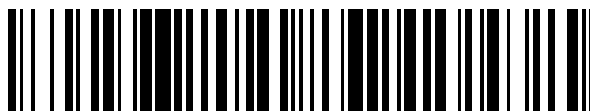


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 659 033**

51 Int. Cl.:

A01N 43/56 (2006.01)

A01N 43/80 (2006.01)

A01N 43/653 (2006.01)

A01P 7/04 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **25.10.2012 PCT/US2012/061948**

87 Fecha y número de publicación internacional: **02.05.2013 WO13063282**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **25.10.2012 E 12781247 (7)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **22.11.2017 EP 2770831**

54 Título: **Plaguicidas heterocíclicos 1,3-diaril-sustituídos**

30 Prioridad:

25.10.2011 US 201161550971 P

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:
13.03.2018

73 Titular/es:

**E. I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY
(100.0%)**

**1007 Market Street
Wilmington, Delaware 19898, US**

72 Inventor/es:

**PAHUTSKI, THOMAS FRANCIS JR.;
LAHM, GEORGE PHILIP;
KAR, MOUMITA y
AHMAD, OMAR KHALED**

74 Agente/Representante:

ELZABURU, S.L.P

ES 2 659 033 T3

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

DESCRIPCIÓN

Plaguicidas heterocíclicos 1,3-diaril-sustituídos

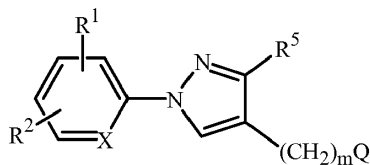
Campo de la invención

5 Esta invención se refiere a ciertos compuestos heterocíclicos 1,3-diaril-sustituídos, sus *N*-óxidos, sales y sus composiciones adecuados para usos agronómicos y no agronómicos, y sus métodos de uso para controlar plagas de invertebrados, tales como artrópodos, en entornos tanto agronómicos como no agronómicos.

Antecedentes de la invención

10 El control de las plagas de invertebrados es extremadamente importante para lograr una alta eficacia de los cultivos. El daño de las plagas de invertebrados a los cultivos agronómicos en crecimiento y almacenados puede causar una reducción significativa de la productividad y, por lo tanto, aumentar los costes para el consumidor. El control de plagas de invertebrados en la selvicultura, cultivos de invernadero, plantas ornamentales, cultivos de vivero, alimentos almacenados y productos de fibra, ganado, hogar, césped, productos de madera y salud pública también es importante. Muchos productos están disponibles comercialmente para estos fines, pero continúa la necesidad de nuevos compuestos que sean más eficaces, menos costosos, menos tóxicos, más seguros para el entorno o que
15 tengan diferentes sitios de acción.

La Patente de los Estados Unidos Núm. 7.566.709 B2 describe compuestos de pirazol de Fórmula i como antagonistas del receptor 5-HT para el tratamiento de psicosis y trastornos neurológicos

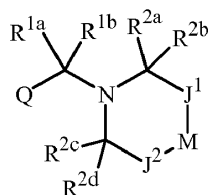


i

20 en donde, entre otros, R¹ y R² son independientemente H, A o halógeno, X es N o CH, R⁵ es alquilo o un anillo aromático, A es alquilo y Q es NR³R⁴ o un radical que contiene heteroátomos. El documento WO2006/134459 describe una gama de aril pirazoles sustituidos en C₄, composiciones que comprenden tales compuestos, procedimientos para su síntesis y su uso como parasiticidas.

Compendio de la Invención

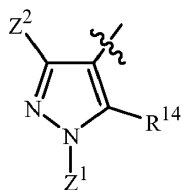
25 Esta invención se dirige a un compuesto de Fórmula 1 (incluidos todos los estereoisómeros), *N*-óxidos y sales de los mismos



1

en donde

Q es



Q-1 ;

30 R^{1a} es H, ciano, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, C(O)OH, C(O)R^{5a}, C(O)OR^{6a} o C(O)NR^{7a}R^{8a};

R^{1b} es H o alquilo C_1-C_6 ;

R^{2a} y R^{2c} son cada uno independientemente H, halógeno, ciano, $C(X)R^5$, $C(O)OR^6$, $C(X)NR^7R^8$ o $S(O)_nR^{11}$; o alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 , cicloalquil(C_4-C_8)alquilo o cicloalqueno C_3-C_6 , cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente seleccionado independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, OR^{12a} , alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 y $S(O)_nR^{11a}$;

R^{2b} y R^{2d} son cada uno independientemente H, halógeno, ciano, nitro, $C(X)R^5$, $C(O)OR^6$, $C(X)NR^7R^8$, NR^9R^{10} , $S(O)_nR^{11}$ o $SO_2NR^9R^{10}$; o alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 , cicloalquil(C_4-C_8)alquilo o cicloalqueno C_3-C_6 , cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, OR^{12a} , alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 y $S(O)_nR^{11a}$; o fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^4 ;

J^1 es $-C(R^{3a}R^{3b})-$;

J^2 es $-C(R^{3c}R^{3d})-$;

M es $-C(R^{3e})(A)-$;

A es halógeno, ciano, nitro, $C(X)R^5$, $C(O)OR^6$, $C(X)NR^7R^8$, $C(X)NR^{7b}R^8$, NR^9R^{10} , $S(O)_nR^{11}$ o $SO_2NR^9R^{10}$; o alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 , cicloalquil(C_4-C_8)alquilo o cicloalqueno C_3-C_6 , cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente seleccionado independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , $C(O)R^{5a}$, $C(O)OR^{6a}$, $C(O)NR^{7a}R^{8a}$, $NR^{9a}R^{10a}$, OR^{12a} y $S(O)_nR^{11a}$; o fenilo, un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros o un sistema anular heteroaromáticos de 7 a 11 miembros, cada anillo o sistema anular no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^4 ;

cada R^{3a} y R^{3c} son independientemente H, halógeno, ciano, $C(X)R^5$, $C(O)OR^6$, $C(X)NR^7R^8$, OR^{12} o $S(O)_nR^{11}$; o alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 , cicloalquil(C_4-C_8)alquilo o cicloalqueno C_3-C_6 , cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, OR^{12a} , alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 y $S(O)_nR^{11a}$;

cada R^{3b} y R^{3d} son cada uno independientemente H, halógeno, ciano, nitro, $C(X)R^5$, $C(O)OR^6$, $C(X)NR^7R^8$, NR^9R^{10} , OR^{12} , $S(O)_nR^{11}$ o $SO_2NR^9R^{10}$; o alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 , cicloalquil(C_4-C_8)alquilo o cicloalqueno C_3-C_6 , cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, OR^{12a} , alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 y $S(O)_nR^{11a}$; o fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^4 ;

R^{3e} es H, halógeno, ciano, nitro, $C(X)R^5$, $C(O)OR^6$, $C(X)NR^7R^8$, NR^9R^{10} , OR^{12} , $S(O)_nR^{11}$ o $SO_2NR^9R^{10}$; o alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 , cicloalquil(C_4-C_8)alquilo o cicloalqueno C_3-C_6 , cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, OR^{12a} , alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 y $S(O)_nR^{11a}$; o fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^4 ; o

R^{3e} y A pueden ser tomados junto con el átomo de carbono al cual están unidos para formar un anillo de 3 a 7 miembros que contiene miembros de anillos seleccionados a partir de átomos de carbono y hasta 2 heteroátomos independientemente seleccionados entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, y hasta 2 átomos de nitrógeno, en donde hasta 2 átomos de carbono miembros de anillos son independientemente seleccionados de $C(=O)$ y $C(=S)$ y el átomo de azufre miembro de anillo se selecciona de S, $S(O)$ o $S(O)_2$, siendo dicho anillo no sustituido o sustituido con hasta 4 sustituyentes independientemente seleccionados del grupo que consiste en halógeno, ciano y alquilo C_1-C_4 ; o

o cuando dos sustituyentes cualesquiera independientemente seleccionados del grupo que consiste en R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} , R^{2d} , R^{3a} , R^{3b} , R^{3c} , R^{3d} y R^{3e} son alquilo C_1-C_4 , dichos dos sustituyentes se pueden tomar juntos para formar un anillo;

Z^1 es fenilo sustituido con 1 a 4 R^{4a} ; o Z^1 es un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros o un sistema anular bicíclicos heteroaromáticos de 8 a 10 miembros, cada anillo o sistema anular no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^{4a} ;

Z^2 es fenilo, no sustituido o sustituido con 1 a 4 R^{4b} ; o Z^2 es un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros o un sistema anular bicíclico heteroaromático de 8 a 10 miembros, cada anillo o sistema anular no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^{4b} ;

cada uno de R^4 , R^{4a} y R^{4b} es independientemente halógeno, ciano, nitro, $C(X)R^5$, $C(O)OR^6$, $C(X)NR^7R^8$, NR^9R^{10} , OR^{12} , $S(O)_nR^{11}$ o $SO_2NR^9R^{10}$; o alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 o cicloalquil(C_4-C_8)alquilo, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, OR^{12a} , alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 y $S(O)_nR^{11a}$; o fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^{13} ; y cuando dos grupos R^4 , dos R^{4a} o dos R^{4b} están unidos a átomos de carbono adyacentes, dichos dos grupos R^4 , dos R^{4a} o dos R^{4b} pueden ser

tomados junto con los átomos de carbono a los cuales están unidos para formar un anillo;

5 cada R^5 es independientemente H; o alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 o cicloalquil(C_4-C_8)alquilo, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, OR^{12a} , alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 y $S(O)_nR^{11a}$; o fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^{13} ;

cada R^{5a} es independientemente alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 o cicloalquilo C_3-C_7 ;

10 cada R^6 es independientemente alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 o cicloalquil(C_4-C_8)alquilo, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, OR^{12a} , alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 y $S(O)_nR^{11a}$; o fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^{13} ;

cada R^{6a} es independientemente alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 ;

15 cada R^7 y R^8 es independientemente H; o alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 o cicloalquil(C_4-C_8)alquilo, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, OR^{12a} , alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 y $S(O)_nR^{11a}$; o fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^{13} ; o R^7 y R^8 pueden tomarse junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos para formar un anillo de 5, 6 o 7 miembros;

cada R^{7a} y R^{8a} es independientemente H, alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 ;

R^{7b} es $N(R^{7a})_2$, OH u OR^{12a} ;

20 cada R^9 y R^{10} es independientemente H, $C(X)R^5$, $C(O)OR^6$ o $C(X)NR^7R^8$; o alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 o cicloalquil(C_4-C_8)alquilo, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, OR^{12a} , alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 y $S(O)_nR^{11a}$; o fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^{13} ; o R^9 y R^{10} pueden tomarse junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos para formar un anillo de 5, 6 o 7 miembros;

25 cada R^{9a} y R^{10a} es independientemente H, $C(X)R^{5a}$, $C(O)OR^{6a}$, $C(X)NR^{7a}R^{8a}$, alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 ;

cada R^{11} es independientemente alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 o cicloalquil(C_4-C_8)alquilo, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, OR^{12a} , alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 y $S(O)_nR^{11a}$; o fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^{13} ;

30 cada R^{11a} es independientemente alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 ;

cada R^{12} es independientemente H; o alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 o cicloalquil(C_4-C_8)alquilo, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, OR^{12a} , alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 y $S(O)_nR^{11a}$; o fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^{13} ;

35 cada R^{12a} es independientemente H, alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 ;

40 cada R^{13} es independientemente halógeno, ciano, nitro, $C(X)R^{5a}$, $C(O)OR^{6a}$, $C(X)NR^{7a}R^{8a}$, $NR^{9a}R^{10a}$, OR^{12a} , $S(O)_nR^{11a}$ o $SO_2NR^{9a}R^{10a}$; o alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 o cicloalquil(C_4-C_8)alquilo, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, OR^{12a} , alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 y $S(O)_nR^{11a}$; siempre que cuando dos grupos R^{13} están unidos a átomos de carbono adyacentes, dichos dos grupos R^{13} pueden tomarse junto con los átomos de carbono a los cuales están unidos para formar un anillo;

R^{14} es H;

cada X es independientemente O o S; y

cada n es independientemente 0, 1 o 2;

45 siempre que cuando A sea $C(X)NR^7R^8$ y X sea O, tanto R^7 como R^8 no sean H.

También se proporcionan composiciones que comprenden un compuesto de Fórmula 1 y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos. En una realización, esta invención también proporciona una composición para controlar una plaga de invertebrados que comprende un compuesto de Fórmula 1, un N-óxido, o una sal del mismo, y al menos un componente adicional

seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos, comprendiendo dicha composición adicionalmente al menos un compuesto o agente biológicamente activos adicionales.

5 Esta invención también proporciona un método para controlar una plaga de invertebrados que comprende poner en contacto la plaga de invertebrados o su entorno con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido, o una sal del mismo (p. ej., como una composición descrita en la presente memoria) con la condición de que el método no sea un método de tratamiento del cuerpo humano o animal mediante terapia. Esta invención también se refiere a tal método en donde la plaga de invertebrados o su entorno se ponen en contacto con una composición que comprende una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido, o una sal del mismo, y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos, comprendiendo dicha composición opcionalmente adicionalmente una cantidad biológicamente eficaz de al menos un compuesto o agente biológicamente activos adicionales con la condición de que el método no sea un método de tratamiento del cuerpo humano o animal mediante terapia.

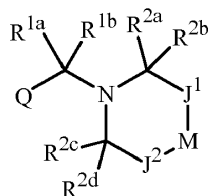
15 Esta invención también proporciona un método para controlar una plaga de invertebrados que comprende poner en contacto la plaga de invertebrados o su entorno con una cantidad biológicamente eficaz de cualquiera de las composiciones mencionadas anteriormente en donde el entorno es una planta.

Las composiciones de la invención también se pueden utilizar en un método para controlar una plaga de invertebrados que comprende poner en contacto la plaga de invertebrados o su entorno con una cantidad biológicamente eficaz de cualquiera de las composiciones mencionadas anteriormente en donde el entorno es un animal.

20 Esta invención también proporciona un método para controlar una plaga de invertebrados que comprende poner en contacto la plaga de invertebrados o su entorno con una cantidad biológicamente eficaz de cualquiera de las composiciones mencionadas anteriormente en donde el entorno es una semilla.

25 Esta invención también proporciona un método para proteger una semilla de una plaga de invertebrados que comprende poner en contacto la semilla con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido, o una sal del mismo (p. ej., como una composición descrita en la presente memoria). Esta invención también se refiere a la semilla tratada.

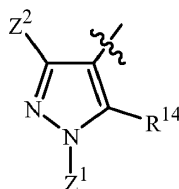
Esta invención también se dirige a compuestos de Fórmula 1p (incluidos todos los estereoisómeros), *N*-óxidos y sales de los mismos:



1p

30 en donde

Q es



Q-1 ;

R^{1a} es H, ciano, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₇, haloalquilo C₁-C₆, C(O)OH, C(O)R^{5a}, C(O)OR^{6a} o C(O)NR^{7a}R^{8a};

35 R^{1b} es H o alquilo C₁-C₆;

R^{2a} y R^{2c} son cada uno independientemente H, halógeno, ciano, C(X)R⁵, C(O)OR⁶, C(X)NR⁷R⁸, OR¹² o S(O)_nR¹¹; o alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₇, cicloalquil(C₄-C₈)alquilo o cicloalquenilo C₃-C₆, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente

seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, OR^{12a} , alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 y $S(O)_nR^{11a}$;

5 R^{2b} y R^{2d} son cada uno independientemente H, halógeno, ciano, nitro, $C(X)R^5$, $C(O)OR^6$, $C(X)NR^7R^8$, NR^9R^{10} , OR^{12} , $S(O)_nR^{11}$ o $SO_2NR^9R^{10}$; o alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 , cicloalquil(C_4-C_8)alquilo o cicloalquenilo C_3-C_6 , cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, OR^{12a} , alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 y $S(O)_nR^{11a}$; o fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^4 ;

J^1 es $-C(R^{3a}R^{3b})-$;

10 J^2 es $-C(R^{3c}R^{3d})-$;

M es $-C(R^{3e})(A)-$;

15 A es ciano, nitro, $C(X)R^5$, $C(O)OR^6$, $C(X)NR^7R^8$, $C(X)NR^{7b}R^8$, NR^9R^{10} , $S(O)_nR^{11}$ o $SO_2NR^9R^{10}$; o alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 , cicloalquil(C_4-C_8)alquilo o cicloalquenilo C_3-C_6 , cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , $C(O)R^{5a}$, $C(O)OR^{6a}$, $C(O)NR^{7a}R^{8a}$, $NR^{9a}R^{10a}$, OR^{12a} y $S(O)_nR^{11a}$; o fenilo, un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, o un sistema anular heteroaromático de 7 a 11 miembros, cada anillo o sistema anular no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^4 ; siempre que cuando A es $C(X)NR^7R^8$ y X es O, ni R^7 ni R^8 son H;

20 R^{3a} y R^{3c} son cada uno independientemente H, halógeno, ciano, $C(X)R^5$, $C(O)OR^6$, $C(X)NR^7R^8$, OR^{12} o $S(O)_nR^{11}$; o alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 , cicloalquil(C_4-C_8)alquilo o cicloalquenilo C_3-C_6 , cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, OR^{12a} , alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 y $S(O)_nR^{11a}$;

25 R^{3b} y R^{3d} son cada uno independientemente H, halógeno, ciano, nitro, $C(X)R^5$, $C(O)OR^6$, $C(X)NR^7R^8$, NR^9R^{10} , OR^{12} , $S(O)_nR^{11}$ o $SO_2NR^9R^{10}$; o alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 , cicloalquil(C_4-C_8)alquilo o cicloalquenilo C_3-C_6 , cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, OR^{12a} , alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 y $S(O)_nR^{11a}$; o fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^4 ;

30 R^{3e} es H, halógeno, ciano, nitro, $C(X)R^5$, $C(O)OR^6$, $C(X)NR^7R^8$, NR^9R^{10} , OR^{12} , NR^9R^{10} , $S(O)_nR^{11}$ o $SO_2NR^9R^{10}$; o alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 , cicloalquil(C_4-C_8)alquilo o cicloalquenilo C_3-C_6 , cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, OR^{12a} , alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 y $S(O)_nR^{11a}$; o fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^4 ;

35 o cuando dos sustituyentes cualesquiera independientemente seleccionados del grupo que consiste en R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} , R^{2d} , R^{3a} , R^{3b} , R^{3c} , R^{3d} y R^{3e} son alquilo C_1-C_4 , dichos dos sustituyentes se pueden tomar juntos para formar un anillo;

Z^1 es fenilo sustituido con 1 a 4 R^4 ; o Z^1 es un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^4 ;

40 Z^2 es fenilo sustituido con 1 a 4 R^4 ; o Z^2 es un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^4 ;

45 cada R^4 es independientemente halógeno, ciano, nitro, $C(X)R^5$, $C(O)OR^6$, $C(X)NR^7R^8$, NR^9R^{10} , OR^{12} , $S(O)_nR^{11}$ o $SO_2NR^9R^{10}$; o alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 o cicloalquil(C_4-C_8)alquilo, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, OR^{12a} , alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 y $S(O)_nR^{11a}$;

50 cada R^5 es independientemente H; o alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 o cicloalquil(C_4-C_8)alquilo, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, OR^{12a} , alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 y $S(O)_nR^{11a}$; o fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^{13} ;

cada R^{5a} es independientemente alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 ;

- 5 cada R^6 es independientemente alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 o cicloalquil(C_4-C_8)alquilo, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, OR^{12a} , alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 y $S(O)_nR^{11a}$; o fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^{13} ;
- cada R^{6a} es independientemente alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 ;
- 10 cada R^7 y R^8 es independientemente H; o alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 o cicloalquil(C_4-C_8)alquilo, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, OR^{12a} , alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 y $S(O)_nR^{11a}$; o fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^{13} ;
- cada R^{7a} y R^{8a} es independientemente H, alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 ;
- cada R^{7b} es independientemente $N(R^{7a})_2$, OH u OR^{12a} ;
- 15 cada R^9 y R^{10} es independientemente H, $C(X)R^5$, $C(O)OR^6$ o $C(X)NR^7R^8$; o alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 o cicloalquil(C_4-C_8)alquilo, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, OR^{12a} , alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 y $S(O)_nR^{11a}$; o fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^{13} ;
- cada R^{9a} y R^{10a} es independientemente H, $C(X)R^{5a}$, $C(O)OR^{6a}$, $C(X)NR^{7a}R^{8a}$, alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 ;
- 20 cada R^{11} es independientemente alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 o cicloalquil(C_4-C_8)alquilo, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, OR^{12a} , alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 y $S(O)_nR^{11a}$; o fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^{13} ;
- 25 cada R^{11a} es independientemente alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 ;
- cada R^{12} es independientemente H; o alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 o cicloalquil(C_4-C_8)alquilo, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, OR^{12a} , alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 y $S(O)_nR^{11a}$; o fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^{13} ;
- 30 cada R^{12a} es independientemente H, alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 ;
- 35 cada R^{13} es independientemente halógeno, ciano, nitro, $C(X)R^{5a}$, $C(O)OR^{6a}$, $C(X)NR^{7a}R^{8a}$, $NR^{9a}R^{10a}$, OR^{12a} , $S(O)_nR^{11a}$ o $SO_2NR^{9a}R^{10a}$, o alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 o cicloalquil(C_4-C_8)alquilo, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, OR^{12a} , alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 y $S(O)_nR^{11a}$;
- R^{14} es H;
- cada X es independientemente O o S;
- y cada n es independientemente 0, 1 o 2.
- 40 Una realización de esta invención también proporciona una composición que comprende un compuesto de Fórmula 1p, un *N*-óxido, o una sal del mismo, y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos. En una realización, esta invención también proporciona una composición para controlar una plaga de invertebrados que comprende un compuesto de Fórmula 1p, un *N*-óxido, o una sal del mismo, y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos, comprendiendo dicha composición adicionalmente al menos un compuesto o
- 45 agente biológicamente activos adicionales.
- Una realización de esta invención proporciona un método para controlar una plaga de invertebrados que comprende poner en contacto la plaga de invertebrados o su entorno con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula 1p, un *N*-óxido, o una sal del mismo (p. ej., como una composición descrita en la presente memoria), con
- 50 la condición de que el método no sea un método de tratamiento del cuerpo humano o animal mediante terapia. Esta invención también se refiere a tal método en donde la plaga de invertebrados o su entorno se pone en contacto con una composición que comprende una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula 1p, un *N*-óxido, o

una sal del mismo, y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos, comprendiendo dicha composición opcionalmente adicionalmente una cantidad biológicamente eficaz de al menos un compuesto o agente biológicamente activos adicionales, con la condición de que el método no sea un método de tratamiento del cuerpo humano o animal mediante terapia.

5 Detalles de la invención

Según se utiliza en la presente memoria, los términos "comprende", "que comprende", "incluye", "que incluye", "tiene", "que tiene", "contiene", "que contiene", "caracterizado por" o cualquier otra variación de los mismos, están destinados a cubrir una inclusión no exclusiva, sujeta a cualquier limitación explícitamente indicada. Por ejemplo, una composición, mezcla, procedimiento o método que comprende una lista de elementos no se limita necesariamente a esos elementos, sino que puede incluir otros elementos no enumerados expresamente o inherentes a tal composición, mezcla, procedimiento o método.

La frase de transición "que consiste en" excluye cualquier elemento, etapa o ingrediente no especificado. Si en la reivindicación, se restringiera la reivindicación a la inclusión de materiales distintos a los citados, a excepción de las impurezas asociadas habitualmente con el mismo. Cuando la frase "que consiste en" aparece en una cláusula del cuerpo de una reivindicación, en lugar de seguir inmediatamente el preámbulo, ésta limita solamente el elemento establecido en esa cláusula; otros elementos no están excluidos de la reivindicación en su totalidad.

La frase de transición "que consiste esencialmente en" se utiliza para definir una composición o método que incluye materiales, etapas, características, componentes o elementos, además de los literalmente descritos, siempre que estos materiales, etapas, características, componentes o elementos adicionales no afecten materialmente a las características básicas y novedosas de la invención reivindicada. El término "que consiste esencialmente en" ocupa un término medio entre "que comprende" y "que consiste en".

Cuando los solicitantes han definido una invención o una parte de ella con un término abierto como "que comprende", debe entenderse fácilmente que se pretende que (a menos que se indique lo contrario) la descripción también describe semejante dicha invención utilizando los términos "que consisten esencialmente de" o "que consiste en".

Adicionalmente, a menos que se indique expresamente lo contrario, "o" se refiere a un "o" inclusivo y no a un "o" exclusivo. Por ejemplo, una condición A o B se satisface con uno cualquiera de los siguientes: A es verdadera (o está presente) y B es falsa (o no está presente), A es falsa (o no está presente) y B es verdadera (o está presente), y tanto A como B son verdaderos (o están presentes).

Asimismo, se pretende que los artículos indefinidos "un", "una" y "uno" que preceden a un elemento o componente de la invención no sean restrictivos con respecto al número de casos (es decir, apariciones) del elemento o componente. Por lo tanto, se deberá considerar que "un", "una" o "uno" incluyen uno o al menos uno, y la forma en singular del elemento o componente también incluye el plural, a menos que el número esté obviamente destinado a ser singular.

Como se menciona en esta descripción, el término "plaga de invertebrados" incluye artrópodos, gasterópodos y nematodos de importancia económica como plagas. El término "artrópodo" incluye insectos, ácaros, arañas, escorpiones, ciempiés, milpiés, cochinillas de la humedad y sínfilos. El término "gasterópodo" incluye caracoles, babosas y otros Stylommatophora. El término "nematodo" se refiere a un organismo vivo del Filum Nematoda. El término "helmintos" incluye gusanos redondos, parásitos del corazón, nematodos fitófagos (Nematoda), trematodos (Tematoda), Acanthocephala y tenias (Cestoda).

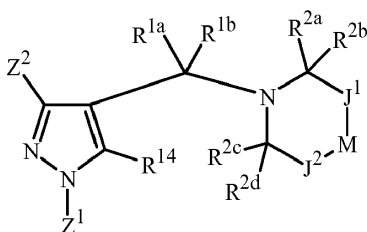
En el contexto de esta descripción, "control de plagas de invertebrados" significa inhibición del desarrollo de plagas de invertebrados (que incluye mortalidad, reducción de alimentación, y/o interrupción de apareamiento), y las expresiones relacionadas se definen análogamente.

El término "agronómico" se refiere a la producción de cultivos de campo como alimentos y fibra e incluye el crecimiento de maíz, soja y otras legumbres, arroz, cereales (p. ej., Trigo, avena, cebada, centeno, arroz, maíz), hortalizas de hoja (p. ej., lechuga, repollo y otros cultivos de crucíferas), hortalizas de fruto (p. ej., tomates, pimientos, berenjenas, crucíferas y cucurbitáceas), patatas, batatas, uvas, algodón, árboles frutales (p. ej., pomos, de hueso y cítricos), frutas pequeñas (bayas, cerezas) y otros cultivos especiales (p. ej., canola, girasol, aceitunas).

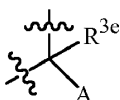
El término "no agronómico" se refiere a cultivos que no son de campo, tales como cultivos hortícolas (p. ej., plantas de invernadero, vivero u ornamentales no cultivadas en el campo), estructuras residenciales, agrícolas, comerciales e industriales, césped (p. ej., granjas de césped, pastos, campo de golf, césped, campos deportivos, etc.), productos de madera, productos almacenados, gestión agroforestal y de la vegetación, aplicaciones de salud pública (es decir, humana) y salud animal (por ejemplo, animales domésticos tales como mascotas, ganado y aves de corral, animales no domesticados tales como fauna silvestre).

Una línea ondulada en un fragmento de estructura denota el punto de unión del fragmento al resto de la molécula. Por ejemplo, la variable Q en la Fórmula 1 se define como Q-1, y la línea ondulada que atraviesa el enlace en la

posición 4 del pirazol Q-1 significa que el pirazol Q-1 está unido al resto de la estructura de Fórmula 1 en dicha posición 4, como se muestra a continuación.



5 La variable M se define como $-C(R^{3e})(A)-$, y esto es equivalente a un átomo de carbono miembro de un anillo sustituido con un R^{3e} y una A como se muestra a continuación.



10 En las lecturas anteriores, el término "alquilo", utilizado solo o en palabras compuestas tales como "haloalquilo" incluye alquilo 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 radicales compuestos de múltiples enlaces triples tales como 2,5-hexadiinilo.

15 "Cicloalquilo" incluye, por ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo. El término "cicloalquilalquilo" indica la sustitución de cicloalquilo en un radical alquilo. Los ejemplos de "cicloalquilalquilo" incluyen ciclopropilmetilo, ciclopentiletilo y otros radicales cicloalquilo unidos a grupos alquilo de cadena lineal o ramificada. "Cicloalquenilo" incluye grupos tales como ciclopentenilo y ciclohexenilo, así como también grupos con más de un doble enlace tal como 1,3- y 1,4-ciclohexadienilo. La fórmula $C(O)CH(CH_2)_2$ representa un grupo carbonilo sustituido con un grupo ciclopropilo.

20 El término "halógeno", solo o en palabras compuestas tales como "haloalquilo", o cuando se utiliza en descripciones tales como "alquilo sustituido con halógeno" incluye flúor, cloro, bromo o yodo. Adicionalmente, cuando se utiliza en palabras compuestas tales como "haloalquilo", o cuando se utiliza 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 CF_3 , CH_2Cl , CH_2CF_3 y CCl_2CF_3 .

25 Las abreviaturas químicas S(O) y S(=O) según se utilizan en la presente memoria representan una fracción sulfinilo. Las abreviaturas químicas SO_2 , $S(O)_2$ y $S(=O)_2$ según se utilizan en la presente memoria representan un radical sulfonilo. Las abreviaturas químicas C(O) y C(=O) según se utilizan en la presente memoria representan un radical carbonilo. Las abreviaturas químicas CO_2 , $C(O)O$ y $C(=O)O$ según se utilizan en la presente memoria representan un radical oxicarbonilo. "CHO" significa formilo.

Los compuestos de Fórmula 1p son un subconjunto de los compuestos de Fórmula 1.

El número total de átomos de carbono en un grupo sustituyente está indicado por el prefijo "C_i-C_j" en donde i y j son números del 1 al 8. Por ejemplo, alquilo C₁-C₄ designa de metilo a butilo.

35 Cuando un grupo contiene un sustituyente que puede ser hidrógeno, por ejemplo, R^{1a} o R^{1b} , en ese caso cuando este sustituyente se toma como hidrógeno, se reconoce que esto es equivalente a que dicho grupo no esté sustituido. Cuando se muestra que un grupo variable está opcionalmente unido a una posición, por ejemplo (R^v)_r en U-36 de la figura 1 en donde r puede ser 0, en ese caso el hidrógeno puede estar en la posición incluso si no se cita en la definición del grupo variable. Cuando se dice que una o más posiciones en un grupo son "no sustituidas" o "sin sustituir", en ese caso los átomos de hidrógeno se unen para tomar cualquier valencia libre.

40 A menos que se indique lo contrario, un "anillo" o "sistema anular" como un componente de la Fórmula 1 es carbocíclico o heterocíclico. El término "sistema anular" denota dos o más anillos conectados. El término "sistema anular bicíclico" denota un sistema anular que consiste en dos anillos que comparten dos o más átomos comunes.

45 Un anillo o un sistema anular bicíclico puede ser parte de un sistema anular extendido que contiene más de dos anillos en donde los sustituyentes del anillo o el sistema anular bicíclico se toman juntos para formar los anillos adicionales, que pueden estar en relaciones bicíclicas con otros anillos en el sistema anular extendido.

El término "aromático" indica que cada uno de los átomos del anillo está esencialmente en el mismo plano y tiene un orbital p perpendicular al plano del anillo, y que $(4n + 2) \pi$ electrones, en donde n es un número entero positivo, están asociados con el anillo o sistema anular para cumplir con la regla de Hückel.

5 Los términos "anillo heterocíclico" o "heterociclo" denotan un anillo en el que al menos uno de los átomos que forman la cadena principal del anillo es distinto de carbono. A menos que se indique lo contrario, un anillo heterocíclico puede ser un anillo saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado. "Anillo heterocíclico saturado" se refiere a un anillo heterocíclico que contiene solo enlaces simples entre los miembros del anillo. "Anillo heterocíclico parcialmente saturado" se refiere a un anillo heterocíclico que contiene al menos un doble enlace pero que no es aromático. El término "anillo heteroaromático" denota un anillo aromático completamente insaturado en el que al menos un átomo que forma la cadena principal del anillo no es carbono. Normalmente, un anillo heteroaromático contiene no más de 4 nitrógenos, no más de 1 oxígeno y no más de 1 azufre. A menos que se indique lo contrario, los anillos heteroaromáticos se pueden unir a través de cualquier carbono o nitrógeno disponible reemplazando un hidrógeno en dicho carbono o nitrógeno. El término "sistema anular bicíclico heteroaromático" denota un sistema anular que consiste en dos anillos fusionados, en el que al menos uno de los dos anillos es un anillo heteroaromático como se definió anteriormente.

Cuando un radical está opcionalmente sustituido con los sustituyentes enumerados con el número de sustituyentes indicados (por ejemplo, "hasta 5"), en ese caso el radical puede estar no sustituido o sustituido con un número de sustituyentes que oscilan hasta el número alto establecido (p. ej., "5"), y los sustituyentes unidos se seleccionan independientemente entre los sustituyentes enumerados.

20 Cuando un sustituyente es un anillo o sistema anular, se puede unir al resto de la Fórmula 1 a través de cualquier miembro del anillo disponible, a menos que se describa lo contrario.

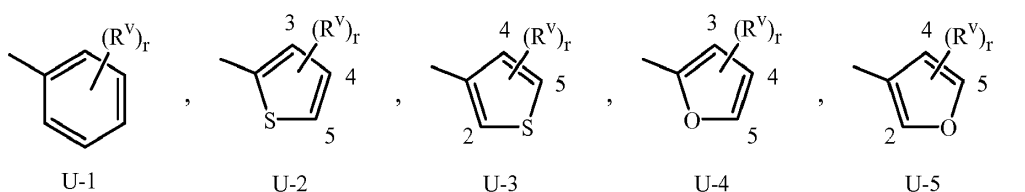
El término "no sustituido" en relación con un grupo tal como un anillo o sistema anular significa que el grupo no tiene ningún sustituyente distinto de sus una o más uniones al resto de la Fórmula. 1.

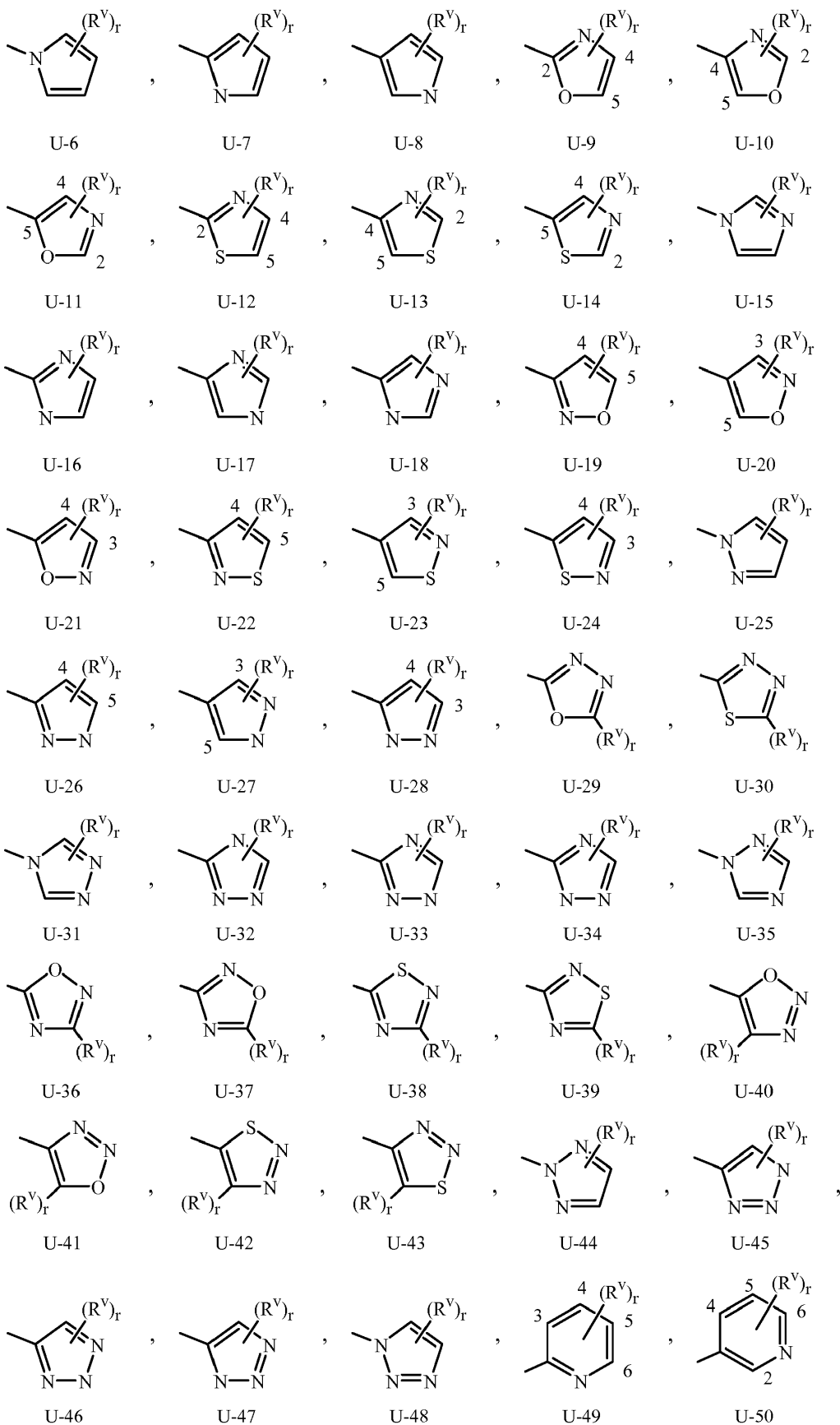
25 La frase "fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo no sustituido o sustituido con 1 a 3 $R^{4''}$ " significa que cada anillo de fenilo no está sustituido o está sustituido con 1 a 3 R^4 , cada anillo heteroaromático de 5 miembros no está sustituido o está sustituido con 1 a 3 R^4 , y cada anillo heteroaromático de 6 miembros no está sustituido o sustituido con 1 a 3 R^4 .

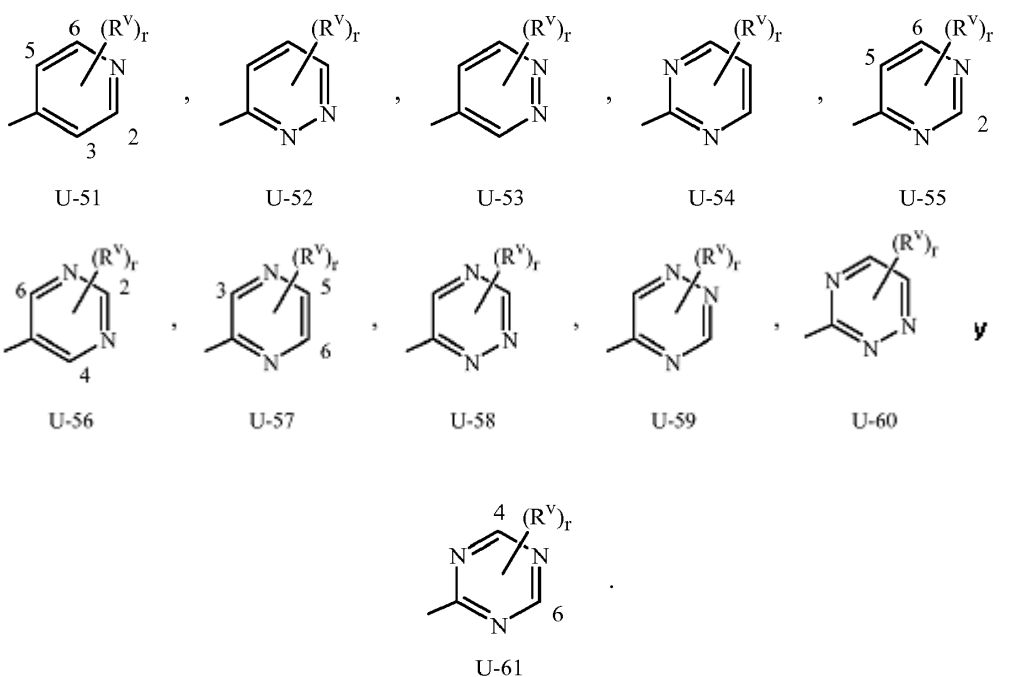
30 Cuando el número de sustituyentes opcionales no está restringido por una limitación expresada (por ejemplo, la frase "no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente seleccionado independientemente entre"), se entiende que significa que el número de sustituyentes opcionales puede variar desde 0 hasta el número de posiciones disponibles. Un experto en la técnica apreciará que mientras que algunos sustituyentes tales como halógeno pueden estar presentes en cada posición disponible (por ejemplo, el sustituyente C_2F_5 es un grupo alquilo C_2 sustituido con el número máximo de 5 átomos de flúor), factores prácticos tales como el coste y la accesibilidad sintética pueden limitar el número de apariciones de otros sustituyentes. Estas limitaciones son parte del conocimiento sintético general conocido por los expertos en la técnica. Son de destacar realizaciones en donde, en ausencia de una limitación expresada del número de sustituyentes opcionales, el número de sustituyentes opcionales es de hasta 3 (es decir, 0, 1, 2 o 3) si son alojados por el número de posiciones disponibles.

40 Como se indicó anteriormente, los sustituyentes tales como A , Z^1 o Z^2 pueden ser (entre otros) un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de un grupo de sustituyentes como se define en el Compendio de la Invención. Los ejemplos de un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes incluyen los anillos U-2 a U-61 ilustrados en la figura 1 en donde R^v es cualquier sustituyente como se define en el Compendio de la Invención (p. ej., para R^1) y r es un número entero de 0 a 5, limitado por el número de posiciones disponibles en cada grupo U. Como U-29, U-30, U-36, U-37, U-38, U-39, U-40, U-41, U-42 y U-43 tienen solo una posición disponible, para estos grupos U r está limitado a los números enteros 0 o 1, y r es 0 significa que el grupo U no está sustituido y que se encuentra presente un hidrógeno en la posición indicada por $(R^v)_r$.

Figura 1



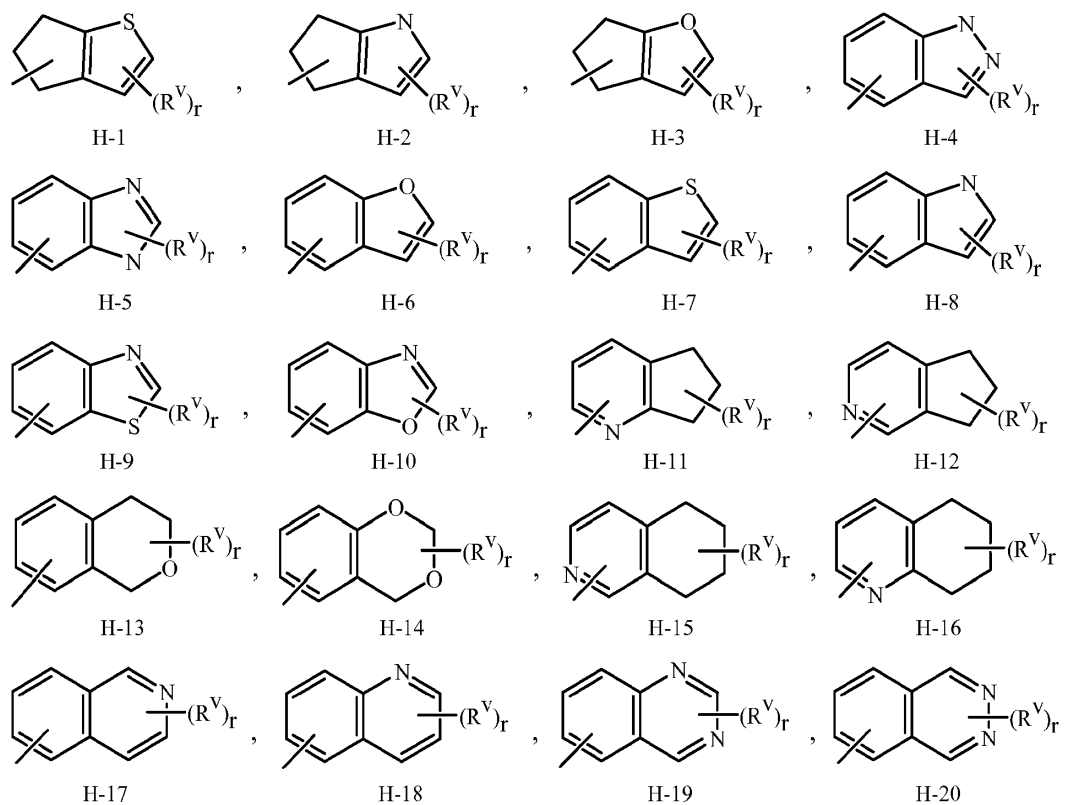




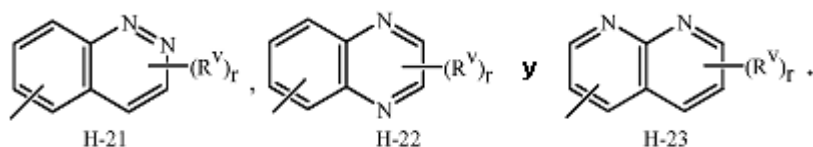
5 Como se indicó anteriormente, los sustituyentes tales como A pueden ser (entre otros) un sistema anular bicíclico heteroaromático de 7, 8, 9, 10 o 11 miembros opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes seleccionados de un grupo de sustituyentes como se define en el Compendio de la Invención. Los ejemplos de un sistema anular bicíclico heteroaromático de 8, 9 o 10 miembros opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes incluyen los sistemas anulares H-1 a H-23 ilustrados en el Figura 2 donde R^V es cualquier sustituyente definido en el Compendio de la Invención (p. ej., para A) y r es un número entero de 0 a 3, limitado por el número de posiciones disponibles en cada grupo H.

10

Figura 2



15



Aunque los grupos R^V se muestran en las estructuras U-1 a U-61 y H-1 a H-23, se observa que no necesitan estar presentes ya que son sustituyentes opcionales. Los átomos de nitrógeno que requieren sustitución para llenar su valencia se sustituyen por H o R^V . obsérvese que cuando el punto de unión entre $(R^V)_r$ y el grupo U o H se ilustra como flotante, $(R^V)_r$ se puede unir a cualquier átomo de carbono o átomo de nitrógeno disponibles del grupo U o H. Obsérvese que cuando el punto de unión en el grupo U o H se ilustra como flotante, el grupo U o H puede unirse al resto de la Fórmula 1 a través de cualquier carbono o nitrógeno disponible del grupo U o H mediante la sustitución de un átomo de hidrógeno.

Se conoce en la técnica una amplia variedad de métodos sintéticos para permitir la preparación de anillos y sistemas anulares heterocíclicos aromáticos y no aromáticos; para revisiones extensas véase el conjunto de ocho volúmenes de Comprehensive Heterocyclic Chemistry, R. R. Katritzky y C. W. Rees redactores jefe, Pergamon Press, Oxford, 1984 y el conjunto de doce volúmenes de Comprehensive Heterocyclic Chemistry II, A. R. Katritzky, C. W. Rees y E. F. V. Scriven redactores jefe, Pergamon Press, Oxford, 1996.

Los compuestos de esta invención pueden existir en forma de uno o más estereoisómeros. Los diversos estereoisómeros incluyen enantiómeros, diastereómeros, atropisómeros e isómeros geométricos. Un experto en la técnica apreciará que un estereoisómero puede ser más activo y/o puede exhibir efectos beneficiosos cuando se enriquece con respecto a los otros estereoisómeros o cuando se separa de los otros estereoisómeros. Adicionalmente, el experto en la técnica sabe cómo separar, enriquecer y/o preparar selectivamente dichos estereoisómeros. Los compuestos de la invención pueden estar presentes como una mezcla de estereoisómeros, estereoisómeros individuales o como una forma ópticamente activa.

Los compuestos de esta invención pueden existir en forma de uno o más isómeros conformacionales debido a la rotación de enlace restringida causada por el impedimento estérico. Esta invención comprende mezclas de isómeros conformacionales. Además, esta invención incluye compuestos que están enriquecidos en un conformero con respecto a otros.

Los compuestos seleccionados de Fórmula 1 (incluidos todos los estereoisómeros, *N*-óxidos, y sus sales) normalmente existen en más de una forma, y la Fórmula 1 por lo tanto, incluye todas las formas cristalinas y no cristalinas de los compuestos que representa la Fórmula 1. Las formas no cristalinas incluyen realizaciones que son sólidas tales como ceras y gomas, así como realizaciones que son líquidas tales como soluciones y masas fundidas. Las formas cristalinas incluyen realizaciones que representan esencialmente un único tipo de cristal y realizaciones que representan una mezcla de formas polimorfas (es decir, diferentes tipos cristalinos). El término "forma polimorfa" se refiere a una forma cristalina particular de un compuesto químico que puede cristalizar en diferentes formas cristalinas, teniendo estas formas diferentes disposiciones y/o conformaciones de las moléculas en la red cristalina. Aunque las formas polimorfas pueden tener la misma composición química, también pueden diferir en su composición debido a la presencia o ausencia de agua cristalizada u otras moléculas, que pueden estar débilmente o fuertemente unidas en la red cristalina. Las formas polimorfas pueden diferir en propiedades químicas, físicas y biológicas tales como la forma cristalina, la densidad, la dureza, el color, la estabilidad química, el punto de fusión, la higroscopicidad, la suspensibilidad, la velocidad de disolución y la disponibilidad biológica. Un experto en la técnica apreciará que una forma polimorfa de un compuesto representado por la Fórmula 1 puede exhibir efectos beneficiosos (p. ej., idoneidad para la preparación de formulaciones útiles, rendimiento biológico mejorado) con respecto a otra forma polimorfa o mezcla de formas polimorfas del mismo compuesto representado por la Fórmula 1. La preparación y aislamiento de una forma polimorfa particular de un compuesto representado por la Fórmula 1 se pueden lograr mediante métodos conocidos por los expertos en la técnica que incluyen, por ejemplo, la cristalización utilizando disolventes y temperaturas seleccionados.

Un experto en la técnica apreciará que no todos los heterociclos que contienen nitrógeno pueden formar *N*-óxidos ya que el nitrógeno requiere un par solitario disponible para oxidación al óxido; un experto en la técnica reconocerá aquellos heterociclos que contienen nitrógeno que pueden formar *N*-óxidos. Un experto en la técnica también reconocerá que las aminas terciarias pueden formar *N*-óxidos. Los métodos sintéticos para la preparación de *N*-óxidos de heterociclos y aminas terciarias son muy bien conocidos por un experto en la técnica, que incluyen la oxidación de heterociclos y aminas terciarias con peroxiacidos tales como ácido peracético y ácido 3-cloroperbenzoico (MCPBA), peróxido de hidrógeno, hidroperóxidos de alquilo tales como hidroperóxido de *t*-butilo, perborato de sodio y dioxiranos tales como dimetildioxirano. Estos métodos para la preparación de *n* óxidos han sido ampliamente descritos y revisados en la bibliografía, véase por ejemplo: T. L. Gilchrist en Comprehensive Organic Synthesis, vol. 7, pág. 748-750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press; M. Tisler y B. Stanovnik en Comprehensive Heterocyclic Chemistry, vol. 3, pág. 18-20, A. J. Boulton y A. McKillop, Eds., Pergamon Press; M. R. Grimmett y B. R. T. Keene en Advances in Heterocyclic Chemistry, vol. 43, pág. 149-161, A. R. Katritzky, Ed., Academic Press; M. Tisler y B. Stanovnik en Advances in Heterocyclic Chemistry, vol. 9, pág. 285-291, A. R. Katritzky y A. J. Boulton,

Eds., Academic Press; y G. W. H. Cheeseman y E. S. G. Werstiuk in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 22, pág. 390-392, A. R. Katritzky y A. J. Boulton, Eds., Academic Press.

5 Un experto en la técnica reconoce que debido a que en el entorno y bajo condiciones fisiológicas las sales de los compuestos químicos están en equilibrio con sus correspondientes formas no salinas, las sales comparten la utilidad biológica de las formas no salinas. Por lo tanto, una amplia variedad de sales de los compuestos de Fórmula 1 son útiles para el control de plagas de invertebrados. Las sales de los compuestos de Fórmula 1 incluyen sales de adición de ácido con ácidos inorgánicos u orgánicos tales como ácidos bromhídrico, clorhídrico, nítrico, fosfórico, sulfúrico, acético, butírico, fumárico, láctico, maleico, malónico, oxálico, propiónico, salicílico, tartárico, 4-toluenosulfónico o valérico. Cuando un compuesto de Fórmula 1 contiene un radical ácido tal como un ácido carboxílico o fenol, las sales también incluyen aquellas formadas con bases orgánicas o inorgánicas tales como piridina, trietilamina o amoníaco, o amidas, hidruros, hidróxidos o carbonatos de sodio, potasio, litio, calcio, magnesio o bario. Por consiguiente, la presente invención se refiere a compuestos seleccionados de Fórmula 1, *N*-óxidos, y sales de los mismos.

15 Las realizaciones de la presente invención como se describen en el Compendio de la Invención incluyen las descritas a continuación. En las siguientes Realizaciones, la Fórmula 1 incluye estereoisómeros, *N*-óxidos, y sus sales, y la referencia a "un compuesto de Fórmula 1" incluye las definiciones de los sustituyentes especificados en el Compendio de la Invención a menos que se defina adicionalmente en las Realizaciones.

20 Realización 1. Un compuesto de Fórmula 1, o una composición que comprende un compuesto de Fórmula 1, en donde R^{1a} es H, ciano, alquilo C_1-C_6 , Cicloalquilo C_3-C_6 , Haloalquilo C_1-C_6 , $C(O)OH$, $C(O)R^{5a}$, $C(O)OR^{6a}$ o $C(O)NR^{7a}R^{8a}$.

Realización 1a. Un compuesto o composición de la Realización 1 en donde R^{1a} es H, ciano o alquilo C_1-C_6 .

Realización 1b. Un compuesto o composición de la Realización 1a en donde R^{1a} es H, ciano o metilo.

Realización 1c. Un compuesto o composición de la Realización 1b en donde R^{1a} es H.

25 Realización 2. Un compuesto de Fórmula 1, o una composición que comprende un compuesto de Fórmula 1, o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 1c, en donde R^{1b} es H o metilo

Realización 2a. Un compuesto o composición de la Realización 2 en donde R^{1b} es H.

Realización 3. Un compuesto de Fórmula 1, o una composición que comprende un compuesto de Fórmula 1, en donde R^{1a} y R^{1b} son H.

30 Realización 4. Un compuesto de Fórmula 1, o una composición que comprende un compuesto de Fórmula 1, o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 3 en donde R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} y R^{2d} son cada uno independientemente ciano, alquilo C_1-C_6 , $C(O)OR^6$, $NHC(O)R^{5a}$ o $NHC(O)OR^{6a}$.

Realización 4a. Un compuesto de fórmula 1, o una composición que comprende un compuesto de Fórmula 1, o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 3 en donde R^{2a} y R^{2c} son H; y R^{2b} y R^{2d} son cada uno independientemente H, alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 .

35 Realización 4b. Un compuesto o composición de la Realización 4 en donde R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} y R^{2d} son cada uno H.

Realización 6. Un compuesto de Fórmula 1, o una composición que comprende un compuesto de Fórmula 1, o cualquiera de las Realizaciones 1 a 4b en donde R^{3a} , R^{3b} , R^{3c} y R^{3d} son cada uno independientemente H, halógeno o alquilo C_1-C_6 .

40 Realización 6a. Un compuesto o composición de la Realización 6 en donde R^{3a} , R^{3b} , R^{3c} y R^{3d} son cada uno independientemente H, F, Cl, Br o metilo.

Realización 6b. Un compuesto o composición de la Realización 6a en donde R^{3a} y R^{3b} son H.

Realización 6c. Un compuesto o composición de la Realización 6a en donde R^{3a} , R^{3b} , R^{3c} y R^{3d} son H.

