

19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 686 044**

51 Int. Cl.:

**A01N 37/52** (2006.01)

**C07C 317/42** (2006.01)

**C07C 323/36** (2006.01)

**C07C 323/44** (2006.01)

**C07C 323/63** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **12.12.2012 PCT/EP2012/075269**

87 Fecha y número de publicación internacional: **27.06.2013 WO13092350**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **12.12.2012 E 12806011 (8)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **06.06.2018 EP 2793578**

54 Título: **Derivados de sulfuro de trifluoroetilo sustituidos con N-arilamidina como acaricidas e insecticidas**

30 Prioridad:

**21.12.2011 EP 11194855**

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

**16.10.2018**

73 Titular/es:

**BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT  
(100.0%)  
Alfred-Nobel-Straße 50  
40789 Monheim, DE**

72 Inventor/es:

**KÖHLER, ADELINE;  
ALIG, BERND;  
BECKER, ANGELA;  
VOERSTE, ARND;  
GÖRGENS, ULRICH;  
FISCHER, REINER;  
MORADI, WAHED AHMED;  
CEREZO-GALVEZ, SILVIA;  
HAHN, JULIA;  
ILG, KERSTIN;  
SCHWARZ, HANS-GEORG;  
GOMIBUCHI, TAKUYA;  
ITO, MASAHITO;  
YAMAZAKI, DAIEI;  
SHIBUYA, KATSUHIKO y  
SHIMOJO, EIICHI**

74 Agente/Representante:

**CARPINTERO LÓPEZ, Mario**

**Observaciones :**

**Véase nota informativa (Remarks, Remarques o Bemerkungen) en el folleto original publicado por la Oficina Europea de Patentes**

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).

ES 2 686 044 T3

## DESCRIPCIÓN

Derivados de sulfuro de trifluoroetilo sustituidos con N-arilamidina como acaricidas e insecticidas

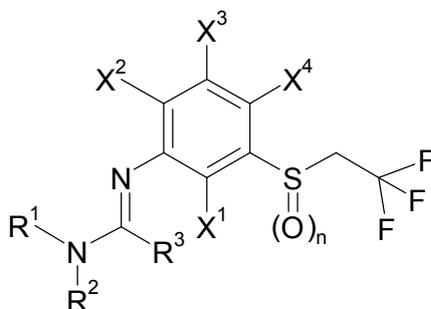
5 La presente invención se refiere a nuevos derivados de sulfuro de trifluoroetilo sustituidos con N-arilamidina, a su uso como acaricidas e insecticidas para combatir plagas animales y a procedimientos e intermedios para su preparación

En la bibliografía, en el documento WO 2007/131680 ya se han descrito diversas N-arilamidinas y su acción insecticida y acaricida.

10 Al aplicarse, los principios activos ya conocidos de las publicaciones citadas antes tienen desventajas, que son que estos pueden tener una actividad insecticida y/o acaricida nula o solamente insuficiente contra plagas animales, en particular, a tasas de aplicación relativamente bajas.

Por consiguiente, un objetivo de la presente invención es proporcionar derivados de sulfuro de trifluoroetilo sustituidos con N-arilamidina que se puedan emplear como insecticidas y/o acaricidas con actividad insecticida y/o acaricida satisfactoria contra plagas animales, en particular, a tasas de aplicación relativamente bajas, con alta selectividad y compatibilidad mejorada en cultivos de plantas útiles.

15 La presente invención proporciona ahora compuestos de la fórmula (I)



(I)

en la que

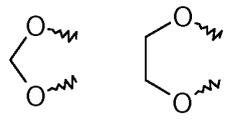
n representa el número 0 o 1,

20 X<sup>1</sup>, X<sup>2</sup>, X<sup>3</sup>, X<sup>4</sup> independientemente unos de otros representan hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alqueno (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alquino (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), aminotiocarbonilo,

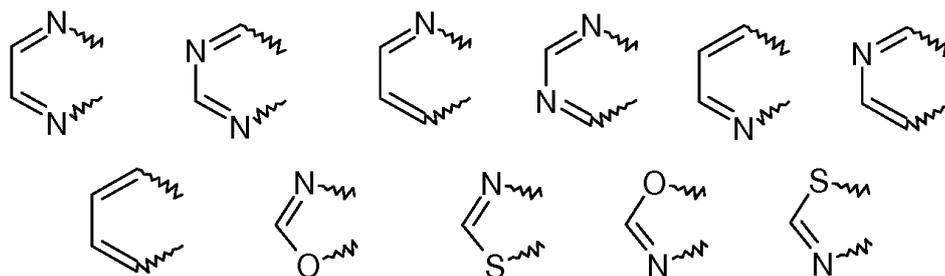
25 o representan fenil-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), fenoxi, hetaril-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), hetariloxi, cicloalquil (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquil (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) opcionalmente saturados o insaturados, opcionalmente mono- o disustituidos con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) o con cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>) opcionalmente saturado o insaturado que está opcionalmente interrumpido por un heteroátomo del grupo constituido por O, S o N,

30 o representan un cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), fenilo, piridilo, pirimidilo, piridazinilo, pirazinilo, triazinilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, oxadiazolilo, pirazolilo, triazolilo o tetrazolilo que está opcionalmente mono- o disustituido con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>),

o X<sup>2</sup> y X<sup>3</sup> o X<sup>3</sup> y X<sup>4</sup> pueden formar el siguiente anillo de 5 o 6 miembros que está opcionalmente mono- a tetrasustituido con flúor o alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>),



35 o X<sup>2</sup> y X<sup>3</sup> o X<sup>3</sup> y X<sup>4</sup> pueden formar los anillos condensados siguientes que están opcionalmente mono- o disustituidos con sustituyentes iguales o distintos, donde los sustituyentes, independientemente unos de otros, se pueden seleccionar del grupo constituido por hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>),



R<sup>3</sup> representa alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), cianoalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>),

5 o representa un anillo de 3 a 6 miembros saturado o parcialmente saturado que puede contener opcionalmente uno a dos heteroátomos del grupo constituido por O, S y N y que está opcionalmente mono- o trisustituido con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquenilo (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alquinilo (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), o sustituido con cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>),

10 o representan un anillo aromático de 3 a 6 miembros que está opcionalmente mono- o trisustituido con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquenilo (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alquinilo (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), o sustituido con cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>),

15 o representan un anillo aromático de 3 a 6 miembros que contiene uno a dos heteroátomos del grupo constituido por O, S y N y que está opcionalmente mono- o trisustituido con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquenilo (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alquinilo (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), o sustituido con cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>),

R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup>, independientemente uno de otro, representan hidrógeno, ciano, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), cianoalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), hidroxialquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquenilo (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alquinilo (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>),

20 o representan alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-carbonilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>)-alcoxicarbonilo, arilcarbonilo, tiofenilcarbonilo, piridilcarbonilo, pirimidilcarbonilo, tiazolilcarbonilo, pirazolilcarbonilo, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-sulfinilo, haloalquil (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-sulfinilo, arilsulfinilo, aril-alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-sulfinilo, hetarilsulfinilo, hetaril-alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-sulfinilo, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-sulfonilo, haloalquil (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-sulfonilo, arilsulfonilo, aril-alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-sulfonilo, hetarilsulfonilo, hetaril-alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-sulfonilo opcionalmente mono- a trisustituidos de forma independiente unos de otros con sustituyentes del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquenilo (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquenilo (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alquinilo (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-tio, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-sulfinilo, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-sulfonilo, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-amino, di-alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-amino,

30 o representan un anillo saturado o aromático de 3 a 6 miembros que puede contener opcionalmente uno a dos heteroátomos del grupo constituido por O, S y N, que puede estar opcionalmente interrumpido una o dos veces por C=O y que está opcionalmente mono- o trisustituido con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquenilo (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alquinilo (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) o cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>),

35 o representan -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-R<sup>6</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-O-R<sup>6</sup>, donde R<sup>6</sup> representa un anillo de 3 a 6 miembros saturado, parcialmente saturado o aromático que puede contener opcionalmente uno a dos heteroátomos del grupo constituido por O, S y N, que puede estar opcionalmente interrumpido una o dos veces por C=O y que está opcionalmente mono- o trisustituido con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquenilo (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alquinilo (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) o cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), donde m representa el número 1 o 2, o

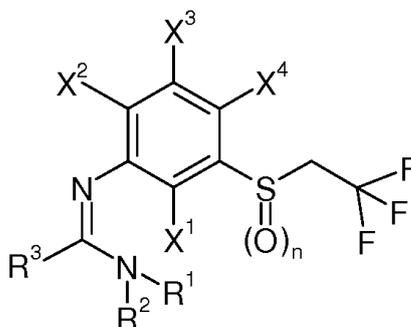
40 R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos pueden formar un anillo de 3 a 6 miembros saturado o insaturado que está opcionalmente mono- o tetrasustituido con flúor, cloro, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) y que puede contener opcionalmente otro heteroátomo del grupo constituido por azufre, oxígeno y nitrógeno y/o al menos un grupo carbonilo, o

45 R<sup>1</sup> y R<sup>3</sup> junto con los átomos a los que están unidos pueden formar un anillo de 5 a 6 miembros saturado o insaturado que está opcionalmente mono- o polisustituido con metilo, etilo, metoxi, etoxi, flúor, cloro, trifluorometilo, ciclopropilo, ciano, clorociclopropilo, fluorociclopropilo, cianociclopropilo, metilciclopropilo, alcanodiilo (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alquenodiilo (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), butanodiilo (donde el butanodiilo puede estar opcionalmente mono- o disustituido con metilo, flúor, cloro, bromo, metoxi o trifluorometilo y/o puede estar opcionalmente interrumpido por al menos un átomo de oxígeno o/y nitrógeno y que contiene otro átomo de azufre u oxígeno o nitrógeno y puede contener un grupo carbonilo.

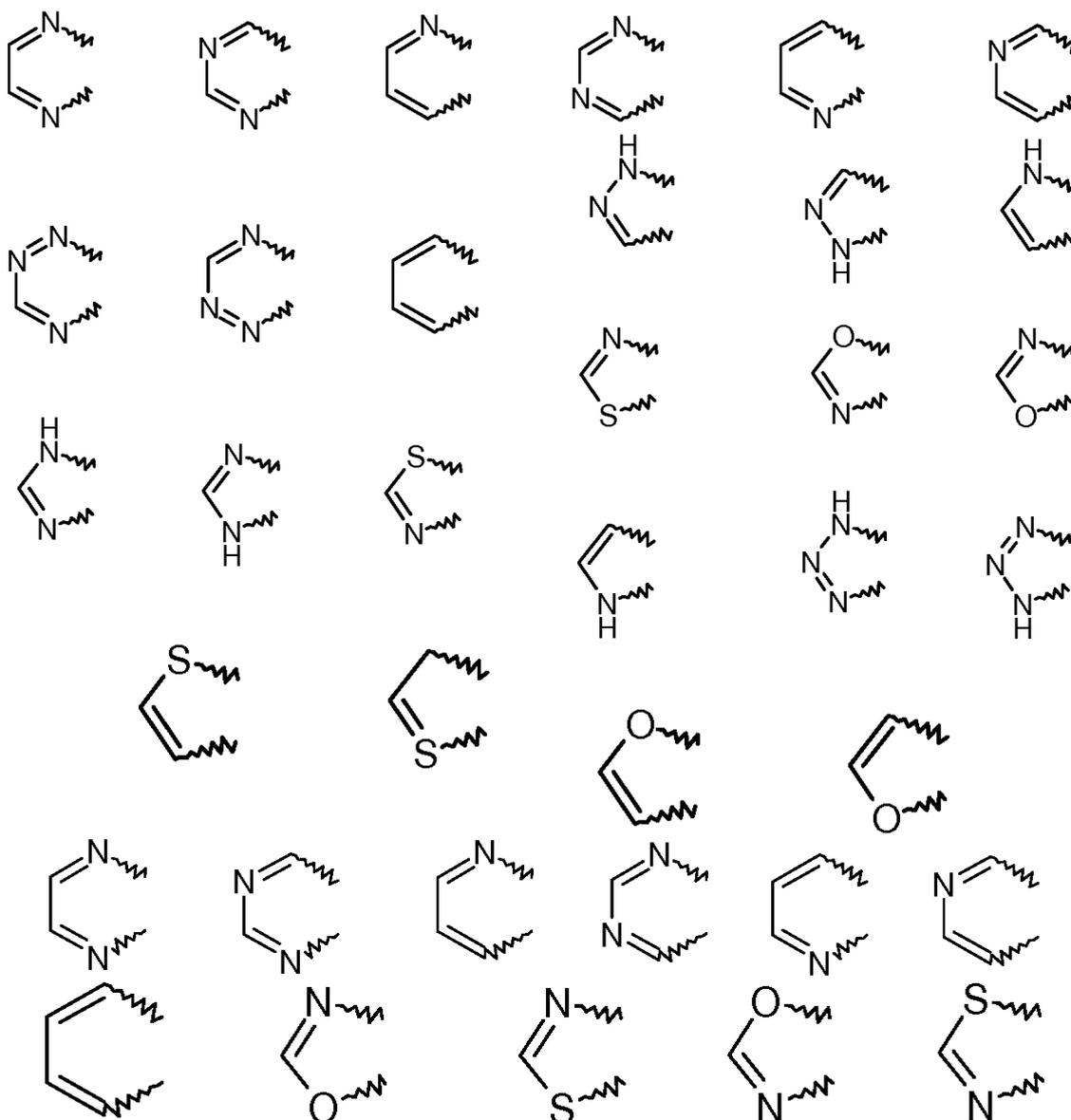
Si fuera apropiado, los compuestos de la fórmula (I) pueden estar presentes en diversas formas polimórficas o como mezclas de diferentes formas polimórficas. Ambos, los polimorfos puros y las mezclas polimórficas se proporcionan por la invención y se pueden usar de acuerdo con la invención.

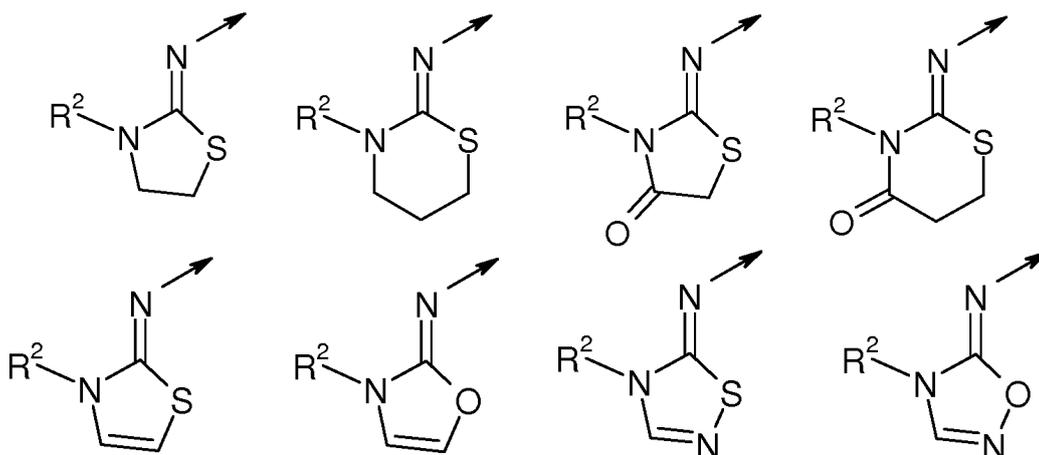
5 Los compuestos de la fórmula (I) comprenden opcionalmente diastereómeros o enantiómeros y también rotámeros, tautómeros y sales de los compuestos de la fórmula (I).

Los compuestos de la fórmula (I) incluyen en particular diastereómeros E/Z tales como, por ejemplo,



Los compuestos de acuerdo con la invención están definidos por la fórmula general (I).





Una definición general de los compuestos de acuerdo con la invención se proporciona por la fórmula (I). Se definen sustituyentes o intervalos de los radicales muy particularmente preferentes dados bajo las fórmulas mostradas antes y más adelante,

en los que

n representa el número 0 o 1,

X<sup>1</sup> y X<sup>3</sup> representan hidrógeno,

X<sup>2</sup> y X<sup>4</sup> independientemente uno de otro representan hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, trifluorometilo, difluorometilo, vinilo, etinilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, OCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, aminotiocarbonilo,

o fenilmetilo, fenoxi, piridilmetilo, pirimidilmetilo, tiazolilmetilo, pirazolilmetilo, piridiloxi, pirimidiloxi, tiazoliloxi, pirazoliloxi, ciclopropilmetilo, ciclopropilmetoxi, opcionalmente mono- o disustituídos con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, trifluorometoxi, difluorometoxi o ciclopropilo,

o representan un cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), fenilo, piridilo, pirimidilo, piridazinilo, pirazinilo, triazinilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, oxadiazolilo, pirazolilo, triazolilo o tetrazolilo que está opcionalmente mono- o disustituído con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, trifluorometoxi o con ciclopropilo,

en especial, X<sup>2</sup> y X<sup>4</sup> representan las siguientes combinaciones X<sup>2</sup>/X<sup>4</sup>: F/F, Cl/Cl, F/Cl, Cl/F, Br/Br, Br/Cl, Cl/Br, Br/F, F/Br, metilo/metilo, metilo/F, F/metilo, metilo/Cl, Cl/metilo, metilo/Br, Br/metilo, etilo/etilo, etilo/F, F/etilo, etilo/Cl, Cl/etilo, etilo/Br, Br/etilo, metoxi/metilo, metilo/metoxi, metilo/H, etilo/H, cloro/H, bromo/H, flúor/H, metoxi/H, H/cloro, H/flúor, H/bromo, H/metilo, H/metoxi, H/etilo

R<sup>3</sup> representa metoximetilo, metoxietilo, cianometilo,

o representa un anillo de 3 a 6 miembros saturado o parcialmente saturado que puede contener opcionalmente uno a tres heteroátomos del grupo constituido por O, S o N y que puede estar opcionalmente mono- o disustituído con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, vinilo, etinilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, trifluoroetoxi o ciclopropilo, en especial, se citan explícitamente los siguientes anillos: ciclopropilo, fenilo, piridilo, pirimidilo, tiazolilo, pirazolilo y tienilo que pueden estar opcionalmente sustituidos con los sustituyentes citados como muy particularmente preferentes,

o representa un anillo de 3 a 6 miembros aromático que está mono- o disustituído con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, vinilo, etinilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, trifluoroetoxi o ciclopropilo, en especial, se citan explícitamente los siguientes anillos: ciclopropilo, fenilo, piridilo, pirimidilo, tiazolilo, pirazolilo y tienilo que pueden estar sustituidos con los sustituyentes citados como muy particularmente preferentes,

o representa un anillo de 3 a 6 miembros aromático que contiene uno a tres heteroátomos del grupo constituido por O, S o N y que puede estar opcionalmente mono- o disustituído con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, vinilo, etinilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, trifluoroetoxi o ciclopropilo, en especial, se citan explícitamente los siguientes anillos: ciclopropilo, fenilo, piridilo, pirimidilo, tiazolilo, pirazolilo y tienilo que pueden estar sustituidos con los sustituyentes citados como muy particularmente preferentes,

$R^1$  representa ciano, cianometilo, metilcarbonilo, etilcarbonilo, propilcarbonilo, isopropilcarbonilo, metoxycarbonilo, etoxycarbonilo,

o representa arilcarbonilo, piridilcarbonilo, pirimidilcarbonilo, tiazolilcarbonilo, pirazolilcarbonilo, metilsulfinilo, trifluorometilsulfinilo, metilsulfonilo, trifluorometilsulfonilo opcionalmente mono- o disustituídos de forma independiente unos de otros con flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, trifluorometilo, alilo, butenilo, metoxi, trifluorometoxi, metiltio, metilsulfinilo, metilsulfonilo, metilamino, dimetilamino,

o representa oxetanilo, tetanilo, trimetilenosulfonilo, trimetilenosulfinilo, oxanilo o tianilo que pueden estar opcionalmente mono- o polisustituídos con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, vinilo, etinilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, trifluoroetoxi o ciclopropilo,

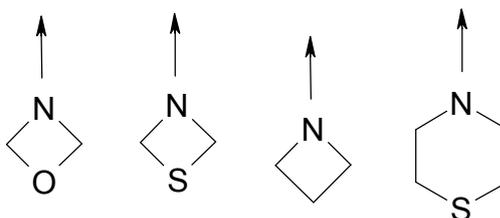
o representa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo que están opcionalmente mono- o polisustituídos con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, vinilo, etinilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, trifluoroetoxi o ciclopropilo,

$R^2$  representa hidrógeno, metilo o etilo, o

$R^1$  y  $R^2$  junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos pueden formar un anillo de 3 a 6 miembros saturado o insaturado que está opcionalmente mono-, di-, tri- o tetrasustituído con metilo, etilo, metoxi, etoxi, flúor, cloro, bromo, trifluorometilo, difluorometilo y que contiene uno o dos heteroátomos adicionales del grupo constituido por azufre o nitrógeno,

o junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos pueden formar un anillo de 4 miembros saturado o insaturado que está opcionalmente mono-, di-, tri- o tetrasustituído con metilo, etilo, metoxi, etoxi, flúor, cloro, bromo, trifluorometilo, difluorometilo y que contiene opcionalmente un heteroátomo adicional del grupo constituido por oxígeno, azufre o nitrógeno,

en especial, se citan explícitamente los siguientes anillos,



en los que el átomo de nitrógeno al que  $R^1$  y  $R^2$  están unidos representan el ciclo y la flecha apunta al resto de la molécula, que puede estar opcionalmente mono- o disustituído con metilo, etilo, metoxi, etoxi, flúor, cloro, bromo, trifluorometilo, difluorometilo.

Una definición general de los compuestos de acuerdo con la invención se proporciona por la fórmula (I). Igualmente, se definen sustituyentes o intervalos de los radicales may particularmente preferentes dados bajo las fórmulas mostradas antes y más adelante,

n representa el número 0 o 1,

$X^1$  y  $X^3$  representan hidrógeno,

$X^2$  y  $X^4$  independientemente uno de otro representan hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, trifluorometilo, difluorometilo, vinilo, etinilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi,  $OCH_2CF_3$ , aminotiocarbonilo,

o fenilmetilo, fenoxi, piridilmetilo, pirimidilmetilo, tiazolilmetilo, pirazolilmetilo, piridiloxi, pirimidiloxi, tiazoliloxi, pirazoliloxi, ciclopropilmetilo, ciclopropilmetoxi, opcionalmente mono- o disustituídos con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, trifluorometoxi, difluorometoxi o ciclopropilo,

o representan un cicloalquilo ( $C_3-C_6$ ), fenilo, piridilo, pirimidilo, piridazinilo, pirazinilo, triazinilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, oxadiazolilo, pirazolilo, triazolilo o tetrazolilo que está opcionalmente mono- o disustituído con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, trifluorometoxi o con ciclopropilo,

en especial,  $X^2$  y  $X^4$  representan las siguientes combinaciones  $X^2/X^4$ : F/F, Cl/Cl, F/Cl, Cl/F, Br/Br, Br/Cl, Cl/Br, Br/F, F/Br, metilo/metilo, metilo/F, F/metilo, metilo/Cl, Cl/metilo, metilo/Br, Br/metilo, etilo/etilo, etilo/F, F/etilo, etilo/Cl, Cl/etilo, etilo/Br, Br/etilo, metoxi/metilo, metilo/metoxi, metilo/H, etilo/H, cloro/H, bromo/H, flúor/H,

metoxi/H, H/cloro, H/flúor, H/bromo, H/metilo, H/metoxi, H/etilo

R<sup>3</sup> representa metoximetilo, metoxietilo, cianometilo,

5 o representa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, piridilo, pirimidilo, pirazinilo, piridazinilo, pirrolilo, furanilo, tiazolilo, pirazolilo o tienilo que pueden estar opcionalmente mono- o polisustituídos con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, vinilo, etinilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, trifluoroetoxi o ciclopropilo,

o representa arilo, en particular fenilo, que está mono- o polisustituído con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, vinilo, etinilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, trifluoroetoxi o ciclopropilo,

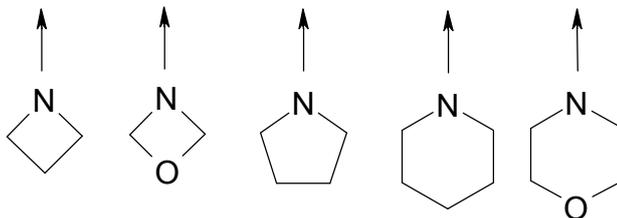
10 R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup>, independientemente uno de otro, representan hidrógeno, ciano, metilo, etilo, propilo, butilo, *sec*-butilo, isopropilo, *terc*-butilo, (2,2,2)-trifluoroetilo, (2,2)-difluorometilo, metoxi, etoxi, cianometilo, metoximetilo, metoxietilo, alilo, butenilo, propinilo, metilcarbonilo, etilcarbonilo, propilcarbonilo, isopropilcarbonilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo,

15 o representan arilcarbonilo, piridilcarbonilo, pirimidilcarbonilo, tiazolilcarbonilo, pirazolilcarbonilo, metilsulfino, trifluorometilsulfino, metilsulfonilo, trifluorometilsulfonilo opcionalmente mono- o disustituídos de forma independiente unos de otros con flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, trifluorometilo, alilo, butenilo, metoxi, trifluorometoxi, metiltio, metilsulfino, metilsulfonilo, metilamino, dimetilamino,

20 o representan un anillo saturado o aromático de 3 a 6 miembros que puede contener opcionalmente uno a dos heteroátomos del grupo constituido por O, S o N, que puede estar opcionalmente interrumpido una, dos o tres veces por C=O y que puede estar opcionalmente mono- o trisustituído con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, vinilo, etinilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, trifluoroetoxi y ciclopropilo, en especial, se citan explícitamente los siguientes anillos: ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, oxetano, fenilo, tienilo y piridilo que pueden estar opcionalmente sustituidos con los sustituyentes citados como muy particularmente preferentes,

25 o representan  $-(CH_2)_m-R^6$ , donde R<sup>6</sup> representa un anillo de 3 a 6 miembros saturado, parcialmente saturado o aromático que puede contener opcionalmente uno a dos heteroátomos del grupo constituido por O, S o N, que puede estar opcionalmente interrumpido una o dos veces por C=O y que puede estar opcionalmente mono-, di- o trisustituído con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, vinilo, etinilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, trifluoroetoxi y ciclopropilo, donde m representa el número 1, en especial, los siguientes R<sup>6</sup> se citan explícitamente: ciclopropilo, fenilo y piridilo que pueden estar opcionalmente sustituidos con los sustituyentes citados como muy particularmente preferentes, o

35 R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos pueden formar un anillo de 3 a 6 miembros saturado o insaturado que está opcionalmente mono-, di-, tri- o tetrasustituído con metilo, etilo, metoxi, etoxi, flúor, cloro, bromo, trifluorometilo, difluorometilo, que puede contener opcionalmente uno o dos heteroátomos adicionales del grupo constituido por azufre, oxígeno y nitrógeno (donde los átomos de oxígeno no deben ser directamente adyacentes unos a otros) y/o al menos un grupo CH<sub>2</sub> está reemplazado por un grupo carbonilo, en especial, se citan explícitamente los siguientes anillos:



40 en los que el átomo de nitrógeno al que R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> están unidos representan el ciclo y la flecha apunta al resto de la molécula, que puede estar mono- o disustituído con metilo, etilo, metoxi, etoxi, flúor, cloro, bromo, trifluorometilo, difluorometilo.

Una definición general de los compuestos de acuerdo con la invención se proporciona por la fórmula (I) Igualmente, se definen sustituyentes o intervalos de los radicales muy particularmente preferentes dados bajo las fórmulas mostradas antes y más adelante,

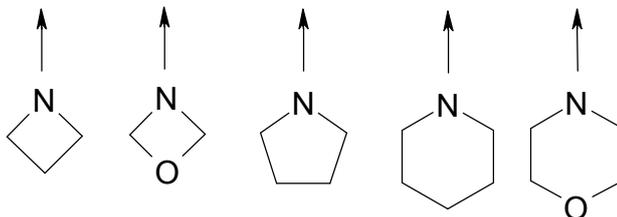
45 en los que

n representa el número 0 o 1,

X<sup>1</sup> y X<sup>3</sup> representan hidrógeno,

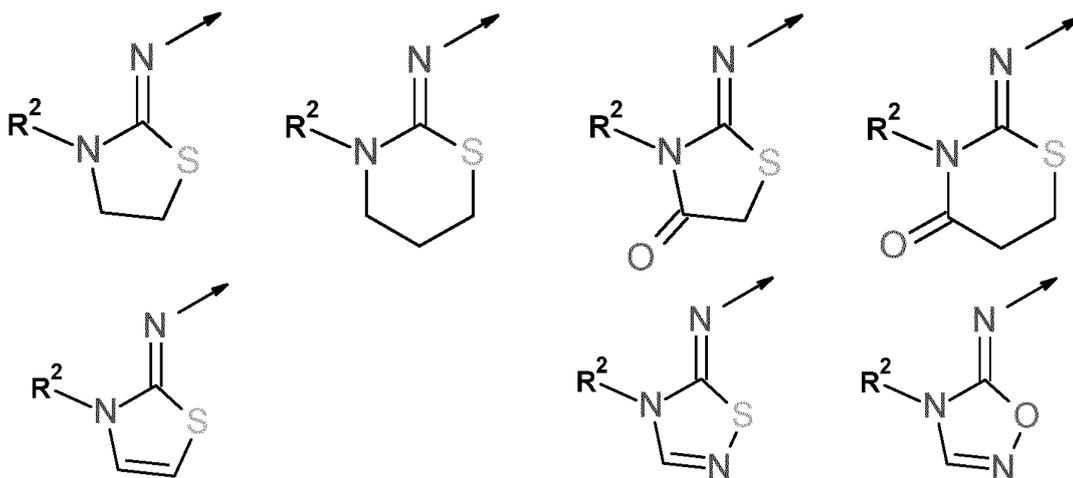
- 5  $X^2$  y  $X^4$  representan las siguientes combinaciones  $X^2/X^4$ : vinilo/H, H/vinilo, etinilo/H, H/etinilo, metoxi/H, H/metoxi, etoxi/H, H/etoxi, aminotiocarbonilo/H, H/aminotiocarbonilo, vinilo/metilo, metilo/vinilo, etinilo/metilo, metilo/etinilo, metoxi/metilo, metilo/metoxi, etoxi/metilo, metilo/etoxi, aminotiocarbonilo/metilo, metilo/aminotiocarbonilo, vinilo/F, F/vinilo, etinilo/F, F/etinilo, metoxi/F, F/metoxi, etoxi/F, F/etoxi, aminotiocarbonilo/F, F/aminotiocarbonilo, vinilo/Cl, Cl/vinilo, etinilo/Cl, Cl/etinilo, metoxi/Cl, Cl/metoxi, etoxi/Cl, Cl/etoxi, aminotiocarbonilo/Cl, Cl/aminotiocarbonilo,
- o fenilmetilo, fenoxi, piridilmetilo, pirimidilmetilo, tiazolilmetilo, pirazolilmetilo, piridiloxi, pirimidiloxi, tiazoliloxi, pirazoliloxi, ciclopropilmetilo, ciclopropilmetoxi opcionalmente mono- o disustituídos con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, trifluorometoxi, difluorometoxi o ciclopropilo,
- 10 o representan un cicloalquilo ( $C_3-C_6$ ), fenilo, piridilo, pirimidilo, piridazinilo, pirazinilo, triazinilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, oxadiazolilo, pirazolilo, triazolilo o tetrazolilo que está opcionalmente mono- o disustituído con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, trifluorometoxi o con ciclopropilo,
- $R^3$  representa metoximetilo, metoxietilo, cianometilo,
- 15 o representa un anillo de 3 a 6 miembros saturado o parcialmente saturado que puede contener opcionalmente uno a tres heteroátomos del grupo constituido por O, S o N y que puede estar opcionalmente mono- o disustituído con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, vinilo, etinilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, trifluoroetoxi y ciclopropilo, en especial, se citan explícitamente los siguientes anillos: ciclopropilo, fenilo, piridilo, pirimidilo, tiazolilo, pirazolilo y tienilo que pueden estar opcionalmente sustituidos con los sustituyentes citados como muy particularmente preferentes,
- 20 o representa un anillo de 3 a 6 miembros aromático que está mono- o disustituído con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, vinilo, etinilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, trifluoroetoxi o ciclopropilo, en especial, se citan explícitamente los siguientes anillos: ciclopropilo, fenilo, piridilo, pirimidilo, tiazolilo, pirazolilo y tienilo que pueden estar opcionalmente sustituidos con los sustituyentes citados como muy particularmente preferentes,
- 25 o representa un anillo de 3 a 6 miembros aromático que contiene uno a tres heteroátomos del grupo constituido por O, S o N y que puede estar opcionalmente mono- o disustituído con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, vinilo, etinilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, trifluoroetoxi o ciclopropilo, en especial, se citan explícitamente los siguientes anillos: ciclopropilo, fenilo, piridilo, pirimidilo, tiazolilo, pirazolilo y tienilo que pueden estar opcionalmente sustituidos con los sustituyentes citados como muy particularmente preferentes,
- 30  $R^1$  y  $R^2$ , independientemente uno de otro, representan hidrógeno, ciano, metilo, etilo, propilo, butilo, *sec*-butilo, isopropilo, *terc*-butilo, (2,2,2)-trifluoroetilo, (2,2)-difluorometilo, metoxi, etoxi, cianometilo, metoximetilo, metoxietilo, alilo, butenilo, propinilo, metilcarbonilo, etilcarbonilo, propilcarbonilo, isopropilcarbonilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo,
- 35 o representan arilcarbonilo, piridilcarbonilo, pirimidilcarbonilo, tiazolilcarbonilo, pirazolilcarbonilo, metilsulfínilo, trifluorometilsulfínilo, metilsulfonilo, trifluorometilsulfonilo opcionalmente mono- o disustituídos de forma independiente unos de otros con flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, trifluorometilo, alilo, butenilo, metoxi, trifluorometoxi, metiltio, metilsulfínilo, metilsulfonilo, metilamino, dimetilamino,
- 40 o representan un anillo saturado o aromático de 3 a 6 miembros que puede contener opcionalmente uno a dos heteroátomos del grupo constituido por O, S o N, que puede estar opcionalmente interrumpido una, dos o tres veces por C=O y que puede estar opcionalmente mono- o trisustituído con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, vinilo, etinilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, trifluoroetoxi y ciclopropilo, en especial, se citan explícitamente los siguientes anillos: ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, oxetano, fenilo, tienilo y piridilo que pueden estar opcionalmente sustituidos con los sustituyentes citados como muy particularmente preferentes,
- 45 o representan  $-(CH_2)_m-R^6$ , donde  $R^6$  representa un anillo de 3 a 6 miembros saturado, parcialmente saturado o aromático que puede contener opcionalmente uno a dos heteroátomos del grupo constituido por O, S o N, que puede estar opcionalmente interrumpido una o dos veces por C=O y que puede estar opcionalmente mono-, di- o trisustituído con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, vinilo, etinilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, trifluoroetoxi y ciclopropilo, donde m representa el número 1, en especial, los siguientes  $R^6$  se citan explícitamente: ciclopropilo, fenilo y piridilo que pueden estar opcionalmente sustituidos con los sustituyentes citados como muy particularmente preferentes, o
- 55  $R^1$  y  $R^2$  junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos pueden formar un anillo de 3 a 6 miembros saturado o insaturado que está opcionalmente mono-, di-, tri- o tetrasustituído con metilo, etilo, metoxi, etoxi, flúor, cloro, bromo, trifluorometilo, difluorometilo, que puede contener opcionalmente uno o dos heteroátomos adicionales del

grupo constituido por azufre, oxígeno y nitrógeno (donde los átomos de oxígeno no deben ser directamente adyacentes unos a otros) y/o al menos un grupo CH<sub>2</sub> está reemplazado por un grupo carbonilo, en especial, se citan explícitamente los siguientes anillos:



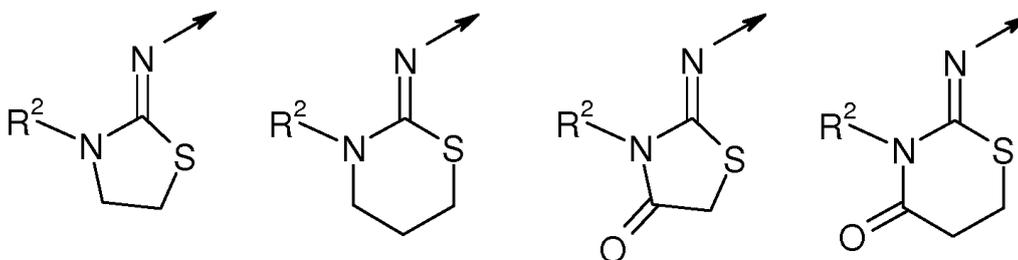
5 en los que el átomo de nitrógeno al que R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> están unidos representan el ciclo y la flecha apunta al resto de la molécula, que puede estar mono- o disustituido con metilo, etilo, metoxi, etoxi, flúor, cloro, bromo, trifluorometilo, difluorometilo,

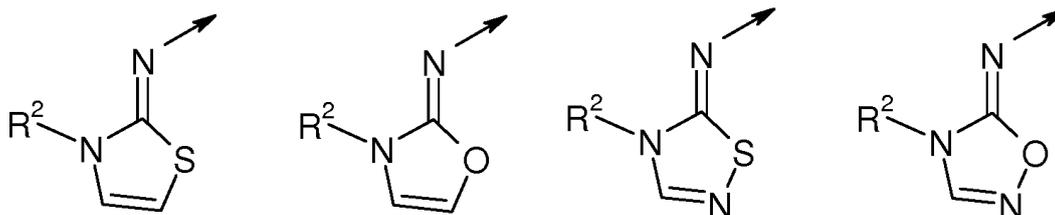
10 R<sup>1</sup> y R<sup>3</sup> junto con los átomos a los que están unidos pueden formar un anillo de 5 a 6 miembros saturado o insaturado y/o uno que está opcionalmente mono- o disustituido con metilo, etilo, metoxi, etoxi, flúor, cloro, trifluorometilo, difluorometilo, ciano, ciclopropilo, clorociclopropilo, fluorociclopropilo, cianociclopropilo, metilciclopropilo, alcanodiilo (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>), alquendiilo (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>), butanodienilo (donde el butanodienilo puede estar opcionalmente mono- o disustituido con metilo, flúor, cloro, bromo, metoxi o trifluorometilo y/o puede estar opcionalmente interrumpido por al menos un átomo de oxígeno o/y nitrógeno) y que puede contener opcionalmente otro átomo de azufre o nitrógeno y un grupo carbonilo, en especial R<sup>1</sup> y R<sup>3</sup> junto con los átomos a los que están unidos representan los siguientes grupos,



20 cada uno de los cuales puede estar opcionalmente mono- o disustituido con metilo, etilo, metoxi, etoxi, flúor, cloro, trifluorometilo, difluorometilo, ciclopropilo, clorociclopropilo, fluorociclopropilo, cianociclopropilo, metilciclopropilo,

donde la flecha apunta al resto de la molécula





Una definición general de los compuestos de acuerdo con la invención se proporciona por la fórmula (I). Igualmente, se definen radicales o intervalos de los sustituyentes muy particularmente preferentes dados bajo las fórmulas mostradas antes y más adelante,

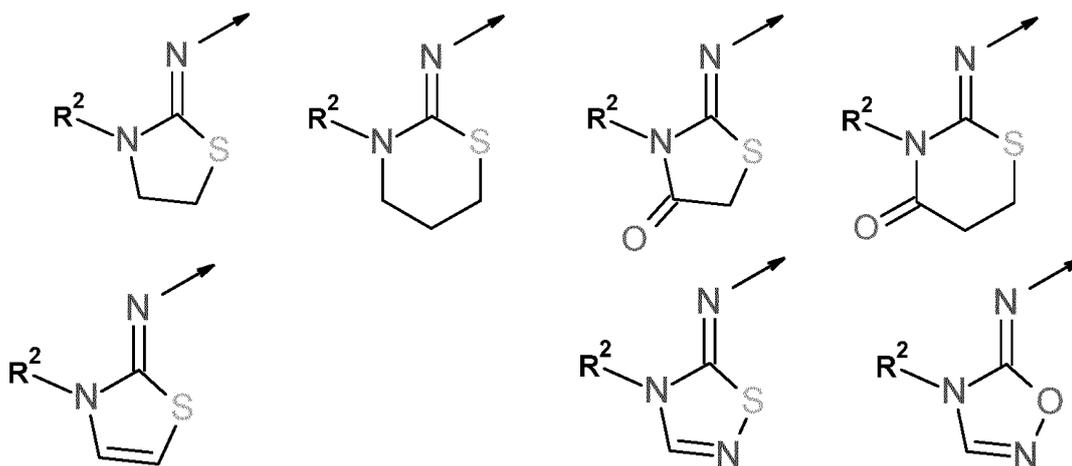
5 n representa el número 0 o 1,  
 $X^1$  y  $X^3$  representan hidrógeno,

$X^2$  y  $X^4$ , independientemente uno de otro, representan hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, trifluorometilo, difluorometilo, vinilo, etinilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi,  $OCH_2CF_3$ , aminotiocarbonilo, o fenilmetilo, fenoxi, piridilmetilo, pirimidilmetilo, tiazolilmetilo, pirazolilmetilo, piridiloxi, pirimidiloxi, tiazoliloxi, pirazoliloxi, ciclopropilmetilo, ciclopropilmetoxi, opcionalmente mono- o disustituidos con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, trifluorometoxi, difluorometoxi o ciclopropilo,

10 o representan un cicloalquilo ( $C_3-C_6$ ), fenilo, piridilo, pirimidilo, piridazinilo, pirazinilo, triazinilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, oxadiazolilo, pirazolilo, triazolilo o tetrazolilo que está opcionalmente mono- o disustituido con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, trifluorometoxi o con ciclopropilo,

15 en especial,  $X^2$  y  $X^4$  representan las siguientes combinaciones  $X^2/X^4$ : F/F, Cl/Cl, F/Cl, Cl/F, Br/Br, Br/Cl, Cl/Br, Br/F, F/Br, metilo/metilo, metilo/F, F/metilo, metilo/Cl, Cl/metilo, metilo/Br, Br/metilo, etilo/etilo, etilo/F, F/etilo, etilo/Cl, Cl/etilo, etilo/Br, Br/etilo, metoxi/metilo, metilo/metoxi, metilo/H, etilo/H, cloro/H, bromo/H, flúor/H, metoxi/H, H/cloro, H/flúor, H/bromo, H/metilo, H/metoxi, H/etilo

20  $R^1$  y  $R^3$  junto con los átomos a los que están unidos pueden formar un anillo de 5 a 6 miembros saturado o insaturado y/o uno que está opcionalmente mono- o disustituido con metilo, etilo, metoxi, etoxi, flúor, cloro, trifluorometilo, difluorometilo, ciano, ciclopropilo, clorociclopropilo, fluorociclopropilo, cianociclopropilo, metilciclopropilo, alcanodiilo ( $C_3-C_4$ ), alquenodiilo ( $C_3-C_4$ ), butanodiieno (donde el butanodiieno puede estar opcionalmente mono- o disustituido con metilo, flúor, cloro, bromo, metoxi o trifluorometilo y/o puede estar opcionalmente interrumpido por al menos un átomo de oxígeno o/ y nitrógeno) y que puede contener opcionalmente otro átomo de azufre o nitrógeno y un grupo carbonilo, en especial  $R^1$  y  $R^3$  junto con los átomos a los que están unidos representan los siguientes grupos,

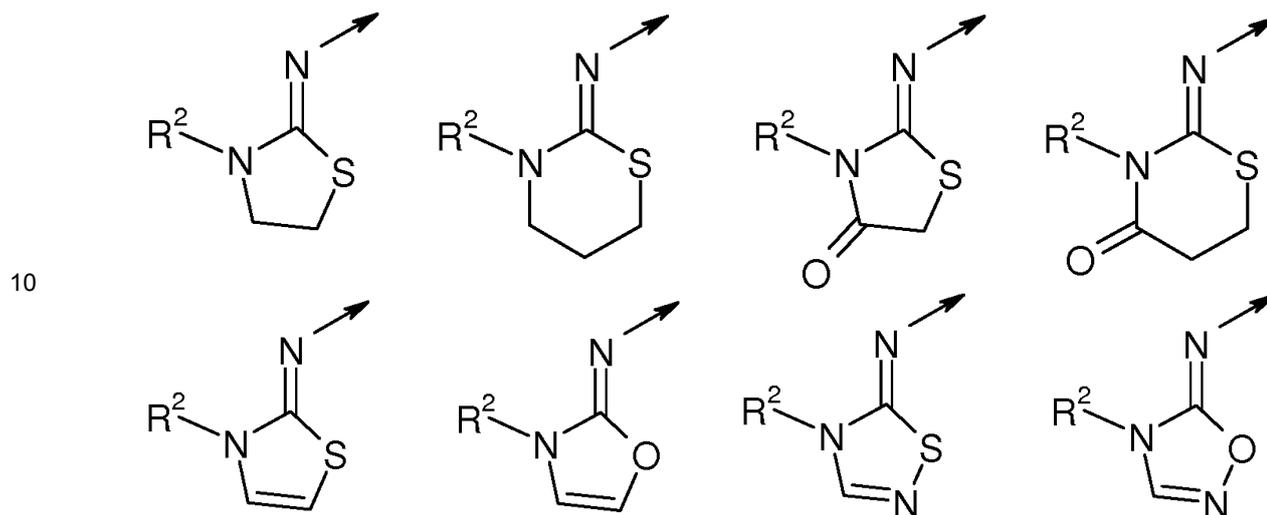


30 cada uno de los cuales puede estar opcionalmente mono- o disustituido con metilo, etilo, metoxi, etoxi, flúor, cloro, trifluorometilo, difluorometilo, ciclopropilo, clorociclopropilo, fluorociclopropilo, cianociclopropilo, metilciclopropilo, donde la flecha apunta al resto de la molécula,

35  $R^2$  representa ciano, (2,2,2)-trifluoroetilo, (2,2)-difluoroetilo, 2-cloro-(2,2)-difluoroetilo, (2,2)-dicloro-2-fluoroetilo, (2,2,2)-tricloroetilo, pentafluoroetilo, 2-clorotetrafluoroetilo, alilo, butenilo, propinilo, metilsulfinilo, trifluorometilsulfinilo, metilsulfonilo, trifluorometilsulfonilo,

o representa un anillo saturado o aromático de 3 a 6 miembros que puede contener opcionalmente uno a dos heteroátomos del grupo constituido por O, S o N, que puede estar opcionalmente interrumpido una, dos o tres veces por  $C=O$  y que puede estar opcionalmente mono- o trisustituido con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, vinilo, etinilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, trifluoroetoxi o ciclopropilo, en especial, se citan explícitamente los siguientes anillos: ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, oxetano, fenilo, tienilo y piridilo que pueden estar opcionalmente sustituidos con

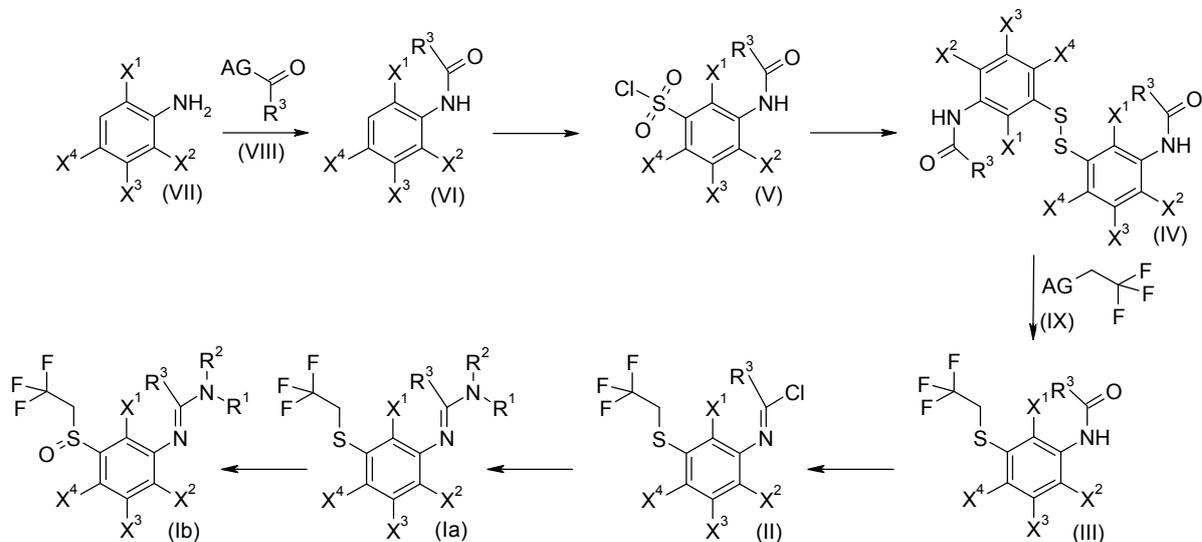
- los sustituyentes citados como muy particularmente preferentes, o representan  $-(CH_2)_m-R^6$ , donde  $R^6$  representa un anillo de 3 a 6 miembros saturado, parcialmente saturado o aromático que puede contener opcionalmente uno a dos heteroátomos del grupo constituido por O, S o N, que puede estar opcionalmente interrumpido una o dos veces por C=O y que puede estar opcionalmente mono-, di- o trisustituido con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, vinilo, etinilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, trifluoroetoxi o ciclopropilo, donde m representa el número 1, en especial, los siguientes  $R^6$  se citan explícitamente: ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, fenilo y piridilo que pueden estar opcionalmente sustituidos con los sustituyentes citados como muy particularmente preferentes.



- Las definiciones o ilustraciones de radicales generales o preferentes antes citadas se pueden combinar entre sí según se desee, es decir, incluyendo combinaciones entre los respectivos intervalos e intervalos preferentes. Son de aplicación tanto a los productos finales como, correspondientemente, a precursores e intermedios.
- 15 Se da preferencia de acuerdo con la invención a los compuestos de la fórmula (I) que contienen una combinación de los significados listados antes como preferentes (preferibles).
- Se da preferencia particular de acuerdo con la invención a los compuestos de la fórmula (I) que contienen una combinación de los significados listados antes como particularmente preferentes.
- 20 Se da preferencia muy particular de acuerdo con la invención a los compuestos de la fórmula (I) que contienen una combinación de los significados listados antes como muy particularmente preferentes.
- Radicales de hidrocarburos saturados o insaturados, tales como alquilo, alcanodiilo o alqueniilo, pueden, en cada caso, ser de cadena lineal o ramificados en la medida en que esto sea posible, incluyendo la combinación con heteroátomos tales como, por ejemplo, en alcoxi.
- 25 A no ser que se indique de otro modo, los radicales opcionalmente sustituidos pueden ser mono- o polisustituidos, pudiendo, en el caso de polisustituciones ser los sustituyentes iguales o distintos.
- En las definiciones de radicales citados como preferentes, halógeno representa flúor, cloro, bromo y yodo, de forma particularmente preferente flúor, cloro y bromo y de forma muy particularmente preferente flúor y cloro.

### Procedimientos de preparación

- 30 Los compuestos de la fórmula general (I) se pueden preparar por los procedimientos descritos en la solicitud WO 2007/131680. De forma alternativa a estos procedimientos descritos, los compuestos de la fórmula (I) también se pueden preparar por el procedimiento A, procedimiento B, procedimiento C, procedimiento E, procedimiento F, procedimiento G, procedimiento H, procedimiento I, procedimiento J y procedimiento K. El Procedimiento D proporciona una alternativa a la preparación de los precursores.
- 35 En S. Patai y Z. Rappoport, The Chemistry of Amidines and Imidates, Vol. 27, John Wiley & Sons, New York, NY, USA, 1991 se describe una serie de procedimientos generales para la preparación de amidinas.
- También se describen en la bibliografía síntesis catalizadas por paladio (II) de arilamidinas con la ayuda de trifluoroboratos, véase, por ejemplo, J.Sävmarker, Ph.D. thesis University of Uppsala, 2012 o J.Sävmarker, Org. Lett. 14 (2012), 2394-2397.

**Procedimiento A**

en el que  $X^1$ ,  $X^2$ ,  $X^3$ ,  $X^4$ ,  $R^1$ ,  $R^2$  y  $R^3$  tienen los significados dados antes, AG representa un grupo saliente y PG representa un grupo protector.

- 5 Las anilinas de la fórmula (VII) están disponibles de forma comercial o se pueden preparar por procedimientos conocidos. En presencia de ácidos, anhídridos de ácido o cloruros de ácido de la fórmula (VIII), las anilinas (VII) se convierten en las correspondientes anilidas (VI). La clorosulfonación de las anilidas (VI) con ácido clorosulfónico proporciona los correspondientes cloruros de sulfonilo (V). La reducción de los cloruros de sulfonilo (V) a los disulfuros (IV) se puede llevar a cabo usando procedimientos conocidos por la bibliografía tales como hierro en ácido clorhídrico o yoduro. La reacción de los disulfuros (IV) con electrófilos de trifluoroetilo de la fórmula (XVI) en la que AG representa un grupo saliente tal como, por ejemplo, cloro, bromo, tosilato, mesilato o triflato proporciona los sulfuros (III).

Las anilidas (III) se cloran, por ejemplo con clorofosfato de difenilo o pentacloruro de fósforo, para dar cloruros de imidoilo de la fórmula (II) y se hacen reaccionar con aminas para dar amidinas (Ia).

- 15 Los tioéteres (Ia) se convierten en los correspondientes sulfóxidos (Ib) por reacción con agentes oxidantes tales como, por ejemplo, ácido meta-cloroperbenzoico.

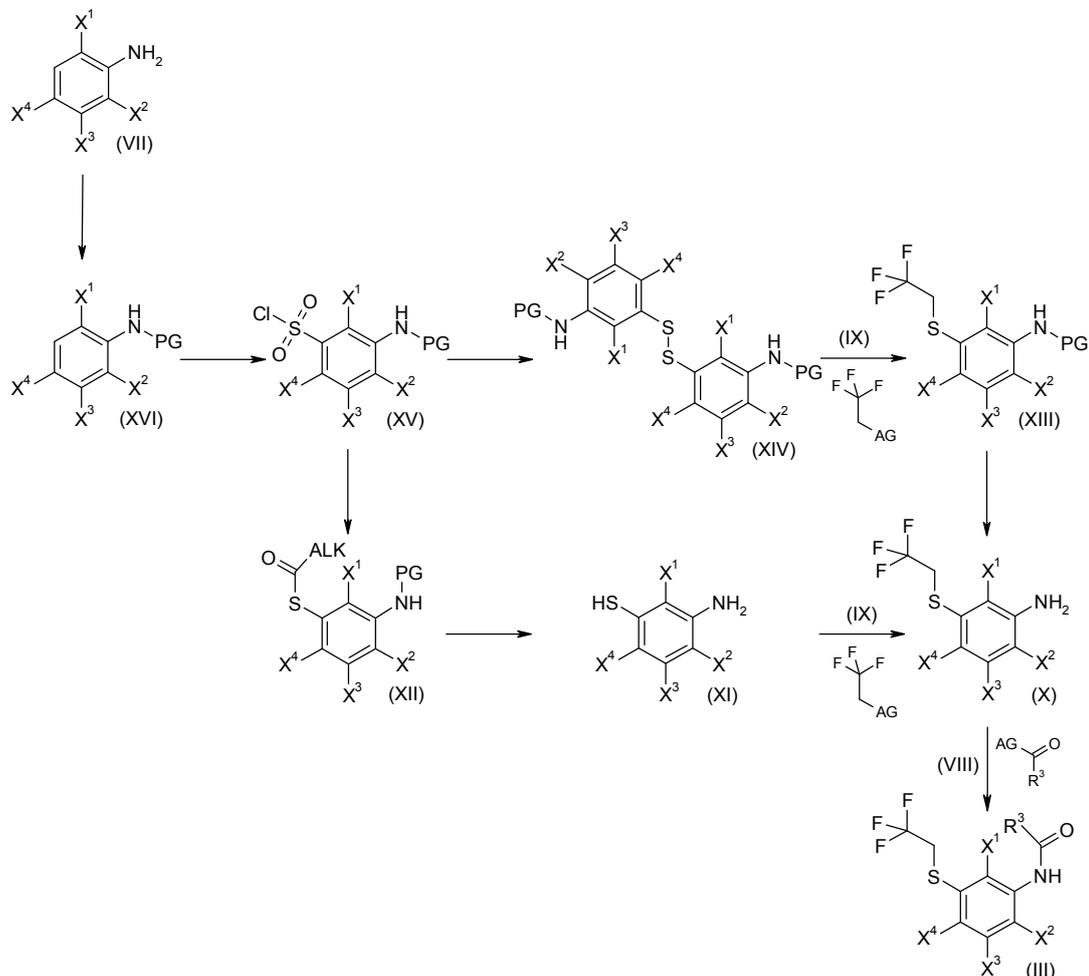
La oxidación de los compuestos de la fórmula (Ia) a compuestos de la fórmula (Ib) se puede llevar a cabo usando un agente oxidante en un disolvente o diluyente adecuado. Agentes oxidantes adecuados son, por ejemplo, ácido nítrico diluido, peróxido de hidrógeno y ácidos peroxycarboxílicos tales como ácido meta-cloroperbenzoico. Disolventes adecuados son disolventes orgánicos inertes, de forma típica, acetonitrilo y disolventes halogenados tales como diclorometano, cloroformo o dicloroetano.

- 20 Para generar sulfóxidos enriquecidos enantioméricamente son adecuados un gran número de procedimientos diferentes, como se describe por A.R. Maguire en ARKIVOC, 2011(i), 1-110 o por el documento WO2011/006646: oxidaciones de tioéteres asimétricas catalizadas por metales, por ejemplo con titanio y vanadio como las fuentes de catalizador empleadas más frecuentemente, en la forma de  $Ti(O^iPr)_4$  y  $VO(acac)_2$ , junto con un ligando quiral y un agente oxidante tal como hidroperóxido de terc-butilo (TBHP), hidroperóxido de 2-fenilpropan-2-ilo (CHP) o peróxido de hidrógeno; oxidaciones asimétricas catalizadas por no metales que emplean agentes oxidantes quirales o catalizadores quirales; oxidaciones asimétricas electroquímicas o biológicas y también resolución cinética de sulfóxidos y desplazamiento nucleófilo (de acuerdo con el procedimiento de Andersen).

- 30 Los enantiómeros también se pueden obtener del racemato, por ejemplo, separándolo a escala preparativa por HPLC quiral.

Los compuestos de las fórmulas (II), (III), (IV) y (V) en el procedimiento A se pueden preparar en particular en las condiciones citadas en los Ejemplos de preparación.

De forma alternativa, los tioéteres de la fórmula (III) se pueden preparar por el procedimiento B.

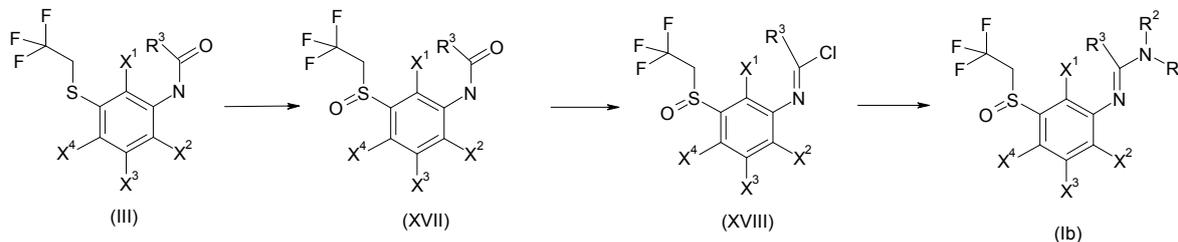
**Procedimiento B**

en el que  $X^1$ ,  $X^2$ ,  $X^3$ ,  $X^4$  y  $R^3$  tienen los significados dados antes, AG representa un grupo saliente y PG representa un grupo protector.

- 5 Las anilinas (VII) se pueden proteger con un grupo protector adecuado conocido por la bibliografía como tal, por ejemplo, un grupo acetilo, para dar compuestos de la fórmula (XVI). La clorosulfonación de los compuestos de la fórmula (XVI) con ácido clorosulfónico proporciona los correspondientes cloruros de sulfonilo (XV). La reducción de los cloruros de sulfonilo (XV) a los disulfuros (XIV) se puede llevar a cabo usando procedimientos conocidos por la bibliografía tales como tales como hierro en ácido clorhídrico o yoduro. La reacción de los disulfuros (XIV) con
- 10 electrófilos de trifluoroetilo de la fórmula (IX) en la que AG representa un grupo saliente tal como, por ejemplo, cloro, bromo, tosilato, mesilato o triflato proporciona los sulfuros (XIII). El grupo protector se retira por procedimientos adecuados conocidos por la bibliografía, dando las anilinas de la fórmula (X). Estas últimas se convierten, en presencia de ácidos, anhídridos de ácido o cloruros de ácido de la fórmula (VIII) en las correspondientes anilidas (III).
- 15 En lugar de la reducción al disulfuro (XIV), también se posible reducir con un agente reductor adecuado tal como, por ejemplo, yodo/fósforo para dar el tioato de alquilo (XI), que a continuación se desprotege usando un procedimiento adecuado, por ejemplo con solución de hidróxido de potasio, para proporcionar compuestos de la fórmula (X). La reacción de los tioles (XI) con electrófilos de trifluoroetilo de la fórmula (IX) en la que AG representa un grupo saliente tal como, por ejemplo, cloro, bromo, tosilato, mesilato o triflato proporciona los sulfuros (X). Estos últimos se convierten en presencia de ácidos, anhídridos de ácido o cloruros de ácido de la fórmula (VIII) en las correspondientes anilidas (III).
- 20

Los compuestos de las fórmulas (III), (X), (XI), (XII), (XV) y (XVI) en el procedimiento B se pueden preparar en particular en las condiciones citadas en los Ejemplos de preparación.

**Procedimiento C**



en el que  $X^1$ ,  $X^2$ ,  $X^3$ ,  $X^4$ ,  $R^1$ ,  $R^2$  y  $R^3$  tienen los significados dados antes.

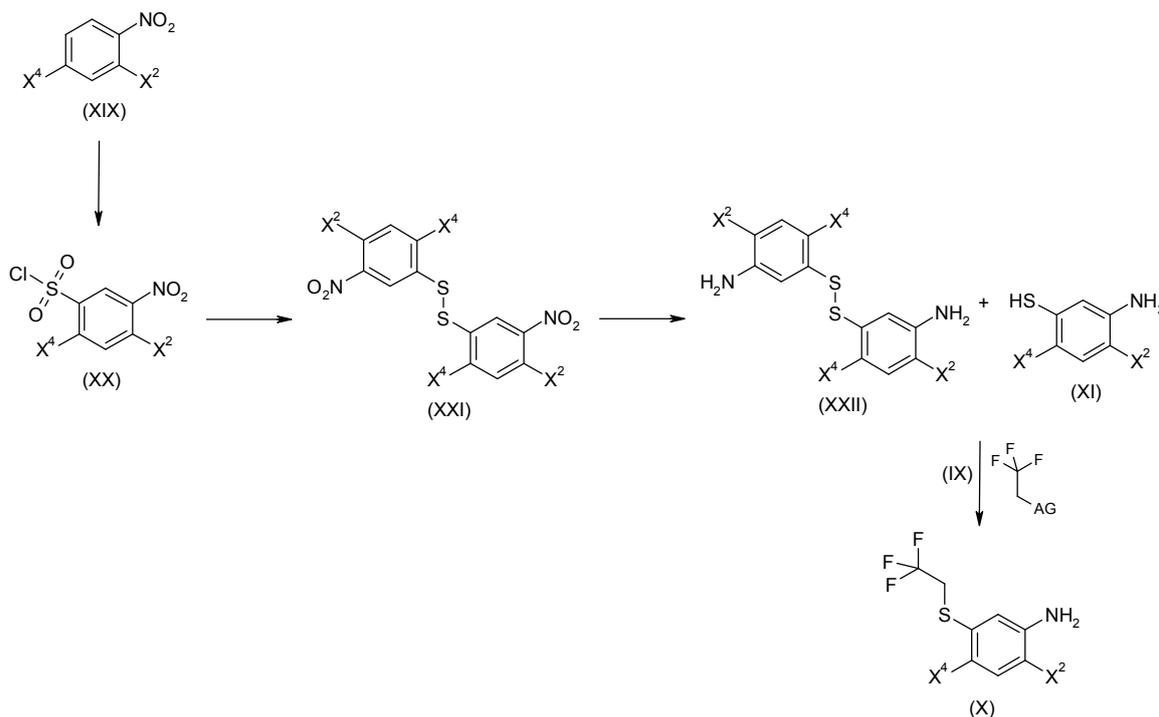
- 5 Se ha encontrado además que los compuestos quirales (Ib) se obtienen por el procedimiento C cuando los compuestos de la fórmula (III) se oxidan de forma quiral a sulfóxidos de la fórmula (XVII).

Las anilidas (XVII) se cloran, por ejemplo con clorofosfato de difenilo o pentacloruro de fósforo, para dar cloruros de imidoilo de la fórmula (XVIII) y se hacen reaccionar con aminas para dar amidinas (Ib).

- 10 Algunos de los compuestos de la fórmula (XVII) en el procedimiento C son novedosos, y se pueden preparar en particular en las condiciones citadas en los Ejemplos de preparación.

**Procedimiento D**

De forma alternativa, los tioéteres de la fórmula (X) se pueden preparar por el procedimiento D.

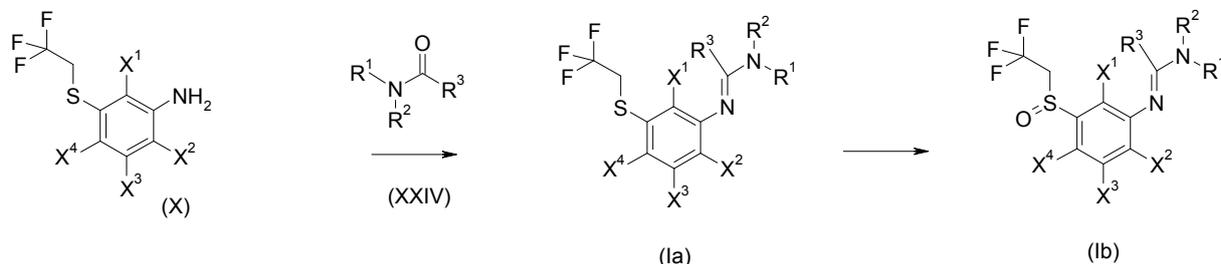


- 15  $X^2$ ,  $X^4$  independientemente uno de otro pueden representar de forma particular y preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo.

- 20 La clorosulfonación de los compuestos nitroarómicos de la fórmula (XIX) con ácido clorosulfónico proporciona los correspondientes cloruros de sulfonilo (XX). La reducción de los cloruros de sulfonilo (XX) a los disulfuros de bis(nitroarilo) (XXI) se puede llevar a cabo usando procedimientos conocidos por la bibliografía, por ejemplo, yoduro. La resolución de los disulfuros (XXI) a las disulfanodiildianilinas (XXII), algunas de las cuales se forman como mezcla con los correspondientes aminoariltioles (XI), es posible usando agentes de reducción tales como, por ejemplo, hidrógeno con la ayuda de catalizadores heterogéneos tales como, por ejemplo, níquel Raney, platino sobre carbón activado o paladio sobre carbón activado. La reacción de los disulfuros (XXII) o tiofenoles (XI) con electrófilos de trifluoroetilo de la fórmula (IX) en la que AG representa un grupo saliente tal como, por ejemplo, cloro, bromo, yodo, tosilato, mesilato o triflato proporciona las 3-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]anilinas de la fórmula (X).

Los compuestos de las fórmulas (X), (XI), (XII), (XX) y (XXI) en el procedimiento D se pueden preparar en particular en las condiciones citadas en los Ejemplos de preparación.

**Procedimiento E**

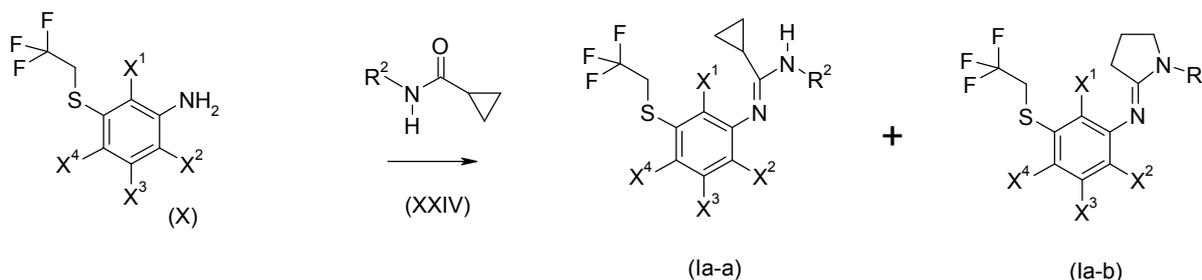


5 en el que X<sup>1</sup>, X<sup>2</sup>, X<sup>3</sup>, X<sup>4</sup>, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> tienen los significados dados antes.

Las anilinas de la fórmula (X) se pueden convertir en los derivados de sulfuro de trifluoroetilo de la fórmula (la) por procedimientos conocidos por la bibliografía, por ejemplo por reacción con amidas de la fórmula (XXIV) y cloruro de fosforilo, si se considera apropiado en presencia de un disolvente orgánico inerte.

10 Los sulfóxidos (lb) se pueden obtener por oxidación de los tioéteres (la) por procedimientos conocidos por la bibliografía.

Las amidas de la fórmula (XXIV) en la que R<sup>3</sup> representa ciclopropilo opcionalmente sustituido y R<sup>1</sup> representa hidrógeno y R<sup>2</sup> representa haloalquilo opcionalmente sustituido proporcionan, cuando se hacen reaccionar con anilinas de la fórmula (X) en presencia de cloruro de fosforilo, una mezcla de las N-arilaminas de acuerdo con la invención de las fórmulas generales (la-a) y (la-b)



15 las que X<sup>1</sup>, X<sup>2</sup>, X<sup>3</sup>, X<sup>4</sup> y R<sup>2</sup> tienen los significados dados antes.

La oxidación de los tioéteres (la-a) por procedimientos conocidos por la bibliografía da sulfóxidos de la fórmula (lb) en la que R<sup>3</sup> representa ciclopropilo opcionalmente sustituido y R<sup>1</sup> representa hidrógeno y R<sup>2</sup> representa haloalquilo opcionalmente sustituido.

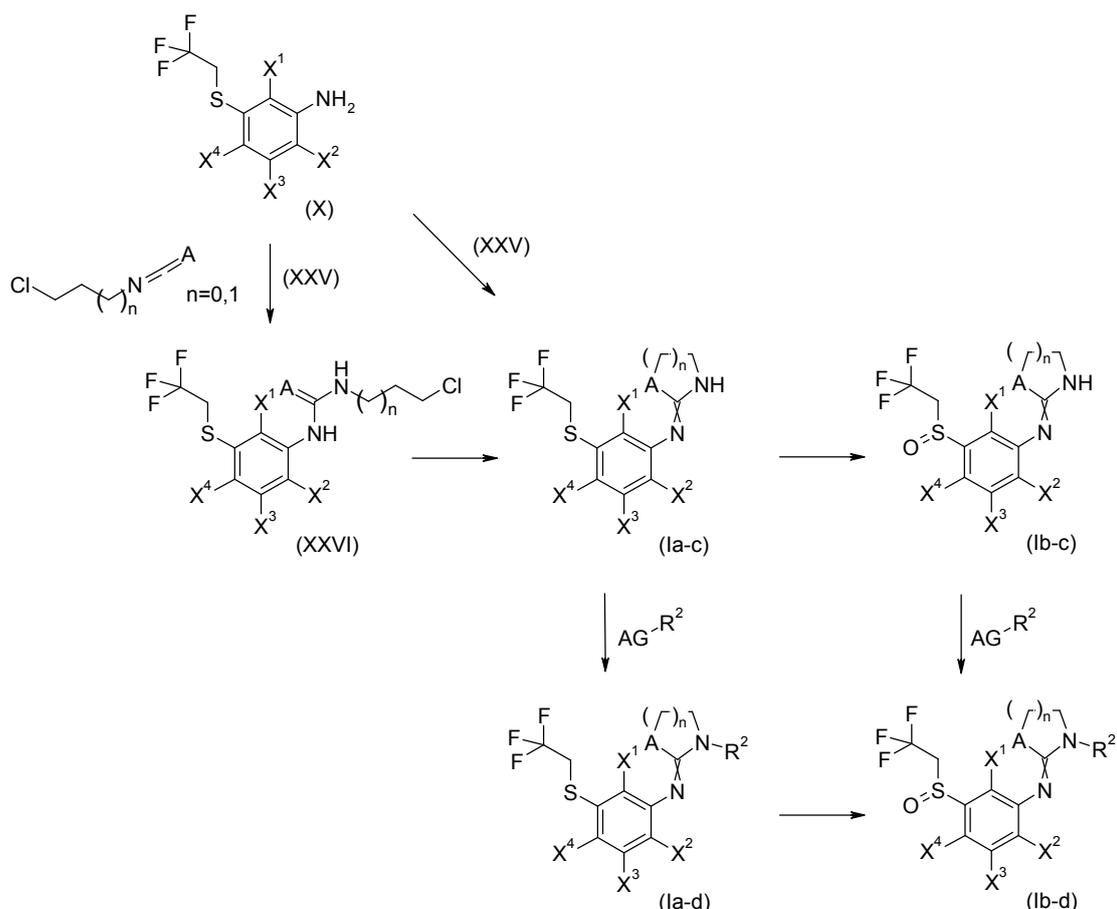
20 La oxidación de los tioéteres (la-b) por procedimientos conocidos por la bibliografía da sulfóxidos de la fórmula (lb) en la que R<sup>1</sup> y R<sup>3</sup> forman juntos un anillo de 5 miembros y R<sup>2</sup> representa haloalquilo opcionalmente sustituido.

