,289\ (1,6);\ 4,278\ (1,6);\ 4,262\ (1,6);\ 4,240\ (2,0);\ 4,224\ (2,0);\ 4,204\ (0,9);\ 4,189\ (0,8);\ 4,131\ (0,3);\ 4,113\ (0,4);\ 2,047\ (1,6);\ 1,963\ (15.9);\ 1,909\ (16,0);\ 1,577\ (45,8);\ 1,278\ (0,5);\ 1,260\ (1,2);\ 1,254\ (1,0);\ 1,242\ (0,6);\ 0,008\ (1,6);\ 0,000\ (49,9);\ -0,009\ (1,8) \end{array}$

Ejemplo 40: RMN ¹H (400,0 MHz, CDCl₃):

 $\begin{array}{l} \overline{0} = 8,764\ (3,5);\ 8,755\ (3,6);\ 8,667\ (6,4);\ 8,652\ (6,2);\ 8,648\ (5,9);\ 8,581\ (5,7);\ 8,574\ (5,8);\ 8,491\ (0,8);\ 7,975\ (6,5);\\ 7,970\ (6,2);\ 7,953\ (0,7);\ 7,948\ (0,6);\ 7,925\ (3,1);\ 7,905\ (3,5);\ 7,877\ (0,4);\ 7,617\ (2,1);\ 7,612\ (2,9);\ 7,606\ (2,0);\\ 7,595\ (2,1);\ 7,590\ (2,9);\ 7,584\ (2,0);\ 7,571\ (3,0);\ 7,559\ (3,1);\ 7,552\ (3,0);\ 7,540\ (2,7);\ 7,521\ (1,6);\ 7,262\ (250,8);\\ 6,998\ (1,5);\ 6,575\ (2,0);\ 4,401\ (0,9);\ 4,385\ (0,9);\ 4,366\ (1,7);\ 4,350\ (2,1);\ 4,333\ (0,9);\ 4,313\ (1,7);\ 4,298\ (1,7);\\ 4,284\ (1,6);\ 4,268\ (1,7);\ 4,249\ (2,5);\ 4,233\ (2,7);\ 4,219\ (0,6);\ 4,214\ (0,9);\ 4,198\ (1,1);\ 4,184\ (0,3);\ 4,149\ (0,6);\\ 4,131\ (1,8);\ 4,113\ (1,8);\ 4,096\ (0,6);\ 2,047\ (7,4);\ 1,964\ (15.9);\ 1,911\ (16,0);\ 1,896\ (2,1);\ 1,843\ (1,8);\ 1,552\ (227,5);\ 1,427\ (0,4);\ 1,333\ (1,0);\ 1,284\ (1,4);\ 1,278\ (2,4);\ 1,260\ (4,8);\ 1,243\ (2,3);\ 0,880\ (0,4);\ 0,846\ (0,4);\ 0,146\ (1,2);\ 0,000\ (236,0);\ -0,150\ (1,2) \end{array}$

Ejemplos Biológicos

15

25

Prueba de Cooperia curticei (COOPCU)

Disolvente: dimetilsulfóxido

Para producir una preparación adecuada de compuesto activo, 10 mg de compuesto activo se disuelven en 0,5 ml de disolvente, y el concentrado se diluye con "solución de Ringer" a la concentración deseada.

Aproximadamente 40 larvas de nematodo (Cooperia curticei) se transfieren a un tubo de ensayo que contiene la solución del compuesto.

Después de 5 días se registra el porcentaje de mortalidad de las larvas. 100 % de eficacia significa que todas las larvas mueren; 0 % de eficacia significa que no hay larvas muertas.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una buena actividad de 100 % a una tasa de aplicación de 20 ppm: 1, 2, 3, 4, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 22, 23, 24, 25, 28

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una buena actividad de 90 % a una tasa de aplicación de 20 ppm: 13

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una buena actividad de 80 % a una tasa de aplicación de 20 ppm: 21

Prueba de Contortus Haemonchus (HAEMCO)

Disolvente: dimetilsulfóxido

Para producir una preparación adecuada de compuesto activo, 10 mg de compuesto activo se disuelven en 0,5 ml de disolvente, y el concentrado se diluye con "solución de Ringer" a la concentración deseada.

Aproximadamente 40 larvas del gusano de estómago rojo (*Haemonchus contortus*) se transfieren a un tubo de ensayo que contiene la solución del compuesto.

Después de 5 días se registra el porcentaje de mortalidad de las larvas. 100 % de eficacia significa que todas las larvas mueren, 0 % de eficacia significa que no hay larvas muertas.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una buena actividad de 100 % a una tasa de aplicación de 20 ppm: 2, 3, 4, 6, 10, 14, 15, 16, 19, 20, 23, 24, 25, 28

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una buena actividad de 90 % a una tasa de aplicación de 20 ppm: 5, 7, 9, 11, 12, 17, 22

30 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una buena actividad de 80 % a una tasa de aplicación de 20 ppm: 1, 18

Prueba de Meloidogyne incognita

Disolvente: 125,0 partes en peso de acetona

Para producir una preparación adecuada de compuesto activo, 1 parte en peso de compuesto activo se mezcla con la cantidad indicada de disolvente y se diluye el concentrado con agua hasta la concentración deseada.

Los vasos se llenan de arena, una solución del principio activo, una suspensión que contiene huevos y larvas del nematodo meridional de la raíz (*Meloidogyne incognita*) y las semillas de ensalada. Las semillas de ensalada germinan y las plántulas crecen. Las agallas se desarrollan en las raíces.

Después de 14 días la actividad nematicida se determina sobre la base del porcentaje de la formación de agallas. 100 % significa que no se encontraron agallas y 0 % significa que el número de agallas que se encontraron en las raíces de las plantas tratadas era igual a la de las plantas de control no tratadas.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una buena actividad de 100 % a una tasa de aplicación de 20 ppm: 2, 3, 4, 5, 6, 10, 14, 16, 18, 23, 24, 25, 28, 29

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una buena actividad de 90 % a una tasa de aplicación de 20 ppm: 7, 12, 13, 15, 20

15 Prueba de Nippostrongylus brasiliensis (NIPOBR) (Ensayo de eficacia in vitro)

Se lavaron Nippostrongylus brasiliensis adultas con un tampón de solución salina que contiene 100 U/ml de penicilina, 0,1 mg/ml de estreptomicina y 2,5 g/ml de anfotericina B. Los compuestos de ensayo se disolvieron en DMSO, y los gusanos se incubaron en un medio en una concentración final de 10 g/ml. Una alícuota del medio se usó para determinar la actividad de esterasa de acetilcolina en comparación con un control negativo. El principio de la medición de la acetilcolina esterasa como lectura para actividad antihelmíntica se describe en Rapson y col (1986) y Rapson y col (1987).