45 Realización 8. Un compuesto de Fórmula 1, o una composición que comprende un compuesto de Fórmula 1, o cualquiera de las Realizaciones 1 a 6c en donde A es ciano, $C(X)R^5$, $C(O)OR^6$, $C(X)NR^7R^8$, $C(X)NR^{7b}R^8$, NR^9R^{10} , $S(O)_nR^{11}$ o $SO_2NR^9R^{10}$; o alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 , cicloalquil(C_4-C_8)alquilo o cicloalqueno C_3-C_6 , cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente seleccionado independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , $C(O)R^{5a}$, $C(O)OR^{6a}$, $C(O)NR^{7a}R^{8a}$, $NR^{9a}R^{10a}$ y $S(O)_nR^{11a}$; o fenilo, un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros o un sistema anular heteroaromático de 7 a 11 miembros, cada anillo o sistema anular no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^4 ; siempre que cuando A sea $NHC(O)CH_3$ y R^{3e} sea H, en ese caso Z^1 es distinto de 2-fluorofenilo, 3-metilfenilo, 4-metilfenilo o 2,5-dimetilfenilo; o R^{3e} y A pueden tomarse junto con el átomo de carbono al que están unidos para formar un anillo de 3 a 7 miembros que contiene miembros del anillo seleccionados entre átomos de carbono y hasta

- 2 heteroátomos seleccionados independientemente entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y hasta a 2 átomos de nitrógeno, en donde hasta 2 átomos de carbono miembros del anillo se seleccionan independientemente de C(=O) y C(=S) y el átomo de azufre miembro del anillo se selecciona entre S, S(O) o S(O)₂, estando dicho anillo no sustituido o sustituido con hasta 4 sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano y alquilo C₁-C₄; siempre que R^{3e} y A sean cada uno distinto de N(CH₃)₂.
- 5
- Realización 8a. Un compuesto de fórmula 1, o una composición que comprende un compuesto de Fórmula 1, o cualquiera de las Realizaciones 1 a 6c en donde A es ciano, C(X)R⁵, C(O)OR⁶, C(X)NR⁷R⁸ o NR⁹R¹⁰; o alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₇ o cicloalquil(C₄-C₈)alquilo, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente seleccionado independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, OR^{12a}, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, C(O)R^{5a}, C(O)OR^{6a}, C(O)NR^{7a}R^{8a} y S(O)_nR^{11a}; o fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo no sustituido o sustituido con 1 a 3 R⁴.
- 10
- Realización 8b. Un compuesto o composición de la Realización 8a en donde A es ciano, C(X)R⁵, C(O)OR⁶, C(X)NR⁷R⁸ o NR⁹R¹⁰; o fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo no sustituido o sustituido con 1 a 3 R⁴.
- 15
- Realización 8c. Un compuesto o composición de la Realización 8a en donde A es ciano, C(X)R⁵, C(O)OR⁶ o NR⁹R¹⁰; o fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo no sustituido o sustituido con 1 a 3 R⁴.
- Realización 8d. Un compuesto o composición de la Realización 8c en donde A es ciano, C(X)R⁵, C(O)OR⁶ o NR⁹R¹⁰.
- Realización 8e. Un compuesto o composición de la Realización 8d en donde A es ciano, C(O)OR^{6a}, NHC(O)R^{5a} o NHC(O)OR^{6a}.
- 20
- Realización 8f. Un compuesto o composición de la Realización 8c en donde A es ciano, C(O)OR^{6a} o NHC(O)R^{5a}; o un anillo heteroaromático de 5 miembros, no sustituido o sustituido con 1 a 3 R⁴.
- Realización 8g. Un compuesto o composición de la Realización 8c en donde A es NHC(O)R^{5a}; o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, no sustituido o sustituido con 1 a 3 R⁴.
- 25
- Realización 8h. Un compuesto o composición de la Realización 8c en donde A es ciano, NHC(O)R^{5a} o 1,3,4-oxadiazol-2-ilo.
- Realización 9. Un compuesto de Fórmula 1, o una composición que comprende un compuesto de Fórmula 1, o cualquiera de las Realizaciones 1 a 8h en donde R^{3e} es H, halógeno, ciano, nitro, C(X)R⁵, C(O)OR⁶, C(X)NR⁷R⁸, NR⁹R¹⁰, S(O)_nR¹¹ SO₂NR⁹R¹⁰; o alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₇, cicloalquil(C₄-C₈)alquilo o cicloalqueno C₃-C₆, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente seleccionado independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, OR^{12a}, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ y S(O)_nR^{11a}; o fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo no sustituido o sustituido con 1 a 3 R⁴.
- 30
- Realización 9a. Un compuesto o composición de la Realización 9 en donde R^{3e} es H, halógeno, C(X)R⁵ o C(O)OR⁶; o alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆ o cicloalqueno C₃-C₆, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente seleccionado independientemente del grupo que consiste en halógeno, OR^{12a}, alquilo C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄; o fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo no sustituido o sustituido con 1 a 3 R⁴.
- 35
- Realización 9b. Un compuesto o composición de la Realización 9a en donde R^{3e} es H o halógeno; o alquilo C₁-C₆ o alqueno C₂-C₆, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente seleccionado independientemente del grupo que consiste en halógeno y haloalquilo C₁-C₄; o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo no sustituido o sustituido con 1 a 3 R⁴.
- 40
- Realización 9c. Un compuesto o composición de la Realización 9b en donde R^{3e} es H, halógeno o alquilo C₁-C₆.
- Realización 9c1. Un compuesto o composición de la Realización 9c en donde R^{3e} es H.
- Realización 9d. Un compuesto de Fórmula 1, o una composición que comprende un compuesto de Fórmula 1, o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 8h en donde R^{3e} y A pueden tomarse junto con el átomo de carbono al que están unidos para formar un anillo de 3 a 7 miembros que contiene miembros del anillo seleccionados entre átomos de carbono y hasta 2 heteroátomos seleccionados independientemente entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y hasta a 2 átomos de nitrógeno, en donde hasta 2 átomos de carbono miembros del anillo se seleccionan independientemente de C(=O) y C(=S) y el átomo de azufre miembro del anillo se selecciona entre S, S(O) o S(O)₂, estando dicho anillo no sustituido o sustituido con hasta 4 sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano y alquilo C₁-C₄.
- 45
- 50
- Realización 10. Un compuesto de Fórmula 1, o una composición que comprende un compuesto de Fórmula 1, o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 9d en donde Z¹ es fenilo sustituido con 1 a 4 R^{4a}.

- Realización 10a. Un compuesto de Fórmula 1, o una composición que comprende un compuesto de Fórmula 1, o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 9d en donde Z^1 es un anillo heteroaromático de 5 miembros, no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^{4a} .
- 5 Realización 10b. Un compuesto o composición de la Realización 10a en donde Z^1 es furanilo, tienilo, oxazolilo o tiazolilo, cada uno no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^{4a} .
- Realización 10c. Un compuesto de Fórmula 1, o una composición que comprende un compuesto de Fórmula 1, o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 9d en donde Z^1 es un anillo heteroaromático de 6 miembros, no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^{4a} .
- 10 Realización 10d. Un compuesto o composición de la Realización 10c en donde Z^1 es piridinilo o pirimidinilo, cada uno no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^{4a} .
- Realización 11. Un compuesto de Fórmula 1, o una composición que comprende un compuesto de Fórmula 1, o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 9d en donde Z^2 es fenilo sustituido con 1 a 4 R^{4b} .
- 15 Realización 11a. Un compuesto de Fórmula 1, o una composición que comprende un compuesto de Fórmula 1, o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 9d en donde Z^2 es un anillo heteroaromático de 5 miembros, no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^{4b} .
- Realización 11b. Un compuesto o composición de la Realización 11a en donde Z^2 es furanilo, tienilo, oxazolilo o tiazolilo, cada uno no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^{4b} .
- 20 Realización 11c. Un compuesto de Fórmula 1, o una composición que comprende un compuesto de Fórmula 1, o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 9d en donde Z^2 es un anillo heteroaromático de 6 miembros, no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^{4b} .
- Realización 11d. Un compuesto o composición de la Realización 11c en donde Z^2 es piridinilo o pirimidinilo, cada uno no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^{4b} .
- 25 Realización 12. Un compuesto de Fórmula 1, o una composición que comprende un compuesto de Fórmula 1, o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 11d en donde cada R^{4a} y cada R^{4b} es independientemente halógeno, ciano, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 o haloalcoxi C_1-C_6 .
- Realización 12a. Un compuesto de Fórmula 1, o una composición que comprende un compuesto de Fórmula 1, o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 11d en donde Z^1 es fenilo o piridinilo, cada uno sustituido con 1 a 3 R^{4a} .
- 30 Realización 12b. Un compuesto o composición de la Realización 12a en donde cada R^{4a} es independientemente halógeno, alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 .
- Realización 12c. Un compuesto de Fórmula 1, o una composición que comprende un compuesto de Fórmula 1, o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 11d en donde Z^2 es fenilo sustituido con 1 a 3 R^{4b} .
- 35 Realización 12d. Un compuesto o composición de la Realización 12c en donde cada R^{4b} es independientemente halógeno, alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 .
- Realización 12e. Un compuesto de Fórmula 1, o una composición que comprende un compuesto de Fórmula 1, o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 11d en donde Z^1 es fenilo o piridinilo, cada uno sustituido con 1 a 3 R^{4a} ; Z^2 es fenilo sustituido con 1 a 3 R^{4b} ; y cada R^{4a} y cada R^{4b} es independientemente halógeno, alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 .
- Realización 13. Un compuesto de Fórmula 1, o una composición que comprende un compuesto de Fórmula 1, o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 12e en donde X es O.
- 40 Realización 13a. Un compuesto de Fórmula 1, o una composición que comprende un compuesto de Fórmula 1, o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 12e en donde X es S.
- 45 Las realizaciones de esta invención, que incluyen las Realizaciones 1-13a anteriores, así como cualquier otra realización descrita en la presente memoria, se pueden combinar de cualquier manera, y las descripciones de las variables en las realizaciones se refieren no solo a los compuestos de Fórmula 1 sino también a los compuestos de partida y compuestos intermedios útiles para preparar los compuestos de Fórmula 1. Además, las realizaciones de esta invención, que incluyen las Realizaciones 1-13a anteriores, así como cualquier otra realización descrita en la presente memoria, y cualquier combinación de las mismas, pertenecen a las composiciones y métodos de la presente invención.
- Las combinaciones de las realizaciones 1-13a se ilustran mediante:
- 50 Realización A. Un compuesto de Fórmula 1, o una composición que comprende un compuesto

de Fórmula 1 en donde

X es O;

R^{1a} es H; y

R^{1b} es H.

5 Realización B. El compuesto o composición de la Realización A en donde

R^{2a}, R^{2b}, R^{2c} y R^{2d} son H;

R^{3e} es H, halógeno o alquilo C₁-C₆; y

A es ciano, C(X)R⁵, C(O)OR⁶, C(X)NR⁷R⁸ o NR⁹R¹⁰; o fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo no sustituido o sustituido con 1 a 3 R⁴.

10 Realización C. El compuesto o composición de la Realización B en donde

A es ciano, C(O)OR^{6a} o NHC(O)R^{5a}; o un anillo heteroaromático de 5 miembros, no sustituido o sustituido con 1 a 3 R⁴.

Realización D. Un compuesto de Fórmula 1, o una composición que comprende un compuesto de Fórmula 1 en donde

15 R^{3e} es H;

A es ciano, C(O)OR^{6a} o NHC(O)R^{5a}; o un anillo heteroaromático de 5 miembros, no sustituido o sustituido con 1 a 3 R⁴;

Z¹ es fenilo o piridinilo, cada uno sustituido con 1 a 3 R^{4a};

cada R^{4a} es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄;

20 Z² es fenilo sustituido con 1 a 4 R^{4b}; y

cada R^{4b} es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄.

Las realizaciones específicas incluyen compuestos de Fórmula 1 seleccionados del grupo que consiste en:

1-[[3-(4-fluorofenil)-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1H-pirazol-4-il] metil]-4-piperidinacarboxilato de metilo

1-[[3-(4-fluorofenil)-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1H-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinocarbonitrilo;

25 1-[[1-(3,4-diclorofenil)-3-(4-fluorofenil)-1H-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinocarbonitrilo;

1-[[3-(2-fluorofenil)-1-[4-(trifluorometoxi)fenil]-1H-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinocarbonitrilo;

1-[[3-(2,4-difluorofenil)-1-[4-(trifluorometoxi)fenil]-1H-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinocarbonitrilo;

1-[[1-(4-clorofenil)-3-(2-fluorofenil)-1H-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinocarbonitrilo;

1-[[1-(3-cloro-4-fluorofenil)-3-(2-fluorofenil)-1H-pirazol-4-il] metil]-4-piperidinocarbonitrilo;

30 1-[[1-(4-bromofenil)-3-(2-fluorofenil)-1H-pirazol-4-il] metil]-4-piperidinocarbonitrilo;

1-[[3-(2-fluorofenil)-1-[4-(trifluorometil)fenil]-1H-pirazol-4-il] metil]-4-piperidinocarbonitrilo;

1-[[3-(2-fluorofenil)-1-[5-(trifluorometil)-2-piridinil]-1H-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinocarbonitrilo;

1-[[3-(2,6-difluorofenil)-1-[4-(trifluorometoxi)fenil]-1H-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinocarbonitrilo;

1-[[1-(3-cloro-4-fluorofenil)-3-(2-fluorofenil)-1H-pirazol-4-il]metil]-4-(1,3,4-oxadiazol-2-il)piperidina;

35 1-[[1-(3,4-diclorofenil)-3-(2-fluorofenil)-1H-pirazol-4-il]metil]-4-(1,3,4-oxadiazol-2-il)piperidina;

1-[[1-(5-cloro-2-piridinil)-3-(2,4,6-trifluorofenil)-1H-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinocarbonitrilo;

1-[[1-(4-clorofenil)-3-(2-fluorofenil)-1H-pirazol-4-il]metil]-4-(1,3,4-oxadiazol-2-il)piperidina;

1-[[1-(3-cloro-4-fluorofenil)-3-(2-fluorofenil)-1H-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinocarbonitrilo;

- 1-[[1-(4-cloro-3-fluorofenil)-3-(2-fluorofenil)-1*H*-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinocarbonitrilo;
 1-[[1-(4-clorofenil)-3-(2-fluorofenil)-1*H*-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinocarbonitrilo;
 1-[[1-(5-cloro-2-piridinil)-3-(2-fluorofenil)-1*H*-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinocarbonitrilo;
 1-[[3-(2-fluorofenil)-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1*H*-pirazol-4-il]metil]-4-(1,3,4-oxadiazol-2-il)piperidina;
- 5 1-[[1-(3-bromofenil)-3-(2-fluorofenil)-1*H*-pirazol-4-il] metil]-4-(1,3,4-oxadiazol-2-il)piperidina;
 1-[[1-(5-bromo-2-piridinil)-3-(2-fluorofenil)-1*H*-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinocarbonitrilo;
 1-[[1-(5-cloro-2-piridinil)-3-(2,4-difluorofenil)-1*H*-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinocarbonitrilo; y
 1-[[3-(2-fluorofenil)-1-[4-(trifluorometoxi)fenil]-1*H*-pirazol-4-il]metil]-4-(1,3,4-oxadiazol-2-il)piperidina.
- 10 Son de destacar los compuestos de la Realización I en donde cuando A es NHC(O)R^{5a} , en ese caso el átomo de carbono al que A y R^{3e} están unidos tiene estereoquímica (S).
- Las realizaciones de la presente invención como se describe en el Compendio de la Invención también incluyen las descritas a continuación. En las siguientes Realizaciones, la Fórmula 1p incluye estereoisómeros, *N*-óxidos, y sus sales, y la referencia a "un compuesto de Fórmula 1p" incluye las definiciones de los sustituyentes especificados en el Compendio de la Invención a menos que se defina adicionalmente en las Realizaciones. El grupo R^2 representa casos de R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} y R^{2d} . El grupo R^3 representa casos de R^{3a} , R^{3b} , R^{3c} y R^{3d} .
- 15 Realización 1. Un compuesto de Fórmula 1p en donde R^{1a} es H, ciano, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_6$, haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, C(O)OH , C(O)R^{5a} , C(O)OR^{6a} o $\text{C(O)NR}^{7a}\text{R}^{8a}$.
- Realización 1a. Un compuesto de la Realización 1 en donde R^{1a} es H, ciano o alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$.
- Realización 1b. Un compuesto de la Realización 1a en donde R^{1a} es H, ciano o metilo.
- 20 Realización 1c. Un compuesto de la Realización 1b en donde R^{1a} es H.
- Realización 2. Un compuesto de Fórmula 1p o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 1c, en donde R^{1b} es H o metilo.
- Realización 2a. Un compuesto de la Realización 2 en donde R^{1b} es H.
- 25 Realización 3. Un compuesto de Fórmula 1p o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 2a en donde A es ciano, C(X)R^5 , C(O)OR^6 , $\text{C(X)NR}^7\text{R}^8$ o NR^9R^{10} ; o alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_7$ o cicloalquil($\text{C}_4\text{-C}_8$)alquilo, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente seleccionado independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, OR^{12a} , alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, C(O)R^{5a} , C(O)OR^{6a} , $\text{C(O)NR}^{7a}\text{R}^{8a}$ y $\text{S(O)}_n\text{R}^{11a}$, o fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^4 .
- 30 Realización 3a. Un compuesto de la Realización 3 en donde A es ciano, C(X)R^5 , C(O)OR^6 o NR^9R^{10} ; o fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^4 .
- Realización 3b. Un compuesto de la Realización 3a en donde A es ciano, C(X)R^5 , C(O)OR^6 o NR^9R^{10} .
- Realización 3c. Un compuesto de la Realización 3b en donde A es ciano, C(O)OR^{6a} , NHC(O)R^{5a} o NHC(O)OR^{6a} .
- Realización 4. Un compuesto de Fórmula 1p o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 3c en donde cada R^2 es independientemente ciano, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, C(O)OR^6 , NHC(O)R^{5a} o NHC(O)OR^{6a} .
- 35 Realización 5. Un compuesto de Fórmula 1p o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 4 en donde R^3 es H, halógeno o alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$.
- Realización 5a. Un compuesto de la Realización 5 en donde R^3 es H, F, Cl, Br o metilo.
- Realización 5b. Un compuesto de la Realización 5a en donde R^3 es H.
- 40 Realización 6. Un compuesto de Fórmula 1p o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 5b en donde Z^1 es fenilo sustituido con 1 a 4 R^4 .
- Realización 6a. Un compuesto de Fórmula 1p o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 5b en donde Z^1 es un anillo heteroaromático de 5 miembros, no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^4 .
- Realización 6b. Un compuesto de la Realización 6a en donde Z^1 es furanilo, tienilo, oxazolilo o tiazolilo, cada uno no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^4 .

Realización 6c. Un compuesto de Fórmula 1p o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 5b en donde Z^1 es un anillo heteroaromático de 6 miembros, no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^4 .

Realización 6d. Un compuesto de la Realización 6c en donde Z^1 es piridinilo o pirimidinilo, cada uno no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^4 .

5 Realización 7. Un compuesto de Fórmula 1p o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 5b en donde Z^2 es fenilo sustituido con 1 a 4 R^4 .

Realización 7a. Un compuesto de Fórmula 1p o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 5b en donde Z^2 es un anillo heteroaromático de 5 miembros, no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^4 .

10 Realización 7b. Un compuesto de la Realización 6a en donde Z^2 es furanilo, tienilo, oxazolilo o tiazolilo, cada uno no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^4 .

Realización 7c. Un compuesto de Fórmula 1p o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 5b en donde Z^2 es un anillo heteroaromático de 6 miembros, no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^4 .

Realización 7d. Un compuesto de la Realización 6c en donde Z^2 es piridinilo o pirimidinilo, cada uno no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^4 .

15 Realización 8. Un compuesto de Fórmula 1p o cualquiera de las Realizaciones 1 a 7d en donde cada R^4 es independientemente halógeno, ciano, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 o haloalquilo C_1-C_6 .

Realización 9. Un compuesto de Fórmula 1p o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 8 en donde Z^1 es fenilo y un R^4 está en la posición 3 o 4.

20 Realización 9a. Un compuesto de la Realización 9 en donde R^4 es halógeno, ciano, alquilo C_1-C_6 , Haloalquilo C_1-C_6 o Haloalquilo C_1-C_6 .

Realización 10. Un compuesto de Fórmula 1p o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 8 en donde Z^2 es fenilo y un R^4 está en la posición 2.

Realización 10a. Un compuesto de la Realización 10 en donde R^4 es halógeno o metilo

Realización 11. Un compuesto de Fórmula 1p o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 10a en donde X es O.

25 Realización 11a. Un compuesto de fórmula 1p o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 10a en donde X es S.

Realización 12. Un compuesto de Fórmula 1p o una cualquiera de las Realizaciones 1 a 11a en donde m es 0, 1 o 2.

Realización 12a. Un compuesto de la Realización 12 en donde m es 1 o 2.

Realización 12b. Un compuesto de la Realización 12 en donde m es 0.

30 Las realizaciones de esta invención, que incluyen las Realizaciones 1-12b anteriores, así como cualquier otra realización descrita en la presente memoria, se pueden combinar de cualquier manera, y las descripciones de las variables en las realizaciones se refieren no solo a los compuestos de Fórmula 1p sino también a los compuestos de partida y compuestos intermedios útiles para preparar los compuestos de Fórmula 1p. Además, las realizaciones de esta invención, que incluyen las Realizaciones 1-12b anteriores, así como cualquier otra realización descrita en la presente memoria, y cualquier combinación de las mismas, pertenecen a las composiciones y métodos de la
35 presente invención.

Las combinaciones de las realizaciones 1-12b se ilustran por:

Realización A. Un compuesto de Fórmula 1p en donde

X es O;

R^{1a} es H; y

40 R^{1b} es H.

Realización B. Un compuesto de la Realización A en donde

R^3 es H, halógeno o alquilo C_1-C_6 ;

A es ciano, $C(X)R^5$, $C(O)OR^6$, $C(X)NR^7R^8$ o NR^9R^{10} ; o fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^4 ; y

45 cada R^2 es independientemente ciano, alquilo C_1-C_6 , $NHC(O)R^{5a}$ o $NHC(O)OR^{6a}$.

Realización C. Un compuesto de la Realización B en donde

A es ciano, C(O)OR^{6a}, NHC(O)R^{5a} o NHC(O)OR^{6a}.

Las realizaciones específicas incluyen compuestos de Fórmula 1p seleccionados del grupo que consiste en:

- 1-[[3-(4-fluorofenil)-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1*H*-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinacarboxilato de metilo;
- 5 1-[[3-(4-fluorofenil)-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1*H*-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinocarbonitrilo;
- 1-[[1-(3,4-diclorofenil)-3-(4-fluorofenil)-1*H*-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinocarbonitrilo;
- 1-[[3-(2-fluorofenil)-1-[4-(trifluorometoxi)fenil]-1*H*-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinocarbonitrilo;
- 1-[[3-(2,4-difluorofenil)-1-[4-(trifluorometoxi)fenil]-1*H*-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinocarbonitrilo;
- 1-[[1-(4-clorofenil)-3-(2-fluorofenil)-1*H*-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinocarbonitrilo;
- 10 1-[[1-(3-cloro-4-fluorofenil)-3-(2-fluorofenil)-1*H*-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinocarbonitrilo;
- 1-[[1-(4-bromofenil)-3-(2-fluorofenil)-1*H*-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinocarbonitrilo;
- 1-[[3-(2-fluorofenil)-1-[4-(trifluorometil)fenil]-1*H*-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinocarbonitrilo;
- 1-[[3-(2-fluorofenil)-1-[5-(trifluorometil)-2-piridinil]-1*H*-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinocarbonitrilo; y
- 1-[[3-(2,6-difluorofenil)-1-[4-(trifluorometoxi)fenil]-1*H*-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinocarbonitrilo.
- 15 Es de destacar que los compuestos de esta invención se caracterizan por patrones metabólicos y/o residuales del suelo favorables y muestran una actividad que controla un espectro de plagas de invertebrados agronómicos y no agronómicos.

Las realizaciones de la invención son de particular interés, por razones del espectro de control de plagas de invertebrados y la importancia económica, la protección de los cultivos agronómicos contra daños o lesiones causados por plagas de invertebrados mediante el control de plagas de invertebrados. Los compuestos de esta invención debido a sus propiedades de translocación favorables o su carácter sistémico en las plantas también protegen las partes foliares u otras partes de la planta que no están en contacto directo con un compuesto de Fórmula 1 o una composición que comprende el compuesto.

20

También son dignas de destacarse como realizaciones de la presente invención composiciones que comprenden un compuesto de cualquiera de las Realizaciones anteriores, así como cualquier otra realización descrita en la presente memoria, y cualquier combinación de las mismas, y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en un tensioactivo, un diluyente sólido y un diluyente líquido, comprendiendo dichas composiciones adicionalmente opcionalmente al menos un compuesto o agente biológicamente activos adicionales.

25

Adicionalmente, son dignas de destacarse como realizaciones de la presente invención composiciones para controlar una plaga de invertebrados que comprende un compuesto (es decir, en una cantidad biológicamente eficaz) de cualquiera de las Realizaciones anteriores, así como cualquier otra realización descrita en la presente memoria, y cualquier combinación de las mismas, y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en un tensioactivo, un diluyente sólido y un diluyente líquido, comprendiendo dichas composiciones adicionalmente opcionalmente al menos un compuesto o agente biológicamente activos adicionales (es decir, en una cantidad biológicamente eficaz).

30

35

Las realizaciones de la invención incluyen adicionalmente métodos para controlar una plaga de invertebrados que comprenden poner en contacto la plaga de invertebrados o su entorno con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de cualquiera de las Realizaciones precedentes (p. ej., en forma de una composición descrita en la presente memoria), con la condición de que el método no es un método de tratamiento del cuerpo humano o animal mediante terapia.

40

Las realizaciones de la invención también incluyen una composición que comprende un compuesto de cualquiera de las Realizaciones anteriores en forma de una formulación líquida para encharcamiento del suelo. Las realizaciones de la invención incluyen adicionalmente métodos para controlar una plaga de invertebrados que comprenden poner en contacto el suelo con una composición líquida en forma de encharcamiento del suelo que comprende una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de cualquiera de las Realizaciones anteriores.

45

Las realizaciones de la invención también incluyen una composición de pulverización para controlar una plaga de invertebrados que comprende un compuesto (es decir, en una cantidad biológicamente eficaz) de cualquiera de las Realizaciones anteriores y un propelente. Las realizaciones de la invención incluyen adicionalmente una composición de cebo para controlar una plaga de invertebrados que comprende un compuesto (es decir, en una cantidad biológicamente eficaz) de cualquiera de las Realizaciones anteriores, uno o más materiales alimenticios,

50

opcionalmente un atrayente, y opcionalmente un humectante. Las realizaciones de la invención también incluyen un dispositivo para controlar una plaga de invertebrados que comprende dicha composición de cebo y un alojamiento adaptado para recibir dicha composición de cebo, en donde el alojamiento tiene al menos una abertura dimensionada para permitir que la plaga de invertebrados pase a través de la abertura de manera que la plaga de invertebrados pueda tener acceso a dicha composición de cebo desde un lugar fuera del alojamiento, y en donde el alojamiento está adaptado adicionalmente para colocarse en o cerca de un lugar de actividad potencial o conocida para la plaga de invertebrados.

Las realizaciones de la invención también incluyen un método para proteger una semilla de una plaga de invertebrados que comprende poner en contacto la semilla con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de cualquiera de las Realizaciones anteriores (p. ej., en forma de una composición descrita en la presente memoria).

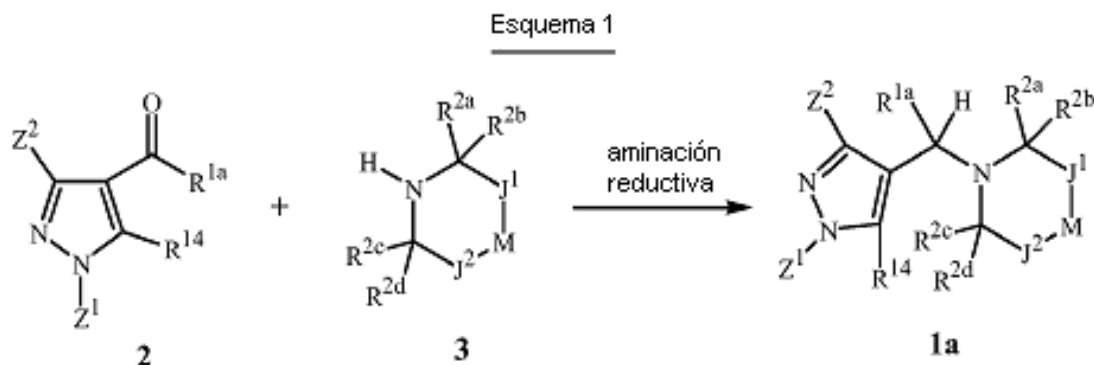
Los compuestos de la invención también se pueden utilizar en métodos para proteger a un animal de una plaga parásita de invertebrados que comprende administrar al animal una cantidad eficaz como parasiticida de un compuesto de cualquiera de las Realizaciones anteriores.

Las realizaciones de la invención también incluyen métodos para controlar una plaga de invertebrados que comprenden poner en contacto la plaga de invertebrados o su entorno con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido, o una sal del mismo, (p. ej., en forma de una composición descrita en la presente memoria), con la condición de que los métodos no sean métodos de tratamiento médico de un cuerpo humano o animal mediante terapia.

Esta invención también se refiere a métodos en donde la plaga de invertebrados o su entorno se ponen en contacto con una composición que comprende una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido, o una sal del mismo, y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos, comprendiendo dicha composición adicionalmente opcionalmente una cantidad biológicamente eficaz de al menos un compuesto o agente biológicamente activos adicionales, siempre que los métodos no sean métodos de tratamiento médico de un cuerpo humano o animal mediante terapia.

Se pueden utilizar uno o más de los siguientes métodos y variaciones como se describe en los Esquemas 1-11 para preparar los compuestos de Fórmula 1. Las definiciones de R^{1a} , R^{1b} , R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} , R^{2d} , R^{14} , Z^1 , Z^2 , J^1 , J^2 y M en los compuestos de Fórmulas 1-10 a continuación se definen como anteriormente en el Compendio de la Invención a menos que se indique lo contrario. La (room or ambient temperatura) temperatura ambiente o ambiente se define como aproximadamente 20-25°C.

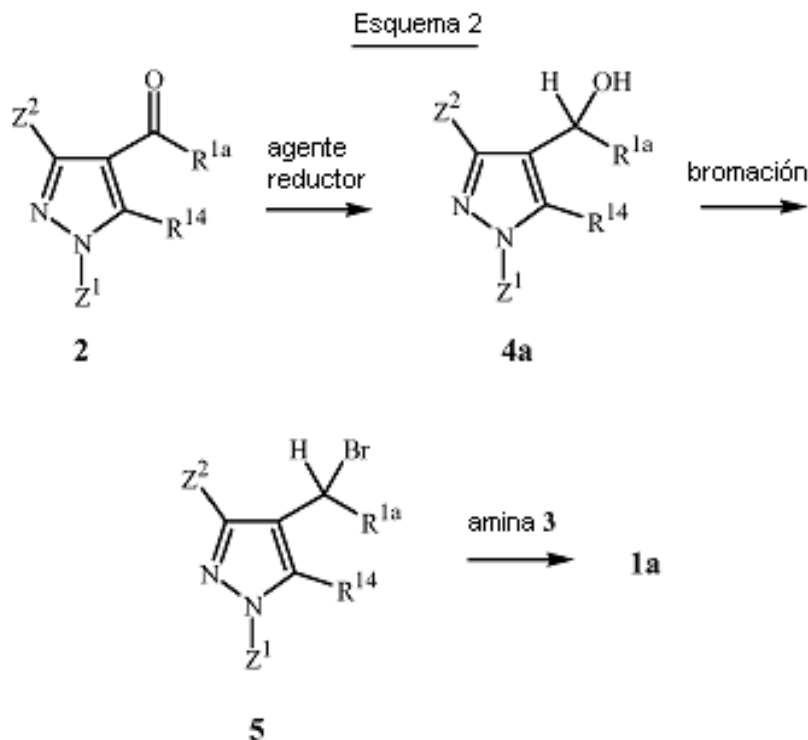
Los compuestos de Fórmula 1a (compuestos de Fórmula 1 en donde R^{1a} es H, alquilo, cicloalquilo o haloalquilo, y R^{1b} es H) se pueden preparar por aminación reductora de compuestos de carbonilo apropiadamente sustituidos de Fórmula 2 con aminas cíclicas opcionalmente sustituidas de Fórmula 3 en presencia de reactivos reductores tales como triacetoxiborohidruro de sodio (véase, por ejemplo, Li, J. *et al.* Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters 2010, 20 (16), páginas 4932-4935) La reacción se lleva a cabo típicamente en un disolvente orgánico inerte tal como diclorometano a temperatura ambiente. Este método se muestra en el Esquema 1 y se ilustra en la Etapa C del Ejemplo de Síntesis 2.



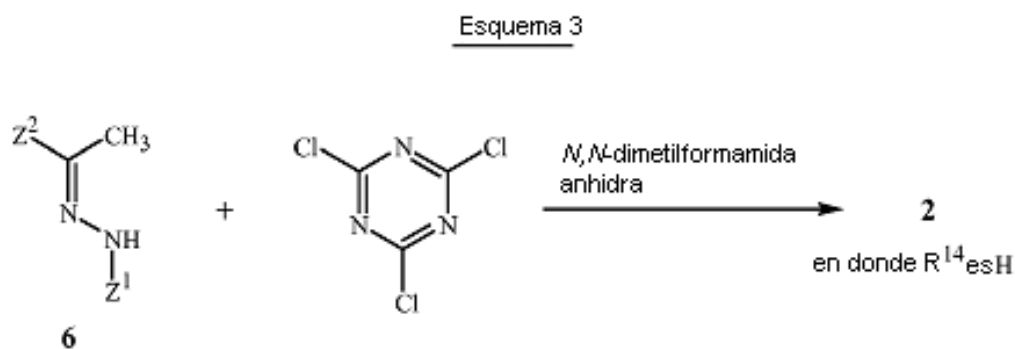
R^{1a} es H, alquilo, cicloalquilo o haloalquilo

Los compuestos de Fórmula 1a también se pueden preparar mediante el método mostrado en el Esquema 2. En este método, un compuesto de carbonilo apropiadamente sustituido de Fórmula 2 se reduce con un agente reductor tal como hidruro de litio y aluminio en un disolvente inerte tal como éter dietílico (véase, por ejemplo, De Luca, Lidia; et al. Synlett 2004, 13, páginas 2299-2302) para producir un alcohol intermedio de Fórmula 4a. El alcohol se convierte en el bromuro correspondiente de Fórmula 5 por tratamiento con un reactivo tal como HBr o PBr_3 (véase, por ejemplo, Toja, Emilio; et al. European Journal of Medicinal Chemistry 1982, 17 (3), páginas 223-227) La reacción

del bromuro de Fórmula 5 con una amina de Fórmula 3 proporciona el compuesto de Fórmula 1a (véase, por ejemplo, Lee, Suk Ho, *et al.* Journal of Medicinal Chemistry 2008, 51 (22), páginas 7216-7233) Este método se ilustra en la Etapa C del Ejemplo de Síntesis 1.

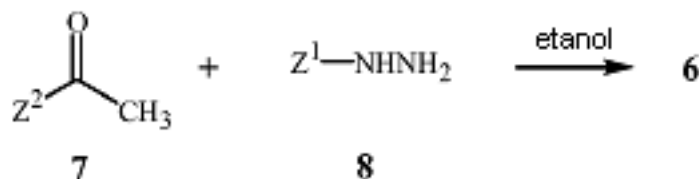


- 5 Los compuestos de Fórmula 2 en donde R^{14} es H pueden prepararse tratando la hidrazona apropiadamente sustituida de Fórmula 6 en condiciones anhidras con cloruro cianúrico y *n,n*-dimetilformamida (véase, por ejemplo, De Luca, Lidia; *et al.* Synlett 2004, 13, páginas 2299-2302) Este método se muestra en el Esquema 3 y se ilustra en la Etapa B del Ejemplo de Síntesis 1 y la Etapa B del Ejemplo de Síntesis 2.



- 10 Los compuestos de Fórmula 6 se pueden preparar mediante una variedad de métodos conocidos en la técnica, tales como la condensación de una acetofenona de Fórmula 7 con una arilhidrazina de Fórmula 8 en etanol a reflujo (véase, por ejemplo, Goeker, Hakan; *et al.* Journal of Heterocyclic Chemistry 2009, 46 (5), páginas 936-948) Este método se muestra en el Esquema 4 y se ilustra en la Etapa A del Ejemplo de Síntesis 1 y la Etapa A del Ejemplo de Síntesis 2.

Esquema 4

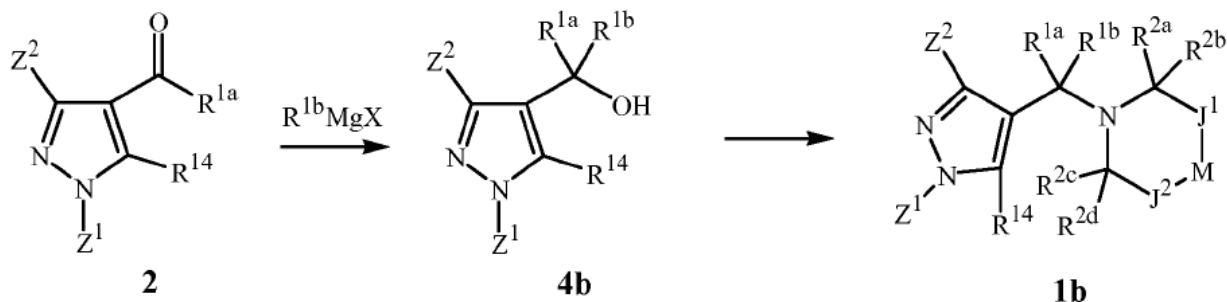


Los compuestos de Fórmulas 3, 7 y 8 están comercialmente disponibles o pueden prepararse mediante métodos bien establecidos conocidos en la técnica.

5 Los compuestos de Fórmula 1b (compuestos de Fórmula 1) en donde R^{1a} es H, alquilo, cicloalquilo o haloalquilo, y R^{1b} es alquilo se pueden preparar a partir de compuestos de Fórmula 2 mediante el método mostrado en el Esquema 5. En este método, el tratamiento de un compuesto de Fórmula 2 con un reactivo de Grignard (es decir, R^{1b}MgX) en condiciones de reacción conocidas en la técnica proporciona el compuesto intermedio de Fórmula 4b (véase, por ejemplo, Journal of Medicinal Chemistry 2008, 51 (22), páginas 7216-7233) La conversión del compuesto de Fórmula 4b en el compuesto de Fórmula 1b se describe como en el Esquema 2.

10

Esquema 5



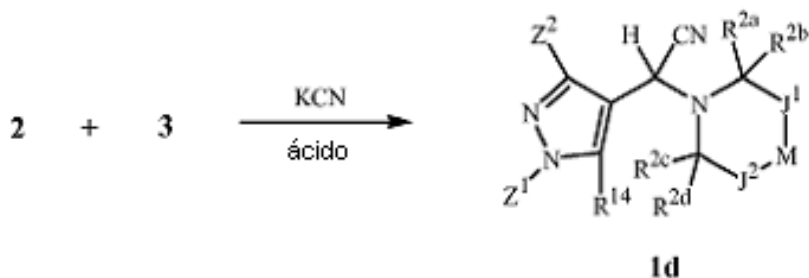
R^{1a} es H, alquilo, cicloalquilo o haloalquilo

R^{1b} es alquilo

15

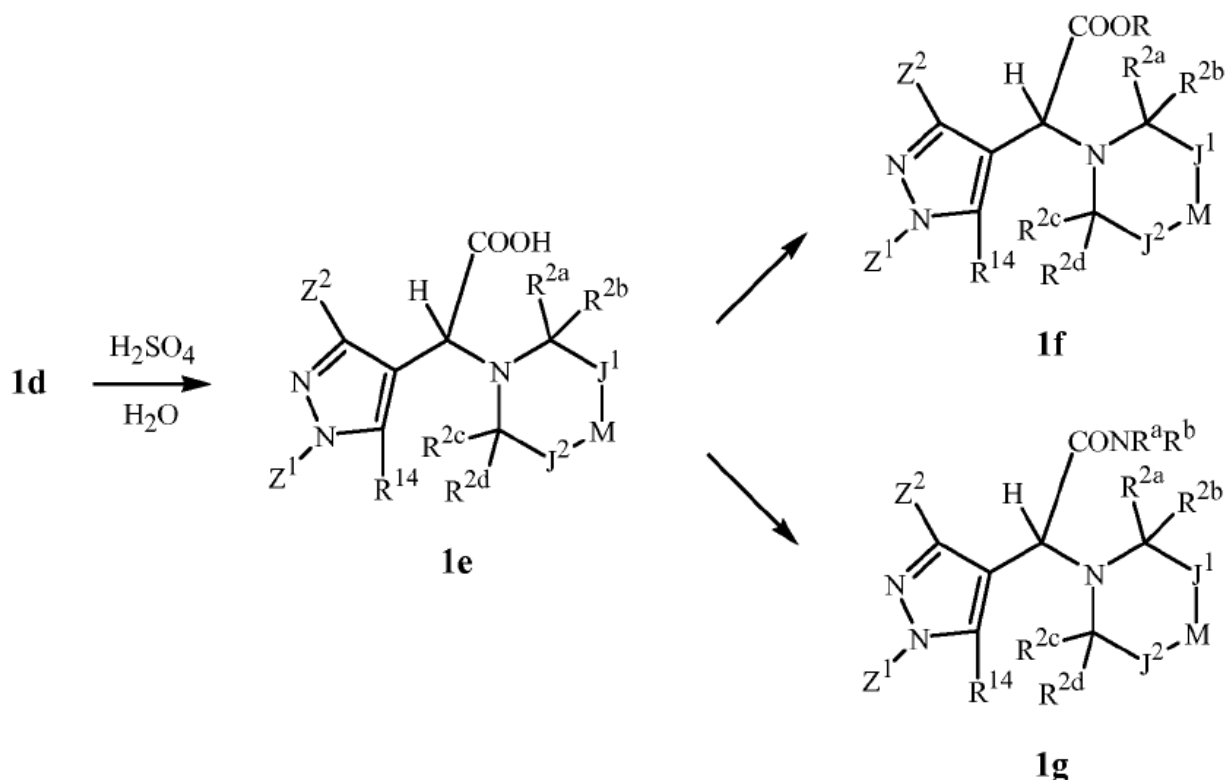
Los compuestos de Fórmula 1d (compuestos de Fórmula 1 en donde R^{1a} es CN y R^{1b} es H) se pueden preparar a partir de compuestos de Fórmula 2 mediante el método mostrado en el Esquema 6. En este método, el tratamiento de un compuesto de Fórmula 2 con KCN en presencia de una amina de Fórmula 3 y un ácido tal como el ácido toluenosulfónico proporciona el compuesto de Fórmula 1d.

Esquema 6



20

Los compuestos de Fórmula 1d son útiles en la preparación de derivados de ácido carboxílico, éster y amida (véase, por ejemplo, Arzneimittel-Forschung 1981, 31 (4), páginas 649-655) El esquema 7 ilustra la preparación de un derivado de ácido carboxílico de Fórmula 1e a partir del compuesto de Fórmula 1d mediante tratamiento con ácido sulfúrico acuoso; el compuesto de Fórmula 1e a su vez puede transformarse en un éster de Fórmula 1f o una amida de Fórmula 1g mediante métodos conocidos en la técnica.

Esquema 7

Los compuestos de Fórmula 1 en donde R^{1a} es un grupo ciano, éster o amida y R^{1b} es alquilo se pueden preparar mediante alquilación de los compuestos correspondientes en donde R^{1b} es H mediante tratamiento con una base fuerte seguida por un agente alquilante (véase, por ejemplo, el documento WO 2006/134459)

5

Los compuestos de Fórmula 1 que contienen los grupos $C(X)R^5$, $C(X)R^{5a}$, $C(X)NR^7R^8$ y $C(X)NR^{7a}R^{8a}$ en donde X es S se pueden preparar a partir de los correspondientes compuestos de Fórmula 1 en donde X es O mediante métodos generales conocidos en la técnica que implican el tratamiento con reactivos de tionación tales como P_4S_{10} o Reactivo de Lawesson (2,4-disulfuro de 2,4-bis(4-metoxifenil)-1,3-ditia-2,4-difosfetano).

Los esquemas 1 a 7 ilustran métodos para preparar compuestos de Fórmula 1 que tienen una variedad de sustituyentes. Los compuestos de Fórmula 1 que tienen sustituyentes distintos a los particularmente indicados para los Esquemas 1 a 7 pueden prepararse mediante métodos generales conocidos en la técnica de química orgánica sintética, que incluyen métodos análogos a los descritos para los Esquemas 1 a 7.

Se reconoce que algunos reactivos y condiciones de reacción descritos anteriormente para preparar compuestos de Fórmula 1 pueden no ser compatibles con ciertas funcionalidades presentes en los productos intermedios. En estos casos, la incorporación de secuencias de protección/desprotección o interconversiones de grupos funcionales en la síntesis ayudará a obtener los productos deseados. El uso y la elección de los grupos protectores serán evidentes para un experto en síntesis química (véase, por ejemplo, Greene, T. W. ; Wuts, P. G. M. Projective Groups in Organic Synthesis, 2ª ed.; Wiley: Nueva York, 1991) Un experto en la técnica reconocerá que, en algunos casos, después de la introducción de un reactivo dado tal como se representa en cualquier esquema individual, puede ser necesario realizar etapas de síntesis de rutina adicionales no descritas en detalle para completar la síntesis de compuestos de Fórmula 1. Un experto en la técnica también reconocerá que puede ser necesario realizar una combinación de las etapas ilustradas en los esquemas anteriores en un orden distinto al que implica la secuencia particular presentada para preparar los compuestos de Fórmula 1.

Un experto en la técnica también reconocerá que los compuestos de Fórmula 1 y los compuestos intermedios descritos en la presente memoria pueden someterse a diversas reacciones electrofílicas, nucleófilas, radicales, organometálicas, de oxidación y de reducción para añadir sustituyentes o modificar sustituyentes existentes.

Sin elaboración adicional, se cree que un experto en la técnica que utilice la descripción precedente puede utilizar la presente invención en su máxima extensión. Los siguientes ejemplos de síntesis, por lo tanto, deben interpretarse como meramente ilustrativos, y no limitantes de la descripción de ninguna manera. Las etapas en los siguientes ejemplos de síntesis ilustran un procedimiento para cada etapa en una transformación sintética global, y el material de partida para cada etapa puede no haberse preparado necesariamente mediante una ronda preparativa particular

30

cuyo procedimiento se describe en otros ejemplos o etapas. La temperatura ambiental o ambiente se define como aproximadamente 20-25°C. Los porcentajes son en peso a excepción de las mezclas de disolventes cromatográficas o cuando se indique lo contrario. Las partes y porcentajes para las mezclas de disolventes cromatográficas son en volumen a menos que se indique lo contrario. MPLC se refiere a cromatografía líquida a presión media sobre gel de sílice. Los espectros de RMN- H^1 se refieren en ppm bajo campo de tetrametilsilano; "s" significa singlete, "d" significa doblete, "dd" significa doblete de dobletes, "ddd" significa doblete de dobletes de dobletes, "t" significa triplete, "m" significa multiplete y "br s" significa singlete ancho. Los números de compuesto se refieren a los compuestos en las Tablas de índice A-E.

Ejemplo de síntesis 1

- 10 Preparación de 1-[[3-(4-fluorofenil)-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1*H*-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinocarbonitrilo (compuesto número 12)

Etapas A: Preparación de 1-(4-fluorofenil)etanona 2-[3-(trifluorometil)fenil]hidrazona

- 15 A una solución de 4-fluoroacetofenona (5,0 g, 36 mmoles) en 200 ml de etanol (200 ml) se le añadió 3-(trifluorometil)fenilhidrazina (6,370 g, 36,20 mmoles). La mezcla de reacción se agitó durante 18 horas, después de lo cual los materiales volátiles se eliminaron a presión reducida, y la mezcla de reacción bruta resultante se añadió a agua (100 ml) y se extrajo con éter dietílico (3 x 200 ml). Los extractos orgánicos combinados se secaron sobre $MgSO_4$ y se concentraron bajo presión reducida. El residuo sólido resultante se purificó mediante cromatografía sobre gel de sílice (acetato de etilo/hexanos) para proporcionar el compuesto del título en forma de un sólido (4,78 g). RMN H^1 ($CDCl_3$) δ 7,75-7,78 (dd, 2H), 7,42 (d, 2H), 7,36 (d, 1H), 7,32 (s ancho, NH), 7,06-7,15 (m, 3H), 2,25 (s, 3H).

- 20 Etapa B: Preparación de 3-(4-fluorofenil)-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1*H*-pirazol-4-carboxaldehído

- 25 Se añadió cloruro cianúrico (15,0 g, 81,3 mmoles) en una porción a *N,N*-dimetilformamida anhidra (100 ml) en una atmósfera de nitrógeno. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente hasta que ya no se pudo detectar el cloruro cianúrico por UV. Después del consumo completo del cloruro cianúrico, se añadió a la mezcla de reacción una solución de 1-(4-fluorofenil)etanona 2-[3-(trifluorometil)fenil]hidrazona (4,78 g, 16,1 mmoles) en *n,n*-dimetilformamida anhidra (25 ml). La mezcla de reacción se agitó después durante 18 horas a temperatura ambiente, después de lo cual la mezcla de reacción se añadió a una solución acuosa de bicarbonato de sodio (200 ml) y se extrajo con éter dietílico (3 x 200 ml). Los extractos orgánicos combinados se lavaron una vez con agua (100 ml) y se secaron sobre $MgSO_4$ y se concentraron a presión reducida. El residuo sólido resultante se purificó mediante cromatografía sobre gel de sílice (acetato de etilo/hexanos) para proporcionar el compuesto del título en forma de un sólido (1,74 g). RMN H^1 ($CDCl_3$) δ 10,06 (s, 1H), 8,59 (s, 1H), 8,11 (s, 1H), 7,95-8,00 (m, 1H), 7,86-7,89 (m, 2H), 7,66 (d, 2H), 7,21 (t, 2H).

Etapas C: Preparación de 1-[[3-(4-fluorofenil)-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1*H*-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinocarbonitrilo

- 35 A una suspensión de hidruro de litio y aluminio (1,0 g, 26 mmoles) en tetrahidrofurano (25 ml) se añadió una solución de 4-carboxaldehído de 3-(4-fluorofenil)-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1*H*-pirazol (1,74 g, 5,21 mmoles) en tetrahidrofurano (25 ml). La mezcla de reacción se dejó en agitación durante 18 horas, después de lo cual se añadió una solución acuosa al 50% de NaOH (1 ml), seguido de agua (1 ml). La mezcla de reacción se dejó en agitación durante 1 hora, se añadió sulfato de magnesio y la mezcla de reacción se filtró. El filtrado se concentró a presión reducida para producir el alcohol intermedio bruto (1,58 g). Este alcohol se disolvió en éter dietílico (100 ml) y se añadió gota a gota tribromuro de fósforo (1,276 g, 4,714 mmoles). La mezcla de reacción se dejó en agitación durante 18 horas a temperatura ambiente bajo nitrógeno. La mezcla de reacción se añadió después a agua (100 ml) y se extrajo con éter dietílico (3 x 125 ml). Los extractos orgánicos combinados se secaron ($MgSO_4$), se concentraron a presión reducida, y el residuo sólido resultante se purificó mediante cromatografía sobre gel de sílice (acetato de etilo/hexanos) para proporcionar el bromuro intermedio (632 mg). Una porción del bromuro intermedio (200 mg, 0,504 mmoles) y piperidino-4-carbonitrilo (300 mg, 2,73 mmoles) se combinaron en acetonitrilo (20 ml) con carbonato de potasio (365 mg, 2,73 mmoles). La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 18 horas. La mezcla de reacción se añadió a continuación a agua (100 ml) y se extrajo con acetato de etilo (3 x 100 ml). Los extractos orgánicos combinados se secaron ($MgSO_4$), se concentraron a presión reducida, y el residuo sólido resultante se purificó mediante cromatografía sobre gel de sílice (acetato de etilo/hexanos) para proporcionar el compuesto del título (203 mg), un compuesto de esta invención. RMN H^1 ($CDCl_3$) δ 8,03 (s, 1H), 7,90-7,94 (m, 4H), 7,52-7,61 (m, 2H), 7,14 (t, 2H), 3,49 (s, 2H), 2,71 (m, 3H), 2,43 (m, 2H), 1,86-1,97 (m, 4H).

Ejemplo de síntesis 2

Preparación de 1-[[1-(2,4-difluorofenil)-3-(2-fluoro-4-metilfenil)-1*H*-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinacarboxilato de metilo (compuesto número 16)

Etapas A: Preparación de 1-(2-fluoro-4-metilfenil)etanona 2-(2,4-difluorofenil)hidrazona

- 55 A una solución de 2-fluoro-4-metilacetofenona (4,210 g, 27,70 mmoles) en etanol (200 ml) se añadió sal de HCl de 2,4-difluorofenil hidrazina (5,0 g, 28 mmoles). A esta mezcla de reacción se añadió acetato de sodio (2.044, 24.93

mmoles) en una porción. Esta mezcla de reacción se agitó durante 18 horas, después de lo cual los materiales volátiles se eliminaron a presión reducida, y la mezcla de reacción bruta resultante se añadió a agua (100 ml) y se extrajo con éter dietílico (3 x 200 ml). Los extractos orgánicos se combinaron, se secaron (MgSO₄), se evaporaron a presión reducida, y el residuo sólido se purificó mediante cromatografía sobre gel de sílice (acetato de etilo/hexanos) para proporcionar el compuesto del título en forma de un sólido (7,417 g). RMN H¹ (CDCl₃) δ 7,49-7,56 (m, 2H), 7,34 (s ancho, NH) 6,97 (d, 1H), 6,80-6,91 (m, 3H), 2,37 (s, 3H), 2,28 (s, 3H).

Etapa B: Preparación de 1-(2,4-difluorofenil)-3-(2-fluoro-4-metilfenil)-1H-pirazol-4-carboxaldehído

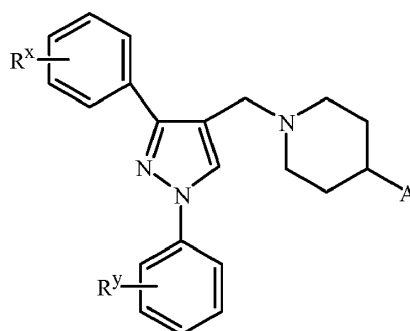
Se añadió cloruro cianúrico (15,0 g, 81,3 mmoles) en una porción *n,n*-dimetilformamida anhidra (75 ml) en una atmósfera de nitrógeno. La mezcla de reacción se dejó en agitación a temperatura ambiente hasta que ya no se pudo detectar el cloruro cianúrico por UV. Después del consumo completo del cloruro cianúrico, se añadió 1-(2-fluoro-4-metilfenil)etanona 2-(2,4-difluorofenil) hidrazona (7,417 g, 26,68 mmoles) en *n,n*-dimetilformamida anhidra (25 ml). La mezcla de reacción se dejó en agitación durante 18 horas a temperatura ambiente, después de lo cual la mezcla de reacción se añadió a una solución acuosa de bicarbonato sódico (200 ml) y se extrajo con éter dietílico (3 x 200 ml). Los extractos orgánicos combinados se lavaron una vez con agua (100 ml) y se secaron (MgSO₄), se evaporaron a presión reducida, y el residuo sólido se purificó mediante cromatografía sobre gel de sílice (acetato de etilo/hexanos) para proporcionar el compuesto del título en forma de un sólido (6,877 g). RMN H¹ (CDCl₃) δ 9,85 (s, 1H), 8,49 (s, 1H), 7,89-7,96 (m, 1H), 7,49 (t, 1H), 6,99-7,06 (m, 4H), 2,39 (s, 3H).

Etapa C: Preparación de 1-[[1-(2,4-difluorofenil)-3-(2-fluoro-4-metilfenil)-1H-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinacarboxilato de metilo

A una solución de éster metílico del ácido piperidino-4-carboxílico (300 mg, 1,80 mmoles) en diclorometano (25 ml) se le añadió 1-(2,4-difluorofenil)-3-(2-fluoro-4-metilfenil)-1H-pirazol-4-carboxaldehído (300 mg, 0,949 mmoles). La mezcla de reacción se dejó en agitación durante 1 hora, y a continuación se añadió triacetoxiborohidruro sódico (358 mg, 1,90 mmoles) en una porción. La mezcla de reacción se agitó durante 18 horas, y a continuación se añadió a 100 ml de agua (100 ml) y se extrajo con diclorometano (3 x 100 ml). Los extractos orgánicos combinados se secaron (MgSO₄), se evaporaron a presión reducida, y el residuo se purificó mediante cromatografía sobre gel de sílice (acetato de etilo/hexanos) para proporcionar el compuesto del título (144,3 mg), un compuesto de esta invención. RMN H¹ (CDCl₃) δ 7,98 (d, 1H), 7,90-7,94 (m, 1H), 7,48 (t, 1H), 6,96-7,03 (m, 4H), 3,65 (s, 3H), 3,46 (s, 2H), 2,84-2,87 (m, 2H), 2,41 (s, 3 H) 2,24-2,31 (m, 1H), 1,96-2,01 (m, 2H), 1,83-1,86 (m, 2H), 1,67-1,74 (m, 2H).

Mediante los procedimientos descritos en la presente memoria junto con los métodos conocidos en la técnica, se pueden preparar los siguientes compuestos de las Tablas 1 a 6b. Las siguientes abreviaturas se utilizan en las Tablas 1 a 6b siguientes: Me significa metilo y Et significa etilo. R^x y R^y representan uno o una combinación de sustituyentes.