25 Las amidas de la fórmula (XXIV) están disponibles de forma comercial o se pueden preparar por procedimientos conocidos de forma general, por ejemplo haciendo reaccionar cloruros de ácido con aminas, opcionalmente en presencia de bases y opcionalmente en presencia de un disolvente, por ejemplo de forma análoga a Houben-Weyl VIII, 655.

Los compuestos de las fórmulas (X) y (XXIV) en el procedimiento E se pueden preparar en particular en las condiciones citadas en los Ejemplos de preparación.

**Procedimiento F**

30 Las 2-arilimino-1,3-tiazolidinas sustituidas en 3 (n=0, A=S), 2-arilimino-1,3-tiazinas (n=1, A=S), 2-arilimino-1,3-oxazolidinas (n=0, A=O) y 2-arilimino-1,3-oxazinas (n=1, A=O) de la fórmula general (I) se pueden preparar, por ejemplo, por el procedimiento F



en el que  $X^1$ ,  $X^2$ ,  $X^3$ ,  $X^4$  y  $R^2$  tienen los significados dados antes.

5 Las anilinas de la fórmula (X) se pueden hacer reaccionar directamente con isocyanatos (XXV, A=O) o isotiocyanatos (XXV, A=S) para dar las amidinas cíclicas de la fórmula (la-c). En el caso del aislamiento de intermedio de las (tio)ureas de la fórmula (XXVI), estas se pueden convertir en presencia de bases en las amidinas cíclicas de la fórmula (la-c).

En la patente JP2011/042611, se reivindican (tio)ureas y sus sulfóxidos como acaricidas. Las (tio)ureas de la fórmula (XXVI) son novedosas y también forman parte del objeto de la invención.

10 Los sulfóxidos de la fórmula (lb-c) se pueden obtener por oxidación de los tioéteres (la-c) por procedimientos conocidos por la bibliografía.

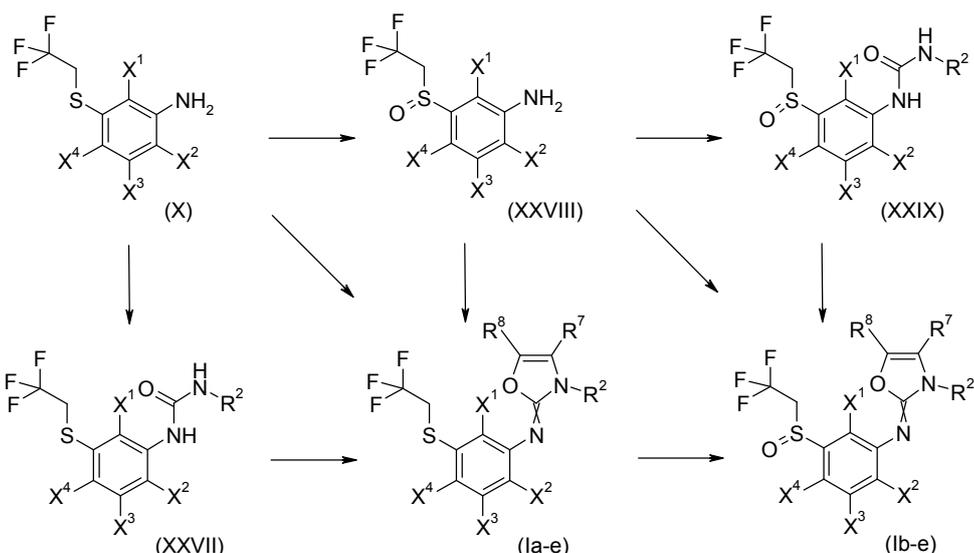
Los tioéteres (la-c) y los sulfóxidos (lb-c) se pueden convertir por procedimientos conocidos por la bibliografía en los compuestos de las fórmulas generales (la-d) y (lb-d), respectivamente, donde  $R^2$  pueden tener los significados dados antes. Agentes alquilantes adecuados son, por ejemplo, haluros de alquilo (cloruros de alquilo, bromuros de alquilo y yoduros de alquilo), triflatos de alquilo, mesilatos de alquilo y sulfatos de dialquilo.

15 Los sulfóxidos de la fórmula (lb) se pueden obtener por oxidación de los tioéteres de la fórmula (la) por procedimientos conocidos por la bibliografía.

Los compuestos de las fórmulas (X) y (XXVI) en el procedimiento F se pueden preparar en particular en las condiciones citadas en los Ejemplos de preparación.

### **Procedimiento G**

20 Los 2-aryl-1,3-oxazoles sustituidos en 3 de la fórmula general (I) se pueden preparar, por ejemplo, por el procedimiento G,



en el que  $X^1$ ,  $X^2$ ,  $X^3$ ,  $X^4$  y  $R^2$  tienen los significados dados antes.

$R^7$  y  $R^8$  son los sustituyentes en el anillo formado por  $R^1$  y  $R^3$  junto con los átomos a los que están unidos.

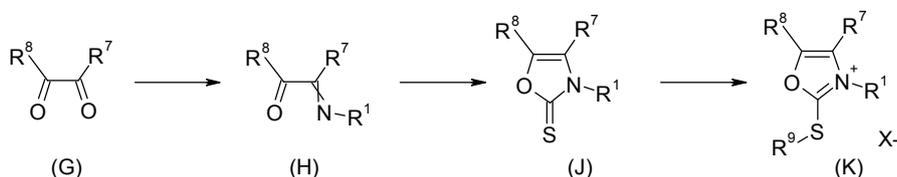
5 Las anilinas de la fórmula (XXVIII) se pueden preparar por oxidación de las anilinas de la fórmula (X), por ejemplo con ácido *meta*-clorobenzoico como agente oxidante en un disolvente orgánico inerte. Las anilinas de la fórmula (XXVII) son novedosas y también forman parte del objeto de la invención.

10 Las anilinas de la fórmula (X) y (XXVIII) se pueden convertir en las ureas de las fórmulas (XXVII) y (XXIX), respectivamente, por procedimientos conocidos por la bibliografía, por ejemplo de acuerdo con el documento JP2011/042611, tratando las mismas con isocianatos, opcionalmente en presencia de una base y opcionalmente en presencia de un disolvente orgánico. De forma alternativa, estas anilinas se pueden convertir por procedimientos conocidos de forma general en sus isocianatos, que se convierten con aminas en las ureas.

15 Los 2-ariliminooxazoles sustituidos en 3 (la-e) y (lb-e) se pueden sintetizar a partir de las ureas (XXVII) y (XXIX), respectivamente, por ejemplo por el procedimiento de M. Han en Bull. Korean Chem. Soc. 2012, 33(4), 1371-1374, en el que, inicialmente, usando tetracloruro de carbono y trifetilfosfina, se prepara una *N*-arilimidoformamida *N'*-sustituida que seguidamente se hace reaccionar con un compuesto de hidroxicarbonilo adecuado en un catalizador de Ku(I) en un disolvente inerte de alto punto de ebullición para proporcionar, de forma selectiva, el 2-ariliminooxazol.

Los sulfóxidos (lb) se pueden obtener por oxidación del tioéter (la) por procedimientos conocidos por la bibliografía.

20 Estos 2-ariliminooxazoles (I) también se pueden sintetizar directamente a partir de las anilinas de la fórmula (X) o (XXVIII), por ejemplo por reacción con 3-alkil-1,3-oxazolinonas de la fórmula (J) o sus sales de oxazolio, opcionalmente en presencia de una base y opcionalmente en un disolvente inerte, en general a altas temperaturas, como se describe por Gompper en Chem. Ber. 1959, 92, 1928-1932.



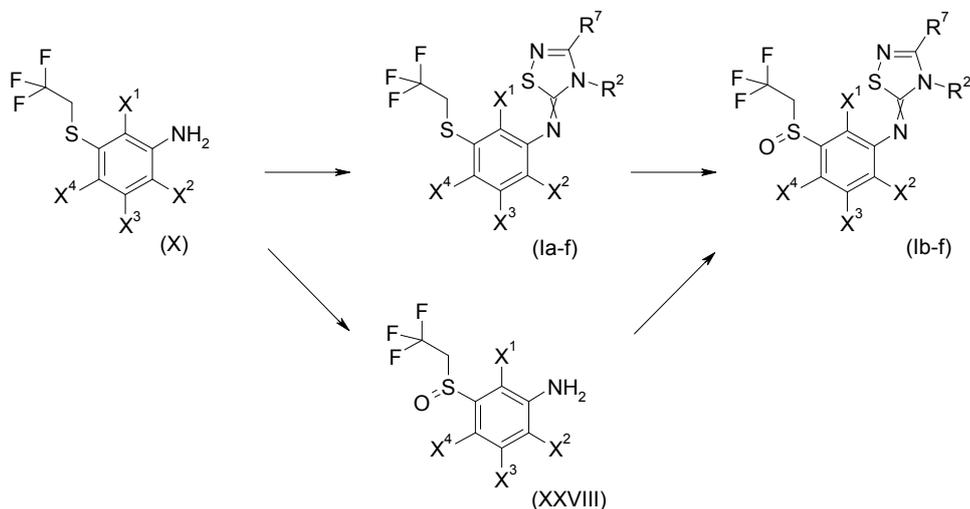
25 Las 1,3-oxazolinonas sustituidas en 3 de la fórmula (J) se pueden obtener de suministradores comerciales o prepararse por procedimientos conocidos por la bibliografía, por ejemplo a partir de compuestos dicarbonílicos de la fórmula (G) mediante la síntesis de intermedios (H), de forma análoga a los procedimientos de K. N. Mehrotra en Bull. Chem. Soc. Jap. 1985, 58 (8), 2399-2402 para  $R^7=R^8$ =arilo, usando disulfuro de carbono como fuente de azufre.

30 Las sales de oxazolio de la fórmula (K) se pueden preparar por alquilación de las correspondientes oxazolinonas de la fórmula (J). Agentes alquilantes adecuados son, por ejemplo, haluros de alquilo (cloruros de alquilo, bromuros de alquilo y yoduros de alquilo), triflatos de alquilo, mesilatos de alquilo y sulfatos de dialquilo. La naturaleza del anión X en la fórmula general (K) se determina por este agente y puede ser, por ejemplo, cloruro, bromuro, yoduro, triflato, mesilato o sulfato.

Los compuestos de las fórmulas (X) y (XXVIII) en el procedimiento G se pueden preparar en particular en las condiciones citadas en los Ejemplos de preparación.

**Procedimiento H**

5 Los 2-ariliminotiadiazoles sustituidos en 3 de la fórmula general (I) se pueden preparar, por ejemplo, por el procedimiento H

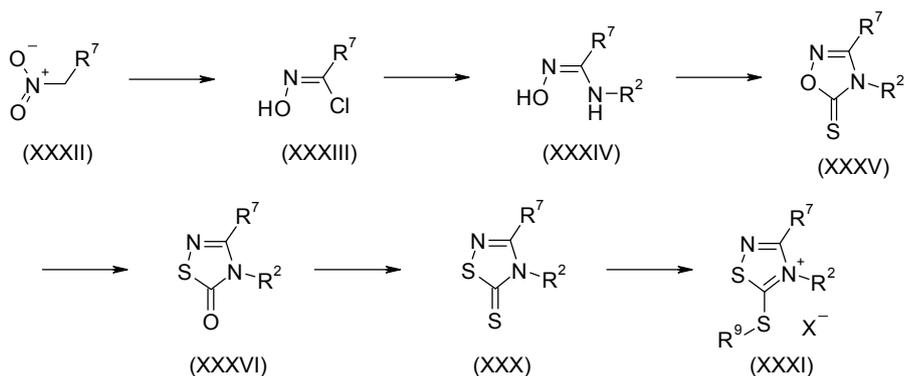


en el que X<sup>1</sup>, X<sup>2</sup>, X<sup>3</sup>, X<sup>4</sup> y R<sup>2</sup> tienen los significados dados antes.

R<sup>7</sup> es el sustituyente en el anillo formado por R<sup>1</sup> y R<sup>3</sup> junto con los átomos a los que están unidos.

10 Las anilinas de la fórmula general (X) o la fórmula general (XXVIII) se pueden hacer reaccionar, por ejemplo, con tiadiazolintionas de la fórmula (XXX) o con las correspondientes sales de tiadiazolio de la fórmula (XXXI) para dar los 2-ariliminotiadiazoles de la fórmula (la-f) y (lb-f), respectivamente. Esto transcurre opcionalmente en presencia de una base, opcionalmente en un disolvente inerte o en un agente que puede servir simultáneamente como base y disolvente, por ejemplo piridina.

15 La síntesis de las tiadiazolintionas de la fórmula (XXX) y sus sales de tiadiazolio (XXXI) se puede llevar a cabo, por ejemplo, por el siguiente procedimiento:



20 La síntesis de amidoximas N-sustituidas de la fórmula (XXXIV) se ha descrito con detalle en la bibliografía. Esta puede ser, por ejemplo, de acuerdo con J. Org. Chem. 1980, 45 (21), 4198 a partir de correspondientes cloruros de imidoilo de la fórmula (XXXIII) por reacción con las aminas deseadas. Opcionalmente, esto tiene lugar en un disolvente inerte a temperaturas de 0 °C a 100 °C con tiempos de reacción de 1 h a 36 h. Para la preparación de los cloruros de imidoilo, es posible aplicar procedimientos conocidos de la bibliografía, por ejemplo, la reacción de los nitrocompuestos apropiados de la fórmula (XXXII) con alcoxilatos, opcionalmente en el alcohol correspondiente como disolvente, seguido de la adición de un agente de cloración, por ejemplo tetracloruro de titanio.

25 La bibliografía divulga una serie de procedimientos para sintetizar oxadiazolintionas de la fórmula (XXXV), por ejemplo la reacción de 1,2,4-oxadiazolín-5-onas con pentasulfuro de fósforo, descrito por D. Sümengen en J. Chem. Soc. Perkin Trans 1 1983, 4, 687-691. Las 1,2,4-oxadiazolín-5-onas requeridas están disponibles de forma comercial o se pueden obtener a partir de las amidoximas N-sustituidas (XXXIV) por reacción con un derivado de halocarbonilo adecuado, como se describe por H. Argibas en Phosp., Sulf., Silicon y rel. elem. 1998, 134/135, 381-319. De forma

alternativa, las oxadiazolinonas se pueden obtener directamente a partir de amidoximas *N*-sustituidas de la fórmula (XXXIV), por ejemplo por reacción con tiosfogeno, como también se publica por D. Sümengen.

5 Para la síntesis de las tiadiazolinonas de la fórmula (XXXVI) a partir de oxadiazolinonas de la fórmula (XXXV), es posible emplear el procedimiento de D. Sümengen en *J. Chem. Soc. Perkin Trans 1* 1983, 4, 687-691: este es una transposición de 1,2,4-oxadiazolin-5-tionas 3,4-disustituidas bajo catálisis de cobre en un disolvente de alto punto de ebullición a temperatura elevada.

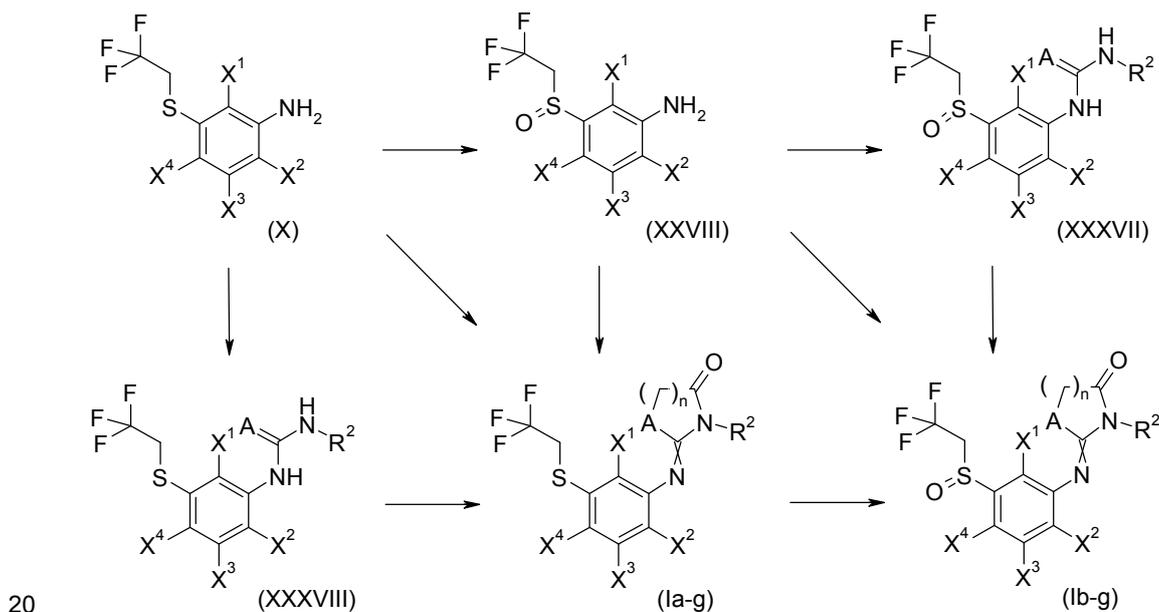
Las tiadiazolinonas de la fórmula (XXX) se pueden preparar, por ejemplo, a partir de tiadiazolinonas de la fórmula (XXXVI) por tratamiento con agentes sulfurizantes adecuados tales como, por ejemplo, pentasulfuro de fósforo o reactivo de Lawesson, opcionalmente en un disolvente inerte a temperaturas de hasta 140 °C.

10 Las sales de tiadiazolio de la fórmula (XXXI) se pueden preparar por procedimientos conocidos por la bibliografía por alquilación de las correspondientes tiadiazolinonas de la fórmula (XXX). Agentes alquilantes adecuados son, por ejemplo, haluros de alquilo (cloruros de alquilo, bromuros de alquilo y yoduros de alquilo), triflatos de alquilo, mesilatos de alquilo y sulfatos de dialquilo.

15 Los compuestos de la fórmula (XXVIII) en el procedimiento H se pueden preparar en particular en las condiciones citadas en los Ejemplos de preparación.

### Procedimiento I

Las 2-arilimino-1,3-oxazolidin-4-onas sustituidas en 3 (A=O, n=0), 2-arilimino-1,3-oxazinan-4-onas (A=O, n=1), 2-arilimino-1,3-tiazolidin-4-onas (A=S, n=0) y 2-arilimino-1,3-tiazinan-4-onas (A=S, n=1) de la fórmula general (I) se pueden preparar, por ejemplo, por el procedimiento I



en el que  $X^1$ ,  $X^2$ ,  $X^3$ ,  $X^4$  y  $R^2$  tienen los significados dados antes y  $n$  pueden representar 0 o 1.

25 Las anilinas de la fórmula (X) y (XXVIII) se pueden convertir en las ureas (A=O) y tioureas (S) de las fórmulas (XXXVIII) y (XXXVII), respectivamente, por procedimientos conocidos por la bibliografía, por ejemplo de acuerdo con el documento JP2011/042611, tratándolas con isocianatos (para A=O) e isotiocianatos (para A=S), opcionalmente en presencia de una base y opcionalmente en presencia de un disolvente orgánico o convirtiéndolas por procedimientos conocidos de forma general en sus isocianatos (A=O) e isotiocianatos (A=S) y haciendo reaccionar estos con aminas para dar las tioureas.

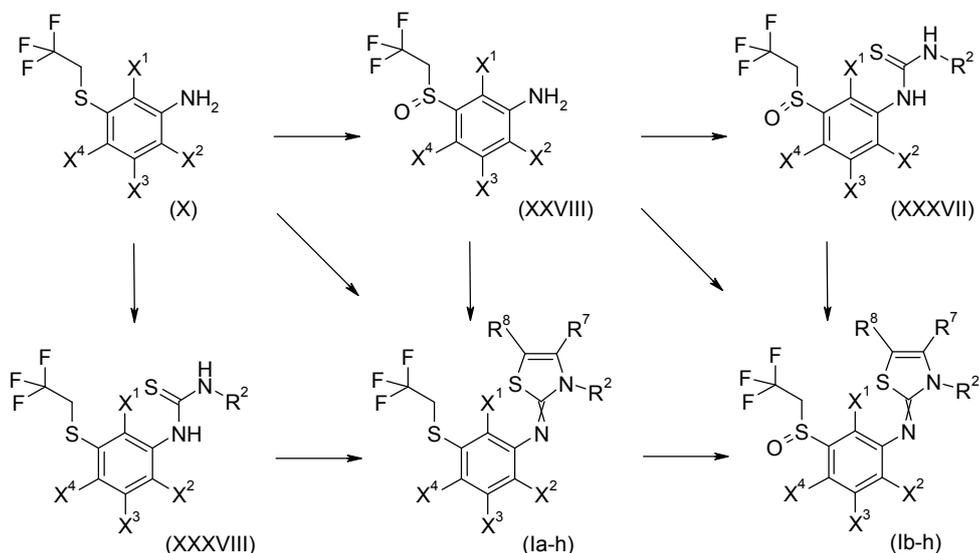
30 A partir de las ureas (A=O) y tioureas (A=S) de las fórmulas generales (XXXVIII) y (XXXVII), respectivamente, es posible sintetizar las 2-arilimino-1,3-oxazolidin-4-onas (A=O) y -tiazolidin-4-onas (A=S) de las fórmulas generales (Ia-g) y (Ib-g), respectivamente, por ejemplo, por cicloadición con un derivado de halocarbonilo adecuado en un disolvente inerte, en la mayoría de los casos a temperaturas superiores a los 100 °C. Derivados de halocarbonilo adecuados son, por ejemplo, para  $n=0$ , ácido cloroacético y su cloruro de ácido, ácido bromoacético y su cloruro o bromuro de ácido; para  $n=1$  la bibliografía cita cloruros de 2-propenoilo sustituidos en 3, como se describe por C. F. Howell en *J. Org. Chem.* 1962, 27, 1686 y 1691 para conversiones análogas en oxazolidinonas y V.N.Britsun en *Russ. J. Org. Chem.* 2006, 41 (11), 1719-1729 para tiazolidinonas.

35

Los compuestos de las fórmulas (XXVIII), (XXXVIII) y (XXXVII) en el procedimiento I se pueden preparar en particular en las condiciones citadas en los Ejemplos de preparación.

**Procedimiento J**

5 Los 2-arilimino-1,3-tiazoles sustituidos en 3 de la fórmula general (I) se pueden preparar, por ejemplo, por el procedimiento J,



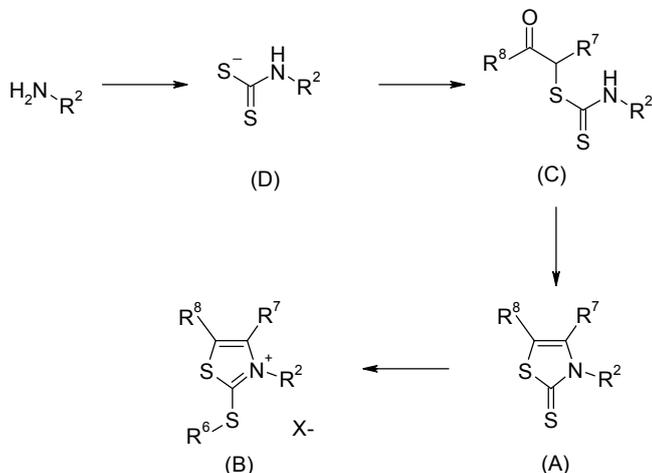
en el que X<sup>1</sup>, X<sup>2</sup>, X<sup>3</sup>, X<sup>4</sup> y R<sup>2</sup> tienen los significados dados antes.

R<sup>7</sup> y R<sup>8</sup> son los sustituyentes en el anillo formado por R<sup>1</sup> y R<sup>3</sup> junto con los átomos a los que están unidos.

10 Los 2-ariliminotiazoles sustituidos en 3 (Ia-h) y (Ib-h) se pueden sintetizar a partir de las tioureas (XXXVIII) y (XXXVII), respectivamente, por ejemplo por reacción con un derivado de halocarbonilo adecuado en un disolvente inerte. Esto puede tener lugar, por ejemplo, por cicloadición con compuestos α-haloceto o derivados de los mismos, por ejemplo con 3-bromo-2-butanona para R<sup>7</sup>=R<sup>8</sup>=metilo, como se describe por A. Yahyazadeh en J. Pharm. Res. 1998, 9, 536-537(S), 2126-2139(M), o con 2-cloro-1,1-dietoxietano para R<sup>7</sup>=R<sup>8</sup>=H como se describe en la patente US4079144.

15 Los sulfóxidos (Ib) se pueden obtener por oxidación del tioéter (Ia) por procedimientos conocidos por la bibliografía. Para este propósito se pueden emplear procedimientos conocidos de enriquecimiento enantioselectivo de los sulfóxidos.

20 Estos 2-arilimino-1,3-tiazoles (I) también se pueden sintetizar directamente a partir de las anilinas de la fórmula (X) o (XXVIII), por ejemplo por reacción con 3-alkil-1,3-tiazolintionas de la fórmula (A) o sus sales de tiazolio, opcionalmente en presencia de una base y opcionalmente en un disolvente inerte.



Las 1,3-tiazolintionas sustituidas en 3 de la fórmula (A) se pueden obtener de suministradores comerciales o

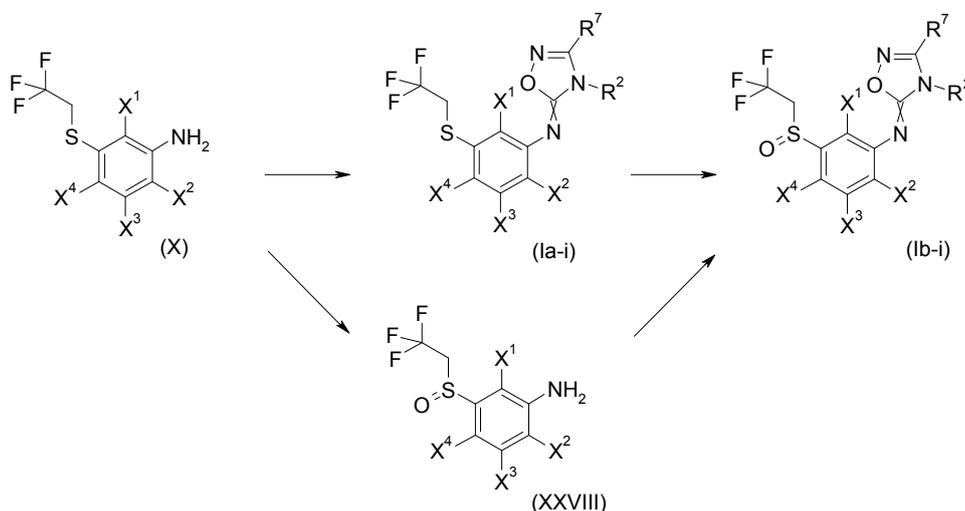
5 prepararse por procedimientos conocidos por la bibliografía como se describe, por ejemplo, por K. Janikowska en Phosp. Sulf. Sil. and rel. elem. 2011, 186(1), 12-20. Como en J. Amer. Chem. Soc. 1987, 109 (2), 492-507, se puede hacer reaccionar las aminas con disulfuro de carbono par dar ditiocarbamatos de la fórmula (D) que, a continuación, usando una halocarbonil sintona adecuada, proporcionan compuestos alquilados de la fórmula (C). Compuestos halocarbonílicos adecuados son, por ejemplo, cloroetanal o 2-cloro-1,1-dietoxietano para  $R^7=R^8=H$ , cloropropanona para  $R^7=H$  y  $R^8=metilo$ , 3-bromo-2-butanona para  $R^7=R^8=metilo$ , 2-bromo-3-pentanona para  $R^7=metilo$  y  $R^8=etilo$ , etc. Los compuestos de la fórmula (C) se pueden ciclar espontáneamente a las tiazolinaciones (A) deseadas o solo después de la deshidratación, en la mayoría de los casos en condiciones ácidas y con calentamiento.

10 Las sales de tiazolinio de la fórmula (B) se pueden preparar por alquilación de las correspondientes tiadiazolintionas de la fórmula (B). Agentes alquilantes adecuados son, por ejemplo, haluros de alquilo (cloruros de alquilo, bromuros de alquilo y yoduros de alquilo), triflato de alquilo, mesilatos de alquilo y sulfatos de dialquilo.

Los compuestos de las fórmulas (XXVIII), (XXXVII) y (XXXVIII) en el procedimiento J se pueden preparar en particular en las condiciones citadas en los Ejemplos de preparación.

**Procedimiento K**

15 Los 2-ariliminoxadiazoles sustituidos en 3 de la fórmula general (I) se pueden preparar, por ejemplo, por el procedimiento K

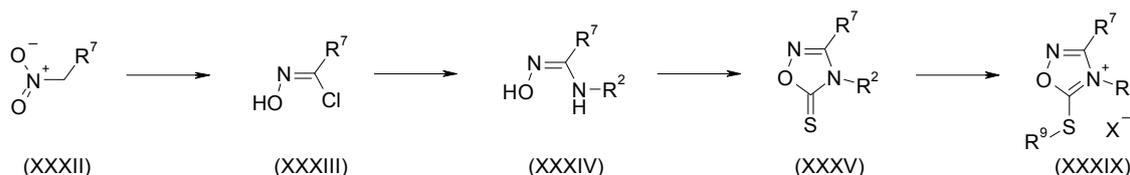


en el que X<sup>1</sup>, X<sup>2</sup>, X<sup>3</sup>, X<sup>4</sup> y R<sup>2</sup> tienen los significados dados antes.

R<sup>7</sup> es el sustituyente en el anillo formado por R<sup>1</sup> y R<sup>3</sup> junto con los átomos a los que están unidos.

20 Las anilinas de la fórmula general (X) o la fórmula general (XXVIII) se pueden hacer reaccionar, por ejemplo, con oxadiazolintionas de la fórmula (XXXV) o con las correspondientes sales de oxadiazolio de la fórmula (XXXIX) para dar los 2-ariliminoxadiazoles de la fórmula (la-i) y (lb-i), respectivamente. Esto transcurre opcionalmente en presencia de una base, opcionalmente en un disolvente inerte o en un agente pueda asumir ambas funciones, por ejemplo piridina.

25 La síntesis de las oxadiazolintionas de la fórmula (XXXV) y sus sales de oxazolio (XXXIX) se puede llevar a cabo, por ejemplo, por el siguiente procedimiento:



30 Las sales de oxadiazolio de la fórmula (XXXIX) se pueden preparar por procedimientos conocidos por la bibliografía por alquilación de las correspondientes oxadiazolintionas de la fórmula (XXXV). Agentes alquilantes adecuados son, por ejemplo, haluros de alquilo (cloruros de alquilo, bromuros de alquilo y yoduros de alquilo), triflato de alquilo, mesilatos de alquilo y sulfatos de dialquilo.

Los compuestos de la fórmula (XXVIII) en el procedimiento K se pueden preparar en particular en las condiciones citadas en los Ejemplos de preparación.

Todos estos procedimientos conducen a los compuestos de la fórmula general (I) de acuerdo con la invención.

Los principios activos de acuerdo con la invención, en combinación con una buena tolerancia por las plantas y toxicidad aceptable para animales de sangre caliente y siendo bien tolerados por el medio ambiente, son adecuados para proteger plantas y órganos de plantas, para aumentar el rendimiento de las cosechas, para mejorar la calidad del producto cosechado y para combatir plagas animales, en particular insectos, arácnidos, helmintos, nematodos y moluscos que se encuentran en agricultura, en horticultura, en la cría de animales, en bosques, en jardines e instalaciones de recreo, en la protección de productos almacenados y de materiales y en el sector de la higiene. Pueden emplearse con preferencia como agentes de protección de cultivos. Son eficaces contra especies normalmente sensibles y resistentes y contra todos o algunos estadios de desarrollo. Las plagas mencionadas anteriormente incluyen:

Del orden de los anopluros (Phthiraptera), por ejemplo, *Damalinea* spp., *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Trichodectes* spp.

De la clase de los arácnidos, por ejemplo, *Acarus* spp., *Aceria sheldoni*, *Aculops* spp., *Aculus* spp., *Amblyomma* spp., *Amphitetranychus viennensis*, *Argas* spp., *Boophilus* spp., *Brevipalpus* spp., *Bryobia praetiosa*, *Chorioptes* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Eotetranychus* spp., *Epirimerus pyri*, *Eutetranychus* spp., *Eriophyes* spp., *Halotydeus destructor*, *Hemitarsonemus* spp., *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Latrodectus mactans*, *Metatetranychus* spp., *Nuphessa* spp., *Oligonychus* spp., *Ornithodoros* spp., *Panonychus* spp., *Phyllocoptura oleivora*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Psoroptes* spp., *Rhipicephalus* spp., *Rhizoglyphus* spp., *Sarcoptes* spp., *Scorpio maurus*, *Stenotarsonemus* spp., *Tarsonemus* spp., *Tetranychus* spp., *Vasates lycopersici*.

De la clase de los bivalvos, por ejemplo, *Dreissena* spp.

Del orden de los quilópodos, por ejemplo *Geophilus carpophagus* y *Scutigera* spp.

Del orden de los coleópteros, por ejemplo, *Acalymma vittatum*, *Acanthoscelides obtectus*, *Adoretus* spp., *Agelastica alni*, *Agriotes* spp., *Amphimallon solstitialis*, *Anobium punctatum*, *Anoplophora* spp., *Anthonomus* spp., *Anthrenus* spp., *Apion* spp., *Apogonia* spp., *Atomaria* spp., *Attagenus* spp., *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp., *Cassida* spp., *Cerotoma trifurcata*, *Ceutorrhynchus* spp., *Chaetocnema* spp., *Cleonus mendicus*, *Conoderus* spp., *Cosmopolites* spp., *Costelytra zealandica*, *Ctenicera* spp., *Curculio* spp., *Cryptorhynchus lapathi*, *Cylindrocopturus* spp., *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp., *Dichocrocis* spp., *Diloboderus* spp., *Epilachna* spp., *Epitrix* spp., *Faustinus* spp., *Gibbium psylloides*, *Hellula undalis*, *Heteronychus arator*, *Heteronyx* spp., *Hylamorpha elegans*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera postica*, *Hypothenemus* spp., *Lachnosterna consanguinea*, *Lema* spp., *Leptinotarsa decemlineata*, *Leucoptera* spp., *Lissorhoptus oryzophilus*, *Lixus* spp., *Luperodes* spp., *Lyctus* spp., *Megascelis* spp., *Melanotus* spp., *Meligethes aeneus*, *Melolontha* spp., *Migdolus* spp., *Monochamus* spp., *Naupactus xanthographus*, *Niptus hololeucus*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Oryzaphagus oryzae*, *Otiorrhynchus* spp., *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllophaga* spp., *Phyllotreta* spp., *Popillia japonica*, *Premnotrypes* spp., *Psylliodes* spp., *Ptinus* spp., *Rhizobius ventralis*, *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus* spp., *Sphenophorus* spp., *Sternechus* spp., *Symphyletes* spp., *Tanymecus* spp., *Tenebrio molitor*, *Tribolium* spp., *Trogoderma* spp., *Tychius* spp., *Xylotrechus* spp., *Zabrus* spp..