Para los ejemplos siguientes, la actividad (reducción de la AChE en comparación con el control negativo) fue del 60 % o superior a 10 mg/ml: 2; 3; 4; 10; 14; 15; 16; 19; 25; 28

Prueba de eficacia in vivo

10

20

25 Haemonchus contortus/Trichostrongylus colubriformis/jerbo

Los jerbos, infectados experimentalmente con Haemonchus y/o Trichostrongylus, fueron tratados una vez a finales de la prepatencia. Los compuestos de ensayo se formularon como soluciones o suspensiones y se aplicaron por vía intraperitoneal o por vía oral.

La eficacia se determinó por grupo como la reducción del recuento de gusanos en el estómago y el intestino delgado, respectivamente, después de la necropsia en comparación con el recuento de gusanos en un grupo de control infectado y tratado con placebo.

Se probaron los siguientes ejemplos y tuvieron una actividad del 85 % o superior en el tratamiento presentado:

Tratamiento	Haemonchus	Trichostrongylus
20 mg/kg por vía intraperitoneal	16; 28	16; 28
10 mg/kg por vía oral	16	

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula (I)

$$\begin{array}{c|c}
Q & X_n \\
R^3 & R^4 & O \\
R^1 & R^2 & R^5
\end{array}$$
(I)

en la que

5

10

15

20

25

30

B¹, B² representan C-X o N, en la que al menos B¹ o B² es N,

n es 1 o 2, limitado por el número de posiciones disponibles en el anillo al que un sustituyente X se pude conectar, cada X se selecciona independientemente entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, nitro, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, alquilamino C₁-C₄, di-(alquilo C₁-C₄)amino, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C₂-C₄, haloalqueniloxi C₂-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquiniloxi C₃-C₄, haloalquiniloxi C₃-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilcarbonilo C₁-C₄, haloalquilcarbonilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, - $CONH(alquilo \ C_1-C_4), \ -CON(alquilo \ C_1-C_4)_2, \ -CONH(Oalquilo \ C_1-C_4), \ -CON(Oalquilo \ C_1-C_4)_2, \ -CON(Oalq$ alcoxicarbonilo C₁-C₄, haloalcoxicarbonilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilcarboniloxi C₁-C₄, haloalquicarboniloxi C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilcarbonilo C₁-C₄, haloalquilcarbonilamino C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -OCONH(alquilo C₁-C₄), -OCON(alquilo C₁-C₄)₂, -OCONH(Oalquilo C₁-C₄), -OCO(Oalquilo C₁-C₄), -S-alquilo C₁-C₄, -S-haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)-alquilo C₁-C₄, -S(O)-haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)₂-alquilo C₁-C₄, -S(O)₂haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, (alcoxiimino C₁-C₄)-alquilo C₁-C₄, (alqueniloxiimino C₂-C₆)-alquilo C₁-C₄, (alquiniloxiimino C₃-C₆)-alquilo C
1-C₄, (benciloxiimino)-alquilo C
1-C₆, benciloxi, -S-bencilo, bencilamino, fenoxi, -S-fenilo y fenilamino,

Q representa un anillo heteroaromático opcionalmente mono o polisustituido del grupo que consiste en Q-41, Q-42, Q-43, Q-44, Q-45, Q-46, Q-47, Q-48, Q-49, Q-50, Q-51, Q-52, Q-53 y Q-57

con

m es 0, 1 o 2, limitado por el número de posiciones disponibles en Q al que un sustituyente Y se puede conectar, y cada Y se selecciona independientemente entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, nitro, ciano, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquenilo C_2 - C_4 , alquinilo C_2 - C_4 ,

alquilamino C_1 - C_4 , di-(alquilo C_1 - C_4)amino, alcoxi C_1 - C_4 , haloalcoxi C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C_2 - C_4 , haloalqueniloxi C_2 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquiniloxi C_3 - C_4 , haloalqueniloxi C_3 - C_6 , halocicloalquilo C_3 - C_6 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilcarbonilo C_1 - C_4 , haloalquilcarbonilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilcarbonilo C_1 - C_4 , haloalquilcarbonilo C_1 - C_4 , que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -CONH(alquilo C_1 - C_4), -CON(alquilo C_1 - C_4), alcoxi carbonilo C_1 - C_4 , haloalcoxicarbonilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilcarboniloxi C_1 - C_4 , haloalquilcarboniloxi C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilcarbonilamino C_1 - C_4 , haloalquilcarbonilamino C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilcarbonilamino C_1 - C_4 , haloalquilcarbonilamino C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -OCONH(alquilo C_1 - C_4), -OCON(alquilo C_1 - C_4), -OCONH(Oalquilo C_1 - C_4), -OCON(alquilo C_1 - C_4), -S-alquilo C_1 - C_4 , -S-haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)-alquilo C_1 - C_4 , -S(O)-haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -CH2-S- alquilo C_1 - C_4 , -CH2-S(O)-alquilo C_1 - C_4 , -CH2-S(O)-alquilo C_1 - C_4 , (alqueniloxiimino C_1 - C_4), (benciloxiimino)-alquilo C_1 - C_4 , (alqueniloxiimino C_2 - C_6)-alquilo C_1 - C_4 , (alquiniloxiimino C_3 - C_6)-alquilo C_1 - C_4 , (benciloxiimino)-alquilo C_1 - C_6 , benciloxi, -S-bencilo, bencilamino, fenoxi, -S-fenilo y fenilamino,

5

10

45

50

55

60

R1, R2, R3 y R4 son iguales o diferentes y se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, 15 ciano, hidroxi, amino, -CHO, -COOH, -CONH2, alquilo C1-C4, alquenilo C2-C4, alquinilo C2-C4, alquilamino C1-C4, di-(alquilo C₁-C₄)amino, alcoxi C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, haloalcoxi C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, algueniloxi C₂-C₄, haloalqueniloxi C₂-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquiniloxi C₃-C₄, haloalquiniloxi C₃-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, cicloalquilo C₃-C₆, 20 halocicloalquilo C₃-C₆ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₃, halocicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₃ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilcarbonilo C₁-C₄, haloalquilcarbonilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -CONH(alquilo C₁-C₄), -CON(alquilo C₁-C₄)₂, -CONH(Oalquilo C₁-C₄), - $CON(Oalquilo\ C_1-C_4) (alquilo\ C_1-C_4),\ alcoxi\ carbonilo\ C_1-C_4,\ haloalcoxi\ carbonilo\ C_1-C_4\ que\ tiene\ de\ 1\ a\ 5\ átomos$ de halógeno, -OC(O)-alquilo C_1 - C_4 , -OC(O)-haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -NHC(O)-alquilo C_1 - C_4 , -NHC(O)-haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -OCONH(alquilo C_1 - C_4), -25 OCON(C₁-C₄-alquil)₂, - OCONH(Oalquilo C₁-C₄), OCO(Oalquilo C₁-C₄), -S-alquilo C₁-C₄, -S-haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)-alquilo C₁-C₄, -S(O)-haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)₂-alquilo C₁-C₄, -S(O)₂-haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, bencilo, benciloxi, -S-bencilo, -S(O)-bencilo, -S(O)₂-bencilo, bencilamino, fenoxi, -S-fenilo, -S(O)-fenilo, -S(O)₂-fenilo,