TABLA 1



A es ciano

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	2-F	2-F	3-F	2-F	3-Cl
2-Cl	2-F	2-Cl	3-F	2-Cl	3-Cl
2-Br	2-F	2-Br	3-F	2-Br	3-Cl
2-Me	2-F	2-Me	3-F	2-Me	3-Cl
2-CF ₃	2-F	2-CF ₃	3-F	2-CF ₃	3-Cl
4-F	2-F	4-F	3-F	4-F	3-Cl

ES 2 659 033 T3

A es ciano

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
4-Cl	2-F	4-Cl	3-F	4-Cl	3-Cl
4-Br	2-F	4-Br	3-F	4-Br	3-Cl
2-F, 4-F	2-F	2-F, 4-F	3-F	2-F, 4-F	3-Cl
2-Cl, 4-F	2-F	2-Cl, 4-F	3-F	2-Cl, 4-F	3-Cl
2-Me, 4-F	2-F	2-Me, 4-F	3-F	2-Me, 4-F	3-Cl
2-F, 6-F	2-F	2-F, 6-F	3-F	2-F, 6-F	3-Cl
2-Cl, 6-Cl	2-F	2-Cl, 6-Cl	3-F	2-Cl, 6-Cl	3-Cl
2-Me, 6-Me	2-F	2-Me, 6-Me	3-F	2-Me, 6-Me	3-Cl
2-F, 4-F, 6-F	2-F	2-F, 4-F, 6-F	3-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl
2-F	3-Br	2-F	3-CF ₃	2-F	3-OCF ₃
2-Cl	3-Br	2-Cl	3-CF ₃	2-Cl	3-OCF ₃
2-Br	3-Br	2-Br	3-CF ₃	2-Br	3-OCF ₃
2-Me	3-Br	2-Me	3-CF ₃	2-Me	3-OCF ₃
2-CF ₃	3-Br	2-CF ₃	3-CF ₃	2-CF ₃	3-OCF ₃
4-F	3-Br	4-F	3-CF ₃	4-F	3-OCF ₃
4-Cl	3-Br	4-Cl	3-CF ₃	4-Cl	3-OCF ₃
4-Br	3-Br	4-Br	3-CF ₃	4-Br	3-OCF ₃
2-F, 4-F	3-Br	2-F, 4-F	3-CF ₃	2-F, 4-F	3-OCF ₃
2-Cl, 4-F	3-Br	2-Cl, 4-F	3-CF ₃	2-Cl, 4-F	3-OCF ₃
2-Me, 4-F	3-Br	2-Me, 4-F	3-CF ₃	2-Me, 4-F	3-OCF ₃
2-F, 6-F	3-Br	2-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 6-F	3-OCF ₃
2-Cl, 6-Cl	3-Br	2-Cl, 6-Cl	3-CF ₃	2-Cl, 6-Cl	3-OCF ₃
2-Me, 6-Me	3-Br	2-Me, 6-Me	3-CF ₃	2-Me, 6-Me	3-OCF ₃
2-F, 4-F, 6-F	3-Br	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-OCF ₃
2-F	4-F	2-F	4-Cl	2-F	4-Br
2-Cl	4-F	2-Cl	4-Cl	2-Cl	4-Br
2-Br	4-F	2-Br	4-Cl	2-Br	4-Br
2-Me	4-F	2-Me	4-Cl	2-Me	4-Br
2-CF ₃	4-F	2-CF ₃	4-Cl	2-CF ₃	4-Br
4-F	4-F	4-F	4-Cl	4-F	4-Br
4-Cl	4-F	4-Cl	4-Cl	4-Cl	4-Br
4-Br	4-F	4-Br	4-Cl	4-Br	4-Br
2-F, 4-F	4-F	2-F, 4-F	4-Cl	2-F, 4-F	4-Br
2-Cl, 4-F	4-F	2-Cl, 4-F	4-Cl	2-Cl, 4-F	4-Br

ES 2 659 033 T3

A es ciano

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-Me, 4-F	4-F	2-Me, 4-F	4-Cl	2-Me, 4-F	4-Br
2-F, 6-F	4-F	2-F, 6-F	4-Cl	2-F, 6-F	4-Br
2-Cl, 6-Cl	4-F	2-Cl, 6-Cl	4-Cl	2-Cl, 6-Cl	4-Br
2-Me, 6-Me	4-F	2-Me, 6-Me	4-Cl	2-Me, 6-Me	4-Br
2-F, 4-F, 6-F	4-F	2-F, 4-F, 6-F	4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	4-Br
2-F	4-CF ₃	2-F	4-OCF ₃	2-F	3-F, 4-F
2-Cl	4-CF ₃	2-Cl	4-OCF ₃	2-Cl	3-F, 4-F
2-Br	4-CF ₃	2-Br	4-OCF ₃	2-Br	3-F, 4-F
2-Me	4-CF ₃	2-Me	4-OCF ₃	2-Me	3-F, 4-F
2-CF ₃	4-CF ₃	2-CF ₃	4-OCF ₃	2-CF ₃	3-F, 4-F
4-F	4-CF ₃	4-F	4-OCF ₃	4-F	3-F, 4-F
4-Cl	4-CF ₃	4-Cl	4-OCF ₃	4-Cl	3-F, 4-F
4-Br	4-CF ₃	4-Br	4-OCF ₃	4-Br	3-F, 4-F
2-F, 4-F	4-CF ₃	2-F, 4-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F	3-F, 4-F
2-Cl, 4-F	4-CF ₃	2-Cl, 4-F	4-OCF ₃	2-Cl, 4-F	3-F, 4-F
2-Me, 4-F	4-CF ₃	2-Me, 4-F	4-OCF ₃	2-Me, 4-F	3-F, 4-F
2-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 6-F	3-F, 4-F
2-Cl, 6-Cl	4-CF ₃	2-Cl, 6-Cl	4-OCF ₃	2-Cl, 6-Cl	3-F, 4-F
2-Me, 6-Me	4-CF ₃	2-Me, 6-Me	4-OCF ₃	2-Me, 6-Me	3-F, 4-F
2-F, 4-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-F, 4-F
2-F	3-F, 4-Cl	2-F	3-F, 4-Br	2-F	3-F, 4-CF ₃
2-Cl	3-F, 4-Cl	2-Cl	3-F, 4-Br	2-Cl	3-F, 4-CF ₃
2-Br	3-F, 4-Cl	2-Br	3-F, 4-Br	2-Br	3-F, 4-CF ₃
2-Me	3-F, 4-Cl	2-Me	3-F, 4-Br	2-Me	3-F, 4-CF ₃
2-CF ₃	3-F, 4-Cl	2-CF ₃	3-F, 4-Br	2-CF ₃	3-F, 4-CF ₃
4-F	3-F, 4-Cl	4-F	3-F, 4-Br	4-F	3-F, 4-CF ₃
4-Cl	3-F, 4-Cl	4-Cl	3-F, 4-Br	4-Cl	3-F, 4-CF ₃
4-Br	3-F, 4-Cl	4-Br	3-F, 4-Br	4-Br	3-F, 4-CF ₃
2-F, 4-F	3-F, 4-Cl	2-F, 4-F	3-F, 4-Br	2-F, 4-F	3-F, 4-CF ₃
2-Cl, 4-F	3-F, 4-Cl	2-Cl, 4-F	3-F, 4-Br	2-Cl, 4-F	3-F, 4-CF ₃
2-Me, 4-F	3-F, 4-Cl	2-Me, 4-F	3-F, 4-Br	2-Me, 4-F	3-F, 4-CF ₃
2-F, 6-F	3-F, 4-Cl	2-F, 6-F	3-F, 4-Br	2-F, 6-F	3-F, 4-CF ₃
2-Cl, 6-Cl	3-F, 4-Cl	2-Cl, 6-Cl	3-F, 4-Br	2-Cl, 6-Cl	3-F, 4-CF ₃
2-Me, 6-Me	3-F, 4-Cl	2-Me, 6-Me	3-F, 4-Br	2-Me, 6-Me	3-F, 4-CF ₃

ES 2 659 033 T3

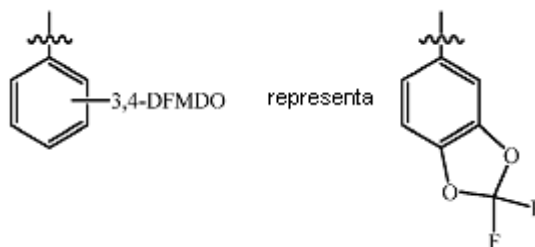
A es ciano

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F, 4-F, 6-F	3-F, 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-F, 4-Br	2-F, 4-F, 6-F	3-F, 4-CF ₃
2-F	3-F, 4-OCF ₃	2-F	3-Cl, 4-F	2-F	3-Cl, 4-Cl
2-Cl	3-F, 4-OCF ₃	2-Cl	3-Cl, 4-F	2-Cl	3-Cl, 4-Cl
2-Br	3-F, 4-OCF ₃	2-Br	3-Cl, 4-F	2-Br	3-Cl, 4-Cl
2-Me	3-F, 4-OCF ₃	2-Me	3-Cl, 4-F	2-Me	3-Cl, 4-Cl
2-CF ₃	3-F, 4-OCF ₃	2-CF ₃	3-Cl, 4-F	2-CF ₃	3-Cl, 4-Cl
4-F	3-F, 4-OCF ₃	4-F	3-Cl, 4-F	4-F	3-Cl, 4-Cl
4-Cl	3-F, 4-OCF ₃	4-Cl	3-Cl, 4-F	4-Cl	3-Cl, 4-Cl
4-Br	3-F, 4-OCF ₃	4-Br	3-Cl, 4-F	4-Br	3-Cl, 4-Cl
2-F, 4-F	3-F, 4-OCF ₃	2-F, 4-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Cl, 4-F	3-F, 4-OCF ₃	2-Cl, 4-F	3-Cl, 4-F	2-Cl, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Me, 4-F	3-F, 4-OCF ₃	2-Me, 4-F	3-Cl, 4-F	2-Me, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-F, 6-F	3-F, 4-OCF ₃	2-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl
2-Cl, 6-Cl	3-F, 4-OCF ₃	2-Cl, 6-Cl	3-Cl, 4-F	2-Cl, 6-Cl	3-Cl, 4-Cl
2-Me, 6-Me	3-F, 4-OCF ₃	2-Me, 6-Me	3-Cl, 4-F	2-Me, 6-Me	3-Cl, 4-Cl
2-F, 4-F, 6-F	3-F, 4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F	3-Br, 4-F	2-F	3-CF ₃ , 4-F
2-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl	3-Br, 4-F	2-Cl	3-CF ₃ , 4-F
2-Br	3-Cl, 4-CF ₃	2-Br	3-Br, 4-F	2-Br	3-CF ₃ , 4-F
2-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-Me	3-Br, 4-F	2-Me	3-CF ₃ , 4-F
2-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	2-CF ₃	3-Br, 4-F	2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-F
4-F	3-Cl, 4-CF ₃	4-F	3-Br, 4-F	4-F	3-CF ₃ , 4-F
4-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	4-Cl	3-Br, 4-F	4-Cl	3-CF ₃ , 4-F
4-Br	3-Cl, 4-CF ₃	4-Br	3-Br, 4-F	4-Br	3-CF ₃ , 4-F
2-F, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F	3-Br, 4-F	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-F
2-Cl, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl, 4-F	3-Br, 4-F	2-Cl, 4-F	3-CF ₃ , 4-F
2-Me, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Me, 4-F	3-Br, 4-F	2-Me, 4-F	3-CF ₃ , 4-F
2-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 6-F	3-Br, 4-F	2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-F
2-Cl, 6-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl, 6-Cl	3-Br, 4-F	2-Cl, 6-Cl	3-CF ₃ , 4-F
2-Me, 6-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-Me, 6-Me	3-Br, 4-F	2-Me, 6-Me	3-CF ₃ , 4-F
2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Br, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-F
2-F	3-CF ₃ , 4-Cl	4-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Me, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	4-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Br	3-CF ₃ , 4-Cl	4-Br	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl, 6-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl

A es ciano

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-Me	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Me, 6-Me	3-CF ₃ , 4-Cl
2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F	3,4-DFMDO*	4-F	3,4-DFMDO*	2-Me, 4-F	3,4-DFMDO*
2-Cl	3,4-DFMDO*	4-Cl	3,4-DFMDO*	2-F, 6-F	3,4-DFMDO*
2-Br	3,4-DFMDO*	4-Br	3,4-DFMDO*	2-Cl, 6-Cl	3,4-DFMDO*
2-Me	3,4-DFMDO*	2-F, 4-F	3,4-DFMDO*	2-Me, 6-Me	3,4-DFMDO*
2-CF ₃	3,4-DFMDO*	2-Cl, 4-F	3,4-DFMDO*	2-F, 4-F, 6-F	3,4-DFMDO*

* 3,4-DFMDO es 3,4-difluorometilenedioxi como se muestra a continuación:



A es CO₂Me

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	2-F	2-F	3-F	2-F	3-Cl
2-Cl	2-F	2-Cl	3-F	2-Cl	3-Cl
2-Br	2-F	2-Br	3-F	2-Br	3-Cl
2-Me	2-F	2-Me	3-F	2-Me	3-Cl
2-CF ₃	2-F	2-CF ₃	3-F	2-CF ₃	3-Cl
4-F	2-F	4-F	3-F	4-F	3-Cl
4-Cl	2-F	4-Cl	3-F	4-Cl	3-Cl
4-Br	2-F	4-Br	3-F	4-Br	3-Cl
2-F, 4-F	2-F	2-F, 4-F	3-F	2-F, 4-F	3-Cl
2-Cl, 4-F	2-F	2-Cl, 4-F	3-F	2-Cl, 4-F	3-Cl
2-Me, 4-F	2-F	2-Me, 4-F	3-F	2-Me, 4-F	3-Cl
2-F, 6-F	2-F	2-F, 6-F	3-F	2-F, 6-F	3-Cl
2-Cl, 6-Cl	2-F	2-Cl, 6-Cl	3-F	2-Cl, 6-Cl	3-Cl
2-Me, 6-Me	2-F	2-Me, 6-Me	3-F	2-Me, 6-Me	3-Cl
2-F, 4-F, 6-F	2-F	2-F, 4-F, 6-F	3-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl
2-F	3-Br	2-F	3-CF ₃	2-F	3-OCF ₃
2-Cl	3-Br	2-Cl	3-CF ₃	2-Cl	3-OCF ₃
2-Br	3-Br	2-Br	3-CF ₃	2-Br	3-OCF ₃
2-Me	3-Br	2-Me	3-CF ₃	2-Me	3-OCF ₃
2-CF ₃	3-Br	2-CF ₃	3-CF ₃	2-CF ₃	3-OCF ₃

ES 2 659 033 T3

A es CO₂Me

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
4-F	3-Br	4-F	3-CF ₃	4-F	3-OCF ₃
4-Cl	3-Br	4-Cl	3-CF ₃	4-Cl	3-OCF ₃
4-Br	3-Br	4-Br	3-CF ₃	4-Br	3-OCF ₃
2-F, 4-F	3-Br	2-F, 4-F	3-CF ₃	2-F, 4-F	3-OCF ₃
2-Cl, 4-F	3-Br	2-Cl, 4-F	3-CF ₃	2-Cl, 4-F	3-OCF ₃
2-Me, 4-F	3-Br	2-Me, 4-F	3-CF ₃	2-Me, 4-F	3-OCF ₃
2-F, 6-F	3-Br	2-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 6-F	3-OCF ₃
2-Cl, 6-Cl	3-Br	2-Cl, 6-Cl	3-CF ₃	2-Cl, 6-Cl	3-OCF ₃
2-Me, 6-Me	3-Br	2-Me, 6-Me	3-CF ₃	2-Me, 6-Me	3-OCF ₃
2-F, 4-F, 6-F	3-Br	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-OCF ₃
2-F	4-F	2-F	4-Cl	2-F	4-Br
2-Cl	4-F	2-Cl	4-Cl	2-Cl	4-Br
2-Br	4-F	2-Br	4-Cl	2-Br	4-Br
2-Me	4-F	2-Me	4-Cl	2-Me	4-Br
2-CF ₃	4-F	2-CF ₃	4-Cl	2-CF ₃	4-Br
4-F	4-F	4-F	4-Cl	4-F	4-Br
4-Cl	4-F	4-Cl	4-Cl	4-Cl	4-Br
4-Br	4-F	4-Br	4-Cl	4-Br	4-Br
2-F, 4-F	4-F	2-F, 4-F	4-Cl	2-F, 4-F	4-Br
2-Cl, 4-F	4-F	2-Cl, 4-F	4-Cl	2-Cl, 4-F	4-Br
2-Me, 4-F	4-F	2-Me, 4-F	4-Cl	2-Me, 4-F	4-Br
2-F, 6-F	4-F	2-F, 6-F	4-Cl	2-F, 6-F	4-Br
2-Cl, 6-Cl	4-F	2-Cl, 6-Cl	4-Cl	2-Cl, 6-Cl	4-Br
2-Me, 6-Me	4-F	2-Me, 6-Me	4-Cl	2-Me, 6-Me	4-Br
2-F, 4-F, 6-F	4-F	2-F, 4-F, 6-F	4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	4-Br
2-F	4-CF ₃	2-F	4-OCF ₃	2-F	3-F, 4-F
2-Cl	4-CF ₃	2-Cl	4-OCF ₃	2-Cl	3-F, 4-F
2-Br	4-CF ₃	2-Br	4-OCF ₃	2-Br	3-F, 4-F
2-Me	4-CF ₃	2-Me	4-OCF ₃	2-Me	3-F, 4-F
2-CF ₃	4-CF ₃	2-CF ₃	4-OCF ₃	2-CF ₃	3-F, 4-F
4-F	4-CF ₃	4-F	4-OCF ₃	4-F	3-F, 4-F
4-Cl	4-CF ₃	4-Cl	4-OCF ₃	4-Cl	3-F, 4-F
4-Br	4-CF ₃	4-Br	4-OCF ₃	4-Br	3-F, 4-F
2-F, 4-F	4-CF ₃	2-F, 4-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F	3-F, 4-F
2-Cl, 4-F	4-CF ₃	2-Cl, 4-F	4-OCF ₃	2-Cl, 4-F	3-F, 4-F
2-Me, 4-F	4-CF ₃	2-Me, 4-F	4-OCF ₃	2-Me, 4-F	3-F, 4-F
2-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 6-F	3-F, 4-F
2-Cl, 6-Cl	4-CF ₃	2-Cl, 6-Cl	4-OCF ₃	2-Cl, 6-Cl	3-F, 4-F
2-Me, 6-Me	4-CF ₃	2-Me, 6-Me	4-OCF ₃	2-Me, 6-Me	3-F, 4-F

ES 2 659 033 T3

A es CO₂Me

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F, 4-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-F, 4-F
2-F	3-F, 4-Cl	2-F	3-F, 4-Br	2-F	3-F, 4-CF ₃
2-Cl	3-F, 4-Cl	2-Cl	3-F, 4-Br	2-Cl	3-F, 4-CF ₃
2-Br	3-F, 4-Cl	2-Br	3-F, 4-Br	2-Br	3-F, 4-CF ₃
2-Me	3-F, 4-Cl	2-Me	3-F, 4-Br	2-Me	3-F, 4-CF ₃
2-CF ₃	3-F, 4-Cl	2-CF ₃	3-F, 4-Br	2-CF ₃	3-F, 4-CF ₃
4-F	3-F, 4-Cl	4-F	3-F, 4-Br	4-F	3-F, 4-CF ₃
4-Cl	3-F, 4-Cl	4-Cl	3-F, 4-Br	4-Cl	3-F, 4-CF ₃
4-Br	3-F, 4-Cl	4-Br	3-F, 4-Br	4-Br	3-F, 4-CF ₃
2-F, 4-F	3-F, 4-Cl	2-F, 4-F	3-F, 4-Br	2-F, 4-F	3-F, 4-CF ₃
2-Cl, 4-F	3-F, 4-Cl	2-Cl, 4-F	3-F, 4-Br	2-Cl, 4-F	3-F, 4-CF ₃
2-Me, 4-F	3-F, 4-Cl	2-Me, 4-F	3-F, 4-Br	2-Me, 4-F	3-F, 4-CF ₃
2-F, 6-F	3-F, 4-Cl	2-F, 6-F	3-F, 4-Br	2-F, 6-F	3-F, 4-CF ₃
2-Cl, 6-Cl	3-F, 4-Cl	2-Cl, 6-Cl	3-F, 4-Br	2-Cl, 6-Cl	3-F, 4-CF ₃
2-Me, 6-Me	3-F, 4-Cl	2-Me, 6-Me	3-F, 4-Br	2-Me, 6-Me	3-F, 4-CF ₃
2-F, 4-F, 6-F	3-F, 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-F, 4-Br	2-F, 4-F, 6-F	3-F, 4-CF ₃
2-F	3-F, 4-OCF ₃	2-F	3-Cl, 4-F	2-F	3-Cl, 4-Cl
2-Cl	3-F, 4-OCF ₃	2-Cl	3-Cl, 4-F	2-Cl	3-Cl, 4-Cl
2-Br	3-F, 4-OCF ₃	2-Br	3-Cl, 4-F	2-Br	3-Cl, 4-Cl
2-Me	3-F, 4-OCF ₃	2-Me	3-Cl, 4-F	2-Me	3-Cl, 4-Cl
2-CF ₃	3-F, 4-OCF ₃	2-CF ₃	3-Cl, 4-F	2-CF ₃	3-Cl, 4-Cl
4-F	3-F, 4-OCF ₃	4-F	3-Cl, 4-F	4-F	3-Cl, 4-Cl
4-Cl	3-F, 4-OCF ₃	4-Cl	3-Cl, 4-F	4-Cl	3-Cl, 4-Cl
4-Br	3-F, 4-OCF ₃	4-Br	3-Cl, 4-F	4-Br	3-Cl, 4-Cl
2-F, 4-F	3-F, 4-OCF ₃	2-F, 4-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Cl, 4-F	3-F, 4-OCF ₃	2-Cl, 4-F	3-Cl, 4-F	2-Cl, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Me, 4-F	3-F, 4-OCF ₃	2-Me, 4-F	3-Cl, 4-F	2-Me, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-F, 6-F	3-F, 4-OCF ₃	2-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl
2-Cl, 6-Cl	3-F, 4-OCF ₃	2-Cl, 6-Cl	3-Cl, 4-F	2-Cl, 6-Cl	3-Cl, 4-Cl
2-Me, 6-Me	3-F, 4-OCF ₃	2-Me, 6-Me	3-Cl, 4-F	2-Me, 6-Me	3-Cl, 4-Cl
2-F, 4-F, 6-F	3-F, 4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F	3-Br, 4-F	2-F	3-CF ₃ , 4-F
2-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl	3-Br, 4-F	2-Cl	3-CF ₃ , 4-F
2-Br	3-Cl, 4-CF ₃	2-Br	3-Br, 4-F	2-Br	3-CF ₃ , 4-F
2-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-Me	3-Br, 4-F	2-Me	3-CF ₃ , 4-F
2-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	2-CF ₃	3-Br, 4-F	2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-F
4-F	3-Cl, 4-CF ₃	4-F	3-Br, 4-F	4-F	3-CF ₃ , 4-F
4-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	4-Cl	3-Br, 4-F	4-Cl	3-CF ₃ , 4-F
4-Br	3-Cl, 4-CF ₃	4-Br	3-Br, 4-F	4-Br	3-CF ₃ , 4-F

ES 2 659 033 T3

A es CO₂Me

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F	3-Br, 4-F	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-F
2-Cl, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl, 4-F	3-Br, 4-F	2-Cl, 4-F	3-CF ₃ , 4-F
2-Me, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Me, 4-F	3-Br, 4-F	2-Me, 4-F	3-CF ₃ , 4-F
2-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 6-F	3-Br, 4-F	2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-F
2-Cl, 6-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl, 6-Cl	3-Br, 4-F	2-Cl, 6-Cl	3-CF ₃ , 4-F
2-Me, 6-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-Me, 6-Me	3-Br, 4-F	2-Me, 6-Me	3-CF ₃ , 4-F
2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Br, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-F
2-F	3-CF ₃ , 4-Cl	4-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Me, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	4-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Br	3-CF ₃ , 4-Cl	4-Br	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl, 6-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Me	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Me, 6-Me	3-CF ₃ , 4-Cl
2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F	3,4-DFMDO*	4-F	3,4-DFMDO*	2-Me, 4-F	3,4-DFMDO*
2-Cl	3,4-DFMDO*	4-Cl	3,4-DFMDO*	2-F, 6-F	3,4-DFMDO*
2-Br	3,4-DFMDO*	4-Br	3,4-DFMDO*	2-Cl, 6-Cl	3,4-DFMDO*
2-Me	3,4-DFMDO*	2-F, 4-F	3,4-DFMDO*	2-Me, 6-Me	3,4-DFMDO*
2-CF ₃	3,4-DFMDO*	2-Cl, 4-F	3,4-DFMDO*	2-F, 4-F, 6-F	3,4-DFMDO*

A es CO₂Et

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	2-F	2-F	3-F	2-F	3-Cl
2-Cl	2-F	2-Cl	3-F	2-Cl	3-Cl
2-Br	2-F	2-Br	3-F	2-Br	3-Cl
2-Me	2-F	2-Me	3-F	2-Me	3-Cl
2-CF ₃	2-F	2-CF ₃	3-F	2-CF ₃	3-Cl
4-F	2-F	4-F	3-F	4-F	3-Cl
4-Cl	2-F	4-Cl	3-F	4-Cl	3-Cl
4-Br	2-F	4-Br	3-F	4-Br	3-Cl
2-F, 4-F	2-F	2-F, 4-F	3-F	2-F, 4-F	3-Cl
2-Cl, 4-F	2-F	2-Cl, 4-F	3-F	2-Cl, 4-F	3-Cl
2-Me, 4-F	2-F	2-Me, 4-F	3-F	2-Me, 4-F	3-Cl
2-F, 6-F	2-F	2-F, 6-F	3-F	2-F, 6-F	3-Cl
2-Cl, 6-Cl	2-F	2-Cl, 6-Cl	3-F	2-Cl, 6-Cl	3-Cl
2-Me, 6-Me	2-F	2-Me, 6-Me	3-F	2-Me, 6-Me	3-Cl
2-F, 4-F, 6-F	2-F	2-F, 4-F, 6-F	3-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl
2-F	3-Br	2-F	3-CF ₃	2-F	3-OCF ₃
2-Cl	3-Br	2-Cl	3-CF ₃	2-Cl	3-OCF ₃
2-Br	3-Br	2-Br	3-CF ₃	2-Br	3-OCF ₃
2-Me	3-Br	2-Me	3-CF ₃	2-Me	3-OCF ₃

ES 2 659 033 T3

A es CO₂Et

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-CF ₃	3-Br	2-CF ₃	3-CF ₃	2-CF ₃	3-OCF ₃
4-F	3-Br	4-F	3-CF ₃	4-F	3-OCF ₃
4-Cl	3-Br	4-Cl	3-CF ₃	4-Cl	3-OCF ₃
4-Br	3-Br	4-Br	3-CF ₃	4-Br	3-OCF ₃
2-F, 4-F	3-Br	2-F, 4-F	3-CF ₃	2-F, 4-F	3-OCF ₃
2-Cl, 4-F	3-Br	2-Cl, 4-F	3-CF ₃	2-Cl, 4-F	3-OCF ₃
2-Me, 4-F	3-Br	2-Me, 4-F	3-CF ₃	2-Me, 4-F	3-OCF ₃
2-F, 6-F	3-Br	2-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 6-F	3-OCF ₃
2-Cl, 6-Cl	3-Br	2-Cl, 6-Cl	3-CF ₃	2-Cl, 6-Cl	3-OCF ₃
2-Me, 6-Me	3-Br	2-Me, 6-Me	3-CF ₃	2-Me, 6-Me	3-OCF ₃
2-F, 4-F, 6-F	3-Br	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-OCF ₃
2-F	4-F	2-F	4-Cl	2-F	4-Br
2-Cl	4-F	2-Cl	4-Cl	2-Cl	4-Br
2-Br	4-F	2-Br	4-Cl	2-Br	4-Br
2-Me	4-F	2-Me	4-Cl	2-Me	4-Br
2-CF ₃	4-F	2-CF ₃	4-Cl	2-CF ₃	4-Br
4-F	4-F	4-F	4-Cl	4-F	4-Br
4-Cl	4-F	4-Cl	4-Cl	4-Cl	4-Br
4-Br	4-F	4-Br	4-Cl	4-Br	4-Br
2-F, 4-F	4-F	2-F, 4-F	4-Cl	2-F, 4-F	4-Br
2-Cl, 4-F	4-F	2-Cl, 4-F	4-Cl	2-Cl, 4-F	4-Br
2-Me, 4-F	4-F	2-Me, 4-F	4-Cl	2-Me, 4-F	4-Br
2-F, 6-F	4-F	2-F, 6-F	4-Cl	2-F, 6-F	4-Br
2-Cl, 6-Cl	4-F	2-Cl, 6-Cl	4-Cl	2-Cl, 6-Cl	4-Br
2-Me, 6-Me	4-F	2-Me, 6-Me	4-Cl	2-Me, 6-Me	4-Br
2-F, 4-F, 6-F	4-F	2-F, 4-F, 6-F	4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	4-Br
2-F	4-CF ₃	2-F	4-OCF ₃	2-F	3-F, 4-F
2-Cl	4-CF ₃	2-Cl	4-OCF ₃	2-Cl	3-F, 4-F
2-Br	4-CF ₃	2-Br	4-OCF ₃	2-Br	3-F, 4-F
2-Me	4-CF ₃	2-Me	4-OCF ₃	2-Me	3-F, 4-F
2-CF ₃	4-CF ₃	2-CF ₃	4-OCF ₃	2-CF ₃	3-F, 4-F
4-F	4-CF ₃	4-F	4-OCF ₃	4-F	3-F, 4-F
4-Cl	4-CF ₃	4-Cl	4-OCF ₃	4-Cl	3-F, 4-F
4-Br	4-CF ₃	4-Br	4-OCF ₃	4-Br	3-F, 4-F
2-F, 4-F	4-CF ₃	2-F, 4-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F	3-F, 4-F
2-Cl, 4-F	4-CF ₃	2-Cl, 4-F	4-OCF ₃	2-Cl, 4-F	3-F, 4-F
2-Me, 4-F	4-CF ₃	2-Me, 4-F	4-OCF ₃	2-Me, 4-F	3-F, 4-F
2-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 6-F	3-F, 4-F
2-Cl, 6-Cl	4-CF ₃	2-Cl, 6-Cl	4-OCF ₃	2-Cl, 6-Cl	3-F, 4-F

ES 2 659 033 T3

A es CO₂Et

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-Me, 6-Me	4-CF ₃	2-Me, 6-Me	4-OCF ₃	2-Me, 6-Me	3-F, 4-F
2-F, 4-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-F, 4-F
2-F	3-F, 4-Cl	2-F	3-F, 4-Br	2-F	3-F, 4-CF ₃
2-Cl	3-F, 4-Cl	2-Cl	3-F, 4-Br	2-Cl	3-F, 4-CF ₃
2-Br	3-F, 4-Cl	2-Br	3-F, 4-Br	2-Br	3-F, 4-CF ₃
2-Me	3-F, 4-Cl	2-Me	3-F, 4-Br	2-Me	3-F, 4-CF ₃
2-CF ₃	3-F, 4-Cl	2-CF ₃	3-F, 4-Br	2-CF ₃	3-F, 4-CF ₃
4-F	3-F, 4-Cl	4-F	3-F, 4-Br	4-F	3-F, 4-CF ₃
4-Cl	3-F, 4-Cl	4-Cl	3-F, 4-Br	4-Cl	3-F, 4-CF ₃
4-Br	3-F, 4-Cl	4-Br	3-F, 4-Br	4-Br	3-F, 4-CF ₃
2-F, 4-F	3-F, 4-Cl	2-F, 4-F	3-F, 4-Br	2-F, 4-F	3-F, 4-CF ₃
2-Cl, 4-F	3-F, 4-Cl	2-Cl, 4-F	3-F, 4-Br	2-Cl, 4-F	3-F, 4-CF ₃
2-Me, 4-F	3-F, 4-Cl	2-Me, 4-F	3-F, 4-Br	2-Me, 4-F	3-F, 4-CF ₃
2-F, 6-F	3-F, 4-Cl	2-F, 6-F	3-F, 4-Br	2-F, 6-F	3-F, 4-CF ₃
2-Cl, 6-Cl	3-F, 4-Cl	2-Cl, 6-Cl	3-F, 4-Br	2-Cl, 6-Cl	3-F, 4-CF ₃
2-Me, 6-Me	3-F, 4-Cl	2-Me, 6-Me	3-F, 4-Br	2-Me, 6-Me	3-F, 4-CF ₃
2-F, 4-F, 6-F	3-F, 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-F, 4-Br	2-F, 4-F, 6-F	3-F, 4-CF ₃
2-F	3-F, 4-OCF ₃	2-F	3-Cl, 4-F	2-F	3-Cl, 4-Cl
2-Cl	3-F, 4-OCF ₃	2-Cl	3-Cl, 4-F	2-Cl	3-Cl, 4-Cl
2-Br	3-F, 4-OCF ₃	2-Br	3-Cl, 4-F	2-Br	3-Cl, 4-Cl
2-Me	3-F, 4-OCF ₃	2-Me	3-Cl, 4-F	2-Me	3-Cl, 4-Cl
2-CF ₃	3-F, 4-OCF ₃	2-CF ₃	3-Cl, 4-F	2-CF ₃	3-Cl, 4-Cl
4-F	3-F, 4-OCF ₃	4-F	3-Cl, 4-F	4-F	3-Cl, 4-Cl
4-Cl	3-F, 4-OCF ₃	4-Cl	3-Cl, 4-F	4-Cl	3-Cl, 4-Cl
4-Br	3-F, 4-OCF ₃	4-Br	3-Cl, 4-F	4-Br	3-Cl, 4-Cl
2-F, 4-F	3-F, 4-OCF ₃	2-F, 4-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Cl, 4-F	3-F, 4-OCF ₃	2-Cl, 4-F	3-Cl, 4-F	2-Cl, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Me, 4-F	3-F, 4-OCF ₃	2-Me, 4-F	3-Cl, 4-F	2-Me, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-F, 6-F	3-F, 4-OCF ₃	2-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl
2-Cl, 6-Cl	3-F, 4-OCF ₃	2-Cl, 6-Cl	3-Cl, 4-F	2-Cl, 6-Cl	3-Cl, 4-Cl
2-Me, 6-Me	3-F, 4-OCF ₃	2-Me, 6-Me	3-Cl, 4-F	2-Me, 6-Me	3-Cl, 4-Cl
2-F, 4-F, 6-F	3-F, 4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F	3-Br, 4-F	2-F	3-CF ₃ , 4-F
2-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl	3-Br, 4-F	2-Cl	3-CF ₃ , 4-F
2-Br	3-Cl, 4-CF ₃	2-Br	3-Br, 4-F	2-Br	3-CF ₃ , 4-F
2-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-Me	3-Br, 4-F	2-Me	3-CF ₃ , 4-F
2-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	2-CF ₃	3-Br, 4-F	2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-F
4-F	3-Cl, 4-CF ₃	4-F	3-Br, 4-F	4-F	3-CF ₃ , 4-F
4-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	4-Cl	3-Br, 4-F	4-Cl	3-CF ₃ , 4-F

ES 2 659 033 T3

A es CO₂Et

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
4-Br	3-Cl, 4-CF ₃	4-Br	3-Br, 4-F	4-Br	3-CF ₃ , 4-F
2-F, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F	3-Br, 4-F	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-F
2-Cl, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl, 4-F	3-Br, 4-F	2-Cl, 4-F	3-CF ₃ , 4-F
2-Me, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Me, 4-F	3-Br, 4-F	2-Me, 4-F	3-CF ₃ , 4-F
2-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 6-F	3-Br, 4-F	2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-F
2-Cl, 6-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl, 6-Cl	3-Br, 4-F	2-Cl, 6-Cl	3-CF ₃ , 4-F
2-Me, 6-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-Me, 6-Me	3-Br, 4-F	2-Me, 6-Me	3-CF ₃ , 4-F
2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Br, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-F
2-F	3-CF ₃ , 4-Cl	4-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Me, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	4-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Br	3-CF ₃ , 4-Cl	4-Br	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl, 6-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Me	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Me, 6-Me	3-CF ₃ , 4-Cl
2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F	3,4-DFMDO*	4-F	3,4-DFMDO*	2-Me, 4-F	3,4-DFMDO*
2-Cl	3,4-DFMDO*	4-Cl	3,4-DFMDO*	2-F, 6-F	3,4-DFMDO*
2-Br	3,4-DFMDO*	4-Br	3,4-DFMDO*	2-Cl, 6-Cl	3,4-DFMDO*
2-Me	3,4-DFMDO*	2-F, 4-F	3,4-DFMDO*	2-Me, 6-Me	3,4-DFMDO*
2-CF ₃	3,4-DFMDO*	2-Cl, 4-F	3,4-DFMDO*	2-F, 4-F, 6-F	3,4-DFMDO*

A es NHC(O)Me

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	2-F	2-F	3-F	2-F	3-Cl
2-Cl	2-F	2-Cl	3-F	2-Cl	3-Cl
2-Br	2-F	2-Br	3-F	2-Br	3-Cl
2-Me	2-F	2-Me	3-F	2-Me	3-Cl
2-CF ₃	2-F	2-CF ₃	3-F	2-CF ₃	3-Cl
4-F	2-F	4-F	3-F	4-F	3-Cl
4-Cl	2-F	4-Cl	3-F	4-Cl	3-Cl
4-Br	2-F	4-Br	3-F	4-Br	3-Cl
2-F, 4-F	2-F	2-F, 4-F	3-F	2-F, 4-F	3-Cl
2-Cl, 4-F	2-F	2-Cl, 4-F	3-F	2-Cl, 4-F	3-Cl
2-Me, 4-F	2-F	2-Me, 4-F	3-F	2-Me, 4-F	3-Cl
2-F, 6-F	2-F	2-F, 6-F	3-F	2-F, 6-F	3-Cl
2-Cl, 6-Cl	2-F	2-Cl, 6-Cl	3-F	2-Cl, 6-Cl	3-Cl
2-Me, 6-Me	2-F	2-Me, 6-Me	3-F	2-Me, 6-Me	3-Cl
2-F, 4-F, 6-F	2-F	2-F, 4-F, 6-F	3-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl
2-F	3-Br	2-F	3-CF ₃	2-F	3-OCF ₃
2-Cl	3-Br	2-Cl	3-CF ₃	2-Cl	3-OCF ₃
2-Br	3-Br	2-Br	3-CF ₃	2-Br	3-OCF ₃

ES 2 659 033 T3

A es NHC(O)Me

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-Me	3-Br	2-Me	3-CF ₃	2-Me	3-OCF ₃
2-CF ₃	3-Br	2-CF ₃	3-CF ₃	2-CF ₃	3-OCF ₃
4-F	3-Br	4-F	3-CF ₃	4-F	3-OCF ₃
4-Cl	3-Br	4-Cl	3-CF ₃	4-Cl	3-OCF ₃
4-Br	3-Br	4-Br	3-CF ₃	4-Br	3-OCF ₃
2-F, 4-F	3-Br	2-F, 4-F	3-CF ₃	2-F, 4-F	3-OCF ₃
2-Cl, 4-F	3-Br	2-Cl, 4-F	3-CF ₃	2-Cl, 4-F	3-OCF ₃
2-Me, 4-F	3-Br	2-Me, 4-F	3-CF ₃	2-Me, 4-F	3-OCF ₃
2-F, 6-F	3-Br	2-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 6-F	3-OCF ₃
2-Cl, 6-Cl	3-Br	2-Cl, 6-Cl	3-CF ₃	2-Cl, 6-Cl	3-OCF ₃
2-Me, 6-Me	3-Br	2-Me, 6-Me	3-CF ₃	2-Me, 6-Me	3-OCF ₃
2-F, 4-F, 6-F	3-Br	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-OCF ₃
2-F	4-F	2-F	4-Cl	2-F	4-Br
2-Cl	4-F	2-Cl	4-Cl	2-Cl	4-Br
2-Br	4-F	2-Br	4-Cl	2-Br	4-Br
2-Me	4-F	2-Me	4-Cl	2-Me	4-Br
2-CF ₃	4-F	2-CF ₃	4-Cl	2-CF ₃	4-Br
4-F	4-F	4-F	4-Cl	4-F	4-Br
4-Cl	4-F	4-Cl	4-Cl	4-Cl	4-Br
4-Br	4-F	4-Br	4-Cl	4-Br	4-Br
2-F, 4-F	4-F	2-F, 4-F	4-Cl	2-F, 4-F	4-Br
2-Cl, 4-F	4-F	2-Cl, 4-F	4-Cl	2-Cl, 4-F	4-Br
2-Me, 4-F	4-F	2-Me, 4-F	4-Cl	2-Me, 4-F	4-Br
2-F, 6-F	4-F	2-F, 6-F	4-Cl	2-F, 6-F	4-Br
2-Cl, 6-Cl	4-F	2-Cl, 6-Cl	4-Cl	2-Cl, 6-Cl	4-Br
2-Me, 6-Me	4-F	2-Me, 6-Me	4-Cl	2-Me, 6-Me	4-Br
2-F, 4-F, 6-F	4-F	2-F, 4-F, 6-F	4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	4-Br
2-F	4-CF ₃	2-F	4-OCF ₃	2-F	3-F, 4-F
2-Cl	4-CF ₃	2-Cl	4-OCF ₃	2-Cl	3-F, 4-F
2-Br	4-CF ₃	2-Br	4-OCF ₃	2-Br	3-F, 4-F
2-Me	4-CF ₃	2-Me	4-OCF ₃	2-Me	3-F, 4-F
2-CF ₃	4-CF ₃	2-CF ₃	4-OCF ₃	2-CF ₃	3-F, 4-F
4-F	4-CF ₃	4-F	4-OCF ₃	4-F	3-F, 4-F
4-Cl	4-CF ₃	4-Cl	4-OCF ₃	4-Cl	3-F, 4-F
4-Br	4-CF ₃	4-Br	4-OCF ₃	4-Br	3-F, 4-F
2-F, 4-F	4-CF ₃	2-F, 4-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F	3-F, 4-F
2-Cl, 4-F	4-CF ₃	2-Cl, 4-F	4-OCF ₃	2-Cl, 4-F	3-F, 4-F
2-Me, 4-F	4-CF ₃	2-Me, 4-F	4-OCF ₃	2-Me, 4-F	3-F, 4-F
2-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 6-F	3-F, 4-F

A es NHC(O)Me

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-Cl, 6-Cl	4-CF ₃	2-Cl, 6-Cl	4-OCF ₃	2-Cl, 6-Cl	3-F, 4-F
2-Me, 6-Me	4-CF ₃	2-Me, 6-Me	4-OCF ₃	2-Me, 6-Me	3-F, 4-F
2-F, 4-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-F, 4-F
2-F	3-F, 4-Cl	2-F	3-F, 4-Br	2-F	3-F, 4-CF ₃
2-Cl	3-F, 4-Cl	2-Cl	3-F, 4-Br	2-Cl	3-F, 4-CF ₃
2-Br	3-F, 4-Cl	2-Br	3-F, 4-Br	2-Br	3-F, 4-CF ₃
2-Me	3-F, 4-Cl	2-Me	3-F, 4-Br	2-Me	3-F, 4-CF ₃
2-CF ₃	3-F, 4-Cl	2-CF ₃	3-F, 4-Br	2-CF ₃	3-F, 4-CF ₃
4-F	3-F, 4-Cl	4-F	3-F, 4-Br	4-F	3-F, 4-CF ₃
4-Cl	3-F, 4-Cl	4-Cl	3-F, 4-Br	4-Cl	3-F, 4-CF ₃
4-Br	3-F, 4-Cl	4-Br	3-F, 4-Br	4-Br	3-F, 4-CF ₃
2-F, 4-F	3-F, 4-Cl	2-F, 4-F	3-F, 4-Br	2-F, 4-F	3-F, 4-CF ₃
2-Cl, 4-F	3-F, 4-Cl	2-Cl, 4-F	3-F, 4-Br	2-Cl, 4-F	3-F, 4-CF ₃
2-Me, 4-F	3-F, 4-Cl	2-Me, 4-F	3-F, 4-Br	2-Me, 4-F	3-F, 4-CF ₃
2-F, 6-F	3-F, 4-Cl	2-F, 6-F	3-F, 4-Br	2-F, 6-F	3-F, 4-CF ₃
2-Cl, 6-Cl	3-F, 4-Cl	2-Cl, 6-Cl	3-F, 4-Br	2-Cl, 6-Cl	3-F, 4-CF ₃
2-Me, 6-Me	3-F, 4-Cl	2-Me, 6-Me	3-F, 4-Br	2-Me, 6-Me	3-F, 4-CF ₃
2-F, 4-F, 6-F	3-F, 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-F, 4-Br	2-F, 4-F, 6-F	3-F, 4-CF ₃
2-F	3-F, 4-OCF ₃	2-F	3-Cl, 4-F	2-F	3-Cl, 4-Cl
2-Cl	3-F, 4-OCF ₃	2-Cl	3-Cl, 4-F	2-Cl	3-Cl, 4-Cl
2-Br	3-F, 4-OCF ₃	2-Br	3-Cl, 4-F	2-Br	3-Cl, 4-Cl
2-Me	3-F, 4-OCF ₃	2-Me	3-Cl, 4-F	2-Me	3-Cl, 4-Cl
2-CF ₃	3-F, 4-OCF ₃	2-CF ₃	3-Cl, 4-F	2-CF ₃	3-Cl, 4-Cl
4-F	3-F, 4-OCF ₃	4-F	3-Cl, 4-F	4-F	3-Cl, 4-Cl
4-Cl	3-F, 4-OCF ₃	4-Cl	3-Cl, 4-F	4-Cl	3-Cl, 4-Cl
4-Br	3-F, 4-OCF ₃	4-Br	3-Cl, 4-F	4-Br	3-Cl, 4-Cl
2-F, 4-F	3-F, 4-OCF ₃	2-F, 4-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Cl, 4-F	3-F, 4-OCF ₃	2-Cl, 4-F	3-Cl, 4-F	2-Cl, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Me, 4-F	3-F, 4-OCF ₃	2-Me, 4-F	3-Cl, 4-F	2-Me, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-F, 6-F	3-F, 4-OCF ₃	2-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl
2-Cl, 6-Cl	3-F, 4-OCF ₃	2-Cl, 6-Cl	3-Cl, 4-F	2-Cl, 6-Cl	3-Cl, 4-Cl
2-Me, 6-Me	3-F, 4-OCF ₃	2-Me, 6-Me	3-Cl, 4-F	2-Me, 6-Me	3-Cl, 4-Cl
2-F, 4-F, 6-F	3-F, 4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F	3-Br, 4-F	2-F	3-CF ₃ , 4-F
2-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl	3-Br, 4-F	2-Cl	3-CF ₃ , 4-F
2-Br	3-Cl, 4-CF ₃	2-Br	3-Br, 4-F	2-Br	3-CF ₃ , 4-F
2-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-Me	3-Br, 4-F	2-Me	3-CF ₃ , 4-F
2-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	2-CF ₃	3-Br, 4-F	2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-F
4-F	3-Cl, 4-CF ₃	4-F	3-Br, 4-F	4-F	3-CF ₃ , 4-F

A es NHC(O)Me

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
4-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	4-Cl	3-Br, 4-F	4-Cl	3-CF ₃ , 4-F
4-Br	3-Cl, 4-CF ₃	4-Br	3-Br, 4-F	4-Br	3-CF ₃ , 4-F
2-F, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F	3-Br, 4-F	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-F
2-Cl, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl, 4-F	3-Br, 4-F	2-Cl, 4-F	3-CF ₃ , 4-F
2-Me, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Me, 4-F	3-Br, 4-F	2-Me, 4-F	3-CF ₃ , 4-F
2-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 6-F	3-Br, 4-F	2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-F
2-Cl, 6-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl, 6-Cl	3-Br, 4-F	2-Cl, 6-Cl	3-CF ₃ , 4-F
2-Me, 6-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-Me, 6-Me	3-Br, 4-F	2-Me, 6-Me	3-CF ₃ , 4-F
2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Br, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-F
2-F	3-CF ₃ , 4-Cl	4-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Me, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	4-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Br	3-CF ₃ , 4-Cl	4-Br	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl, 6-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Me	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Me, 6-Me	3-CF ₃ , 4-Cl
2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F	3,4-DFMDO*	4-F	3,4-DFMDO*	2-Me, 4-F	3,4-DFMDO*
2-Cl	3,4-DFMDO*	4-Cl	3,4-DFMDO*	2-F, 6-F	3,4-DFMDO*
2-Br	3,4-DFMDO*	4-Br	3,4-DFMDO*	2-Cl, 6-Cl	3,4-DFMDO*
2-Me	3,4-DFMDO*	2-F, 4-F	3,4-DFMDO*	2-Me, 6-Me	3,4-DFMDO*
2-CF ₃	3,4-DFMDO*	2-Cl, 4-F	3,4-DFMDO*	2-F, 4-F, 6-F	3,4-DFMDO*

A es C(O)Me

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	2-F	2-F	3-F	2-F	3-Cl
2-Cl	2-F	2-Cl	3-F	2-Cl	3-Cl
2-Br	2-F	2-Br	3-F	2-Br	3-Cl
2-Me	2-F	2-Me	3-F	2-Me	3-Cl
2-CF ₃	2-F	2-CF ₃	3-F	2-CF ₃	3-Cl
4-F	2-F	4-F	3-F	4-F	3-Cl
4-Cl	2-F	4-Cl	3-F	4-Cl	3-Cl
4-Br	2-F	4-Br	3-F	4-Br	3-Cl
2-F, 4-F	2-F	2-F, 4-F	3-F	2-F, 4-F	3-Cl
2-Cl, 4-F	2-F	2-Cl, 4-F	3-F	2-Cl, 4-F	3-Cl
2-Me, 4-F	2-F	2-Me, 4-F	3-F	2-Me, 4-F	3-Cl
2-F, 6-F	2-F	2-F, 6-F	3-F	2-F, 6-F	3-Cl
2-Cl, 6-Cl	2-F	2-Cl, 6-Cl	3-F	2-Cl, 6-Cl	3-Cl
2-Me, 6-Me	2-F	2-Me, 6-Me	3-F	2-Me, 6-Me	3-Cl
2-F, 4-F, 6-F	2-F	2-F, 4-F, 6-F	3-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl
2-F	3-Br	2-F	3-CF ₃	2-F	3-OCF ₃
2-Cl	3-Br	2-Cl	3-CF ₃	2-Cl	3-OCF ₃

ES 2 659 033 T3

A es C(O)Me

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-Br	3-Br	2-Br	3-CF ₃	2-Br	3-OCF ₃
2-Me	3-Br	2-Me	3-CF ₃	2-Me	3-OCF ₃
2-CF ₃	3-Br	2-CF ₃	3-CF ₃	2-CF ₃	3-OCF ₃
4-F	3-Br	4-F	3-CF ₃	4-F	3-OCF ₃
4-Cl	3-Br	4-Cl	3-CF ₃	4-Cl	3-OCF ₃
4-Br	3-Br	4-Br	3-CF ₃	4-Br	3-OCF ₃
2-F, 4-F	3-Br	2-F, 4-F	3-CF ₃	2-F, 4-F	3-OCF ₃
2-Cl, 4-F	3-Br	2-Cl, 4-F	3-CF ₃	2-Cl, 4-F	3-OCF ₃
2-Me, 4-F	3-Br	2-Me, 4-F	3-CF ₃	2-Me, 4-F	3-OCF ₃
2-F, 6-F	3-Br	2-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 6-F	3-OCF ₃
2-Cl, 6-Cl	3-Br	2-Cl, 6-Cl	3-CF ₃	2-Cl, 6-Cl	3-OCF ₃
2-Me, 6-Me	3-Br	2-Me, 6-Me	3-CF ₃	2-Me, 6-Me	3-OCF ₃
2-F, 4-F, 6-F	3-Br	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-OCF ₃
2-F	4-F	2-F	4-Cl	2-F	4-Br
2-Cl	4-F	2-Cl	4-Cl	2-Cl	4-Br
2-Br	4-F	2-Br	4-Cl	2-Br	4-Br
2-Me	4-F	2-Me	4-Cl	2-Me	4-Br
2-CF ₃	4-F	2-CF ₃	4-Cl	2-CF ₃	4-Br
4-F	4-F	4-F	4-Cl	4-F	4-Br
4-Cl	4-F	4-Cl	4-Cl	4-Cl	4-Br
4-Br	4-F	4-Br	4-Cl	4-Br	4-Br
2-F, 4-F	4-F	2-F, 4-F	4-Cl	2-F, 4-F	4-Br
2-Cl, 4-F	4-F	2-Cl, 4-F	4-Cl	2-Cl, 4-F	4-Br
2-Me, 4-F	4-F	2-Me, 4-F	4-Cl	2-Me, 4-F	4-Br
2-F, 6-F	4-F	2-F, 6-F	4-Cl	2-F, 6-F	4-Br
2-Cl, 6-Cl	4-F	2-Cl, 6-Cl	4-Cl	2-Cl, 6-Cl	4-Br
2-Me, 6-Me	4-F	2-Me, 6-Me	4-Cl	2-Me, 6-Me	4-Br
2-F, 4-F, 6-F	4-F	2-F, 4-F, 6-F	4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	4-Br
2-F	4-CF ₃	2-F	4-OCF ₃	2-F	3-F, 4-F
2-Cl	4-CF ₃	2-Cl	4-OCF ₃	2-Cl	3-F, 4-F
2-Br	4-CF ₃	2-Br	4-OCF ₃	2-Br	3-F, 4-F
2-Me	4-CF ₃	2-Me	4-OCF ₃	2-Me	3-F, 4-F
2-CF ₃	4-CF ₃	2-CF ₃	4-OCF ₃	2-CF ₃	3-F, 4-F
4-F	4-CF ₃	4-F	4-OCF ₃	4-F	3-F, 4-F
4-Cl	4-CF ₃	4-Cl	4-OCF ₃	4-Cl	3-F, 4-F
4-Br	4-CF ₃	4-Br	4-OCF ₃	4-Br	3-F, 4-F
2-F, 4-F	4-CF ₃	2-F, 4-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F	3-F, 4-F
2-Cl, 4-F	4-CF ₃	2-Cl, 4-F	4-OCF ₃	2-Cl, 4-F	3-F, 4-F
2-Me, 4-F	4-CF ₃	2-Me, 4-F	4-OCF ₃	2-Me, 4-F	3-F, 4-F

ES 2 659 033 T3

A es C(O)Me

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 6-F	3-F, 4-F
2-Cl, 6-Cl	4-CF ₃	2-Cl, 6-Cl	4-OCF ₃	2-Cl, 6-Cl	3-F, 4-F
2-Me, 6-Me	4-CF ₃	2-Me, 6-Me	4-OCF ₃	2-Me, 6-Me	3-F, 4-F
2-F, 4-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-F, 4-F
2-F	3-F, 4-Cl	2-F	3-F, 4-Br	2-F	3-F, 4-CF ₃
2-Cl	3-F, 4-Cl	2-Cl	3-F, 4-Br	2-Cl	3-F, 4-CF ₃
2-Br	3-F, 4-Cl	2-Br	3-F, 4-Br	2-Br	3-F, 4-CF ₃
2-Me	3-F, 4-Cl	2-Me	3-F, 4-Br	2-Me	3-F, 4-CF ₃
2-CF ₃	3-F, 4-Cl	2-CF ₃	3-F, 4-Br	2-CF ₃	3-F, 4-CF ₃
4-F	3-F, 4-Cl	4-F	3-F, 4-Br	4-F	3-F, 4-CF ₃
4-Cl	3-F, 4-Cl	4-Cl	3-F, 4-Br	4-Cl	3-F, 4-CF ₃
4-Br	3-F, 4-Cl	4-Br	3-F, 4-Br	4-Br	3-F, 4-CF ₃
2-F, 4-F	3-F, 4-Cl	2-F, 4-F	3-F, 4-Br	2-F, 4-F	3-F, 4-CF ₃
2-Cl, 4-F	3-F, 4-Cl	2-Cl, 4-F	3-F, 4-Br	2-Cl, 4-F	3-F, 4-CF ₃
2-Me, 4-F	3-F, 4-Cl	2-Me, 4-F	3-F, 4-Br	2-Me, 4-F	3-F, 4-CF ₃
2-F, 6-F	3-F, 4-Cl	2-F, 6-F	3-F, 4-Br	2-F, 6-F	3-F, 4-CF ₃
2-Cl, 6-Cl	3-F, 4-Cl	2-Cl, 6-Cl	3-F, 4-Br	2-Cl, 6-Cl	3-F, 4-CF ₃
2-Me, 6-Me	3-F, 4-Cl	2-Me, 6-Me	3-F, 4-Br	2-Me, 6-Me	3-F, 4-CF ₃
2-F, 4-F, 6-F	3-F, 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-F, 4-Br	2-F, 4-F, 6-F	3-F, 4-CF ₃
2-F	3-F, 4-OCF ₃	2-F	3-Cl, 4-F	2-F	3-Cl, 4-Cl
2-Cl	3-F, 4-OCF ₃	2-Cl	3-Cl, 4-F	2-Cl	3-Cl, 4-Cl
2-Br	3-F, 4-OCF ₃	2-Br	3-Cl, 4-F	2-Br	3-Cl, 4-Cl
2-Me	3-F, 4-OCF ₃	2-Me	3-Cl, 4-F	2-Me	3-Cl, 4-Cl
2-CF ₃	3-F, 4-OCF ₃	2-CF ₃	3-Cl, 4-F	2-CF ₃	3-Cl, 4-Cl
4-F	3-F, 4-OCF ₃	4-F	3-Cl, 4-F	4-F	3-Cl, 4-Cl
4-Cl	3-F, 4-OCF ₃	4-Cl	3-Cl, 4-F	4-Cl	3-Cl, 4-Cl
4-Br	3-F, 4-OCF ₃	4-Br	3-Cl, 4-F	4-Br	3-Cl, 4-Cl
2-F, 4-F	3-F, 4-OCF ₃	2-F, 4-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Cl, 4-F	3-F, 4-OCF ₃	2-Cl, 4-F	3-Cl, 4-F	2-Cl, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Me, 4-F	3-F, 4-OCF ₃	2-Me, 4-F	3-Cl, 4-F	2-Me, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-F, 6-F	3-F, 4-OCF ₃	2-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl
2-Cl, 6-Cl	3-F, 4-OCF ₃	2-Cl, 6-Cl	3-Cl, 4-F	2-Cl, 6-Cl	3-Cl, 4-Cl
2-Me, 6-Me	3-F, 4-OCF ₃	2-Me, 6-Me	3-Cl, 4-F	2-Me, 6-Me	3-Cl, 4-Cl
2-F, 4-F, 6-F	3-F, 4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F	3-Br, 4-F	2-F	3-CF ₃ , 4-F
2-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl	3-Br, 4-F	2-Cl	3-CF ₃ , 4-F
2-Br	3-Cl, 4-CF ₃	2-Br	3-Br, 4-F	2-Br	3-CF ₃ , 4-F
2-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-Me	3-Br, 4-F	2-Me	3-CF ₃ , 4-F
2-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	2-CF ₃	3-Br, 4-F	2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-F

A es C(O)Me

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
4-F	3-Cl, 4-CF ₃	4-F	3-Br, 4-F	4-F	3-CF ₃ , 4-F
4-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	4-Cl	3-Br, 4-F	4-Cl	3-CF ₃ , 4-F
4-Br	3-Cl, 4-CF ₃	4-Br	3-Br, 4-F	4-Br	3-CF ₃ , 4-F
2-F, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F	3-Br, 4-F	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-F
2-Cl, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl, 4-F	3-Br, 4-F	2-Cl, 4-F	3-CF ₃ , 4-F
2-Me, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Me, 4-F	3-Br, 4-F	2-Me, 4-F	3-CF ₃ , 4-F
2-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 6-F	3-Br, 4-F	2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-F
2-Cl, 6-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl, 6-Cl	3-Br, 4-F	2-Cl, 6-Cl	3-CF ₃ , 4-F
2-Me, 6-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-Me, 6-Me	3-Br, 4-F	2-Me, 6-Me	3-CF ₃ , 4-F
2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Br, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-F
2-F	3-CF ₃ , 4-Cl	4-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Me, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	4-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Br	3-CF ₃ , 4-Cl	4-Br	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl, 6-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Me	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Me, 6-Me	3-CF ₃ , 4-Cl
2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F	3,4-DFMDO*	4-F	3,4-DFMDO*	2-Me, 4-F	3,4-DFMDO*
2-Cl	3,4-DFMDO*	4-Cl	3,4-DFMDO*	2-F, 6-F	3,4-DFMDO*
2-Br	3,4-DFMDO*	4-Br	3,4-DFMDO*	2-Cl, 6-Cl	3,4-DFMDO*
2-Me	3,4-DFMDO*	2-F, 4-F	3,4-DFMDO*	2-Me, 6-Me	3,4-DFMDO*
2-CF ₃	3,4-DFMDO*	2-Cl, 4-F	3,4-DFMDO*	2-F, 4-F, 6-F	3,4-DFMDO*