Del orden de los colémbolos, por ejemplo, *Onychiurus armatus*.

Del orden de los diplópodos, por ejemplo, *Blaniulus guttulatus*.

Del orden de los dípteros, por ejemplo, *Aedes* spp., *Agromyza* spp., *Anastrepha* spp., *Anopheles* spp., *Asphondylia* spp., *Bactrocera* spp., *Bibio hortulanus*, *Calliphora erythrocephala*, *Ceratitis capitata*, *Chironomus* spp., *Chrysomyia* spp., *Cochliomyia* spp., *Contarinia* spp., *Cordylobia anthropophaga*, *Culex* spp., *Cuterebra* spp., *Dacus oleae*, *Dasyneura* spp., *Delia* spp., *Dermatobia hominis*, *Drosophila* spp., *Echinocnemus* spp., *Fannia* spp., *Gastrophilus* spp., *Hydrellia* spp., *Hylemyia* spp., *Hyppobosca* spp., *Hypoderma* spp., *Liriomyza* spp., *Lucilia* spp., *Musca* spp., *Nezara* spp., *Oestrus* spp., *Oscinella frit*, *Pegomyia* spp., *Phorbia* spp., *Prodiplosis* spp., *Psila rosae*, *Rhagoletis* spp., *Stomoxys* spp., *Tabanus* spp., *Tannia* spp., *Tetanops* spp., *Tipula* spp.

De la clase de los gasterópodos, por ejemplo, *Arion* spp., *Biomphalaria* spp., *Bulinus* spp., *Deroceas* spp., *Galba* spp., *Lymnaea* spp., *Oncomelania* spp., *Pomacea* spp., *Succinea* spp.

De la clase de los helmintos, por ejemplo, *Ancylostoma duodenale*, *Ancylostoma ceylanicum*, *Acylostoma braziliensis*, *Ancylostoma* spp., *Ascaris lubricoides*, *Ascaris* spp., *Brugia malayi*, *Brugia timori*, *Bunostomum* spp., *Chabertia* spp., *Clonorchis* spp., *Cooperia* spp., *Dicrocoelium* spp., *Dictyocaulus filaria*, *Diphyllobothrium latum*, *Dracunculus medinensis*, *Echinococcus granulosus*, *Echinococcus multilocularis*, *Enterobius vermicularis*, *Faciola* spp., *Haemonchus* spp., *Heterakis* spp., *Hymenolepis nana*, *Hyostrongylus* spp., *Loa Loa*, *Nematodirus* spp., *Oesophagostomum* spp., *Opisthorchis* spp., *Onchocerca volvulus*, *Ostertagia* spp., *Paragonimus* spp., *Schistosomen* spp., *Strongyloides fuelleborni*, *Strongyloides stercoralis*, *Strongyloides* spp., *Taenia saginata*, *Taenia solium*, *Trichinella spiralis*, *Trichinella nativa*, *Trichinella britovi*, *Trichinella nelsoni*, *Trichinella pseudopsiralis*, *Trichostrongylus* spp., *Trichuris trichuria*, *Wuchereria bancrofti*. *Ancylostoma duodenale*, *Ancylostoma ceylanicum*, *Acylostoma braziliensis*, *Ancylostoma* spp., *Ascaris lubricoides*, *Ascaris* spp., *Brugia malayi*, *Brugia timori*, *Bunostomum* spp., *Chabertia* spp., *Clonorchis* spp., *Cooperia* spp., *Dicrocoelium* spp., *Dictyocaulus filaria*,

Diphyllobothrium latum, Dracunculus medinensis, Echinococcus granulosus, Echinococcus multilocularis, Enterobius vermicularis, Faciola spp., Haemonchus spp., Heterakis spp., Hymenolepis nana, Hyostrongylus spp., Loa Loa, Nematodirus spp., Oesophagostomum spp., Opisthorchis spp., Onchocerca volvulus, Ostertagia spp., Paragonimus spp., Schistosomen spp., Strongyloides fuelleborni, Strongyloides stercoralis, Strongyloides spp., Taenia saginata, 5 Taenia solium, Trichinella spiralis, Trichinella nativa, Trichinella britovi, Trichinella nelsoni, Trichinella pseudospiralis, Trichostrongylus spp., Trichuris trichuria, Wuchereria bancrofti.

Además, es posible combatir protozoos, tales como Eimeria.

Del orden de los heterópteros, por ejemplo, Anasa tristis, Antestiopsis spp., Blissus spp., Calocoris spp., Campylomma livida, Cavellerius spp., Cimex spp., Collaria spp., Creontiades dilutus, Dasynus piperis, Dichelops 10 furcatus, Diconocoris hewetti, Dysdercus spp., Euschistus spp., Eurygaster spp., Heliopeltis spp., Horcias nobilellus, Leptocoris spp., Leptoglossus phyllopus, Lygus spp., Macropes excavatus, Miridae, Monalonia atratum, Nezara spp., Oebalus spp., Pentomidae, Piesma quadrata, Piezodorus spp., Psallus seriatus, Pseudacysta perseae, Rhodnius spp., Sahlbergella singularis, Scaptocoris castanea, Scotinophora spp., Stephanitis nashi, Tibraca spp., Triatoma spp.

15 Del orden de los homópteros, por ejemplo, Acyrthosipon spp., Acrogonia spp., Aeneolamia spp., Agonoscena spp., Aleurodes spp., Aleurolobus barodensis, Aleurothrixus spp., Amrasca spp., Anuraphis cardui, Aonidiella spp., Aphanostigma piri, Aphis spp., Arboridia apicalis, Aspidiella spp., Aspidiotus spp., Atanus spp., Aulacorthum solani, Bemisia spp., Brachycaudus helichrysi, Brachycolus spp., Brevicoryne brassicae, Calligypona marginata, Carnecephala fulgida, Ceratovacuna lanigera, Cercopidae, Ceroplastes spp., Chaetosiphon fragaefolii, Chionaspis 20 tegalensis, Chlorita onukii, Chromaphis juglandicola, Chrysomphalus ficus, Cicadulina mbila, Cocomytilus halli, Coccus spp., Cryptomyzus ribis, Dalbulus spp., Dialeurodes spp., Diaphorina spp., Diaspis spp., Drosicha spp., Dysaphis spp., Dymicoccus spp., Empoasca spp., Eriosoma spp., Erythroneura spp., Euscelis bilobatus, Ferrisia spp., Geococcus coffeae, Hieroglyphus spp., Homalodisca coagulata, Hyalopterus arundinis, Icerya spp., Idiocerus spp., Idioscopus spp., Laodelphax striatellus, Lecanium spp., Lepidosaphes spp., Lipaphis erysimi, Macrosiphum 25 spp., Mahanarva spp., Melanaphis sacchari, Metcalfiella spp., Metopolophium dirhodum, Monellia costalis, Monelliopsis pecanis, Myzus spp., Nasonovia ribisnigri, Nephrotettix spp., Nilaparvata lugens, Oncometopia spp., Orthezia praelonga, Parabemisia myricae, Paratrioza spp., Parlatoria spp., Pemphigus spp., Pergrinus maidis, Phenacoccus spp., Phloeomyzus passerinii, Phorodon humuli, Phylloxera spp., Pinnaspis aspidistrae, Planococcus spp., Protospulvinaria pyriformis, Pseudaulacaspis pentagona, Pseudococcus spp., Psylla spp., Pteromalus spp., 30 Pyrilla spp., Quadraspidiotus spp., Quesada gigas, Rastrococcus spp., Rhopalosiphum spp., Saissetia spp., Scaphoides titanus, Schizaphis graminum, Selenaspis articulatus, Sogata spp., Sogatella furcifera, Sogatodes spp., Stictocephala festina, Tenalaphara malayensis, Tinocallis caryaefoliae, Tomaspis spp., Toxoptera spp., Trialeurodes spp., Trioza spp., Typhlocyba spp., Unaspis spp., Viteus vitifolii, Zyginia spp.

Del orden de los himenópteros, por ejemplo, Athalia spp., Diprion spp., Hoplocampa spp., Lasius spp., Monomorium 35 pharaonis, Vespa spp.

Del orden de los isópodos, por ejemplo, Armadillidium vulgare, Oniscus asellus, Porcellio scaber.

Del orden de los isópteros, por ejemplo, Acromyrmex spp., Atta spp., Cornitermes cumulans, Microtermes obesi, Odontotermes spp., Reticulitermes spp.

Del orden de los lepidópteros, por ejemplo, Acronicta major, Adoxophyes spp., Aedia leucomelas, Agrotis spp., 40 Alabama spp., Amyeloides transitella, Anarsia spp., Anticarsia spp., Argyroploce spp., Barathra brassicae, Borbo cinnara, Bucculatrix thurberiella, Bupalus piniarius, Busseola spp., Cacoecia spp., Caloptilia theivora, Capua reticulana, Carpocapsa pomonella, Carposina niponensis, Cheimatomia brumata, Chilo spp., Choristoneura spp., Clysia ambiguella, Cnaphalocerus spp., Cnephasia spp., Conopomorpha spp., Conotrachelus spp., Copitarsia spp., Cydia spp., Dalaca noctuides, Diaphania spp., Diatraea saccharalis, Earias spp., Ecdytoplopha aurantium, 45 Elasmopalpus lignosellus, Eldana saccharina, Ephestia kuehniella, Epinotia spp., Epiphyas postvittana, Etiella spp., Eulia spp., Eupoecilia ambiguella, Euproctis spp., Euxoa spp., Feltia spp., Galleria mellonella, Gracillaria spp., Grapholitha spp., Hedylepta spp., Helicoverpa spp., Heliothis spp., Hofmannophila pseudospretella, Homoeosoma spp., Homona spp., Hyponomeuta padella, Kakivoria flavofasciata, Laphygma spp., Laspeyresia molesta, Leucinodes orbonalis, Leucopetra spp., Lithocolletis spp., Lithophane antennata, Lobesia spp., Loxagrotis albicosta, 50 Lymantria spp., Lyonetia spp., Malacosoma neustria, Maruca testulalis, Mamestra brassicae, Mocsis spp., Mythimna separata, Nymphula spp., Oiketicus spp., Oriia spp., Orthaga spp., Ostrinia spp., Oulema oryzae, Panolis flammea, Parnara spp., Pectinophora spp., Perileucoptera spp., Phthorimaea spp., Phyllocnistis citrella, Phyllonorycter spp., Pieris spp., Platynota stultana, Plusia spp., Plutella xylostella, Prays spp., Prodenia spp., Protoperce spp., Pseudaletia spp., Pseudoplusia includens, Pyrausta nubilalis, Rachiplusia nu, Schoenobius spp., Scirpophaga spp., 55 Scotia segetum, Sesamia spp., Sparganothis spp., Spodoptera spp., Stathmopoda spp., Stomopteryx subsecivella, Synanthedon spp., Tecia solanivora, Thermesia gemmatilis, Tinea pellionella, Tinea bisselliella, Tortrix spp., Trichoplusia spp., Tuta absoluta, Virachola spp.

Del orden de los ortópteros, por ejemplo, Acheta domesticus, Blatta orientalis, Blattella germanica, Dichroplus spp., Grylotalpa spp., Leucophaea maderae, Locusta spp., Melanoplus spp., Periplaneta americana, Schistocerca

gregaria.

Del orden de los sifonápteros, por ejemplo, *Ceratophyllus* spp. y *Xenopsylla cheopis*.

Del orden de los sínfilos, por ejemplo, *Scutigera* spp.

5 Del orden de los tisanópteros, por ejemplo, *Anaphothrips obscurus*, *Baliothrips biformis*, *Drepanothrips reuteri*, *Enneothrips flavens*, *Frankliniella* spp., *Heliothrips* spp., *Hercinothrips femoralis*, *Rhipiphorotherips cruentatus*, *Scirtothrips* spp., *Taeniothrips cardamoni*, *Thrips* spp.

Del orden de los tisanuros, por ejemplo, *Lepisma saccharina*.

10 Los nematodos fitoparasitos incluyen, por ejemplo, *Aphelenchoides* spp., *Bursaphelenchus* spp., *Ditylenchus* spp., *Globodera* spp., *Heterodera* spp., *Longidorus* spp., *Meloidogyne* spp., *Pratylenchus* spp., *Radopholus similis*, *Trichodorus* spp., *Tylenchulus semipenetrans*, *Xiphinema* spp.

15 Si es apropiado, los compuestos de acuerdo con la invención pueden, a determinadas concentraciones o tasas de aplicación, usarse también como herbicidas, protectores, reguladores del crecimiento o agentes para mejorar las propiedades de la planta, o como microbicidas, por ejemplo como fungicidas, antimicóticos, bactericidas, viricidas (incluidos agentes contra viroides) o como agentes contra MLO (organismos similares a micoplasma) y RLO (organismos similares a rickettsia). Si es apropiado, pueden emplearse también como intermedios o precursores para la síntesis de otros principios activos.

20 La presente invención se refiere además a formulaciones y formas de uso preparadas a partir de las mismas como composiciones para la protección de cultivos y/o plaguicidas, por ejemplo, licores para empapamiento, goteo y pulverización, que comprenden al menos uno de los principios activos de acuerdo con la invención. Las formas de uso comprenden opcionalmente agentes protectores de cultivos y/o pesticidas y/o adyuvantes mejoradores de la acción, tales como potenciadores de penetración, por ejemplo, aceites de parafina, alquilésteres de ácidos grasos vegetales, por ejemplo, éster metílico de aceite de colza o éster metílico de aceite de soja, o alcoxilatos de alcanoles y/o dispersantes, por ejemplo, alquilsiloxanos, y/o sales, por ejemplo, sales orgánicas o inorgánicas de amonio o de fosfonio, por ejemplo, sulfato de amonio o hidrogenofosfato de diamonio, y/o promotores de retención, por ejemplo, sulfosuccinato de dioctilo o polímeros de hidroxipropil guar, y/o humectantes, por ejemplo, glicerol, y/o fertilizantes, por ejemplo fertilizantes que contienen amonio, potasio o fósforo.

30 Las formulaciones habituales son, por ejemplo, líquidos hidrosolubles (LH), concentrados de emulsión (CE), emulsiones en agua (EA), concentrados de suspensión (SC, SE, FS, OD), gránulos dispersables en agua (GA), gránulos (GR) y concentrados en cápsulas (CC); estos y otros posibles tipos de formulación se describen, por ejemplo, en Crop Life International y en las Especificaciones de Plaguicidas, Manual sobre el desarrollo y uso de las especificaciones FAO y WHO para plaguicidas, los Documentos sobre Protección y Producción de Plantas FAO – 173, preparados por la reunión conjunta de la FAO/WHO sobre Especificaciones de Plaguicidas, 2004, ISBN: 9251048576. Las formulaciones opcionalmente comprenden, además de uno o más ingredientes activos de la invención, otros ingredientes agroquímicos activos.

35 Estas son preferentemente formulaciones o formas de uso que comprenden auxiliares, por ejemplo, diluyentes, disolventes, promotores de la espontaneidad, vehículos, emulsionantes, dispersantes, anticongelantes, biocidas, espesantes y/u otros auxiliares, por ejemplo adyuvantes. Un adyuvante en este contexto es un componente que intensifica el efecto biológico de la formulación sin que el propio componente tenga un efecto biológico. Ejemplos de adyuvantes son agentes que promueven la retención, dispersión, unión a la superficie de la hoja o penetración.

40 Estas formulaciones se producen de una manera conocida, por ejemplo, mezclando los principios activos con auxiliares, por ejemplo diluyentes, disolventes y/o vehículos sólidos y/u otros auxiliares, por ejemplo tensioactivos. Las formulaciones se producen o bien en las plantas adecuadas para la producción o bien antes o durante la aplicación.

45 Los auxiliares que se usan pueden ser sustancias adecuadas para impartir propiedades especiales, tales como ciertas propiedades físicas, técnicas y/o biológicas, a la formulación del ingrediente activo, o a las formas de uso preparadas a partir de estas formulaciones (por ejemplo composiciones para la protección de cultivos listos para usar tales como licores para pulverización o productos para el tratamiento de semillas).

50 Diluyentes adecuados son, por ejemplo, agua, líquidos químicos orgánicos polares y no polares, por ejemplo de las clases de los hidrocarburos aromáticos y no aromáticos (tales como parafinas, alquilbencenos, alquilnaftalenos, clorobencenos), de los alcoholes y polioles (que pueden, si fuera apropiado, estar sustituidos, eterificados o esterificados), de las cetonas (tales como acetona, ciclohexanona), ésteres (incluidos grasos y oleaginosos) y (poli)éteres; aminas, amidas, lactamas (como la N-alquilpirrolidona) y lactonas, no sustituidas o sustituidas, sulfonas y sulfóxidos (tales como dimetil sulfóxido).

55 Si el diluyente usado es agua, también es posible emplear, por ejemplo, disolventes orgánicos como codisolventes. Disolventes líquidos útiles son esencialmente: compuestos aromáticos, tales como xileno, tolueno o alquilnaftalenos,

- 5 compuestos aromáticos clorados o hidrocarburos alifáticos clorados, tales como clorobencenos, cloroetilenos o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos, tales como ciclohexano o parafinas, por ejemplo, fracciones de aceites minerales, aceites minerales y vegetales, alcoholes tales como butanol o glicol y sus éteres y ésteres, cetonas, tales como acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona o ciclohexanona, disolventes fuertemente polares, tales como dimetilformamida y dimetilsulfóxido, y también agua.
- 10 En principio, es posible usar todos los disolventes adecuados. Ejemplos de disolventes adecuados son: hidrocarburos aromáticos tales como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, hidrocarburos aromáticos clorados o hidrocarburos alifáticos clorados tales como clorobenceno, cloroetileno o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos tales como ciclohexano o parafinas, fracciones de petróleo, aceites minerales y vegetales, alcoholes tales como metanol, etanol, isopropanol, butanol o glicol y sus éteres y ésteres, cetonas tales como acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona o ciclohexanona, disolventes fuertemente polares tales como dimetilsulfóxido, y además agua.
- 15 En principio, es posible usar todos los vehículos adecuados. Vehículos útiles incluyen, en particular: por ejemplo sales de amonio y minerales naturales molidos tales como caolines, arcillas, talco, creta, cuarzo, atapulgita, montmorillonita o tierra de diatomeas y materiales sintéticos molidos, tales como ácido silícico finamente dividido, óxido de aluminio y silicatos naturales o sintéticos, resinas, ceras y/o fertilizantes sólidos. También se pueden usar mezclas de dichos vehículos. Vehículos útiles para granulados incluyen: por ejemplo, rocas naturales machacadas y fraccionadas tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita y granulados sintéticos de harinas orgánicas y también granulados de materiales orgánicos tales como serrín, papel, cáscaras de coco, mazorcas de maíz y tallos de tabaco.
- 20 Se pueden usar también diluyentes o disolventes gaseosos licuados. Los diluyentes o vehículos particularmente adecuados son aquellos que son gaseosos a temperatura ambiente y a presión atmosférica, por ejemplo propulsores para aerosoles, tales como halohidrocarburos, y también butano, propano, nitrógeno y dióxido de carbono.
- 25 Ejemplos de emulsionantes y/o formadores de espuma, dispersantes y agentes humectantes que tienen propiedades iónicas o no iónicas y mezclas de estas sustancias tensioactivas incluyen sales de ácido poliacrílico, sales de ácido lignosulfónico, sales de ácido fenolsulfónico o ácido naftalensulfónico, policondensados de óxido de etileno con alcoholes grasos o con ácidos grasos o con aminas grasas, fenoles sustituidos (preferentemente alquilfenoles o arilfenoles), sales de ésteres sulfosuccínicos, derivados de taurina (preferentemente tauratos de alquilo), ésteres fosfóricos de alcoholes o fenoles polietoxilados, ésteres de ácidos grasos de polioles, y derivados de los compuestos que contienen sulfatos, sulfonatos y fosfatos, por ejemplo, alquilarilpoliglicoléteres, alquilsulfonatos, alquilsulfatos, arilsulfonatos, hidrolizados de proteína, lejías de lignosulfito y metilcelulosa. La presencia de un tensioactivo es ventajosa cuando uno de los ingredientes activos y/o uno de los vehículos inertes es insoluble en agua y la aplicación se realiza en agua.
- 30 Otros auxiliares que pueden estar presentes en las formulaciones y las formas de uso de las mismas incluyen colorantes tales como pigmentos inorgánicos, por ejemplo óxido de hierro, óxido de titanio y azul de Prusia, y colorantes orgánicos, tales como colorantes de alizarina, colorantes azoicos y colorantes de ftalocianina metálicos, y nutrientes y oligonutrientes tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc.
- 35 Componentes adicionales pueden ser estabilizantes, tales como crioestabilizantes, conservantes, antioxidantes, fotoestabilizantes u otros agentes que mejoran la estabilidad química y/o física. También pueden estar presentes formadores de espuma o antiespumantes.
- 40 En las formulaciones y formas de uso derivadas de las mismas también pueden estar presentes como auxiliares adicionales agentes de adherencia tales como carboximetilcelulosa y polímeros naturales y sintéticos en forma de polvos, gránulos o látex, tales como goma arábiga, poli(alcohol vinílico) y poli(acetato de vinilo), o fosfolípidos naturales tales como cefalinas y lecitinas, y fosfolípidos sintéticos. Otros auxiliares pueden ser aceites minerales y vegetales.
- 45 Opcionalmente, otros auxiliares pueden estar presentes en las formulaciones y formas de uso derivadas de las mismas. Ejemplos de tales aditivos incluyen fragancias, coloides protectores, aglutinantes, adhesivos, espesantes, agentes tixotrópicos, agentes de penetración, promotores de retención, estabilizantes, secuestrantes, complejantes, humectantes, dispersantes. En general, los principios activos pueden combinarse con cualquier aditivo sólido o líquido de uso habitual para fines de formulación.
- 50 Promotores de retención útiles incluyen todas las sustancias que reduzcan la tensión superficial dinámica, por ejemplo, sulfosuccinato de dioctilo o aumenten la viscoelasticidad, por ejemplo, polímeros de hidroxipropilgumar.
- 55 Agentes de penetración útiles en el presente contexto son todas aquellas sustancias que se usan habitualmente para mejorar la penetración de ingredientes agroquímicamente activos en plantas. Los agentes de penetración se definen en este contexto por su capacidad de penetración desde un licor de aplicación (generalmente acuoso) y/o desde un recubrimiento de pulverización en la cutícula de la planta y aumentar de este modo la movilidad de ingredientes activos en la cutícula. El procedimiento descrito en la bibliografía (Baur y col., 1997, Pesticide Science 51, 131-152) puede usarse para determinar esta propiedad. Ejemplos incluyen alcoxiatos de alcohol tal como

etoxilato graso de coco (10) o isotridecil etoxilato (12), ésteres de ácido graso, por ejemplo éster metílico de aceite de colza o éster metílico de aceite de soja, alcoxilatos de amina graso, por ejemplo etoxilato de amina de sebo (15), o sales de amonio y/o fosfonio, por ejemplo sulfato de amonio o hidrógeno fosfato de diamonio.

5 Las formulaciones contienen preferentemente entre 0,00000001 % y 98 % en peso del ingrediente activo o más preferentemente entre 0,01 % y 95 % en peso del ingrediente activo, más preferentemente entre 0,5 % y 90 % en peso del ingrediente activo, basado en el peso de la formulación.

10 El contenido del principio activo de las formas de uso (composiciones para la protección de cultivos) preparadas a partir de las formulaciones puede variar dentro de márgenes muy amplios. La concentración del ingrediente activo de las formas de uso puede estar típicamente entre 0,00000001 % y 95 % en peso del ingrediente activo, preferentemente entre 0,00001 % y 1 % en peso, basado en el peso de la forma de uso. La aplicación se realiza de un modo habitual apropiado para las formas de uso.

15 Los principios activos de acuerdo con la invención puede usarse como tales en sus formulaciones, incluyendo en una mezcla con uno o más fungicidas adecuados, bactericidas, acaricidas, nematocidas, insecticidas, microbicidas, fertilizantes, atrayentes, fototónicos, esterilizantes, sinergistas, protectores, productos semioquímicos y/o reguladores del crecimiento de plantas, con el fin de este modo, por ejemplo, de ampliar el espectro de acción, prolongar la duración de acción, aumentar la velocidad de acción, prevenir electrostática o prevenir el desarrollo de resistencia. Además, el crecimiento de la planta se puede mejorar por estas combinaciones que potencian la tolerancia a factores abióticos, por ejemplo, temperaturas altas o bajas, a la sequía o a un elevado contenido en agua o salinidad del suelo. También es posible mejorar el comportamiento de la floración y producción de frutos, optimizar la capacidad de germinación y el desarrollo de las raíces, facilitar la recolección y mejorar los rendimientos, influir en la maduración, mejorar la calidad y/o valor nutricional de los productos recolectados, prolongar la vida útil de almacenamiento y/o mejorar la capacidad de procesado de los productos recolectados. En general, combinando los principios activos de acuerdo con la invención y las parejas de mezcla, se obtienen efectos sinérgicos, es decir, la eficacia de la mezcla en cuestión es mayor que la eficacia de los componentes individuales. En general, es posible usar las combinaciones en premezclas, mezclas en depósito o mezclas preparadas y también en aplicaciones en semillas.

Asociados de mezcla particularmente favorables son, por ejemplo, las siguientes:

#### **Insecticidas/acaricidas/nematocidas**

30 Los principios activos especificados en el presente documento por su "denominación común" son conocidos y se describen, por ejemplo en Pesticide Manual ("The Pesticide Handbook", 14ª Ed., British Crop Protection Council 2006) o se pueden encontrar en internet (por ejemplo, <http://www.alanwood.net/pesticides>).

(1) Inhibidores de la acetilcolinesterasa (AChE) tales como, por ejemplo carbamatos, por ejemplo, alanicarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxicarboxim, carbarilo, carbofurano, carbosulfano, etiofencarb, fenobucarb, formetanato, furatiocarb, isoprocarb, metiocarb, metomilo, metolcarb, oxamilo, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, triazamato, trimetacarb, XMC y xililcarb; o organofosforos, por ejemplo, acefato, azametifos, azinfos, cadusafos, cloretoxifos, clorfenvinfos, clorfenvinfos, clormefos, clorpirifos, clorpirifos-metilo, coumafos, cianofos, demeton-S-metilo, diazinona, diclorvos/DDVP, dicrotofos, dimetoato, dimetilvinfos, disulfoton, EPN, etion, etoprofos, famfur, fenamifos, fenitrothion, fention, fostiazato, heptenofos, imidiafos, isofenfos, O-(metoxiaminotiofosforil)salicilato de isopropilo, isoxation, malation, mecarbam, metamidofos, metidation, mevinfos, monocrotofos, naled, ometoato, oxidemeton-metilo, paration, paration-metilo, fentoato, forato, fosadona, fosmet, fosfamidon, foxim, pirimifos (-metilo), profenofos, propetamfos, protiofos, piraclorfos, piridafention, quinalfos, sulfotep, tebupirimfos, temefos, terbufos, tetraclorvinfos, tiometon, triazofos, tricloforon y vamidotion.

(2) Antagonistas de los canales de cloro dependientes de GABA tales como, por ejemplo ciclodieno organoclorados, por ejemplo, clordano, endosulfán; o fenilpirazoles (fiproles), por ejemplo, etiprol y fipronilo.

(3) Moduladores de los canales de sodio/bloqueantes de canales de sodio dependientes de voltaje tales como, por ejemplo piretroides, por ejemplo, acrinatrina, aletrina, d-cis-trans-aletrina, d-trans-aletrina, bifentrina, bioaletrina, isómero S-ciclopentenilo de bioaletrina, bioresmetrina, cicloprotrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, lambda-cihalotrina, gamma-cihalotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, beta-cipermetrina, teta-cipermetrina, zeta-cipermetrina, cifenotrina [isómeros (1R)-trans], deltametrina, empentrina [isómeros (EZ)-(1R)], esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flumetrina, tau-fluvalinato, halfenprox, imiprotrina, kadetrina, permetrina, fenotrina [isómero (1R)-trans], praletrina, piretrinas (piretro), resmetrina, silafluofeno, teflutrina, tetrametrina [isómeros (1R)], tralometrina y transflutrina; o DDT; o metoxiclor.

(4) Agonistas de los receptores nicotínicos de acetilcolina (nAChR) tales como, por ejemplo neonicotinoides, por ejemplo, acetamiprid, clotianidina, dinotefurano, imidacloprid, nitenpiram, tiacloprid y tiametoxam; o nicotina.

- (5) Activadores alostéricos de los receptores nicotínicos de acetilcolina (nAChR) tales como, por ejemplo espinosinas, por ejemplo, espinetoram y espinosad.
- (6) Activadores de los canales de cloruro tales como, por ejemplo avermectinas/milbemicinas, por ejemplo, abamectina, benzoato de emamectina, lepimectina y milbemectina.
- 5 (7) Miméticos de hormonas juveniles tales como, por ejemplo, análogos de hormonas juveniles, por ejemplo hidropreno, kinopreno y metopreno; o fenoxicarb o piriproxifeno.
- (8) Principios activos con mecanismos de acción desconocidos o no específicos tales como, por ejemplo haluros de alquilo, por ejemplo, bromuro de metilo y otros haluros de alquilo; o
- 10 cloropricina; o fluoruro de sulfurilo; o borax, o tártaro emético.
- (9) Bloqueantes selectivos de la nutrición de homópteros, por ejemplo pimetrozina o flonicamid.
- (10) Inhibidores de crecimiento de ácaros, por ejemplo clofentezina, hexitiazox y diflovidazina; o etoxazol.
- (11) Alteradores microbianos de la membrana del intestino de insectos, por ejemplo, *Bacillus thuringiensis* subespecie *israelensis*, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus thuringiensis* subespecie *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subespecie *kurstaki*, *Bacillus thuringiensis* subespecie *tenebrionis*, y proteínas del plantas BT: Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry2Ab, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb, Cry34/35Ab1.
- 15 (12) Inhibidores de la fosforilación oxidativa, alteradores de la ATP tales como, por ejemplo diafentiuron; o compuestos de organoestaño, por ejemplo, azociclotina, cihexatina y óxido de fenbutatina; o propargita o tetradifon.
- (13) Desacopladores de la fosforilación oxidativa por medio de la interrupción del gradiente de protones tales como, por ejemplo clorfenapir, DNOC y sulfuramid.
- (14) Antagonistas del receptor nicotínico de la acetilcolina tales como, por ejemplo, bensultap, clorhidrato de cartap, tiociclam y tiosultap-sodio.
- 25 (15) Inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 0, tales como, por ejemplo bistrifluron, clorfluazuron, diflubenzuron, flucicloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, teflubenzuron y triflumuron.
- (16) Inhibidores de biosíntesis de quitina, de tipo 1, tales como, por ejemplo, buprofezina.
- (17) Agentes de alteración de la muda de dípteros, tales como, por ejemplo, ciromazina.
- 30 (18) Agonistas del receptor de ecdisona tales como, por ejemplo, clomaenzida, halofenozida, metoxifenozida y tebufenozida.
- (19) Agonistas del receptor de octopamina tales como, por ejemplo, amitraz.
- (20) Inhibidores del transporte de electrones del complejo III, tales como, por ejemplo, hidrametilnona; o acequinocilo; o fluacropirim.
- 35 (21) Inhibidores de transporte de electrones del complejo I, por ejemplo, acaricidas METI, por ejemplo, fenazaquina, fenpiroximato, pirimidifeno, piridaben, tebufenpirad y tolfenpirad; o rotenona (Derris).
- (22) Bloqueantes de los canales de sodio dependientes de voltaje, por ejemplo, indoxacarb; metaflumizona.
- (23) Inhibidores de la acetilCoA carboxilasa, tales como, por ejemplo, derivados de ácido tetrónico o tetrámico, por ejemplo espirodiclofeno, espiromesifeno y espirotetramat.
- 40 (24) Inhibidores de transporte de electrones del complejo IV, tales como, por ejemplo, fosfinas, por ejemplo, fosfuro de aluminio, fosfuro de calcio, fosfina y fosfuro de cinc; o cianuro.
- (25) Inhibidores de transporte de electrones del complejo II, tales como, por ejemplo, cienopirafeno.
- 45 (28) Efectores del receptor de rianodina, tales como, por ejemplo, diamidas, por ejemplo clorantraniliprol, ciantraniliprol y flubendiamida.