fenilamino, fenilcarbonilamino, 2,6-diclorofenil-carbonilamino, 2-clorofenil-carbonilamino y fenilo, o R¹ y R² junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un carbociclo de 4 o 5 miembros y R³ y R⁴ son iguales o diferentes y se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxi, amino, -CHO, -COOH, -CONH₂, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, alquilamino C₁-C₄, di-(alquilo C₁-C₄)amino, alcoxi C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, haloalcoxi C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquiniloxi C₃-C₄, haloalquiniloxi C₂-C₄, haloalquiniloxi C₂-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, cicloalquilo C₁-C₃, haloalquiniloxi C₃-C₆-alquilo C₁-C₃ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilcarbonilo C₁-C₄, haloalquilcarbonilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -CONH(alquilo C₁-C₄), -CON(alquilo C₁-C₄)₂, -CONH(Oalquilo C₁-C₄), alcoxi carbonilo C₁-C₄, haloalcoxi carbonilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -OC(O)-alquilo C₁-C₄, - OC(O)-haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -NHC(O)-

alquilo C₁-C₄, -NHC(O)-haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -OCONH(alquilo C₁-C₄), -OCON(alquilo C₁-C₄)₂, -OCONH(Oalquilo C₁-C₄), OCO(Oalquilo C₁-C₄), -S-alquilo C₁-C₄, -S-haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)-alquilo C₁-C₄, -S(O)-haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)₂-alquilo C₁-C₄, -S(O)₂-haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, benciloxi, -S-bencilo, -S(O)-bencilo, -S(O)₂-bencilo, bencilamino, fenoxi, -S-fenilo, -S(O)-fenilo, -S(O)₂-fenilo, fenilamino, fenilcarbonilamino, 2,6-diclorofenil-carbonilamino, 2-clorofenil-carbonilamino y fenilo, o R³ y R⁴ junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un carbociclo de 3, 4 o 5 miembros y R¹ y R²

son iguales o diferentes y se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxi, amino, -CHO, -COOH, -CONH₂, alquillo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, alquillamino C₁-C₄, di-(alquilo C₁-C₄)amino, alcoxi C₁-C₄, haloalquillo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, haloalcoxi C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C₃-C₄, haloalqueniloxi C₂-C₄, haloalqueniloxi C₂-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₃, halocicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₃ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilcarbonilo C₁-C₄, haloalquilcarbonilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -CONH(alquilo C₁-C₄), -CON(alquilo C₁-C₄), -CONH(Oalquilo C₁-C₄), -CON(Oalquilo C₁-C₄), -CON(Oalquilo C₁-C₄), -CONH(Oalquilo C₁-C₄), -CON(Oalquilo C₁-C₄), -CONH(Oalquilo C₁-C₄)

átomos de halógeno, -CONH(alquilo C₁-C₄), -CON(alquilo C₁-C₄)₂, -CONH(Oalquilo C₁-C₄), -CON(Oalquilo C₁-C₄) (alquilo C₁-C₄), alcoxi carbonilo C₁-C₄, haloalcoxi carbonilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -OC(O)-alquilo C₁-C₄, - OC(O)-haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -NHC(O)-alquilo C₁-C₄, -NHC(O)-haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -OCONH(alquilo C₁-C₄), -OCON(C₁-C₄-alquil)₂, -OCONH(Oalquilo C₁-C₄), OCO(Oalquilo C₁-C₄), -S-alquilo C₁-C₄, -S-haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)-alquilo C₁-C₄, -S(O)-haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)-alquilo C₁-C₄, -S(O)-haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)-alquilo C₁-C₄, -S(O)-haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)-alquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)-alquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)-alquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)-alquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)-alquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)-alquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)-alquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)-alquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)-alquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)-alquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)-alquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)-alquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)-alquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)-alquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)-alquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)-alquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)-alquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)-alquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)-

de halógeno, -S(O)-alquilo C_1 - C_4 , -S(O)-haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, $-S(O)_2$ -alquilo C_1 - C_4 , $-S(O)_2$ -haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, benciloxi, -S-bencilo, $-S(O)_2$ -bencilo, bencilamino, fenoxi, -S-fenilo, $-S(O)_2$ -fenilo, fenilamino, fenilamino, 2,6-diclorofenil-carbonilamino, 2-clorofenil-carbonilamino y fenilo, o

R⁴ y R² junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un carbociclo no aromático de 3, 4 o 5 miembros opcionalmente sustituido con sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en uno a cuatro

grupos alquilo C₁-C₄ y uno a cuatro átomos de halógeno, y R¹ y R³ son iguales o diferentes y se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxi, amino, -CHO, - COOH, -CONH2, alquilo C1-C4, alquenilo C_2 - C_4 , alquinilo C_2 - C_4 , alquilamino C_1 - C_4 , di-(alquilo C_1 - C_4)amino, alcoxi C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, haloalcoxi C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C₂-C₄, haloalqueniloxi C₂-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquiniloxi C₃-C₄, haloalquiniloxi C₃-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, cicloalquil C_3 - C_6 -alquilo C_1 - C_3 , halocicloalquil C_3 - C_6 -alquilo C_1 - C_3 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilcarbonilo C₁-C₄, haloalquilcarbonilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -CONH(alquilo C₁-C₄), - $CON(alquilo \ C_1-C_4)_2, \ -CONH(Oalquilo \ C_1-C_4), \ -CON(Oalquilo \ C_1-C_4)(alquilo \ C_1-C_4), \ alcoxi \ carbonilo \ C_1-C_4, \ -CON(Oalquilo \ C_1-C_4)_2, \ -CON(Oalquilo \ C_$ haloalcoxi carbonilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -OC(O)-alquilo C₁-C₄, -OC(O)-haloalquilo C₁- C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -NHC(O)-alquilo C_1 - C_4 , -NHC(O)-haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -OCONH(alquilo C_1 - C_4), -OCON(alquilo C_1 - C_4), -OCONH(Oalquilo C_1 - C_4), OCO(Oalquilo C_1 - C_4), -OCONH(Oalquilo C_1 - C_4), OCO(Oalquilo C_1 - C_4), OCO(Oalquilo C_1 - C_4), -OCONH(Oalquilo C_1 - C_4) C₁-C₄), -S-alquilo C₁-C₄, -S-haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, - S(O)-alquilo C₁-C₄, -S(O)haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)₂-alquilo C₁-C₄, - S(O)₂-haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, bencilo, benciloxi, -S-bencilo, -S(O)-bencilo, -S(O)₂-bencilo, bencilamino, fenoxi, -S-fenilo, -S(O)-fenilo, -S(O)₂-fenilo, fenilamino, fenilcarbonilamino, 2,6-diclorofenil-carbonilamino, 2clorofenil-carbonilamino y fenilo, o