A es NHC(O)OMe

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	2-F	2-F	3-F	2-F	3-Cl
2-Cl	2-F	2-Cl	3-F	2-Cl	3-Cl
2-Br	2-F	2-Br	3-F	2-Br	3-Cl
2-Me	2-F	2-Me	3-F	2-Me	3-Cl
2-CF ₃	2-F	2-CF ₃	3-F	2-CF ₃	3-Cl
4-F	2-F	4-F	3-F	4-F	3-Cl
4-Cl	2-F	4-Cl	3-F	4-Cl	3-Cl
4-Br	2-F	4-Br	3-F	4-Br	3-Cl
2-F, 4-F	2-F	2-F, 4-F	3-F	2-F, 4-F	3-Cl
2-Cl, 4-F	2-F	2-Cl, 4-F	3-F	2-Cl, 4-F	3-Cl
2-Me, 4-F	2-F	2-Me, 4-F	3-F	2-Me, 4-F	3-Cl
2-F, 6-F	2-F	2-F, 6-F	3-F	2-F, 6-F	3-Cl
2-Cl, 6-Cl	2-F	2-Cl, 6-Cl	3-F	2-Cl, 6-Cl	3-Cl
2-Me, 6-Me	2-F	2-Me, 6-Me	3-F	2-Me, 6-Me	3-Cl
2-F, 4-F, 6-F	2-F	2-F, 4-F, 6-F	3-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl
2-F	3-Br	2-F	3-CF ₃	2-F	3-OCF ₃

A es NHC(O)OMe

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-Cl	3-Br	2-Cl	3-CF ₃	2-Cl	3-OCF ₃
2-Br	3-Br	2-Br	3-CF ₃	2-Br	3-OCF ₃
2-Me	3-Br	2-Me	3-CF ₃	2-Me	3-OCF ₃
2-CF ₃	3-Br	2-CF ₃	3-CF ₃	2-CF ₃	3-OCF ₃
4-F	3-Br	4-F	3-CF ₃	4-F	3-OCF ₃
4-Cl	3-Br	4-Cl	3-CF ₃	4-Cl	3-OCF ₃
4-Br	3-Br	4-Br	3-CF ₃	4-Br	3-OCF ₃
2-F, 4-F	3-Br	2-F, 4-F	3-CF ₃	2-F, 4-F	3-OCF ₃
2-Cl, 4-F	3-Br	2-Cl, 4-F	3-CF ₃	2-Cl, 4-F	3-OCF ₃
2-Me, 4-F	3-Br	2-Me, 4-F	3-CF ₃	2-Me, 4-F	3-OCF ₃
2-F, 6-F	3-Br	2-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 6-F	3-OCF ₃
2-Cl, 6-Cl	3-Br	2-Cl, 6-Cl	3-CF ₃	2-Cl, 6-Cl	3-OCF ₃
2-Me, 6-Me	3-Br	2-Me, 6-Me	3-CF ₃	2-Me, 6-Me	3-OCF ₃
2-F, 4-F, 6-F	3-Br	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-OCF ₃
2-F	4-F	2-F	4-Cl	2-F	4-Br
2-Cl	4-F	2-Cl	4-Cl	2-Cl	4-Br
2-Br	4-F	2-Br	4-Cl	2-Br	4-Br
2-Me	4-F	2-Me	4-Cl	2-Me	4-Br
2-CF ₃	4-F	2-CF ₃	4-Cl	2-CF ₃	4-Br
4-F	4-F	4-F	4-Cl	4-F	4-Br
4-Cl	4-F	4-Cl	4-Cl	4-Cl	4-Br
4-Br	4-F	4-Br	4-Cl	4-Br	4-Br
2-F, 4-F	4-F	2-F, 4-F	4-Cl	2-F, 4-F	4-Br
2-Cl, 4-F	4-F	2-Cl, 4-F	4-Cl	2-Cl, 4-F	4-Br
2-Me, 4-F	4-F	2-Me, 4-F	4-Cl	2-Me, 4-F	4-Br
2-F, 6-F	4-F	2-F, 6-F	4-Cl	2-F, 6-F	4-Br
2-Cl, 6-Cl	4-F	2-Cl, 6-Cl	4-Cl	2-Cl, 6-Cl	4-Br
2-Me, 6-Me	4-F	2-Me, 6-Me	4-Cl	2-Me, 6-Me	4-Br
2-F, 4-F, 6-F	4-F	2-F, 4-F, 6-F	4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	4-Br
2-F	4-CF ₃	2-F	4-OCF ₃	2-F	3-F, 4-F
2-Cl	4-CF ₃	2-Cl	4-OCF ₃	2-Cl	3-F, 4-F
2-Br	4-CF ₃	2-Br	4-OCF ₃	2-Br	3-F, 4-F
2-Me	4-CF ₃	2-Me	4-OCF ₃	2-Me	3-F, 4-F
2-CF ₃	4-CF ₃	2-CF ₃	4-OCF ₃	2-CF ₃	3-F, 4-F
4-F	4-CF ₃	4-F	4-OCF ₃	4-F	3-F, 4-F
4-Cl	4-CF ₃	4-Cl	4-OCF ₃	4-Cl	3-F, 4-F
4-Br	4-CF ₃	4-Br	4-OCF ₃	4-Br	3-F, 4-F
2-F, 4-F	4-CF ₃	2-F, 4-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F	3-F, 4-F
2-Cl, 4-F	4-CF ₃	2-Cl, 4-F	4-OCF ₃	2-Cl, 4-F	3-F, 4-F

ES 2 659 033 T3

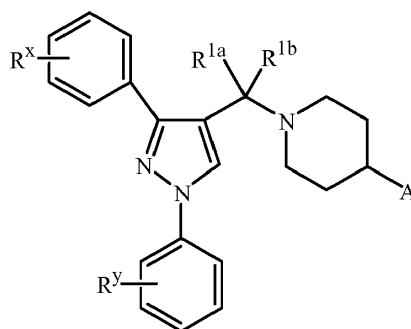
A es NHC(O)OMe

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-Me, 4-F	4-CF ₃	2-Me, 4-F	4-OCF ₃	2-Me, 4-F	3-F, 4-F
2-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 6-F	3-F, 4-F
2-Cl, 6-Cl	4-CF ₃	2-Cl, 6-Cl	4-OCF ₃	2-Cl, 6-Cl	3-F, 4-F
2-Me, 6-Me	4-CF ₃	2-Me, 6-Me	4-OCF ₃	2-Me, 6-Me	3-F, 4-F
2-F, 4-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-F, 4-F
2-F	3-F, 4-Cl	2-F	3-F, 4-Br	2-F	3-F, 4-CF ₃
2-Cl	3-F, 4-Cl	2-Cl	3-F, 4-Br	2-Cl	3-F, 4-CF ₃
2-Br	3-F, 4-Cl	2-Br	3-F, 4-Br	2-Br	3-F, 4-CF ₃
2-Me	3-F, 4-Cl	2-Me	3-F, 4-Br	2-Me	3-F, 4-CF ₃
2-CF ₃	3-F, 4-Cl	2-CF ₃	3-F, 4-Br	2-CF ₃	3-F, 4-CF ₃
4-F	3-F, 4-Cl	4-F	3-F, 4-Br	4-F	3-F, 4-CF ₃
4-Cl	3-F, 4-Cl	4-Cl	3-F, 4-Br	4-Cl	3-F, 4-CF ₃
4-Br	3-F, 4-Cl	4-Br	3-F, 4-Br	4-Br	3-F, 4-CF ₃
2-F, 4-F	3-F, 4-Cl	2-F, 4-F	3-F, 4-Br	2-F, 4-F	3-F, 4-CF ₃
2-Cl, 4-F	3-F, 4-Cl	2-Cl, 4-F	3-F, 4-Br	2-Cl, 4-F	3-F, 4-CF ₃
2-Me, 4-F	3-F, 4-Cl	2-Me, 4-F	3-F, 4-Br	2-Me, 4-F	3-F, 4-CF ₃
2-F, 6-F	3-F, 4-Cl	2-F, 6-F	3-F, 4-Br	2-F, 6-F	3-F, 4-CF ₃
2-Cl, 6-Cl	3-F, 4-Cl	2-Cl, 6-Cl	3-F, 4-Br	2-Cl, 6-Cl	3-F, 4-CF ₃
2-Me, 6-Me	3-F, 4-Cl	2-Me, 6-Me	3-F, 4-Br	2-Me, 6-Me	3-F, 4-CF ₃
2-F, 4-F, 6-F	3-F, 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-F, 4-Br	2-F, 4-F, 6-F	3-F, 4-CF ₃
2-F	3-F, 4-OCF ₃	2-F	3-Cl, 4-F	2-F	3-Cl, 4-Cl
2-Cl	3-F, 4-OCF ₃	2-Cl	3-Cl, 4-F	2-Cl	3-Cl, 4-Cl
2-Br	3-F, 4-OCF ₃	2-Br	3-Cl, 4-F	2-Br	3-Cl, 4-Cl
2-Me	3-F, 4-OCF ₃	2-Me	3-Cl, 4-F	2-Me	3-Cl, 4-Cl
2-CF ₃	3-F, 4-OCF ₃	2-CF ₃	3-Cl, 4-F	2-CF ₃	3-Cl, 4-Cl
4-F	3-F, 4-OCF ₃	4-F	3-Cl, 4-F	4-F	3-Cl, 4-Cl
4-Cl	3-F, 4-OCF ₃	4-Cl	3-Cl, 4-F	4-Cl	3-Cl, 4-Cl
4-Br	3-F, 4-OCF ₃	4-Br	3-Cl, 4-F	4-Br	3-Cl, 4-Cl
2-F, 4-F	3-F, 4-OCF ₃	2-F, 4-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Cl, 4-F	3-F, 4-OCF ₃	2-Cl, 4-F	3-Cl, 4-F	2-Cl, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Me, 4-F	3-F, 4-OCF ₃	2-Me, 4-F	3-Cl, 4-F	2-Me, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-F, 6-F	3-F, 4-OCF ₃	2-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl
2-Cl, 6-Cl	3-F, 4-OCF ₃	2-Cl, 6-Cl	3-Cl, 4-F	2-Cl, 6-Cl	3-Cl, 4-Cl
2-Me, 6-Me	3-F, 4-OCF ₃	2-Me, 6-Me	3-Cl, 4-F	2-Me, 6-Me	3-Cl, 4-Cl
2-F, 4-F, 6-F	3-F, 4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F	3-Br, 4-F	2-F	3-CF ₃ , 4-F
2-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl	3-Br, 4-F	2-Cl	3-CF ₃ , 4-F
2-Br	3-Cl, 4-CF ₃	2-Br	3-Br, 4-F	2-Br	3-CF ₃ , 4-F
2-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-Me	3-Br, 4-F	2-Me	3-CF ₃ , 4-F

A es NHC(O)OMe

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	2-CF ₃	3-Br, 4-F	2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-F
4-F	3-Cl, 4-CF ₃	4-F	3-Br, 4-F	4-F	3-CF ₃ , 4-F
4-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	4-Cl	3-Br, 4-F	4-Cl	3-CF ₃ , 4-F
4-Br	3-Cl, 4-CF ₃	4-Br	3-Br, 4-F	4-Br	3-CF ₃ , 4-F
2-F, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F	3-Br, 4-F	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-F
2-Cl, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl, 4-F	3-Br, 4-F	2-Cl, 4-F	3-CF ₃ , 4-F
2-Me, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Me, 4-F	3-Br, 4-F	2-Me, 4-F	3-CF ₃ , 4-F
2-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 6-F	3-Br, 4-F	2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-F
2-Cl, 6-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl, 6-Cl	3-Br, 4-F	2-Cl, 6-Cl	3-CF ₃ , 4-F
2-Me, 6-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-Me, 6-Me	3-Br, 4-F	2-Me, 6-Me	3-CF ₃ , 4-F
2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Br, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-F
2-F	3-CF ₃ , 4-Cl	4-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Me, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	4-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Br	3-CF ₃ , 4-Cl	4-Br	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl, 6-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Me	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Me, 6-Me	3-CF ₃ , 4-Cl
2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F	3,4-DFMDO*	4-F	3,4-DFMDO*	2-Me, 4-F	3,4-DFMDO*
2-Cl	3,4-DFMDO*	4-Cl	3,4-DFMDO*	2-F, 6-F	3,4-DFMDO*
2-Br	3,4-DFMDO*	4-Br	3,4-DFMDO*	2-Cl, 6-Cl	3,4-DFMDO*
2-Me	3,4-DFMDO*	2-F, 4-F	3,4-DFMDO*	2-Me, 6-Me	3,4-DFMDO*
2-CF ₃	3,4-DFMDO*	2-Cl, 4-F	3,4-DFMDO*	2-F, 4-F, 6-F	3,4-DFMDO*

TABLA 2



R^{1a} es H, R^{1b} es ciano, A es ciano

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	3-Cl	2-Cl	3-Cl	2-Br	3-Cl
2-F	4-Cl	2-Cl	4-Cl	2-Br	4-Cl
2-F	3-CF ₃	2-Cl	3-CF ₃	2-Br	3-CF ₃
2-F	4-CF ₃	2-Cl	4-CF ₃	2-Br	4-CF ₃
2-F	4-OCF ₃	2-Cl	4-OCF ₃	2-Br	4-OCF ₃
2-F	3-Cl, 4-Cl	2-Cl	3-Cl, 4-Cl	2-Br	3-Cl, 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Br	3-Cl, 4-CF ₃

ES 2 659 033 T3

R^{1a} es H, R^{1b} es ciano, A es ciano

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Br	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-F	2-Cl	3-Cl, 4-F	2-Br	3-Cl, 4-F
2-Me	3-Cl	2-CF ₃	3-Cl	2-F, 4-F	3-Cl
2-Me	4-Cl	2-CF ₃	4-Cl	2-F, 4-F	4-Cl
2-Me	3-CF ₃	2-CF ₃	3-CF ₃	2-F, 4-F	3-CF ₃
2-Me	4-CF ₃	2-CF ₃	4-CF ₃	2-F, 4-F	4-CF ₃
2-Me	4-OCF ₃	2-CF ₃	4-OCF ₃	2-F, 4-F	4-OCF ₃
2-Me	3-Cl, 4-Cl	2-CF ₃	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-Me	3-CF ₃ , 4-Cl	2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-F	2-CF ₃	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F	3-Cl, 4-F
2-F, 6-F	3-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl	4-F	3-Cl
2-F, 6-F	4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	4-Cl	4-F	4-Cl
2-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃	4-F	3-CF ₃
2-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-CF ₃	4-F	4-CF ₃
2-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-OCF ₃	4-F	4-OCF ₃
2-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	4-F	3-Cl, 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-F	4-F	3-Cl, 4-F

R^{1a} es H, R^{1b} es ciano, A es CO₂Me

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	3-Cl	2-Cl	3-Cl	2-Br	3-Cl
2-F	4-Cl	2-Cl	4-Cl	2-Br	4-Cl
2-F	3-CF ₃	2-Cl	3-CF ₃	2-Br	3-CF ₃
2-F	4-CF ₃	2-Cl	4-CF ₃	2-Br	4-CF ₃
2-F	4-OCF ₃	2-Cl	4-OCF ₃	2-Br	4-OCF ₃
2-F	3-Cl, 4-Cl	2-Cl	3-Cl, 4-Cl	2-Br	3-Cl, 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Br	3-Cl, 4-CF ₃
2-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Br	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-F	2-Cl	3-Cl, 4-F	2-Br	3-Cl, 4-F
2-Me	3-Cl	2-CF ₃	3-Cl	2-F, 4-F	3-Cl
2-Me	4-Cl	2-CF ₃	4-Cl	2-F, 4-F	4-Cl
2-Me	3-CF ₃	2-CF ₃	3-CF ₃	2-F, 4-F	3-CF ₃
2-Me	4-CF ₃	2-CF ₃	4-CF ₃	2-F, 4-F	4-CF ₃
2-Me	4-OCF ₃	2-CF ₃	4-OCF ₃	2-F, 4-F	4-OCF ₃
2-Me	3-Cl, 4-Cl	2-CF ₃	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃

ES 2 659 033 T3

R^{1a} es H, R^{1b} es ciano, A es CO₂Me

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-Me	3-CF ₃ , 4-Cl	2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-F	2-CF ₃	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F	3-Cl, 4-F
2-F, 6-F	3-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl	4-F	3-Cl
2-F, 6-F	4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	4-Cl	4-F	4-Cl
2-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃	4-F	3-CF ₃
2-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-CF ₃	4-F	4-CF ₃
2-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-OCF ₃	4-F	4-OCF ₃
2-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	4-F	3-Cl, 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-F	4-F	3-Cl, 4-F

R^{1a} es H, R^{1b} es ciano, A es CO₂Et

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	3-Cl	2-Cl	3-Cl	2-Br	3-Cl
2-F	4-Cl	2-Cl	4-Cl	2-Br	4-Cl
2-F	3-CF ₃	2-Cl	3-CF ₃	2-Br	3-CF ₃
2-F	4-CF ₃	2-Cl	4-CF ₃	2-Br	4-CF ₃
2-F	4-OCF ₃	2-Cl	4-OCF ₃	2-Br	4-OCF ₃
2-F	3-Cl, 4-Cl	2-Cl	3-Cl, 4-Cl	2-Br	3-Cl, 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Br	3-Cl, 4-CF ₃
2-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Br	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-F	2-Cl	3-Cl, 4-F	2-Br	3-Cl, 4-F
2-Me	3-Cl	2-CF ₃	3-Cl	2-F, 4-F	3-Cl
2-Me	4-Cl	2-CF ₃	4-Cl	2-F, 4-F	4-Cl
2-Me	3-CF ₃	2-CF ₃	3-CF ₃	2-F, 4-F	3-CF ₃
2-Me	4-CF ₃	2-CF ₃	4-CF ₃	2-F, 4-F	4-CF ₃
2-Me	4-OCF ₃	2-CF ₃	4-OCF ₃	2-F, 4-F	4-OCF ₃
2-Me	3-Cl, 4-Cl	2-CF ₃	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-Me	3-CF ₃ , 4-Cl	2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-F	2-CF ₃	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F	3-Cl, 4-F
2-F, 6-F	3-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl	4-F	3-Cl
2-F, 6-F	4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	4-Cl	4-F	4-Cl
2-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃	4-F	3-CF ₃
2-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-CF ₃	4-F	4-CF ₃
2-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-OCF ₃	4-F	4-OCF ₃
2-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	4-F	3-Cl, 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	4-F	3-Cl, 4-CF ₃

ES 2 659 033 T3

R^{1a} es H, R^{1b} es ciano, A es CO₂Et

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-F	4-F	3-Cl, 4-F

R^{1a} es H, R^{1b} es ciano, A es NHC(O)Me

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	3-Cl	2-Cl	3-Cl	2-Br	3-Cl
2-F	4-Cl	2-Cl	4-Cl	2-Br	4-Cl
2-F	3-CF ₃	2-Cl	3-CF ₃	2-Br	3-CF ₃
2-F	4-CF ₃	2-Cl	4-CF ₃	2-Br	4-CF ₃
2-F	4-OCF ₃	2-Cl	4-OCF ₃	2-Br	4-OCF ₃
2-F	3-Cl, 4-Cl	2-Cl	3-Cl, 4-Cl	2-Br	3-Cl, 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Br	3-Cl, 4-CF ₃
2-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Br	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-F	2-Cl	3-Cl, 4-F	2-Br	3-Cl, 4-F
2-Me	3-Cl	2-CF ₃	3-Cl	2-F, 4-F	3-Cl
2-Me	4-Cl	2-CF ₃	4-Cl	2-F, 4-F	4-Cl
2-Me	3-CF ₃	2-CF ₃	3-CF ₃	2-F, 4-F	3-CF ₃
2-Me	4-CF ₃	2-CF ₃	4-CF ₃	2-F, 4-F	4-CF ₃
2-Me	4-OCF ₃	2-CF ₃	4-OCF ₃	2-F, 4-F	4-OCF ₃
2-Me	3-Cl, 4-Cl	2-CF ₃	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-Me	3-CF ₃ , 4-Cl	2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-F	2-CF ₃	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F	3-Cl, 4-F
2-F, 6-F	3-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl	4-F	3-Cl
2-F, 6-F	4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	4-Cl	4-F	4-Cl
2-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃	4-F	3-CF ₃
2-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-CF ₃	4-F	4-CF ₃
2-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-OCF ₃	4-F	4-OCF ₃
2-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	4-F	3-Cl, 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-F	4-F	3-Cl, 4-F

R^{1a} es H, R^{1b} es ciano, A es C(O)Me

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	3-Cl	2-Cl	3-Cl	2-Br	3-Cl
2-F	4-Cl	2-Cl	4-Cl	2-Br	4-Cl
2-F	3-CF ₃	2-Cl	3-CF ₃	2-Br	3-CF ₃
2-F	4-CF ₃	2-Cl	4-CF ₃	2-Br	4-CF ₃
2-F	4-OCF ₃	2-Cl	4-OCF ₃	2-Br	4-OCF ₃
2-F	3-Cl, 4-Cl	2-Cl	3-Cl, 4-Cl	2-Br	3-Cl, 4-Cl

ES 2 659 033 T3

R^{1a} es H, R^{1b} es ciano, A es C(O)Me

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Br	3-Cl, 4-CF ₃
2-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Br	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-F	2-Cl	3-Cl, 4-F	2-Br	3-Cl, 4-F
2-Me	3-Cl	2-CF ₃	3-Cl	2-F, 4-F	3-Cl,
2-Me	4-Cl	2-CF ₃	4-Cl	2-F, 4-F	4-Cl
2-Me	3-CF ₃	2-CF ₃	3-CF ₃	2-F, 4-F	3-CF ₃
2-Me	4-CF ₃	2-CF ₃	4-CF ₃	2-F, 4-F	4-CF ₃
2-Me	4-OCF ₃	2-CF ₃	4-OCF ₃	2-F, 4-F	4-OCF ₃
2-Me	3-Cl, 4-Cl	2-CF ₃	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-Me	3-CF ₃ , 4-Cl	2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-F	2-CF ₃	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F	3-Cl, 4-F
2-F, 6-F	3-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl	4-F	3-Cl
2-F, 6-F	4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	4-Cl	4-F	4-Cl
2-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃	4-F	3-CF ₃
2-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-CF ₃	4-F	4-CF ₃
2-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-OCF ₃	4-F	4-OCF ₃
2-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	4-F	3-Cl, 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-F	4-F	3-Cl, 4-F

R^{1a} es H, R^{1b} es ciano, A es NHC(O)OMe

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	3-Cl	2-Cl	3-Cl	2-Br	3-Cl
2-F	4-Cl	2-Cl	4-Cl	2-Br	4-Cl
2-F	3-CF ₃	2-Cl	3-CF ₃	2-Br	3-CF ₃
2-F	4-CF ₃	2-Cl	4-CF ₃	2-Br	4-CF ₃
2-F	4-OCF ₃	2-Cl	4-OCF ₃	2-Br	4-OCF ₃
2-F	3-Cl, 4-Cl	2-Cl	3-Cl, 4-Cl	2-Br	3-Cl, 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Br	3-Cl, 4-CF ₃
2-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Br	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-F	2-Cl	3-Cl, 4-F	2-Br	3-Cl, 4-F
2-Me	3-Cl	2-CF ₃	3-Cl	2-F, 4-F	3-Cl
2-Me	4-Cl	2-CF ₃	4-Cl	2-F, 4-F	4-Cl
2-Me	3-CF ₃	2-CF ₃	3-CF ₃	2-F, 4-F	3-CF ₃
2-Me	4-CF ₃	2-CF ₃	4-CF ₃	2-F, 4-F	4-CF ₃
2-Me	4-OCF ₃	2-CF ₃	4-OCF ₃	2-F, 4-F	4-OCF ₃
2-Me	3-Cl, 4-Cl	2-CF ₃	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃

ES 2 659 033 T3

R^{1a} es H, R^{1b} es ciano, A es NHC(O)OMe

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-Me	3-CF ₃ , 4-Cl	2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-F	2-CF ₃	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F	3-Cl, 4-F
2-F, 6-F	3-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl	4-F	3-Cl
2-F, 6-F	4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	4-Cl	4-F	4-Cl
2-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃	4-F	3-CF ₃
2-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-CF ₃	4-F	4-CF ₃
2-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-OCF ₃	4-F	4-OCF ₃
2-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	4-F	3-Cl, 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-F	4-F	3-Cl, 4-F

R^{1a} es H, R^{1b} es Me, A es ciano

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	3-Cl	2-Cl	3-Cl	2-Br	3-Cl
2-F	4-Cl	2-Cl	4-Cl	2-Br	4-Cl
2-F	3-CF ₃	2-Cl	3-CF ₃	2-Br	3-CF ₃
2-F	4-CF ₃	2-Cl	4-CF ₃	2-Br	4-CF ₃
2-F	4-OCF ₃	2-Cl	4-OCF ₃	2-Br	4-OCF ₃
2-F	3-Cl, 4-Cl	2-Cl	3-Cl, 4-Cl	2-Br	3-Cl, 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Br	3-Cl, 4-CF ₃
2-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Br	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-F	2-Cl	3-Cl, 4-F	2-Br	3-Cl, 4-F
2-Me	3-Cl	2-CF ₃	3-Cl	2-F, 4-F	3-Cl
2-Me	4-Cl	2-CF ₃	4-Cl	2-F, 4-F	4-Cl
2-Me	3-CF ₃	2-CF ₃	3-CF ₃	2-F, 4-F	3-CF ₃
2-Me	4-CF ₃	2-CF ₃	4-CF ₃	2-F, 4-F	4-CF ₃
2-Me	4-OCF ₃	2-CF ₃	4-OCF ₃	2-F, 4-F	4-OCF ₃
2-Me	3-Cl, 4-Cl	2-CF ₃	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-Me	3-CF ₃ , 4-Cl	2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-F	2-CF ₃	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F	3-Cl, 4-F
2-F, 6-F	3-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl	4-F	3-Cl
2-F, 6-F	4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	4-Cl	4-F	4-Cl
2-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃	4-F	3-CF ₃
2-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-CF ₃	4-F	4-CF ₃
2-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-OCF ₃	4-F	4-OCF ₃
2-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	4-F	3-Cl, 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	4-F	3-CF ₃ , 4-Cl

ES 2 659 033 T3

R^{1a} es H, R^{1b} es Me, A es ciano

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-F	4-F	3-Cl, 4-F

R^{1a} es H, R^{1b} es Me, A es CO₂Me

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	3-Cl	2-Cl	3-Cl	2-Br	3-Cl
2-F	4-Cl	2-Cl	4-Cl	2-Br	4-Cl
2-F	3-CF ₃	2-Cl	3-CF ₃	2-Br	3-CF ₃
2-F	4-CF ₃	2-Cl	4-CF ₃	2-Br	4-CF ₃
2-F	4-OCF ₃	2-Cl	4-OCF ₃	2-Br	4-OCF ₃
2-F	3-Cl, 4-Cl	2-Cl	3-Cl, 4-Cl	2-Br	3-Cl, 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Br	3-Cl, 4-CF ₃
2-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Br	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-F	2-Cl	3-Cl, 4-F	2-Br	3-Cl, 4-F
2-Me	3-Cl	2-CF ₃	3-Cl	2-F, 4-F	3-Cl
2-Me	4-Cl	2-CF ₃	4-Cl	2-F, 4-F	4-Cl
2-Me	3-CF ₃	2-CF ₃	3-CF ₃	2-F, 4-F	3-CF ₃
2-Me	4-CF ₃	2-CF ₃	4-CF ₃	2-F, 4-F	4-CF ₃
2-Me	4-OCF ₃	2-CF ₃	4-OCF ₃	2-F, 4-F	4-OCF ₃
2-Me	3-Cl, 4-Cl	2-CF ₃	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-Me	3-CF ₃ , 4-Cl	2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-F	2-CF ₃	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F	3-Cl, 4-F
2-F, 6-F	3-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl	4-F	3-Cl
2-F, 6-F	4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	4-Cl	4-F	4-Cl
2-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃	4-F	3-CF ₃
2-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-CF ₃	4-F	4-CF ₃
2-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-OCF ₃	4-F	4-OCF ₃
2-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	4-F	3-Cl, 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-F	4-F	3-Cl, 4-F

R^{1a} es H, R^{1b} es Me, A es CO₂Et

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	3-Cl	2-Cl	3-Cl	2-Br	3-Cl
2-F	4-Cl	2-Cl	4-Cl	2-Br	4-Cl
2-F	3-CF ₃	2-Cl	3-CF ₃	2-Br	3-CF ₃
2-F	4-CF ₃	2-Cl	4-CF ₃	2-Br	4-CF ₃
2-F	4-OCF ₃	2-Cl	4-OCF ₃	2-Br	4-OCF ₃
2-F	3-Cl, 4-Cl	2-Cl	3-Cl, 4-Cl	2-Br	3-Cl, 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Br	3-Cl, 4-CF ₃

ES 2 659 033 T3

R^{1a} es H, R^{1b} es Me, A es CO₂Et

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Br	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-F	2-Cl	3-Cl, 4-F	2-Br	3-Cl, 4-F
2-Me	3-Cl	2-CF ₃	3-Cl	2-F, 4-F	3-Cl
2-Me	4-Cl	2-CF ₃	4-Cl	2-F, 4-F	4-Cl
2-Me	3-CF ₃	2-CF ₃	3-CF ₃	2-F, 4-F	3-CF ₃
2-Me	4-CF ₃	2-CF ₃	4-CF ₃	2-F, 4-F	4-CF ₃
2-Me	4-OCF ₃	2-CF ₃	4-OCF ₃	2-F, 4-F	4-OCF ₃
2-Me	3-Cl, 4-Cl	2-CF ₃	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-Me	3-CF ₃ , 4-Cl	2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-F	2-CF ₃	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F	3-Cl, 4-F
2-F, 6-F	3-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl	4-F	3-Cl
2-F, 6-F	4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	4-Cl	4-F	4-Cl
2-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃	4-F	3-CF ₃
2-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-CF ₃	4-F	4-CF ₃
2-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-OCF ₃	4-F	4-OCF ₃
2-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	4-F	3-Cl, 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-F	4-F	3-Cl, 4-F

R^{1a} es H, R^{1b} es Me, A es NHC(O)Me

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	3-Cl	2-Cl	3-Cl	2-Br	3-Cl
2-F	4-Cl	2-Cl	4-Cl	2-Br	4-Cl
2-F	3-CF ₃	2-Cl	3-CF ₃	2-Br	3-CF ₃
2-F	4-CF ₃	2-Cl	4-CF ₃	2-Br	4-CF ₃
2-F	4-OCF ₃	2-Cl	4-OCF ₃	2-Br	4-OCF ₃
2-F	3-Cl, 4-Cl	2-Cl	3-Cl, 4-Cl	2-Br	3-Cl, 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Br	3-Cl, 4-CF ₃
2-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Br	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-F	2-Cl	3-Cl, 4-F	2-Br	3-Cl, 4-F
2-Me	3-Cl	2-CF ₃	3-Cl	2-F, 4-F	3-Cl
2-Me	4-Cl	2-CF ₃	4-Cl	2-F, 4-F	4-Cl
2-Me	3-CF ₃	2-CF ₃	3-CF ₃	2-F, 4-F	3-CF ₃
2-Me	4-CF ₃	2-CF ₃	4-CF ₃	2-F, 4-F	4-CF ₃
2-Me	4-OCF ₃	2-CF ₃	4-OCF ₃	2-F, 4-F	4-OCF ₃
2-Me	3-Cl, 4-Cl	2-CF ₃	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-Me	3-CF ₃ , 4-Cl	2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl

ES 2 659 033 T3

R^{1a} es H, R^{1b} es Me, A es NHC(O)Me

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-Me	3-Cl, 4-F	2-CF ₃	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F	3-Cl, 4-F
2-F, 6-F	3-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl	4-F	3-Cl
2-F, 6-F	4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	4-Cl	4-F	4-Cl
2-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃	4-F	3-CF ₃
2-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-CF ₃	4-F	4-CF ₃
2-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-OCF ₃	4-F	4-OCF ₃
2-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	4-F	3-Cl, 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-F	4-F	3-Cl, 4-F

R^{1a} es H, R^{1b} es Me, A es C(O)Me

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	3-Cl	2-Cl	3-Cl	2-Br	3-Cl
2-F	4-Cl	2-Cl	4-Cl	2-Br	4-Cl
2-F	3-CF ₃	2-Cl	3-CF ₃	2-Br	3-CF ₃
2-F	4-CF ₃	2-Cl	4-CF ₃	2-Br	4-CF ₃
2-F	4-OCF ₃	2-Cl	4-OCF ₃	2-Br	4-OCF ₃
2-F	3-Cl, 4-Cl	2-Cl	3-Cl, 4-Cl	2-Br	3-Cl, 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Br	3-Cl, 4-CF ₃
2-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Br	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-F	2-Cl	3-Cl, 4-F	2-Br	3-Cl, 4-F
2-Me	3-Cl	2-CF ₃	3-Cl	2-F, 4-F	3-Cl
2-Me	4-Cl	2-CF ₃	4-Cl	2-F, 4-F	4-Cl
2-Me	3-CF ₃	2-CF ₃	3-CF ₃	2-F, 4-F	3-CF ₃
2-Me	4-CF ₃	2-CF ₃	4-CF ₃	2-F, 4-F	4-CF ₃
2-Me	4-OCF ₃	2-CF ₃	4-OCF ₃	2-F, 4-F	4-OCF ₃
2-Me	3-Cl, 4-Cl	2-CF ₃	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-Me	3-CF ₃ , 4-Cl	2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-F	2-CF ₃	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F	3-Cl, 4-F
2-F, 6-F	3-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl	4-F	3-Cl
2-F, 6-F	4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	4-Cl	4-F	4-Cl
2-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃	4-F	3-CF ₃
2-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-CF ₃	4-F	4-CF ₃
2-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-OCF ₃	4-F	4-OCF ₃
2-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	4-F	3-Cl, 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-F	4-F	3-Cl, 4-F

ES 2 659 033 T3

R^{1a} es H, R^{1b} es Me, A es NHC(O)OMe

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	3-Cl	2-Cl	3-Cl	2-Br	3-Cl
2-F	4-Cl	2-Cl	4-Cl	2-Br	4-Cl
2-F	3-CF ₃	2-Cl	3-CF ₃	2-Br	3-CF ₃
2-F	4-CF ₃	2-Cl	4-CF ₃	2-Br	4-CF ₃
2-F	4-OCF ₃	2-Cl	4-OCF ₃	2-Br	4-OCF ₃
2-F	3-Cl, 4-Cl	2-Cl	3-Cl, 4-Cl	2-Br	3-Cl, 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Br	3-Cl, 4-CF ₃
2-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Br	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-F	2-Cl	3-Cl, 4-F	2-Br	3-Cl, 4-F
2-Me	3-Cl	2-CF ₃	3-Cl	2-F, 4-F	3-Cl
2-Me	4-Cl	2-CF ₃	4-Cl	2-F, 4-F	4-Cl
2-Me	3-CF ₃	2-CF ₃	3-CF ₃	2-F, 4-F	3-CF ₃
2-Me	4-CF ₃	2-CF ₃	4-CF ₃	2-F, 4-F	4-CF ₃
2-Me	4-OCF ₃	2-CF ₃	4-OCF ₃	2-F, 4-F	4-OCF ₃
2-Me	3-Cl, 4-Cl	2-CF ₃	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-Me	3-CF ₃ , 4-Cl	2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-F	2-CF ₃	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F	3-Cl, 4-F
2-F, 6-F	3-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl	4-F	3-Cl
2-F, 6-F	4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	4-Cl	4-F	4-Cl
2-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃	4-F	3-CF ₃
2-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-CF ₃	4-F	4-CF ₃
2-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-OCF ₃	4-F	4-OCF ₃
2-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	4-F	3-Cl, 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-F	4-F	3-Cl, 4-F

R^{1a} es H, R^{1b} es CO₂Me, A es ciano

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	3-Cl	2-Cl	3-Cl	2-Br	3-Cl
2-F	4-Cl	2-Cl	4-Cl	2-Br	4-Cl
2-F	3-CF ₃	2-Cl	3-CF ₃	2-Br	3-CF ₃
2-F	4-CF ₃	2-Cl	4-CF ₃	2-Br	4-CF ₃
2-F	4-OCF ₃	2-Cl	4-OCF ₃	2-Br	4-OCF ₃
2-F	3-Cl, 4-Cl	2-Cl	3-Cl, 4-Cl	2-Br	3-Cl, 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Br	3-Cl, 4-CF ₃
2-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Br	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-F	2-Cl	3-Cl, 4-F	2-Br	3-Cl, 4-F
2-Me	3-Cl	2-CF ₃	3-Cl	2-F, 4-F	3-Cl

ES 2 659 033 T3

R^{1a} es H, R^{1b} es CO₂Me, A es ciano

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-Me	4-Cl	2-CF ₃	4-Cl	2-F, 4-F	4-Cl
2-Me	3-CF ₃	2-CF ₃	3-CF ₃	2-F, 4-F	3-CF ₃
2-Me	4-CF ₃	2-CF ₃	4-CF ₃	2-F, 4-F	4-CF ₃
2-Me	4-OCF ₃	2-CF ₃	4-OCF ₃	2-F, 4-F	4-OCF ₃
2-Me	3-Cl, 4-Cl	2-CF ₃	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-Me	3-CF ₃ , 4-Cl	2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-F	2-CF ₃	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F	3-Cl, 4-F
2-F, 6-F	3-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl	4-F	3-Cl
2-F, 6-F	4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	4-Cl	4-F	4-Cl
2-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃	4-F	3-CF ₃
2-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-CF ₃	4-F	4-CF ₃
2-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-OCF ₃	4-F	4-OCF ₃
2-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	4-F	3-Cl, 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-F	4-F	3-Cl, 4-F

R^{1a} es H, R^{1b} es CO₂Me, A es CO₂Me

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	3-Cl	2-Cl	3-Cl	2-Br	3-Cl
2-F	4-Cl	2-Cl	4-Cl	2-Br	4-Cl
2-F	3-CF ₃	2-Cl	3-CF ₃	2-Br	3-CF ₃
2-F	4-CF ₃	2-Cl	4-CF ₃	2-Br	4-CF ₃
2-F	4-OCF ₃	2-Cl	4-OCF ₃	2-Br	4-OCF ₃
2-F	3-Cl, 4-Cl	2-Cl	3-Cl, 4-Cl	2-Br	3-Cl, 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Br	3-Cl, 4-CF ₃
2-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Br	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-F	2-Cl	3-Cl, 4-F	2-Br	3-Cl, 4-F
2-Me	3-Cl	2-CF ₃	3-Cl	2-F, 4-F	3-Cl
2-Me	4-Cl	2-CF ₃	4-Cl	2-F, 4-F	4-Cl
2-Me	3-CF ₃	2-CF ₃	3-CF ₃	2-F, 4-F	3-CF ₃
2-Me	4-CF ₃	2-CF ₃	4-CF ₃	2-F, 4-F	4-CF ₃
2-Me	4-OCF ₃	2-CF ₃	4-OCF ₃	2-F, 4-F	4-OCF ₃
2-Me	3-Cl, 4-Cl	2-CF ₃	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-Me	3-CF ₃ , 4-Cl	2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-F	2-CF ₃	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F	3-Cl, 4-F
2-F, 6-F	3-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl	4-F	3-Cl
2-F, 6-F	4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	4-Cl	4-F	4-Cl

ES 2 659 033 T3

R^{1a} es H, R^{1b} es CO₂Me, A es CO₂Me

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃	4-F	3-CF ₃
2-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-CF ₃	4-F	4-CF ₃
2-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-OCF ₃	4-F	4-OCF ₃
2-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	4-F	3-Cl, 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-F	4-F	3-Cl, 4-F

R^{1a} es H, R^{1b} es CO₂Me, A es CO₂Et

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	3-Cl	2-Cl	3-Cl	2-Br	3-Cl
2-F	4-Cl	2-Cl	4-Cl	2-Br	4-Cl
2-F	3-CF ₃	2-Cl	3-CF ₃	2-Br	3-CF ₃
2-F	4-CF ₃	2-Cl	4-CF ₃	2-Br	4-CF ₃
2-F	4-OCF ₃	2-Cl	4-OCF ₃	2-Br	4-OCF ₃
2-F	3-Cl, 4-Cl	2-Cl	3-Cl, 4-Cl	2-Br	3-Cl, 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Br	3-Cl, 4-CF ₃
2-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Br	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-F	2-Cl	3-Cl, 4-F	2-Br	3-Cl, 4-F
2-Me	3-Cl	2-CF ₃	3-Cl	2-F, 4-F	3-Cl
2-Me	4-Cl	2-CF ₃	4-Cl	2-F, 4-F	4-Cl
2-Me	3-CF ₃	2-CF ₃	3-CF ₃	2-F, 4-F	3-CF ₃
2-Me	4-CF ₃	2-CF ₃	4-CF ₃	2-F, 4-F	4-CF ₃
2-Me	4-OCF ₃	2-CF ₃	4-OCF ₃	2-F, 4-F	4-OCF ₃
2-Me	3-Cl, 4-Cl	2-CF ₃	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-Me	3-CF ₃ , 4-Cl	2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-F	2-CF ₃	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F	3-Cl, 4-F
2-F, 6-F	3-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl	4-F	3-Cl
2-F, 6-F	4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	4-Cl	4-F	4-Cl
2-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃	4-F	3-CF ₃
2-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-CF ₃	4-F	4-CF ₃
2-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-OCF ₃	4-F	4-OCF ₃
2-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	4-F	3-Cl, 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-F	4-F	3-Cl, 4-F

R^{1a} es H, R^{1b} es CO₂Me, A es NHC(O)Me

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	3-Cl	2-Cl	3-Cl	2-Br	3-Cl

ES 2 659 033 T3

R^{1a} es H, R^{1b} es CO₂Me, A es NHC(O)Me

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	4-Cl	2-Cl	4-Cl	2-Br	4-Cl
2-F	3-CF ₃	2-Cl	3-CF ₃	2-Br	3-CF ₃
2-F	4-CF ₃	2-Cl	4-CF ₃	2-Br	4-CF ₃
2-F	4-OCF ₃	2-Cl	4-OCF ₃	2-Br	4-OCF ₃
2-F	3-Cl, 4-Cl	2-Cl	3-Cl, 4-Cl	2-Br	3-Cl, 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Br	3-Cl, 4-CF ₃
2-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Br	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-F	2-Cl	3-Cl, 4-F	2-Br	3-Cl, 4-F
2-Me	3-Cl	2-CF ₃	3-Cl	2-F, 4-F	3-Cl
2-Me	4-Cl	2-CF ₃	4-Cl	2-F, 4-F	4-Cl
2-Me	3-CF ₃	2-CF ₃	3-CF ₃	2-F, 4-F	3-CF ₃
2-Me	4-CF ₃	2-CF ₃	4-CF ₃	2-F, 4-F	4-CF ₃
2-Me	4-OCF ₃	2-CF ₃	4-OCF ₃	2-F, 4-F	4-OCF ₃
2-Me	3-Cl, 4-Cl	2-CF ₃	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-Me	3-CF ₃ , 4-Cl	2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-F	2-CF ₃	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F	3-Cl, 4-F
2-F, 6-F	3-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl	4-F	3-Cl
2-F, 6-F	4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	4-Cl	4-F	4-Cl
2-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃	4-F	3-CF ₃
2-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-CF ₃	4-F	4-CF ₃
2-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-OCF ₃	4-F	4-OCF ₃
2-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	4-F	3-Cl, 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-F	4-F	3-Cl, 4-F

R^{1a} es H, R^{1b} es CO₂Me, A es C(O)Me

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	3-Cl	2-Cl	3-Cl	2-Br	3-Cl
2-F	4-Cl	2-Cl	4-Cl	2-Br	4-Cl
2-F	3-CF ₃	2-Cl	3-CF ₃	2-Br	3-CF ₃
2-F	4-CF ₃	2-Cl	4-CF ₃	2-Br	4-CF ₃
2-F	4-OCF ₃	2-Cl	4-OCF ₃	2-Br	4-OCF ₃
2-F	3-Cl, 4-Cl	2-Cl	3-Cl, 4-Cl	2-Br	3-Cl, 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Br	3-Cl, 4-CF ₃
2-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Br	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-F	2-Cl	3-Cl, 4-F	2-Br	3-Cl, 4-F
2-Me	3-Cl	2-CF ₃	3-Cl	2-F, 4-F	3-Cl
2-Me	4-Cl	2-CF ₃	4-Cl	2-F, 4-F	4-Cl

ES 2 659 033 T3

R^{1a} es H, R^{1b} es CO₂Me, A es C(O)Me

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-Me	3-CF ₃	2-CF ₃	3-CF ₃	2-F, 4-F	3-CF ₃
2-Me	4-CF ₃	2-CF ₃	4-CF ₃	2-F, 4-F	4-CF ₃
2-Me	4-OCF ₃	2-CF ₃	4-OCF ₃	2-F, 4-F	4-OCF ₃
2-Me	3-Cl, 4-Cl	2-CF ₃	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-Me	3-CF ₃ , 4-Cl	2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-F	2-CF ₃	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F	3-Cl, 4-F
2-F, 6-F	3-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl	4-F	3-Cl
2-F, 6-F	4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	4-Cl	4-F	4-Cl
2-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃	4-F	3-CF ₃
2-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-CF ₃	4-F	4-CF ₃
2-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-OCF ₃	4-F	4-OCF ₃
2-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	4-F	3-Cl, 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-F	4-F	3-Cl, 4-F

R^{1a} es H, R^{1b} es CO₂Me, A es NHC(O)OMe

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	3-Cl	2-Cl	3-Cl	2-Br	3-Cl
2-F	4-Cl	2-Cl	4-Cl	2-Br	4-Cl
2-F	3-CF ₃	2-Cl	3-CF ₃	2-Br	3-CF ₃
2-F	4-CF ₃	2-Cl	4-CF ₃	2-Br	4-CF ₃
2-F	4-OCF ₃	2-Cl	4-OCF ₃	2-Br	4-OCF ₃
2-F	3-Cl, 4-Cl	2-Cl	3-Cl, 4-Cl	2-Br	3-Cl, 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Br	3-Cl, 4-CF ₃
2-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Br	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-F	2-Cl	3-Cl, 4-F	2-Br	3-Cl, 4-F
2-Me	3-Cl	2-CF ₃	3-Cl	2-F, 4-F	3-Cl
2-Me	4-Cl	2-CF ₃	4-Cl	2-F, 4-F	4-Cl
2-Me	3-CF ₃	2-CF ₃	3-CF ₃	2-F, 4-F	3-CF ₃
2-Me	4-CF ₃	2-CF ₃	4-CF ₃	2-F, 4-F	4-CF ₃
2-Me	4-OCF ₃	2-CF ₃	4-OCF ₃	2-F, 4-F	4-OCF ₃
2-Me	3-Cl, 4-Cl	2-CF ₃	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-Me	3-CF ₃ , 4-Cl	2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-F	2-CF ₃	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F	3-Cl, 4-F
2-F, 6-F	3-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl	4-F	3-Cl
2-F, 6-F	4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	4-Cl	4-F	4-Cl
2-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃	4-F	3-CF ₃

ES 2 659 033 T3

R^{1a} es H, R^{1b} es CO₂Me, A es NHC(O)OMe

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-CF ₃	4-F	4-CF ₃
2-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-OCF ₃	4-F	4-OCF ₃
2-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	4-F	3-Cl, 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-F	4-F	3-Cl, 4-F

R^{1a} es Me, R^{1b} es Me, A es ciano

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	3-Cl	2-Cl	3-Cl	2-Br	3-Cl
2-F	4-Cl	2-Cl	4-Cl	2-Br	4-Cl
2-F	3-CF ₃	2-Cl	3-CF ₃	2-Br	3-CF ₃
2-F	4-CF ₃	2-Cl	4-CF ₃	2-Br	4-CF ₃
2-F	4-OCF ₃	2-Cl	4-OCF ₃	2-Br	4-OCF ₃
2-F	3-Cl, 4-Cl	2-Cl	3-Cl, 4-Cl	2-Br	3-Cl, 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Br	3-Cl, 4-CF ₃
2-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Br	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-F	2-Cl	3-Cl, 4-F	2-Br	3-Cl, 4-F
2-Me	3-Cl	2-CF ₃	3-Cl	2-F, 4-F	3-Cl
2-Me	4-Cl	2-CF ₃	4-Cl	2-F, 4-F	4-Cl
2-Me	3-CF ₃	2-CF ₃	3-CF ₃	2-F, 4-F	3-CF ₃
2-Me	4-CF ₃	2-CF ₃	4-CF ₃	2-F, 4-F	4-CF ₃
2-Me	4-OCF ₃	2-CF ₃	4-OCF ₃	2-F, 4-F	4-OCF ₃
2-Me	3-Cl, 4-Cl	2-CF ₃	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-Me	3-CF ₃ , 4-Cl	2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-F	2-CF ₃	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F	3-Cl, 4-F
2-F, 6-F	3-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl	4-F	3-Cl
2-F, 6-F	4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	4-Cl	4-F	4-Cl
2-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃	4-F	3-CF ₃
2-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-CF ₃	4-F	4-CF ₃
2-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-OCF ₃	4-F	4-OCF ₃
2-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	4-F	3-Cl, 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-F	4-F	3-Cl, 4-F

R^{1a} es Me, R^{1b} es Me, A es CO₂Me

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	3-Cl	2-Cl	3-Cl	2-Br	3-Cl
2-F	4-Cl	2-Cl	4-Cl	2-Br	4-Cl

ES 2 659 033 T3

R^{1a} es Me, R^{1b} es Me, A es CO₂Me

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	3-CF ₃	2-Cl	3-CF ₃	2-Br	3-CF ₃
2-F	4-CF ₃	2-Cl	4-CF ₃	2-Br	4-CF ₃
2-F	4-OCF ₃	2-Cl	4-OCF ₃	2-Br	4-OCF ₃
2-F	3-Cl, 4-Cl	2-Cl	3-Cl, 4-Cl	2-Br	3-Cl, 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Br	3-Cl, 4-CF ₃
2-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Br	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-F	2-Cl	3-Cl, 4-F	2-Br	3-Cl, 4-F
2-Me	3-Cl	2-CF ₃	3-Cl	2-F, 4-F	3-Cl
2-Me	4-Cl	2-CF ₃	4-Cl	2-F, 4-F	4-Cl
2-Me	3-CF ₃	2-CF ₃	3-CF ₃	2-F, 4-F	3-CF ₃
2-Me	4-CF ₃	2-CF ₃	4-CF ₃	2-F, 4-F	4-CF ₃
2-Me	4-OCF ₃	2-CF ₃	4-OCF ₃	2-F, 4-F	4-OCF ₃
2-Me	3-Cl, 4-Cl	2-CF ₃	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-Me	3-CF ₃ , 4-Cl	2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-F	2-CF ₃	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F	3-Cl, 4-F
2-F, 6-F	3-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl	4-F	3-Cl
2-F, 6-F	4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	4-Cl	4-F	4-Cl
2-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃	4-F	3-CF ₃
2-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-CF ₃	4-F	4-CF ₃
2-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-OCF ₃	4-F	4-OCF ₃
2-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	4-F	3-Cl, 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-F	4-F	3-Cl, 4-F

R^{1a} es Me, R^{1b} es Me, A es CO₂Et

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	3-Cl	2-Cl	3-Cl	2-Br	3-Cl
2-F	4-Cl	2-Cl	4-Cl	2-Br	4-Cl
2-F	3-CF ₃	2-Cl	3-CF ₃	2-Br	3-CF ₃
2-F	4-CF ₃	2-Cl	4-CF ₃	2-Br	4-CF ₃
2-F	4-OCF ₃	2-Cl	4-OCF ₃	2-Br	4-OCF ₃
2-F	3-Cl, 4-Cl	2-Cl	3-Cl, 4-Cl	2-Br	3-Cl, 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Br	3-Cl, 4-CF ₃
2-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Br	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-F	2-Cl	3-Cl, 4-F	2-Br	3-Cl, 4-F
2-Me	3-Cl	2-CF ₃	3-Cl	2-F, 4-F	3-Cl
2-Me	4-Cl	2-CF ₃	4-Cl	2-F, 4-F	4-Cl
2-Me	3-CF ₃	2-CF ₃	3-CF ₃	2-F, 4-F	3-CF ₃

ES 2 659 033 T3

R^{1a} es Me, R^{1b} es Me, A es CO₂Et

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-Me	4-CF ₃	2-CF ₃	4-CF ₃	2-F, 4-F	4-CF ₃
2-Me	4-OCF ₃	2-CF ₃	4-OCF ₃	2-F, 4-F	4-OCF ₃
2-Me	3-Cl, 4-Cl	2-CF ₃	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-Me	3-CF ₃ , 4-Cl	2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-F	2-CF ₃	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F	3-Cl, 4-F
2-F, 6-F	3-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl	4-F	3-Cl
2-F, 6-F	4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	4-Cl	4-F	4-Cl
2-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃	4-F	3-CF ₃
2-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-CF ₃	4-F	4-CF ₃
2-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-OCF ₃	4-F	4-OCF ₃
2-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	4-F	3-Cl, 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-F	4-F	3-Cl, 4-F

R^{1a} es Me, R^{1b} es Me, A es NHC(O)Me

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	3-Cl	2-Cl	3-Cl	2-Br	3-Cl
2-F	4-Cl	2-Cl	4-Cl	2-Br	4-Cl
2-F	3-CF ₃	2-Cl	3-CF ₃	2-Br	3-CF ₃
2-F	4-CF ₃	2-Cl	4-CF ₃	2-Br	4-CF ₃
2-F	4-OCF ₃	2-Cl	4-OCF ₃	2-Br	4-OCF ₃
2-F	3-Cl, 4-Cl	2-Cl	3-Cl, 4-Cl	2-Br	3-Cl, 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Br	3-Cl, 4-CF ₃
2-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Br	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-F	2-Cl	3-Cl, 4-F	2-Br	3-Cl, 4-F
2-Me	3-Cl	2-CF ₃	3-Cl	2-F, 4-F	3-Cl
2-Me	4-Cl	2-CF ₃	4-Cl	2-F, 4-F	4-Cl
2-Me	3-CF ₃	2-CF ₃	3-CF ₃	2-F, 4-F	3-CF ₃
2-Me	4-CF ₃	2-CF ₃	4-CF ₃	2-F, 4-F	4-CF ₃
2-Me	4-OCF ₃	2-CF ₃	4-OCF ₃	2-F, 4-F	4-OCF ₃
2-Me	3-Cl, 4-Cl	2-CF ₃	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-Me	3-CF ₃ , 4-Cl	2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-F	2-CF ₃	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F	3-Cl, 4-F
2-F, 6-F	3-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl	4-F	3-Cl
2-F, 6-F	4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	4-Cl	4-F	4-Cl
2-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃	4-F	3-CF ₃
2-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-CF ₃	4-F	4-CF ₃

ES 2 659 033 T3

R^{1a} es Me, R^{1b} es Me, A es NHC(O)Me

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-OCF ₃	4-F	4-OCF ₃
2-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	4-F	3-Cl, 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-F	4-F	3-Cl, 4-F
2-F	3-Cl	2-Cl	3-Cl	2-Br	3-Cl
2-F	4-Cl	2-Cl	4-Cl	2-Br	4-Cl
2-F	3-CF ₃	2-Cl	3-CF ₃	2-Br	3-CF ₃
2-F	4-CF ₃	2-Cl	4-CF ₃	2-Br	4-CF ₃
2-F	4-OCF ₃	2-Cl	4-OCF ₃	2-Br	4-OCF ₃
2-F	3-Cl, 4-Cl	2-Cl	3-Cl, 4-Cl	2-Br	3-Cl, 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Br	3-Cl, 4-CF ₃
2-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Br	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-F	2-Cl	3-Cl, 4-F	2-Br	3-Cl, 4-F
2-Me	3-Cl	2-CF ₃	3-Cl	2-F, 4-F	3-Cl
2-Me	4-Cl	2-CF ₃	4-Cl	2-F, 4-F	4-Cl
2-Me	3-CF ₃	2-CF ₃	3-CF ₃	2-F, 4-F	3-CF ₃
2-Me	4-CF ₃	2-CF ₃	4-CF ₃	2-F, 4-F	4-CF ₃
2-Me	4-OCF ₃	2-CF ₃	4-OCF ₃	2-F, 4-F	4-OCF ₃
2-Me	3-Cl, 4-Cl	2-CF ₃	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-Me	3-CF ₃ , 4-Cl	2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-F	2-CF ₃	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F	3-Cl, 4-F
2-F, 6-F	3-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl	4-F	3-Cl
2-F, 6-F	4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	4-Cl	4-F	4-Cl
2-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃	4-F	3-CF ₃
2-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-CF ₃	4-F	4-CF ₃
2-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-OCF ₃	4-F	4-OCF ₃
2-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	4-F	3-Cl, 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-F	4-F	3-Cl, 4-F

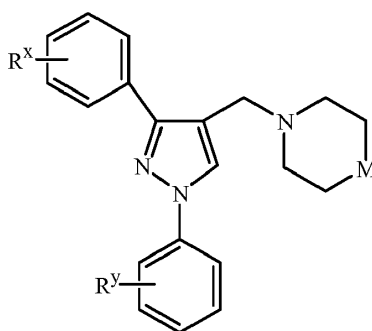
R^{1a} es Me, R^{1b} es Me, A es NHC(O)OMe