Otros principios activos con mecanismo de acción desconocido, tales como, por ejemplo, amidoflumet, azadiractina, benclotiaz, benzoximato, bifenazato, bromopropilato, quinometionat, criolita, ciantraniliprol (Cyazyppyr), ciflumetofeno, dicofol, diflovodazina, fluensulfona, flufenerim, flufiprol, fluopiram, flufenozida, imidaclotiz, iprodiona, meperflutrona, piridalilo, pirifluquinazom, tetrametilfutrina y yodometano; y además preparaciones basadas en *Bacillus firmus* (incluyendo en particular, la cepa CNCM I-1582, por ejemplo, VOTIVO™, BioNem) y los siguientes principios activos conocidos:

3-bromo-N-{2-bromo-4-cloro-6-[(1-ciclopropiletil)carbamoil]fenil}-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocida por el documento WO 2005/077934), 4-[[[(6-bromopirid-3-il)metil](2-fluoroetil)amino]furan-2(5H)-ona (conocida por el documento WO 2007/115644), 4-[[[(6-fluoropirid-3-il)metil](2,2-difluoroetil)amino]furan-2(5H)-ona (conocida por el documento WO 2007/115644), 4-[[[(2-cloro-1,3-tiazol-5-il)metil](2-fluoroetil)amino]furan-2(5H)-ona (conocida por el documento WO 2007/115644), 4-[[[(6-cloropirid-3-il)metil](2-fluoroetil)amino]furan-2(5H)-ona (conocida por el documento WO 2007/115644), flupiradifurona, 4-[[[(6-cloro-5-fluoropirid-3-il)metil](metil)amino]furan-2(5H)-ona (conocida por el documento WO 2007/115643), 4-[[[(5,6-dicloropirid-3-il)metil](2-fluoroetil)amino]furan-2(5H)-ona (conocida por el documento WO 2007/115646), 4-[[[(6-cloro-5-fluoropirid-3-il)metil](ciclopropil)amino]furan-2(5H)-ona (conocida por el documento WO 2007/115643), 4-[[[(6-cloropirid-3-il)metil](ciclopropil)amino]furan-2(5H)-ona (conocida por el documento EP-A-0 539 588), 4-[[[(6-cloropirid-3-il)metil](metil)amino]furan-2(5H)-ona (conocida por el documento EP-A-0 539 588), {[1-(6-cloropiridin-3-il)etil](metil)óxido-λ<sup>4</sup>-sulfanilideno]cianamida (conocida por el documento WO 2007/149134) sus diastereómeros {[[(1R)-1-(6-cloropiridin-3-il)etil](metil)óxido-λ<sup>4</sup>-sulfanilideno]cianamida (A) y {[[(1S)-1-(6-cloropiridin-3-il)etil](metil)óxido-λ<sup>4</sup>-sulfanilideno]cianamida (B) (igualmente

conocida por el documento WO 2007/149134) y sulfoxaflor y sus diastereómeros [(R)-metil(óxido){(1R)-1-[6-(trifluorometil)piridin-3-il]etil}-λ<sup>4</sup>-sulfaniliden]cianamida (A1) y [(S)-metil(óxido){(1S)-1-[6-(trifluorometil)piridin-3-il]etil}-λ<sup>4</sup>-sulfaniliden]cianamida (A2), identificados como grupo de diastereómeros A (conocidas por el documento WO 2010/074747, WO 2010/074751), [(R)-metil(óxido){(1R)-1-[6-(trifluorometil)piridin-3-il]etil}-λ<sup>4</sup>-sulfaniliden]cianamida (B1) y [(S)-metil(óxido){(1S)-1-[6-(trifluorometil)piridin-3-il]etil}-λ<sup>4</sup>-sulfaniliden]cianamida (B2), identificados como grupo de diastereómeros B (igualmente conocidas por el documento WO 2010/074747, WO 2010/074751) y 11-(4-cloro-2,6-dimetilfenil)-12-hidroxi-1,4-dioxa-9-azadiespiro[4.2.4.2]tetradec-11-en-10-ona (conocida por el documento WO 2006/089633), 3-(4'-fluoro-2,4-dimetilbifenil-3-il)-4-hidroxi-8-oxa-1-azaespiro[4.5]dec-3-en-2-ona (conocida por el documento WO 2008/067911), 1-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfonil]fenil}-3-(trifluorometil)-1H-1,2,4-triazol-5-amina (conocida por el documento WO 2006/043635), ciclopropanocarboxilato de [(3S,4aR,12R,12aS,12bS)-3-[(ciclopropilcarbonyl)oxil]-6,12-dihidroxi-4,12b-dimetil-11-oxo-9-(piridin-3-il)-1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-decahidro-2H,11H-benzof[pirano[4,3-b]cromen-4-il]metilo (conocido por el documento WO 2008/066153), 2-ciano-3-(difluorometoxi)-N,N-dimetilbencenosulfonamida (conocida por el documento WO 2006/056433), 2-ciano-3-(difluorometoxi)-N-metilbencenosulfonamida (conocida por el documento WO 2006/100288), 2-ciano-3-(difluorometoxi)-N-etilbencenosulfonamida (conocida por el documento WO 2005/035486), 4-(difluorometoxi)-N-etil-N-metil-1,2-benzotiazol-3-amina 1,1-dióxido (conocido por el documento WO 2007/057407), N-[1-(2,3-dimetilfenil)-2-(3,5-dimetilfenil)etil]-4,5-dihidro-1,3-tiazol-2-amina (conocida por el documento WO 2008/104503), {1'-[(2E)-3-(4-clorofenil)prop-2-en-1-il]-5-fluoro-espiro[indol-3,4'-piperidin]-1(2H)-il]}(2-cloropiridin-4-il)metanona (conocida por el documento WO 2003/106457), 3-(2,5-dimetilfenil)-4-hidroxi-8-metoxi-1,8-diazaespiro[4.5]dec-3-en-2-ona (conocida por el documento WO 2009/049851), carbonato de 3-(2,5-dimetilfenil)-8-metoxi-2-oxo-1,8-diazaespiro[4.5]dec-3-en-4-ilo y etilo (conocido por el documento WO 2009/049851), 4-(but-2-in-1-iloxi)-6-(3,5-dimetilpiperidin-1-il)-5-fluoropirimidina (conocida por el documento WO 2004/099160), (2,2,3,3,4,4,5,5-octafluoropentil)(3,3,3-trifluoropropil)malononitrilo (conocido por el documento WO 2005/063094), (2,2,3,3,4,4,5,5-octafluoropentil)(3,3,4,4-pentafluorobutil)malononitrilo (conocido por el documento WO 2005/063094), 8-[2-(ciclopropilmetoxi)-4-(trifluorometil)fenoxi]-3-[6-(trifluorometil)piridazin-3-il]-3-azabicyclo[3.2.1]octano (conocido por el documento WO 2007/040280), flometoquin, PF1364 (n.º registro CAS 1204776-60-2) (conocido por el documento JP2010/018586), 5-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)benzonitrilo (conocido por el documento WO 2007/075459), 5-[5-(2-cloropiridin-4-il)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)benzonitrilo (conocido por el documento WO 2007/075459), 4-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-2-metil-N-{2-oxo-2-[(2,2,2-trifluoroetil)amino]etil}benzamida (conocida por el documento WO 2005/085216), 4-[[6-cloropiridin-3-il]metil](ciclopropil)amino-1,3-oxazol-2(5H)-ona, 4-[[6-cloropiridin-3-il]metil](2,2-difluoroetil)amino-1,3-oxazol-2(5H)-ona, 4-[[6-cloropiridin-3-il]metil](etil)amino-1,3-oxazol-2(5H)-ona, 4-[[6-cloropiridin-3-il]metil](metil)amino-1,3-oxazol-2(5H)-ona (todas conocidas por el documento WO 2010/005692), NNI-0711 (conocido por el documento WO 2002/096882), 1-acetil-N-[4-(1,1,1,3,3,3-hexafluoro-2-metoxipropan-2-il)-3-isobutilfenil]-N-isobutil-3,5-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida (conocida por el documento WO 2002/096882), 2-[2-([3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil)amino]-5-cloro-3-metilbenzoil]-2-metilhidrazincarboxilato de metilo (conocido por el documento WO 2005/085216), 2-[2-([3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil)amino]-5-ciano-3-metilbenzoil]-2-etilhidrazincarboxilato de metilo (conocido por el documento WO 2005/085216), 2-[2-([3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil)amino]-5-ciano-3-metilbenzoil]-2-metilhidrazincarboxilato de metilo (conocido por el documento WO 2005/085216), 2-[3,5-dibromo-2-([3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil)amino]benzoil]-1,2-dietilhidrazincarboxilato de metilo (conocido por el documento WO 2005/085216), 2-[3,5-dibromo-2-([3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil)amino]benzoil]-1H-pirazol-5-il]carbonil)amino]benzoil]-2-etilhidrazincarboxilato de metilo (conocido por el documento WO 2005/085216), (5RS,7RS;5RS,7SR)-1-(6-cloro-3-piridilmetil)-1,2,3,5,6,7-hexahidro-7-metil-8-nitro-5-propoximidazo[1,2-a]piridina (conocida por el documento WO 2007/101369), 2-{6-[2-(5-fluoropiridin-3-il)-1,3-tiazol-5-il]piridin-2-il}pirimidina (conocida por el documento WO 2010/006713), 2-{6-[2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-il]piridin-2-il}pirimidina (conocida por el documento WO 2010/006713), 1-(3-cloropiridin-2-il)-N-[4-ciano-2-metil-6-(metilcarbamoil)fenil]-3-[[5-(trifluorometil)-1H-tetrazol-1-il]metil]-1H-pirazol-5-carboxamida (conocida por el documento WO 2010/069502), 1-(3-cloropiridin-2-il)-N-[4-ciano-2-metil-6-(metilcarbamoil)fenil]-3-[[5-(trifluorometil)-2H-tetrazol-2-il]metil]-1H-pirazol-5-carboxamida (conocida por el documento WO 2010/069502), N-[2-(terc-butilcarbamoil)-4-ciano-6-metilfenil]-1-(3-cloropiridin-2-il)-3-[[5-(trifluorometil)-1H-tetrazol-1-il]metil]-1H-pirazol-5-carboxamida (conocida por el documento WO 2010/069502), N-[2-(terc-butilcarbamoil)-4-ciano-6-metilfenil]-1-(3-cloropiridin-2-il)-3-[[5-(trifluorometil)-2H-tetrazol-2-il]metil]-1H-pirazol-5-carboxamida (conocida por el documento WO 2010/069502), (1E)-N-[(6-cloropiridin-3-il)metil]-N'-ciano-N-(2,2-difluoroetil)etanimidamida (conocida por el documento WO 2008/009360), N-[2-(5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-il)-4-cloro-6-metilfenil]-3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocida por el documento CN102057925) y 2-[3,5-dibromo-2-([3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil)amino]benzoil]-2-etil-1-metilhidrazincarboxilato de metilo (conocido por el documento WO2011/049233).

### Fungicidas

(1) Inhibidores de la biosíntesis de ergosterol tales como, por ejemplo, (1.1) aldimorf (1704-28-5), (1.2) azaconazol (60207-31-0), (1.3) bitertanol (55179-31-2), (1.4) bromuconazol (116255-48-2), (1.5) ciproconazol (113096-99-4), (1.6) diclobutrazol (75736-33-3), (1.7) difenoconazol (119446-68-3), (1.8) diniconazol (83657-24-3), (1.9) diniconazol-M (83657-18-5), (1.10) dodemorf (1593-77-7), (1.11) dodemorf acetato (31717-87-0), (1.12) epoxiconazol (106325-08-0), (1.13) etaconazol (60207-93-4), (1.14) fenarimol (60168-88-9), (1.15) fenbuconazol (114369-43-6), (1.16) fenhexamid (126833-17-8), (1.17) fenpropidina (67306-00-7), (1.18) fenpropimorf (67306-

03-0), (1.19) fluquinconazol (136426-54-5), (1.20) flurprimidol (56425-91-3), (1.21) flusilazol (85509-19-9), (1.22) flutriafol (76674-21-0), (1.23) furconazol (112839-33-5), (1.24) furconazol-cis (112839-32-4), (1.25) hexaconazol (79983-71-4), (1.26) imazalilo (60534-80-7), (1.27) imazalilo sulfato (58594-72-2), (1.28) imibenconazol (86598-92-7), (1.29) ipconazol (125225-28-7), (1.30) metconazol (125116-23-6), (1.31) miclobutanol (88671-89-0), (1.32) naftifina (65472-88-0), (1.33) nuarimol (63284-71-9), (1.34) oxpoconazol (174212-12-5), (1.35) paclobutrazol (76738-62-0), (1.36) pefurazoato (101903-30-4), (1.37) penconazol (66246-88-6), (1.38) piperalina (3478-94-2), (1.39) procloraz (67747-09-5), (1.40) propiconazol (60207-90-1), (1.41) protioconazol (178928-70-6), (1.42) piributicarb (88678-67-5), (1.43) pirifenox (88283-41-4), (1.44) quinconazol (103970-75-8), (1.45) simeconazol (149508-90-7), (1.46) espiroxamina (118134-30-8), (1.47) tebuconazol (107534-96-3), (1.48) terbinafina (91161-71-6), (1.49) tetraconazol (112281-77-3), (1.50) triadimefon (43121-43-3), (1.51) triadimenol (89482-17-7), (1.52) tridemorf (81412-43-3), (1.53) triflumizol (68694-11-1), (1.54) triforina (26644-46-2), (1.55) triticonazol (131983-72-7), (1.56) uniconazol (83657-22-1), (1.57) uniconazol-p (83657-17-4), (1.58) viniconazol (77174-66-4), (1.59) voriconazol (137234-62-9), (1.60) 1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)cicloheptanol (129586-32-9), (1.61) 1-(2,2-dimetil-2,3-dihidro-1H-inden-1-il)-1H-imidazol-5-carboxilato de metilo (110323-95-0), (1.62) N'-(5-(difluorometil)-2-metil-4-[3-(trimetilsilil)propoxi]fenil)-N-etil-N-metilimidofornamida, (1.63) N-etil-N-metil-N'-(2-metil-5-(trifluorometil)-4-[3-(trimetilsilil)propoxi]fenil)imidofornamida y (1.64) O-[1-(4-metoxifenoxi)-3,3-dimetilbutan-2-il]-1H-imidazol-1-carbotioato (111226-71-2).

(2) Inhibidores de la respiración (inhibidores de la cadena respiratoria) tales como, por ejemplo, (2.1) bixafeno (581809-46-3), (2.2) boscalid (188425-85-6), (2.3) carboxina (5234-68-4), (2.4) diflumetorim (130339-07-0), (2.5) fenfuram (24691-80-3), (2.6) fluopiram (658066-35-4), (2.7) flutolanilo (66332-96-5), (2.8) fluxaproxad (907204-31-3), (2.9) furametpir (123572-88-3), (2.10) furmeciclox (60568-05-0), (2.11) isopirazam mezcla del racemato sin-epimérico 1RS,4SR,9RS y el racemato anti-epimérico 1RS,4SR,9SR (881685-58-1), (2.12) isopirazam (racemato anti-epimérico), (2.13) isopirazam (enantiómero anti-epimérico 1R,4S,9S), (2.14) isopirazam (enantiómero anti-epimérico 1S,4R,9R), (2.15) isopirazam (racemato sin-epimérico 1RS,4SR,9RS), (2.16) isopirazam (enantiómero sin-epimérico 1R,4S,9R), (2.17) isopirazam (enantiómero sin-epimérico 1S,4R,9S), (2.18) mepronilo (55814-41-0), (2.19) oxicarboxina (5259-88-1), (2.20) penflufeno (494793-67-8), (2.21) pentiopirad (183675-82-3), (2.22) sedaxano (874967-67-6), (2.23) tfluzamid (130000-40-7), (2.24) 1-metil-N-[2-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil]-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.25) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[2-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.26) 3-(difluorometil)-N-[4-fluoro-2-(1,1,2,3,3,3-hexafluoropropoxi)fenil]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.27) N-[1-(2,4-diclorofenil)-1-metoxipropan-2-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida (1092400-95-7), (2.28) 5,8-difluoro-N-[2-(2-fluoro-4-[[4-(trifluorometil)piridin-2-il]oxi]fenil)etil]quinazolin-4-amina (1210070-84-0) (conocida por el documento WO 2010025451), (2.29) N-[9-(diclorometileno)-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.30) N-[(1S,4R)-9-(diclorometileno)-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida y (2.31) N-[(1R,4S)-9-(diclorometileno)-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida.

(3) Inhibidores de la respiración (inhibidores de la cadena respiratoria) que actúan sobre el complejo III de la cadena respiratoria tales como, por ejemplo, (3.1) ametocradina (865318-97-4), (3.2) amisulbrom (348635-87-0), (3.3) azoxistrobina (131860-33-8), (3.4) ciazofamid (120116-88-3), (3.5) cumetoxistrobina (850881-30-0), (3.6) cumoxistrobina (850881-70-8), (3.5) dimoxistrobina (141600-52-4), (3.6) enestroburina (238410-11-2) (conocida por el documento WO 2004/058723), (3.9) famoxadona (131807-57-3) (conocida por el documento WO 2004/058723), (3.10) fenamidona (161326-34-7) (conocida por el documento WO 2004/058723), (3.11) fenoxistrobina (918162-02-4), (3.12) fluoxastrobina (361377-29-9) (conocida por el documento WO 2004/058723), (3.13) kresoxim-metilo (143390-89-0) (conocido por el documento WO 2004/058723), (3.14) metominostrobin (133408-50-1) (conocida por el documento WO 2004/058723), (3.15) orisastrobina (189892-69-1) (conocida por el documento WO 2004/058723), (3.16) picoxistrobina (117428-22-5) (conocida por el documento WO 2004/058723), (3.17) piraclostrobin (175013-18-0) (conocida por el documento WO 2004/058723), (3.18) pirametostrobin (915410-70-7) (conocida por el documento WO 2004/058723), (3.19) piraoxistrobin (862588-11-2) (conocida por el documento WO 2004/058723), (3.20) piribencarb (799247-52-2) (conocido por el documento WO 2004/058723), (3.21) triclopiricarb (902760-40-1), (3.22) trifloxistrobina (141517-21-7) (conocida por el documento WO 2004/058723), (3.23) (2E)-2-(2-[[6-(3-cloro-2-metilfenoxi)-5-fluoropirimidin-4-il]oxi]fenil)-2-(metoxiimino)-N-metiletanamida (conocida por el documento WO 2004/058723), (3.24) (2E)-2-(metoxiimino)-N-metil-2-(2-[[[(1E)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etilideno]amino]oxi]metil]fenil)etanamida (conocida por el documento WO 2004/058723), (3.25) (2E)-2-(metoxiimino)-N-metil-2-[2-[(E)-{(1-[3-(trifluorometil)fenil]etoxi)imino]metil]fenil]etanamida (158169-73-4), (3.26) (2E)-2-[2-[[[(1E)-1-[3-[(E)-1-fluoro-2-feniletetil]oxi]fenil]etilideno]amino]oxi]metil]fenil]-2-(metoxiimino)-N-metiletanamida (326896-28-0), (3.27) (2E)-2-[2-[[[(2E,3E)-4-(2,6-diclorofenil)but-3-en-2-ilideno]amino]oxi]metil]fenil]-2-(metoxiimino)-N-metiletanamida, (3.28) 2-cloro-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)piridin-3-carboxamida (119899-14-8), (3.29) 5-metoxi-2-metil-4-(2-[[[(1E)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etilideno]amino]oxi]metil]fenil)-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-ona, (3.30) (2E)-2-[2-[[[ciclopropil]-(4-metoxifenil)imino]metil]sulfanil]fenil]-3-metoxiprop-2-enoato de metilo (149601-03-6), (3.31) N-(3-etil-3,5,5-trimetilciclohexil)-3-(formilamino)-2-hidroxibenzamida (226551-21-9), (3.32) 2-[2-[[2,5-dimetilfenoxi]metil]fenil]-2-metoxi-N-metilacetamida (173662-97-0) y (3.33) (2R)-2-[2-[[2,5-dimetilfenoxi]metil]fenil]-2-metoxi-N-metilacetamida (394657-24-0).

- (4) Inhibidores de la mitosis y la división celular tales como, por ejemplo, (4.1) benomilo (17804-35-2), (4.2) carbendazim (10605-21-7), (4.3) clorfenazol (3574-96-7), (4.4) dietofencarb (87130-20-9), (4.5) etaboxam (162650-77-3), (4.6) fluopicolid (239110-15-7), (4.7) fuberidazol (3878-19-1), (4.8) pencicuron (66063-05-6), (4.9) tiabendazol (148-79-8), (4.10) tiofanato-metilo (23564-05-8), (4.11) tiofanato (23564-06-9), (4.12) zoxamida (156052-68-5), (4.13) 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina (214706-53-3) y (4.14) 3-cloro-5-(6-cloropiridin-3-il)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorofenil)piridazina (1002756-87-7).
- (5) Compuestos capaces de actuar sobre múltiples sitios tales como, por ejemplo, (5.1) mezcla de Burdeos (8011-63-0), (5.2) captafol (2425-06-1), (5.3) captan (133-06-2) (conocido por el documento WO 02/12172), (5.4) clorotalonilo (1897-45-6), (5.5) preparaciones de cobre tales como hidróxido de cobre (20427-59-2), (5.6) naftenato de cobre (1338-02-9), (5.7) óxido de cobre (1317-39-1), (5.8) oxiclورو de cobre (1332-40-7), (5.9) sulfato de cobre (7758-98-7), (5.10) diclofluand (1085-98-9), (5.11) ditionon (3347-22-6), (5.12) dodina (2439-10-3), (5.13) dodina base libre, (5.14) ferbam (14484-64-1), (5.15) fluorofolpet (719-96-0), (5.16) folpet (133-07-3), (5.17) guazatina (108173-90-6), (5.18) guazatina acetato, (5.19) iminoctadina (13516-27-3), (5.20) iminoctadina albesilato (169202-06-6), (5.21) iminoctadina triacetato (57520-17-9), (5.22) mancobre (53988-93-5), (5.23) mancozeb (8018-01-7), (5.24) maneb (12427-38-2), (5.25) metiram (9006-42-2), (5.26) zinc metiram (9006-42-2), (5.27) cobre-oxina (10380-28-6), (5.28) propamidina (104-32-5), (5.29) propineb (12071-83-9), (5.30) azufre y preparaciones de azufre tales como, por ejemplo, polisulfuro de calcio (7704-34-9), (5.31) tiram (137-26-8), (5.32) tolilfluand (731-27-1), (5.33) zineb (12122-67-7) y (5.34) ziram (137-30-4).
- (6) Inductores de resistencia tales como, por ejemplo, (6.1) acibenzolar-S-metilo (135158-54-2), (6.2) isotianilo (224049-04-1), (6.3) probenazol (27605-76-1) y (6.4) tiadinilo (223580-51-6).
- (7) Inhibidores de la biosíntesis de aminoácidos y proteínas tales como, por ejemplo, (7.1) andoprim (23951-85-1), (7.2) blasticidina-S (2079-00-7), (7.3) ciprodinilo (121552-61-2), (7.4) kasugamicina (6980-18-3), (7.5) hidrato de kasugamicina clorhidrato (19408-46-9), (7.6) mepanipirim (110235-47-7), (7.7) pirimetanilo (53112-28-0) y (7.8) 3-(5-fluoro-3,3,4,4-tetrametil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina (861647-32-7) (conocida por el documento WO 2005070917).
- (8) Inhibidores de la producción de ATP tales como, por ejemplo, (8.1) fentina acetato (900-95-8), (8.2) fentina cloruro (639-58-7), (8.3) fentina hidróxido (76-87-9) y (8.4) siltiofam (175217-20-6).
- (9) Inhibidores de la síntesis de la pared celular tales como, por ejemplo, (9.1) bentiavalicarb (177406-68-7), (9.2) dimetomorf (110488-70-5), (9.3) flumorf (211867-47-9), (9.4) iprovalicarb (140923-17-7), (9.5) mandipropamid (374726-62-2), (9.6) polioxinas (11113-80-7), (9.7) polioxorim (22976-86-9), (9.8) validamicina A (37248-47-8) y (9.9) valifenalato (283159-94-4; 283159-90-0).
- (10) Inhibidores de los lípidos y la síntesis de membrana tales como, por ejemplo, (10.1) bifenilo (92-52-4), (10.2) cloroneb (2675-77-6), (10.3) dicloran (99-30-9), (10.4) edifenfos (17109-49-8), (10.5) etridiazol (2593-15-9), (10.6) yodocarb (55406-53-6), (10.7) iprobenfos (26087-47-8), (10.8) isoprotilano (50512-35-1), (10.9) propamocarb (25606-41-1), (10.10) propamocarb clorhidrato (25606-41-1), (10.11) protiocarb (19622-08-3), (10.12) pirazofos (13457-18-6), (10.13) quintozeno (82-68-8), (10.14) tecnazeno (117-18-0) y (10.15) tolclofos-metilo (57018-04-9).
- (11) Inhibidores de la biosíntesis de melanina tales como, por ejemplo, (11.1) carpropamid (104030-54-8), (11.2) diclocimet (139920-32-4), (11.3) fenoxanilo (115852-48-7), (11.4) ftalida (27355-22-2), (11.5) piroquilon (57369-32-1), (11.6) triciclazol (41814-78-2) y (11.7) {3-metil-1-[(4-metilbenzoil)amino]butan-2-il}carbamato de 2,2,2-trifluoroetilo (851524-22-6) (conocido por el documento WO 2005042474).
- (12) Inhibidores de la síntesis de ácidos nucleicos tales como, por ejemplo, (12.1) benalaxilo (71626-11-4), (12.2) benalaxilo-M (kiralaxilo) (98243-83-5), (12.3) bupirimato (41483-43-6), (12.4) cloclacon (67932-85-8), (12.5) dimetirimol (5221-53-4), (12.6) etirimol (23947-60-6), (12.7) furalaxilo (57646-30-7), (12.8) himexazol (10004-44-1), (12.9) metalaxilo (57837-19-1), (12.10) metalaxilo-M (mefenoxam) (70630-17-0), (12.11) ofurace (58810-48-3), (12.12) oxadixilo (77732-09-3) y (12.13) ácido oxolínico (14698-29-4).
- (13) Inhibidores de la transducción de señal tales como, por ejemplo, (13.1) clozolinato (84332-86-5), (13.2) fempiclonilo (74738-17-3), (13.3) fludioxonilo (131341-86-1), (13.4) iprodiona (36734-19-7), (13.5) procimidona (32809-16-8), (13.6) quinoxifeno (124495-18-7) y (13.7) vinclozolina (50471-44-8).
- (14) Desacopladores tales como, por ejemplo, (14.1) binapacril (485-31-4), (14.2) dinocap (131-72-6), (14.3) ferimzona (89269-64-7), (14.4) fluazinam (79622-59-6) y (14.5) mepildinocap (131-72-6).
- (15) Otros compuestos tales como, por ejemplo, (15.1) bentiazol (21564-17-0), (15.2) betoxazina (163269-30-5), (15.3) capsimicina (70694-08-5), (15.4) carvona (99-49-0), (15.5) quinometionat (2439-01-2), (15.6) piriufenona (clazafenona) (688046-61-9), (15.7) cufraneb (11096-18-7), (15.8) ciflufenamid (180409-60-3), (15.9) cimoxanilo (57966-95-7), (15.10) cipro sulfamida (221667-31-8), (15.11) dazomet (533-74-4), (15.12) debacarb (62732-91-6), (15.13) diclorofen (97-23-4), (15.14) diclomezina (62865-36-5), (15.15) difenzoquat (49866-87-7), (15.16) difenzoquat metilsulfato (43222-48-6), (15.17) difenilamina (122-39-4), (15.18) EcoMate, (15.19) fenpirazamina (473798-59-3), (15.20) flumetover (154025-04-4), (15.21) fluoromid (41205-21-4), (15.22) flusulfamida (106917-

52-6), (15.23) flutianilo (304900-25-2), (15.24) fosetil-aluminio (39148-24-8), (15.25) fosetil-calcio, (15.26) fosetil-sodio (39148-16-8), (15.27) hexaclorobenceno (118-74-1), (15.28) irumamicina (81604-73-1), (15.29) metasulfocarb (66952-49-6), (15.30) isotiocianato de metilo (556-61-6), (15.31) metrafenona (220899-03-6), (15.32) mildiomicina (67527-71-3), (15.33) natamicina (7681-93-8), (15.34) dimetilditiocarbamato de níquel (15521-65-0), (15.35) nitrotal-isopropilo (10552-74-6), (15.36) octilina (26530-20-1), (15.37) oxamocarb (917242-12-7), (15.38) oxifentiina (34407-87-9), (15.39) pentaclorofenol y sus sales (87-86-5), (15.40) fenotrina, (15.41) ácido fosfórico y sus sales (13598-36-2), (15.42) propamocarb-fosetilato, (15.43) propanosina-sodio (88498-02-6), (15.44) proquinazid (189278-12-4), (15.45) pirimorf (868390-90-3), (15.45e) (2E)-3-(4-terc-butilfenil)-3-(2-cloropiridin-4-il)-1-(morfolin-4-il)prop-2-en-1-ona (1231776-28-5), (15.45z) (2Z)-3-(4-terc-butilfenil)-3-(2-cloropiridin-4-il)-1-(morfolin-4-il)prop-2-en-1-ona (1231776-29-6), (15.46) pirrolnitrina (1018-71-9) (conocida por el documento EP-A 1 559 320), (15.47) tebufloquina (376645-78-2), (15.48) tecloftalam (76280-91-6), (15.49) tolmanida (304911-98-6), (15.50) triazóxido (72459-58-6), (15.51) triclamida (70193-21-4), (15.52) zarilamid (84527-51-5), (15.53) 2-metilpropanoato de (3S,6S,7R,8R)-8-bencil-3-[[[3-[(isobutiriloxi)metoxi]-4-metoxipiridin-2-il]carbonil]amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxan-7-ilo (517875-34-2) (conocido por el documento WO 2003035617), (15.54) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona (1003319-79-6), (15.55) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona (1003319-80-9), (15.56) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona (1003318-67-9), (15.57) 1H-imidazol-1-carboxilato de 1-(4-metoxifenoxi)-3,3-dimetilbutan-2-ilo (111227-17-9), (15.58) 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)piridina (13108-52-6), (15.59) 2,3-dibutil-6-clorotieno[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona (221451-58-7), (15.60) 2,6-dimetil-1H,5H-[1,4]ditiino[2,3-c:5,6-c']dipirrol-1,3,5,7(2H,6H)-tetrona, (15.61) 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(5R)-5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona (1003316-53-7), (15.62) 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(5S)-5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona (1003316-54-8), (15.63) 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-(5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il)-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona (1003316-51-5), (15.64) 2-butoxi-6-yodo-3-propil-4H-cromen-4-ona, (15.65) 2-cloro-5-[2-cloro-1-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-4-metil-1H-imidazol-5-il]piridina, (15.66) 2-fenilfenol y sus sales (90-43-7), (15.67) 3-(4,4,5-trifluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina (861647-85-0) (conocida por el documento WO 2005070917), (15.68) 3,4,5-tricloropiridin-2,6-dicarbonitrilo (17824-85-0), (15.69) 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetil-1,2-oxazolidin-3-il]piridina, (15.70) 3-cloro-5-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-6-metilpiridazina, (15.71) 4-(4-clorofenil)-5-(2,6-difluorofenil)-3,6-dimetilpiridazina, (15.72) 5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-tiol, (15.73) 5-cloro-N'-fenil-N'-(prop-2-in-1-tiofen-2-sulfonohidrazida (134-31-6), (15.74) 5-fluoro-2-[(4-fluorobenzil)oxi]pirimidin-4-amina (1174376-11-4) (conocida por el documento WO 2009094442), (15.75) 5-fluoro-2-[(4-metilbencil)oxi]pirimidin-4-amina (1174376-25-0) (conocida por el documento WO 2009094442), (15.76) 5-metil-6-oxil[1,2,4]triazol[1,5-a]pirimidin-7-amina, (15.77) (2Z)-3-amino-2-ciano-3-fenilprop-2-enoato de etilo, (15.78) N'-(4-{3-(4-clorobencil)-1,2,4-tiadiazol-5-il}oxi)-2,5-dimetilfenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (15.79) N-(4-clorobencil)-3-[3-metoxi-4-(prop-2-in-1-ilo)fenil]propanamida, (15.80) N-[(4-clorofenil)(ciano)metil]-3-[3-metoxi-4-(prop-2-in-1-ilo)fenil]propanamida, (15.81) N-[(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)metil]-2,4-dicloropiridin-3-carboxamida, (15.82) N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2,4-dicloropiridin-3-carboxamida, (15.83) N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2-fluoro-4-yodopiridin-3-carboxamida, (15.84) N-[(E)-[(ciclopropilmetoxi)imino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil]-2-fenilacetamida (221201-92-9), (15.85) N-[(Z)-[(ciclopropilmetoxi)imino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil]-2-fenilacetamida (221201-92-9), (15.86) N'-4-{3-terc-butil-4-ciano-1,2-tiazol-5-il}oxi]-2-cloro-5-metilfenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (15.87) N-metil-2-(1-{[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-N-(1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il)-1,3-tiazol-4-carboxamida (922514-49-6), (15.88) N-metil-2-(1-{[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il]-1,3-tiazol-4-carboxamida (922514-07-6), (15.89) N-metil-2-(1-{[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-N-[(1S)-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il]-1,3-tiazol-4-carboxamida (922514-48-5), (15.90) {6-[[[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metiliden]amino]oxi]metil}piridin-2-il}carbamato de pentilo, (15.91) ácido fenazin-1-carboxílico, (15.92) quinolin-8-ol (134-31-6), (15.93) sulfato de quinolin-8-ol (2:1) (134-31-6) y (15.94) {6-[[[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metiliden]amino]oxi]metil}piridin-2-il}carbamato de terc-butilo.

(16) Otros compuestos tales como, por ejemplo, (16.1) 1-metil-3-(trifluorometil)-N-[2'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.2) N-(4'-clorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.3) N-(2',4'-diclorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.4) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[4'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.5) N-(2',5'-difluorobifenil-2-il)-1-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.6) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[4'-(prop-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.7) 5-fluoro-1,3-dimetil-N-[4'-(prop-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.8) 2-cloro-N-[4'-(prop-1-in-1-il)bifenil-2-il]piridin-3-carboxamida, (16.9) 3-(difluorometil)-N-[4'-(3,3-dimetilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.10) N-[4'-(3,3-dimetilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.11) 3-(difluorometil)-N-(4'-etinilbifenil-2-il)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.12) N-(4'-etinilbifenil-2-il)-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.13) 2-cloro-N-(4'-etinilbifenil-2-il)piridin-3-carboxamida, (16.14) 2-cloro-N-[4'-(3,3-dimetilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]piridin-3-carboxamida (conocida por el documento EP-A 1 559 320), (16.15) 4-(difluorometil)-2-metil-N-[4'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1,3-tiazol-5-carboxamida, (16.16) 5-fluoro-N-[4'-(3-hidroxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.17) 2-cloro-N-[4'-(3-hidroxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]piridin-3-carboxamida, (16.18) 3-(difluorometil)-N-[4'-(3-metoxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.19) 5-fluoro-N-[4'-(3-metoxi-3-

metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.20) 2-cloro-N-[4'-(3-metoxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]piridin-3-carboxamida, (16.21) (5-bromo-2-metoxi-4-metilpiridin-3-il)(2,3,4-trimetoxi-6-metilfenil)metanona, (16.22) N-[2-(4-[[3-(4-clorofenil)prop-2-in-1-il]oxi]-3-metoxifenil)etil]-N2-(metilsulfonyl)valinamida (220706-93-4), (16.23) ácido 4-oxo-4-[(2-feniletil)amino]butanoico y (16.24) {6-[[{(Z)-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilen]amino]oxi]metil]piridin-2-il}carbamato de but-3-in-1-ilo.

Todos los asociados de mezcla citados en las clases (1) a (16) pueden, si pueden en base a sus grupos funcionales, formar opcionalmente sales con bases o ácidos adecuados.

También es posible una mezcla con otros principios activos conocidos tales como herbicidas, fertilizantes, reguladores del crecimiento, protectores, semioquímicos o también con agentes para mejorar las propiedades de las plantas.

Cuando se usan como insecticidas, los principios activos de acuerdo con la invención además pueden estar presentes en sus formulaciones disponibles comercialmente y en las formas de uso, preparadas a partir de estas formulaciones, en forma de una mezcla con sinergistas. Los sinergistas son compuestos que aumentan la acción de los principios activos sin que sea necesario lque el propio sinergista sea activo.

Cuando se usan como insecticidas, los principios activos de acuerdo con la invención pueden además estar presentes en sus formulaciones disponibles comercialmente y en las formas de uso preparadas a partir de dichas formulaciones, en forma de una mezcla con inhibidores que reducen la degradación del principio activo después del uso en el entorno de la planta, sobre la superficie de partes de plantas o en tejidos vegetales.

De acuerdo con la invención, es posible tratar todas las plantas y partes de las plantas. Se entiende que plantas significa, en el presente documento, todas las plantas y poblaciones de plantas, tales como plantas silvestres deseadas y no deseadas o plantas de cultivo, (incluidas las plantas de cultivo de origen natural). Las plantas de cosecha pueden ser plantas que se pueden obtener mediante procedimientos de cultivo y optimización convencionales o mediante procedimientos biotecnológicos y de ingeniería genética o combinaciones de estos procedimientos, incluidas las plantas transgénicas e incluidas las variedades de plantas que pueden estar protegidas o pueden no estar protegidas por los derechos de los cultivadores de plantas. Se entenderá que partes de las plantas significa todas las partes y órganos de las plantas por encima y debajo de la tierra, tales como brotes, hojas, flores y raíces, incluidos como ejemplos las hojas, acículas, tallos, troncos, flores, cuerpos fructíferos, frutas y semillas y también raíces, tubérculos y rizomas. Las partes de las plantas también incluyen el material recolectado y el material de propagación vegetativa y por generación, por ejemplo plantones, tubérculos, rizomas, esquejes y semillas.

El tratamiento de acuerdo con la invención de las plantas y partes de plantas con los principios activos se realiza directamente o dejando actuar los compuestos sobre sus alrededores, hábitat o espacio de almacenamiento mediante los procedimientos de tratamiento habituales, por ejemplo, mediante inmersión, pulverización, evaporación, nebulización, dispersión, embadurnado, inyección y en el caso de material de reproducción, en particular en el caso de semillas, también mediante aplicación de una o más capas.

Como ya se ha mencionado anteriormente, es posible tratar todas las plantas y sus partes de acuerdo con la invención. En una forma de realización preferida, se tratan especies de plantas silvestres y cultivares de plantas, o las obtenidas mediante procedimientos de cultivo biológico convencionales, tales como cruzamiento o fusión de protoplastos, y también sus partes. En una realización preferente adicional, se tratan plantas transgénicas y plantas de cultivo obtenidas mediante procedimientos de ingeniería genética, si fuera apropiado en combinación con procedimientos convencionales (organismos genéticamente modificados) y sus partes. Los términos "partes", "partes de plantas" y "partes de la planta" se han explicado anteriormente.

Más preferentemente, las plantas de los cultivares de plantas que están disponibles comercialmente o que están en uso se tratan de acuerdo con la invención. Variedades de plantas de cultivo se entiende que significa plantas que tienen características novedosas ("rasgos") y que se han obtenido mediante cultivo convencional, mediante mutagénesis o mediante técnicas de ADN recombinante. Estas pueden ser variedades de plantas de cultivo, biotipos y genotipos.

Dependiendo de la especie de planta o la variedad de cultivo, su localización y condiciones de cultivo (suelos, clima, periodo de vegetación, dieta), el tratamiento de acuerdo con la invención también puede dar lugar a efectos superaditivos ("sinérgicos"). Por ejemplo, las posibilidades incluyen tasas de aplicación reducidas y/o una ampliación del espectro de actividad y/o un aumento de la actividad de los compuestos y composiciones que se usan según la invención, mejor crecimiento de la planta, mayor tolerancia a temperaturas altas o bajas, mayor tolerancia a la sequía o a niveles de salinidad en agua o suelo, mayor floración, mayor facilidad de recolección, maduración acelerada, mayores rendimientos de cosecha, mayor calidad y/o un mayor valor nutricional de los productos recolectados, mayor duración en almacenamiento y/o capacidad de procesado de los productos recolectados, que exceden los efectos que normalmente deben esperarse.