R¹ y R³ junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un carbociclo no aromático de 3, 4 o 5 miembros opcionalmente sustituido con sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en uno a cuatro grupos alquilo C₁-C₄ y uno a cuatro átomos de halógeno, y R² y R⁴ son iguales o diferentes y se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxi, amino, -CHO, - COOH, -CONH₂, alquilo C₁-C₄, alquenilo C2-C4, alquinilo C2-C4, alquilamino C1-C4, di-(alquilo C1-C4)amino, alcoxi C1-C4, haloalquilo C1-C4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, haloalcoxi C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alqueniloxi C₂-C₄, haloalqueniloxi C₂-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquiniloxi C₃-C₄, haloalquiniloxi C₃-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₃, halocicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₃ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilcarbonilo C₁-C₄, haloalquilcarbonilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -CONH(alquilo C₁-C₄), -CON(alguilo C₁-C₄)₂, -CONH(Oalguilo C₁-C₄), -CON(Oalguilo C₁-C₄), alcoxi carbonilo C₁-C₄, haloalcoxi carbonilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -OC(O)-alquilo C₁-C₄, -OC(O)-haloalquilo C₁- C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -NHC(O)-alquilo C_1 - C_4 , -NHC(O)-haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -OCONH(alquilo C_1 - C_4), -OCON(alquilo C_1 - C_4), -OCONH(Oalquilo C_1 - C_4), OCO(Oalquilo C_1 - C_4), -OCONH(Oalquilo C_1 - C_4), OCO(Oalquilo C_1 - C_4), OCO(Oalquilo C_1 - C_4), -OCONH(Oalquilo C_1 - C_4) C₁-C₄), -S-alquilo C₁-C₄, -S-haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, - S(O)-alquilo C₁-C₄, -S(O)haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)₂-alquilo C₁-C₄, -S(O)₂-haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, bencilo, benciloxi, -S-bencilo, -S(O)-bencilo, -S(O)₂-bencilo, bencilamino, fenoxi, -S-fenilo, -S(O)-fenilo, -S(O)₂-fenilo, fenilamino, fenilamino, 2,6-diclorofenil-carbonilamino, 2-clorofenilcarbonilamino y fenilo,

 R^5 se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, -CHO, -OH, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxi C_1 - C_4 , haloalcoxi C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, cicloalquilo C_3 - C_6 , halocicloalquilo C_3 - C_6 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquenilo C_2 - C_4 , alquinilo C_2 - C_4 , alquinilo C_1 - C_4 , cicloalquil C_3 - C_6 -alquilo C_1 - C_3 , ciano-alquilo C_1 - C_4 , amino-alquilo C_1 - C_4 , alquilamino C_1 - C_4 -alquilo C_1 - C_4 , di-(alquilo C_1 - C_4)amino-alquilo C_1 - C_4 , alquilcarbonilo C_1 - C_4 , haloalquilcarbonilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxi carbonilo C_1 - C_4 , benciloxicarbonilo, alcoxi C_1 - C_4 -alquilcarbonilo C_1 - C_4 , -S(O)₂-alquilo C_1 - C_4 y -S(O)₂-haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, A representa un grupo fenilo de fórmula (A1)

$$R_{o}$$

en la que

5

10

15

20

25

30

35

40

45

50

55

o es 0, 1 o 2, y

cada R se selecciona independientemente entre el grupo que consiste en halógeno, nitro, -OH, CHO, OCHO, NHCHO" ciano, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquenilo C_2 - C_4 , alquinilo C_2 - C_4 , cicloalquilo C_3 - C_6 , -S-alquilo C_1 - C_4 , -S-haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxi C_1 - C_4 , haloalcoxi C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxi C_1 - C_4 -alquenilo C_2 - C_4 , alcoxi carbonilo C_1 - C_4 , haloalcoxi carbonilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilcarboniloxi C_1 - C_4 , haloalquilcarboniloxi C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)-alquilo C_1 - C_4 , -S(O)-haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alquilsulfonamida C_1 - C_4 , -NH(alquilo C_1 - C_4), N(alquilo C_1 - C_4), fenilo (opcionalmente sustituido con alcoxi C_1 - C_4) y fenoxi, o dos R unidos a átomos de carbono adyacentes, representan juntos -O(CH₂)_pO-, en la que p representa 1 o 2, o

A representa un heterociclo de fórmula (Het-1)

en la que

5

15

20

25

 R^6 y R^7 pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, nitro, alquilo C_1 - C_4 y haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, y R^8 se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C_1 - C_4 y haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, o

A representa un heterociclo de fórmula (Het-2)

$$R^{10}$$
 R^{10}
 R^{10}
 R^{10}
 R^{10}
 R^{10}
 R^{10}
 R^{10}
 R^{10}

10 en la que

 R^9 se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C_1 - C_4 y haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, y

 R^{10} y R^{11} pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C_1 - C_4 y haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, fenilo opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo C_1 - C_4), o

A representa un heterociclo de fórmula (Het-4)

$$R^{15}$$
 R^{16}
 R^{14}
 S
 $\#$
(Het-4)

en la que

 R^{14} y R^{15} pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S-alquilo C_1 - C_4 , -S(O)₂-alquilo C_1 - C_4 , fenilo (opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo C_1 - C_4) y piridilo (opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo C_1 - C_4), y

R¹⁶ se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno y haloalcoxi C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, o

A representa un heterociclo de fórmula (Het-5)

en la que

 R^{17} y R^{18} pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C_1 - C_4 , alquiloxi C_1 - C_4 y haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, y