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	3-Cl	2-Cl	3-Cl	2-Br	3-Cl
2-F	4-Cl	2-Cl	4-Cl	2-Br	4-Cl
2-F	3-CF ₃	2-Cl	3-CF ₃	2-Br	3-CF ₃
2-F	4-CF ₃	2-Cl	4-CF ₃	2-Br	4-CF ₃
2-F	4-OCF ₃	2-Cl	4-OCF ₃	2-Br	4-OCF ₃

R^{1a} es Me, R^{1b} es Me, A es NHC(O)OMe

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	3-Cl, 4-Cl	2-Cl	3-Cl, 4-Cl	2-Br	3-Cl, 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Br	3-Cl, 4-CF ₃
2-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Br	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-F	2-Cl	3-Cl, 4-F	2-Br	3-Cl, 4-F
2-Me	3-Cl	2-CF ₃	3-Cl	2-F, 4-F	3-Cl
2-Me	4-Cl	2-CF ₃	4-Cl	2-F, 4-F	4-Cl
2-Me	3-CF ₃	2-CF ₃	3-CF ₃	2-F, 4-F	3-CF ₃
2-Me	4-CF ₃	2-CF ₃	4-CF ₃	2-F, 4-F	4-CF ₃
2-Me	4-OCF ₃	2-CF ₃	4-OCF ₃	2-F, 4-F	4-OCF ₃
2-Me	3-Cl, 4-Cl	2-CF ₃	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-Me	3-CF ₃ , 4-Cl	2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-F	2-CF ₃	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F	3-Cl, 4-F
2-F, 6-F	3-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl	4-F	3-Cl
2-F, 6-F	4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	4-Cl	4-F	4-Cl
2-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃	4-F	3-CF ₃
2-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-CF ₃	4-F	4-CF ₃
2-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-OCF ₃	4-F	4-OCF ₃
2-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	4-F	3-Cl, 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-F	4-F	3-Cl, 4-F

TABLA 4



M es CH(fenilo)

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	3-Cl	2-Cl	3-Cl	2-Br	3-Cl
2-F	4-Cl	2-Cl	4-Cl	2-Br	4-Cl
2-F	3-CF ₃	2-Cl	3-CF ₃	2-Br	3-CF ₃
2-F	4-CF ₃	2-Cl	4-CF ₃	2-Br	4-CF ₃
2-F	4-OCF ₃	2-Cl	4-OCF ₃	2-Br	4-OCF ₃
2-F	3-Cl, 4-Cl	2-Cl	3-Cl, 4-Cl	2-Br	3-Cl, 4-Cl

ES 2 659 033 T3

M es CH(fenilo)

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Br	3-Cl, 4-CF ₃
2-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Br	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-F	2-Cl	3-Cl, 4-F	2-Br	3-Cl, 4-F
2-Me	3-Cl	2-CF ₃	3-Cl	2-F, 4-F	3-Cl
2-Me	4-Cl	2-CF ₃	4-Cl	2-F, 4-F	4-Cl
2-Me	3-CF ₃	2-CF ₃	3-CF ₃	2-F, 4-F	3-CF ₃
2-Me	4-CF ₃	2-CF ₃	4-CF ₃	2-F, 4-F	4-CF ₃
2-Me	4-OCF ₃	2-CF ₃	4-OCF ₃	2-F, 4-F	4-OCF ₃
2-Me	3-Cl, 4-Cl	2-CF ₃	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-Me	3-CF ₃ , 4-Cl	2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-F	2-CF ₃	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F	3-Cl, 4-F
2-F, 6-F	3-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl	4-F	3-Cl
2-F, 6-F	4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	4-Cl	4-F	4-Cl
2-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃	4-F	3-CF ₃
2-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-CF ₃	4-F	4-CF ₃
2-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-OCF ₃	4-F	4-OCF ₃
2-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	4-F	3-Cl, 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-F	4-F	3-Cl, 4-F

M es CH(Me)

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	3-Cl	2-Cl	3-Cl	2-Br	3-Cl
2-F	4-Cl	2-Cl	4-Cl	2-Br	4-Cl
2-F	3-CF ₃	2-Cl	3-CF ₃	2-Br	3-CF ₃
2-F	4-CF ₃	2-Cl	4-CF ₃	2-Br	4-CF ₃
2-F	4-OCF ₃	2-Cl	4-OCF ₃	2-Br	4-OCF ₃
2-F	3-Cl, 4-Cl	2-Cl	3-Cl, 4-Cl	2-Br	3-Cl, 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Br	3-Cl, 4-CF ₃
2-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Br	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-F	2-Cl	3-Cl, 4-F	2-Br	3-Cl, 4-F
2-Me	3-Cl	2-CF ₃	3-Cl	2-F, 4-F	3-Cl
2-Me	4-Cl	2-CF ₃	4-Cl	2-F, 4-F	4-Cl
2-Me	3-CF ₃	2-CF ₃	3-CF ₃	2-F, 4-F	3-CF ₃
2-Me	4-CF ₃	2-CF ₃	4-CF ₃	2-F, 4-F	4-CF ₃
2-Me	4-OCF ₃	2-CF ₃	4-OCF ₃	2-F, 4-F	4-OCF ₃
2-Me	3-Cl, 4-Cl	2-CF ₃	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F	3-Cl, 4-Cl

M es CH(Me)

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-Me	3-CF ₃ , 4-Cl	2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-F	2-CF ₃	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F	3-Cl, 4-F
2-F, 6-F	3-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl	4-F	3-Cl
2-F, 6-F	4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	4-Cl	4-F	4-Cl
2-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃	4-F	3-CF ₃
2-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-CF ₃	4-F	4-CF ₃
2-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-OCF ₃	4-F	4-OCF ₃
2-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	4-F	3-Cl, 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-F	4-F	3-Cl, 4-F

M es CH(CF₃)

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	3-Cl	2-Cl	3-Cl	2-Br	3-Cl
2-F	4-Cl	2-Cl	4-Cl	2-Br	4-Cl
2-F	3-CF ₃	2-Cl	3-CF ₃	2-Br	3-CF ₃
2-F	4-CF ₃	2-Cl	4-CF ₃	2-Br	4-CF ₃
2-F	4-OCF ₃	2-Cl	4-OCF ₃	2-Br	4-OCF ₃
2-F	3-Cl, 4-Cl	2-Cl	3-Cl, 4-Cl	2-Br	3-Cl, 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Br	3-Cl, 4-CF ₃
2-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Br	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-F	2-Cl	3-Cl, 4-F	2-Br	3-Cl, 4-F
2-Me	3-Cl	2-CF ₃	3-Cl	2-F, 4-F	3-Cl
2-Me	4-Cl	2-CF ₃	4-Cl	2-F, 4-F	4-Cl
2-Me	3-CF ₃	2-CF ₃	3-CF ₃	2-F, 4-F	3-CF ₃
2-Me	4-CF ₃	2-CF ₃	4-CF ₃	2-F, 4-F	4-CF ₃
2-Me	4-OCF ₃	2-CF ₃	4-OCF ₃	2-F, 4-F	4-OCF ₃
2-Me	3-Cl, 4-Cl	2-CF ₃	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-Me	3-CF ₃ , 4-Cl	2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-F	2-CF ₃	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F	3-Cl, 4-F
2-F, 6-F	3-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl	4-F	3-Cl
2-F, 6-F	4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	4-Cl	4-F	4-Cl
2-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃	4-F	3-CF ₃
2-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-CF ₃	4-F	4-CF ₃
2-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-OCF ₃	4-F	4-OCF ₃
2-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	4-F	3-Cl, 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-F	4-F	3-Cl, 4-F

M es CH(SMe)

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	3-Cl	2-Cl	3-Cl	2-Br	3-Cl
2-F	4-Cl	2-Cl	4-Cl	2-Br	4-Cl
2-F	3-CF ₃	2-Cl	3-CF ₃	2-Br	3-CF ₃
2-F	4-CF ₃	2-Cl	4-CF ₃	2-Br	4-CF ₃
2-F	4-OCF ₃	2-Cl	4-OCF ₃	2-Br	4-OCF ₃
2-F	3-Cl, 4-Cl	2-Cl	3-Cl, 4-Cl	2-Br	3-Cl, 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Br	3-Cl, 4-CF ₃
2-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Br	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-F	2-Cl	3-Cl, 4-F	2-Br	3-Cl, 4-F

ES 2 659 033 T3

M es CH(SMe)

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-Me	3-Cl	2-CF ₃	3-Cl	2-F, 4-F	3-Cl
2-Me	4-Cl	2-CF ₃	4-Cl	2-F, 4-F	4-Cl
2-Me	3-CF ₃	2-CF ₃	3-CF ₃	2-F, 4-F	3-CF ₃
2-Me	4-CF ₃	2-CF ₃	4-CF ₃	2-F, 4-F	4-CF ₃
2-Me	4-OCF ₃	2-CF ₃	4-OCF ₃	2-F, 4-F	4-OCF ₃
2-Me	3-Cl, 4-Cl	2-CF ₃	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-Me	3-CF ₃ , 4-Cl	2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-F	2-CF ₃	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F	3-Cl, 4-F
2-F, 6-F	3-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl	4-F	3-Cl
2-F, 6-F	4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	4-Cl	4-F	4-Cl
2-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃	4-F	3-CF ₃
2-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-CF ₃	4-F	4-CF ₃
2-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-OCF ₃	4-F	4-OCF ₃
2-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	4-F	3-Cl, 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-F	4-F	3-Cl, 4-F

M es CH(S(O)Me)

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	3-Cl	2-Cl	3-Cl	2-Br	3-Cl
2-F	4-Cl	2-Cl	4-Cl	2-Br	4-Cl
2-F	3-CF ₃	2-Cl	3-CF ₃	2-Br	3-CF ₃
2-F	4-CF ₃	2-Cl	4-CF ₃	2-Br	4-CF ₃
2-F	4-OCF ₃	2-Cl	4-OCF ₃	2-Br	4-OCF ₃
2-F	3-Cl, 4-Cl	2-Cl	3-Cl, 4-Cl	2-Br	3-Cl, 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Br	3-Cl, 4-CF ₃
2-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Br	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-F	2-Cl	3-Cl, 4-F	2-Br	3-Cl, 4-F
2-Me	3-Cl	2-CF ₃	3-Cl	2-F, 4-F	3-Cl
2-Me	4-Cl	2-CF ₃	4-Cl	2-F, 4-F	4-Cl
2-Me	3-CF ₃	2-CF ₃	3-CF ₃	2-F, 4-F	3-CF ₃
2-Me	4-CF ₃	2-CF ₃	4-CF ₃	2-F, 4-F	4-CF ₃
2-Me	4-OCF ₃	2-CF ₃	4-OCF ₃	2-F, 4-F	4-OCF ₃
2-Me	3-Cl, 4-Cl	2-CF ₃	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-Me	3-CF ₃ , 4-Cl	2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-F	2-CF ₃	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F	3-Cl, 4-F
2-F, 6-F	3-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl	4-F	3-Cl

ES 2 659 033 T3

M es CH(S(O)Me)

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F, 6-F	4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	4-Cl	4-F	4-Cl
2-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃	4-F	3-CF ₃
2-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-CF ₃	4-F	4-CF ₃
2-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-OCF ₃	4-F	4-OCF ₃
2-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	4-F	3-Cl, 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-F	4-F	3-Cl, 4-F

M es CH(S(O)₂)Me

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	3-Cl	2-Cl	3-Cl	2-Br	3-Cl
2-F	4-Cl	2-Cl	4-Cl	2-Br	4-Cl
2-F	3-CF ₃	2-Cl	3-CF ₃	2-Br	3-CF ₃
2-F	4-CF ₃	2-Cl	4-CF ₃	2-Br	4-CF ₃
2-F	4-OCF ₃	2-Cl	4-OCF ₃	2-Br	4-OCF ₃
2-F	3-Cl, 4-Cl	2-Cl	3-Cl, 4-Cl	2-Br	3-Cl, 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Br	3-Cl, 4-CF ₃
2-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Br	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-F	2-Cl	3-Cl, 4-F	2-Br	3-Cl, 4-F
2-Me	3-Cl	2-CF ₃	3-Cl	2-F, 4-F	3-Cl
2-Me	4-Cl	2-CF ₃	4-Cl	2-F, 4-F	4-Cl
2-Me	3-CF ₃	2-CF ₃	3-CF ₃	2-F, 4-F	3-CF ₃
2-Me	4-CF ₃	2-CF ₃	4-CF ₃	2-F, 4-F	4-CF ₃
2-Me	4-OCF ₃	2-CF ₃	4-OCF ₃	2-F, 4-F	4-OCF ₃
2-Me	3-Cl, 4-Cl	2-CF ₃	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-Me	3-CF ₃ , 4-Cl	2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-F	2-CF ₃	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F	3-Cl, 4-F
2-F, 6-F	3-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl	4-F	3-Cl
2-F, 6-F	4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	4-Cl	4-F	4-Cl
2-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃	4-F	3-CF ₃
2-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-CF ₃	4-F	4-CF ₃
2-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-OCF ₃	4-F	4-OCF ₃
2-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	4-F	3-Cl, 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-F	4-F	3-Cl, 4-F

M es CH(C≡CH)

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
----------------	----------------	----------------	----------------	----------------	----------------

ES 2 659 033 T3

M es CH(C≡CH)

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	3-Cl	2-Cl	3-Cl	2-Br	3-Cl
2-F	4-Cl	2-Cl	4-Cl	2-Br	4-Cl
2-F	3-CF ₃	2-Cl	3-CF ₃	2-Br	3-CF ₃
2-F	4-CF ₃	2-Cl	4-CF ₃	2-Br	4-CF ₃
2-F	4-OCF ₃	2-Cl	4-OCF ₃	2-Br	4-OCF ₃
2-F	3-Cl, 4-Cl	2-Cl	3-Cl, 4-Cl	2-Br	3-Cl, 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Br	3-Cl, 4-CF ₃
2-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Br	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-F	2-Cl	3-Cl, 4-F	2-Br	3-Cl, 4-F
2-Me	3-Cl	2-CF ₃	3-Cl	2-F, 4-F	3-Cl
2-Me	4-Cl	2-CF ₃	4-Cl	2-F, 4-F	4-Cl
2-Me	3-CF ₃	2-CF ₃	3-CF ₃	2-F, 4-F	3-CF ₃
2-Me	4-CF ₃	2-CF ₃	4-CF ₃	2-F, 4-F	4-CF ₃
2-Me	4-OCF ₃	2-CF ₃	4-OCF ₃	2-F, 4-F	4-OCF ₃
2-Me	3-Cl, 4-Cl	2-CF ₃	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-Me	3-CF ₃ , 4-Cl	2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-F	2-CF ₃	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F	3-Cl, 4-F
2-F, 6-F	3-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl	4-F	3-Cl
2-F, 6-F	4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	4-Cl	4-F	4-Cl
2-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃	4-F	3-CF ₃
2-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-CF ₃	4-F	4-CF ₃
2-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-OCF ₃	4-F	4-OCF ₃
2-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	4-F	3-Cl, 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-F	4-F	3-Cl, 4-F

M es CH(CH=CH₂)

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	3-Cl	2-Cl	3-Cl	2-Br	3-Cl
2-F	4-Cl	2-Cl	4-Cl	2-Br	4-Cl
2-F	3-CF ₃	2-Cl	3-CF ₃	2-Br	3-CF ₃
2-F	4-CF ₃	2-Cl	4-CF ₃	2-Br	4-CF ₃
2-F	4-OCF ₃	2-Cl	4-OCF ₃	2-Br	4-OCF ₃
2-F	3-Cl, 4-Cl	2-Cl	3-Cl, 4-Cl	2-Br	3-Cl, 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Br	3-Cl, 4-CF ₃
2-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Br	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-F	2-Cl	3-Cl, 4-F	2-Br	3-Cl, 4-F
2-Me	3-Cl	2-CF ₃	3-Cl	2-F, 4-F	3-Cl

ES 2 659 033 T3

M es CH(CH=CH₂)

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-Me	4-Cl	2-CF ₃	4-Cl	2-F, 4-F	4-Cl
2-Me	3-CF ₃	2-CF ₃	3-CF ₃	2-F, 4-F	3-CF ₃
2-Me	4-CF ₃	2-CF ₃	4-CF ₃	2-F, 4-F	4-CF ₃
2-Me	4-OCF ₃	2-CF ₃	4-OCF ₃	2-F, 4-F	4-OCF ₃
2-Me	3-Cl, 4-Cl	2-CF ₃	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-Me	3-CF ₃ , 4-Cl	2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-F	2-CF ₃	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F	3-Cl, 4-F
2-F, 6-F	3-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl	4-F	3-Cl
2-F, 6-F	4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	4-Cl	4-F	4-Cl
2-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃	4-F	3-CF ₃
2-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-CF ₃	4-F	4-CF ₃
2-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-OCF ₃	4-F	4-OCF ₃
2-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	4-F	3-Cl, 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-F	4-F	3-Cl, 4-F

M es CH(2-piridinilo)

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	3-Cl	2-Cl	3-Cl	2-Br	3-Cl
2-F	4-Cl	2-Cl	4-Cl	2-Br	4-Cl
2-F	3-CF ₃	2-Cl	3-CF ₃	2-Br	3-CF ₃
2-F	4-CF ₃	2-Cl	4-CF ₃	2-Br	4-CF ₃
2-F	4-OCF ₃	2-Cl	4-OCF ₃	2-Br	4-OCF ₃
2-F	3-Cl, 4-Cl	2-Cl	3-Cl, 4-Cl	2-Br	3-Cl, 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Br	3-Cl, 4-CF ₃
2-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Br	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-F	2-Cl	3-Cl, 4-F	2-Br	3-Cl, 4-F
2-Me	3-Cl	2-CF ₃	3-Cl	2-F, 4-F	3-Cl
2-Me	4-Cl	2-CF ₃	4-Cl	2-F, 4-F	4-Cl
2-Me	3-CF ₃	2-CF ₃	3-CF ₃	2-F, 4-F	3-CF ₃
2-Me	4-CF ₃	2-CF ₃	4-CF ₃	2-F, 4-F	4-CF ₃
2-Me	4-OCF ₃	2-CF ₃	4-OCF ₃	2-F, 4-F	4-OCF ₃
2-Me	3-Cl, 4-Cl	2-CF ₃	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-Me	3-CF ₃ , 4-Cl	2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-F	2-CF ₃	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F	3-Cl, 4-F
2-F, 6-F	3-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl	4-F	3-Cl
2-F, 6-F	4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	4-Cl	4-F	4-Cl

ES 2 659 033 T3

M es CH(2-piridinilo)

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃	4-F	3-CF ₃
2-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-CF ₃	4-F	4-CF ₃
2-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-OCF ₃	4-F	4-OCF ₃
2-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	4-F	3-Cl, 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-F	4-F	3-Cl, 4-F

M es CH(3-piridinilo)

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	3-Cl	2-Cl	3-Cl	2-Br	3-Cl
2-F	4-Cl	2-Cl	4-Cl	2-Br	4-Cl
2-F	3-CF ₃	2-Cl	3-CF ₃	2-Br	3-CF ₃
2-F	4-CF ₃	2-Cl	4-CF ₃	2-Br	4-CF ₃
2-F	4-OCF ₃	2-Cl	4-OCF ₃	2-Br	4-OCF ₃
2-F	3-Cl, 4-Cl	2-Cl	3-Cl, 4-Cl	2-Br	3-Cl, 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Br	3-Cl, 4-CF ₃
2-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Br	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-F	2-Cl	3-Cl, 4-F	2-Br	3-Cl, 4-F
2-Me	3-Cl	2-CF ₃	3-Cl	2-F, 4-F	3-Cl
2-Me	4-Cl	2-CF ₃	4-Cl	2-F, 4-F	4-Cl
2-Me	3-CF ₃	2-CF ₃	3-CF ₃	2-F, 4-F	3-CF ₃
2-Me	4-CF ₃	2-CF ₃	4-CF ₃	2-F, 4-F	4-CF ₃
2-Me	4-OCF ₃	2-CF ₃	4-OCF ₃	2-F, 4-F	4-OCF ₃
2-Me	3-Cl, 4-Cl	2-CF ₃	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-Me	3-CF ₃ , 4-Cl	2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-F	2-CF ₃	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F	3-Cl, 4-F
2-F, 6-F	3-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl	4-F	3-Cl
2-F, 6-F	4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	4-Cl	4-F	4-Cl
2-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃	4-F	3-CF ₃
2-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-CF ₃	4-F	4-CF ₃
2-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-OCF ₃	4-F	4-OCF ₃
2-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	4-F	3-Cl, 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-F	4-F	3-Cl, 4-F

M es CH(5-pirimidinilo)

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	3-Cl	2-Cl	3-Cl	2-Br	3-Cl

M es CH(5-pirimidinilo)

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	4-Cl	2-Cl	4-Cl	2-Br	4-Cl
2-F	3-CF ₃	2-Cl	3-CF ₃	2-Br	3-CF ₃
2-F	4-CF ₃	2-Cl	4-CF ₃	2-Br	4-CF ₃
2-F	4-OCF ₃	2-Cl	4-OCF ₃	2-Br	4-OCF ₃
2-F	3-Cl, 4-Cl	2-Cl	3-Cl, 4-Cl	2-Br	3-Cl, 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Br	3-Cl, 4-CF ₃
2-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Br	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-F	2-Cl	3-Cl, 4-F	2-Br	3-Cl, 4-F
2-Me	3-Cl	2-CF ₃	3-Cl	2-F, 4-F	3-Cl
2-Me	4-Cl	2-CF ₃	4-Cl	2-F, 4-F	4-Cl
2-Me	3-CF ₃	2-CF ₃	3-CF ₃	2-F, 4-F	3-CF ₃
2-Me	4-CF ₃	2-CF ₃	4-CF ₃	2-F, 4-F	4-CF ₃
2-Me	4-OCF ₃	2-CF ₃	4-OCF ₃	2-F, 4-F	4-OCF ₃
2-Me	3-Cl, 4-Cl	2-CF ₃	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-Me	3-CF ₃ , 4-Cl	2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-F	2-CF ₃	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F	3-Cl, 4-F
2-F, 6-F	3-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl	4-F	3-Cl
2-F, 6-F	4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	4-Cl	4-F	4-Cl
2-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃	4-F	3-CF ₃
2-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-CF ₃	4-F	4-CF ₃
2-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-OCF ₃	4-F	4-OCF ₃
2-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	4-F	3-Cl, 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-F	4-F	3-Cl, 4-F

M es CH(2-imidazolilo)

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	3-Cl	2-Cl	3-Cl	2-Br	3-Cl
2-F	4-Cl	2-Cl	4-Cl	2-Br	4-Cl
2-F	3-CF ₃	2-Cl	3-CF ₃	2-Br	3-CF ₃
2-F	4-CF ₃	2-Cl	4-CF ₃	2-Br	4-CF ₃
2-F	4-OCF ₃	2-Cl	4-OCF ₃	2-Br	4-OCF ₃
2-F	3-Cl, 4-Cl	2-Cl	3-Cl, 4-Cl	2-Br	3-Cl, 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Br	3-Cl, 4-CF ₃
2-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Br	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-F	2-Cl	3-Cl, 4-F	2-Br	3-Cl, 4-F
2-Me	3-Cl	2-CF ₃	3-Cl	2-F, 4-F	3-Cl
2-Me	4-Cl	2-CF ₃	4-Cl	2-F, 4-F	4-Cl

ES 2 659 033 T3

M es CH(2-imidazolilo)

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-Me	3-CF ₃	2-CF ₃	3-CF ₃	2-F, 4-F	3-CF ₃
2-Me	4-CF ₃	2-CF ₃	4-CF ₃	2-F, 4-F	4-CF ₃
2-Me	4-OCF ₃	2-CF ₃	4-OCF ₃	2-F, 4-F	4-OCF ₃
2-Me	3-Cl, 4-Cl	2-CF ₃	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-Me	3-CF ₃ , 4-Cl	2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-F	2-CF ₃	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F	3-Cl, 4-F
2-F, 6-F	3-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl	4-F	3-Cl
2-F, 6-F	4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	4-Cl	4-F	4-Cl
2-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃	4-F	3-CF ₃
2-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-CF ₃	4-F	4-CF ₃
2-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-OCF ₃	4-F	4-OCF ₃
2-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	4-F	3-Cl, 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-F	4-F	3-Cl, 4-F

M es CH(1-(1,2,4-triazolilo))

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	3-Cl	2-Cl	3-Cl	2-Br	3-Cl
2-F	4-Cl	2-Cl	4-Cl	2-Br	4-Cl
2-F	3-CF ₃	2-Cl	3-CF ₃	2-Br	3-CF ₃
2-F	4-CF ₃	2-Cl	4-CF ₃	2-Br	4-CF ₃
2-F	4-OCF ₃	2-Cl	4-OCF ₃	2-Br	4-OCF ₃
2-F	3-Cl, 4-Cl	2-Cl	3-Cl, 4-Cl	2-Br	3-Cl, 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Br	3-Cl, 4-CF ₃
2-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Br	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-F	2-Cl	3-Cl, 4-F	2-Br	3-Cl, 4-F
2-Me	3-Cl	2-CF ₃	3-Cl	2-F, 4-F	3-Cl
2-Me	4-Cl	2-CF ₃	4-Cl	2-F, 4-F	4-Cl
2-Me	3-CF ₃	2-CF ₃	3-CF ₃	2-F, 4-F	3-CF ₃
2-Me	4-CF ₃	2-CF ₃	4-CF ₃	2-F, 4-F	4-CF ₃
2-Me	4-OCF ₃	2-CF ₃	4-OCF ₃	2-F, 4-F	4-OCF ₃
2-Me	3-Cl, 4-Cl	2-CF ₃	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-Me	3-CF ₃ , 4-Cl	2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-F	2-CF ₃	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F	3-Cl, 4-F
2-F, 6-F	3-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl	4-F	3-Cl
2-F, 6-F	4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	4-Cl	4-F	4-Cl
2-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃	4-F	3-CF ₃

ES 2 659 033 T3

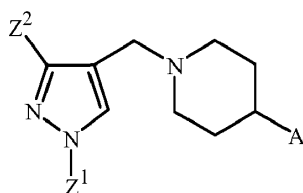
M es CH(1-(1,2,4-triazolilo))

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-CF ₃	4-F	4-CF ₃
2-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-OCF ₃	4-F	4-OCF ₃
2-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	4-F	3-Cl, 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-F	4-F	3-Cl, 4-F

M es CH(2-(1,3,4-oxadiazolilo))

R ^x	R ^y	R ^x	R ^y	R ^x	R ^y
2-F	3-Cl	2-Cl	3-Cl	2-Br	3-Cl
2-F	4-Cl	2-Cl	4-Cl	2-Br	4-Cl
2-F	3-CF ₃	2-Cl	3-CF ₃	2-Br	3-CF ₃
2-F	4-CF ₃	2-Cl	4-CF ₃	2-Br	4-CF ₃
2-F	4-OCF ₃	2-Cl	4-OCF ₃	2-Br	4-OCF ₃
2-F	3-Cl, 4-Cl	2-Cl	3-Cl, 4-Cl	2-Br	3-Cl, 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-Cl	3-Cl, 4-CF ₃	2-Br	3-Cl, 4-CF ₃
2-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Cl	3-CF ₃ , 4-Cl	2-Br	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F	3-Cl, 4-F	2-Cl	3-Cl, 4-F	2-Br	3-Cl, 4-F
2-Me	3-Cl	2-CF ₃	3-Cl	2-F, 4-F	3-Cl
2-Me	4-Cl	2-CF ₃	4-Cl	2-F, 4-F	4-Cl
2-Me	3-CF ₃	2-CF ₃	3-CF ₃	2-F, 4-F	3-CF ₃
2-Me	4-CF ₃	2-CF ₃	4-CF ₃	2-F, 4-F	4-CF ₃
2-Me	4-OCF ₃	2-CF ₃	4-OCF ₃	2-F, 4-F	4-OCF ₃
2-Me	3-Cl, 4-Cl	2-CF ₃	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F	3-Cl, 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-CF ₃	2-CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-Me	3-CF ₃ , 4-Cl	2-CF ₃	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-Me	3-Cl, 4-F	2-CF ₃	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F	3-Cl, 4-F
2-F, 6-F	3-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl	4-F	3-Cl
2-F, 6-F	4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	4-Cl	4-F	4-Cl
2-F, 6-F	3-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃	4-F	3-CF ₃
2-F, 6-F	4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-CF ₃	4-F	4-CF ₃
2-F, 6-F	4-OCF ₃	2-F, 4-F, 6-F	4-OCF ₃	4-F	4-OCF ₃
2-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-Cl	4-F	3-Cl, 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-CF ₃	4-F	3-Cl, 4-CF ₃
2-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	2-F, 4-F, 6-F	3-CF ₃ , 4-Cl	4-F	3-CF ₃ , 4-Cl
2-F, 6-F	3-Cl, 4-F	2-F, 4-F, 6-F	3-Cl, 4-F	4-F	3-Cl, 4-F

TABLA 6A



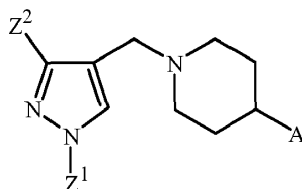
A es ciano

Z ¹	Z ²	Z ¹	Z ²
4,5-dicloro-2-piridinilo	2-(OCF ₃)-3-piridinilo	4,5-dicloro-2-piridinilo	2-(CF ₃)-3-piridinilo
5,6-dicloro-2-piridinilo	2-(OCF ₃)-3-piridinilo	5,6-dicloro-2-piridinilo	2-(CF ₃)-3-piridinilo
4,5-dicloro-2-pirimidinilo	2-(OCF ₃)-3-piridinilo	4,5-dicloro-2-pirimidinilo	2-(CF ₃)-3-piridinilo
4-cloro-5-(CF ₃)-2-piridinilo	2-(OCF ₃)-3-piridinilo	4-cloro-5-(CF ₃)-2-piridinilo	2-(CF ₃)-3-piridinilo
5-cloro-6-(CF ₃)-2-piridinilo	2-(OCF ₃)-3-piridinilo	5-cloro-6-(CF ₃)-2-piridinilo	2-(CF ₃)-3-piridinilo
4-cloro-5-(CF ₃)-2-pirimidinilo	2-(OCF ₃)-3-piridinilo	4-cloro-5-(CF ₃)-2-pirimidinilo	2-(CF ₃)-3-piridinilo
4-cloro-5-(OCF ₃)-2-piridinilo	2-(OCF ₃)-3-piridinilo	4-cloro-5-(OCF ₃)-2-piridinilo	2-(CF ₃)-3-piridinilo
5-cloro-6-(OCF ₃)-2-piridinilo	2-(OCF ₃)-3-piridinilo	5-cloro-6-(OCF ₃)-2-piridinilo	2-(CF ₃)-3-piridinilo
4-cloro-5-(OCF ₃)-2-pirimidinilo	2-(OCF ₃)-3-piridinilo	4-cloro-5-(OCF ₃)-2-pirimidinilo	2-(CF ₃)-3-piridinilo
4-(CF ₃)-5-cloro-2-piridinilo	2-(OCF ₃)-3-piridinilo	4-(CF ₃)-5-cloro-2-piridinilo	2-(CF ₃)-3-piridinilo
5-(CF ₃)-6-cloro-2-piridinilo	2-(OCF ₃)-3-piridinilo	5-(CF ₃)-6-cloro-2-piridinilo	2-(CF ₃)-3-piridinilo
4-(CF ₃)-5-cloro-2-pirimidinilo	2-(OCF ₃)-3-piridinilo	4-(CF ₃)-5-cloro-2-pirimidinilo	2-(CF ₃)-3-piridinilo
4,5-bis(CF ₃)-2-piridinilo	2-(OCF ₃)-3-piridinilo	4,5-bis(CF ₃)-2-piridinilo	2-(CF ₃)-3-piridinilo
5,6-bis(CF ₃)-2-piridinilo	2-(OCF ₃)-3-piridinilo	5,6-bis(CF ₃)-2-piridinilo	2-(CF ₃)-3-piridinilo
4,5-bis(CF ₃)-2-pirimidinilo	2-(OCF ₃)-3-piridinilo	4,5-bis(CF ₃)-2-pirimidinilo	2-(CF ₃)-3-piridinilo
4-(OCF ₃)-5-cloro-2-piridinilo	2-(OCF ₃)-3-piridinilo	4-(OCF ₃)-5-cloro-2-piridinilo	2-(CF ₃)-3-piridinilo
5-(OCF ₃)-6-cloro-2-piridinilo	2-(OCF ₃)-3-piridinilo	5-(OCF ₃)-6-cloro-2-piridinilo	2-(CF ₃)-3-piridinilo
4-(OCF ₃)-5-cloro-2-pirimidinilo	2-(OCF ₃)-3-piridinilo	4-(OCF ₃)-5-cloro-2-pirimidinilo	2-(CF ₃)-3-piridinilo
2-naftalenilo	2-(OCF ₃)-3-piridinilo	2-naftalenilo	2-(CF ₃)-3-piridinilo
2-quinolinilo	2-(OCF ₃)-3-piridinilo	2-quinolinilo	2-(CF ₃)-3-piridinilo
5-cloro-2-piridinilo	2-(OCF ₃)-3-piridinilo	5-cloro-2-piridinilo	2-(CF ₃)-3-piridinilo
5-bromo-2-piridinilo	2-(OCF ₃)-3-piridinilo	5-bromo-2-piridinilo	2-(CF ₃)-3-piridinilo
5-fluoro-2-piridinilo	2-(OCF ₃)-3-piridinilo	5-fluoro-2-piridinilo	2-(CF ₃)-3-piridinilo
5-(CF ₃)-2-piridinilo	2-(OCF ₃)-3-piridinilo	5-(CF ₃)-2-piridinilo	2-(CF ₃)-3-piridinilo
5-(OCF ₃)-2-piridinilo	2-(OCF ₃)-3-piridinilo	5-(OCF ₃)-2-piridinilo	2-(CF ₃)-3-piridinilo
4-(CF ₃)-2-piridinilo	2-(OCF ₃)-3-piridinilo	4-(CF ₃)-2-piridinilo	2-(CF ₃)-3-piridinilo
4,5-dicloro-2-piridinilo	2-cloro-3-piridinilo	4,5-dicloro-2-piridinilo	3-fluoro-4-piridinilo
5,6-dicloro-2-piridinilo	2-cloro-3-piridinilo	5,6-dicloro-2-piridinilo	3-fluoro-4-piridinilo
4,5-dicloro-2-pirimidinilo	2-cloro-3-piridinilo	4,5-dicloro-2-pirimidinilo	3-fluoro-4-piridinilo
4-cloro-5-(CF ₃)-2-piridinilo	2-cloro-3-piridinilo	4-cloro-5-(CF ₃)-2-piridinilo	3-fluoro-4-piridinilo
5-cloro-6-(CF ₃)-2-piridinilo	2-cloro-3-piridinilo	5-cloro-6-(CF ₃)-2-piridinilo	3-fluoro-4-piridinilo
4-cloro-5-(CF ₃)-2-pirimidinilo	2-cloro-3-piridinilo	4-cloro-5-(CF ₃)-2-pirimidinilo	3-fluoro-4-piridinilo
4-cloro-5-(OCF ₃)-2-piridinilo	2-cloro-3-piridinilo	4-cloro-5-(OCF ₃)-2-piridinilo	3-fluoro-4-piridinilo
5-cloro-6-(OCF ₃)-2-piridinilo	2-cloro-3-piridinilo	5-cloro-6-(OCF ₃)-2-piridinilo	3-fluoro-4-piridinilo
4-cloro-5-(OCF ₃)-2-pirimidinilo	2-cloro-3-piridinilo	4-cloro-5-(OCF ₃)-2-pirimidinilo	3-fluoro-4-piridinilo

A es ciano

Z ¹	Z ²	Z ¹	Z ²
4-(CF ₃)-5-cloro-2-piridinilo	2-cloro-3-piridinilo	4-(CF ₃)-5-cloro-2-piridinilo	3-fluoro-4-piridinilo
5-(CF ₃)-6-cloro-2-piridinilo	2-cloro-3-piridinilo	5-(CF ₃)-6-cloro-2-piridinilo	3-fluoro-4-piridinilo
4-(CF ₃)-5-cloro-2-pirimidinilo	2-cloro-3-piridinilo	4-(CF ₃)-5-cloro-2-pirimidinilo	3-fluoro-4-piridinilo
4,5-bis(CF ₃)-2-piridinilo	2-cloro-3-piridinilo	4,5-bis(CF ₃)-2-piridinilo	3-fluoro-4-piridinilo
5,6-bis(CF ₃)-2-piridinilo	2-cloro-3-piridinilo	5,6-bis(CF ₃)-2-piridinilo	3-fluoro-4-piridinilo
4,5-bis(CF ₃)-2-pirimidinilo	2-cloro-3-piridinilo	4,5-bis(CF ₃)-2-pirimidinilo	3-fluoro-4-piridinilo
4-(OCF ₃)-5-cloro-2-piridinilo	2-cloro-3-piridinilo	4-(OCF ₃)-5-cloro-2-piridinilo	3-fluoro-4-piridinilo
5-(OCF ₃)-6-cloro-2-piridinilo	2-cloro-3-piridinilo	5-(OCF ₃)-6-cloro-2-piridinilo	3-fluoro-4-piridinilo
4-(OCF ₃)-5-cloro-2-pirimidinilo	2-cloro-3-piridinilo	4-(OCF ₃)-5-cloro-2-pirimidinilo	3-fluoro-4-piridinilo
2-naftalenilo	2-cloro-3-piridinilo	2-naftalenilo	3-fluoro-4-piridinilo
2-quinolinilo	2-cloro-3-piridinilo	2-quinolinilo	3-fluoro-4-piridinilo
5-cloro-2-piridinilo	2-cloro-3-piridinilo	5-cloro-2-piridinilo	3-fluoro-4-piridinilo
5-bromo-2-piridinilo	2-cloro-3-piridinilo	5-bromo-2-piridinilo	3-fluoro-4-piridinilo
5-fluoro-2-piridinilo	2-cloro-3-piridinilo	5-fluoro-2-piridinilo	3-fluoro-4-piridinilo
5-(CF ₃)-2-piridinilo	2-cloro-3-piridinilo	5-(CF ₃)-2-piridinilo	3-fluoro-4-piridinilo
5-(OCF ₃)-2-piridinilo	2-cloro-3-piridinilo	5-(OCF ₃)-2-piridinilo	3-fluoro-4-piridinilo
4-(CF ₃)-2-piridinilo	2-cloro-3-piridinilo	4-(CF ₃)-2-piridinilo	3-fluoro-4-piridinilo

TABLA 6b



Z² es 2-fluorofenilo, A es ciano

Z ¹	Z ¹	Z ¹
4,5-dicloro-2-piridinilo	4-cloro-5-(OCF ₃)-2-piridinilo	4,5-bis(CF ₃)-2-piridinilo
5,6-dicloro-2-piridinilo	5-cloro-6-(OCF ₃)-2-piridinilo	5,6-bis(CF ₃)-2-piridinilo
4,5-dicloro-2-pirimidinilo	4-cloro-5-(OCF ₃)-2-pirimidinilo	4,5-bis(CF ₃)-2-pirimidinilo
4-cloro-5-(CF ₃)-2-piridinilo	4-(CF ₃)-5-cloro-2-piridinilo	4-(OCF ₃)-5-cloro-2-piridinilo
5-cloro-6-(CF ₃)-2-piridinilo	5-(CF ₃)-6-cloro-2-piridinilo	5-(OCF ₃)-6-cloro-2-piridinilo
4-cloro-5-(CF ₃)-2-pirimidinilo	4-(CF ₃)-5-cloro-2-pirimidinilo	4-(OCF ₃)-5-cloro-2-pirimidinilo
5,6-dicloro-3-piridinilo	6-cloro-3-piridinilo	2-cloro-4-piridinilo
4,5-dicloro-2-furanilo	4,5-dicloro-2-tienilo	2-naftalenilo
2-quinolinilo	5-cloro-2-piridinilo	5-bromo-2-piridinilo
5-fluoro-2-piridinilo	5-(CF ₃)-2-piridinilo	5-(OCF ₃)-2-piridinilo
4-(CF ₃)-2-piridinilo		

Z² es 4-fluorofenilo, A es ciano

Z ¹	Z ¹	Z ¹
4,5-dicloro-2-piridinilo	4-cloro-5-(OCF ₃)-2-piridinilo	4,5-bis(CF ₃)-2-piridinilo

ES 2 659 033 T3

Z² es 4-fluorofenilo, A es ciano

Z ¹	Z ¹	Z ¹
5,6-dicloro-2-piridinilo	5-cloro-6-(OCF ₃)-2-piridinilo	5,6-bis(CF ₃)-2-piridinilo
4,5-dicloro-2-pirimidinilo	4-cloro-5-(OCF ₃)-2-pirimidinilo	4,5-bis(CF ₃)-2-pirimidinilo
4-cloro-5-(CF ₃)-2-piridinilo	4-(CF ₃)-5-cloro-2-piridinilo	4-(OCF ₃)-5-cloro-2-piridinilo
5-cloro-6-(CF ₃)-2-piridinilo	5-(CF ₃)-6-cloro-2-piridinilo	5-(OCF ₃)-6-cloro-2-piridinilo
4-cloro-5-(CF ₃)-2-pirimidinilo	4-(CF ₃)-5-cloro-2-pirimidinilo	4-(OCF ₃)-5-cloro-2-pirimidinilo
5,6-dicloro-3-piridinilo	6-cloro-3-piridinilo	2-cloro-4-piridinilo
4,5-dicloro-2-furanilo	4,5-dicloro-2-tienilo	2-naftalenilo
2-quinolinilo	5-cloro-2-piridinilo	5-bromo-2-piridinilo
5-fluoro-2-piridinilo	5-(CF ₃)-2-piridinilo	5-(OCF ₃)-2-piridinilo
4-(CF ₃)-2-piridinilo		

Z² es 2-clorofenilo, A es ciano

Z ¹	Z ¹	Z ¹
4,5-dicloro-2-piridinilo	4-cloro-5-(OCF ₃)-2-piridinilo	4,5-bis(CF ₃)-2-piridinilo
5,6-dicloro-2-piridinilo	5-cloro-6-(OCF ₃)-2-piridinilo	5,6-bis(CF ₃)-2-piridinilo
4,5-dicloro-2-pirimidinilo	4-cloro-5-(OCF ₃)-2-pirimidinilo	4,5-bis(CF ₃)-2-pirimidinilo
4-cloro-5-(CF ₃)-2-piridinilo	4-(CF ₃)-5-cloro-2-piridinilo	4-(OCF ₃)-5-cloro-2-piridinilo
5-cloro-6-(CF ₃)-2-piridinilo	5-(CF ₃)-6-cloro-2-piridinilo	5-(OCF ₃)-6-cloro-2-piridinilo
4-cloro-5-(CF ₃)-2-pirimidinilo	4-(CF ₃)-5-cloro-2-pirimidinilo	4-(OCF ₃)-5-cloro-2-pirimidinilo
5,6-dicloro-3-piridinilo	6-cloro-3-piridinilo	2-cloro-4-piridinilo
4,5-dicloro-2-furanilo	4,5-dicloro-2-tienilo	2-naftalenilo
2-quinolinilo	5-cloro-2-piridinilo	5-bromo-2-piridinilo
5-fluoro-2-piridinilo	5-(CF ₃)-2-piridinilo	5-(OCF ₃)-2-piridinilo
4-(CF ₃)-2-piridinilo		

Z² es 2-bromofenilo, A es ciano

Z ¹	Z ¹	Z ¹
4,5-dicloro-2-piridinilo	4-cloro-5-(OCF ₃)-2-piridinilo	4,5-bis(CF ₃)-2-piridinilo
5,6-dicloro-2-piridinilo	5-cloro-6-(OCF ₃)-2-piridinilo	5,6-bis(CF ₃)-2-piridinilo
4,5-dicloro-2-pirimidinilo	4-cloro-5-(OCF ₃)-2-pirimidinilo	4,5-bis(CF ₃)-2-pirimidinilo
4-cloro-5-(CF ₃)-2-piridinilo	4-(CF ₃)-5-cloro-2-piridinilo	4-(OCF ₃)-5-cloro-2-piridinilo
5-cloro-6-(CF ₃)-2-piridinilo	5-(CF ₃)-6-cloro-2-piridinilo	5-(OCF ₃)-6-cloro-2-piridinilo
4-cloro-5-(CF ₃)-2-pirimidinilo	4-(CF ₃)-5-cloro-2-pirimidinilo	4-(OCF ₃)-5-cloro-2-pirimidinilo
5,6-dicloro-3-piridinilo	6-cloro-3-piridinilo	2-cloro-4-piridinilo
4,5-dicloro-2-furanilo	4,5-dicloro-2-tienilo	2-naftalenilo
2-quinolinilo	5-cloro-2-piridinilo	5-bromo-2-piridinilo
5-fluoro-2-piridinilo	5-(CF ₃)-2-piridinilo	5-(OCF ₃)-2-piridinilo
4-(CF ₃)-2-piridinilo		

Z² es 2-metilfenilo, A es ciano

Z ¹	Z ¹	Z ¹
4,5-dicloro-2-piridinilo	4-cloro-5-(OCF ₃)-2-piridinilo	4,5-bis(CF ₃)-2-piridinilo
5,6-dicloro-2-piridinilo	5-cloro-6-(OCF ₃)-2-piridinilo	5,6-bis(CF ₃)-2-piridinilo
4,5-dicloro-2-pirimidinilo	4-cloro-5-(OCF ₃)-2-pirimidinilo	4,5-bis(CF ₃)-2-pirimidinilo
4-cloro-5-(CF ₃)-2-piridinilo	4-(CF ₃)-5-cloro-2-piridinilo	4-(OCF ₃)-5-cloro-2-piridinilo
5-cloro-6-(CF ₃)-2-piridinilo	5-(CF ₃)-6-cloro-2-piridinilo	5-(OCF ₃)-6-cloro-2-piridinilo
4-cloro-5-(CF ₃)-2-pirimidinilo	4-(CF ₃)-5-cloro-2-pirimidinilo	4-(OCF ₃)-5-cloro-2-pirimidinilo
5,6-dicloro-3-piridinilo	6-cloro-3-piridinilo	2-cloro-4-piridinilo
4,5-dicloro-2-furanilo	4,5-dicloro-2-tienilo	2-naftalenilo
2-quinolinilo	5-cloro-2-piridinilo	5-bromo-2-piridinilo
5-fluoro-2-piridinilo	5-(CF ₃)-2-piridinilo	5-(OCF ₃)-2-piridinilo
4-(CF ₃)-2-piridinilo		

Z² es 2-(trifluorometil)fenilo, A es ciano

Z ¹	Z ¹	Z ¹
4,5-dicloro-2-piridinilo	4-cloro-5-(OCF ₃)-2-piridinilo	4,5-bis(CF ₃)-2-piridinilo
5,6-dicloro-2-piridinilo	5-cloro-6-(OCF ₃)-2-piridinilo	5,6-bis(CF ₃)-2-piridinilo
4,5-dicloro-2-pirimidinilo	4-cloro-5-(OCF ₃)-2-pirimidinilo	4,5-bis(CF ₃)-2-pirimidinilo
4-cloro-5-(CF ₃)-2-piridinilo	4-(CF ₃)-5-cloro-2-piridinilo	4-(OCF ₃)-5-cloro-2-piridinilo
5-cloro-6-(CF ₃)-2-piridinilo	5-(CF ₃)-6-cloro-2-piridinilo	5-(OCF ₃)-6-cloro-2-piridinilo
4-cloro-5-(CF ₃)-2-pirimidinilo	4-(CF ₃)-5-cloro-2-pirimidinilo	4-(OCF ₃)-5-cloro-2-pirimidinilo
5,6-dicloro-3-piridinilo	6-cloro-3-piridinilo	2-cloro-4-piridinilo
4,5-dicloro-2-furanilo	4,5-dicloro-2-tienilo	2-naftalenilo
2-quinolinilo	5-cloro-2-piridinilo	5-bromo-2-piridinilo
5-fluoro-2-piridinilo	5-(CF ₃)-2-piridinilo	5-(OCF ₃)-2-piridinilo
4-(CF ₃)-2-piridinilo		

Z² es 2,4-difluorofenilo, A es ciano

ES 2 659 033 T3

Z ¹	Z ¹	Z ¹
4,5-dicloro-2-piridinilo 5,6-dicloro-2-piridinilo 4,5-dicloro-2-pirimidinilo 4-cloro-5-(CF ₃)-2-piridinilo 5-cloro-6-(CF ₃)-2-piridinilo 4-cloro-5-(CF ₃)-2-pirimidinilo 5,6-dicloro-3-piridinilo 4,5-dicloro-2-furanilo 2-quinolinilo 5-fluoro-2-piridinilo 4-(CF ₃)-2-piridinilo	4-cloro-5-(OCF ₃)-2-piridinilo 5-cloro-6-(OCF ₃)-2-piridinilo 4-cloro-5-(OCF ₃)-2-pirimidinilo 4-(CF ₃)-5-cloro-2-piridinilo 5-(CF ₃)-6-cloro-2-piridinilo 4-(CF ₃)-5-cloro-2-pirimidinilo 6-cloro-3-piridinilo 4,5-dicloro-2-tienilo 5-cloro-2-piridinilo 5-(CF ₃)-2-piridinilo	4,5-bis(CF ₃)-2-piridinilo 5,6-bis(CF ₃)-2-piridinilo 4,5-bis(CF ₃)-2-pirimidinilo 4-(OCF ₃)-5-cloro-2-piridinilo 5-(OCF ₃)-6-cloro-2-piridinilo 4-(OCF ₃)-5-cloro-2-pirimidinilo 2-cloro-4-piridinilo 2-naftalenilo 5-bromo-2-piridinilo 5-(OCF ₃)-2-piridinilo
Z ² es 2,6-difluorofenilo, A es ciano		
Z ¹	Z ¹	Z ¹
4,5-dicloro-2-piridinilo 5,6-dicloro-2-piridinilo 4,5-dicloro-2-pirimidinilo 4-cloro-5-(CF ₃)-2-piridinilo 5-cloro-6-(CF ₃)-2-piridinilo 4-cloro-5-(CF ₃)-2-pirimidinilo 5,6-dicloro-3-piridinilo 4,5-dicloro-2-furanilo 2-quinolinilo 5-fluoro-2-piridinilo 4-(CF ₃)-2-piridinilo	4-cloro-5-(OCF ₃)-2-piridinilo 5-cloro-6-(OCF ₃)-2-piridinilo 4-cloro-5-(OCF ₃)-2-pirimidinilo 4-(CF ₃)-5-cloro-2-piridinilo 5-(CF ₃)-6-cloro-2-piridinilo 4-(CF ₃)-5-cloro-2-pirimidinilo 6-cloro-3-piridinilo 4,5-dicloro-2-tienilo 5-cloro-2-piridinilo 5-(CF ₃)-2-piridinilo	4,5-bis(CF ₃)-2-piridinilo 5,6-bis(CF ₃)-2-piridinilo 4,5-bis(CF ₃)-2-pirimidinilo 4-(OCF ₃)-5-cloro-2-piridinilo 5-(OCF ₃)-6-cloro-2-piridinilo 4-(OCF ₃)-5-cloro-2-pirimidinilo 2-cloro-4-piridinilo 2-naftalenilo 5-bromo-2-piridinilo 5-(OCF ₃)-2-piridinilo
Z ² es 2,4,6-trifluorofenilo, A es ciano		
Z ¹	Z ¹	Z ¹
4,5-dicloro-2-piridinilo 5,6-dicloro-2-piridinilo 4,5-dicloro-2-pirimidinilo 4-cloro-5-(CF ₃)-2-piridinilo 5-cloro-6-(CF ₃)-2-piridinilo 4-cloro-5-(CF ₃)-2-pirimidinilo 5,6-dicloro-3-piridinilo 4,5-dicloro-2-furanilo 2-quinolinilo 5-fluoro-2-piridinilo 4-(CF ₃)-2-piridinilo	4-cloro-5-(OCF ₃)-2-piridinilo 5-cloro-6-(OCF ₃)-2-piridinilo 4-cloro-5-(OCF ₃)-2-pirimidinilo 4-(CF ₃)-5-cloro-2-piridinilo 5-(CF ₃)-6-cloro-2-piridinilo 4-(CF ₃)-5-cloro-2-pirimidinilo 6-cloro-3-piridinilo 4,5-dicloro-2-tienilo 5-cloro-2-piridinilo 5-(CF ₃)-2-piridinilo	4,5-bis(CF ₃)-2-piridinilo 5,6-bis(CF ₃)-2-piridinilo 4,5-bis(CF ₃)-2-pirimidinilo 4-(OCF ₃)-5-cloro-2-piridinilo 5-(OCF ₃)-6-cloro-2-piridinilo 4-(OCF ₃)-5-cloro-2-pirimidinilo 2-cloro-4-piridinilo 2-naftalenilo 5-bromo-2-piridinilo 5-(OCF ₃)-2-piridinilo
Z ² es 2-cloro-3-piridinilo, A es ciano		
Z ¹	Z ¹	Z ¹
2-fluorofenilo	2-clorofenilo	2-bromofenilo

Z² es 2-cloro-3-piridinilo, A es ciano

Z ¹	Z ¹	Z ¹
2-metilfenilo 2,6-difluorofenilo	2-(trifluorometil)fenilo	2,4-difluorofenilo

Z² es 2-(trifluorometil)-3-piridinilo, A es ciano

Z ¹	Z ¹	Z ¹
2-fluorofenilo 2-metilfenilo 2,6-difluorofenilo	2-clorofenilo 2-(trifluorometil)fenilo	2-bromofenilo 2,4-difluorofenilo

Z² es 2-(trifluorometoxi)-3-piridinilo, A es ciano

Z ¹	Z ¹	Z ¹
2-fluorofenilo 2-metilfenilo 2,6-difluorofenilo	2-clorofenilo 2-(trifluorometil)fenilo	2-bromofenilo 2,4-difluorofenilo

5 Un compuesto de esta invención se utilizará generalmente como un ingrediente activo de control de plagas de invertebrados en una composición, es decir, formulación, con al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos, que sirve como un portador. Los ingredientes de la formulación o composición se seleccionan para que sean compatibles con las propiedades físicas del ingrediente activo, modo de aplicación y factores medioambientales tales como el tipo de suelo, la humedad y la temperatura.

10 Las formulaciones útiles incluyen ambas composiciones tanto líquidas como sólidas. Las composiciones líquidas incluyen soluciones (incluyendo productos concentrados emulsionables), suspensiones, emulsiones (incluyendo microemulsiones y/o suspoemulsiones) y similares, que opcionalmente pueden ser espesadas a geles. Los tipos generales de composiciones líquidas acuosas son producto concentrado soluble, producto concentrado en suspensión, suspensión para cápsulas, emulsión concentrada, microemulsión y suspo-emulsión. Los tipos generales de composiciones líquidas no acuosas son producto concentrado emulsionable, producto concentrado microemulsionable, producto concentrado dispersable y dispersión oleosa.

20 Los tipos generales de composiciones sólidas son espolvoreables, polvos, gránulos, pélets, perlitas, pastillas, comprimidos, películas rellenas (incluyendo recubrimientos de semillas) y similares, que pueden ser dispersables en agua ("mojables") o soluble en agua. Las películas y recubrimientos formados a partir de soluciones que forman película o suspensiones verticales son particularmente útiles para el tratamiento de semillas. El ingrediente activo puede estar (micro)encapsulado y adicionalmente conformado en una suspensión o formulación sólida; alternativamente la formulación de ingrediente activo completa puede estar encapsulada (o "recubierta"). La encapsulación puede controlar o retrasar la liberación del ingrediente activo. Un gránulo emulsionable combina las ventajas de una formulación concentrada emulsionable y una formulación granular seca. Las composiciones de alta resistencia son utilizadas fundamentalmente como intermedios para la formulación adicional.

25 Las formulaciones pulverizables se extienden típicamente en un medio adecuado antes de la pulverización. Tales formulaciones líquidas y sólidas están formuladas para ser diluidas inmediatamente en el medio de pulverización, normalmente agua. Los volúmenes de pulverización pueden oscilar desde aproximadamente uno a varios miles de litros por hectárea, pero más típicamente están en el intervalo desde aproximadamente diez a varios cientos de litros por hectárea. Las formulaciones pulverizables se pueden mezclar en tanques con agua u otro medio adecuado para tratamiento foliar mediante aplicación aérea o terrestre, o para aplicación al medio de crecimiento de la planta. Las formulaciones líquidas y secas se pueden medir directamente en sistemas de riego por goteo o se pueden medir en el surco durante la plantación. Las formulaciones líquidas y sólidas se pueden aplicar sobre semillas de cultivos y otra vegetación deseable como tratamiento de semillas antes de la plantación para proteger las raíces en desarrollo y otras partes subterráneas de la planta y/o follaje a través de absorción sistémica.

35 Las formulaciones contendrán típicamente cantidades eficaces de ingrediente activo, diluyente y tensioactivo dentro de los siguientes intervalos aproximados que añaden hasta 100 por cien en peso.

Porcentaje en peso

Ingrediente activo	Diluyente	Tensioactivo
--------------------	-----------	--------------

Gránulos, Comprimidos y Polvos Dispersables en Agua y Solubles en Agua	0,001-90	0-99,999	0-15
Dispersiones, Suspensiones, Emulsiones, Soluciones oleosas (incluyendo Productos Concentrados Emulsionables)	1-50	40-99	0-50
Espolvoreables	1-25	70-99	0-5
Gránulos y Péllets	0,001-95	5-99,999	0-15
Composiciones de alta resistencia	90-99	0-10	0-2

Los diluyentes sólidos incluyen, por ejemplo, arcillas tales como bentonita, montmorillonita, atapulgita y caolín, yeso, celulosa, dióxido de titanio, óxido de zinc, almidón, dextrina, azúcares (p. ej., lactosa, sacarosa), sílice, talco, mica, tierra de diatomeas, urea, carbonato de calcio, carbonato de sodio y bicarbonato y sulfato de sodio. Los diluyentes sólidos típicos se describen en Watkins et al., *Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers*, 2ª Ed., Dorland Books, Caldwell, New Jersey.