Las plantas o variedades de plantas de cultivo transgénicas (obtenidas mediante ingeniería genética) preferentes que se tratan según la invención incluyen todas las plantas que, mediante la modificación genética, recibieron

material genético que confiere rasgos útiles particularmente ventajosos a estas plantas. Ejemplos de dichas características son mejor crecimiento de la planta, mayor tolerancia a temperaturas altas o bajas, mayor tolerancia a la sequía o a niveles de salinidad del agua o el suelo, mayor floración, mayor facilidad de recolección, maduración acelerada, mayores rendimientos de la cosecha, calidad más alta y/o un mayor valor nutricional de los productos recolectados, mayor vida útil de almacenamiento y/o mejor capacidad de procesamiento de los productos recolectados. Ejemplos adicionales y particularmente enfatizados de dichas propiedades son una mejor defensa de las plantas contra plagas animales y microbianas, tales como contra insectos, ácaros, hongos fitopatógenos, bacterias y/o virus, y también mayor tolerancia de las plantas a determinados ingredientes con actividad herbicida. Ejemplos de plantas transgénicas que pueden mencionarse son las plantas de cultivo importantes, tales como cereales (trigo, arroz), maíz, soja, patatas, remolacha azucarera, tomates, guisantes y otros tipos de vegetales como algodón, tabaco, colza y también plantas frutales (con frutas como manzanas, peras, cítricos y uvas) y se enfatiza particularmente en el maíz, soja, patatas, algodón, tabaco y colza. Las características sobre las que se enfatiza son, en particular, la mayor resistencia de las plantas frente a insectos, arácnidos, nematodos y babosas y caracoles gracias a toxinas formadas en las plantas, en particular las formadas en las plantas mediante el material genético procedente de *Bacillus thuringiensis* (por ejemplo, por medio de los genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb y CryIF y también de sus combinaciones) (denominadas a continuación como "plantas Bt") Los rasgos sobre los que también se pone particular énfasis son la resistencia mejorada de las plantas contra hongos, bacterias y virus por resistencia sistémica adquirida (SAR), genes de sistemina, de fitoalexinas, facilitadores y de resistencia y las proteínas y toxinas expresadas correspondientemente. Los rasgos que se enfatizan adicionalmente de forma particular son la mayor tolerancia de las plantas a determinados ingredientes con actividad herbicida, por ejemplo imidazolinonas, sulfonilureas, glifosato o fosfinotricina (por ejemplo el gen "PAT"). Los genes que confieren los rasgos deseados en cuestión también pueden estar presentes en combinación unos con otros en las plantas transgénicas. Los ejemplos de "plantas Bt" incluyen variedades de maíz, variedades de algodón, variedades de soja y variedades de patatas que se comercializan con los nombres comerciales de YIELD GARD® (por ejemplo maíz, algodón, soja), KnockOut® (por ejemplo maíz), StarLink® (por ejemplo maíz), Bollgard® (algodón), NuCotn® (algodón) y NewLeaf® (patata). Ejemplos de plantas tolerantes a herbicidas incluyen variedades de maíz, variedades de algodón y variedades de soja que se comercializan bajo las marcas comerciales Roundup Ready® (tolerancia a glifosato, por ejemplo maíz, algodón, soja), Liberty Link® (tolerancia a fosfinotricina, por ejemplo colza), IMI® (tolerancia a imidazolinonas) y STS® (tolerancia a sulfonilureas, por ejemplo maíz). Las plantas resistentes a herbicidas (plantas reproducidas de forma convencional para la tolerancia a herbicida) que pueden mencionarse incluyen las variedades que se venden con el nombre Clearfield® (por ejemplo maíz). Por supuesto, estas afirmaciones también se aplican a las variedades de plantas cultivadas que tienen estos rasgos genéticos o rasgos genéticos que todavía están por desarrollar; plantas que se desarrollarán y/o comercializarán en el futuro.

Las plantas enumeradas pueden tratarse de acuerdo con la invención de un modo particularmente ventajoso con los compuestos de la fórmula general (I) y/o las mezclas de principio activo de acuerdo con la invención. Los intervalos preferidos mencionados anteriormente para los principios activos y mezclas también son aplicables al tratamiento de estas plantas. El tratamiento de plantas con los compuestos o mezclas indicados especialmente en el presente texto es particularmente destacado.

Los principios activos de acuerdo con la invención son activos no solo contra plagas de plantas, de la higiene y de productos almacenados, sino también en el sector veterinario contra parásitos animales (ectoparásitos y endoparásitos), tales como garrapatas duras y blandas, aradores de la sarna, trombídidos, moscas (picadoras y chupadoras), larvas de moscas parásitas, piojos, malófagos de pelo, malófagos de pluma y pulgas. Estos parásitos incluyen:

Del orden de los anopluros, por ejemplo, *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phtirus* spp. y *Solenopotes* spp.

Del orden de los malófagos y los subórdenes *Amblycerina* e *Ichnocerina*, por ejemplo, *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Damalina* spp., *Trichodectes* spp. y *Felicola* spp.

Del orden de los dípteros y los subórdenes *Nematocera* y *Brachycera*, por ejemplo, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Simulium* spp., *Eusimulium* spp., *Phlebotomus* spp., *Lutzomyia* spp., *Culicoides* spp., *Chrysops* spp., *Hybomitra* spp., *Atylotus* spp., *Tabanus* spp., *Haematopota* spp., *Philipomyia* spp., *Braula* spp., *Musca* spp., *Hydrotaea* spp., *Stomoxys* spp., *Haematobia* spp., *Morellia* spp., *Fannia* spp., *Glossina* spp., *Calliphora* spp., *Lucilia* spp., *Chrysomyia* spp., *Wohlfahrtia* spp., *Sarcophaga* spp., *Oestrus* spp., *Hypoderma* spp., *Gasterophilus* spp., *Hippobosca* spp., *Lipoptena* spp. y *Melophagus* spp.

Del orden de los sifonaptéridos, por ejemplo *Pulex* spp., *Ctenocephalides* spp., *Xenopsylla* spp. y *Ceratophyllus* spp.

Del orden de los heteroptéridos, por ejemplo, *Cimex* spp., *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp. y *Panstrongylus* spp.

Del orden de los blatáridos, por ejemplo, *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Blattella germanica* y *Supella* spp.

De la subclase de los ácaros (*Acarina*) y de los órdenes *Meta-* y *Mesostigmata*, por ejemplo, *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Otobius* spp., *Ixodes* spp., *Amblyomma* spp., *Boophilus* spp., *Dermacentor* spp., *Haemophysalis*

spp., *Hyalomma* spp., *Rhipicephalus* spp., *Dermanyssus* spp., *Raillietia* spp., *Pneumonyssus* spp., *Sternostoma* spp. y *Varroa* spp.

5 Del orden de los actinédidos (Prostigmata) y acarídidos (Astigmata), por ejemplo, *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp., *Ornithocheyletia* spp., *Myobia* spp., *Psorergates* spp., *Demodex* spp., *Trombicula* spp., *Listrophorus* spp., *Acarus* spp., *Tyrophagus* spp., *Caloglyphus* spp., *Hypodectes* spp., *Pterolichus* spp., *Psoroptes* spp., *Choriotes* spp., *Otodectes* spp., *Sarcoptes* spp., *Notoedres* spp., *Knemidocoptes* spp., *Cytodites* spp. y *Laminosioptes* spp.

10 Los principios activos de la fórmula (I) de acuerdo con la invención son también adecuados para combatir artrópodos que atacan al ganado agrícola tal como, por ejemplo, ganado vacuno, ovejas, cabras, caballos, cerdos, burros, camellos, búfalos, conejos, pollos, pavos, patos, gansos, abejas de miel, otros animales domésticos tales como, por ejemplo, perros, gatos, pájaros de jaula, peces de acuario y animales experimentales tales como, por ejemplo, hámsteres, conejillos de Indias, ratas y ratones. El combate de estos artrópodos desea reducir los casos de muertes y menor productividad (en el caso de carne, leche, lana, cueros, huevos, miel y similares), de tal forma que sea más económico y que se haga posible el mantenimiento animal más económico y simple por el uso de los principios activos de acuerdo con la invención.

15 Los principios activos de acuerdo con la invención se usan en el sector veterinario y en la cría de animales de un modo conocido mediante administración enteral en forma de, por ejemplo, comprimidos, cápsulas, pociones, fluidos orales de administración con pistola, gránulos, pastas, bolos, procedimientos a través de la alimentación, supositorios, mediante administración parenteral, como por ejemplo por inyecciones (intramusculares, subcutáneas, intravenosas, intraperitoneales y otras), implantes, administración nasal, mediante aplicación dérmica en forma de  
20 por ejemplo inmersión o baño, pulverización, vertido en dorso y en la cruz, lavado y empolvado, así como con ayuda de artículos moldeados que contienen principios activos, como collares, marcas para las orejas o el rabo, brazaletes para las extremidades, ronzales, dispositivos de marcado y similares.

25 Cuando se usan en ganado, aves de corral, animales domésticos y similares, los principios activos de la fórmula (I) pueden usarse en forma de formulaciones (por ejemplo polvos, emulsiones, agentes fluidizables) que comprenden los principios activos en una cantidad de entre el 1 y el 80 % en peso, bien directamente bien después de diluirlas entre 100 y 10.000 veces, o pueden usarse como baño químico.

Se ha encontrado además que los compuestos de acuerdo con la invención tienen una fuerte acción insecticida contra insectos que destruyen materiales industriales.

30 Ejemplos preferidos pero no limitantes incluyen los insectos siguientes:  
escarabajos, tales como *Hylotrupes bajulus*, *Chlorophorus pilosis*, *Anobium punctatum*, *Xestobium rufovillosum*, *Ptilinus pecticornis*, *Dendrobium pertinex*, *Ernobius mollis*, *Priobium carpini*, *Lyctus brunneus*, *Lyctus africanus*, *Lyctus planicollis*, *Lyctus linearis*, *Lyctus pubescens*, *Trogoxylon aequale*, *Minthes rugicollis*, *Xyleborus spec.*, *Tryptodendron spec.*, *Apate monachus*, *Bostrychus capucins*, *Heterobostrychus brunneus*, *Sinoxylon spec.*, *Dinoderus minutus*;

35 Dermápteros, tales como *Sirex juvencus*, *Urocerus gigas*, *Urocerus gigas taignus*, *Urocerus augur*;

termitas, tales como *Kaloterme flavicollis*, *Cryptoterme brevis*, *Heteroterme indicola*, *Reticuliterme flavipes*, *Reticuliterme santonensis*, *Reticuliterme lucifugus*, *Mastoterme darwiniensis*, *Zootermopsis nevadensis*, *Coptoterme formosanus*;

Lepismátidos, tales como *Lepisma saccharina*.

40 Los materiales industriales en la presente relación se entiende que se refieren a materiales inanimados, tales como, preferentemente, plásticos, adhesivos, tamaños, papeles y cartones, cuero, madera, productos de madera procesada y composiciones de recubrimiento.

Las composiciones listas para usar pueden comprender, opcionalmente, otros insecticidas y, opcionalmente, uno o más fungicidas.

45 Los compuestos de acuerdo con la invención pueden usarse también para proteger objetos que están en contacto con agua marina o salobre, en particular cascos de barcos, tamices, redes, edificios, instalaciones de atraque y sistemas de señalización, de la formación de incrustación.

Además, los compuestos de acuerdo con la invención, solos o en combinaciones con otros principios activos, se pueden usar como composiciones antincrustantes.

50 Los principios activos son también útiles para combatir plagas animales en el sector doméstico, en el sector de la higiene y en la protección de productos almacenados, en especial insectos, arácnidos y ácaros, que se encuentran en los espacios cerrados, por ejemplo, domicilios, naves industriales, oficinas, cabinas de vehículos y similares. Estos se pueden usar para combatir estas plagas solos o combinados con otros principios activos y agentes auxiliares activos en productos insecticidas domésticos. Son efectivos contra especies sensibles y resistentes y

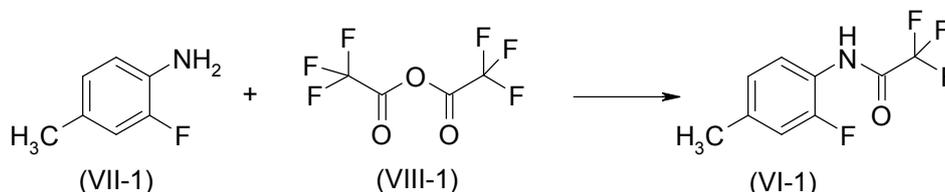
- contra todos los estadios de desarrollo. Estas plagas incluyen:  
Del orden de los escorpiones, por ejemplo, *Buthus occitanus*.
- 5 Del orden de los ácaros, por ejemplo, *Argas persicus*, *Argas reflexus*, *Bryobia* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Glyciphagus domesticus*, *Ornithodoros moubat*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Trombicula alfreddugesi*, *Neutrombicula autumnalis*, *Dermatophagoides pteronissimus*, *Dermatophagoides forinae*.
- Del orden de las arañas, por ejemplo, *Aviculariidae*, *Araneidae*.
- Del orden de los opiliones, por ejemplo, *Pseudoscorpiones chelifer*, *Pseudoscorpiones cheiridium*, *Opiliones phalangium*.
- Del orden de los isópodos, por ejemplo, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*.
- 10 Del orden de los diplópodos, por ejemplo, *Blaniulus guttulatus*, *Polydesmus* spp.
- Del orden de los quilópodos, por ejemplo, *Geophilus* spp.
- Del orden de los zigentomas, por ejemplo, *Ctenolepisma* spp., *Lepisma saccharina*, *Lepismodes inquilinus*.
- 15 Del orden de los blatarios, por ejemplo, *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Blattella asahinai*, *Leucophaea maderae*, *Panchlora* spp., *Parcoblatta* spp., *Periplaneta australasiae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Supella longipalpa*.
- Del orden de los saltatorios, por ejemplo, *Acheta domesticus*.
- Del orden de los dermápteros, por ejemplo, *Forficula auricularia*.
- Del orden de los isópteros, por ejemplo, *Kaloterme* spp., *Reticuliterme* spp.
- Del orden de los psocópteros, por ejemplo, *Lepinatus* spp., *Liposcelis* spp.
- 20 Del orden de los coleópteros, por ejemplo, *Anthrenus* spp., *Attagenus* spp., *Dermestes* spp., *Latheticus oryzae*, *Necrobia* spp., *Ptinus* spp., *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus granarius*, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Stegobium paniceum*.
- 25 Del orden de los dípteros, por ejemplo, *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes taeniorhynchus*, *Anopheles* spp., *Calliphora erythrocephala*, *Chrysozona pluvialis*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex pipiens*, *Culex tarsalis*, *Drosophila* spp., *Fannia canicularis*, *Musca domestica*, *Phlebotomus* spp., *Sarcophaga carnaria*, *Simulium* spp., *Stomoxys calcitrans*, *Tipula paludosa*.
- Del orden de los lepidópteros, por ejemplo, *Achroia grisella*, *Galleria mellonella*, *Plodia interpunctella*, *Tinea cloacella*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*.
- 30 Del orden de los sifonápteros, por ejemplo, *Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, *Xenopsylla cheopis*.
- Del orden de los himenópteros, por ejemplo, *Camponotus herculeanus*, *Lasius fuliginosus*, *Lasius niger*, *Lasius umbratus*, *Monomorium pharaonis*, *Paravespula* spp., *Tetramorium caespitum*.
- Del orden de los anopluros, por ejemplo, *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pemphigus* spp., *Phylloera vastatrix*, *Phthirus pubis*.
- 35 Del orden de los heterópteros, por ejemplo, *Cimex hemipterus*, *Cimex lectularius*, *Rhodinus prolixus*, *Triatoma infestans*.
- En el campo de los insecticidas domésticos, éstos se usan solos o en combinación con otros principios activos adecuados, tales como ésteres de ácido fosfórico, carbamatos, piretroides, neonicotinoides, reguladores del crecimiento o principios activos de otras clases conocidas de insecticidas.
- 40 Se usan en aerosoles, productos de pulverización sin presión, por ejemplo pulverizadores de bomba y atomizadores, sistemas automáticos de nebulización, nebulizadores, espumas, geles, productos de vaporización con placas de vaporización de celulosa o plástico, vaporizadores de líquido, vaporizadores de gel y membrana, vaporizadores por propulsión, sistemas de vaporización carentes de energía o pasivos, papeles antipollas, bolsitas antipollas y geles antipollas, en forma de gránulos o polvos, en cebos para dispersar o en trampas con cebo.

**Ilustración de los procedimientos e intermedios**

Los siguientes Ejemplos de preparación y de uso ilustran la invención sin limitarla.

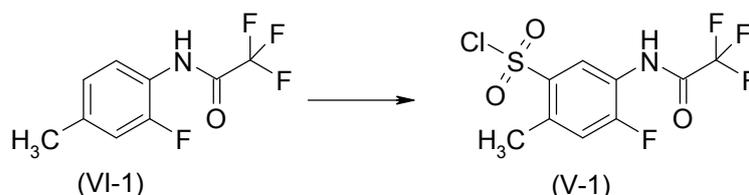
Ejemplo de preparación 1: 2,2,2-Trifluoro-N'-(2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfonil]fenil)-N,N-dimetiletanimidamida (Ib-01)

5 Etapa 1: 2,2,2-Trifluoro-N-(2-fluoro-4-metilfenil)acetamida (VI-1)



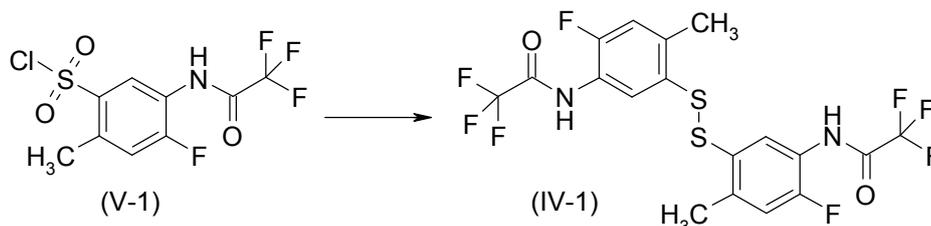
10 A 0 °C, se cargan inicialmente 27,5 g de 2-fluoro-4-metil-anilina en 300 ml de diclorometano, se añaden 26,7 g de trietilamina y seguidamente se añaden gota a gota 50,8 g de anhídrido trifluoroacético. La mezcla se agita a 0 °C durante otras 2 h y luego se concentra por evaporación rotatoria. El residuo se recoge en agua y se extrae dos veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas reunidas se secan sobre sulfato de sodio y se filtra y el disolvente se elimina a presión reducida. Esto da 49,0 g (100 % del teórico) de la trifluoroacetamida (VI-1).  
logP(HCOOH): 2,40

**Etapa 2:** Cloruro de 4-fluoro-2-metil-5-[(trifluoroacetil)amino]bencenosulfonilo (V-1)



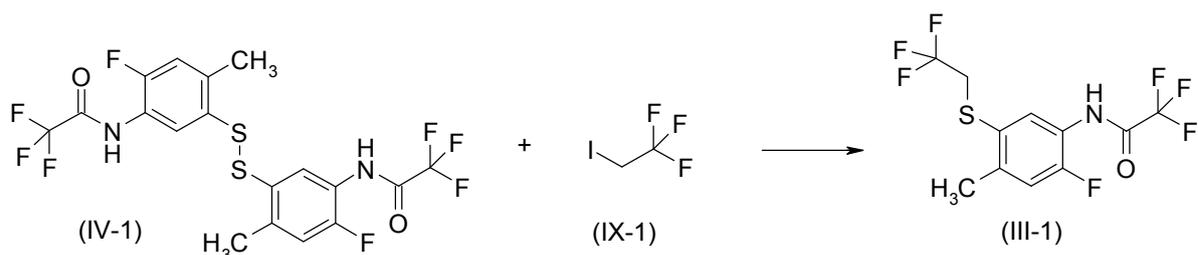
15 Se cargan inicialmente 258 g de ácido clorosulfónico, y 49 g de 2,2,2-trifluoro-N-(2-fluoro-4-metilfenil)acetamida (VI-1) se añaden poco a poco a temperatura ambiente. La mezcla se agita a temperatura ambiente durante otras 16 h. Con agitación, la mezcla se añade a hielo y se extrae dos veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas reunidas se secan sobre sulfato de sodio y se filtra y el disolvente se elimina a presión reducida. Esto da 70,8 g del clorosulfonilo (V-1). El producto bruto se hace reaccionar luego inmediatamente.

20 **Etapa 3:** N,N'-[Disulfanodibis(6-fluoro-4-metilbenceno-3,1-diil)]bis(2,2,2-trifluoroacetamida) (IV-1)



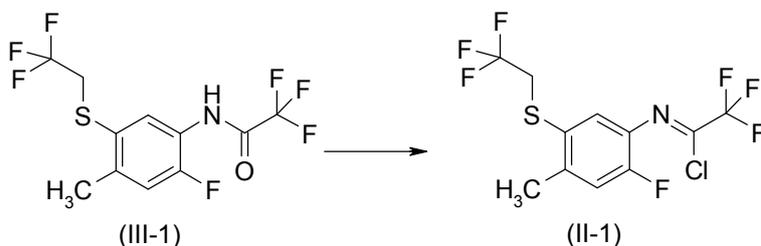
25 Se disuelven 298,8 g de yoduro de sodio en 1000 ml de ácido trifluoroacético, y se añaden a temperatura ambiente 70,8 g de cloruro de 4-fluoro-2-metil-5-[(trifluoroacetil)amino]bencenosulfonilo (V-1). La mezcla se agita a temperatura ambiente durante 16 h y el disolvente se elimina seguidamente a presión reducida. El residuo se tritura con agua y se separa por filtración con succión. Esto da 62,3 g (86 % del teórico) del disulfuro (IV-1) como un sólido.  
logP(HCOOH): 4,41

**Etapa 4:** 2,2,2-Trifluoro-N-(2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil)acetamida (III-1)



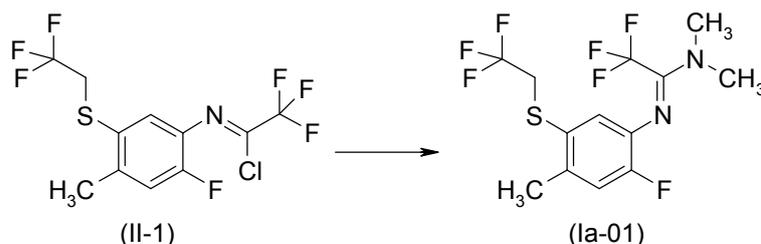
5 Se disuelven 3,4 g de N,N'-[disulfanodibis(6-fluoro-4-metilbenceno-3,1-diil)]bis(2,2,2-trifluoroacetamida) (IV-1) en 150 ml de N,N-dimetilformamida, y se añaden 1,86 g de carbonato de potasio, 3,11 g de 1,1,1-trifluoroyodoetano (XVI-1), 2,39 g de Rongalite y unas gotas de agua. La mezcla de reacción se agita a temperatura ambiente durante 16 h. La mayor parte de la N,N-dimetilformamida se elimina por destilación a presión reducida. El residuo se recoge en agua y se extrae dos veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas reunidas se secan sobre sulfato de sodio y se filtra, y el disolvente se elimina seguidamente a presión reducida. Esto da 4,48 g (90 % del teórico) del tioéter (III-1).  
logP(HCOOH): 3,31

10 **Etapas 5:** Cloruro de 2,2,2-trifluoro-N-[2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil]etanamidoilo (II-1)

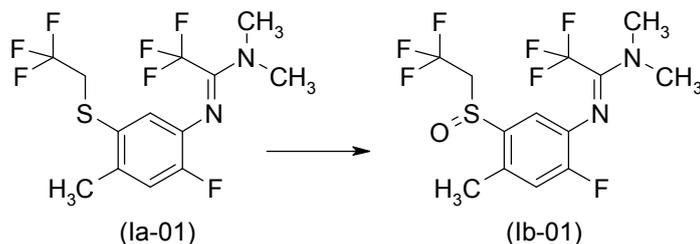


15 Se calientan a reflujo durante 16 h 1 g de 2,2,2-trifluoro-N-[2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil]acetamida (III-1), 1,51 g de trietilamina y 4,01 g de clorofosfato de difenilo en 20 ml de acetonitrilo. Después de enfriar, se añade acetato de etilo y el sólido precipitado se separa por filtración y se desecha. El filtrado se adsorbe sobre gel de sílice y se somete a cromatografía usando ciclohexano/acetato de etilo (98/2). La eliminación del disolvente proporciona 1 g del cloruro de imidoilo (II-1).

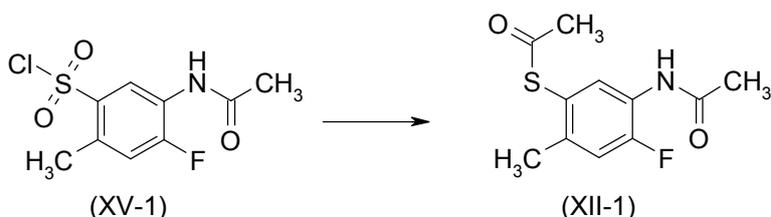
**Etapas 6:** 2,2,2-Trifluoro-N'-[2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil]-N,N-dimetiletanimidamida (Ia-01)



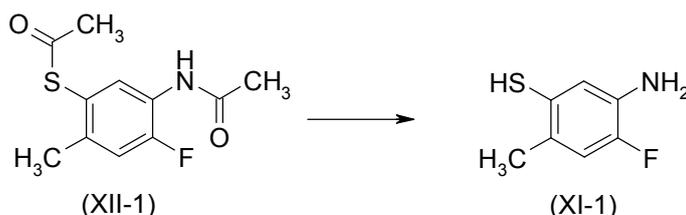
20 Se cargan inicialmente 0,77 g de dimetilamina (2 M en THF) en 40 ml de acetonitrilo, y se añade gota a gota a temperatura ambiente 1 g de cloruro de 2,2,2-trifluoro-N-[2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil]etanamidoilo (II-1) disuelto en 10 ml de acetonitrilo. La mezcla de reacción se agita a temperatura ambiente durante 16 h y el disolvente se elimina seguidamente a presión reducida. El residuo se recoge en agua y se extrae dos veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas reunidas se secan sobre sulfato de sodio y se filtra, y el disolvente se elimina seguidamente a presión reducida. Esto da 0,36 g (35 % del teórico) de la amidina (Ia-01).  
25 logP(HCOOH): 4,48

**Etapa 7:** 2,2,2-Trifluoro-N'-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]fenil}-N,N-dimetiletanimidamida (Ib-01)

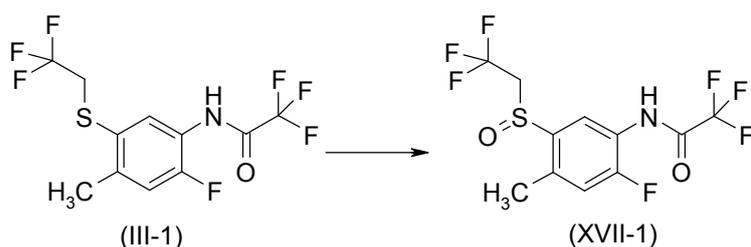
Se disuelven 0,36 g de 2,2,2-trifluoro-N'-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]fenil}-N,N-dimetiletanimidamida (Ia-01) en 30 ml de diclorometano, y se añaden a temperatura ambiente 0,21 g de ácido meta-cloroperbenzoico. La mezcla de reacción se agita a temperatura ambiente durante otras 16 h y luego se alcaliniza usando solución de carbonato de sodio. El exceso de ácido meta-cloroperbenzoico se reduce con tiosulfato de sodio. Después de separar las fases, el disolvente se elimina a presión reducida. El residuo se somete a cromatografía con ciclohexano/acetona (9/1). Esto da 0,31 g (79 % del teórico) de la amidina (Ib-01).  
logP(HCOOH): 3,15

**Ejemplo de preparación 2: 5-Amino-4-fluoro-2-metilbencenotiol (XI-1)****Etapa 1:** Etanotioato de S-(5-acetamido-4-fluoro-2-metilfenilo) (XII-1)

Se suspenden 99,3 g de 5-acetamido-4-fluoro-2-metilbencenosulfonilo cloruro de (XV-1) en 700 ml de ácido acético glacial, se añaden 0,9 g de yodo y 38,7 g de fósforo rojo, y la mezcla se agita a reflujo durante 5 h. Después de enfriar, el sólido se separa por filtración y el filtrado se concentra por evaporación rotatoria. El residuo se tritura con agua y se separa por filtración con succión. Esto da 57,6 g (67 % del teórico) del tioato (XII-1) como un sólido.  
logP(HCOOH): 1,78

**Etapa 2:** 5-Amino-4-fluoro-2-metilbencenotiol (XI-1)

Se disuelven 57,4 g de etanotioato de S-(5-acetamido-4-fluoro-2-metilfenilo) (XII-1) en 750 ml de agua y 96,6 g de hidróxido de potasio. La mezcla de reacción se hierve a reflujo durante 16 horas. Después de enfriar, la solución se ajusta a pH 2-3 usando ácido clorhídrico, y el sólido precipitado se separa por filtración con succión. Esto da 35,8 g (94 % del teórico) del tiol (XI-1) como un sólido.  
logP(HCOOH): 3,70

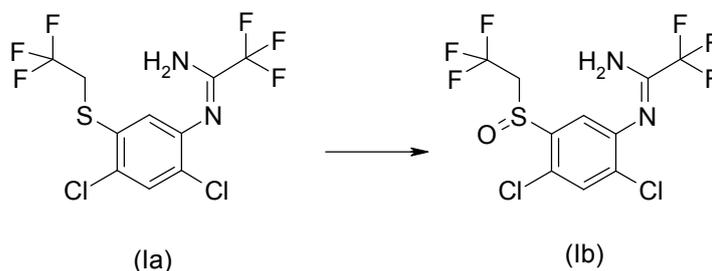
**25 Oxidación quiral de (III) a (XVII)****Ejemplo 1:** Síntesis de 2,2,2-trifluoro-N-{4-fluoro-2-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]fenil}acetamida

En un matraz de tres bocas, se disolvieron 500 mg (1,49 mmol) de 2,2,2-trifluoro-N-{4-fluoro-2-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}acetamida en 5 g de cloroformo y se enfrió hasta 15 °C. Se añadió a esta mezcla una solución de 15,82 mg (0,06 mmol) de acetilacetato de vanadio y 29,84 mg (0,089 mmol) de (S)(2,4-di-*terc*-butil-6-  
 5 {E)-[(1-hidroxi-3,3-dimetilbutan-2-il)imino]metil}fenol 1 g de cloroformo. Después de 5 minutos, se dosificó durante 20 minutos una solución de 225,5 mg (1,79 mmol) de 30 % de concentración de H<sub>2</sub>O<sub>2</sub> y 300 mg de solución tampón pH 7 (KH<sub>2</sub>PO<sub>4</sub>/Na<sub>2</sub>HPO<sub>4</sub>). El progreso de la reacción se controló por HPLC. Después de un tiempo de reacción de 2 h, se añadieron 100 mg de solución de tiosulfato y se evaporó la mayor parte del cloroformo a presión reducida. Se añadieron 5 g de ciclohexano al residuo el sólido precipitado se separó por filtración.

10 Esto dio 1-{2,4-dimetil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]fenil}-3-(trifluorometil)-1H-1,2,4-triazol (91,24 % pureza por HPLC) como un sólido beige. El exceso enantiomérico se determinó por HPLC en una fase quirál (Daicel Chiracel OJ-RH 150) con una proporción de 25,90:74,10.

### Oxidación quirál de (Ia) a (Ib)

#### Ejemplo 1: Síntesis de N'-{2,4-dicloro-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]fenil}-2,2,2-trifluoroetanimidamida

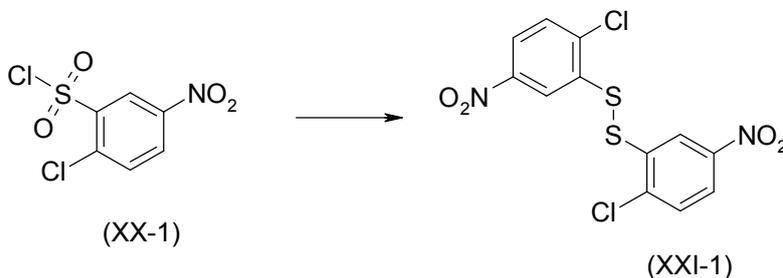


15 En un matraz de tres bocas, se disolvió 1 g (2,69 mmol) de N'-{2,4-dicloro-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-2,2,2-trifluoroetanimidamida en 10 ml de cloroformo y se enfrió hasta 15 °C. Se añadió a esta mezcla una solución de 29 mg (0,10 mmol) de acetilacetato de vanadio y 54 mg (0,16 mmol) de (S)(2,4-di-*terc*-butil-6-  
 20 {E)-[(1-hidroxi-3,3-dimetilbutan-2-il)imino]metil}fenol en 2 ml de cloroformo. Se dosificó durante 4 horas una solución de 367 mg (3,23 mmol) de 30 % de concentración de H<sub>2</sub>O<sub>2</sub> y 750 mg de solución tampón pH 7 (KH<sub>2</sub>PO<sub>4</sub>/Na<sub>2</sub>HPO<sub>4</sub>). El progreso de la reacción se controló por TLC. Después de un tiempo de reacción de 2 h, se añadieron 128 mg de solución de tiosulfato (1M) y la mezcla se agitó durante una noche. Se separaron las fases y se evaporó la mayor parte del cloroformo (salvo aproximadamente 3 ml) a presión reducida. Se añadió ciclohexano al residuo y el sólido precipitado se separó por filtración.

25 Esto dio 980 mg de N'-{2,4-dicloro-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]fenil}-2,2,2-trifluoroetanimidamida (pureza por HPLC >99 %) como un sólido. El exceso enantiomérico se determinó por HPLC en una fase quirál (Daicel Chiracel OD-RH 150) con una proporción de 89,63:10,37.

#### Ejemplo de preparación 3: N'-{4-Cloro-3-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]fenil}-2,2,2-trifluoroetanimidamida (Ib-108)

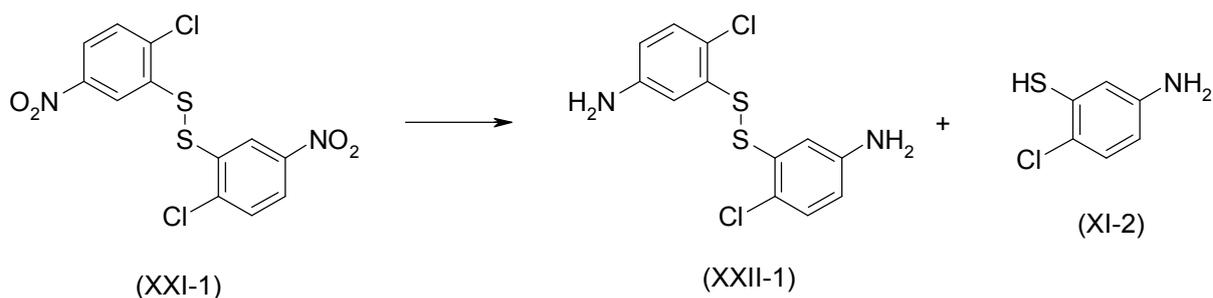
##### Etapla 1: 1,1'-Disulfanodiilbis(2-cloro-5-nitrobenceno)



30 Con agitación vigorosa, se añaden 236,1 g (1,02 mol) de ácido clorosulfónico a 52,0 g (203,1 mmol) de cloruro de 2-cloro-5-nitrobenzenosulfonilo, y la mezcla se agita a temperatura ambiente durante una noche. Después de la adición de solución acuosa concentrada al 40 % de bisulfito de sodio, el sólido formado se separa por filtración con succión, se lava con agua y se seca en un disco de arcilla durante una noche. Esto da 36,1 g (100 % de pureza, 94 % del teórico) del compuesto del epígrafe como un sólido gris-pardo.

35 logP(HCOOH): 5,03; logP(neutro): 5,01; RMN de <sup>1</sup>H (D6-DMSO, 400 MHz) δ ppm 8,40(d,2H), 8,18-8,16(m,2H), 7,91(d,2H); CG-EM: masa por IE (m/z): 376 (2Cl) [M]<sup>+</sup>

##### Etapla 2: 3,3'-Disulfanodiilbis(4-cloroanilina)



Se disuelven 8,00 g (21,2 mmol) de 1,1'-disulfanodiilbis(2-cloro-5-nitrobenzene) en 150 ml de THF, se añaden 1,6 g de níquel Raney y la mezcla se agita a 50 °C bajo una atmósfera de hidrógeno ( $20 \times 10^5$  Pa) durante 72 h. Usando THF, la mezcla de reacción se filtra a través de kieselguhr, y se elimina el disolvente del filtrado a presión reducida. Esto da 6,64 g (90 % de pureza, 89 % del teórico) de una mezcla de 1,1'-disulfanodiilbis(2-cloro-5-nitrobenzene) y 5-amino-2-clorobenzenotiol que se alquila sin purificación posterior.