 R^{19} se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C_1 - C_4 y haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos, o

A representa un heterociclo de fórmula (Het-6)

$$R^{20}$$
 # R^{23} R^{23} (Het-6)

5 en la que

10

15

20

25

 R^{20} se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C_1 - C_4 y haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, y

R²¹ y R²³ pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, y

R²² se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, o

A representa un heterociclo de fórmula (Het-7)

$$R^{27}$$
 R^{26}
 R^{25}
 R^{24}
(Het-7)

en la que

 R^{24} se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, ciano, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxi C_1 - C_4 -alquilo C_1 - C_4 , alquilcarbonilo C_1 - C_6 , o benzoílo (opcionalmente sustituido con halógeno o un alquilo C_1 - C_4), y

 R^{25} , R^{26} y R^{27} pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno y alquilcarbonilo C_1 - C_4 C_4 C_5 C_6 C_6

A representa un heterociclo de fórmula (Het-9)

$$R^{30}$$
 O
 R^{31}
(Het-9)

en la que

 R^{30} se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno y alquilo $C_1\text{-}C_4$, y

 R^{31} se selecciona entre el grupo que consiste en halógeno, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno y fenilo (opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo C_1 - C_4), o

A representa un heterociclo de fórmula (Het-10)

5

10

15

20

25

 R^{32} se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, amino, ciano, alquilamino C_1 - C_4 , di-(alquilo C_1 - C_4)amino, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno y fenilo (opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo C_1 - C_4), y

 R^{33} se selecciona entre el grupo que consiste en halógeno, alquilo C_1 - C_4 y haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, haloalcoxi C_1 - C_5 que comprende de 1 a 9 átomos de halógeno, amino, alquilamino C_1 - C_5 sustituido o no sustituido o di- $(C_1$ - C_5 -alquil)-amino sustituido o no sustituido, o

A representa un heterociclo de fórmula (Het-11)

en la que

 R^{34} se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilamino C_1 - C_4 , di-(alquilo C_1 - C_4)amino, alquilo C_1 - C_4 y haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, y

 R^{35} se selecciona entre el grupo que consiste en halógeno, alquilo C_1 - C_4 y haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, o

A representa un heterociclo de fórmula (Het-12)

en la que

 R^{36} se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, cicloalquilo C_3 - C_6 , alcoxi C_1 - C_4 , haloalcoxi C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S-alquilo C_1 - C_4 , -S(O)-alquilo C_1 - C_4 , -S(O)₂-alquilo C_1 - C_4 y -S-haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, y

 R^{37} se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo C_1 - C_4 , alcoxi C_1 - C_4 y -S-alquilo C_1 - C_4 , -S(O)-alquilo C_1 - C_4 , -S(O)₂-alquilo C_1 - C_4 , y

 R^{38} se selecciona entre el grupo que consiste en fenilo, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, hidroxi-alquilo C_1 - C_4 , alquenilo C_2 - C_6 , cicloalquilo C_3 - C_6 , alquiltio C_1 - C_4 -alquilo C_1 - C_4 , alquil C_1 - C_4 -alquilo C_1 - C_4 -

30 A representa un heterociclo de fórmula (Het-13)

5

10

20

25

30

35

 R^{39} se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, cicloalquilo C_3 - C_6 , alcoxi C_1 - C_4 , haloalcoxi C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S-alquilo C_1 - C_4 , -S(O)-alquilo C_1 - C_4 , -S(O)₂-alquilo C_1 - C_4 , -S-haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos, aminocarbonilo y aminocarbonil-alquilo C_1 - C_4 , y

 R^{40} se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C_1 - C_4 , alcoxi C_1 - C_4 , haloalcoxi C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno,-S-alquilo C_1 - C_4 , -S(O)-alquilo C_1 - C_4 , y -S(O)₂-alquilo C_1 - C_4 , y

 R^{41} se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, hidroxi-alquilo C_1 - C_4 , alquenilo C_2 - C_6 , cicloalquilo C_3 - C_6 , alquiltio C_1 - C_4 -alquilo C_1 - C_4 , alquil C_1 - C_4 -S(O)-alquilo C_1 - C_4 , alquil C_1 - C_4 -alquilo C_1 - C_4 , haloalquiltio C_1 - C_4 -alquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxi C_1 - C_4 -alquilo C_1 - C_4 , haloalcoxi C_1 - C_4 -alquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno y fenilo opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C_1 - C_4 , alcoxi C_1 - C_4 -alquilo C_1 - C_4 o nitro, o

15 A representa un heterociclo de fórmula (Het-14)

en la que

 R^{42} se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, cicloalquilo C_3 - C_6 , alcoxi C_1 - C_4 , haloalcoxi C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S-alquilo C_1 - C_4 , -S(O)-alquilo C_1 - C_4 , y -S(O)₂-alquilo C_1 - C_4 , -S-haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, aminocarbonilo y aminocarbonil-alquilo C_1 - C_4 , y

 R^{43} se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C_1 - C_4 , alcoxi C_1 - C_4 , -S-alquilo C_1 - C_4 , -S(O)-alquilo C_1 - C_4 , y -S(O)₂-alquilo C_1 - C_4 , y haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, y

 R^{44} se selecciona entre el grupo que consiste en fenilo, bencilo, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, hidroxi-alquilo C_1 - C_4 , alquenilo C_2 - C_6 , cicloalquilo C_3 - C_6 , alquiltio C_1 - C_4 -alquilo C_1 - C_4 , C_1 - C_4 -alquilo C_1 - C_4 , C_1 - C_4 -alquilo C_1 - C_4 , C_1 - C_4 -haloalquiltio-alquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxi C_1 - C_4 -alquilo C_1 - C_4 y haloalcoxi C_1 - C_4 -alquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, o

A representa un heterociclo de fórmula (Het-15)

en la que

 R^{45} y R^{46} pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C_1 - C_4 y haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, o A representa un heterociclo de fórmula (Het-16)

5

10

15

 R^{47} y R^{48} pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, fenilo (opcionalmente sustituido con halógeno o un alquilo C_1 - C_4), o heterociclilo como piridilo, pirimidinilo y tiadiazolilo (opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo C_1 - C_4), o

A representa un heterociclo de fórmula (Het-17)

en la que

 R^{49} y R^{50} pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C_1 - C_4 y haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, o A representa un heterociclo de fórmula (Het-19)

en la que

 R^{52} se selecciona entre el grupo que consiste en halógeno, alquilo C_1 - C_4 y haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, y

 R^{53} se selecciona entre el grupo que consiste en alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno y fenilo (opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo C_1 - C_4), o