Los diluyentes líquidos incluyen, por ejemplo, agua, *N,N*-dimetilalcanamidas (p.ej., *N,N*-dimetilformamida), limoneno, dimetil sulfoxido, *N*-alquilpirrolidonas (p.ej., *N*-metilpirrolidinona), etilen glicol, trietilen glicol, propilen glicol, dipropilen glicol, polipropilen glicol, carbonato de propileno, carbonato de butileno, parafinas (p.ej., aceites minerales blancos, parafinas normales, isoparafinas), alquilbencenos, alquilnaftalenos, glicerina, triacetato de glicerol, sorbitol, triacetin, hidrocarburos aromáticos, alifáticos desaromatizados, alquilbencenos, alquilnaftalenos, cetonas tales como ciclohexanona, 2-heptanona, isoforona y 4-hidroxi-4-metil-2-pentanona, acetatos tales como acetato de isoamilo, acetato de hexilo, acetato de heptilo, acetato de octilo, acetato de nonilo, acetato de tridecilo e acetato de isobornilo, otros ésteres tales como ésteres de lactato alquilado, ésteres dibásicos y γ -butirolactona, y alcoholes, que pueden ser lineales, ramificados, saturados o insaturados, tales como metanol, etanol, *n*-propanol, alcohol isopropílico, *n*-butanol, alcohol isobutílico, *n*-hexanol, 2-etilhexanol, *n*-octanol, decanol, alcohol isodecílico, isooctadecanol, alcohol cetílico, alcohol laurílico, alcohol tridecílico, alcohol oleílico, ciclohexanol, alcohol tetrahidrofurfurílico, alcohol diacetónico y alcohol bencílico. Los diluyentes líquidos también incluyen ésteres de glicerol de ácidos grasos saturados e insaturados (típicamente C₆-C₂₂), tales como aceites de semillas y frutos vegetales (p. ej., aceites de oliva, ricino, linaza, sésamo, maíz (maíz), cacahuete, girasol, semilla de uva, cártamo, semilla de algodón, soja, colza, coco y palmiste), grasas de origen animal (p. ej., sebo de ternera, sebo de cerdo, manteca de cerdo, aceite de hígado de bacalao, aceite de pescado) y mezclas de los mismos. Los diluyentes líquidos también incluyen ácidos grasos alquilados (p. ej., metilados, etilados, butilados) en donde los ácidos grasos pueden obtenerse por hidrólisis de ésteres de glicerol de fuentes vegetales y animales, y pueden purificarse por destilación. Los diluyentes líquidos típicos se describen en Marsden, *Solvents Guide*, 2ª Ed., Interscience, Nueva York, 1950.

Las composiciones sólidas y líquidas de la presente invención a menudo incluyen uno o más tensioactivos. Cuando se agregan a un líquido, los surfactantes (también conocidos como "agentes tensioactivos") generalmente modifican, muy a menudo reducen, la tensión superficial del líquido. Dependiendo de la naturaleza de los grupos hidrófilos y lipófilos en una molécula de tensioactivo, los tensioactivos pueden ser útiles como agentes humectantes, dispersantes, emulsionantes o agentes desespumantes.

Los tensioactivos se pueden clasificar como no iónicos, aniónicos o catiónicos. Los tensioactivos no iónicos útiles para las presentes composiciones incluyen, pero no están limitados a: productos alcoxilados alcohólicos tales como productos alcoxilados alcohólicos basados en alcoholes naturales y sintéticos (que son ramificados o lineales) y preparados a partir de alcoholes y óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de los mismos; productos etoxilados de aminas, alcanolamidas y alcanolamidas etoxiladas; triglicéridos alcoxilados tales como aceites etoxilados de soja, ricino y colza; productos alcoxilados de alquilfenoles tales como productos etoxilados de octilfenol, productos etoxilados de nonilfenol, productos etoxilados de dinonil fenol y productos etoxilados de dodecil fenol (preparados a partir de los fenoles y óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de los mismos); polímeros de bloque preparados a partir de óxido de etileno u óxido de propileno y polímeros de bloque inverso en los que los bloques terminales se preparan a partir de óxido de propileno; ácidos grasos etoxilados; ésteres grasos y aceites etoxilados; ésteres metílicos etoxilados; triestirilfenol etoxilado (incluidos los preparados a partir de óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de los mismos); ésteres de ácidos grasos, ésteres de glicerol, derivados basados en lanolina, ésteres de productos polietoxilados tales como ésteres de ácidos grasos de sorbitán polietoxilado, ésteres de ácidos grasos de sorbitol polietoxilado y ésteres de ácidos grasos de glicerol polietoxilado; otros derivados de sorbitán tales como ésteres de sorbitán; tensioactivos poliméricos tales como copolímeros al azar, copolímeros de bloques, resinas alquídicas pegiladas (polietilenglicol), polímeros de injerto o de peine y polímeros en estrella; polietilenglicoles (peg); ésteres de ácidos grasos de polietilenglicol; tensioactivos a base de silicona; y derivados de azúcar tales como ésteres de sacarosa, alquil poliglicósidos y alquil polisacáridos.

Los tensioactivos aniónicos útiles incluyen, pero no se limitan a: ácidos alquilarilsulfónicos y sus sales; productos etoxilados de alcohol o alquilfenol carboxilados; derivados de sulfonato de difenilo; lignina y derivados de lignina

tales como lignosulfonatos; ácidos maleico o succínico o sus anhídridos; olefin sulfonatos; ésteres fosfato tales como ésteres fosfato de productos alcoxilados alcohólicos, ésteres fosfato de productos alcoxilados alquilfenólicos y ésteres fosfato de productos etoxilados de estiril fenol; tensioactivos basados en proteínas; derivados de sarcosina; étersulfato de estiril fenol; sulfatos y sulfonatos de aceites y ácidos grasos; sulfatos y sulfonatos de alquilfenoles etoxilados; sulfatos de alcoholes; sulfatos de alcoholes etoxilados; sulfonatos de aminas y amidas tales como *N,N*-alquilauratos; sulfonatos de benceno, cumeno, tolueno, xileno y dodecil- y tridecil-bencenos; sulfonatos de naftaleno condensados; sulfonatos de naftaleno y alquilnaftaleno; sulfonatos de petróleo fraccionado; sulfosuccinamatos; y sulfosuccinatos y sus derivados tales como sales de dialquilsulfosuccinato.

Los tensioactivos catiónicos útiles incluyen, pero no se limitan a: amidas y amidas etoxiladas; aminas tales como *N*-alquil propanodiaminas, tripropilentriaminas y dipropilentetraminas, y aminas etoxiladas, diaminas etoxiladas y aminas propoxiladas (preparadas a partir de aminas y óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de los mismos); sales de amina tales como acetatos de amina y sales de diamina; sales de amonio cuaternario tales como sales cuaternarias, sales cuaternarias etoxiladas y sales diquaternarias; y óxidos de aminas tales como óxidos de alquildimetilamina y óxidos de bis-(2-hidroxietil)-alquilamina.

También son útiles para las presentes composiciones mezclas de tensioactivos no iónicos y aniónicos o mezclas de tensioactivos no iónicos y catiónicos. Los tensioactivos no iónicos, aniónicos y catiónicos y sus usos recomendados se describen en una variedad de referencias publicadas que incluyen McCutcheon's Emulsifiers y Detergents, annual American and International Editions publicadas por McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; Sisely y Wood, Encyclopedia of Surface Active Agents, Chemical Publ. Co., Inc., Nueva York, 1964; y A.S. Davidson y B. Milwidsky, Synthetic Detergents, Séptima edición, John Wiley y Sons, Nueva York, 1987.

Las composiciones de esta invención también pueden contener auxiliares y aditivos de formulación, conocidos por los expertos en la técnica como coadyuvantes de formulación (algunos de los cuales también se puede considerar que funcionan como diluyentes sólidos, diluyentes líquidos o tensioactivos). Dichos auxiliares y aditivos de formulación pueden controlar: pH (tampones), la formación de espuma durante el procesamiento (antiespumantes tales como poliorganosiloxanos), la sedimentación de ingredientes activos (agentes de suspensión), la viscosidad (espesantes tixotrópicos), el crecimiento microbiano en el recipiente (antimicrobianos), la congelación del producto (anticongelantes), el color (tintes/dispersiones de pigmentos), el lavado (formadores de película o adhesivos), la evaporación (retardantes de la evaporación) y otros atributos de formulación. Los formadores de película incluyen, por ejemplo, poli(acetatos de vinilo), copolímeros de poli(acetato de vinilo), copolímero de polivinilpirrolidona-acetato de vinilo, alcoholes polivinílicos, copolímeros de poli(alcohol vinílico) y ceras. Los ejemplos de los auxiliares y aditivos de formulación incluyen los enumerados en el Volumen 2 de McCutcheon: Functional Materials, annual International and North American Editions publicado por McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; y publicación PCT WO 03/024222.

El compuesto de Fórmula 1 y cualquier otro ingrediente activo se incorporan típicamente a las presentes composiciones disolviendo el ingrediente activo en un disolvente o moliendo en un diluyente líquido o seco. Las soluciones, incluidos los concentrados emulsionables, se pueden preparar simplemente mezclando los ingredientes. Si el disolvente de una composición líquida destinada a utilizarse como un concentrado emulsionable es inmisible en agua, típicamente se añade un emulsionante para emulsionar el disolvente que contiene el activo tras la dilución con agua. Las suspensiones de ingrediente activo, con diámetros de partícula de hasta 2.000 μm , se pueden moler en húmedo utilizando molinos de medios para obtener partículas con diámetros promedio por debajo de 3 μm . Las suspensiones acuosas pueden prepararse en productos concentrados de suspensión terminados (véase, por ejemplo, el documento US 3.060.084) o procesarse adicionalmente mediante secado por pulverización para formar gránulos dispersables en agua. Las formulaciones secas generalmente requieren procedimientos de molienda en seco, que producen diámetros medios de partícula en el intervalo de 2 a 10 μm . Los espolvoreables y polvos se pueden preparar combinando y normalmente triturando (como con un molino de martillos o un molino de energía de fluidos). Los gránulos y pélets se pueden preparar pulverizando el material activo sobre portadores granulares preformados o mediante técnicas de aglomeración. Véanse Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, 4 de diciembre, 1967, pág. 147-48, Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4ª edición, McGraw-Hill, Nueva York, 1963, pág. 8-57 y siguientes, y documento WO 91/13546. Los pélets se pueden preparar como se describe en el documento US 4.172.714. Los gránulos dispersables en agua y solubles en agua se pueden preparar como se ilustra en los documentos US 4.144.050, US 3.920.442 y DE 3.246.493. Los comprimidos se pueden preparar como se ilustra en los documentos US 5.180.587, US 5.232.701 y US 5.208.030. Las películas se pueden preparar como se ilustra en los documentos GB 2.095.558 y U.S. 3.299.566.

Para obtener más información sobre la técnica de la formulación, véanse T.S. Woods, "The Formulator's Toolbox – Product Forms for Modern Agriculture" in Pesticide Chemistry and Bioscience. The Food-Environment Challenge, T. Brooks y T.R. Roberts, Eds., Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, pág. 120-133. Véase también el documento US 3.235.361, Col. 6, línea 16 a Col. 7, línea 19 y ejemplos 10-41; Documento US 3.309.192, Col. 5, línea 43 a Col. 7, línea 62 y ejemplos 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138-140, 162-164, 166, 167 y 169-182; Documentos US 2.891.855, Col. 3, línea 66 a Col. 5, línea 17 y ejemplos 1-4; Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., Nueva York, 1961, pág. 81-96; Hance *et al.*, Weed Control Handbook, 8ª Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989; y Developments in formulation technology, PJB Publications, Richmond, Reino Unido, 2000.

En los siguientes ejemplos, todas las formulaciones se preparan de manera convencional. Los números de los compuestos se refieren a los compuestos en las tablas índice A-D. Sin una elaboración adicional, se cree que un experto en la técnica que utilice la descripción precedente puede utilizar la presente invención en su máxima extensión. Los siguientes Ejemplos, por lo tanto, deben interpretarse como meramente ilustrativos, y no limitantes de la descripción de ninguna manera. Los porcentajes son en peso, salvo que se indique lo contrario.

5

Ejemplo A

Producto concentrado de alta resistencia

compuesto 41	98,5%
aerogel de sílice	0,5%
sílice fina amorfa sintética	1,0%

Ejemplo B

Polvo mojable

compuesto 77	65,0%
dodecilfenol polietilenglicol éter	2,0%
lignosulfonato de sodio	4,0%
silicoaluminato de sodio	6,0%
montmorillonita (calcinada)	23,0%

Ejemplo C

Gránulo

compuesto 546	10,0%
gránulos de atapulgita (materia poco volátil, 0,71/0,30 mm; tamices U.S.S. Núm. 25-50)	90,0%

Ejemplo D

Pélet extrudido

compuesto 613	25,0%
sulfato de sodio anhidro	10,0%
lignosulfato de calcio bruto	5,0%
alquilnaftalenosulfonato de sodio	1,0%
bentonita de calcio/magnesio	59,0%

10 Ejemplo E (Referencia)

Producto concentrado emulsionable

compuesto 869 (no reivindicado)	10,0%
hexoleato de polioxietilen sorbitol	20,0%
éster metílico de ácido graso C ₆ -C ₁₀	70,0%

Ejemplo F

Microemulsión

compuesto 805	5,0%
copolímero de polivinilpirrolidona-acetato de vinilo	30,0%

ES 2 659 033 T3

Alquilpoliglicósido	30,0%
monooleato de glicerilo	15,0%
Agua	20,0%

Ejemplo G

Tratamiento de semillas

compuesto 800	20,00%
copolímero de polivinilpirrolidona-acetato de vinilo	5,00%
cera montana ácida	5,00%
lignosulfonato de calcio	1,00%
copolímeros de bloque de polioxietileno/polioxipropileno	1,00%
alcohol estearílico (POE 20)	2,00%
poliorganoxilano	0,20%
tinte rojo colorante	0,05%
agua	65,75%

Ejemplo H

Barritas fertilizantes

compuesto 720	2,50%
copolímero de pirrolidona-estireno	4,80%
16-etoxilato de triestirilfenilo	2,30%
Talco	0,80%
almidón de maíz	5,00%
fertilizante de liberación lenta	36,00%
Caolín	38,00%
Agua	10,60%

ES 2 659 033 T3

Ejemplo I

Producto concentrado en suspensión

compuesto 802	35%
copolímero de bloques de butilpolioxietileno/polipropileno	4,0%
copolímero de ácido esteárico/polietilenglicol	1,0%
polímero acrílico de estireno	1,0%
goma xantana	0,1%
propilen glicol	5,0%
desespumante con una base de silicona	0,1%
1,2-benzisotiazolin-3-ona	0,1%
Agua	53,7%

Ejemplo J

Emulsión en agua

compuesto 801	10,0%
copolímero de bloques de butilpolioxietileno/polipropileno	4,0%
copolímero de ácido esteárico/polietilen glicol	1,0%
polímero acrílico de estireno	1,0%
goma xantana	0,1%
propilen glicol	5,0%
desespumante con una base de silicona	0,1%
1,2-benzisotiazolin-3-ona	0,1%
hidrocarburo con una base de petróleo aromático	20,0
agua	58,7%

Ejemplo K

Dispersión oleosa

compuesto 807	25%
hexaoleato de polioxietilén sorbitol	15%
arcilla bentonita modificada orgánicamente	2,5%
éster metílico de ácido graso	57,5%

Ejemplo L

Suspoemulsión

compuesto 806	10,0%
Imidacloprid	5,0%
copolímero de bloques de butilpolioxietileno/polipropileno	4,0%
copolímero de ácido esteárico/polietilén glicol	1,0%

Suspoemulsión

polímero acrílico de estireno	1,0%
goma xantana	0,1%
Propilenglicol	5,0%
desespumante con una base de silicona	0,1%
1,2-benzisotiazolin-3-ona	0,1%
hidrocarburo con una base de petróleo aromático	20,0%
Agua	53,7%

Los compuestos de esta invención muestran actividad contra un amplio espectro de plagas de invertebrados. Estas plagas incluyen invertebrados que habitan en una variedad de entornos tales como, por ejemplo, follaje de plantas, raíces, suelo, cultivos cosechados u otros alimentos, estructuras de construcción o tegumentos de animales. Estas plagas incluyen, por ejemplo, invertebrados que se alimentan de follaje (incluyendo hojas, tallos, flores y frutos), semillas, madera, fibras textiles o sangre o tejidos animales y causan, de ese modo, lesiones o daños a, por ejemplo, cultivos agronómicos en crecimiento o almacenados, bosques, cultivos de invernadero, plantas ornamentales, cultivos de vivero, productos alimenticios almacenados o productos de fibra, o casas u otras estructuras o sus contenidos, o son nocivos para la salud animal o la salud pública. Los expertos en la técnica apreciarán que no todos los compuestos son igualmente eficaces contra todos los estadios de crecimiento de todas las plagas.

Estos compuestos y composiciones presentes son, por lo tanto, útiles agronómicamente para proteger los cultivos de campo de las plagas de invertebrados fitófagos, y también de forma no agronómica para proteger otros cultivos hortícolas y plantas de las plagas de invertebrados fitófagos. Esta utilidad incluye proteger cultivos y otras plantas (es decir, tanto agronómicas como no agronómicas) que contienen material genético introducido mediante ingeniería genética (es decir, transgénico) o modificado por mutagénesis para proporcionar rasgos ventajosos. Los ejemplos de tales rasgos incluyen tolerancia a herbicidas, resistencia a plagas fitófagas (p. ej., insectos, ácaros, áfidos, arañas, nematodos, caracoles, hongos patógenos de plantas, bacterias y virus), crecimiento de plantas mejorado, mayor tolerancia a condiciones adversas de crecimiento tales como altas o bajas temperaturas, baja o alta humedad del suelo y alta salinidad, mayor floración o fructificación, mayores rendimientos de cosecha, maduración más rápida, mayor calidad y/o valor nutricional del producto cosechado, o mejores propiedades de almacenamiento o procesamiento de los productos cosechados. Las plantas transgénicas se pueden modificar para expresar rasgos múltiples. Entre los ejemplos de plantas que contienen rasgos proporcionados mediante ingeniería genética o mutagénesis se incluyen variedades de maíz, algodón, soja y patata que expresan una toxina insecticida de *Bacillus thuringiensis*, como YIELD GARD®, KNOCKOUT®, STARLINK®, BOLLGARD®, NuCOTN® y NEWLEAF®, y variedades tolerantes a herbicidas de maíz, algodón, soja y colza, tales como ROUNDUP READY®, LIBERTY LINK®, IMI®, STS® y CLEARFIELD®, así como cultivos que expresan *N*-acetiltransferasa (GAT) para proporcionar resistencia al herbicida glifosato, o cultivos que contienen el gen HRA que proporciona resistencia a herbicidas que inhiben la acetolactato sintasa (ALS). Los presentes compuestos y composiciones pueden interactuar sinérgicamente con los rasgos introducidos mediante ingeniería genética o modificados por mutagénesis, mejorando así la expresión fenotípica o la eficacia de los rasgos o aumentando la eficacia del control de plagas de invertebrados de los presentes compuestos y composiciones. En particular, los presentes compuestos y composiciones pueden interactuar sinérgicamente con la expresión fenotípica de proteínas u otros productos naturales tóxicos para las plagas de invertebrados para proporcionar un control mayor que el aditivo de estas plagas.

Las composiciones de esta invención también pueden comprender opcionalmente nutrientes vegetales, por ejemplo, una composición fertilizante que comprende al menos un nutriente vegetal seleccionado entre nitrógeno, fósforo, potasio, azufre, calcio, magnesio, hierro, cobre, boro, manganeso, zinc y molibdeno. Son de destacar las composiciones que comprenden al menos una composición de fertilizante que comprende al menos un nutriente vegetal seleccionado entre nitrógeno, fósforo, potasio, azufre, calcio y magnesio. Las composiciones de la presente invención que comprenden adicionalmente al menos un nutriente vegetal pueden estar en forma de líquidos o sólidos. Son de destacar las formulaciones sólidas en forma de gránulos, pequeñas barritas o comprimidos. Las formulaciones sólidas que comprenden una composición de fertilizante se pueden preparar mezclando el compuesto o composición de la presente invención con la composición de fertilizante junto con los ingredientes de formulación y después preparando la formulación por métodos tales como granulación o extrusión. Alternativamente, las formulaciones sólidas pueden prepararse pulverizando una solución o suspensión de un compuesto o composición de la presente invención en un disolvente volátil sobre una composición de fertilizante preparada previamente en forma de mezclas dimensionalmente estables, por ejemplo, gránulos, pequeñas barritas o comprimidos, y después, evaporando el disolvente.

Los ejemplos de plagas de invertebrados agronómicas o no agronómicas incluyen huevos, larvas y adultos del orden Lepidóptera, tales como orugas soldado, gusanos cortadores, gusanos enrolladores, y heliotos en la familia

- Noctuidae (p.ej., barrenador rosado (*Sesamia inferens* Walker), perforador del tallo del maíz (*Sesamia nonagrioides* Lefebvre), gusano negro (*Spodoptera eridania* Cramer), oruga soldado tardía (*Spodoptera fugiperda* J. E. Smith), oruga soldado de la remolacha (*Spodoptera exigua* Hübner), rosquilla negra (*Spodoptera littoralis* Boisduval), oruga de bandas amarillas (*Spodoptera ornithogalli* Guenée), gusano cortador grasiento (*Agrotis ipsilon* Hufnagel), oruga de las leguminosas (*Anticarsia gemmatalis* Hübner), oruga de la fruta verde (*Lithophane antennata* Walker), oruga de las coles (*Barathra brassicae* Linnaeus), enrollador de la soja (*Pseudoplusia includens* Walker), enrollador de las coles (*Trichoplusia ni* Hübner), oruga del tabaco (*Heliothis virescens* Fabricius); perforadores, polillas, gusanos telañareros, gusanos de la piña del pino, gusanos de las coles y orugas minadoras de la familia Pyralidae (p.ej., taladro del maíz (*Ostrinia nubilales* Hübner), gusano de la naranja Navel (*Amyelois transitella* Walker), gusano perforador de la raíz del maíz (*Crambus caliginosellus* Clemens), gusano de la tierra (Pyralidae: *Crambinae*) gusano tropical de la tierra (*Herpetogramma licarsisalis* Walker), gusano gris de las plantas de huerta (*Chilo infuscatellus* Snellen), barrenador del tomate menor (*Neoleucinodes elegantalis* Guenée), gusano enrollador de hojas verde (*Cnaphalocerus medinalis*), gusano enrollador de la vid (*Desmia funeralis* Hübner), gusano del pepino (*Diaphania nitidalis* Stoll), gusano del cogollo de la col (*Hellula hydralis* Guenée), barrenador de tallos amarillo (*Scirpophaga incertulas* Walker), barrenador temprano (*Scirpophaga infuscatellus* Snellen), barrenador de tallos blanco (*Scirpophaga innotata* Walker), barrenador del tallo superior (*Scirpophaga nivella* Fabricius), barrenador del arroz de cabeza oscura (*Chilo polychrysus* Meyrick), oruga del racimo de col (*Crocidolomia binotalis* English)); enrolladores de hojas, gusanos de las semillas, gusanos de semillas y gusanos de la familia Tortricidae (p. ej., polilla de la manzana (*Cydia pomonella* Linnaeus), polilla de la vid de la uva (*Endopiza viteana* Clemens), polilla de la fruta oriental (*Grapholita molesta* Busck), polilla falsa de la fruta cítrica (*Cryptophlebia leucotreta* Meyrick), perforador de cítricos (*Ecdytophaga aurantiana* Lima), enrollador de hojas rojas (*Argyrotaenia velutinana* Walker), enrollador de hojas oblicuas (*Choristoneura rosaceana* Harris), polilla de la manzana de color marrón claro (*Epiphyas postvittana* Walker), polilla de la uva europea (*Eupoecilia ambiguella* Hiibner), polilla de la yema de la manzana (*Pandemis pyrusana* Kearfott), enrollador omnívoro (*Platynota stultana* Walsingham), tórtrix barrado de árboles frutales (*Pandemis cerasana* Hiibner), tórtrix marrón de la manzana (*Pandemis heparana* Denis & Schiffermuller); y muchos otros lepidópteros de importancia económica (p. ej., polilla de dorso de diamante (*Plutella xylostella* Linnaeus), gusano de la cápsula rosa (*Pectinophora gossypiella* Saunders), polilla gitana (*Lymantria dispar* Linnaeus), perforadora del melocotonero (*Carposina niponensis* Walsingham), perforador de la ramita del melocotonero (*Anarsia lineatella* Zeller), polilla de la patata (*Phthorimaea operculella* Zeller), minadora jaspeada de las hojas del manzano y el peral (*Lithocolletis blancardella* Fabricius), minador de la manzana asiático (*Lithocolletis anillooniella* Matsumura), saltahojas de arroz (*Lerodea eufala* Edwards), minador de la manzana (*Leucoptera scitella* Zeller); huevos, ninfas y adultos del orden Blattodea, incluyendo cucarachas de las familias Blattellidae y Blattidae (p. ej., cucaracha oriental (*Blatta orientalis* Linnaeus), cucaracha asiática (*Blattella asahinai* Mizukubo), cucaracha alemana (*Blattella germanica* Linnaeus), cucaracha parda (*Supella longipalpa* Fabricius), cucaracha americana (*Periplaneta americana* Linnaeus), cucaracha marrón (*Periplaneta brunnea* Burmeister), cucaracha de Madeira (*Leucophaea maderae* Fabricius), cucaracha ahumada (*Periplaneta fuliginosa* Service), cucaracha australiana (*Periplaneta australasiae* Fabr.), cucaracha de langosta (*Nauphoeta cinerea* Olivier) y cucaracha lisa (*Symploce pallens* Stephens)); huevos, alimentación foliar, alimentación de frutas, alimentación de raíces, alimentación de semillas y tejido vesicular alimentando larvas y adultos del orden Coleópteros incluyendo gorgojos de las familias Anthribidae, Bruchidae y Curculionidae (p. ej., gorgojo de la cápsula (*Anthonomus grandis* Boheman), gorgojo acuático del arroz (*Lissorhoptrus oryzophilus* Kuschel), gorgojo de granero (*Sitophilus granarius* Linnaeus), gorgojo de arroz (*Sitophilus oryzae* Linnaeus), gorgojo del césped (*Listronotus maculicollis* Dietz), picudo de la poa (*Sphenophorus parvulus* Gyllenhal), picudo del césped (*Sphenophorus venatus vestitus*), picudo de Denver (*Sphenophorus cicatristriatus* Fahraeus)); escarabajos pulga, escarabajos del pepino, gusanos de la raíz, escarabajos de la hoja, escarabajos de la patata y minadores de la familia Chrysomelidae (p. ej., escarabajo de la patata (*Leptinotarsa decemlineata* Say), gusano de la raíz del maíz occidental (*Diabrotica virgifera virgifera* LeConte)); escarabajos abejorro y otros escarabajos de la familia Scarabaeidae (p. ej., escarabajo japonés (*Popillia japonica* Newman), escarabajo oriental (*Anomala orientalis* Waterhouse, *Exomala orientalis* (Waterhouse) Baraud), escarabajo enmascarado del norte (*Cyclocephala borealis* Arrow), escarabajo enmascarado del sur (*Cyclocephala immaculata* Olivier o *C. lurida* Bland), escarabajo pelotero larvas blancas (*Aphodius* sp.), escarabajo del estiércol (*Ataenius spretulus* Haldeman), escarabajo verde de junio (*Cotinis nitida* Linnaeus), escarabajo del jardín asiático (*Maladera castanea* Arrow), escarabajos de mayo/junio (*Phyllophaga* sp.) y escarabajo europeo (*Rhizotrogus majalis* Razoumowsky); escarabajos de alfombras de la familia Dermestidae; gusanos de alambre de la familia Elateridae; los escarabajos de la corteza de la familia Scolytidae y los escarabajos de la harina de la familia Tenebrionidae).
- Además, las plagas agronómicas y no agronómicas incluyen: huevos, adultos y larvas del orden Dermaptera incluyendo tijeretas de la familia Forficulidae (p. ej., tijereta europea (*Forficula auricularia* Linnaeus), tijereta negra (*Chelisoche morio* Fabricius)); huevos, inmaduros, adultos y ninfas de los órdenes Hemiptera y Homoptera tales como, chinches de la familia Miridae, cigarras de la familia Cicadidae, chicharritas (p. ej., *Empoasca* sp.) de la familia Cicadellidae, chinches (p. ej., *Cimex lectularius* Linnaeus) de la familia Cimicidae, saltahojas de las familias Fulgoroidae y Delphacidae, toritos de la familia Membracidae, psílidos de la familia Psyllidae, moscas blancas de la familia Aleyrodidae, áfidos de la familia Afididae, filoxera de la familia Phylloxeridae, cochinillas de la familia Pseudococcidae, insectos escama de las familias Coccidae, Diaspididae y Margarodidae, chinches de encaje de la familia Tingidae, chinches apestosos de la familia Pentatomidae, chinches de los céspedes (p.ej., el chinche de los pastos (*Blissus leucopterus hirtus* Montandon) y chinche del sur (*Blissus insularis* Barber)) y otros chinches de la

semilla de la familia Lygaeidae, chinches salivosas de la familia Cercopidae chinches de la calabaza de la familia Coreidae, y chinches del arce y teñidores de algodón de la familia Pyrrhocoridae.

Las plagas agronómicas y no agronómicas también incluyen: huevos, larvas, ninfas y adultos del orden Acari (ácaros) como ácaros y ácaros rojos en la familia Tetranychidae (p. ej., Ácaro rojo europeo (*Panonychus ulmi* Koch), ácaro araña de dos manchas (*Tetranychus urticae* Koch), ácaro McDaniel (*Tetranychus mcdanieli* McGregor)); ácaros planos en la familia Tenuipalpidae (p. ej., ácaro plano de los cítricos (*Brevipalpus lewisi* McGregor)); ácaros del moho y la yema en la familia Eriophyidae y otros ácaros de alimentación foliar y ácaros importantes en la salud humana y animal, es decir, ácaros del polvo de la familia Epidermoptidae, ácaros foliculares en la familia Demodicidae, ácaros del grano en la familia Glycyphagidae; garrapatas en la familia Ixodidae, comúnmente conocidas como garrapatas duras (p. ej., garrapata de ciervo (*Ixodes scapularis* Say), garrapata de la parálisis australiana (*Ixodes holocyclus* Neumann), garrapata de perro americana (*Dermacentor variabilis* Say), garrapata estrella solitaria (*Amblyomma americanum* Linnaeus) y garrapatas en la familia Argasidae, comúnmente conocidas como garrapatas blandas (p. ej., garrapata de fiebre recurrente (*Ornithodoros turicata*), garrapata común de las aves (*Argas radiatus*)); ácaros de las costras y de la sarna y ácaros en las familias Psoroptidae, Pyemotidae y Sarcoptidae; huevos, adultos e inmaduros del orden Orthoptera incluyendo saltamontes, langostas y grillos (p. ej., saltamontes migratorios (p. ej., *Melanoplus sanguinipes* Fabricius, *M. differ entialis* Thomas), saltamontes americanos (p. ej., *Schistocerca americana* Drury), langosta del desierto (*Schistocerca gregaria* Forskal), langosta migratoria (*Locusta migratoria* Linnaeus), langosta arbustiva (*Zonocerus* sp.), grillo doméstico (*Acheta domestica* Linnaeus), los grillos topo (p. ej. el grillo topo morado (*Scapteriscus vicinus* Scudder) y el grillo topo sureño (*Scapteriscus borellii* Giglio-Tos)); huevos, adultos e inmaduros del orden Diptera incluyendo minadores de hojas (p. ej., *Liriomyza* sp. como minador de hoja vegetal (*Liriomyza sativae* Blanchard)), mosquitos, moscas de la fruta (Tephritidae), moscas frit (p. ej., *Oscinella frit* Linnaeus), gusanos del suelo, moscas domésticas (p. ej., *Musca domestica* Linnaeus), moscas domésticas menores (p. ej., *Fannia canicularis* Linnaeus, *F. femoralis* Stein), moscas de los establos (p. ej., *Stomoxys calcitrans* Linnaeus), moscas de la cara, moscas de los cuernos, moscardones etc. (p. ej., *Chrysomya* sp., *Phormia* sp.), y otras plagas de la moscas muscoides, moscas del caballo (p. ej., *Tabanus* sp.), moscas de la muerte (p. ej., *Gastrophilus* sp., *Oestrus* sp.), reznos (p. ej., *Hypoderma* sp.), moscas del venado (p. ej., *Chrysops* sp.), garrapatas de ovinos (p. ej., *Melophagus ovinus* Linnaeus) y otros Brachycera, mosquitos (p. ej., *Aedes* sp., *Anopheles* sp., *Culex* sp.), Moscas negras (p. ej., *Prosimulium* sp., *Simulium* sp.), Beatillas, moscas de arena, mosquillas negras y otros Nematocera ; huevos, adultos e inmaduros del orden Thysanoptera incluyendo trips de la cebolla (*Thrips tabaci* Lindeman), trips de las flores (*Frankliniella* sp.) y otros trips de alimentación foliar; plagas de insectos del orden Hymenoptera incluidas las hormigas de la familia Formicidae, incluida la hormiga carpintera de Florida (*Camponotus floridanus* Buckley), la hormiga carpintera roja (*Camponotus ferrugineus* Fabricius), la hormiga carpintera negra (*Camponotus pennsylvanicus* De Geer), la hormiga de patas blancas (*Technomyrmex albipes* fr Smith), hormigas de cabeza grande (*Pheidole* sp.), Hormiga fantasma (*Tapinoma melanocephalum* Fabricius); Hormiga Faraón (*Monomorium pharaonis* Linnaeus), pequeña hormiga de fuego (*Wasmannia auropunctata* Roger), hormiga de fuego (*Solenopsis geminata* Fabricius), hormiga de fuego roja importada (*Solenopsis invicta* Buren), hormiga argentina (*Iridomyrmex humilis* Mayr), hormiga loca (*Paratrechina longicornis* Latreille), hormiga delpavimento (*Tetramorium caespitum* Linnaeus) , hormiga del campo de maíz (*Lasius alienus* Forster) y hormiga doméstica olorosa (*Tapinoma sessile* Say). Otros himenópteros, incluyendo abejas (incluyendo las abejas carpinteras), avispones, avispas de chaqueta amarilla, avispas y moscas de sierra (*Neodiprion* sp., *Cephus* sp.); plagas de insectos del orden Isoptera incluyendo termitas en las familias Termitidae (p. ej., *Macrotermes* sp., *Odontotermes obesus* Rambur), Kalotermitidae (p. ej., *Cryptotermes* sp.) y Rhinotermitidae (p. ej., *Reticulitermes* sp., *Coptotermes* sp., *Heterotermes tenues* Hagen) , la termita subterránea oriental (*Reticulitermes flavipes* Kollar), termitas subterráneas occidentales (*Reticulitermes hesperus* Banks), termita subterránea de Formosa (*Coptotermes formosanus* Shiraki), termitas de madera seca de la India occidental (*Incisitermes immigrans* Snyder), termitas de la madera seca (*Cryptotermes brevis* Walker), termitas de la madera seca del sudoeste (*Incisitermes snyderi* Light), termitas subterráneas del sudeste (*Reticulitermes virginicus* Banks), termitas de madera seca occidental (*Incisitermes minor* Hagen), termitas arbóreas tales como *Nasutitermes* sp. y otras termitas de importancia económica; plagas de insectos del orden Thysanura tales como pececillo de plata (*Lepisma saccharina* Linnaeus) e insectos de fuego (*Thermobia domestica* Packard); plagas de insectos del orden Mallophaga incluyendo el piojo de la cabeza (*Pediculus humanus capitis* De Geer), piojo del cuerpo (*Pediculus humanus* Linnaeus), piojo del cuerpo del pollo (*Menacanthus stramineus* Nitzsch), piojo canino (*Trichodectes canis* De Geer), piojo peludo (*Goniocotes gallinae* De Geer), piojo del cuerpo de la oveja (*Bovicola ovis* Schrank), piojo de ganado de hocico corto (*Haematopinus eurysternus* Nitzsch), piojo de ganado de hocico largo (*Linognathus vituli* Linnaeus) y otros piojos parasitarios chupadores y masticadores que atacan al hombre y a los animales; plagas de insectos del orden Siphonoptera incluyendo la pulga de la rata oriental (*Xenopsylla cheopis* Rothschild), pulga de gato (*Ctenocephalides felis* Bouche), pulga de perro (*Ctenocephalides canis* Curtis), pulga de gallina (*Ceratophyllus gallinae* Schrank), pulga común (*Echidnophaga gallinacea* Westwood), humana pulga (*Pulex irritans* Linnaeus) y otras pulgas que afectan a mamíferos y aves. Otras plagas de artrópodos abarcadas incluyen: arañas en el orden Araneae tales como la araña reclusa parda (*Loxosceles reclusa* Gertsch & Mulaik) y la araña viuda negra (*Latrodectus mactans* Fabricius), y cienpiés del orden Scutigeraomorpha tal como el cienpiés doméstico (*Scutigera coleoptrata* Linnaeus).

Entre los ejemplos de plagas de invertebrados del grano almacenado se incluyen el barrenador del grano mayor (*Prostephanus truncatus*), el barrenador del grano menor (*Rhyzopertha dominica*), el gorgojo del arroz (*Stiophilus oryzae*), el gorgojo del maíz (*Stiophilus zeamais*), el gorgojo del Caribe (*Callosobruchus maculatus*), el escarabajo

rojo de la harina (*Tribolium castaneum*), gorgojo del granero (*Stiophilus granarius*), polilla india de la harina (*Plodia interpunctella*), escarabajo mediterráneo de la harina (*Ephestia kuhniella*) carcoma aplanada de los granos (*Cryptolestis ferrugineus*).

5 Los compuestos de la invención muestran una actividad particularmente alta contra plagas del orden Lepidoptera (p. ej., *Alabama argillacea* Hiibner (gusano de hoja de algodón), *Archips argyrospila* Walker (enrollador de la hoja de los frutales), *A. rosana* Linnaeus (enrollador de las hojas europeo) y otras especies Archips, *Chilo suppressalis* Walker (perforador del tallo del arroz), *Cnaphalocrosis medinalis* Guenee (enrollador de la hoja de arroz), *Crambus caliginosellus* Clemens (gusano de la raíz del maíz), *Crambus teterrellus* Zincken (gusano del pasto azul), *Cydia pomonella* Linnaeus (polilla de la manzana), *Earias insulana* Boisduval (gusano de la cápsula), *Earias vittella* Fabricius (gusano de la cápsula), *Helicoverpa armigera* Hiibner (gusano de la cápsula americana), *Helicoverpa zea* Boddie (gusano de la raíz del maíz), *Heliothis virescens* Fabricius (oruga del tabaco), *Herpetogramma licarsisalis* Walker (gusano de la tela), *Lobesia botrana* Denis & Schiffermuller (polilla de la uva), *Pectinophora gossypiella* Saunders (gusano de la cápsula rosa), *Phyllocnistis citrella* Stainton (minador de la fruta cítrica), *Pieris brassicae* Linnaeus (mariposa blanca grande), *Pieris rapae* Linnaeus (mariposa blanca pequeña), *Plutella xylostella* Linnaeus (polilla dorso de diamante), *Spodoptera exigua* Hiibner (gusano de la remolacha), *Spodoptera litura* Fabricius (gusano cortador del tabaco, oruga del racimo), *Spodoptera frugiperda* JE Smith (gusano cogollero), *Trichoplusia ni* Hiibner (gusano medidor falso) y *Tuta absoluta* Meyrick (minador de la hoja del tomate).

10 Los compuestos de la invención tienen también actividad sobre miembros del orden Homoptera incluyendo: *Acyrtosiphon pisum* Harris (pulgón del guisante), *Aphis craccivora* Koch (pulgón de las leguminosas), *Aphis fabae* Scopoli (pulgón negro de las habas), *Aphis gossypii* Glover (pulgón del algodón o del melón), *Aphis pomi* De Geer (pulgón de la manzana), *Aphis spiraecola* Patch (pulgón verde de los cítricos), *Aulacorthum solani* Kaltenbach (pulgón de la patata), *Chaetosiphon fragaefolii* Cockerell (pulgón de la fresa), *Diuraphis noxia* Kurdjumov/Mordvilko (pulgón ruso del trigo), *Dysaphis plantaginea* Paaserini (pulgón ceniciento del manzano), *Eriosoma lanigerum* Hausmann (pulgón lanífero del manzano), *Hyalopterus pruni* Geoffroy (pulgón harinoso del ciruelo), *Lipaphis erysimi* Kaltenbach (pulgón del nabo), *Metopolophium dirrhodum* Walker (pulgón de los cereales), *Macrosiphum euphorbia* Thomas (pulgón de la patata), *Myzus persicae* Sulzer (pulgón del melocotón y la patata, pulgón verde del melocotón), *Nasonovia ribisnigri* Mosley (pulgón de la lechuga), *Pemphigus* sp. (áfidos de la raíz y áfidos de la agalla), *Rhopalosiphum maidis* Fitch (áfido de la hoja del maíz), *Rhopalosiphum padi* Linnaeus (pulgón de la avena), *Schizaphis graminum* Rondani (chinche verde), *Sitobion avenae* Fabricius (áfido del grano inglés), *Therioaphis maculata* Buckton (áfido moteado de la alfalfa), *Toxoptera aurantii* Boyer de Fonscolombe (áfido negro de los cítricos) y *Toxoptera citricida* Kirkaldy (áfido marrón de los cítricos); *Adelges* sp. (adélgidos); *Phylloxera devastatrix* Pergande (filoxera de la nuez de pecán); *Bemisia tabaci* Gennadius (mosca blanca del tabaco, mosca blanca de la batata), *Bemisia argentifolii* Bellows & Perring (mosca blanca de hoja plateada), *Diameuodes citri* Ashmead (mosca blanca de los cítricos) y *Trialeurodes vaporariorum* Westwood (mosca blanca de los invernaderos); *Empoasca fabae* Harris (saltamontes de la patata), *Laodelphax striatellus* Fallen (saltahojas marrón menor), *Macrolestes quadrilineatus* Forbes (saltahojas de las Aster), *Nephotettix cincticeps* Uhler (saltahojas verde), *Nephotettix nigropictus* Stal (saltahojas de arroz), *Nilaparvata lugens* Stal (saltahojas marrón), *Peregrinus maidis* Ashmead (saltahojas de maíz), *Sogatella furcifera* Horvath (saltahojas de dorso blanco), *Sogatodes orizicola* Muir (insecto Sogata), *Typhlocyba pomaria* McAtee (saltahojas de manzana blanca), *Erythroneoura* sp. (saltahojas de uva); *Magacidada septendecim* Linnaeus (cigarra periódica); *Icerya purchasi* Maskell (escala algodonosa), *Quadraspidiotus perniciosus* Comstock (escala San Jose); *Planococcus citri* Risso (piojo harinoso de los cítricos); *Pseudococcus* sp. (otro complejo de cochinilla harinosa); *Cacopsylla pyricola* Foerster (psilla de la pera), *Trioza diospyri* Ashmead (psylla del melocotón).

15 Los compuestos de esta invención también pueden tener actividad en miembros del orden Hemiptera, incluyendo: *Acrosternum hilare* Say (chinche verde), *Anasa tristis* De Geer (chinche de la calabaza), *Blissus leucopterus leucopterus* Say (Chinche veloso), *Cimex lectularius* Linnaeus (chinche de las camas) *Corythuca gossypii* Fabricius (chinche de encaje del algodón), *Cyrtopeltis modesta* Distant (chinche del tomate), *Dysdercus suturellus* Herrich-Schaffer (chinche del algodón), *Euchistus servus* Say (chinche apestoso marrón), *Euchistus variolarius* Palisot de Beauvois (chinche apestoso de una mancha), *Graptosthetus* sp. (complejo de chinches de semillas), *Leptoglossus corculus* Say (chinche de la semilla de pino), *Lygus lineolaris* Palisot de Beauvois (chinche opaco de las plantas), *Nezara viridula* Linnaeus (chinche verde del sur), *Oebalus pugnax* Fabricius (chinche apestoso del arroz), *Oncopeltus fasciatus* Dallas (chinches grande del algodoncillo), *Pseudatomoscelis seriatus* Reuter (pulga saltona del algodón). Otros órdenes de insectos controlados por los compuestos de la invención incluyen Thysanoptera (p. ej., *Frankliniella occidentalis* Pergande (trips de flores occidentales), *Scirtothrips citri* Moulton (trips de cítricos), *Sericothrips variabilis* Beach (trips de soja) y *Thrips tabaci* Lindeman (trips de la cebolla); orden Coleoptera (p. ej., *Leptinotarsa decemlineata* Say (escarabajo de la patata de Colorado), *Epilachna varivestis* Mulsant (escarabajo de la judía mexicana) y gusanos de alambre de los géneros Agriotes, Athous o Limonius).

Obsérvese que algunos sistemas de clasificación contemporáneos colocan a Homóptera como un suborden dentro del orden Hemiptera.

60 Es de destacar el uso de los compuestos de esta invención para controlar la polilla de dorso de diamante (*Plutella xylostella*). Es de destacar el uso de compuestos de esta invención para controlar el gusano cogollero (*Spodoptera frugiperda*).

Los compuestos de esta invención también se pueden mezclar con uno o más compuestos o agentes biológicamente activos que incluyen insecticidas, fungicidas, nematocidas, bactericidas, acaricidas, herbicidas, protectores de herbicidas, reguladores de crecimiento tales como inhibidores de muda de insectos y estimulantes de enraizamiento, quimioesterilizantes, semioquímicos, repelentes, atrayentes, feromonas, estimulantes de alimentación, otros compuestos biológicamente activos o bacterias entomopatógenas, virus u hongos para formar un plaguicida multicomponente que proporciona un espectro incluso más amplio de utilidad agronómica y no agronómica. Por tanto, la presente invención también se refiere a una composición que comprende una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula 1, un *N-óxido*, o una sal del mismo, al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos, y al menos un compuesto o agente biológicamente activos adicionales. Para las mezclas de la presente invención, los otros compuestos o agentes biológicamente activos se pueden formular junto con los presentes compuestos, que incluyen los compuestos de Fórmula 1, para formar una premezcla, o los otros compuestos o agentes biológicamente activos se pueden formular por separado de los presentes compuestos, que incluyen los compuestos de Fórmula 1, y las dos formulaciones combinadas juntas antes de la aplicación (por ejemplo, en un tanque de pulverización) o, alternativamente, se aplican sucesivamente.

Los ejemplos de tales compuestos o agentes biológicamente activos con los que pueden formularse compuestos de esta invención son insecticidas tales como abamectina, acefato, acequinocilo, acetamiprid, acrinatrina, amidoflumet, amitraz, avermectina, azadiractina, azinfos-metilo, benfuracarb, bensultap, bifentrina, bifenazato, bistriflurón, borato, buprofezin, cadusafos, carbarilo, carbofuran, cartap, carzol, clorantraniliprol, clorfenapir, clorfluazurón, clorpirifos, clorpirifos-metilo, cromafenozida, clofentezina, clotianidina, ciantraniliprol, cicloprotrina, ciflometofen, ciflutrin, beta-ciflutrin, cihalotrina, gamma-cihalotrina, lambda-cihalotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, zeta-cipermetrina, ciromazina, deltametrina, diafentiuon, diazinon, dieldrina, diflubenzuron, dimeflutrin, dimehipo, dimetoato, dinotefuran, diofenolan, emamectina, endosulfan, esfenvalerato, etiprol, etofenprox, etoxazol, fenbutatin oxido, fenitrothion, fenotiocarb, fenoxicarb, fenpropatrina, fenvalerato, fipronil, flonicamid, flubendiamida, flucitrinato, flufenerim, flufenoxuron, fluvalinato, tau-fluvalinato, fonopfos, formetanato, fostiazato, halofenocida, hexaflumuron, hexitiazox, hidrametilnon, imidacloprid, indoxacarb, jabones insecticidas, isofenfos, lufenuron, malation, meperflutrina, metaflumizona, metaldehido, metamidofos, metidation, metiodicarb, metomilo, metopreno, metoxiclor, metoflutrina, monocrotofos, metoxifenocida, nitenpiram, nitiacina, novaluron, noviflumuron, oxamilo, paratión, paratión-metilo, permetrina, forato, fosalona, fosmet, fosfamidón, pirimicarb, profenofos, proflutrina, propargita, protrifenbute, pimetrozina, pirafluprol, piretrina, piridaben, piridalilo, pirifluquinazon, piriprol, piriproxifen, rotenone, rianodine, silafluofen, spinetoram, spinosad, spirodiclofen, spiromesifen, spirotetramat, sulprofos, sulfoxaflor, tebufenocida, tebufenpirad, teflubenzuron, teflutrina, terbufos, tetraclorvinfos, tetrametrina, tetrametilflutrina, tiacloprid, tiametoxam, tiodicarb, thiosultap-sodio, tolfenpirad, tralometrina, triazamato, triclorfón, triflumurón, delta-endotoxinas de *Bacillus thuringiensis*, bacterias entomopatógenas, virus entomopatógenos y hongos entomopatógenos.

Destacan los insecticidas como abamectina, acetamiprid, acrinatrin, amitraz, avermectina, azadiractina, bensultap, bifentrina, buprofezin, cadusafos, carbaril, cartap, clorantraniliprol, clorfenapir, clorpirifos, clotianidina, ciantraniliprol, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, gamma-cihalotrina, lambda-cihalotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, zeta-cipermetrina, ciromazina, deltametrina, dieldrina, dinotefurano, diofenolan, emamectina, endosulfán, esfenvalerato, etiprol, etofenprox, etoxazol, fenotiocarb, fenoxicarb, fenvalerato, fipronil, flonicamid, flubendiamida, flufenoxuron, fluvalinato, formetanato, fostiazato, hexaflumuron, hidrametilnon, imidacloprid, indoxacarb, lufenuron, metaflumizona, metiodicarb, metomilo, metopreno, metoxifenocida, nitenpyram, nitiacina, novaluron, oxamilo, pimetrocina, piretrina, piridaben, piridalilo, piriproxifen, rianodina, spinetoram, spinosad, spirodiclofen, spiromesifen, spirotetramat, sulfoxaflor, tebufenocida, tetrametrina, tiacloprid, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap-sodio, tralometrina, triazamato, triflumuron, delta-endotoxinas de *Bacillus thuringiensis*, todas las cepas de *Bacillus thuringiensis* y todas las cepas de los virus de la *polihidrosis del núcleo*.

Una realización de agentes biológicos para mezclar con compuestos de esta invención incluye bacterias entomopatógenas tales como *Bacillus thuringiensis*, y las delta-endotoxinas encapsuladas de *Bacillus thuringiensis* tales como los bioinsecticidas MVP® y MVPII® preparados mediante el procedimiento CellCap® (CellCap®, MVP® y MVPII® son marcas comerciales de Mycogen Corporation, Indianapolis, Indiana, USA); hongos entomopatógenos tales como hongos verdes muscardina; y virus entomopatógenos (tanto naturales como genéticamente modificados) ique incluyen baculovirus, nucleopolihedrovirus (NPV) tales como el nucleopolihedrovirus de *Helicoverpa zea* (HzNPV), nucleopolyhedrovirus de *Anagrapha falcifera* (AfNPV); y virus de granulosis (GV) tales como el virus de la granulosis de *Cydia pomonella* (CpGV).

Tiene particular interés que esta combinación en la que el otro ingrediente activo de control de plagas de invertebrados pertenece a una clase química diferente o tiene un sitio de acción diferente que el compuesto de Fórmula 1. En ciertos casos, una combinación con al menos otro ingrediente activo de control de plagas de invertebrados que tiene un espectro de control similar, pero un sitio de acción diferente será particularmente ventajoso para la gestión de la resistencia. Por tanto, una composición de la presente invención puede comprender adicionalmente una cantidad biológicamente eficaz de al menos un ingrediente activo de control de plagas de invertebrados adicional que tiene un espectro de control similar pero que pertenece a una clase química diferente o que tiene un sitio de acción diferente. Estos compuestos o agentes biológicamente activos adicionales incluyen, pero no se limitan a, moduladores del canal de sodio tales como bifentrina, cipermetrina, cihalotrina, lambda-cihalotrina,

ciflutrina, beta-ciflutrina, deltametrina, dimeflutrina, esfenvalerato, fenvalerato, indoxacarb, metoflutrina, proflutrina, piretrina y tralometrina; inhibidores de colinesterasa tales como clorpirifos, metomilo, oxamilo, tiodicarb y triazamato; neonicotinoides tales como acetamiprid, clotianidina, dinotefuran, imidacloprid, nitenpiram, nitiazina, tiacloprid y tiametoxam; lactonas macrocíclicas insecticidas tales como spinetoram, spinosad, abamectina, avermectina y emamectina; antagonistas del canal de cloruro regulados por GABA (ácido γ -aminobutírico) tales como avermectina o bloqueadores tales como etiprol y fipronilo; inhibidores de la síntesis de quitina tales como buprofezin, ciromacina, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron y triflumuron; imitadores de hormonas juveniles tales como diufenolan, fenoxicarb, metopreno y piriproxifen; ligandos del receptor de octopamina tales como amitraz; inhibidores de muda y agonistas de ecdisona tales como azadiractina, metoxifenzida y tebufenzida; ligandos del receptor de rianodina tales como la rianodina, diamidas antranílicas tales como clorantraniliprol, ciantraniliprol y flubendiamida; análogos de nereistoxina tales como cartap; inhibidores del transporte de electrones mitocondriales tales como clorfenapir, hidrametilnon y piridaben; inhibidores de la biosíntesis de lípidos tales como spirodiclofen y spiromesifen; insecticidas de ciclodieno tales como dieldrina o endosulfan; piretroides; carbamatos; ureas insecticidas; y agentes biológicos que incluyen nucleopolihedrovirus (NPV), miembros de *Bacillus thuringiensis*, delta-endotoxinas encapsuladas de *Bacillus thuringiensis*, y otros virus insecticidas modificados genéticamente o de origen natural.

Los ejemplos adicionales de compuestos o agentes biológicamente activos con los cuales los compuestos de esta invención se pueden formular son: fungicidas tales como 1-[4-[4-[5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona, acibenzolar, aldiform, amisulbrom, azaconazol, azoxistrobin, benalaxil, benomilo, bentiavalicarb, bentiavalicarb-isopropilo, binomial, bifenil, bitertanol, blasticidin-S, mezcla Bordeaux (sulfato de cobre tribásico), boscalid/nicobifen, bromuconazol, bupirimate, butiobato, carboxin, carpropamid, captafol, captan, carbendazim, cloroneb, clorotalonil, clozolinato, clotrimazol, oxiclóruo de cobre, sales de cobre tales como sulfato de cobre e hidróxido de cobre, ciazofamid, ciflunamid, cimoxanil, ciproconazol, ciprodinil, diclofluanid, diclocimet, diclomezina, dicloran, dietofencarb, difenoconazol, dimetomorf, dimoxistrobin, diniconazol, diniconazol-M, dinocap, discostrobil, ditianon, dodemorf, dodina, econazol, etaconazol, edifenfos, epoxiconazol, etaboxam, etirimol, etridiazol, famoxadona, fenamidona, fenarimol, fenbuconazol, fencaramid, fenfuram, fenhexamida, fenoxanil, fencpiclonil, fenpropidin, fenpropimorf, acetato de fentina, hidróxido de fentina, ferbam, ferfurazoato, ferimzona, fluazinam, fludioxonil, flumetover, fluopicolida, fluoxastrobin, fluquinconazol, fluquinconazol, flusilazol, flusulfamida, flutolanil, flutriafol, fluxapiroxad, folpet, fosetil-aluminio, ftalida, fuberidazol, furalaxil, furametpir, hexaconazol, himexazol, guazatina, imazalil, imibenconazol, iminoctadina, iodicarb, ipconazol, iprobenfos, iprodiona, iprovalicarb, isoconazol, isoprotiolano, isotianil, kasugamicina, kresoxim-metilo, mancozeb, mandipropamid, maneb, mapanipirin, mefenoxam, mepronilo, metalaxil, metconazol, metasulfocarb, metiram, metominostrobin/fenominostrobin, mepanipirim, metrafenona, miconazol, miclobutanil, neo-asozin (metanearsonato férrico), nuarimol, otilinona, ofurace, orisastrobin, oxadixilo, ácido oxolinico, oxpoconazol, oxicarboxin, paclobutrazol, penconazol, pencicuron, penflufen, pentiopirad, perfurazoato, ácido fosfonico, ftalida, picobenzamid, picoxistrobin, polioxin, probenazol, procloraz, procimidona, propamocarb, propamocarb-hidrocóruo, propiconazol, propineb, proquinazid, protioconazol, piraclostrobil, pirametrostrobil, piraoxistrobin, priazofos, pirifenox, pirimetanil, pirifenox, piriofenona, pirocloraz, piroquilon, quinconazol, quinoxifen, quintozeno, siltiofam, simeconazol, espiroxamina, estreptomocina, azufre, tebuconazol, tebufloquin, tecrazeno, tecloftalam, tecnazeno, tetraconazol, tiabendazol, tifuluzamida, tiofanato, metil-tiofanato, tiram, tiadinil, tolclófos-metilo, tolifluanid, triadimefon, triadimenol, triarimol, triazoxida, tridemorf, trimorfamida, triciclazol, trifloxistrobin, triflumizol, triflorina, triticonazol, uniconazol, validamicina, valifenalato, vinclozolin, zineb, ziram, y zoxamida; nematocidas tales como aldicarb, imiciaf, oxamilo y fenamifos; bactericidas tales como estreptomocina; acaricidas tales como amitraz, quinometionato, clorobenzilato, cihexatina, dicofol, dienoclor, etoxazol, fenazaquin, óxido de fenbutatin, fenpropatrina, fenpiroximate, hexitiazox, propargita, piridaben y tebufenpirad.

Son de destacar los fungicidas y las composiciones que comprenden fungicidas tales como 1-[4-[4-[5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona, azoxistrobin, hidróxido de cobre, cimoxanilo, ciproconazol, difenoconazol, famoxadona, fenoxanil, ferimzona, flusilazol, flutolanil, ftalida, furametpir, hexaconazol, isoprotiolano, isotianil, kasugamicina, mancozeb, metominostrobin, orisastrobin, pencicuron, pentiopirad, picoxistrobin, probenazol, propiconazol, proquinazid, piroquilon, simeconazol, tiadinil, triciclazol, trifloxistrobin y validamicina.