A representa un heterociclo de fórmula (Het-20)

20 en la que

 R^{54} se selecciona entre el grupo que consiste en halógeno, alquilo C_1 - C_4 y haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, o

A representa un heterociclo de fórmula (Het-21)

25 en la que

 R^{55} se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxi C_1 - C_4 , -S-alquilo C_1 - C_4 , -S(O)-alquilo C_1 - C_4 , -S(O)₂-alquilo C_1 - C_4 , -S-haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, y

 $R^{56},\,R^{57}\,y\,R^{58},\,$ que pueden ser iguales o diferentes, se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo $C_1\text{-}C_4,\,$ haloalquilo $C_1\text{-}C_4$ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxi $C_1\text{-}C_4,\,$ -S(O)-alquilo $C_1\text{-}C_4,\,$ -S(O)₂-alquilo $C_1\text{-}C_4,\,$ haloalcoxi $C_1\text{-}C_4$ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)-alquilo $C_1\text{-}C_4$ y -S(O)₂-alquilo $C_1\text{-}C_4,\,$ o

A representa un heterociclo de fórmula (Het-22)

$$R^{61}$$
 # R^{60} N R^{59} (Het-22)

en la que

5

10

15

20

25

30

35

 R^{59} se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, hidroxi, ciano, alquilo $C_1\text{-}C_4$, haloalquilo $C_1\text{-}C_4$ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxi $C_1\text{-}C_4$, -S-alquilo $C_1\text{-}C_5$, -S(O)-alquilo $C_1\text{-}C_4$, -S-alquilo $C_1\text{-}C_4$ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, haloalcoxi $C_1\text{-}C_4$ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, feniloxi (opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo $C_1\text{-}C_4$) y -S-fenilo (opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo $C_1\text{-}C_4$), y

 R^{60} se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxi C_1 - C_4 , -S-alquilo C_1 - C_4 , -S(O)-alquilo C_1 - C_4 , -S(O)₂-alquilo C_1 - C_4 , N-morfolina (opcionalmente sustituida con halógeno o alquilo C_1 - C_4) y tienilo (opcionalmente sustituido con halógeno o un alquilo C_1 - C_4), y

 R^{61} y R^{62} , que pueden ser los mismos o diferentes, se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxi C_1 - C_4 , -S-alquilo C_1 - C_4 , haloalcoxi C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)-alquilo C_1 - C_4 , -S(O)₂-alquilo C_1 - C_4 , N-morfolina (opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo C_1 - C_4) y tienilo (opcionalmente sustituido con halógeno o un alquilo C_1 - C_4), o

A representa un heterociclo de fórmula (Het-23)

$$R^{66}$$
 R^{65}
 R^{64}
(Het-23)

en la que

 R^{63} , R^{64} , R^{65} y R^{66} , que pueden ser iguales o diferentes, se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, hidroxi, ciano, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxi C_1 - C_4 , -S-alquilo C_1 - C_4 , -S-haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, haloalcoxi C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)-alquilo C_1 - C_4 y -S(O)₂-alquilo C_1 - C_4 , o A representa un heterociclo de fórmula (Het-24)

en la que

 R^{67} se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C_1 - C_4 y haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, y

 R^{68} se selecciona entre el grupo que consiste en alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxi carbonilo C_1 - C_6 , bencilo (opcionalmente sustituido con 1 a 3 átomos de halógeno), benciloxicarbonilo (opcionalmente sustituido con 1 a 3 átomos de halógeno) y heterociclilo como pirimidinilo, (opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno), o

A representa un heterociclo de fórmula (Het-25)

en la que

5

15

20

25

30

 R^{69} se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C_1 - C_4 y haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, y

R⁷⁰ se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno y bencilo, o

A representa un heterociclo de fórmula (Het-26)

$$R^{73}$$
 X^{1} # R^{72} X^{1} X^{1}

10 en la que

X1 se selecciona entre el grupo que consiste en azufre, -SO- o -SO2-, y

R⁷¹ se selecciona entre el grupo que consiste en alquilo C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, y

 R^{72} y R^{73} pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno y alquilo C_1 - C_4 , o

A representa un heterociclo de fórmula (Het-29)

en la que

 R^{76} se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C_1 - C_4 y haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

2. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en el que B^1 , B^2 representan C-X o N, en el que al menos B^1 o B^2 es N, n es 1

X se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, nitro, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno,

Q <u>representa</u> un anillo heteroaromático opcionalmente mono o polisustituido del grupo que consiste en Q-41, Q-42 y Q-53, con

m es 0, 1 o 2, limitado por el número de posiciones disponibles en Q al que un sustituyente Y se puede conectar, y cada Y se selecciona independientemente entre el grupo que consiste en hidrógeno, -CF₃, -CH₂CF₃, metilo, etilo, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, -OCH₃, -OCH₂CH₃, -OCH(CH₃)₂, -OCH₂CF₃, - CH₂-S(O)₂-CH₃, dimetilamino, R¹ y R² son iguales o diferentes y se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxi, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, alcoxi C₁-C₄, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₃, alcoxi carbonilo C₁-C₄, -OC(O)-alquilo C₁-C₄, -NHC(O)-alquilo C₁-C₄, 2,6-diclorofenil-carbonilamino, 2-clorofenil-carbonilamino y fenilo,

R³ y R⁴ son iguales o diferentes y se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, -COOH, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ alcoxi C₁-C₄, hidroxi-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₃, -CONH(alquilo C₁-C₄), alcoxi carbonilo C₁-C₄, -OC(O)-alquilo C₁-C₄, y fenilo, o

R1 y R2 junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un carbociclo de 4 o 5 miembros, y R3 y R4 son

iguales o diferentes y se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, -COOH, alquilo C_1 - C_4 , haloalquil C_1 - C_4 -alcoxi C_1 - C_4 , hidroxi-alquilo C_1 - C_4 , alcoxi C_1 - C_4 -alquilo C_1 - C_3 , -CONH(alquilo C_1 - C_4), alcoxi carbonilo C_1 - C_4 , -OC(O)-alquilo C_1 - C_4 , y fenilo,