En ciertos casos, las combinaciones de un compuesto de esta invención con otros compuestos o agentes biológicamente activos (particularmente control de plagas de invertebrados) (es decir, ingredientes activos) pueden dar como resultado un efecto mayor que el aditivo (es decir, sinérgico). Siempre es deseable reducir la cantidad de ingredientes activos liberados en el entorno mientras se asegura un control eficaz de plagas. Cuando la sinergia de los ingredientes activos para el control de plagas de invertebrados ocurre a tasas de aplicación que proporcionan niveles agrónomicamente satisfactorios de control de plagas de invertebrados, tales combinaciones pueden ser ventajosas para reducir el coste de producción del cultivo y disminuir la carga ambiental.

Los compuestos de esta invención y sus composiciones se pueden aplicar a plantas genéticamente transformadas para expresar proteínas tóxicas para plagas de invertebrados (tales como delta-endotoxinas de *Bacillus thuringiensis*). Tal aplicación puede proporcionar un espectro más amplio de protección de plantas y ser ventajosa para la gestión de la resistencia. El efecto de los compuestos de control de plagas de invertebrados aplicados exógenamente de esta invención puede ser sinérgico con las proteínas de toxina expresadas.

Las referencias generales para estos protectores agrícolas (es decir, insecticidas, fungicidas, nematocidas, acaricidas, herbicidas y agentes biológicos) incluyen The Pesticide Manual, 13ª edición, C.D.S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, Reino Unido, 2003 y The BioPesticide. Manual, 2ª edición, L. G. Copping, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, Reino Unido, 2001.

5 Para las realizaciones en las que se utilizan uno o más de estos diversos compañeros de mezcla, la razón en peso de estos diversos compañeros de mezcla (en total) con respecto al compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido, o una sal del mismo, está típicamente entre aproximadamente 1:3000 y aproximadamente 3000:1. Cabe destacar las razones en peso entre aproximadamente 1:300 y aproximadamente 300:1 (por ejemplo, razones entre aproximadamente 1:30 y aproximadamente 30:1). Un experto en la técnica puede determinar fácilmente mediante experimentación simple las cantidades biológicamente eficaces de ingredientes activos necesarios para el espectro deseado de actividad biológica. Será evidente que la inclusión de estos componentes adicionales puede expandir el espectro de plagas de invertebrados controladas más allá del espectro controlado por el compuesto de Fórmula 1 solo.

15 La Tabla A enumera combinaciones específicas de un compuesto de Fórmula 1 con otros agentes de control de plagas de invertebrados ilustrativos de las mezclas, composiciones y métodos de la presente invención. La primera columna de la Tabla A enumera los agentes específicos de control de plagas de invertebrados (p. ej., "Abamectina" en la primera línea). La segunda columna de la Tabla A enumera el modo de acción (si se conoce) o la clase química de los agentes de control de plagas de invertebrados. La tercera columna de la Tabla A enumera las realizaciones de los intervalos de las razones en peso para las tasas a las cuales se puede aplicar un compuesto de Fórmula 1 con respecto a un agente de control de plagas de invertebrados (p. ej., "50:1 a 1:50" de un compuesto de Fórmula 1 con respecto a abamectina en peso). Por lo tanto, por ejemplo, la primera línea de la Tabla A describe específicamente que la combinación de un compuesto de Fórmula 1 con abamectina se puede aplicar en una razón en peso entre 50:1 a 1: 50. Las líneas restantes de la Tabla A deben interpretarse de manera similar. Además, la Tabla A enumera combinaciones específicas de un compuesto de Fórmula 1 con otros agentes de control de plagas de invertebrados ilustrativos de las mezclas, composiciones y métodos de la presente invención e incluye realizaciones adicionales de intervalos de razón en peso para tasas de aplicación.

Tabla A

Agente de control de plagas de invertebrados	Modo de acción o clase química	Razón en peso típica
Abamectin	lactonas macrocíclicas	50:1 a 1:50
Acetamiprid	neonicotinoides	150:1 a 1:200
Amitraz	Ligandos de receptores de octopamina	200:1 a 1:100
Avermectina	lactonas macrocíclicas	50:1 a 1:50
Azadiractina	agonistas de ecdisona	100:1 a 1:120
Beta-ciflutrin	moduladores del canal de sodio	150:1 a 1:200
Bifentrin	moduladores del canal de sodio	100:1 a 1:10
Buprofezin	inhibidores de la síntesis de quitina	500:1 a 1:50
Cartap	Análogos de nereistoxina	100:1 a 1:200
Clorantraniliprol	ligandos del receptor de rianodina	100:1 a 1:120
Clorfenapir	inhibidores del transporte de electrones mitocondriales	300:1 a 1:200
Clorpirifos	inhibidores de colinesterasa	500:1 a 1:200
Clotianidin	neonicotinoides	100:1 a 1:400
Ciantraniliprol	ligandos del receptor de rianodina	100:1 a 1:120
Ciflutrin	moduladores del canal de sodio	150:1 a 1:200
Cihalotrin	moduladores del canal de sodio	150:1 a 1:200
Cipermetrina	moduladores del canal de sodio	150:1 a 1:200
Cyromazina	inhibidores de la síntesis de quitina	400:1 a 1:50
Deltametrina	moduladores del canal de sodio	50:1 a 1:400
Dieldrin	insecticidas de ciclodieno	200:1 a 1:100

ES 2 659 033 T3

Agente de control de plagas de invertebrados	Modo de acción o clase química	Razón en peso típica
Dinotefuran	neonicotinoides	150:1 a 1:200
Diofenolan	Inhibidor de la muda	150:1 a 1:200
Emamectina	lactonas macrocíclicas	50:1 a 1:10
Endosulfan	insecticidas de ciclodieno	200:1 a 1:100
Esfenvalerato	moduladores del canal de sodio	100:1 a 1:400
Etiprol	bloqueadores del canal de cloruro regulados por GABA	200:1 a 1:100
Fenotiocarb		150:1 a 1:200
Fenoxicarb	imitadores de hormonas juveniles	500:1 a 1:100
Fenvalerato	moduladores del canal de sodio	150:1 a 1:200
Fipronil	bloqueadores del canal de cloruro regulados por GABA	150:1 a 1:100
Flonicamid		200:1 a 1:100
Flubendiamida	ligandos del receptor de rianodina	100:1 a 1:120
Flufenoxuron	inhibidores de la síntesis de quitina	200:1 a 1:100
Hexaflumuron	inhibidores de la síntesis de quitina	300:1 a 1:50
Hidrametilnon	inhibidores del transporte de electrones mitocondriales	150:1 a 1:250
Imidacloprid	neonicotinoides	1000:1 a 1:1000
Indoxacarb	moduladores del canal de sodio	200:1 a 1:50
Lambda-cihalotrina	moduladores del canal de sodio	50:1 a 1:250
Lufenuron	inhibidores de la síntesis de quitina	500:1 a 1:250
Metaflumizona		200:1 a 1:200
Metomilo	inhibidores de colinesterasa	500:1 a 1:100
Metopreno	imitadores de hormonas juveniles	500:1 a 1:100
Metoxifenoizida	agonistas de ecdisona	50:1 a 1:50
Nitenpiram	neonicotinoides	150:1 a 1:200
Nitiazina	neonicotinoides	150:1 a 1:200
Novaluron	inhibidores de la síntesis de quitina	500:1 a 1:150
Oxamilo	inhibidores de colinesterasa	200:1 a 1:200
Pimetrozina		200:1 a 1:100
Piretrina	moduladores del canal de sodio	100:1 a 1:10
Piridaben	inhibidores del transporte de electrones mitocondriales	200:1 a 1:100
Piridaliil		200:1 a 1:100
Piriproxifen	imitadores de hormonas juveniles	500:1 a 1:100
Rianodina	ligandos del receptor de rianodina	100:1 a 1:120
Spinetoram	lactonas macrocíclicas	150:1 a 1:100
Spinosad	lactonas macrocíclicas	500:1 a 1:10
Spirodiclofen	inhibidores de la biosíntesis de lípidos	200:1 a 1:200

ES 2 659 033 T3

Agente de control de plagas de invertebrados	Modo de acción o clase química	Razón en peso típica
Spiromesifen	inhibidores de la biosíntesis de lípidos	200:1 a 1:200
Tebufenozida	agonistas de ecdisona	500:1 a 1:250
Tiacloprid	neonicotinoides	100:1 a 1:200
Tiametoxam	neonicotinoides	1250:1 a 1:1000
Tiodicarb	inhibidores de colinesterasa	500:1 a 1:400
Tiosultap-sodio		150:1 a 1:100
Tralometrina	moduladores del canal de sodio	150:1 a 1:200
Triazamato	inhibidores de colinesterasa	250:1 a 1:100
Triflumuron	inhibidores de la síntesis de quitina	200:1 a 1:100
<i>Bacillus thuringiensis</i>	agentes biológicos	50:1 a 1:10
Delta-endotoxina de <i>Bacillus thuringiensis</i>	agentes biológicos	50:1 a 1:10
NPV (p.ej., Gemstar)	agentes biológicos	50:1 a 1:10

Es de destacar la composición de la presente invención en donde al menos un compuesto o agente biológicamente activos adicionales se selecciona entre los Agentes de Control de Plagas de Invertebrados enumerados en la Tabla A anterior.

- 5 Las razones en peso de un compuesto, incluyendo un compuesto de Fórmula 1, un *N-óxido* o una sal del mismo, con respecto al agente de control de plagas de invertebrados adicional están típicamente entre 1000:1 y 1:1000, siendo una una realización entre 500:1 y 1:500, siendo otra realización que está entre 250:1 y 1:200 y siendo otra realización entre 100:1 y 1:50.

- 10 Se enumeran a continuación en las Tablas B1 a B13, realizaciones de composiciones específicas que comprenden un compuesto de Fórmula 1 (los números de compuesto (Núm. Comp.) hacen referencia a los compuestos en la Tabla de Índice A) y un agente adicional de control de plagas de invertebrados.

Tabla B1

Mezcla Núm.	Núm. Comp.	y	Agente de Control de Plagas de Invertebrados	Mezcla Núm.	Núm. Comp.	y	Agente de Control de Plagas de Invertebrados
B1-1	41	y	Abamectin	B1-36	41	y	Imidacloprid
B1-2	41	y	Acetamiprid	B1-37	41	y	Indoxacarb
B1-3	41	y	Amitraz	B1-38	41	y	Lambda-cihalotrina
B1-4	41	y	Avermectina	B1-39	41	y	Lufenuron
B1-5	41	y	Azadiractin	B1-40	41	y	Metaflumizone
B1-5a	41	y	Bensultap	B1-41	41	y	Metomilo
B1-6	41	y	Beta-ciflutrin	B1-42	41	y	Metopreno
B1-7	41	y	Bifentrin	B1-43	41	y	Metoxifenoazida
B1-8	41	y	Buprofezin	B1-44	41	y	Nitenpiram
B1-9	41	y	Cartap	B1-45	41	y	Nitiazina
B1-10	41	y	Clorantraniliprol	B1-46	41	y	Novaluron
B1-11	41	y	Clorfenapir	B1-47	41	y	Oxamilo
B1-12	41	y	Clorpirifos	B1-48	41	y	Fosmet
B1-13	41	y	Clotianidin	B1-49	41	y	Pimetrozina
B1-14	41	y	Ciantraniliprol	B1-50	41	y	Piretrina

Mezcla Núm.	Núm. Comp.	y	Agente de Control de Plagas de Invertebrados	Mezcla Núm.	Núm. Comp.	y	Agente de Control de Plagas de Invertebrados
B1-15	41	y	Ciflutrin	B1-51	41	y	Piridaben
B1-16	41	y	Cihalotrin	B1-52	41	y	Piridalil
B1-17	41	y	Cipermetrina	B1-53	41	y	Piriproxifen
B1-18	41	y	Ciromazine	B1-54	41	y	Rianodine
B1-19	41	y	Deltametrina	B1-55	41	y	Spinetoram
B1-20	41	y	Dieldrin	B1-56	41	y	Spinosad
B1-21	41	y	Dinotefuran	B1-57	41	y	Spiroclifofen
B1-22	41	y	Diofenolan	B1-58	41	y	Spiromesifen
B1-23	41	y	Emamectin	B1-59	41	y	Spirotetramat
B1-24	41	y	Endosulfan	B1-59a	41	y	Sulfoxaflor
B1-25	41	y	Esfenvalerato	B1-60	41	y	Tebufenozida
B1-26	41	y	Etiprol	B1-61	41	y	Tiaclopid
B1-27	41	y	Fenotiocarb	B1-62	41	y	Tiametoxam
B1-28	41	y	Fenoxicarb	B1-63	41	y	Tiodicarb
B1-29	41	y	Fenvalerato	B1-64	41	y	Tiosultap-sodio
B1-30	41	y	Fipronil	B1-65	41	y	Tolfenpirad
B1-31	41	y	Flonicamid	B1-66	41	y	Tralometrina
B1-32	41	y	Flubendiamida	B1-67	41	y	Triazamato
B1-33	41	y	Flufenoxuron	B1-68	41	y	Triflumuron
B1-34	41	y	Hexaflumuron	B1-69	41	y	<i>Bacillus thuringiensis</i>
B1-35	41	y	Hidrametilnon	B1-70	41	y	Delta endotoxina de <i>Bacillus thuringiensis</i>
				B1-71	41	y	NPV (p.ej., Gemstar)

Tabla B2

La Tabla B2 es idéntica a la Tabla B1, excepto que cada referencia al compuesto 41 en la columna encabezada como "Núm. Comp." se reemplaza por una referencia al compuesto 77. Por ejemplo, la primera mezcla en la Tabla B2 se designa B2-1 y es una mezcla del compuesto 77 y el agente adicional para el control de plagas de invertebrados abamectina.

5

Tabla B3

La Tabla B3 es idéntica a la Tabla B1, excepto que cada referencia al compuesto 41 en la columna encabezada como "Núm. Comp." se reemplaza por una referencia al compuesto 546. Por ejemplo, la primera mezcla en la Tabla B3 se designa B3-1 y es una mezcla del compuesto 546 y el agente adicional para el control de plagas de invertebrados abamectina.

10

Tabla B4

La Tabla B4 es idéntica a la Tabla B1, excepto que cada referencia al compuesto 41 en la columna encabezada como "Núm. Comp." se reemplaza por una referencia al compuesto 613. Por ejemplo, la primera mezcla en la Tabla B4 se designa B4-1 y es una mezcla del compuesto 613 y el agente adicional para el control de plagas de invertebrados abamectina.

15

Tabla B5

5 La Tabla B5 es idéntica a la Tabla B1, excepto que cada referencia al compuesto 41 en la columna encabezada como "Núm. Comp." se reemplaza por una referencia al compuesto 652. Por ejemplo, la primera mezcla en la Tabla B5 se designa B5-1 y es una mezcla del compuesto 652 y el agente adicional para el control de plagas de invertebrados abamectina.

Tabla B6

10 La Tabla B6 es idéntica a la Tabla B1, excepto que cada referencia al compuesto 41 en la columna encabezada como "Núm. Comp." se reemplaza por una referencia al compuesto 720. Por ejemplo, la primera mezcla en la Tabla B6 se designa B6-1 y es una mezcla del compuesto 720 y el agente adicional para el control de plagas de invertebrados abamectina.

Tabla B7

15 La Tabla B7 es idéntica a la Tabla B1, excepto que cada referencia al compuesto 41 en la columna encabezada como "Núm. Comp." se reemplaza por una referencia al compuesto 800. Por ejemplo, la primera mezcla en la Tabla B7 se designa B7-1 y es una mezcla del compuesto 800 y el agente adicional para el control de plagas de invertebrados abamectina.

Tabla B8

20 La Tabla B8 es idéntica a la Tabla B1, excepto que cada referencia al compuesto 41 en la columna encabezada como "Núm. Comp." se reemplaza por una referencia al compuesto 801. Por ejemplo, la primera mezcla en la Tabla B8 se designa B8-1 y es una mezcla del compuesto 801 y el agente adicional para el control de plagas de invertebrados abamectina.

Tabla B9

25 La Tabla B9 es idéntica a la Tabla B1, excepto que cada referencia al compuesto 41 en la columna encabezada como "Núm. Comp." se reemplaza por una referencia al compuesto 802. Por ejemplo, la primera mezcla en la Tabla B9 se designa B9-1 y es una mezcla del compuesto 802 y el agente adicional para el control de plagas de invertebrados abamectina.

Tabla B10

30 La Tabla B10 es idéntica a la Tabla B1, excepto que cada referencia al compuesto 41 en la columna encabezada como "Núm. Comp." se reemplaza por una referencia al compuesto 804. Por ejemplo, la primera mezcla en la Tabla B10 se designa B10-1 y es una mezcla del compuesto 804 y el agente adicional para el control de plagas de invertebrados abamectina.

Tabla B11

35 La Tabla B11 es idéntica a la Tabla B1, excepto que cada referencia al compuesto 41 en la columna encabezada como "Núm. Comp." se reemplaza por una referencia al compuesto 805. Por ejemplo, la primera mezcla en la Tabla B11 se designa como B11-1 y es una mezcla del compuesto 805 y el agente adicional para el control de plagas de invertebrados abamectina.

Tabla B12

40 La Tabla B12 es idéntica a la Tabla B1, excepto que cada referencia al compuesto 41 en la columna encabezada como "Núm. Comp." se reemplaza por una referencia al compuesto 806. Por ejemplo, la primera mezcla en la Tabla B12 se designa B12-1 y es una mezcla del compuesto 806 y el agente adicional para el control de plagas de invertebrados abamectina.

Tabla B13

45 La Tabla B13 es idéntica a la Tabla B1, excepto que cada referencia al compuesto 41 en la columna encabezada como "Núm. Comp." se reemplaza por una referencia al compuesto 807. Por ejemplo, la primera mezcla en la Tabla B13 se designa B13-1 y es una mezcla del compuesto 807 y el agente adicional para el control de plagas de invertebrados abamectina.

Las mezclas específicas enumeradas en las Tablas B1 a B13 típicamente combinan un compuesto de Fórmula 1 con el otro agente para plagas de invertebrados en las proporciones especificadas en la Tabla A.

50 A continuación se enumeran en las Tablas C₁ a C₁₃, las realizaciones de composiciones específicas que comprenden un compuesto de Fórmula 1 (los números de compuesto (Núm. Comp.) se refieren a compuestos en las Tablas de Índice A-E) y un fungicida adicional.

Tabla C1

Mezcla Núm.	Núm. Comp.	y	Fungicida		Mezcla Núm.	Núm. Comp.	y	Fungicida
C1-1	41	y	Probenazol		C1-17	41	y	Difenoconazol
C1-2	41	y	Tiadinil		C1-18	41	y	Ciproconazol
C1-3	41	y	Isotianil		C1-19	41	y	Propiconazol
C1-4	41	y	Piroquilon		C1-20	41	y	Fenoxanil
C1-5	41	y	Metominostrobin		C1-21	41	y	Ferimzona
C1-6	41	y	Flutolanil		C1-22	41	y	Ftalida
C1-7	41	y	Validamicina		C1-23	41	y	Kasugamicina
C1-8	41	y	Furametpir		C1-24	41	y	Picoxistrobin
C1-9	41	y	Pencicuron		C1-25	41	y	Fentiopirad
C1-10	41	y	Simeconazol		C1-26	41	y	Famoxadona
C1-11	41	y	Orisastrobin		C1-27	41	y	Cimoxanil
C1-12	41	y	Trifloxistrobin		C1-28	41	y	Proquinazid
C1-13	41	y	Isoprotioloano		C1-29	41	y	Flusilazol
C1-14	41	y	Azoxistrobin		C1-30	41	y	Mancozeb
C1-15	41	y	Triciclazol		C1-31	41	y	Hidróxido de cobre
C1-16	41	y	Hexaconazol		C1-32	41	y	(a)
(a) 1-[4-[4-[5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona								

Tabla C2

5 La Tabla C2 es idéntica a la Tabla C1, excepto que cada referencia al compuesto 41 en la columna encabezada como "Núm. Comp." se reemplaza por una referencia al compuesto 77. Por ejemplo, la primera mezcla en la Tabla C2 se designa C2-1 y es una mezcla del compuesto 77 y el fungicida adicional probenazol.

Tabla C3

10 La Tabla C3 es idéntica a la Tabla C1, excepto que cada referencia al compuesto 41 en la columna encabezada como "Núm. Comp." se reemplaza por una referencia al compuesto 546. Por ejemplo, la primera mezcla en la Tabla C3 se designa C3-1 y es una mezcla del compuesto 546 y el fungicida adicional probenazol.

Tabla C4

10 La Tabla C4 es idéntica a la Tabla C1, excepto que cada referencia al compuesto 41 en la columna encabezada como "Núm. Comp." se reemplaza por una referencia al compuesto 613. Por ejemplo, la primera mezcla en la Tabla C4 se designa C4-1 y es una mezcla del compuesto 613 y el fungicida adicional probenazol.

Tabla C5

15 La Tabla C5 es idéntica a la Tabla C1, excepto que cada referencia al compuesto 41 en la columna encabezada como "Núm. Comp." se reemplaza por una referencia al compuesto 652. Por ejemplo, la primera mezcla en la Tabla C5 se designa C5-1 y es una mezcla del compuesto 652 y el fungicida adicional probenazol.

Tabla C6

20 La Tabla C6 es idéntica a la Tabla C1, excepto que cada referencia al compuesto 41 en la columna encabezada como "Núm. Comp." se reemplaza por una referencia al compuesto 720. Por ejemplo, la primera mezcla en la Tabla C6 se designa C6-1 y es una mezcla del compuesto 720 y el fungicida adicional probenazol.

Tabla C7

La Tabla C7 es idéntica a la Tabla C1, excepto que cada referencia al compuesto 41 en la columna encabezada como "Núm. Comp." se reemplaza por una referencia al compuesto 800. Por ejemplo, la primera mezcla en la Tabla C7 se designa C7-1 y es una mezcla del compuesto 800 y el fungicida adicional probenazol.

5 Tabla C8

La Tabla C8 es idéntica a la Tabla C1, excepto que cada referencia al compuesto 41 en la columna encabezada como "Núm. Comp." se reemplaza por una referencia al compuesto 801. Por ejemplo, la primera mezcla en la Tabla C8 se designa C8-1 y es una mezcla del compuesto 801 y el fungicida adicional probenazol.

Tabla C9

10 La Tabla C9 es idéntica a la Tabla C1, excepto que cada referencia al compuesto 41 en la columna encabezada como "Núm. Comp." se reemplaza por una referencia al compuesto 802. Por ejemplo, la primera mezcla en la Tabla C9 se designa C9-1 y es una mezcla del compuesto 802 y el fungicida adicional probenazol.

Tabla C10

15 La Tabla C10 es idéntica a la Tabla C1, excepto que cada referencia al compuesto 41 en la columna encabezada como "Núm. Comp." se reemplaza por una referencia al compuesto 804. Por ejemplo, la primera mezcla en la Tabla C10 se designa C10-1 y es una mezcla del compuesto 804 y el fungicida adicional probenazol.

Tabla C11

20 La Tabla C11 es idéntica a la Tabla C1, excepto que cada referencia al compuesto 41 en la columna encabezada como "Núm. Comp." se reemplaza por una referencia al compuesto 805. Por ejemplo, la primera mezcla en la Tabla C11 se designa C11-1 y es una mezcla del compuesto 805 y el fungicida adicional probenazol.

Tabla C12

La Tabla C12 es idéntica a la Tabla C1, excepto que cada referencia al compuesto 41 en la columna encabezada como "Núm. Comp." se reemplaza por una referencia al compuesto 806. Por ejemplo, la primera mezcla en la Tabla C12 se designa C12-1 y es una mezcla del compuesto 806 y el fungicida adicional probenazol.

25 Tabla C13

La Tabla C13 es idéntica a la Tabla C1, excepto que cada referencia al compuesto 41 en la columna encabezada como "Núm. Comp." se reemplaza por una referencia al compuesto 807. Por ejemplo, la primera mezcla en la Tabla C13 se designa C13-1 y es una mezcla del compuesto 807 y el fungicida adicional probenazol.

30 Las plagas de invertebrados se controlan en aplicaciones agronómicas y no agronómicas aplicando uno o más compuestos de esta invención, típicamente en forma de una composición, en una cantidad biológicamente eficaz, al entorno de las plagas, incluyendo el lugar de infestación agronómico y/o no agronómico al área a proteger, o directamente a las plagas a controlar.

35 Por tanto, la presente invención comprende un método para controlar una plaga de invertebrados en aplicaciones agronómicas y/o no agronómicas, que comprende poner en contacto la plaga de invertebrados o su entorno con una cantidad biológicamente eficaz de uno o más de los compuestos de la invención, o con una composición que comprende al menos uno de tales compuestos o una composición que comprende al menos uno de tales compuestos y una cantidad biológicamente eficaz de al menos un compuesto o agente biológicamente activos adicionales, con la condición de que el método no sea un método de tratamiento del cuerpo humano o animal mediante terapia. Los ejemplos de composiciones adecuadas que comprenden un compuesto de la invención y una
40 cantidad biológicamente eficaz de al menos un compuesto o agente biológicamente activos adicionales incluyen composiciones granulares en donde el compuesto activo adicional está presente en el mismo gránulo que el compuesto de la invención o en gránulos separados de los del compuesto de la invención.

Las realizaciones del método de esta invención incluyen el contacto con el entorno. Es de destacar el método en donde el entorno es una planta. También es de destacar el método en donde el entorno es una semilla.

45 Para lograr el contacto con un compuesto o composición de la invención para proteger un cultivo de campo de plagas de invertebrados, el compuesto o composición se aplican típicamente a la semilla del cultivo antes de la plantación, al follaje (p. ej., hojas, tallos, flores, frutos) de plantas de cultivo, o al suelo u otro medio de crecimiento antes o después de la plantación del cultivo.

50 Una realización de un método de contacto es mediante pulverización. Alternativamente, una composición granular que comprende un compuesto de la invención se puede aplicar al follaje de la planta o al suelo. Los compuestos de esta invención también pueden administrarse eficazmente a través de la absorción de plantas poniendo en contacto

la planta con una composición que comprende un compuesto de esta invención aplicado como encharcamiento del suelo con una formulación líquida, una formulación granular para el suelo, un tratamiento de caja de vivero o una inmersión de trasplantes. Es de destacar una composición de la presente invención en forma de una formulación líquida de encharcamiento de suelos. También es de destacar un método para controlar una plaga de invertebrados que comprende poner en contacto la plaga de invertebrados o su entorno con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de la presente invención o con una composición que comprende una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de la presente invención. Se debe destacar adicionalmente este método en donde el entorno es el suelo y la composición se aplica al suelo como una formulación de encharcamiento del suelo. Se debe destacar adicionalmente que los compuestos de esta invención también son eficaces por aplicación localizada al lugar de infestación. Otros métodos de contacto incluyen la aplicación de un compuesto o una composición de la invención mediante pulverizaciones directas y residuales, pulverizaciones aéreas, geles, recubrimientos de semillas, microencapsulaciones, absorción sistémica, cebos, etiquetas para las orejas, bolos, nebulizadores, fumigantes, aerosoles, espolvoreables y muchos otros. Una realización de un método de contacto es un gránulo, bastoncillo o comprimido de fertilizante dimensionalmente estables que comprenden un compuesto o composición de la invención. Los compuestos de esta invención también se pueden impregnar en materiales para fabricar dispositivos de control de invertebrados (p. ej., redes para insectos).

Los compuestos de esta invención también son útiles en tratamientos de semillas para proteger semillas de plagas de invertebrados. En el contexto de la presente descripción y reivindicaciones, el tratamiento de una semilla significa poner en contacto la semilla con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de esta invención, que se formula típicamente como una composición de la invención. Este tratamiento de semillas protege la semilla de las plagas del suelo de invertebrados y, en general, también puede proteger las raíces y otras partes de la planta en contacto con el suelo de las plántulas que se desarrollan a partir de la semilla en germinación. El tratamiento de la semilla también puede proporcionar protección del follaje mediante la translocación del compuesto de esta invención o un segundo ingrediente activo dentro de la planta en desarrollo. Los tratamientos de semillas se pueden aplicar a todo tipo de semillas, incluyendo aquellas de las cuales germinarán plantas genéticamente transformadas para expresar rasgos especializados. Los ejemplos representativos incluyen aquellos que expresan proteínas tóxicas para plagas de invertebrados, tales como la toxina de *Bacillus thuringiensis* o aquellos que expresan resistencia a herbicidas tales como glifosato acetiltransferasa, que proporciona resistencia al glifosato.

Un método de tratamiento de semillas consiste en rociar o espolvorear la semilla con un compuesto de la invención (es decir, en forma de una composición formulada) antes de sembrar las semillas. Las composiciones formuladas para el tratamiento de semillas generalmente comprenden un agente formador de película o adherente. Por lo tanto, típicamente una composición de revestimiento de semillas de la presente invención comprende una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula 1, un *N-óxido*, o una sal del mismo, y un agente formador de película o adherente. La semilla puede ser recubierta mediante pulverización de un concentrado de suspensión vertible directamente en un lecho volteador de semillas a continuación secado de las semillas. Alternativamente, se pueden pulverizar sobre la semilla otros tipos de formulaciones tales como polvos humedecidos, soluciones, suspoemulsiones, concentrados emulsificables y emulsiones en agua. Este procedimiento es particularmente útil para aplicar recubrimientos de película sobre semillas. Se encuentran disponibles para los expertos en la técnica diversas máquinas y procedimientos de recubrimiento. Los procedimientos adecuados incluyen los enumerados en P. Kusters et al; Seed Treatment: Progress and Prospects, 1994 BCPC Mongraph Núm. 57, y las referencias allí enumeradas.

La semilla tratada comprende típicamente un compuesto de la presente invención en una cantidad de 0,1 g a 1 kg por 100 kg de semilla (es decir, de aproximadamente 0,0001 a 1% en peso de la semilla antes del tratamiento). Una suspensión vertible formulada para el tratamiento de semillas típicamente comprende de 0,5 a aproximadamente 70% del ingrediente activo, de 0,5 a aproximadamente 30% de un adherente formador de película, de 0,5 a aproximadamente 20% de un agente dispersante, de 0 a 5% de un espesante, de 0 a 5% de un pigmento y/o colorante, de 0 a 2% de un agente antiespumante, de 0 a 1% de un conservante, y de 0 a 75% de un diluyente líquido volátil.

Los compuestos de esta invención se pueden incorporar en una composición de cebo que es consumida por una plaga de invertebrados o se utiliza dentro de un dispositivo tal como una trampa, estación de cebo, y similares. Dicha composición de cebo puede estar en forma de gránulos que comprenden (a) ingredientes activos, concretamente una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula 1 y un *N-óxido*, o una sal del mismo; (b) uno o más materiales alimenticios; opcionalmente (c) un atrayente, y opcionalmente (d) uno o más humectantes. Son de destacar los gránulos o composiciones de cebo que comprenden entre aproximadamente 0,001-5% de ingredientes activos, aproximadamente 40-99% de material alimenticio y/o atrayente; y opcionalmente aproximadamente de 0.05-10% de humectantes, que son eficaces en el control de plagas de invertebrados del suelo a tasas de aplicación muy bajas, particularmente a dosis de ingrediente activo que son letales por ingestión más que por contacto directo. Algunos materiales alimenticios pueden funcionar como una fuente de alimento y como un atrayente. Los materiales alimenticios incluyen carbohidratos, proteínas y lípidos. Los ejemplos de materiales alimenticios son harina de verdura, azúcar, almidones, grasa animal, aceite vegetal, extractos de levadura y sólidos lácteos. Los ejemplos de atrayentes son odorantes y aromatizantes, tales como extractos de frutas o plantas, perfume u otros componentes animales o vegetales, feromonas u otros agentes conocidos por atraer a una plaga de invertebrados diana. Los ejemplos de humectantes, es decir, agentes de retención de humedad, son glicoles y otros polioles, glicerina y

sorbitol. Es de destacar una composición de cebo (y un método que utiliza dicha composición de cebo) utilizada para controlar al menos una plaga de invertebrados seleccionada del grupo que consiste en hormigas, termitas y cucarachas. Un dispositivo para controlar una plaga de invertebrados puede comprender la presente composición de cebo y una carcasa adaptada para recibir la composición de cebo, en donde la carcasa tiene al menos una abertura dimensionada para permitir que la plaga de invertebrados pase a través de la abertura de manera que la plaga de invertebrados pueda acceder a la composición de cebo desde una localización fuera del alojamiento, y en donde el alojamiento está adaptado adicionalmente para colocarse en o cerca de un lugar de actividad potencial o conocida de la plaga de invertebrados.

Los compuestos de esta invención se pueden aplicar sin otros coadyuvantes, pero la aplicación más frecuente será de una formulación que comprende uno o más ingredientes activos con portadores, diluyentes y tensioactivos adecuados y posiblemente en combinados con un alimento dependiendo del uso final contemplado. Un método de aplicación implica pulverizar una dispersión en agua o solución de aceite refinado de un compuesto de la presente invención. Las combinaciones con aceites de pulverización, concentraciones de aceite de pulverización, adhesivos de dispersión, coadyuvantes, otros disolventes y agentes sinérgicos tales como butóxido de piperonilo a menudo aumentan la eficacia del compuesto. Para usos no agronómicos, tales pulverizaciones se pueden aplicar desde recipientes de pulverización tales como una lata, una botella u otro recipiente, ya sea por medio de una bomba o liberándolo de un recipiente presurizado, p. ej., una lata de pulverización en aerosol presurizada. Tales composiciones de pulverización pueden adoptar diversas formas, por ejemplo, pulverizaciones, neblinas, espumas, humos o niebla. Tales composiciones de pulverización pueden de ese modo comprender adicionalmente propelentes, agentes espumantes, etc. según sea necesario para la aplicación. Es de destacar una composición de pulverización que comprende una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto o una composición de la presente invención y un portador. Una realización de tal composición de pulverización comprende una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto o una composición de la presente invención y un propelente. Los propelentes representativos incluyen, pero no se limitan a, metano, etano, propano, butano, isobutano, buteno, pentano, isopentano, neopentano, penteno, hidrofluorocarbonos, clorofluorocarbonos, dimetil éter y mezclas de los anteriores. Es de destacar una composición para pulverización (y un método que utiliza semejante composición para pulverización dispensada desde un recipiente de pulverización) utilizada para controlar al menos una plaga de invertebrado seleccionada del grupo que consiste en mosquitos, moscas negras, moscas de los establos, moscas de los venados, moscas de caballos, avispas, avispas de chaqueta amarilla, avispones, garrapatas, arañas, hormigas, jejenes y similares, incluyendo individualmente o combinadas.

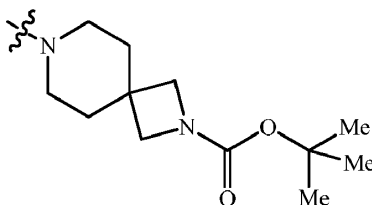
Los usos no agronómicos se refieren al control de plagas de invertebrados en áreas distintas a los campos de plantas de cultivo. Los usos no agronómicos de los presentes compuestos y composiciones incluyen el control de plagas de invertebrados en granos almacenados, judías y otros productos alimenticios, y en textiles tales como ropa y alfombras. Los usos no agronómicos de los presentes compuestos y composiciones también incluyen el control de plagas de invertebrados en plantas ornamentales, bosques, en patios, a lo largo de caminos y caminos de ferrocarril, y en pastos tales como céspedes, campos de golf y pastizales. Los usos no agronómicos de los presentes compuestos y composiciones también incluyen el control de plagas de invertebrados en casas y otros edificios que pueden estar ocupados por humanos y/o animales de compañía, granjas, ranchos, zoológicos u otros animales. Los usos no agronómicos de los presentes compuestos y composiciones también incluyen el control de plagas tales como termitas que pueden dañar la madera u otros materiales estructurales empleados en edificios.

Para aplicaciones agronómicas, la tasa de aplicación requerida para el control eficaz (es decir, "cantidad biológicamente eficaz") dependerá de factores tales como las especies de invertebrados a controlar, el ciclo de vida de las plagas, fase biológica, tamaño, ubicación, época del año, cultivo o animal anfitrión, comportamiento de alimentación, comportamiento de apareamiento, humedad ambiental temperatura y similares. En circunstancias normales, las tasas de aplicación de aproximadamente 0.01 a 2 kg de ingrediente activo por hectárea son suficientes para controlar las plagas en los ecosistemas agronómicos, pero puede ser suficiente tan poco como 0.0001 kg/hectárea o se pueden requerir hasta 8 kg/hectárea. Para aplicaciones no agronómicas, las tasas de uso eficaces oscilarán de aproximadamente 1.0 a 50 mg/metro cuadrado, pero puede ser suficiente tan solo 0.1 mg/metro cuadrado o se pueden requerir tanto como 150 mg/metro cuadrado. Un experto en la técnica puede determinar fácilmente la cantidad biológicamente eficaz necesaria para el nivel deseado de control de plaga de invertebrados.

Los compuestos representativos de esta invención preparados mediante los métodos descritos en la presente memoria se muestran en las tablas de índice A-E. Véase la Tabla de índice F para obtener información de RMN H^1 . La columna encabezada como "mp ($^{\circ}C$) o AP^+ (M + 1)" contiene datos espectrales de masa como una sola entrada numérica (p. ej., 348) o datos de punto de fusión como un intervalo numérico (p. ej., 122-124 $^{\circ}C$). Para datos espectrales de masa (AP^+ (M + 1)), el valor numérico referido es el peso molecular del ion molecular parental (M) formado por la adición de H^+ (peso molecular de 1) a la molécula para dar un pico de M + 1 observado mediante espectrometría de masas utilizando la ionización química a presión atmosférica (AP^+). Los picos de iones moleculares alternativos (p. ej., M + 2 o M + 4) que ocurren con compuestos que contienen halógenos múltiples no se refieren.

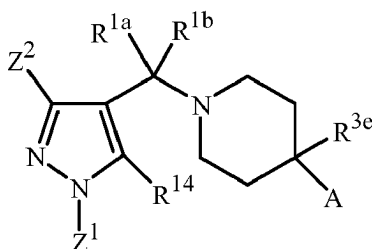
En la Tabla de índice B, las entradas en la columna encabezada como "X" representan definiciones de la variable M de Fórmula 1. Cuando M es $-C(R^{3e})(A)-$ y R^{3e} y A se toman juntos para formar un anillo, el anillo se representa en la forma "C (miembros de anillo)" estando el primer y último miembros del anillo unidos al átomo de carbono de -

C(R^{3e})(A)-. Por ejemplo, cuando X se define como "[C(-CH₂N(C(O)OC(Me)₃)CH₂)]", la estructura del anillo de piperidina que contiene X sería como se muestra a continuación.



5 Las siguientes abreviaturas se utilizan en las Tablas de Índice que siguen: Comp. significa Compuesto, Me es metilo, Et es etilo, c-Pr es ciclopropilo, Ph es fenilo, CHO es formilo y CN es ciano.

TABLA ÍNDICE A



R ^{1a} , R ^{1b} y R ¹⁴ son H					
Comp	Z ¹	Z ²	A	R ^{3e}	p.f. (°C) o AP+ (M+1)
1	2-clorofenilo	4-fluorofenilo	fenilo	H	
2	3-metilfenilo	3-fluorofenilo	CO ₂ Me	H	408,5
3	2,4-difluorofenilo	2-metilfenilo	CO ₂ Me	H	426,5
4	4-metilfenilo	4-fluorofenilo	CO ₂ Me	H	408,5
5	3-metilfenilo	3-fluorofenilo	CH ₂ OCH ₃	H	394,5
6	2-metilfenilo	3-fluoro-4-metoxifenilo	CO ₂ Et	H	
7	4-metilfenilo	4-fluorofenilo	CH ₂ OCH ₃	H	
8	4-metilfenilo	4-fluorofenilo	C(O)NEt ₂	H	
9	2,4-difluorofenilo	4-fluorofenilo	CO ₂ Me	H	91-92°C
10	4-(trifluorometoxi)fenilo	4-fluorofenilo	CO ₂ Me	H	478,4
11	3-(trifluorometil)fenilo	4-fluorofenilo	CO ₂ Me	H	462,5
12	3-(trifluorometil)fenilo	4-fluorofenilo	ciano	H	429,4
13	4-clorofenilo	4-fluorofenilo	CO ₂ Me	H	428,4
14	4-clorofenilo	4-fluorofenilo	ciano	H	395,4
15	2,4-difluorofenilo	3-(trifluorometil)fenilo	CO ₂ Me	H	480,4
16	2,4-difluorofenilo	2-fluoro-4-metilfenilo	CO ₂ Me	H	444,5
17	2,4-difluorofenilo	4-clorofenilo	CO ₂ Me	H	446,4
18	2,6-dicloro-4-(trifluorometil)fenilo	4-clorofenilo	CO ₂ Me	H	546,3
19	3-clorofenilo	2-fluorofenilo	CO ₂ Me	H	442,5
20	3-clorofenilo	3-fluorofenilo	CO ₂ Et	H	442,4
21	3-clorofenilo	4-fluorofenilo	CO ₂ Et	H	442,4

R ^{1a} , R ^{1b} y R ¹⁴ son H					
Comp	Z ¹	Z ²	A	R ^{3e}	p.f. (°C) o AP+ (M+1)
22	3,4-diclorofenilo	2-fluorofenilo	CO ₂ Et	H	476,4
23	3,4-diclorofenilo	3-fluorofenilo	CO ₂ Et	H	476,4
24	3,4-diclorofenilo	4-fluorofenilo	CO ₂ Et	H	476,4
25	3-clorofenilo	3-fluorofenilo	CF ₃	H	438,4
26	3-clorofenilo	2-fluorofenilo	NHC(O)OEt	H	457,5
27	3-clorofenilo	3-fluorofenilo	NHC(O)OEt	H	457,5
28	3-clorofenilo	4-fluorofenilo	NHC(O)OEt	H	457,5
29	3,4-diclorofenilo	2-fluorofenilo	C(O)Me	H	446,4
30	3,4-diclorofenilo	3-fluorofenilo	C(O)Me	H	446,4
31	3,4-diclorofenilo	4-fluorofenilo	C(O)Me	H	446,4
32	3,4-diclorofenilo	4-fluorofenilo	CO ₂ Me	H	462,4
33	3,4-diclorofenilo	4-fluorofenilo	ciano	H	429,4
34	3,5-bis(trifluorometil)fenilo	4-fluorofenilo	CO ₂ Me	H	530,5
35	3,5-diclorofenilo	4-fluorofenilo	CO ₂ Et	H	476,4
36	3,5-diclorofenilo	4-fluorofenilo	ciano	H	429,4
37	3-cloro-2-piridinilo	4-fluorofenilo	ciano	H	396,5
38	3,5-bis(trifluorometil)fenilo	4-fluorofenilo	ciano	H	497,4
39	2-fluorofenilo	2-fluorofenilo	ciano	H	379,5
40	3-fluorofenilo	2-fluorofenilo	ciano	H	379,5
41	3-cloro-4-fluorofenilo	2-fluorofenilo	ciano	H	413,4
42	4-cianofenilo	4-fluorofenilo	ciano	H	386,5
43	2-fluorofenilo	2-fluorofenilo	CO ₂ Me	H	412,5
44	3-fluorofenilo	2-fluorofenilo	CO ₂ Me	H	412,5
45	3-cloro-4-fluorofenilo	2-fluorofenilo	CO ₂ Me	H	446,4
46	4-(trifluorometil)-2-pirimidinilo	2-fluorofenilo	ciano	H	431,5
47	4-(trifluorometil)-2-pirimidinilo	2-fluorofenilo	CO ₂ Me	H	464,5
48	4-(trifluorometil)fenilo	2-fluorofenilo	ciano	H	429,4
49	4-(trifluorometil)fenilo	2-fluorofenilo	NHC(O)OEt	H	491,5
50	4-(trifluorometil)fenilo	2-fluorofenilo	CO ₂ Me	H	462,5
51	4-bromofenilo	2-fluorofenilo	ciano	H	440,4
52	4-bromofenilo	2-fluorofenilo	CO ₂ Me	H	472,4
53	4-cloro-3-fluorofenilo	2-fluorofenilo	ciano	H	393,5
54	4-cloro-3-fluorofenilo	2-fluorofenilo	NHC(O)OEt	H	455,5
55	4-cloro-3-fluorofenilo	2-fluorofenilo	CO ₂ Me	H	426,5
56	3,4-diclorofenilo	2-fluorofenilo	ciano	H	429,4
57	3,4-diclorofenilo	2-fluorofenilo	NHC(O)OEt	H	491,4

R ^{1a} , R ^{1b} y R ¹⁴ son H					
Comp	Z ¹	Z ²	A	R ^{3e}	p.f. (°C) o AP+ (M+1)
58	4-(trifluorometil)fenilo	2-fluorofenilo	ciano	Ph	505,5
59	4-(trifluorometil)fenilo	2-fluorofenilo	NHC(O)Me	H	461,5
60	4-bromofenilo	2-fluorofenilo	NHPh	H	505,4
61	4-cloro-3-fluorofenilo	2-fluorofenilo	NHC(O)Me	H	425,5
62	3,4-diclorofenilo	2-fluorofenilo	NHC(O)Me	H	461,4
63	4-(trifluorometoxi)fenilo	2-fluorofenilo	ciano	H	445,5
64	4-(trifluorometoxi)fenilo	2-fluorofenilo	CO ₂ Me	H	478,5
65	4-(trifluorometoxi)fenilo	2-fluorofenilo	NHC(O)Me	H	477,4
66	4-(trifluorometoxi)fenilo	2,4-difluorofenilo	ciano	H	463,4
67	4-(trifluorometoxi)fenilo	2,4-difluorofenilo	CO ₂ Me	H	496,4
68	4-(trifluorometoxi)fenilo	2,4-difluorofenilo	NHC(O)Me	H	495,5
69	4-(trifluorometoxi)fenilo	2-fluorofenilo	ciano	Ph	521,5
70	4-(trifluorometoxi)fenilo	2,4-difluorofenilo	ciano	Ph	539,5
71	3-(trifluorometil)fenilo	2-fluorofenilo	ciano	H	429,4
72	3-(trifluorometil)fenilo	2-fluorofenilo	CO ₂ Me	H	462,5
73	3-(trifluorometil)fenilo	2-fluorofenilo	ciano	Ph	505,5
74	3-(trifluorometil)fenilo	2-fluorofenilo	NHC(O)Me	H	461,5
75	4-clorofenilo	2-fluorofenilo	CO ₂ Me	H	428,4
76	4-clorofenilo	2-fluorofenilo	NHC(O)Me	H	427,5
77	4-clorofenilo	2-fluorofenilo	ciano	H	395,4
78	5-(trifluorometil)-2-piridinilo	2-fluorofenilo	ciano	H	#
79	4-(trifluorometoxi)fenilo	2,6-difluorofenilo	ciano	H	463,4
80	4-(trifluorometoxi)fenilo	2,6-difluorofenilo	CO ₂ Me	H	496,5
81	5-(trifluorometil)-2-piridinilo	2-fluorofenilo	CO ₂ Me	H	463,4
82	4-(trifluorometoxi)fenilo	2-fluorofenilo	1-BZT*	H	537,6
83	3,4-diclorofenilo	2-clorofenilo	ciano	H	445,4
84	3,4-diclorofenilo	2-clorofenilo	CO ₂ Me	H	478,4
85	3-cloro-4-cianofenilo	2-fluorofenilo	ciano	H	420
86	3,4-diclorofenilo	2-metilfenilo	ciano	H	425
87	3-clorofenilo	2-fluorofenilo	ciano	H	395
88	3-clorofenilo	2-fluorofenilo	CO ₂ Me	H	428
89	4-(methylsulfonil)fenilo	2-fluorofenilo	ciano	H	439
90	4-(methylsulfonil)fenilo	2-fluorofenilo	CO ₂ Me	H	472
91	4-(trifluorometil)fenilo	2-furanilo	ciano	H	401,5
92	4-(trifluorometil)fenilo	2-furanilo	CO ₂ Me	H	434
94	3,4-difluorofenilo	2-fluorofenilo	ciano	H	397
95	3,4-difluorofenilo	2-fluorofenilo	CO ₂ Me	H	430
96	3-cloro-4-metilfenilo	2-fluorofenilo	ciano	H	409

R ^{1a} , R ^{1b} y R ¹⁴ son H					
Comp	Z ¹	Z ²	A	R ^{3e}	p.f. (°C) o AP+ (M+1)
97	3-cloro-4-metilfenilo	2-fluorofenilo	CO ₂ Me	H	442,5
98	3,4-diclorofenilo	3-piridinilo	ciano	H	412,4
99	4-ciano-3-(trifluorometil)fenilo	2-fluorofenilo	ciano	H	454
100	4-ciano-3-(trifluorometil)fenilo	2-fluorofenilo	CO ₂ Me	H	487
101	4-ciano-3-(trifluorometil)fenilo	2-fluorofenilo	CO ₂ Et	H	501
102	3,4-diclorofenilo	2-fluorofenilo	CO ₂ Me	H	463
103	4-clorofenilo	2-fluorofenilo	CHO	H	398
104	4-(trifluorometil)-2-pirimidinilo	2-fluorofenilo	NHC(O)Me	H	463,5
105	4-(trifluorometoxi)fenilo	2,6-difluorofenilo	NHC(O)Me	H	495,5
106	5-(trifluorometil)-2-piridinilo	2-fluorofenilo	NHC(O)Me	H	462,5
107	3,4-diclorofenilo	2-clorofenilo	NHC(O)Me	H	477
108	3,4-diclorofenilo	2-metilfenilo	NHC(O)Me	H	457,4
109	3-clorofenilo	2-fluorofenilo	NHC(O)Me	H	427,5
110	4-(methylsulfonyl)fenilo	2-fluorofenilo	NHC(O)Me	H	471,5
111	4-(trifluorometil)fenilo	2-furanilo	NHC(O)Me	H	433,4
112	3,4-difluorofenilo	2-fluorofenilo	NHC(O)Me	H	429,5
113	3-cloro-4-metilfenilo	2-fluorofenilo	NHC(O)Me	H	441,5
114	3,4-diclorofenilo	2-fluorofenilo	NHC(O)OC(Me) ₃	H	519,4
115	3,4-diclorofenilo	2-(trifluorometil)fenilo	ciano	H	479,4
116	3,4-diclorofenilo	2-(trifluorometil)fenilo	CO ₂ Me	H	512,4
117	3,4-diclorofenilo	2-(trifluorometil)fenilo	NHC(O)Me	H	511,4
118	3,4-diclorofenilo	2-tienil	ciano	H	417,4
119	3,4-diclorofenilo	2-tienil	NHC(O)Me	H	201-202°C
120	3,4-diclorofenilo	2-fluorofenilo	NH ₂	H	419,5
121	3,4-diclorofenilo	2-fluorofenilo	NHC(O)CF ₃	H	515
122	3,4-difluorofenilo	2-fluorofenilo	CH ₂ NHC(O)Me	H	443,5
123	3,4-diclorofenilo	(trifluorometil)fenilo	CH ₂ NHC(O)Me	H	525,4
124	3,4-diclorofenilo	2-clorofenilo	CH ₂ NHC(O)Me	H	492,4
125	3-(trifluorometil)fenilo	2-fluorofenilo	CH ₂ NHC(O)Me	H	475,5
126	4-(trifluorometoxi)fenilo	2-fluorofenilo	CH ₂ NHC(O)Me	H	491,5
127	3-cloro-4-metilfenilo	2-fluorofenilo	CH ₂ NHC(O)Me	H	455,5
128	3,4-diclorofenilo	5-cloro-2-tienil	ciano	H	451
129	5-(trifluorometil)-3-piridinilo	2-fluorofenilo	ciano	H	430,5
130	3,4-dimetilfenilo	2-fluorofenilo	CO ₂ Me	H	422,5
131	3,4-dimetilfenilo	2-fluorofenilo	ciano	H	389,5

R ^{1a} , R ^{1b} y R ¹⁴ son H					
Comp	Z ¹	Z ²	A	R ^{3e}	p.f. (°C) o AP+ (M+1)
132	3-bromofenilo	2-fluorofenilo	CO ₂ Me	H	472,4
133	3-bromofenilo	2-fluorofenilo	ciano	H	439,4
134	4-fluorofenilo	2-metilfenilo	ciano	H	375,5
135	3-bromofenilo	2-fluorofenilo	C(O)NHMe	H	471,4
136	3,4-difluorofenilo	2-fluorofenilo	C(O)NHMe	H	429,5
137	3-cloro-4-metilfenilo	2-fluorofenilo	C(O)NHMe	H	441,5
138	3,4-diclorofenilo	2-(trifluorometil)fenilo	C(O)NHMe	H	511,5
500	4-metilfenilo	4-fluorofenilo	C(O)N(-(CH ₂) ₄ -)	H	
505	2,5-dimetilfenilo	fenilo	CO ₂ Me	H	
506	4-metilfenilo	3-metilfenilo	OMe	H	
510	4-clorofenilo	2-fluorofenilo	CH ₂ OH	H	400
511	3,4-diclorofenilo	2-fluorofenilo	NHC(O)OC(Me) ₃	H	519,4
512	4-fluorofenilo	2-metilfenilo	CO ₂ Me	H	408,4
516	3,4-diclorofenilo	5-cloropiridin-2-il	ciano	H	448
517	3-metilfenilo	2-metilfenilo	ciano	H	371,5
519	3,4-diclorofenilo	5-metiltiofen-2-il	ciano	H	431
520	3,4-diclorofenilo	tiofen-2-il	ciano	H	417
530	3,4-difluorofenilo	2-clorofenilo	ciano	H	413,5
531	3,4-difluorofenilo	2-clorofenilo	CO ₂ Me	H	446,4
534	3,4-difluorofenilo	2-bromofenilo	ciano	H	457,4
535	3,4-difluorofenilo	2-bromofenilo	CO ₂ Me	H	490,4
538	3,4-difluorofenilo	2-(trifluorometil)fenilo	ciano	H	447,5
539	3,4-difluorofenilo	2-(trifluorometil)fenilo	CO ₂ Me	H	480,4
542	3,4-diclorofenilo	2,5-diclorotiofen-3-il	ciano	H	487
543	3,4-diclorofenilo	2,5-dimetiltiofen-3-il	ciano	H	445
544	3,4-diclorofenilo	3-metiltiofen-2-il	ciano	H	431
546	4-cloro-3-fluorofenilo	2-fluorofenilo	ciano	H	413,5
547	4-cloro-3-fluorofenilo	2-fluorofenilo	CO ₂ Me	H	446,4
549	4-cloro-3-fluorofenilo	2-fluorofenilo	NHC(O)Me	H	445,5
550	4-cloro-3-fluorofenilo	2-clorofenilo	ciano	H	429,4
551	4-cloro-3-fluorofenilo	2-clorofenilo	CO ₂ Me	H	462,4
553	4-cloro-3-fluorofenilo	2-clorofenilo	NHC(O)Me	H	461,5
556	4-(trifluorometoxi)fenilo	2-clorofenilo	ciano	H	461,5
557	4-(trifluorometoxi)fenilo	2-clorofenilo	NHC(O)Me	H	493,5
559	4-(trifluorometoxi)fenilo	2-metilfenilo	ciano	H	441,5
560	4-(trifluorometoxi)fenilo	2-metilfenilo	NHC(O)Me	H	473,5
562	4-(trifluorometoxi)fenilo	2-metilfenilo	CO ₂ Me	H	474,5
563	4-(trifluorometoxi)fenilo	2-(trifluorometil)fenilo	ciano	H	495,5

R ^{1a} , R ^{1b} y R ¹⁴ son H					
Comp	Z ¹	Z ²	A	R ^{3e}	p.f. (°C) o AP+ (M+1)
565	2-tienil	2-fluorofenilo	CO ₂ Me	H	400,2
566	3,4-diclorofenilo	2-fluoropiridin-3-il	ciano	H	430
567	4-metilfenilo	2-fluorofenilo	ciano	H	375,5
568	4-metilfenilo	2-fluorofenilo	NHC(O)Me	H	407,6
570	4-metilfenilo	2-fluorofenilo	CO ₂ Me	H	408,5
571	4-metilfenilo	2-metilfenilo	ciano	H	371,6
572	4-fluorofenilo	2-fluorofenilo	ciano	H	379,5
573	4-fluorofenilo	2-fluorofenilo	NHC(O)Me	H	411,5
575	4-fluorofenilo	2-fluorofenilo	CO ₂ Me	H	412,5
576	3,4-difluorofenilo	2-fluorofenilo	OH	H	388,5
577	3-cloro-4-fluorofenilo	4-fluorofenilo	ciano	H	413,4
579	3-cloro-4-fluorofenilo	4-clorofenilo	ciano	H	429,4
581	3-cloro-4-fluorofenilo	2,6-difluorofenilo	ciano	H	431,4
583	3-cloro-4-fluorofenilo	2,4-difluorofenilo	ciano	H	431,4
585	3-cloro-4-fluorofenilo	2-fluorofenilo	Cl	H	422,4
586	3-cloro-4-fluorofenilo	2-fluorofenilo	F	H	406,4
587	4-cloro-2-fluorofenilo	2-fluorofenilo	ciano	H	390,4
591	3-cloro-2-fluorofenilo	2-fluorofenilo	ciano	H	413,4
594	3-cloro-4-fluorofenilo	2-fluorofenilo	C(S)NH ₂	H	447,4
597	3-cloro-4-fluorofenilo	2-fluorofenilo	OH	H	404,4
602	4-clorofenilo	2,4,6-trifluorofenilo	ciano	H	431,4
604	4-clorofenilo	2-cloro-4-fluorofenilo	ciano	H	429,4
606	4-clorofenilo	3-cloro-5-fluorofenilo	ciano	H	429,4
609	5-bromopiridin-2-il	2-fluorofenilo	ciano	H	443,1
610	2-tiofen-2-il	2-fluorofenilo	ciano	H	367,1
613	5-bromopiridin-2-il	2-fluorofenilo	ciano	H	440,4
615	4-cloro-2-metilfenilo	2-fluorofenilo	ciano	H	409,5
617	3-cloro-4-fluorofenilo	2,4-difluorofenilo	ciano	CO ₂ Me	489,4
618	4-cloro-3-fluorofenilo	2-fluorofenilo	ciano	CO ₂ Me	471,4
626	4-clorofenilo	2-fluorofenilo	NHC(O)Me	C(O)NHC(Me) ₃	526,5
627	4-clorofenilo	2-fluorofenilo	NHC(O)Me	C(O)NH ₂	470,5
629	4-clorofenilo	2,4-difluorofenilo	ciano	H	413,5
632	4-cloro-3-(trifluorometil)fenilo	2-fluorofenilo	ciano	H	463,4
633	4-clorofenilo	2,4-difluorofenilo	N(Me)C(O)Me	H	459,5