- preferentemente R^1 y R^2 junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un ciclopentilo, o R^3 y R^4 junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un carbociclo de 3, 4 o 5 miembros, y R^1 y R^2 son iguales o diferentes y se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxi, alquilo C_1 - C_4 , alquenilo C_2 - C_4 , alquenilo C_2 - C_4 , alcoxi C_1 - C_4 , cicloalquil C_3 - C_6 -alquilo C_1 - C_3 , alcoxi carbonilo C_1 - C_4 , -OC(O)-alquilo C_1 - C_4 , -NHC(O)-alquilo C_1 - C_4 , 2,6-diclorofenil-carbonilamino, 2-clorofenil-carbonilamino y fenilo,
- preferentemente R³ y R⁴ junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un ciclopropilo o un ciclobutilo, o R² y R⁴ junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un carbociclo no aromático de 3, 4 o 5 miembros opcionalmente sustituido con sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en uno a cuatro grupos alquilo C₁-C₃ y uno a dos átomos de halógeno, y R¹ se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxi, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, alcoxi C₁-C₄, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₃, alcoxi carbonilo C₁-C₄, -OC(O)-alquilo C₁-C₄, -NHC(O)-alquilo C₁-C₄, 2,₆-diclorofenil-carbonilamino, 2-clorofenil-carbonilamino y fenilo, y R³ se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, -COOH, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₃, -CONH(alquilo C₁-C₄), alcoxi carbonilo C₁-C₄, -OC(O)-alquilo C₁-C₄, y fenilo,
 - preferentemente R² y R⁴ junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un ciclopropilo, ciclobutilo o ciclopentilo, o
- R¹ y R³ junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un carbociclo no aromático de 3, 4 o 5 miembros opcionalmente sustituido con sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en uno a cuatro grupos alquilo C₁-C₃ y uno a dos átomos de halógeno, preferentemente ciclopropilo, ciclobutilo o ciclopentilo, y R² se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxi, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, alcoxi C₁-C₄, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₃, alcoxi carbonilo C₁-C₄, -OC(O)-alquilo C₁-C₄, -NHC(O)-alquilo C₁-C₄, 2,6-diclorofenil-carbonilamino, 2-clorofenil-carbonilamino y fenilo, y R⁴ se selecciona entre el grupo que consiste en
- diclorofenil-carbonilamino, 2-clorofenil-carbonilamino y fenilo, y R⁴ se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno,-COOH, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ alcoxi C₁-C₄, hidroxi-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₃, -CONH(alquilo C₁-C₄), alcoxi carbonilo C₁-C₄, -OC(O)-alquilo C₁-C₄, y fenilo, preferentemente R¹ y R³ junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un ciclopropilo, ciclobutilo o
- ciclopentilo, 30 R^5 se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, cicloalquilo C_3 - C_6 , alquilcarbonilo C_1 - C_4 , alcoxicarbonilo C_1 - C_4 ,

A representa un grupo fenilo de fórmula (A1)

$$R_{o}$$

en la que

35

40

45

5

o es 0, 1 o 2, v

cada R se selecciona independientemente entre el grupo que consiste en halógeno, nitro, -OH, ciano, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, cicloalquilo C_3 - C_6 , alcoxi C_1 - C_4 , alcoxicarbonilo C_1 - C_4 , -NH(alquilo C_1 - C_4), fenilo (opcionalmente sustituido con alcoxi C_1 - C_4) y fenoxi, o

A representa un heterociclo de fórmula (Het-1)

$$\mathbb{R}^{7}$$
 \mathbb{R}^{8}
 \mathbb{R}^{6}
 $\mathbb{$

en la que

 R^6 y R^7 pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, nitro, alquilo C_1 - C_4 y haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, y

 R^8 se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C_1 - C_4 y haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, o

A representa un heterociclo de fórmula (Het-2)

$$R^{10}$$
 R^{10}
 R^{10}
 R^{10}
(Het-2)

 R^9 se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C_1 - C_4 y haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, y

R¹⁰ y R¹¹ pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, fenilo opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo C₁-C₄), o

A representa un heterociclo de fórmula (Het-4)

10 en la que

 R^{14} y R^{15} pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S-alquilo C_1 - C_4 , -S(O)₂-alquilo C_1 - C_4 , fenilo (opcionalmente sustituido con halógeno o C_1 - C_4 -alquil) y piridilo (opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo C_1 - C_4), y

15 R¹⁶ se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno y haloalcoxi C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, o

A representa un heterociclo de fórmula (Het-5)

en la que

R¹⁷ y R¹⁸ pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄, alquiloxi C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, y R¹⁹ se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos, o

A representa un heterociclo de fórmula (Het-6)

$$R^{20}$$
 # R^{23} R^{23} (Het-6)

، ما مم

25

en la que

 R^{20} se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C_1 - C_4 y haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, y

R²¹ y R²³ pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, y

 R^{22} se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, ciano, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxi C_1 - C_4 -alquilo C_1 - C_4 , o

A representa un heterociclo de fórmula (Het-10)

en la que

5

15

20

25

35

10 R^{32} se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, amino, ciano, alquilamino C_1 - C_4 , di-(alquilo C_1 - C_4)amino, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno y fenilo (opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo C_1 - C_4), y

 \dot{R}^{33} se selecciona entre el grupo que consiste en halógeno, alquilo C_1 - C_4 y haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, haloalcoxi C_1 - C_5 que comprende de 1 a 9 átomos de halógeno, amino, alquilamino C_1 - C_5 sustituido o no sustituido o di-(alquilo C_1 - C_5)-amino sustituido o no sustituido, o

A representa un heterociclo de fórmula (Het-21)

en la que

 R^{55} se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxi C_1 - C_4 , -S-alquilo C_1 - C_4 , -S(O)-alquilo C_1 - C_4 , que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno y haloalcoxi C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, y

 R^{56} , R^{57} y R^{58} , que pueden ser iguales o diferentes, se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxi C_1 - C_4 , -S-alquilo C_1 - C_4 , haloalcoxi C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)-alquilo C_1 - C_4 y-S(O)₂-alquilo C_1 - C_4 , o

A representa un heterociclo de fórmula (Het-22)

$$R^{61}$$
 # R^{60} N R^{59} (Het-22)

en la que

 R^{59} se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, hidroxi, ciano, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxi C_1 - C_4 , -S-alquilo C_1 - C_5 , -S(O)-alquilo C_1 - C_4 , -S-alquenilo C_2 - C_5 , -S-haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, haloalcoxi C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, feniloxi (opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo C_1 - C_4) y -S-fenilo (opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo C_1 - C_4), y

R⁶⁰ se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxi C₁-C₄, -S-alquilo C₁-C₄, -S(O)-alquilo C₁-C₄,-S(O)₂-alquilo C₁-C₄, N-

morfolina (opcionalmente sustituida con halógeno o alquilo C_1 - C_4) y tienilo (opcionalmente sustituido con halógeno o a alquilo C_1 - C_4), y

 R^{61} y R^{62} , que pueden ser los mismos o diferentes, se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxi C_1 - C_4 , -S-alquilo C_1 - C_4 , haloalcoxi C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, -S(O)-alquilo C_1 - C_4 , -S(O)₂-alquilo C_1 - C_4 , N-morfolina (opcionalmente sustituida con halógeno o alquilo C_1 - C_4) y tienilo (opcionalmente sustituido con halógeno o a alquilo C_1 - C_4), o

A representa un heterociclo de fórmula (Het-29)

10 en la que

5

 R^{76} se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C_1 - C_4 y haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

3. Un compuesto de acuerdo con las reivindicaciones 1 o 2, en el que

B1 representa N,

B² representa CH,

n es 1,

15

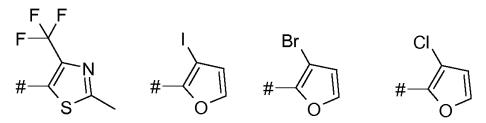
X se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, nitro, ciano, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxi C_1 - C_4 , haloalcoxi C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, C_1 - C_2 0 se selecciona entre:

R¹ y R² son iguales o diferentes y se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, metilo, etilo, metoxi, etoxi o flúor,

R³ y R⁴ son iguales o diferentes y se seleccionan entre el grupo que consiste en hidrógeno, metilo o etilo, R⁵ es hidrógeno,

A se selecciona entre:

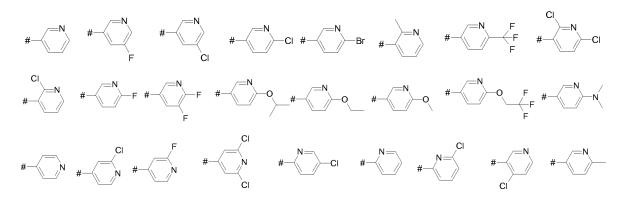
ES 2 640 646 T3



- 4. Un compuesto de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 2, en el que
- B1 representa N,
- B² representa CH,
- n es 1,

10

X se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, nitro, ciano, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxi C_1 - C_4 , haloalcoxi C_1 - C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, Q se selecciona entre:



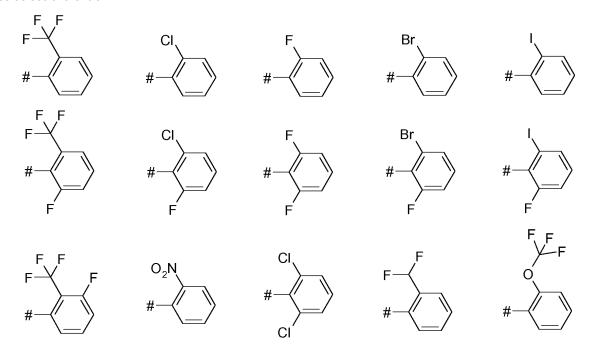
R¹ se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, metilo, etilo, metoxi, etoxi o flúor,

R³ se selecciona entre el grupo que consiste en hidrógeno, metilo o etilo,

R² y R⁴ junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un ciclobutano,

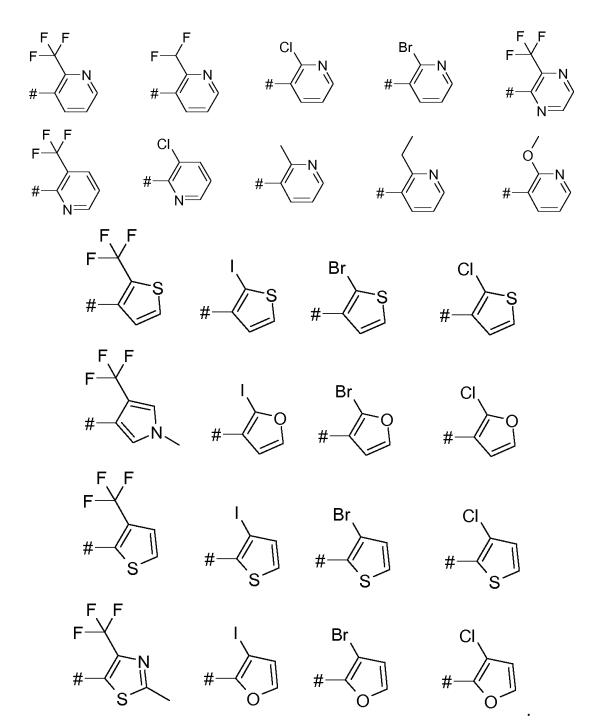
15 R⁵ es hidrógeno,

A se selecciona entre:



20

A se selecciona entre:

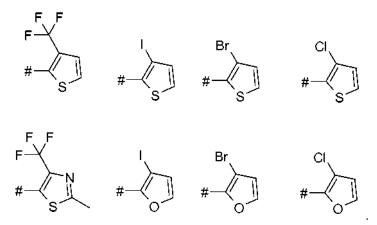


- 5. Un compuesto de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 4, en el que Q está en posición para.
- 6. Un compuesto de fórmula (XIX)

5

10 en la que

A se selecciona entre:



7. Un compuesto de fórmula (XVII):

- 8. Una composición que comprende al menos un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 5.
- 9. Una composición que comprende una cantidad eficaz de al menos un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 5 y al menos un tensioactivo, un diluyente sólido o líquido.
 - 10. Una composición de acuerdo con las reivindicaciones 8 o 9 que además comprende al menos un principio activo adicional.
- 11. Uso de un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 5 o de una composición de acuerdo con las reivindicaciones 8 a 10 para controlar plagas animales, en especial nematodos, en la protección de cultivos, en el que se excluyen los usos en procedimientos para el tratamiento quirúrgico o terapéutico del cuerpo humano o animal y en procedimientos de diagnóstico llevados a cabo en el cuerpo humano o animal.
 - 12. Uso de un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 5 o de una composición de acuerdo con las reivindicaciones 8 a 10 para controlar plagas animales, en especial nematodos, en el sector veterinario.
- 13. Un procedimiento para controlar un nematodo que comprende poner en contacto el nematodo o su entorno con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 5, en el que se excluyen los procedimientos para el tratamiento quirúrgico o terapéutico del cuerpo humano o animal y los procedimientos de diagnóstico llevados a cabo en el cuerpo humano o animal.
- 14. Un procedimiento para controlar un nematodo que comprende poner en contacto el nematodo o su entorno con una composición de acuerdo con las reivindicaciones 8 a 10.
 - 15. Un procedimiento para proteger una semilla de un nematodo que comprende poner en contacto la semilla con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 5, o con una composición de acuerdo con la reivindicación 8 a 10.
 - 16. Una semilla obtenida por un procedimiento de acuerdo con la reivindicación 15.