R ^{1a} , R ^{1b} y R ¹⁴ son H					
Comp	Z ¹	Z ²	A	R ^{3e}	p.f. (°C) o AP+ (M+1)
634	4-clorofenilo	2-fluorofenilo	N(Me)C(O)Me	H	441,5
641	4-clorofenilo	2-fluorofenilo	SO ₂ CH ₃	H	448
643	4-clorofenilo	2,4-difluorofenilo	ciano	NHC(O)Me	470,4
644	4-clorofenilo	2,4-difluorofenilo	NHC(O)Me	C(O)NH ₂	488,4
645	4-clorofenilo	2-fluorofenilo	ciano	NHC(O)Me	452,4
646	3-cloro-4-fluorofenilo	2,4-difluorofenilo	NHC(O)Me	C(O)NH ₂	506,4
647	3-cloro-4-fluorofenilo	2,4-difluorofenilo	ciano	NHC(O)Me	488,4
648	4-(trifluorometoxi)fenilo	2,4-difluorofenilo	ciano	NHC(O)Me	520,4
649	4-(trifluorometoxi)fenilo	2,4-difluorofenilo	NHC(O)Me	C(O)NH ₂	538,5
650	2,4-difluorofenilo	2,4-difluorofenilo	ciano	H	415,4
652	5-cloropiridin-2-il	2,4-difluorofenilo	ciano	H	414,4
654	5-(trifluorometil)piridine-2-il	2-fluorofenilo	ciano	H	430,5
663	4-clorofenilo	2,4-difluorofenilo	1 <i>H</i> -imidazol-2-il	H	454,4
664	5-cloropiridin-2-il	2,4-difluorofenilo	1 <i>H</i> -imidazol-2-il	H	455,4
667	4-clorofenilo	2-fluorofenilo	1 <i>H</i> -imidazol-2-il	H	436,5
674	2-benzotriazolilo	2-fluorofenilo	NHC(O)Me	H	450,4
676	2-benzotriazolilo	2-fluorofenilo	ciano	H	418,4
677	4-clorofenilo	2-fluorofenilo	OH	H	386,4
679	4-clorofenilo	2-fluorofenilo	COOH	H	414
680	4-clorofenilo	2-fluorofenilo	C(O)NHNHC(O)Me	H	470
681	4-clorofenilo	2-fluorofenilo	C(O)NHNHC(O)OEt	H	500
686	4-(trifluorometoxi)fenilo	2-fluorofenilo	NHC(O)OC(Me) ₃	H	535,1
691	4-(trifluorometoxi)fenilo	2-fluorofenilo	NHC(O)CF ₃	H	531
692	4-(trifluorometoxi)fenilo	2-fluorofenilo	NHCHO	H	463,1
693	4-bromofenilo	2-fluorofenilo	CH(OH)CH ₃	H	414
694	3-cloro-4-fluorofenilo	2-fluorofenilo	1,2,4-triazol-1-il	H	455,4
695	4-clorofenilo	2-fluorofenilo	1,2,4-triazol-1-il	H	437,4
696	4-(trifluorometoxi)fenilo	2,4-difluorofenilo	1,2,4-triazol-1-il	H	505,4
697	3-cloro-4-fluorofenilo	2-fluorofenilo	imidazol-1-il	H	454,4
698	4-clorofenilo	2-fluorofenilo	imidazol-1-il	H	436,4
699	3,4-difluorofenilo	2-clorofenilo	imidazol-1-il	H	454,4
700	3-cloro-4-fluorofenilo	2-fluorofenilo	CH ₂ N(Me) ₂	H	445,2
702	3-cloro-4-fluorofenilo	2-fluorofenilo	N(Me) ₂	H	431,31

R ^{1a} , R ^{1b} y R ¹⁴ son H					
Comp	Z ¹	Z ²	A	R ^{3e}	p.f. (°C) o AP+ (M+1)
704	3-cloro-4-fluorofenilo	2-fluorofenilo	NHC(O)NH ₂	H	196-198°C
706	3,4-diclorofenilo	2-fluorofenilo	NHC(O)NH ₂	H	214-216°C
707	3,4-diclorofenilo	2-fluorofenilo	CH ₂ N(Me) ₂	H	460,97
708	3,4-diclorofenilo	2-fluorofenilo	N(Me) ₂	H	447,1
710	3-cloro-4-fluorofenilo	2-fluorofenilo	ciano	ciano	438,3
717	4-clorofenilo	2-fluorofenilo	CH ₂ Br	H	463
718	4-clorofenilo	2-fluorofenilo	CH ₂ OCH ₃	H	415
719	4-clorofenilo	2-fluorofenilo	C(O)NHNH ₂	H	428,4
720	4-clorofenilo	2-fluorofenilo	1,3,4-oxadiazol-2-il	H	438,3
721	4-clorofenilo	2-fluorofenilo	5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il	H	452,4
727	4-clorofenilo	2-fluorofenilo	5-CF ₃ -pirazol-1-il	H	518
729	2,3,4-trifluorofenilo	2-fluorofenilo	NHC(O)Me	H	505,2
730	2,3,4-trifluorofenilo	2-fluorofenilo	ciano	H	415,3
736	4-(trifluorometoxi)fenilo	2,4-difluorofenilo	1,2,4-triazol-4-il	H	505,3
737	3-cloro-4-fluorofenilo	2-fluorofenilo	1,2,4-triazol-4-il	H	455,3
738	4-clorofenilo	2,4,6-trifluorofenilo	1,2,4-triazol-4-il	H	473,3
742	4-clorofenilo	2-fluorofenilo	3-CH ₃ -1,2,4-oxadiazol-5-il	H	452,4
743	4-clorofenilo	2-fluorofenilo	2-oxo-1,3-oxazolidin-3-il	H	455,3
744	3-cloro-4-fluorofenilo	2-fluorofenilo	2-oxo-1,3-oxazolidin-3-il	H	473,4
745	4-clorofenilo	2,4,6-trifluorofenilo	2-oxo-1,3-oxazolidin-3-il	H	491,4
746	4-clorofenilo	2-fluorofenilo	piridin-4-il	H	446,7
747	3-cloro-4-fluorofenilo	2-fluorofenilo	piridin-4-il	H	464,6
748	4-clorofenilo	2,4,6-trifluorofenilo	piridin-4-il	H	483
755	4-clorofenilo	fenilo	ciano	H	377,3
765	4-clorofenilo	2-cianofenilo	ciano	H	402,4
767	4-bromofenilo	2-fluorofenilo	C(O)NHNH ₂	H	474,3
768	4-bromofenilo	2-fluorofenilo	1,3,4-oxadiazol-2-il	H	484,3
769	4-bromofenilo	2-fluorofenilo	5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il	H	498,3
770	4-bromofenilo	2,4,6-trifluorofenilo	ciano	H	475,2
771	4-bromofenilo	2,4-difluorofenilo	ciano	H	457,2
772	4-clorofenilo	fenilo	CO ₂ Me	H	410,4
773	4-bromofenilo	2,4-difluorofenilo	CO ₂ Me	H	490,2
774	4-bromofenilo	2,4,6-trifluorofenilo	CO ₂ Me	H	508,3
778	2'-fluoro[1,1'-bifenil]-4-il	2,4,6-trifluorofenilo	ciano	H	491,4

R ^{1a} , R ^{1b} y R ¹⁴ son H					
Comp	Z ¹	Z ²	A	R ^{3e}	p.f. (°C) o AP+ (M+1)
779	3'-fluoro[1,1'-bifenil]-4-il	2,4,6-trifluorofenilo	ciano	H	491,3
780	4'-fluoro[1,1'-bifenil]-4-il	2,4,6-trifluorofenilo	ciano	H	491,3
784	2'-fluoro[1,1'-bifenil]-4-il	2,4-difluorofenilo	ciano	H	473,4
785	3'-fluoro[1,1'-bifenil]-4-il	2,4-difluorofenilo	ciano	H	473,4
786	4'-fluoro[1,1'-bifenil]-4-il	2,4-difluorofenilo	ciano	H	473,4
787	4-clorofenilo	fenilo	C(O)NHNH ₂	H	410,4
788	4-bromofenilo	2,4-difluorofenilo	C(O)NHNH ₂	H	492,2
789	3-cloro-4-fluorofenilo	2-fluorofenilo	C(O)NHNH ₂	H	446,3
790	4-(trifluorometoxi)fenilo	2-fluorofenilo	C(O)NHNH ₂	H	478,3
791	3,4-diclorofenilo	2-fluorofenilo	C(O)NHNH ₂	H	462,3
792	4-clorofenilo	fenilo	5-oxo-1,3,4-oxadiazol-2-il	H	436,3
793	4-clorofenilo	2,4,6-trifluorofenilo	5-oxo-1,3,4-oxadiazol-2-il	H	490,2
794	5-cloropiridin-2-il	2,4-difluorofenilo	5-oxo-1,3,4-oxadiazol-2-il	H	473,3
795	4-clorofenilo	2-fluorofenilo	5-oxo-1,3,4-oxadiazol-2-il	H	454,3
798	4-clorofenilo	fenilo	1,3,4-oxadiazol-2-il	H	420,3
799	4-bromofenilo	2,4-difluorofenilo	1,3,4-oxadiazol-2-il	H	502,3
800	3-cloro-4-fluorofenilo	2-fluorofenilo	1,3,4-oxadiazol-2-il	H	456,3
801	4-(trifluorometoxi)fenilo	2-fluorofenilo	1,3,4-oxadiazol-2-il	H	488,3
802	3,4-diclorofenilo	2-fluorofenilo	1,3,4-oxadiazol-2-il	H	472,3
803	4-(trifluorometoxi)fenilo	2,6-difluorofenilo	1,3,4-oxadiazol-2-il	H	506,4
804	3-bromofenilo	2-fluorofenilo	1,3,4-oxadiazol-2-il	H	484,2
805	3-(trifluorometil)fenilo	2-fluorofenilo	1,3,4-oxadiazol-2-il	H	472,4
806	5-cloropiridin-2-il	2,4,6-trifluorofenilo	ciano	H	432,4
807	5-cloropiridin-2-il	2-fluorofenilo	ciano	H	396,4
808	4-isopropilfenil	2-fluorofenilo	ciano	H	403,5
809	4-clorofenilo	fenilo	ciano	H	376,4
810	4-clorofenilo	2,4,6-trifluorofenilo	ciano	H	430,3
811	4-bromofenilo	2,4,6-trifluorofenilo	ciano	H	474,2
812	4-clorofenilo	piridin-2-il	ciano	H	378,4
814	4-clorofenilo	piridin-2-il	NHC(O)Me	H	410,4
815	quinolin-2-il	2-fluorofenilo	ciano	H	412,4
816	quinolin-2-il	2,4-difluorofenilo	ciano	H	430,4
817	3'-(trifluorometil)[1,1'-bifenil]-3-il	2-fluorofenilo	ciano	H	505,8
818	2'-(trifluorometil)[1,1'-bifenil]-3-il	2-fluorofenilo	ciano	H	505,3

R ^{1a} , R ^{1b} y R ¹⁴ son H					
Comp	Z ¹	Z ²	A	R ^{3e}	p.f. (°C) o AP+ (M+1)
819	4'-(trifluorometil)[1,1'-bifenil]-3-il	2-fluorofenilo	ciano	H	505,2
822	4-clorofenilo	2-fluorofenilo	1,3-oxazol-5-il	H	437,4
823	4-clorofenilo	2-fluorofenilo	4,5-dihidro-1,3-oxazol-2-il	H	439,4
824	3,5-difluorofenilo	2,4,6-trifluorofenilo	ciano	H	433,3
825	4-clorofenilo	2,4-difluorofenilo	CO ₂ Me	Me	460,4
826	5-cloropiridin-2-il	2,4-difluorofenilo	CO ₂ Me	Me	461,4
827	4-clorofenilo	piridin-2-il	1,2,4-oxadiazol-3-il	H	421,4
828	4-bromofenilo	2,4,6-trifluorofenilo	1,2,4-oxadiazol-3-il	H	518,4
829	5-cloropiridin-2-il	2-fluorofenilo	1,2,4-oxadiazol-3-il		439,4
830	4-clorofenilo	2-fluorofenilo	1,2,4-oxadiazol-3-il		438,4
831	4-clorofenilo	2-fluorofenilo	1,2,4-triazol-3-il	H	437,4
832	4-clorofenilo	2-fluorofenilo	C(O)CH ₃	H	412,4
834	4-clorofenilo	2-fluorofenilo	4-metil-4 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-il	H	451,4
835	5-cloropiridin-2-il	2,4-difluorofenilo	4-metil-4 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-il	H	470,4
836	4-bromofenilo	2,4,6-trifluorofenilo	4-metil-4 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-il	H	531,3
837	3-cloro-4-fluorofenilo	2,6-difluorofenilo	4-metil-4 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-il	H	487,3
838	4-clorofenilo	2-fluorofenilo	1 <i>H</i> -tetrazol-5-il	H	438,3
839	5-cloropiridin-2-il	2,4-difluorofenilo	1 <i>H</i> -tetrazol-5-il	H	457,4
840	4-bromofenilo	2,4,6-trifluorofenilo	1 <i>H</i> -tetrazol-5-il	H	518,3
841	3-cloro-4-fluorofenilo	2,6-difluorofenilo	1 <i>H</i> -tetrazol-5-il	H	474,3
846	4-clorofenilo	2,3,4,5,6-tetrafluorofenilo	ciano	H	467,3
847	4-clorofenilo	2-bromo-4-fluorofenilo	ciano	H	473,2
848	4-clorofenilo	2,3-difluorofenilo	ciano	H	413,3
849	4-clorofenilo	2,4,5-trifluorofenilo	ciano	H	431,3
850	4-clorofenilo	5-cloro-2-metoxifenilo	ciano	H	441,3
851	4-clorofenilo	2-cloro-6-fluorofenilo	ciano	H	429,3
852	4-clorofenilo	5-fluoro-2-metoxifenilo	ciano	H	425,4
853	4-clorofenilo	2,5-difluorofenilo	ciano	H	413,3
854	4-clorofenilo	2,6-difluoro-3-metilfenilo	ciano	H	427,3
855	4-clorofenilo	2,3,6-trifluorofenilo	ciano	H	431,3
856	4-clorofenilo	4-fluoro-2-metoxifenilo	ciano	H	425,4
857	quinoxalin-2-il	2-fluorofenilo	ciano	H	413,4
858	quinolin-6-il	2-fluorofenilo	ciano	H	412,4

R ^{1a} , R ^{1b} y R ¹⁴ son H					
Comp	Z ¹	Z ²	A	R ^{3e}	p.f. (°C) o AP+ (M+1)
860	4-clorofenilo	2-fluorofenilo	tiazol-2-il	H	453
861	4-clorofenilo	2-fluorofenilo	isoxazol-5-il	H	437,4
862	3,4-diclorofenilo	2-fluorofenilo	isoxazol-5-il	H	471,3
863	3,5-dicloropiridin-2-il	4-fluorofenilo	ciano	H	430,3
864	2,3-dibromopiridin-5-il	4-fluorofenilo	ciano	H	520,2
865	4-fenoxifenilo	2-fluorofenilo	ciano	H	453,5
866	4-(4-clorofenoxi)fenilo	2-fluorofenilo	ciano	H	487,4
867	5-cloro-3-fluoropiridin-2-il	2-fluorofenilo	ciano	H	414,4
868	5-cloropiridin-2-il	2-fluorofenilo	1,3,4-oxadiazol-2-il	H	439,4
877	4-(2,2,2-trifluoroetoxi)fenilo	2-fluorofenilo	ciano	H	459,4
878	6-cloropiridin-2-il	2-fluorofenilo	ciano	H	396,4
879	5-cloropiridin-2-il	2,4,6-trifluorofenilo	pirimidin-2-il	H	485,4
880	4-clorofenilo	2,4,6-trifluorofenilo	pirimidin-2-il	H	484,4
881	5-bromopiridin-2-il	2-fluorofenilo	pirimidin-2-il	H	493,4
882	5-cloro-6-fluoropiridin-2-il	2-fluorofenilo	ciano	H	414,4
883	5-bromo-6-fluoropiridin-2-il	2,4,6-trifluorofenilo	ciano	H	494,3
884	1,3-benzodioxol-5-il	2-fluorofenilo	ciano	H	405,2
885	4-clorofenilo	2-fluorofenilo	pirimidin-5-il	H	448,5
886	4-clorofenilo	2-metoxifenilo	ciano	H	407,3
887	2-cloropiridin-4-il	2,4,6-trifluorofenilo	ciano	H	432,4
888	4-clorofenilo	2-fluoro-4-metoxifenilo	ciano	H	425,4
889	4-clorofenilo	2,6-difluoro-4-metoxifenilo	ciano	H	443,4
890	4-clorofenilo	4-metoxifenilo	ciano	H	407,2
891	5-cloropiridin-2-il	2,6-difluorofenilo	ciano	H	414
893	5-bromopiridin-2-il	2,6-difluorofenilo	ciano	H	458,4
895	5-cloropiridin-2-il	4-fluorofenilo	ciano	H	396,2
897	5-bromopiridin-2-il	4-fluorofenilo	ciano	H	440,4
899	5-bromopiridin-2-il	2,4,6-trifluorofenilo	ciano	H	476,4
904	3,4-diclorofenilo	fenilo	ciano	H	411,4
905	5-fluoropiridin-2-il	4-fluorofenilo	ciano	H	380,3
907	3,4-diclorofenilo	4-fluorofenilo	NHC(O)Me	H	461,5
908	3,4-diclorofenilo	fenilo	NHC(O)Me	H	443,4
909	5-cloropiridin-2-il	4-fluorofenilo	NHC(O)Me	H	428,5
924	3-cloro-4-fluorofenilo	2,4,6-trifluorofenilo	ciano	H	449,5
927	4-(trifluorometil)piridin-2-il	4-fluorofenilo	ciano	H	430,5
928	4-(trifluorometil)piridin-2-il	4-fluorofenilo	NHC(O)Me	H	462,5
930	6-(trifluorometil)piridin-2-il	4-fluorofenilo	ciano	H	430,4

R ^{1a} , R ^{1b} y R ¹⁴ son H					
Comp	Z ¹	Z ²	A	R ^{3e}	p.f. (°C) o AP+ (M+1)
932	3-cloro-4-fluorofenilo	2,4,6-trifluorofenilo	CO ₂ Me	H	482,5
933	3,4-diclorofenilo	1 <i>H</i> -1,2,3-triazol-4-il	ciano	H	402,1
937	3-cloro-4-fluorofenilo	2,4,6-trifluorofenilo	1,3,4-oxadiazol-2-il	H	492,5
938	3,4-diclorofenilo	4-fluorofenilo	1,3,4-oxadiazol-2-il	H	472,5
939	6-cloropiridin-2-il	4-fluorofenilo	ciano	H	396,5
941	6-cloropiridin-2-il	4-fluorofenilo	NHC(O)Me	H	428,5

Véase la Tabla Índice F para los datos de RMN H¹.
* 1-BZT significa 1-benzotriazol

TABLA ÍNDICE A1

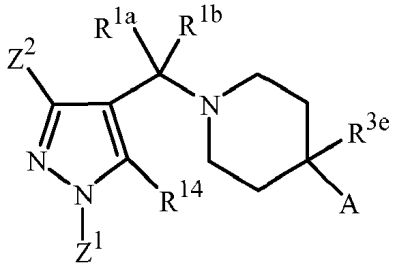
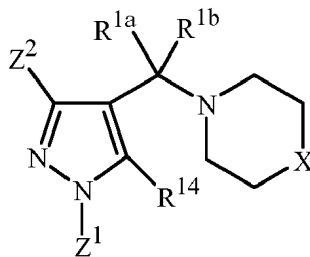
						
R ^{1a} y R ¹⁴ son H						
Comp	Z ¹	Z ²	R ^{1b}	A	R ^{3e}	p.f. (°C) o AP+ (M+1)
545	3-(trifluorometil)fenilo	2-fluorofenilo	ciano	NHC(O)Me	H	193-195°C
590	3-(trifluorometil)fenilo	4-fluorofenilo	ciano	CN	H	127-129°C
635	3-(trifluorometil)fenilo	4-fluorofenilo	Me	NHC(O)Me	H	185-187°C
636	3-(trifluorometil)fenilo	2-fluorofenilo	Me	CO ₂ Me	H	124-125°C
655	3-(trifluorometil)fenilo	2-fluorofenilo	Me	CN	H	95-97°C
656	3-(trifluorometil)fenilo	4-fluorofenilo	Me	CO ₂ Me	H	165-166°C
658	3-(trifluorometil)fenilo	4-fluorofenilo	Me	CN	H	157-160°C
659	3-(trifluorometil)fenilo	2-fluorofenilo	Me	NHC(O)Me	H	110-113°C
701	3-cloro-4-fluorofenilo	2-fluorofenilo	Me	CN	H	264-268°C
703	3-cloro-4-fluorofenilo	2-fluorofenilo	Me	NHC(O)Me	H	459,2
709	3-cloro-4-fluorofenilo	2-fluorofenilo	Me	CO ₂ Me	H	460,2

TABLA ÍNDICE B



R^{1a}, R^{1b} y R¹⁴ son H

Comp	Z ¹	Z ²	X	AP+ (M+1)
501	3-clorofenilo	2-fluorofenilo	C(-OCH ₂ CH ₂ O-)	429.7
502	3-clorofenilo	3-fluorofenilo	C(-OCH ₂ CH ₂ O-)	429.7
503	3-clorofenilo	4-fluorofenilo	C(-OCH ₂ CH ₂ O-)	428.7
504	4-(trifluorometoxi)fenilo	2-fluorofenilo	C(-OC(O)NHCH ₂ -)	492.2
598	4-clorofenilo	2-fluorofenilo	C(-OC(O)CH ₂ CH ₂ -)	440
599	3,4-diclorofenilo	2-fluorofenilo	C(-OC(O)NHCH ₂ -)	476
600	3,4-diclorofenilo	2-fluorofenilo	C(-CH ₂ C(O)NHCH ₂ -)	474
601	3,4-diclorofenilo	2-fluorofenilo	C(-OC(O)CH ₂ CH ₂ -)	475
611	4-clorofenilo	2-fluorofenilo	C(-CH ₂ C(O)NHCH ₂ -)	439
612	4-clorofenilo	2-fluorofenilo	C(-OC(O)NHCH ₂ -)	441
622	4-clorofenilo	2-fluorofenilo	C(-CH ₂ CH(CN))CH ₂ -)	435
623	4-clorofenilo	2-fluorofenilo	C(-O CH ₂ CH ₂ CH ₂ -)	426
624	4-clorofenilo	2-fluorofenilo	C(-CH ₂ OCH ₂ -)	412
683	4-clorofenilo	2-fluorofenilo	C(-C(O)NHC(O)NH-)	454.3
684	4-(trifluorometoxi)fenilo	2,4-difluorofenilo	C(-C(O)NHC(O)NH-)	522.3
685	3-cloro-4-fluorofenilo	2,6-difluorofenilo	C(-C(O)NHC(O)NH-)	490.3
705	4-clorofenilo	2-fluorofenilo	C(-C(O)OCH ₂ CH ₂ -)	440
711	3-cloro-4-fluorofenilo	2-fluorofenilo	C[-CH ₂ N(C(O)OC(Me) ₃)CH ₂ -]	529.4
712	4-clorofenilo	2-fluorofenilo	C[-CH ₂ N(C(O)OC(Me) ₃)CH ₂ -]	511.4
713	3,4-difluorofenilo	2-clorofenilo	C[-CH ₂ N(C(O)OC(Me) ₃)CH ₂ -]	529.4
775	4-clorofenilo	fenilo	C(-CH ₂ CH ₂ C(O)NH-)	421.4
776	3-cloro-4-fluorofenilo	2-fluorofenilo	C(-CH ₂ CH ₂ C(O)NH-)	457.3
777	4-clorofenilo	2,4,6-trifluorofenilo	C(-CH ₂ CH ₂ C(O)NH-)	475.3

TABLA ÍNDICE D

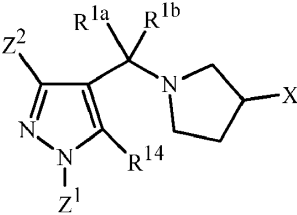
				
R ^{1a} , R ^{1b} y R ¹⁴ son H				
Comp	Z ¹	Z ²	X	AP+ (M+1)
869*	3,4-diclorofenilo	4-fluorofenilo	(S)-NHC(O)-c-Pr	473.1
* no reivindicado				

TABLA ÍNDICE E

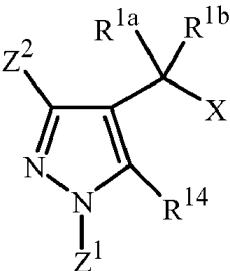
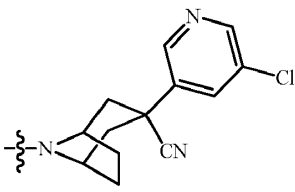
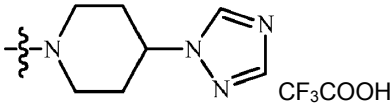
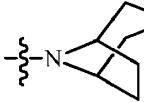
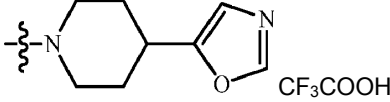
				
R ^{1a} , R ^{1b} y R ¹⁴ son H				
Comp	Z ¹	Z ²	X	p.f. (°C) o AP+ (M+1)
529	3,4-diclorofenilo	2-fluorofenilo		566,4
619	4-fluorofenilo	2-fluorofenilo		421,5
689	4-clorofenilo	2-fluorofenilo		421,4
796	4-clorofenilo	2-fluorofenilo		505,3

TABLA ÍNDICE F

Núm Comp.	Datos RMN H ¹ ^a
78	δ 8,66 (s, 1H), 8,58 (s, 1H), 8,15 (d, 1H), 8,02 (dd, 1H), 7,61 (dt, 1H), 7,42 (dq, 1H), 7,24 (t, 1H), 7,17 (t, 1H), 3,50 (s, 2H), 2,63 (m, 2H), 2,56 (m, 1H), 2,28 (m, 2H), 1,80-1,84 (m, 2H), 1,70-1,76 (m, 2H),

^a Los datos de RMN H¹ están en ppm bajo campo de tetrametilsilano. Solución CDCl₃ a menos que se indique lo contrario. Los acoplamiento se designan por (s) singlete, (d) doblete, (t) triplete, (m) multiplete, (dd) doblete de dobletes, (dt) doblete de tripletes, (dc) doblete de cuartetos, (br s) singlete ancho.

Los siguientes Ensayos demuestran la eficacia de control de los compuestos de esta invención sobre plagas específicas. La "eficacia del control" representa la inhibición del desarrollo de plagas de invertebrados (incluida la mortalidad) que causa una alimentación significativamente reducida. La protección contra el control de plagas proporcionada por los compuestos no está limitada, sin embargo, a estas especies. Los números de compuestos se refieren a los compuestos en las tablas de índice A-E.

Ejemplos biológicos de la invención

Ensayo A

Para evaluar el control de la polilla de dorso de diamante (*Plutella xylostella*), la unidad de ensayo consistió en un pequeño contenedor abierto con una planta de rábano de 12-14 días de edad en el interior. Esto se preinfestó con ~ 50 larvas recién nacidas que se dispensaron en la unidad de ensayo a través de granos de mazorca de maíz utilizando un inoculador de bazooka. Las larvas se trasladaron a la planta de ensayo después de ser dispensadas a la unidad de ensayo.

Los compuestos de ensayo se formularon utilizando una solución que contiene 10% de acetona, 90% de agua y 300 ppm de tensioactivo no iónico X-77® Spreader Lo-Foam Formula que contenía alquil-aril-polioxietileno, ácidos grasos libres, glicoles e isopropanol (Loveland Industries, Inc. Greeley, Colorado, USA). Los compuestos formulados se aplicaron en 1 ml de líquido a través de una boquilla atomizadora SUJ2 con cuerpo personalizado 1/8 JJ (Spraying Systems Co., Wheaton, Illinois, USA) Colocado a 1,27 cm (0,5 pulgadas) por encima de la parte superior de cada unidad de ensayo. Los compuestos de ensayo se pulverizaron a 250 ppm y/o 50 ppm y se repitieron tres veces. Después de la pulverización del compuesto de ensayo formulado, se dejó que cada unidad de ensayo se secase durante 1 hora y después se colocó una tapa de rejilla de color negro en la parte superior. Las unidades de ensayo se mantuvieron durante 6 días en una cámara de crecimiento a 25°C y 70% de humedad relativa. El daño por alimentación de la planta fue evaluado visualmente basándose en el follaje consumido.

De los compuestos de Fórmula 1 sometidos a ensayo a 250 ppm, los siguientes proporcionaron niveles de eficacia de control de muy buenos a excelentes (40% o menos de daño por alimentación y/o 100% de mortalidad): 3, 4, 7, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 16, 17, 19, 20, 21, 22, 24, 25, 26, 27, 28, 29, 30, 31, 32, 33, 34, 39, 40, 41, 42, 43, 44, 45, 46, 47, 48, 49, 50, 51, 52, 53, 54, 55, 56, 57, 58, 59, 62, 63, 64, 65, 66, 67, 68, 69, 70, 71, 72, 73, 74, 75, 76, 77, 79, 80, 81, 82, 83, 84, 85, 86, 103, 301, 302, 303, 310, 508 y 510.

De los compuestos de Fórmula 1 sometidos a ensayo a 50 ppm, los siguientes proporcionaron niveles de eficacia de control de muy buenos a excelentes (40% o menos de daño por alimentación y/o 100% de mortalidad): 4, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 19, 22, 24, 26, 28, 29, 30, 31, 32, 33, 39, 40, 41, 42, 43, 44, 45, 46, 47, 48, 49, 50, 51, 52, 53, 54, 55, 56, 57, 58, 59, 62, 63, 64, 65, 66, 67, 68, 69, 71, 72, 74, 75, 76, 77, 78, 79, 80, 81, 82, 83, 84, 86, 87, 88, 91, 94, 95, 96, 97, 98, 99, 102, 105, 106, 107, 108, 109, 112, 114, 116, 117, 118, 121, 124, 129, 130, 131, 132, 133, 134, 135, 301, 309, 315, 508, 510, 511, 512, 516, 517, 519, 520, 521, 522, 523, 530, 531, 534, 535, 539, 546, 547, 549, 550, 551, 553, 556, 560, 562, 566, 572, 581, 583, 602, 629, 632, 633, 634, 648, 649, 650, 652, 654, 768, 769, 770, 771, 772, 773, 774, 775, 776, 777, 778, 780, 784, 785, 786, 792, 793, 794, 795, 796, 798, 799, 800, 801, 802, 803, 804, 805, 806, 807, 808, 809, 810, 811, 812, 815, 816, 822, 824, 825, 826, 827, 829, 830, 831, 832, 835, 839, 847, 848, 849, 851, 852, 854, 855, 856, 857, 858, 860, 861, 862, 863, 867, 868, 875, 876, 877, 878, 879, 880, 881, 884, 885, 886, 887, 889, 891, 893, 895, 897 y 899.

Ensayo B

Para evaluar el control del gusano cogollero (*Spodoptera frugiperda*), la unidad de ensayo consistió en un pequeño recipiente abierto con una planta de maíz (maíz) de 4-5 días de edad. Esta se preinfestó (utilizando un muestreador central) con 10-15 larvas de 1 día de vida sobre un trozo de dieta de insecto.

Los compuestos de ensayo se formularon y se pulverizaron a 250 ppm y/o 50 ppm como se ha descrito para el Ensayo A. Las aplicaciones se repitieron tres veces. Después de la pulverización, las unidades de ensayo se mantuvieron en una cámara de crecimiento a 25°C y una humedad relativa del 70% y después se evaluaron visualmente como se describió para el Ensayo A.

De los compuestos de Fórmula 1 sometidos a Ensayo a 250 ppm, los siguientes proporcionaron niveles de eficacia de control de muy buenos a excelentes (40% o menos de daño por alimentación y/o 100% de mortalidad): 4, 13, 14, 57, 82, 83, 84, 85, 86, 559, 563, 567, 571, 577, 579, 585, 586, 587, 591, 594, 601, 604, 606, 608, 609, 613, 619, 620, 621, 622, 624, 676, 691, 694, 695, 696, 705, 720, 721, 726, 727, 730, 742, 745, 746, 747, 748, 754, 755, 768, 769, 770, 771, 773, 774, 776, 778, 780 y 796.

De los compuestos de Fórmula 1 sometidos a Ensayo a 50 ppm, los siguientes proporcionaron niveles de eficacia de control de muy buenos a excelentes (40% o menos de daño por alimentación y/o 100% de mortalidad): 10, 12, 14, 33, 40, 41, 42, 48, 49, 51, 53, 56, 57, 63, 65, 66, 71, 77, 78, 79, 83, 86, 87, 91, 94, 115, 118, 121, 129, 131, 133, 134, 517, 520, 521, 523, 530, 534, 544, 546, 550, 556, 559, 563, 566, 567, 571, 572, 577, 581, 583, 587, 594, 602, 604, 606, 608, 613, 629, 632, 633, 650, 652, 654, 676, 705, 720, 721, 742, 748, 754, 755, 768, 769, 770, 771, 777, 778, 780, 784, 785, 786, 794, 798, 799, 800, 801, 802, 803, 804, 805, 806, 807, 809, 810, 811, 815, 822, 824, 825,

826, 829, 847, 848, 849, 851, 854, 855, 857, 858, 860, 861, 862, 868, 875, 876, 878, 879, 880, 884, 885, 886, 888, 889, 891, 893, 895, 897 y 899.

Ensayo C

5 Para evaluar el control del áfido verde del melocotonero (*Myzus persicae*) a través de medios de contacto y/o sistémicos, la unidad de ensayo consistió en un pequeño recipiente abierto con una planta de rábano de 12-15 días de edad en el interior. Esta se pre-infestó colocando sobre una hoja de la planta de ensayo 30-40 áfidos en un trozo de hoja extirpada de una planta de cultivo (método de hojas cortadas). Los áfidos se trasladaron a la planta de ensayo cuando la hoja se secó. Después de la pre-infestación, el suelo de la unidad de ensayo se cubrió con una capa de arena.

10 Los compuestos de ensayo se formularon y se pulverizaron a 250 ppm y/o 50 ppm como se describió para el Ensayo A. Las aplicaciones se repitieron tres veces. Después de la pulverización del compuesto de ensayo formulado, se dejó que cada unidad de ensayo se secase durante 1 hora y después se colocó una tapa de rejilla de color negro en la parte superior. Las unidades de ensayo se mantuvieron durante 6 días en una cámara de crecimiento a 19-21°C y 50-70% de humedad relativa. Cada unidad de ensayo se evaluó visualmente para determinar la mortalidad de insectos.

15 De los compuestos de Fórmula 1 sometidos a ensayo a 250 ppm, los siguientes dieron como resultado al menos 80% de mortalidad: 3, 41, 63, 77, 79, 86, 88, 94, 131, 132, 512, 521, 522, 523, 529, 531, 546, 556, 567, 581, 587, 602, 613, 629, 650, 720, 748, 770, 784, 806, 807, 810, 825, 826, 830, 861 y 880.

20 De los compuestos de Fórmula 1 sometidos a ensayo a 50 ppm, los siguientes dieron como resultado al menos 80% de mortalidad: 806.

Ensayo D

25 Para evaluar el control del áfido del algodón (*Aphis gossypii*) a través de medios de contacto y/o sistémicos, la unidad de ensayo consistió en un pequeño recipiente abierto con una planta de algodón de 6-7 días de edad en el interior. Esta se pre-infestó con 30-40 insectos sobre un trozo de una hoja de acuerdo con el método de hojas cortadas descrito para el Ensayo C, y el suelo de la unidad de ensayo se cubrió con una capa de arena.

Los compuestos de ensayo se formularon y se pulverizaron a 250 ppm como se ha descrito para el Ensayo C. Las aplicaciones se repitieron tres veces. Después de la pulverización, las unidades de ensayo se mantuvieron en una cámara de crecimiento y después se evaluaron visualmente como se ha descrito para el Ensayo C.

30 De los compuestos de Fórmula 1 sometidos a ensayo a 250 ppm, los siguientes dieron como resultado al menos 80% de mortalidad: 529 y 806.

Ensayo E

35 Para evaluar el control de la chicharrita de maíz (*Peregrinus maidis*) a través de medios de contacto y/o sistémicos, la unidad de ensayo consistió en un pequeño recipiente abierto con una planta de maíz de 3-4 días de edad (espiga) en el interior. Se añadió arena blanca a la parte superior del suelo antes de la aplicación. Los compuestos de ensayo se formularon y pulverizaron a 250 ppm, y se repitieron tres veces como se ha descrito para el Ensayo A. Después de pulverizar, las unidades de ensayo se dejaron secar durante 1 h antes de que se post-infestaran con 15-20 ninfas (18 a 21 días de edad) rociándolas sobre la arena con un salero. Se colocó una tapa de rejilla de color negro en la parte superior de cada unidad de ensayo, y las unidades de ensayo se mantuvieron durante 6 días en una cámara de crecimiento a 22-24°C y 50-70% de humedad relativa. Cada unidad de ensayo se evaluó visualmente después para determinar la mortalidad de los insectos.

40 De los compuestos de Fórmula 1 sometidos a ensayo a 250 ppm, los siguientes proporcionaron niveles de eficacia de control de muy buenos a excelentes (80% o más de mortalidad): 64, 66, 742, 863, 880 y 881.

Ensayo F

45 Para evaluar el control del saltahoja de la patata (*Empoasca fabae*) a través de medios de contacto y/o sistémicos, la unidad de ensayo consistió en un pequeño recipiente abierto con una planta de judía Soleil de 5-6 días de edad (hojas primarias emergidas) en el interior. Se añadió arena blanca a la parte superior del suelo y se cortó una de las hojas primarias antes de la aplicación.

50 Los compuestos de ensayo se formularon y pulverizaron a 250 ppm y/o 50 ppm, y los ensayos se repitieron tres veces como se ha descrito para el Ensayo A. Después de la pulverización, las unidades de ensayo se dejaron secar durante 1 h antes de que fueran post-infestadas con 5 saltahoja de la patata (adultos de 18-21 días de edad). Se colocó una tapa de rejilla de color negro en la parte superior de cada unidad de ensayo, y las unidades de ensayo se mantuvieron durante 6 días en una cámara de crecimiento a 24°C y 70% de humedad relativa. Cada unidad de ensayo se evaluó visualmente después para determinar la mortalidad de los insectos.

5 De los compuestos de Fórmula 1 sometidos a ensayo a 250 ppm, los siguientes proporcionaron niveles de eficacia de control de muy buenos a excelentes (80% o más de mortalidad): 11, 12, 22, 32, 33, 34, 41, 45, 46, 47, 50, 56, 57, 59, 62, 63, 71, 72, 74, 76, 78, 79, 80, 81, 83, 84, 95, 99, 102, 105, 106, 107, 108, 109, 112, 113, 114, 117, 121, 122, 124, 125, 126, 127, 129, 130, 132, 135, 136, 137, 304, 311, 314, 511, 530, 531, 534, 546, 547, 549, 550, 551, 553, 557, 560, 568, 570, 573, 581, 600, 602, 608, 609, 619, 620, 621, 622, 624, 633, 634, 647, 650, 685, 692, 694, 696, 702, 705, 720, 729, 738, 742, 744, 747, 748, 754, 768, 770, 774, 793, 794, 800, 801, 802, 803, 804, 805, 806, 810, 824, 829, 837, 862, 868, 875, 876, 879, 880, 891 y 893.

10 De los compuestos de Fórmula 1 sometidos a ensayo a 50 ppm, los siguientes proporcionaron niveles de eficacia de control de muy buenos a excelentes (80% o más de mortalidad): 62, 74, 76, 105, 106, 107, 108, 112, 113, 121, 136, 137, 549, 602, 633, 647, 685, 729, 744, 800, 806 y 879.

Ensayo G

Para evaluar el control de trips de las flores occidentales (*Frankliniella occidentalis*) a través de medios de contacto y/o sistémicos, la unidad de ensayo consistió en un pequeño contenedor abierto con una planta de judía Soleil de 5-7 días de edad en el interior.

15 Los compuestos de ensayo se formularon y pulverizaron a 250 y/o 50 ppm, y los ensayos se repitieron tres veces como se ha descrito para el Ensayo A. Después de pulverizar, las unidades de ensayo se dejaron secar durante 1 hora y después se añadieron 22-27 trips adultos a la unidad. Se colocó una tapa de rejilla de color negro en la parte superior de cada unidad de ensayo, y las unidades de ensayo se mantuvieron durante 7 días a 25°C y 45-55% de humedad relativa.

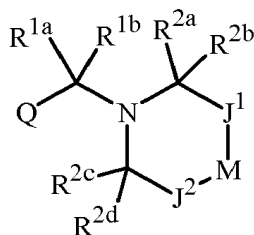
20 De los compuestos de Fórmula 1 sometidos a ensayo a 250 ppm, los siguientes proporcionaron niveles de eficacia de control de muy buenos a excelentes (40% o menos de daño a la planta y/o 100% de mortalidad): 50, 52, 56, 57, 63, 66, 67, 77, 79, 80, 81, 92 y 102.

De los compuestos de Fórmula 1 sometidos a ensayo a 50 ppm, los siguientes proporcionaron niveles de eficacia de control de muy buenos a excelentes (40% o menos de daño a la planta y/o 100% de mortalidad): 86.

25

REIVINDICACIONES

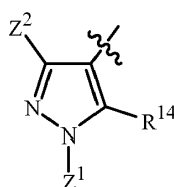
1. Un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido, o una sal del mismo,



1

en donde

- 5 Q es



Q-1 ;

R^{1a} es H, ciano, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, C(O)OH, C(O)R^{5a}, C(O)OR^{6a} o C(O)NR^{7a}R^{8a};

R^{1b} es H o alquilo C₁-C₆;

- 10 R^{2a} y R^{2c} son cada uno independientemente H, halógeno, ciano, C(X)R⁵, C(O)OR⁶, C(X)NR⁷R⁸ o S(O)_nR¹¹; o alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₇, cicloalquil(C₄-C₈)alquilo o cicloalqueno C₃-C₆, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, OR^{12a}, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ y S(O)_nR^{11a};

- 15 R^{2b} y R^{2d} son cada uno independientemente H, halógeno, ciano, nitro, C(X)R⁵, C(O)OR⁶, C(X)NR⁷R⁸, NR⁹R¹⁰, S(O)_nR¹¹ o SO₂NR⁹R¹⁰; o alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₇, cicloalquil(C₄-C₈)alquilo o cicloalqueno C₃-C₆, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, OR^{12a}, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ y S(O)_nR^{11a}; o fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo no sustituido o sustituido con 1 a 3 R⁴;

J^1 es -C(R^{3a}R^{3b})-;

J^2 es -C(R^{3c}R^{3d})-;

- 20 M es -C(R^{3e})(A)-;

- 25 A es halógeno, ciano, nitro, C(X)R⁵, C(O)OR⁶, C(X)NR⁷R⁸, C(X)NR^{7b}R⁸, NR⁹R¹⁰, S(O)_nR¹¹ o SO₂NR⁹R¹⁰; o alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₇, cicloalquil(C₄-C₈)alquilo o cicloalqueno C₃-C₆, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, C(O)R^{5a}, C(O)OR^{6a}, C(O)NR^{7a}R^{8a}, NR^{9a}R^{10a}, OR^{12a} y S(O)_nR^{11a}; o fenilo, un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros o un sistema anular heteroaromático de 7 a 11 miembros, cada anillo o sistema anular no sustituido o sustituido con 1 a 3 R⁴;

- 30 R^{3a} y R^{3c} son cada uno independientemente H, halógeno, ciano, C(X)R⁵, C(O)OR⁶, C(X)NR⁷R⁸, OR¹² o S(O)_nR¹¹; o alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₇, cicloalquil(C₄-C₈)alquilo o cicloalqueno C₃-C₆, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, OR^{12a}, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ y S(O)_nR^{11a};

- 35 R^{3b} y R^{3d} son cada uno independientemente H, halógeno, ciano, nitro, C(X)R⁵, C(O)OR⁶, C(X)NR⁷R⁸, NR⁹R¹⁰, OR¹², S(O)_nR¹¹ o SO₂NR⁹R¹⁰; o alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₇, cicloalquil(C₄-C₈)alquilo o cicloalqueno C₃-C₆, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, OR^{12a}, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ y S(O)_nR^{11a}; o fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo no sustituido o sustituido con 1 a 3 R⁴;

R^{3e} es H, halógeno, ciano, nitro, C(X)R⁵, C(O)OR⁶, C(X)NR⁷R⁸, NR⁹R¹⁰, OR¹², S(O)_nR¹¹ o SO₂NR⁹R¹⁰; o alquilo C₁-

- C₆, alquenido C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₇, cicloalquil(C₄-C₈)alquilo o cicloalquenido C₃-C₆, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, OR^{12a}, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ y S(O)_nR^{11a}; o fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo no sustituido o sustituido con 1 a 3 R⁴; o
- 5 R^{3e} y A pueden tomarse junto con el átomo de carbono al cual están unidos para formar un anillo de 3 a 7 miembros que contiene miembros de anillo seleccionados entre átomos de carbono y hasta 2 heteroátomos independientemente seleccionados entre un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, y hasta 2 átomos de nitrógeno, en donde hasta 2 átomos de carbono miembros de anillo son independientemente seleccionados entre C(=O) y C(=S) y el átomo de azufre miembro de anillo se selecciona entre S, S(O) o S(O)₂, estando dicho anillo no sustituido o sustituido con hasta 4 sustituyentes independientemente seleccionados del grupo que consiste en halógeno, ciano y alquilo C₁-C₄; o
- 10 o cuando dos sustituyentes cualesquiera independientemente seleccionados del grupo que consiste en R^{2a}, R^{2b}, R^{2c}, R^{2d}, R^{3a}, R^{3b}, R^{3c}, R^{3d} y R^{3e} son alquilo C₁-C₄, dichos dos sustituyentes pueden tomarse juntos para formar un anillo;
- Z¹ es fenilo sustituido con 1 a 4 R^{4a}; o Z¹ es un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros o un sistema anular heteroaromático bicíclico de 8 a 10 miembros, cada anillo o sistema anular no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^{4a};
- 15 Z² es fenilo, no sustituido o sustituido con 1 a 4 R^{4b}; o Z² es un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros o un sistema anular heteroaromático bicíclico de 8 a 10 miembros, cada anillo o sistema anular no sustituido o sustituido con 1 a 3 R^{4b};
- cada R⁴, R^{4a} y R^{4b} es independientemente halógeno, ciano, nitro, C(X)R⁵, C(O)OR⁶, C(X)NR⁷R⁸, NR⁹R¹⁰, OR¹², S(O)_nR¹¹ o SO₂NR⁹R¹⁰; o alquilo C₁-C₆, alquenido C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₇ o cicloalquil(C₄-C₈)alquilo, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, OR^{12a}, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ y S(O)_nR^{11a}; o fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo no sustituido o sustituido con 1 a 3 R¹³; siempre que cuando dos grupos R⁴, R^{4a} o R^{4b} están unidos a átomos de carbono adyacentes, dichos dos grupos R⁴, dos R^{4a} o dos R^{4b} pueden tomarse junto con los átomos de carbono a los cuales están unidos para formar un anillo;
- 20 cada R⁵ es independientemente H; o alquilo C₁-C₆, alquenido C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₇ o cicloalquil(C₄-C₈)alquilo, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, OR^{12a}, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ y S(O)_nR^{11a}; o fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo no sustituido o sustituido con 1 a 3 R¹³;
- 25 cada R^{5a} es independientemente alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ o cicloalquilo C₃-C₇;
- 30 cada R⁶ es independientemente alquilo C₁-C₆, alquenido C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₇ o cicloalquil(C₄-C₈)alquilo, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, OR^{12a}, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ y S(O)_nR^{11a}; o fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo no sustituido o sustituido con 1 a 3 R¹³;
- 35 cada R^{6a} es independientemente alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄;
- cada R⁷ y R⁸ es independientemente H; o alquilo C₁-C₆, alquenido C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₇ o cicloalquil(C₄-C₈)alquilo, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, OR^{12a}, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ y S(O)_nR^{11a}; o fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo no sustituido o sustituido con 1 a 3 R¹³; o R⁷ y R⁸ pueden tomarse junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos para formar un anillo de 5, 6 o 7 miembros;
- 40 cada R^{7a} y R^{8a} es independientemente H, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄;
- cada R^{7b} es independientemente N(R^{7a})₂, OH o OR^{12a};
- cada R⁹ y R¹⁰ es independientemente H, C(X)R⁵, C(O)OR⁶ o C(X)NR⁷R⁸; o alquilo C₁-C₆, alquenido C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₇ o cicloalquil(C₄-C₈)alquilo, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, OR^{12a}, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ y S(O)_nR^{11a}; o fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo no sustituido o sustituido con 1 a 3 R¹³; o R⁹ y R¹⁰ pueden tomarse junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos para formar un anillo de 5, 6 o 7 miembros;
- 45 cada R^{9a} y R^{10a} es independientemente H, C(X)R^{5a}, C(O)OR^{6a}, C(X)NR^{7a}R^{8a}, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄;
- 50 cada R¹¹ es independientemente alquilo C₁-C₆, alquenido C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₇ o cicloalquil(C₄-C₈)alquilo, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, OR^{12a}, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ y S(O)_nR^{11a}; o fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo no sustituido o sustituido con 1 a 3 R¹³;

cada R^{11a} es independientemente alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄;

5 cada R¹² es independientemente H; o alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₇ o cicloalquil(C₄-C₈)alquilo, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, OR^{12a}, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ y S(O)_nR^{11a}, o fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo no sustituido o sustituido con 1 a 3 R¹³;

cada R^{12a} es independientemente H, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄;

10 cada R¹³ es independientemente halógeno, ciano, nitro, C(X)R^{5a}, C(O)OR^{6a}, C(X)NR^{7a}R^{8a}, NR^{9a}R^{10a}, OR^{12a}, S(O)_nR^{11a} o SO₂NR^{9a}R^{10a}; o alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₇ o cicloalquil(C₄-C₈)alquilo, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, OR^{12a}, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ y S(O)_nR^{11a}; siempre que cuando dos grupos R¹³ están unidos a átomos de carbono adyacentes, dichos dos grupos R¹³ pueden tomarse junto con los átomos de carbono a los cuales están unidos para formar un anillo;

R¹⁴ es H;

cada X es independientemente O o S; y

15 cada n es independientemente 0, 1 o 2;

siempre que cuando A es C(X)NR⁷R⁸ y X es O, ni R⁷ ni R⁸ son H.

2. El compuesto de la Reivindicación 1 en donde

X es O;

R^{1a} es H; y

20 R^{1b} es H.

3. El compuesto de la Reivindicación 2 en donde

R^{2a}, R^{2b}, R^{2c} y R^{2d} son H;

R^{3e} es H, halógeno o alquilo C₁-C₆; y

25 A es ciano, C(X)R⁵, C(O)OR⁶, C(X)NR⁷R⁸ o NR⁹R¹⁰; o fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo no sustituido o sustituido con 1 a 3 R⁴.

4. El compuesto de la Reivindicación 3 en donde A es ciano, C(O)OR^{6a} o NHC(O)R^{5a}; o un anillo heteroaromático de 5 miembros, no sustituido o sustituido con 1 a 3 R⁴.

5. El compuesto de Fórmula 1 según se describe en la Reivindicación 1 que se selecciona del grupo que consiste en:

30 1-[[3-(4-fluorofenil)-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1*H*-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinacarboxilato de metilo;

1-[[3-(4-fluorofenil)-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1*H*-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinocarbonitrilo;

1-[[1-(3,4-diclorofenil)-3-(4-fluorofenil)-1*H*-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinocarbonitrilo;

1-[[3-(2-fluorofenil)-1-[4-(trifluorometoxi)fenil]-1*H*-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinocarbonitrilo;

1-[[3-(2,4-difluorofenil)-1-[4-(trifluorometoxi)fenil]-1*H*-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinocarbonitrilo;

35 1-[[1-(4-clorofenil)-3-(2-fluorofenil)-1*H*-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinocarbonitrilo;

1-[[1-(3-cloro-4-fluorofenil)-3-(2-fluorofenil)-1*H*-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinocarbonitrilo;

1-[[1-(4-bromofenil)-3-(2-fluorofenil)-1*H*-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinocarbonitrilo;

1-[[3-(2-fluorofenil)-1-[4-(trifluorometil)fenil]-1*H*-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinocarbonitrilo;

1-[[3-(2-fluorofenil)-1-[5-(trifluorometil)-2-piridinilo]-1*H*-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinocarbonitrilo;

40 1-[[3-(2,6-difluorofenil)-1-[4-(trifluorometoxi)fenil]-1*H*-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinocarbonitrilo;

1-[[1-(3-cloro-4-fluorofenil)-3-(2-fluorofenil)-1*H*-pirazol-4-il]metil]-4-(1,3,4-oxadiazol-2-il)piperidina;

- 1-[[1-(3,4-diclorofenil)-3-(2-fluorofenil)-1*H*-pirazol-4-il]metil]-4-(1,3,4-oxadiazol-2-il)piperidina;
- 1-[[1-(5-cloro-2-piridinil)-3-(2,4,6-trifluorofenil)-1*H*-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinocarbonitrilo;
- 1-[[1-(4-clorofenil)-3-(2-fluorofenil)-1*H*-pirazol-4-il]metil]-4-(1,3,4-oxadiazol-2-il)piperidina;
- 1-[[1-(3-cloro-4-fluorofenil)-3-(2-fluorofenil)-1*H*-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinocarbonitrilo;
- 5 1-[[1-(4-cloro-3-fluorofenil)-3-(2-fluorofenil)-1*H*-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinocarbonitrilo;
- 1-[[1-(4-clorofenil)-3-(2-fluorofenil)-1*H*-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinocarbonitrilo;
- 1-[[1-(5-cloro-2-piridinil)-3-(2-fluorofenil)-1*H*-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinocarbonitrilo;
- 1-[[3-(2-fluorofenil)-1-[3-(trifluorometil)fenil]-1*H*-pirazol-4-il]metil]-4-(1,3,4-oxadiazol-2-il)piperidina;
- 1-[[1-(3-bromofenil)-3-(2-fluorofenil)-1*H*-pirazol-4-il]metil]-4-(1,3,4-oxadiazol-2-il)piperidina;
- 10 1-[[1-(5-bromo-2-piridinil)-3-(2-fluorofenil)-1*H*-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinocarbonitrilo;
- 1-[[1-(5-cloro-2-piridinil)-3-(2,4-difluorofenil)-1*H*-pirazol-4-il]metil]-4-piperidinocarbonitrilo; y
- 1-[[3-(2-fluorofenil)-1-[4-(trifluorometoxi)fenil]-1*H*-pirazol-4-il]metil]-4-(1,3,4-oxadiazol-2-il)piperidina.
6. Una composición que comprende un compuesto de Fórmula 1 de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5 y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos.
- 15
7. La composición de la Reivindicación 6 que comprende adicionalmente al menos un compuesto o agente biológicamente activos adicionales.
8. La composición de la Reivindicación 7 en donde al menos un compuesto o agente biológicamente activos adicionales se seleccionan del grupo que consiste en abamectina, acefato, acequinocilo, acetamiprid, acrinatrin, amidoflomet, amitraz, avermectina, azadiractin, azinfos-metilo, benfuracarb, bensultap, bifentrin, bifenazato, bistrifluron, borato, buprofezin, cadusafos, carbaril, carbofuran, cartap, carzol, clorantraniliprol, clorfenapir, clorfluazuron, clorpirifos, clorpirifos-metilo, cromafenocida, clofentezin, clotianidin, ciantraniliprol, cicloprotrin, ciflumetofen, ciflutrin, beta-ciflutrin, cihalotrina, gamma-cihalotrina, lambda-cihalotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, zeta-cipermetrina, ciromacina, deltametrina, diafentiuron, diazinon, dieldrin, diflubenzuron, dimeflutrin, dimehipo, dimetoato, dinotefuran, diofenolan, emamectina, endosulfan, esfenvalerato, etiprol, etofenprox, etoxazol, fenbutatin oxido, fenitrotion, fenotiocarb, fenoxicarb, fenpropatrin, fenvalerato, fipronil, flonicamid, flubendiamida, flucitrinato, flufenerim, flufenoxuron, fluvalinato, tau-fluvalinato, fonofos, formatanato, fostiazato, halofenocida, hexaflumuron, hexitiazox, hidrametilnon, imidacloprid, indoxacarb, jabones insecticidas, isofenfos, lufenuron, malation, meperflutrin, metaflumizona, metaldehido, metamidofos, metidation, metiodicarb, metomilo, metopreno, metoxiclor, metoflutrin, monocrotofos, metoxifenocida, nitenpiram, nitiacina, novaluron, noviflumuron, oxamilo, paration, paration-metilo, permetrina, forato, fosalona, fosmet, fosfamidon, pirimicarb, profenofos, proflutrin, propargita, protrifenbut, pimetrocina, pirafluprol, piretrina, piridaben, piridalilo, pirfluquinazon, piriprol, piriproxifen, rotenona, rianodina, silafluofen, spinetoram, spinosad, espirodiclofen, espiromesifen, espirotetramat, sulprofos, sulfoxaflor, tebufenocida, tebufenpirad, teflutrin, terbufos, tetraclorvinfos, tetrametrina, tetrametilflutrin,
- 20
- 25
- 30
- 35 tiacloprid, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap-sodio, tolfenpirad, tralometrina, triazamato, triclorfon, triflumuron, delta-endotoxinas de *Bacillus thuringiensis*, bacterias entomopatógenas, virus entomopatógenos y hongos entomopatógenos.
9. Un método para controlar una plaga de invertebrados que comprende poner en contacto la plaga de invertebrados o su entorno con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula 1 de acuerdo con una cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 5, con la condición de que método no sea un método de tratamiento del cuerpo humano o animal mediante terapia
- 40
10. Una semilla tratada que comprende un compuesto de Fórmula 1 de acuerdo una cualquiera de las Reivindicaciones 1 a 5 en una cantidad de 0.0001 a 1% en peso de la semilla antes del tratamiento.