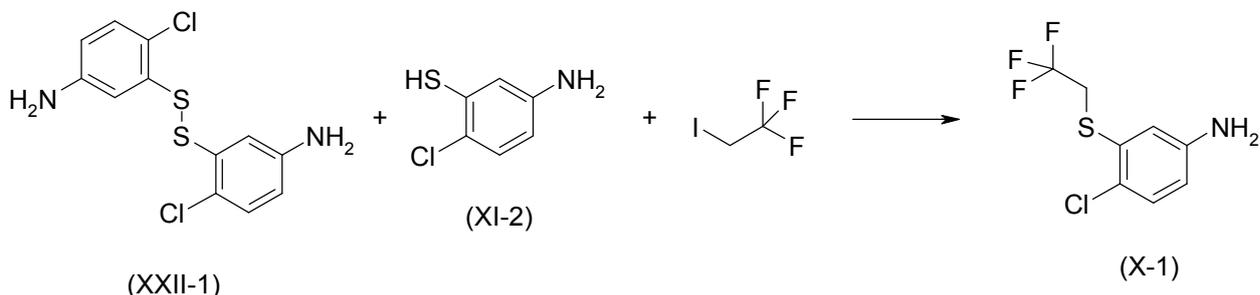
1,1'-Disulfanodiilbis(2-cloro-5-nitrobenzene):

logP(HCOOH): 3,31; logP(neutro): 3,35; RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO, 400 MHz)  $\delta$  ppm 7,10(d,2H), 6,73(d,2H), 6,47-6,44(m,2H), 5,51(ancho, 4H); CG-EM: masa por IE (m/z): 316 (2Cl) [M]<sup>+</sup>

5-Amino-2-clorobenzenotiol:

logP(HCOOH): 1,64; logP(neutro): no determinable; RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO, 400 MHz)  $\delta$  ppm 7,01(d,1H), 6,54(d,1H), 6,35-6,32(m,1H), 5,28(ancho, 3H); CG-EM: masa por IE (m/z): 159 (1Cl) [M]<sup>+</sup>

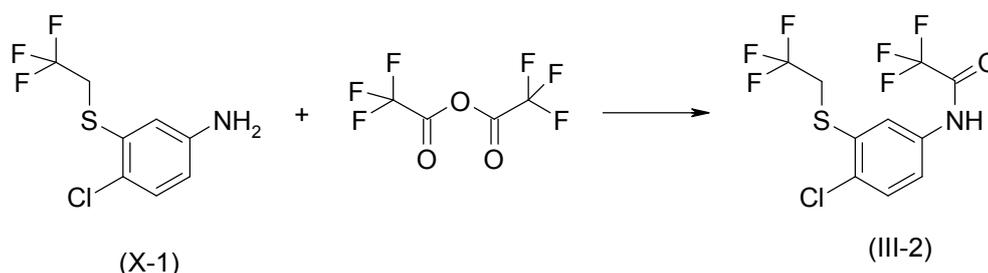
**Etapa 3:** 4-Cloro-3-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]anilina



Se cargan inicialmente 6,40 g de una mezcla de disulfanodiilbis(2-cloro-5-nitrobenzene) y 5-amino-2-clorobenzenotiol (aproximadamente 20 mmol) en 100 ml de N,N-dimetilformamida, y se añaden 7,02 g (40,3 mmol) de ditionito de sodio, 5,58 g (40,3 mmol) de carbonato de potasio y 5,49 g (40,3 mmol) de Rongalit y la mezcla se enfría hasta 0 °C. Se añaden gota a gota a 0 °C 9,32 g de 1,1,1-trifluoro-2-yodoetano. La mezcla de reacción se agita a temperatura ambiente durante una noche. Se elimina la mayor parte del disolvente a presión reducida, se añade agua al residuo y la mezcla se extrae con acetato de etilo. Las fases orgánicas reunidas se lavan sucesivamente con agua y solución acuosa saturada de cloruro de sodio, se seca sobre sulfato de magnesio, se filtra y se elimina el disolvente a presión reducida. La purificación por cromatografía en columna sobre gel de sílice por medio de MPLC usando la fase móvil ciclohexano/acetato de etilo da 4,70 g (98 % de pureza, 47 % del teórico) del compuesto del epígrafe como un líquido amarillo.

logP(HCOOH): 2,64; logP(neutro): 2,69; RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO, 400 MHz)  $\delta$  ppm 7,09(d,1H), 6,78(d,1H), 6,49-6,46(m,1H), 5,37(ancho, 2H), 3,90(q,2H); CG-EM: masa por IE (m/z): 241 (1Cl) [M]<sup>+</sup>

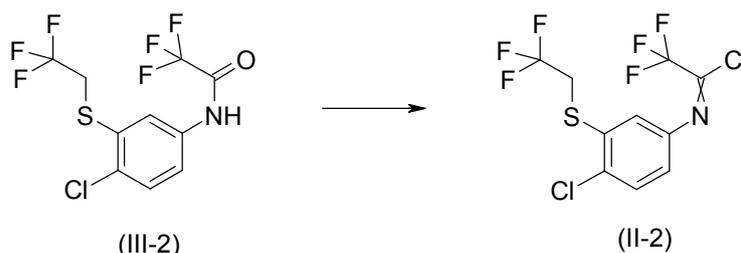
**Etapa 4:** N-[4-Cloro-3-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil]-2,2,2-trifluoroacetamida



Se carga inicialmente 1,00 g (4,14 mmol) de 4-cloro-3-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]anilina en 14 ml de diclorometano, y se añaden a 0 °C 0,50 g (4,97 mmol) de trietilamina. Se añaden gota a gota a 0 °C 0,96 g (4,55 mmol) de anhídrido trifluoroacético. La mezcla de reacción se agita a temperatura ambiente durante una noche, luego se lava con agua y solución acuosa saturada de cloruro de sodio, se seca sobre sulfato de magnesio, se filtra y se elimina el disolvente a presión reducida. La purificación por cromatografía en columna sobre gel de sílice por medio de MPLC usando la fase móvil ciclohexano/acetato de etilo da 1,00 g (99 % de pureza, 71 % del teórico) del compuesto del epígrafe como un sólido incoloro.

logP(HCOOH): 3,46; logP(neutro): 3,41; RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO, 400 MHz)  $\delta$  ppm 11,43(s,1H), 7,91(d,1H), 7,63-7,69(m,1H), 7,56-7,58(m,1H), 4,05(q,2H); RMN de  $^1\text{H}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz)  $\delta$  ppm 7,85(ancho, 1H), 7,82(d,1H), 7,52-7,45(m,2H), 3,53(q,2H); CG-EM: masa por IE (m/z): 337 (1Cl) [M]<sup>+</sup>

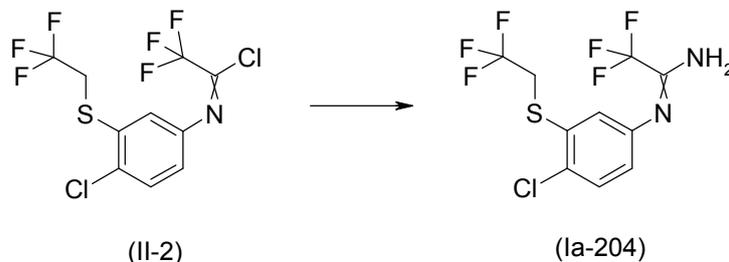
**Etapa 5:** Cloruro de N-{4-cloro-3-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-2,2,2-trifluoroetanimidóilo



Se cargan inicialmente en 17 ml de acetonitrilo 880 mg (2,61 mmol) de N-{4-cloro-3-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-2,2,2-trifluoroacetamida, 1,32 g (13,03 mmol) de trietilamina y se añaden a temperatura ambiente 3,50 g (13,03 mmol) de clorofosfato de difenilo y la mezcla se calienta a reflujo durante una noche. Después de enfriar, se añade acetato de etilo y la mezcla se filtra y se concentra. El residuo se somete directamente a purificación por cromatografía en columna sobre gel de sílice por MPLC usando la fase móvil ciclohexano/acetato de etilo. Esto da 640 mg (93 % de pureza, 64 % del teórico) del compuesto del epígrafe como un aceite amarillo.

logP(HCOOH): 4,77; logP(neutro): 4,73; RMN de  $^1\text{H}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz)  $\delta$  ppm 7,51(d,1H), 7,24(d,1H), 7,02-7,00(m,1H), 3,51(q,2H); CG-EM: masa por IE (m/z): 355 (2Cl) [M]<sup>+</sup>

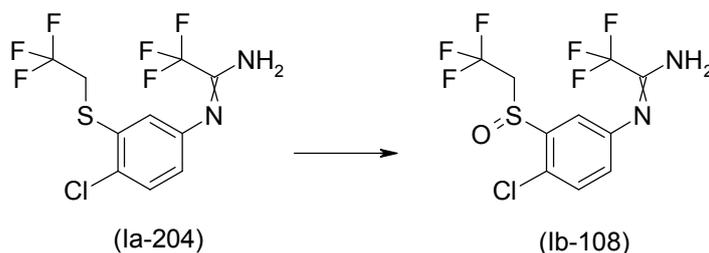
**Etapa 6:** N'-(4-Cloro-3-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil)-2,2,2-trifluoroetanimidamida (Ia-204)



Se cargan inicialmente en 5 ml de acetonitrilo 210 mg (0,59 mmol) de cloruro de N-{4-cloro-3-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-2,2,2-trifluoroetanimidóilo, y se añade una solución de 241 mg (3,54 mmol) de solución acuosa al 25 % de amoníaco en 5 ml de acetonitrilo. La mezcla de reacción se agita a temperatura ambiente durante una noche y luego se concentra. El residuo se extrae con agua y acetato de etilo. Las fases orgánicas reunidas se secan sobre sulfato de magnesio, se filtra y se elimina el disolvente a presión reducida. La purificación por cromatografía en columna sobre gel de sílice por medio de MPLC usando la fase móvil ciclohexano/acetato de etilo da 120 mg (100 % de pureza, 60 % del teórico) del compuesto del epígrafe como un aceite amarillo.

logP(HCOOH): 3,10; logP(neutro): 3,10; RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO, 400 MHz)  $\delta$  ppm 7,42(d,1H), 7,26(ancho, 2H), 7,05(d,1H), 6,75-6,72(m,1H), 4,13(q,2H)

**Etapa 7:** N'-(4-Cloro-3-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil)-2,2,2-trifluoroetanimidamida (Ib-108)



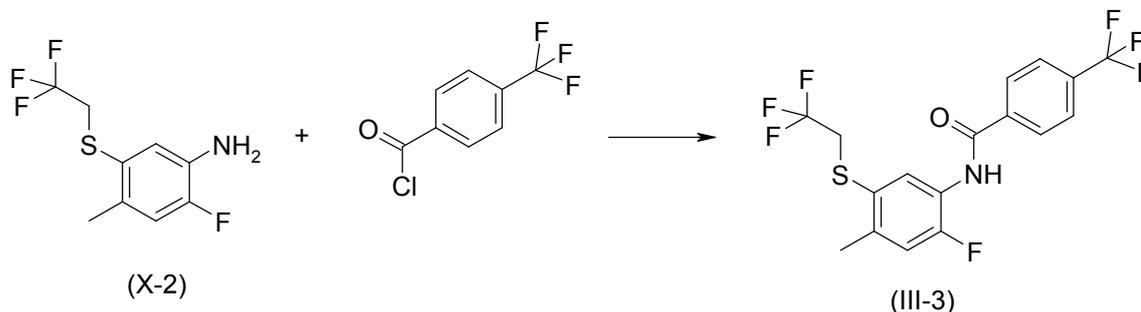
Se disuelven 90 mg (0,27 mmol) de N'-{4-cloro-3-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-2,2,2-trifluoroetanimidamida en 6 ml de diclorometano, y se añaden a 0 °C 68 mg (0,29 mmol) de ácido meta-cloroperbenzoico. Después de dos horas de agitación a 0 °C, se añaden otros 23 mg (0,13 mmol). La mezcla de reacción se agita a temperatura ambiente durante una noche y luego se diluye con diclorometano y se lava sucesivamente con solución concentrada al 40 %

5 de bisulfito de sodio y bicarbonato de sodio acuoso saturado. La fase orgánica se seca sobre sulfato de magnesio, se filtra y se elimina el disolvente a presión reducida. La purificación por cromatografía en columna sobre gel de sílice por medio de MPLC usando la fase móvil ciclohexano/acetato de etilo da 90 mg (95 % de pureza, 91 % del teórico) del compuesto del epígrafe como un sólido beige.

10 logP(HCOOH): 2,25; logP(neutro): 2,21; RMN de <sup>1</sup>H (D6-DMSO, 400 MHz) δ ppm 7,57(d,1H), 7,42(ancho, 2H), 7,30(d,1H), 7,10-7,07(m,1H), 4,22-4,04(m,2H)

**Ejemplo de preparación 4: N'-{2-Fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-N-metil-4-(trifluorometil)benzenocarboximidamida (Ia-250)**

**Etapas 1:** N-{2-Fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-4-(trifluorometil)benzamidina

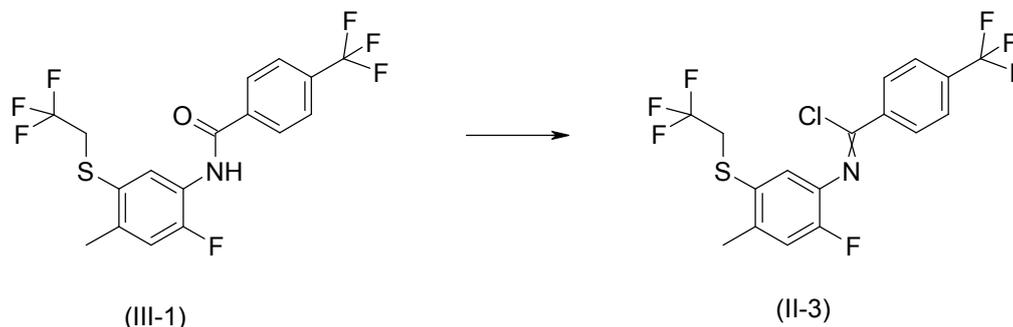


15 Se carga inicialmente en 25 ml de diclorometano 1,00 g (4,18 mmol) de 2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]anilina, se añaden 0,47 g (4,60 mmol) de trietilamina y la mezcla se enfría hasta 0 °C. Se añaden gota a gota a 0 °C 0,96 g (4,60 mmol) de cloruro de 4-(trifluorometil)benzoilo en 25 ml de diclorometano. La mezcla de reacción se agita a temperatura ambiente durante una noche. Se añaden 0,17 g (0,84 mmol) de cloruro de 4-(trifluorometil)benzoilo, y la mezcla se agita a temperatura ambiente durante otras 3 h. La mezcla de reacción se diluye con diclorometano, se lava sucesivamente con solución acuosa semisaturada de cloruro de amonio y solución acuosa saturada de cloruro de sodio, se seca sobre sulfato de magnesio, se filtra y se elimina el disolvente a presión reducida. El residuo se tritura con éter de petróleo, se separa por filtración con succión y se seca. Esto da 1,69 g

20 (95 % de pureza, 93 % del teórico) del compuesto del epígrafe como un sólido incoloro.

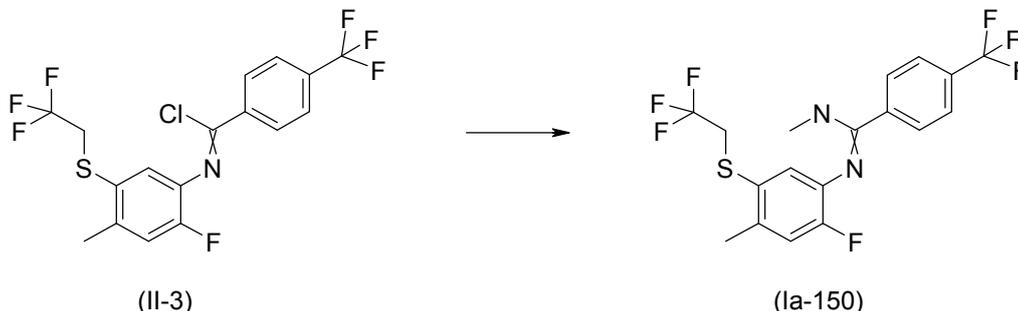
25 logP(HCOOH): 4,20; logP(neutro): 4,17; RMN de <sup>1</sup>H (D6-DMSO, 400 MHz) δ ppm 10,40(s,1H), 8,17(d,2H), 7,93(d,2H), 7,82(d,1H), 7,31(d,1H), 3,89(q,2H), 2,42(s,3H); RMN de <sup>1</sup>H (CD<sub>3</sub>CN, 400 MHz) δ ppm 8,70(ancho, 1H), 8,12(d,1H), 8,08(d,2H), 7,84(d,2H), 7,17(d,1H), 3,57(q,2H), 2,46(s,3H); CG-EM: masa por IE (m/z): 411 [M]<sup>+</sup>

**Etapas 2:** Cloruro de N-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-4-(trifluorometil)benzenocarboximidóilo



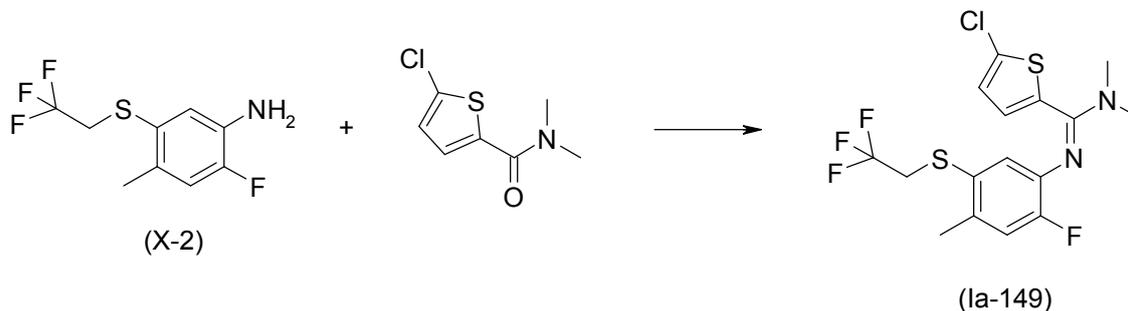
30 Se carga inicialmente en 20 ml de diclorometano 1,00 g (2,43 mmol) de N-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-4-(trifluorometil)benzamidina, se añaden 0,51 g (2,43 mmol) de pentacloruro de fósforo y la mezcla se agita a temperatura ambiente durante una noche. Se añaden otros 0,51 g (2,43 mmol) de pentacloruro de fósforo y la mezcla se agita a temperatura ambiente durante una noche. Se añaden otros 0,51 g (2,43 mmol) de pentacloruro de fósforo, y la mezcla de reacción se agita a temperatura ambiente durante 3 h y luego se filtra a través de gel de sílice y se concentra. Esto da 0,91 g (74 % de pureza, 65 % del teórico) del compuesto del epígrafe como un aceite amarillo que se hace reaccionar directamente a continuación.

35 RMN de <sup>1</sup>H (CD<sub>3</sub>CN, 400 MHz) δ ppm 8,32(d,2H), 7,86(d,2H), 7,32(d,1H), 7,21(d,1H), 3,58(q,2H), 2,47(s,3H); CG-EM: masa por IE (m/z): 429 (1Cl) [M]<sup>+</sup>

**Etapas 3:** N'-{2-Fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-N-metil-4-(trifluorometil)bencenocarboximidamida

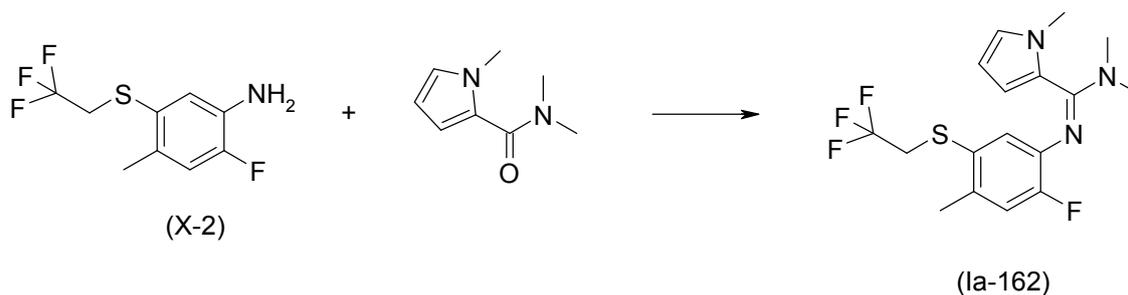
Se cargan inicialmente en 25 ml de acetonitrilo 150 mg (4,65 mmol) de metilamina (2M en THF), se añaden a 0 °C 400 mg (0,93 mmol) de cloruro de N'-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-4-(trifluorometil)bencenocarboximidoilo en 25 ml de acetonitrilo y la mezcla se agita a temperatura ambiente durante una noche y luego se concentra. El residuo se purifica por cromatografía en columna sobre gel de sílice por MPLC usando la fase móvil ciclohexano/acetato de etilo. Esto da 220 mg (99 % de pureza, 56 % del teórico) del compuesto del epígrafe como un sólido amarillo.

logP(HCOOH): 1,96; logP(neutro): 4,08; RMN de <sup>1</sup>H (D6-DMSO, 400 MHz) δ ppm 7,64(d,2H), 7,46(d,1H), 7,39(d,2H), 6,88(d,1H), 7,76(d,1H), 3,53(q,2H), 2,89(d,3H), 2,20(s,3H); CG-EM: masa por IE (m/z): 424 [M]<sup>+</sup>

**Ejemplo de preparación 5: 5-Cloro-N'-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-N,N-dimetiltiofen-2-carboximidamida (Ia-149)****Etapas 1:** 5-Cloro-N'-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-N,N-dimetiltiofen-2-carboximidamida

Se añaden 743 mg (4,85 mmol) de cloruro de fosforilo a 200 mg (0,84 mmol) de 2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]anilina y 206 mg (1,09 mmol) de 5-cloro-N,N-dimetiltiofen-2-carboxamida, y la mezcla se calienta a reflujo durante una noche. Después de enfriar, la mezcla de reacción se vierte en agua, se alcaliniza con carbonato de potasio y se extrae con diclorometano. Las fases orgánicas reunidas se secan sobre sulfato de magnesio, se filtra y se elimina el disolvente a presión reducida. La purificación por cromatografía en columna sobre gel de sílice por medio de MPLC usando la fase móvil ciclohexano/acetato de etilo da 165 mg (92 % de pureza, 44 % del teórico) del compuesto del epígrafe como un aceite rojo-pardo.

logP(HCOOH): 2,11; logP(neutro): 4,89; RMN de <sup>1</sup>H (D6-DMSO, 400 MHz) δ ppm 7,00(d,1H), 7,93(d,1H), 6,87-6,84(m,2H), 3,68(q,2H), 2,97(ancho, 6H), 2,23(s,3H)

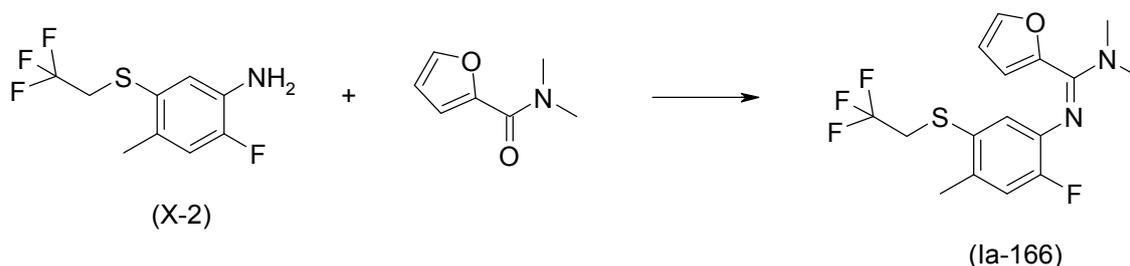
**Ejemplo de preparación 6: N'-{2-Fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-N,N,1-trimetil-1H-pirrol-2-carboximidamida (Ia-162)****Etapas 1:** N'-{2-Fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-N,N,1-trimetil-1H-pirrol-2-carboximidamida

Se añaden 743 mg (4,85 mmol) de cloruro de fosforilo a 200 mg (0,84 mmol) de 2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]anilina y 165 mg (1,09 mmol) de N,N,1-trimetil-1H-pirrol-2-carboxamida, y la mezcla se calienta a reflujo durante una noche. Después de enfriar, la mezcla de reacción se vierte en agua, se alcaliniza con carbonato de potasio y se extrae con diclorometano. Las fases orgánicas reunidas se secan sobre sulfato de magnesio, se filtra y se elimina el disolvente a presión reducida. La purificación por cromatografía en columna sobre gel de sílice por medio de MPLC usando la fase móvil ciclohexano/acetato de etilo da 177 mg (99 % de pureza, 56 % del teórico) del compuesto del epígrafe como un aceite amarillo.

5 logP(HCOOH): 1,67; logP(neutro): 4,11; RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO, 400 MHz)  $\delta$  ppm 6,88(d,1H), 6,70-6,68(m,1H), 6,64(d,1H), 5,91-5,89(m,2H), 3,59(q,2H), 3,39(s,3H), 3,05(ancho, 3H), 2,77(ancho, 3H), 2,21(s,3H)

10 **Ejemplo de preparación 7: N'-{2-Fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-N,N-dimetilfuran-2-carboximidamida (Ia-166)**

**Etapas 1:** N'-{2-Fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-N,N-dimetilfuran-2-carboximidamida

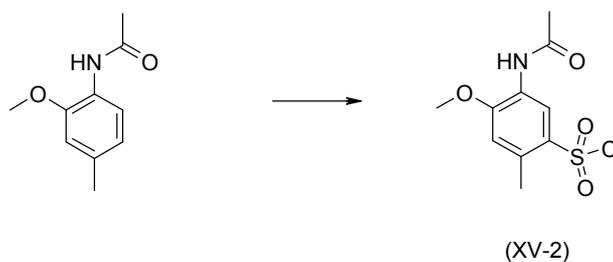


15 Se añaden 743 mg (4,85 mmol) de cloruro de fosforilo a 200 mg (0,84 mmol) de 2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]anilina y 139 mg (1,09 mmol) de N,N-dimetil-2-furanamida, y la mezcla se calienta a reflujo durante una noche. Después de enfriar, la mezcla de reacción se vierte en agua, se alcaliniza con carbonato de potasio y se extrae con diclorometano. Las fases orgánicas reunidas se secan sobre sulfato de magnesio, se filtra y se elimina el disolvente a presión reducida. La purificación por cromatografía en columna sobre gel de sílice por medio de MPLC usando la fase móvil ciclohexano/acetato de etilo da 64 mg (98 % de pureza, 21 % del teórico) del compuesto del epígrafe como un aceite amarillo.

20 logP(HCOOH): 1,57; logP(neutro): 3,94; RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO, 400 MHz)  $\delta$  ppm 7,69-7,67(m,1H), 6,91(d,1H), 6,76(d,1H), 6,43-6,40(m,1H), 6,25(d,1H), 3,69(q,2H), 2,94(s,6H), 2,24(s,3H)

**Ejemplo de preparación 8: 2-Metoxi-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]anilina**

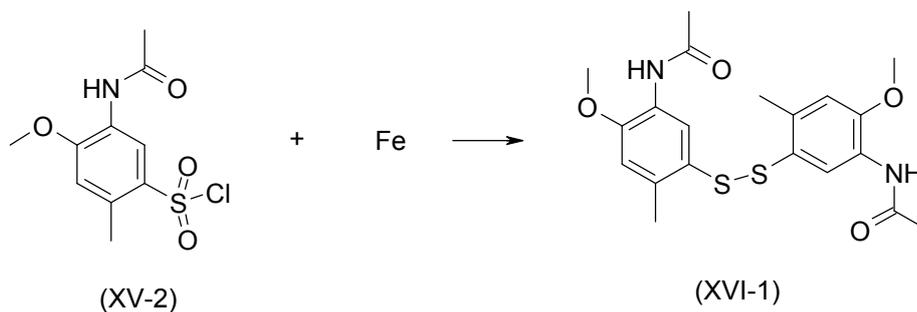
**Etapas 1:** Cloruro de 5-acetamido-4-metoxi-2-metilbencenosulfonilo



25 Poco a poco, se añaden 19,5 g (108,8 mmol) de N-(2-metoxi-4-metilfenil)acetamida [CAS-RN 89345-81-3] a 150 g (1287 mmol) de ácido clorosulfónico, y la mezcla se agita a 80 °C durante otras 4 h. Después de enfriar, la mezcla se añade a hielo-agua y el sólido obtenido se separa por filtración con succión, dando 25,4 g de producto (84,1 % del teórico, pureza 100 % de acuerdo con la RMN de  $^1\text{H}$ ).

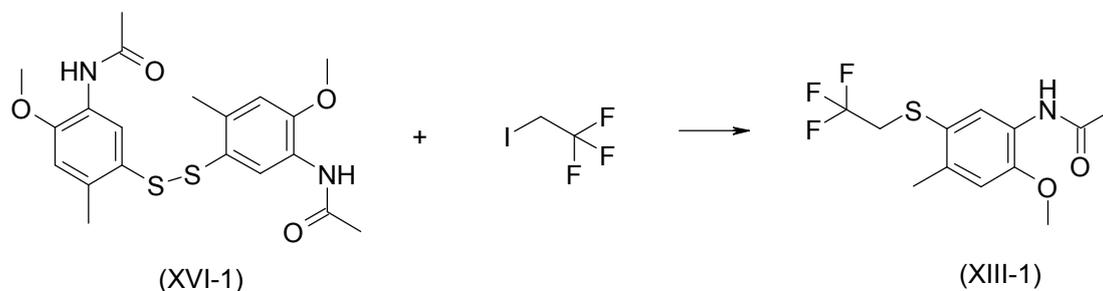
30 RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO)  $\delta$  ppm: 9,04(s,1H), 8,14(s,1H), 6,80(s,1H), 3,80(s,3H), 2,48(s,3H), 2,04(s,3H)

**Etapas 2:** N,N'-[Disulfanodilbis(6-metoxi-4-metilbenceno-3,1-diil)]diacetamida



5 Se calientan a reflujo durante 12 h 25,3 g (91,1 mmol) de cloruro de 5-acetamido-4-metoxi-2-metilbencenosulfonilo y 14,6 g (261,4 mmol) de polvo de hierro en 400 ml de etanol y 36,7 g de ácido clorhídrico concentrado. Después de eliminar el disolvente a presión reducida, el residuo se tritura con agua y se separa por filtración con succión, dando 9,4 g de producto bruto (49,1 % del teórico, pureza 86,4 % de acuerdo con la CL/EM) como un sólido pardo claro. logP(HCOOH): 2,73

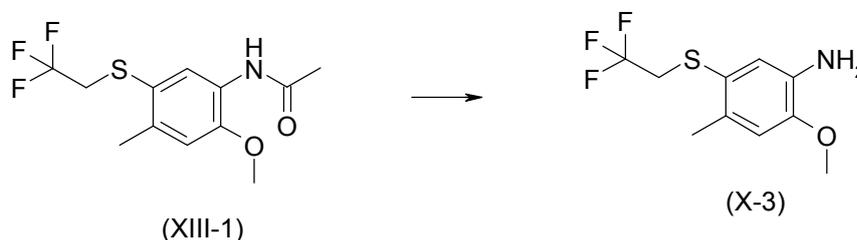
**Etapas 3:** N-{2-Metoxi-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}acetamida



10 Se cargan inicialmente en 60 ml de dimetilformamida 9,4 g (22,35 mmol) de N,N'-[disulfanodilbis(6-metoxi-4-metilbenceno-3,1-dil)]diacetamida, 6,5 g de ditionito de sodio, 15,9 g de carbonato de potasio y 5,45 g de bisfosfato de sodio y 40 ml de agua se añaden y la mezcla se agita entonces a 60 °C durante 3 h. Después de enfriar, se añaden 12,5 g (59,54 mmol) de 1,1,1-trifluoro-2-yodoetano y la mezcla se agita a 75 °C durante otras 12 h. Después de eliminar el disolvente a presión reducida, el residuo que queda se acidifica con ácido clorhídrico concentrado y el precipitado formado se separa por filtración con succión. Esto deja 5,3 g de producto (80,8 % del teórico, pureza > 95 % de acuerdo con la RMN de <sup>1</sup>H).

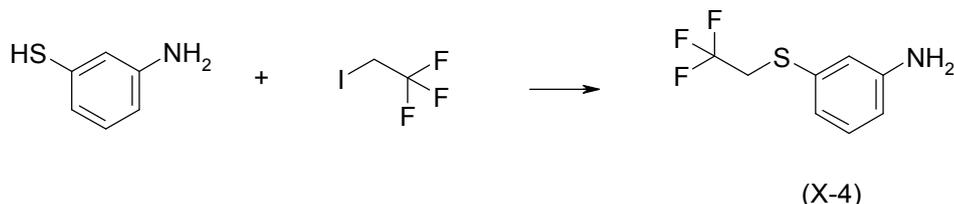
15 RMN de <sup>1</sup>H (D6-DMSO) δ ppm : 9,15(s,1H), 8,14(s,1H), 6,98(s,1H), 3,83(s,3H), 3,69-3,61(q,2H), 2,40(s,3H), 2,06(s,3H)

**Etapas 4:** 2-Metoxi-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]anilina



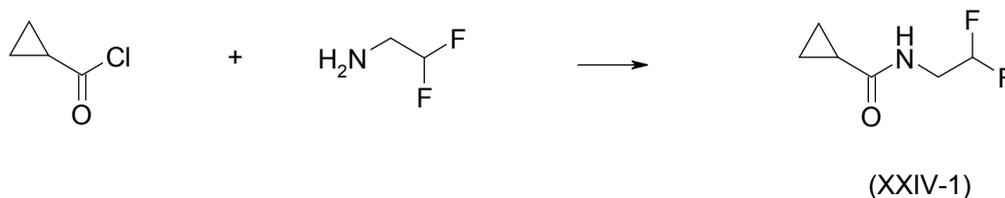
20 Se agitan a reflujo durante 18 h 5,3 g (22,35 mmol) de N-{2-metoxi-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}acetamida en 125 ml de ácido clorhídrico 5 molar. La mezcla de reacción se alcaliniza con solución acuosa de hidróxido de sodio y se extrae con diclorometano. La fase orgánica se separa, se seca sobre sulfato de sodio y se elimina el disolvente a presión reducida. Esto deja 3,6 g de producto como un aceite naranja oscuro (79,3 % del teórico, pureza 96,8 % de acuerdo con la CL/EM).

25 RMN de <sup>1</sup>H (D6-DMSO) δ ppm : 6,83(s,1H), 6,72(s,1H), 4,64(ancho, 2H), 3,75(s,3H), 3,64-3,56(q,2H), 2,30(s,3H)

**Ejemplo de preparación 9: 3-[(2,2,2-Trifluoroetil)sulfanil]anilina**

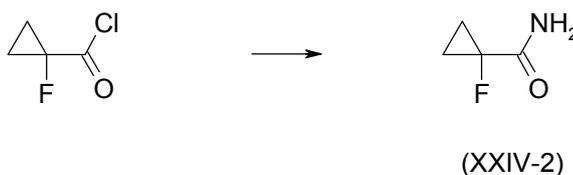
Se cargan inicialmente en 200 ml de acetonitrilo 6,5 g (51,92 mmol) de 3-aminobenzenotiol, 13,7 g de carbonato de potasio, 1,6 g de hidróxido de sodio sólido, 1 ml de dimetil sulfóxido y se añaden 13 g (61,93 mmol) de 1,1,1-trifluoro-2-yodoetano y la mezcla se agita a 45 °C durante 18 h. La mezcla de reacción se diluye con 250 ml de agua y se extrae con diclorometano. La fase orgánica se separa, se seca sobre sulfato de sodio y se elimina el disolvente a presión reducida. Esto deja 9,5 g de producto como un aceite pardo (88,3 % del teórico, pureza 97,9 % de acuerdo con la CL/EM).

RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO)  $\delta$  ppm: 7,00-6,97(m,1H), 6,61(m,1H), 6,59(m,1H), 6,47-6,45(m,1H), 5,19(ancho, 2H), 3,88-3,80(q,2H)  
logP(HCOOH): 2,01

**Ejemplo de preparación 10: N-(2,2-Difluoroetil)ciclopropanocarboxamida (XXIV-1)**

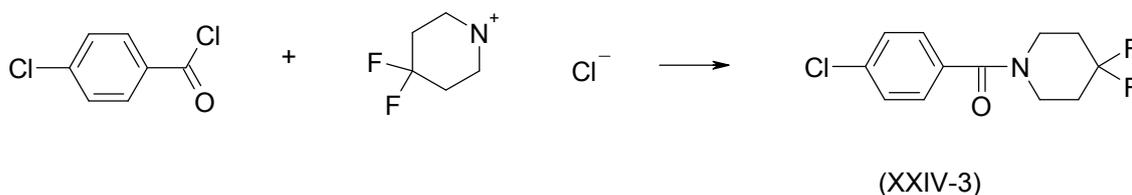
Se disuelven en 300 ml de tetrahidrofurano anhidro 14,4 g (137,75 mmol) de cloruro de ciclopropanocarboxilo. Después de la adición de 1 g de trietilamina, se añade gota a gota una solución de 16,8 g (207,24 mmol) de 2,2-difluoroetanamina en 50 ml de tetrahidrofurano anhidro. Después de finalizar la adición, la mezcla se agita a temperatura ambiente durante otras 18 h y seguidamente a 40 °C durante otra 1 h. La mezcla se diluye con 200 ml de agua y se extrae con diclorometano. Las fases orgánicas reunidas se separan, se secan sobre sulfato de sodio y se elimina el disolvente a presión reducida. Esto deja un residuo de 18,9 g de producto (92 % del teórico, pureza 100 % de acuerdo con la RMN de  $^1\text{H}$ ) como un sólido blanco.

RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO)  $\delta$  ppm: 8,46(t,1H), 5,99(tt,1H), 3,54-3,43(m,2H), 1,65-1,59(m,1H), 0,70-0,60(m,4H)

**Ejemplo de preparación 11: 1-Fluorociclopropanocarboxamida (XXIV-2)**

Poco a poco, se añaden 600 mg (4,9 mmol) de cloruro de 1-fluorociclopropanocarboxilo [CAS-RN 149961-53-5] a 15 g de hidróxido de amonio (solución concentrada al 28-30 % en peso de  $\text{NH}_3$  en agua), y la mezcla se agita a temperatura ambiente durante otras 18 h. El precipitado resultante se separa por filtración con succión, dando 470 mg de producto (93,1 % del teórico, pureza 100 % de acuerdo con la RMN de  $^1\text{H}$ ) como un sólido blanco.

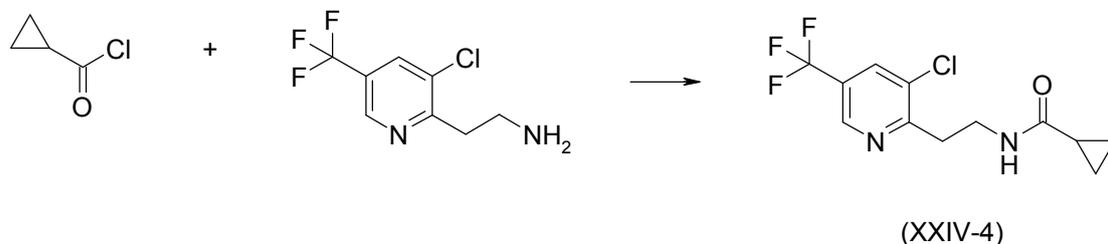
RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO)  $\delta$  ppm : 7,80(ancho, 1H), 7,58(ancho, 1H), 1,29-1,12(m,4H)

**Ejemplo de preparación 12: (4-Clorofenil)(4,4-difluoropiperidin-1-il)metanona (XXIV-3)**

Se cargan inicialmente en 35 ml de tolueno anhidro 470 mg (2,98 mmol) de cloruro de 4,4-difluoropiperidinio. Después de la adición de 1,4 g de trietilamina, se añaden poco a poco 690 mg (3,94 mmol) de cloruro de 4-

clorobenzoilo, y la mezcla se agita a 100 °C durante otras 18 h. La mezcla de reacción se diluye con 250 ml de agua y se separa la fase orgánica, se seca sobre sulfato de sodio y se elimina el disolvente a presión reducida. Esto deja 480 mg de producto como un aceite naranja (62 % del teórico, pureza 88 % de acuerdo con la CL/EM).  
RMN de <sup>1</sup>H (D6-DMSO) δ ppm : 7,54-7,49(m,4H), 3,70(m,2H), 3,39(m,2H), 2,03(m,4H)

5 **Ejemplo de preparación 13: N-{2-[3-Cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il]etil}ciclopropanocarboxamida (XXIV-4)**

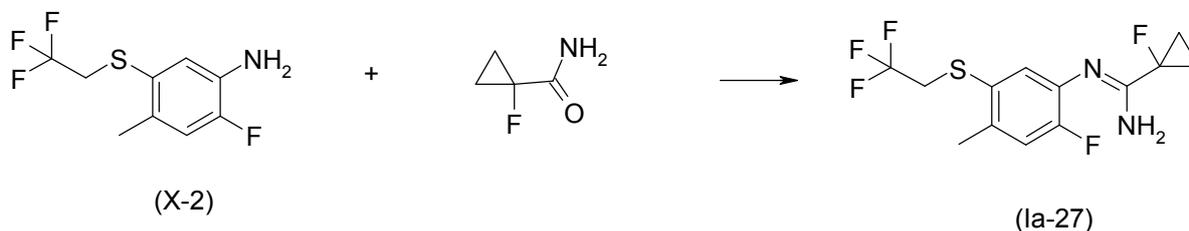


Se cargan inicialmente en 20 ml de diclorometano anhidro 550 mg (2,11 mmol) de 2-[3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il]etanamina. Después de la adición de 1 g de trietilamina, se añaden gota a gota 270 mg (2,58 mmol) de cloruro de ciclopropanocarbonilo, disueltos en 5 ml de diclorometano anhidro, y la mezcla se agita entonces a 50 °C durante otras 12 h. La mezcla de reacción se diluye con 50 ml de agua y se separa la fase orgánica, se seca sobre sulfato de magnesio y se elimina el disolvente a presión reducida. Esto da 450 mg de producto como un sólido naranja (73 % del teórico, pureza 87,1 % de acuerdo con la CL/EM).

10 RMN de <sup>1</sup>H (D6-DMSO) δ ppm : 8,89(d,1H), 8,41(d,1H), 8,17(t,1H), 3,53-3,48(m,2H), 3,11(t,2H), 1,51-1,46(m,1H), 0,63-0,59(m,4H)

15 **Ejemplo de preparación 14: 1-Fluoro-N'-(2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]fenil)ciclopropanocarboximidamida (Ib-19)**

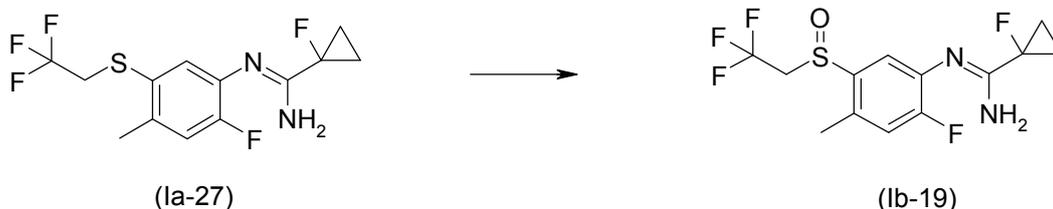
**Etapas 1:** 1-Fluoro-N'-(2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]fenil)ciclopropanocarboximidamida (Ia-27)



Se añaden 1,4 g (9,13 mmol) de cloruro de fosforilo a 400 mg (1,67 mmol) de 2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]anilina y 470 mg (4,56 mmol) de 1-fluorociclopropanocarboxamida, y la mezcla se agita a 95 °C durante 18 h. El residuo que queda después de evaporación rotatoria se agita con agua, se alcaliniza con carbonato de potasio sólido y se extrae con diclorometano. Las fases orgánicas reunidas se separan, se secan sobre sulfato de sodio y se elimina el disolvente a presión reducida. Esto deja 380 mg de producto (70,1 % del teórico, pureza 88,8 % de acuerdo con la CL/EM) como residuo.

25 logP(HCOOH): 1,2

**Etapas 2:** 1-Fluoro-N'-(2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]fenil)ciclopropanocarboximidamida (Ib-19)

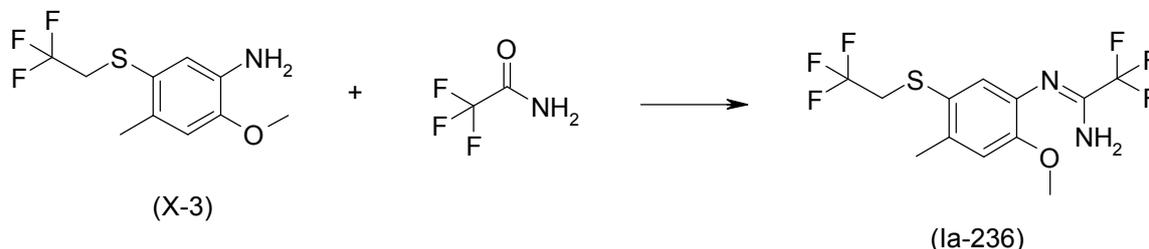


A 0-4 °C, se cargan inicialmente en 30 ml de triclorometano 310 mg (0,96 mmol) de 1-fluoro-N'-(2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]fenil)ciclopropano-carboximidamida (Ia-27). Después de la adición de 335 mg de solución tampón pH 7 (KH<sub>2</sub>PO<sub>4</sub>/Na<sub>2</sub>HPO<sub>4</sub>) y 65 mg de cloruro de benciltriethylamonio, se añaden poco a poco a 0-4 °C 230 mg (concentración 70 %, 1,03 mmol) de ácido m-cloroperbenzoico y la mezcla de reacción se agita a temperatura ambiente durante 24 h. Se añade una solución acuosa concentrada al 33 % de bisulfito de sodio, y la mezcla se extrae entonces dos veces con diclorometano. Las fases orgánicas reunidas se lavan con agua, se seca sobre sulfato de sodio y se filtra. Después de eliminar el disolvente a presión reducida, el residuo se purifica por cromatografía en columna usando MPLC sobre FI(C-18) con agua/acetronitrilo. Esto da 42 mg de producto (12,9 %

35

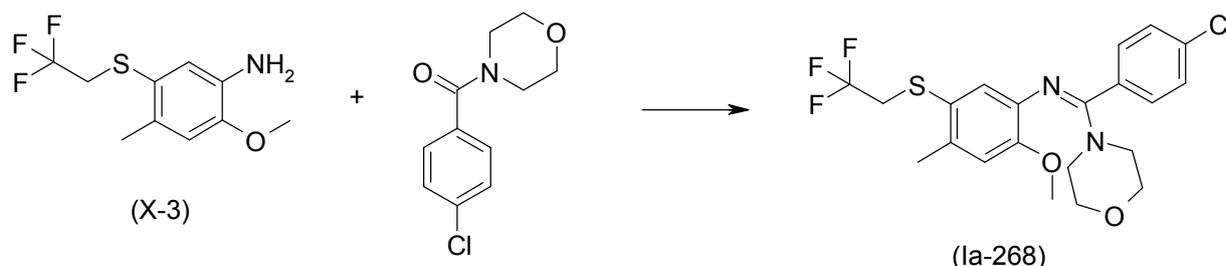
del teórico, pureza 98,1 % de acuerdo con la CL/EM).

**Ejemplo de preparación 15:** 2,2,2-Trifluoro-N'-{2-metoxi-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}etanimidamida (Ia-236)



- 5 Se añaden 2,5 g (16,3 mmol) de cloruro de fosforilo a 300 mg (1,19 mmol) de 2-metoxi-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]anilina y 400 mg (3,54 mmol) de trifluoroacetamida, y la mezcla se agita a 95 °C durante 18 h. El residuo que queda después de evaporación rotatoria se agita con agua, se alcaliniza con carbonato de potasio sólido y se extrae con diclorometano. Las fases orgánicas reunidas se separan, se secan sobre sulfato de sodio y se elimina el disolvente a presión reducida. Esto deja 61,3 mg de producto (14,1 % del teórico, pureza > 95 % de acuerdo con la RMN de <sup>1</sup>H) como residuo.
- 10

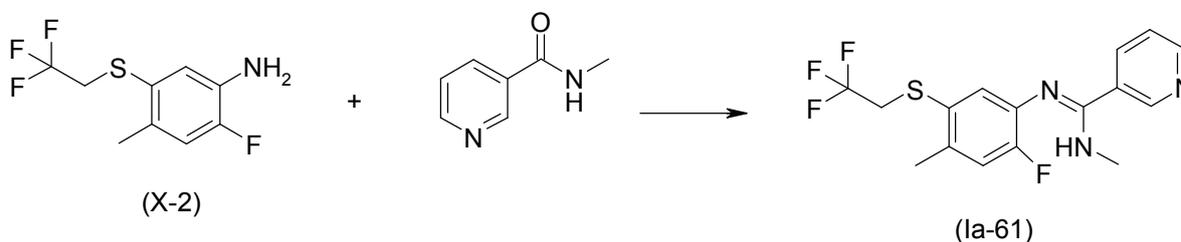
**Ejemplo de preparación 16:** N-[(4-Clorofenil)(morfolin-4-il)metilen]-2-metoxi-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]anilina (Ia-268)



- 15 Se añaden a 2,5 g (16,3 mmol) de cloruro de fosforilo 300 mg (1,19 mmol) de 2-metoxi-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]anilina y 360 mg (1,60 mmol) de (4-clorofenil)(morfolin-4-il)metanona, y la mezcla se agita a 95 °C durante 18 h. El residuo que queda después de evaporación rotatoria se agita con agua, se alcaliniza con carbonato de potasio sólido y se extrae con diclorometano. Las fases orgánicas reunidas se separan, se secan sobre sulfato de sodio y se elimina el disolvente a presión reducida. Esto deja 247 mg de producto (40,9 % del teórico, pureza 90,9 % de acuerdo con la CL/EM) como residuo.

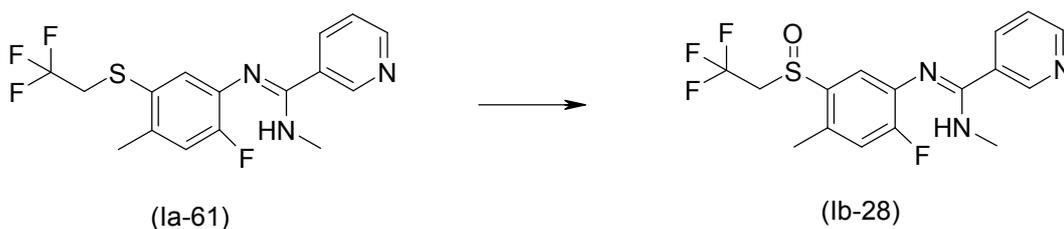
**Ejemplo de preparación 17:** N'-{2-Fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-N-metilpiridin-3-carboximidamida (Ib-28)

**Etapas 1:** N'-{2-Fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-N-metilpiridin-3-carboximidamida (Ia-61)



- 25 Se añaden 1,5 g (9,78 mmol) de cloruro de fosforilo a 400 mg (1,67 mmol) de 2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]anilina y 450 mg (3,31 mmol) de N-metilnicotinamida, y la mezcla se agita a 95 °C durante 18 h. El residuo que queda después de evaporación rotatoria se agita con agua, se alcaliniza con carbonato de potasio sólido y se extrae con diclorometano. Las fases orgánicas reunidas se separan, se secan sobre sulfato de sodio y se elimina el disolvente a presión reducida. Esto deja 550 mg de producto (92,1 % del teórico, pureza 92,9 % de acuerdo con la CL/EM) como residuo.

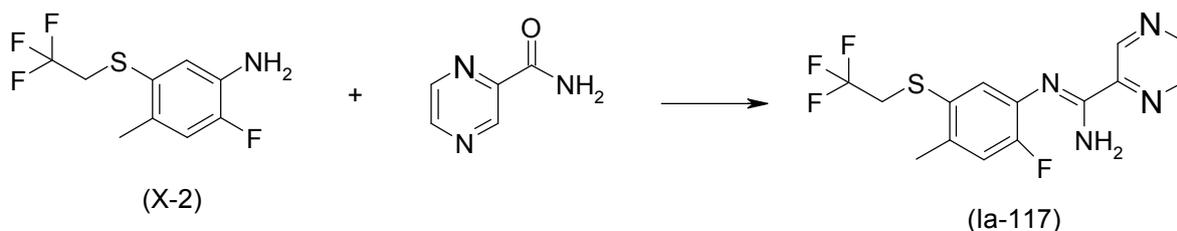
**Etapas 2:** N'-{2-Fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-N-metilpiridin-3-carboximidamida (Ib-28)



A 0-4 °C, se cargan inicialmente en 40 ml de triclorometano 460 mg (1,29 mmol) de N'-(2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanyl]fenil)-N-metilpiridin-3-carboximidamida (Ia-61). Después de la adición de 460 mg de solución tampón pH 7 (KH<sub>2</sub>PO<sub>4</sub>/Na<sub>2</sub>HPO<sub>4</sub>) y 90 mg de cloruro de benciltrietilamonio, se añaden poco a poco a 0-4 °C 320 mg (70 %, 0,261 mmol) de ácido m-cloroperbenzoico y la mezcla de reacción se agita a temperatura ambiente durante 24 h. Se añade una solución acuosa concentrada al 33 % de bisulfito de sodio, y la mezcla se extrae seguidamente dos veces con diclorometano. Las fases orgánicas reunidas se lavan con agua, se seca sobre sulfato de sodio y se filtra. Después de eliminar el disolvente a presión reducida, el residuo se purifica por cromatografía en columna usando MPLC sobre FI(C-18) con agua/acetónitrilo. Esto da 145 mg de producto (30,2 % del teórico, pureza 98,7 % de acuerdo con la HPLC).

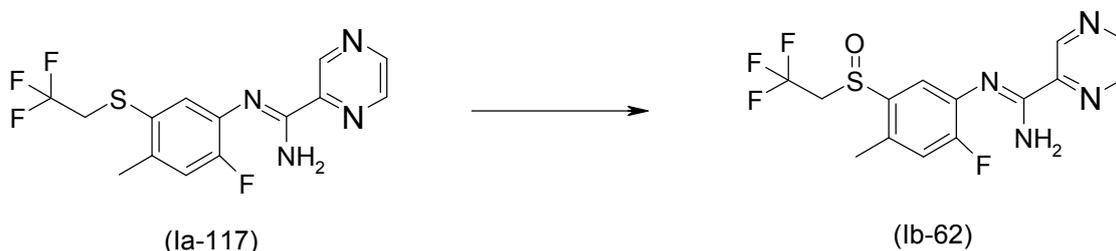
**Ejemplo de preparación 18: N'-(2-Fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]fenil)pirazin-2-carboximidamida (Ib-62)**

**Etap 1:** N'-(2-Fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanyl]fenil)pirazin-2-carboximidamida (Ia-117)



Se añaden 2 g (13,04 mmol) de cloruro de fosforilo a 300 mg (1,25 mmol) de 2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanyl]anilina y 190 mg (1,54 mmol) de pirazincarboxamida, y la mezcla se agita a 95 °C durante 18 h. El residuo que queda después de evaporación rotatoria se agita con agua, se alcaliniza con carbonato de potasio sólido y se extrae con diclorometano. Las fases orgánicas reunidas se separan, se secan sobre sulfato de sodio y se elimina el disolvente a presión reducida. Esto deja 365 mg de producto (84,5 % del teórico, pureza 91,2 % de acuerdo con la CL/EM) como residuo.  
logP(HCOOH): 1,24

**Etap 2:** N'-(2-Fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]fenil)pirazin-2-carboximidamida (Ib-62)



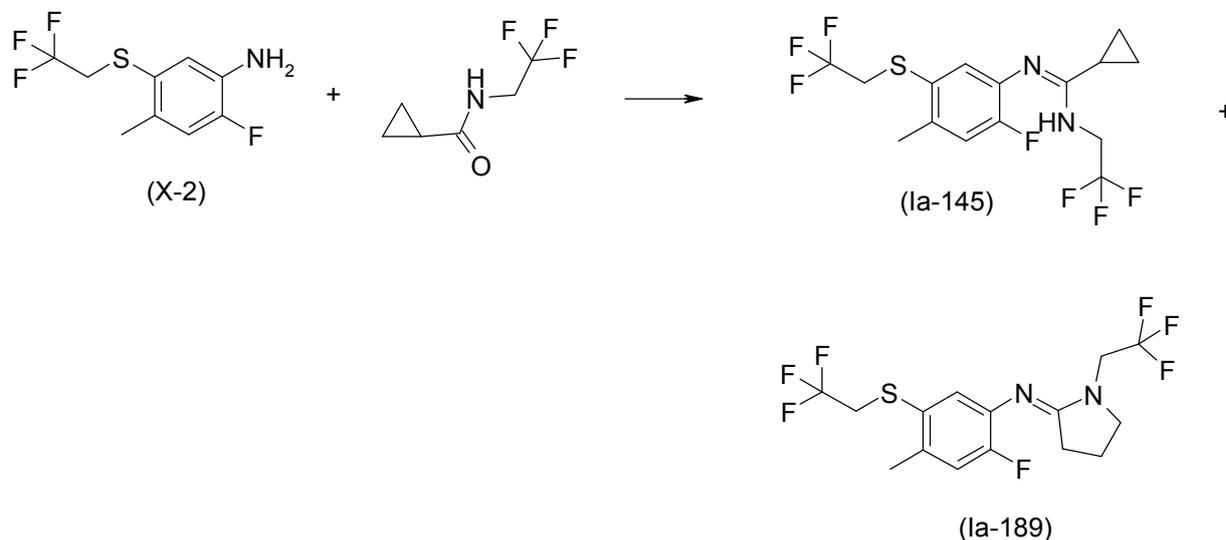
A 0-4 °C, se cargan inicialmente en 30 ml de triclorometano 305 mg (0,89 mmol) de N'-(2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanyl]fenil)pirazin-2-carboximidamida (Ia-117). Después de la adición de 320 mg de solución tampón pH 7 (KH<sub>2</sub>PO<sub>4</sub>/Na<sub>2</sub>HPO<sub>4</sub>) y 60 mg de cloruro de benciltrietilamonio, se añaden poco a poco a 0-4 °C 225 mg (70 %, 1,04 mmol) de ácido m-cloroperbenzoico y la mezcla de reacción se agita a temperatura ambiente durante 24 h. Se añade una solución acuosa concentrada al 33 % de bisulfito de sodio, y la mezcla se extrae seguidamente dos veces con diclorometano. Las fases orgánicas reunidas se lavan con agua, se seca sobre sulfato de sodio y se filtra. Después de eliminar el disolvente a presión reducida, el residuo se adsorbe sobre material de FI(C-18). La purificación por cromatografía en columna usando MPLC sobre FI(C-18) con agua/acetónitrilo da 55 mg (17,2 % del teórico, pureza 100 % de acuerdo con la CL/EM) de producto como un sólido beige claro.

logP(HCOOH): 0,84 logP(neutro): 1,77

**Ejemplo de preparación 19: 2-Fluoro-4-metil-N-[1-(2,2,2-trifluoroetil)pirrolidin-2-iliden]-5-[(2,2,2-**

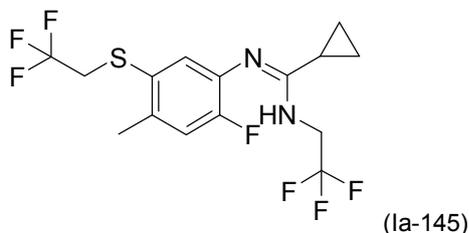
**trifluoroetil)sulfinil]anilina (Ib-115)**

**Etapa 1:** N'-{2-Fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]fenil}-N-(2,2,2 trifluoroetil)ciclopropanocarboximidamida (Ia-145) y 2-fluoro-4-metil-N-[1-(2,2,2-trifluoroetil)pirrolidin-2-iliden]-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]anilina (Ia-189)

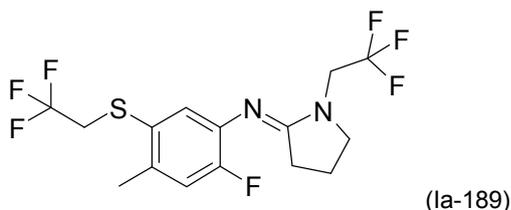


- 5 Se añaden 1,5 g (9,78 mmol) de cloruro de fosforilo a 300 mg (1,25 mmol) de 2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]anilina y 430 mg (2,57 mmol) de N-(2,2,2-trifluoroetil)ciclopropanocarboxamida, y la mezcla se agita a 95 °C durante 18 h. El residuo que queda después de evaporación rotatoria se agita con agua, se alcaliniza con carbonato de potasio sólido y se extrae con diclorometano. Las fases orgánicas reunidas se separan, se secan sobre sulfato de sodio y se elimina el disolvente a presión reducida. Esto deja 630 mg de producto bruto como una mezcla aproximadamente 3:1 de los isómeros descritos antes como residuo.
- 10

La purificación por cromatografía en columna usando MPLC sobre FI(C-18) con agua/acetonitrilo da 239,8 mg (49,2 % del teórico, pureza 80 % de acuerdo con la RMN de  $^1\text{H}$ ) de N'-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]fenil}-N-(2,2,2 trifluoroetil)ciclopropanocarboximidamida (Ia-145)

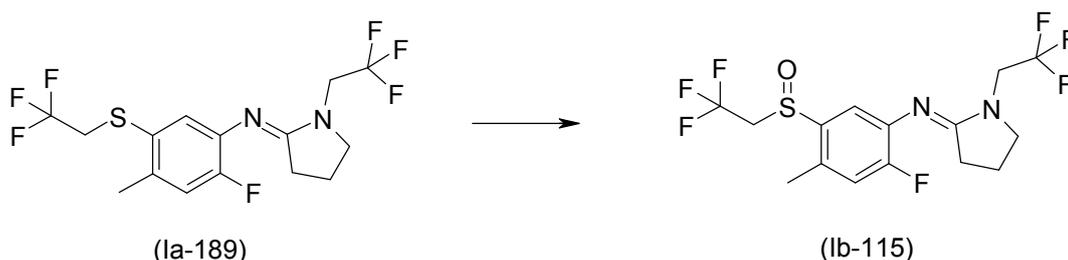


- 15 RMN de  $^{13}\text{C}$  (D6-DMSO)  $\delta$  ppm: 161,0, 153,5, 137,0, 133,9, 128,1, 127,2, 117,5, 41,0, 35,6, 19,6, 11,6, 6,2  
logP(HCOOH): 1,99 logP(neutro): 4,12  
y 72,4 mg (14,9 % del teórico, pureza 100 % de acuerdo con la HPLC) de 2-fluoro-4-metil-N-[1-(2,2,2-trifluoroetil)pirrolidin-2-iliden]-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]anilina (Ia-189).



- 20 RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO)  $\delta$  ppm: 7,09-7,01(m,2H), 4,28-4,21(q,2H), 3,89-3,81(q,2H), 3,51-3,47(t,2H), 2,36-2,30(t,2H), 2,32(s,3H), 1,98-1,90(m,2H).  
logP(HCOOH): 2,32 logP(neutro): 4,37

**Etapa 2:** 2-Fluoro-4-metil-N-[1-(2,2,2-trifluoroetil)pirrolidin-2-iliden]-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]anilina (Ib-115)

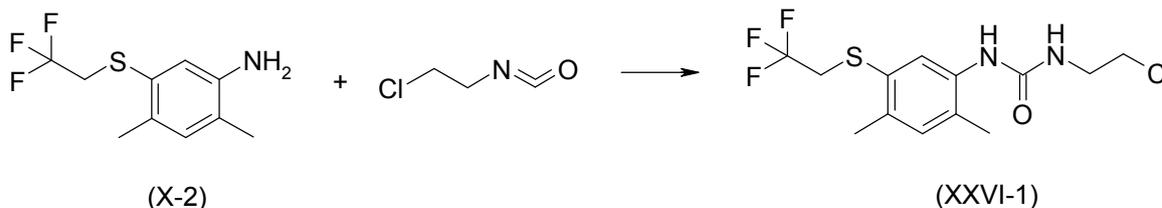


A 0-4 °C, se cargan inicialmente en 40 ml de triclorometano 900 mg (2,32 mmol) de 2-fluoro-4-metil-N-[1-(2,2,2-trifluoroetil)pirrolidin-2-iliden]-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]anilina (Ia-189). Después de la adición de 850 mg de solución tampón pH 7 (KH<sub>2</sub>PO<sub>4</sub>/Na<sub>2</sub>HPO<sub>4</sub>) y 160 mg de cloruro de benciltrietilamonio, se añaden poco a poco a 0-4 °C 600 mg (77 %, 2,68 mmol) de ácido m-cloroperbenzoico y la mezcla de reacción se agita a temperatura ambiente durante 24 h. Se añade una solución acuosa concentrada al 33 % de bisulfito de sodio, y la mezcla se extrae seguidamente dos veces con diclorometano. Las fases orgánicas reunidas se lavan con agua, se seca sobre sulfato de sodio y se filtra. Después de eliminar el disolvente a presión reducida, el residuo se purifica por cromatografía en columna usando MPLC sobre FI(C-18) con agua/acetonitrilo. Esto da 70 mg de producto (7,5 % del teórico, pureza 95,2 % de acuerdo con la CL/EM).

RMN de <sup>13</sup>C (D6-DMSO) δ ppm: 164,2, 155,6, 138,3, 136,0, 129,8, 125,1, 124,2, 119,9, 117,9, 56,8, 49,5, 44,4, 27,0, 19,5, 16,4

#### Ejemplo de preparación 20: 2,4-Dimetil-N-[1,3-oxazolidin-2-iliden]-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]anilina

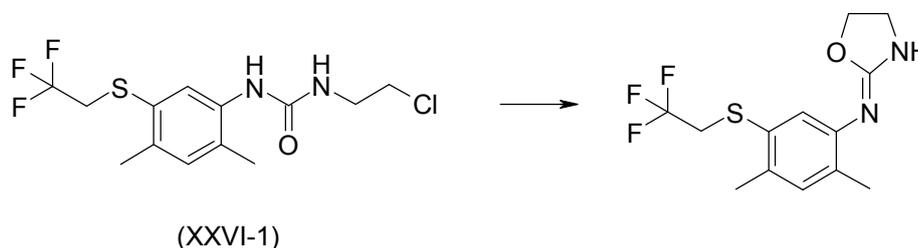
##### Etapas 1: 1-(2-Cloroetil)-3-{2,4-dimetil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}urea



Poco a poco, se añaden 1,45 g (6,16 mmol) de 2,4-dimetil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]anilina a una solución de 700 mg (6,63 mmol) de 2-cloroetilisocianato en 50 ml de éter terc-butil metílico y una cantidad catalítica de 1,8-diazabicyclo[5,4,0]undec-7-eno (DBU) y, a continuación, se agita a temperatura ambiente durante otras 18 h. A presión reducida, se elimina de la mezcla casi todo el disolvente, y el sólido blanco resultante se separa por filtración con succión. Esto deja 2,00 g de producto (88,5 % del teórico, pureza 94,4 % de acuerdo con la CL/EM).

RMN de <sup>1</sup>H (D6-DMSO) δ ppm: 8,01(s,1H), 7,83(s,1H), 7,04(s,1H), 6,83(t,1H), 3,77-3,69(q,2H), 3,68-3,65(m,2H), 3,45-3,40(m,2H), 2,30(s,3H), 2,14(s,3H).

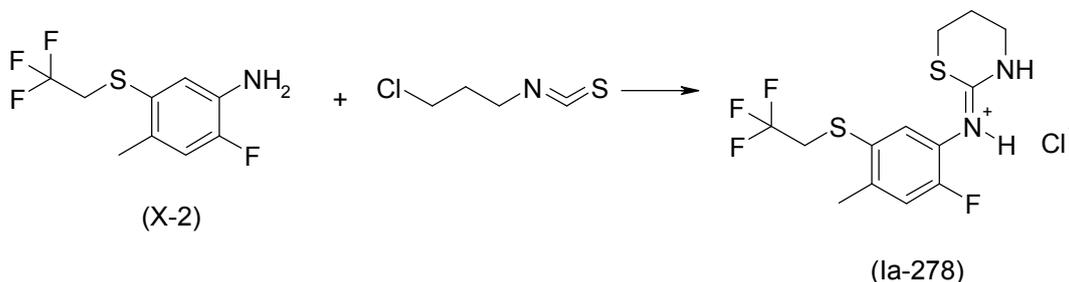
##### Etapas 2: 2,4-Dimetil-N-[1,3-oxazolidin-2-iliden]-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]anilina



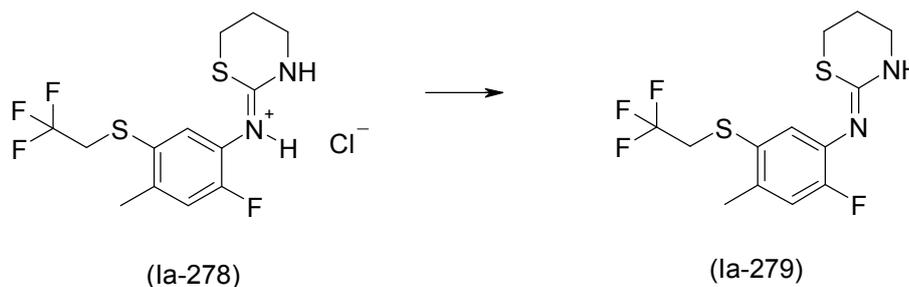
Se calientan a reflujo durante 18 h 900 mg (2,64 mmol) de 1-(2-cloroetil)-3-{2,4-dimetil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}urea en una mezcla de 15 ml de agua y 20 ml de propionitrilo con 4 g de carbonato de potasio. A presión reducida, se elimina el disolvente de la mezcla y la suspensión de sólidos que queda se acidifica con ácido clorhídrico diluido. La mezcla se deja reposar entonces durante 18 h, y el precipitado beige se separa por filtración con succión. Esto da 560 mg de producto bruto. La purificación por cromatografía en columna usando una Biotage Isolera One y acetato 1de etilo / ciclohexano 2:1 v/v como fase móvil da 130 mg de producto (16,2 % del teórico, pureza de acuerdo con la CL/EM 81,5 %).

logP(HCOOH): 1,36

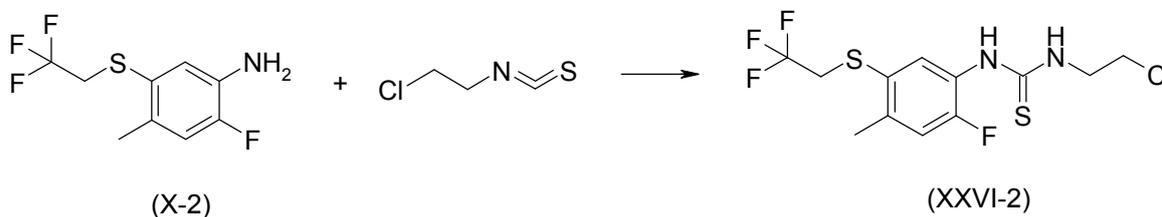
#### Ejemplo de preparación 21: 2-Fluoro-4-metil-N-[1,3-tiazinan-2-iliden]-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]anilina (Ia-279)

**Etapas 1:** Cloruro de 2-fluoro-4-metil-N-[(1,3-tiazinan-2-iliden]-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]anilinium (Ia-278)

Poco a poco, se añaden 1,61 g (6,72 mmol) de 2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]anilina a una solución de 1 g (7,37 mmol) de 3-cloropropilisocianato en 30 ml de éter terc-butil metílico y una cantidad catalítica de 1,8-diazabicyclo[5,4,0]undec-7-eno (DBU) y seguidamente se agita a temperatura ambiente durante otras 18 h. A presión reducida, se elimina el disolvente de la mezcla. El residuo que queda es un aceite beige claro que cristaliza lentamente. Esto deja 2,3 g de producto (91,3 % del teórico, pureza 95 % de acuerdo con la CL/EM).  
 RMN de <sup>13</sup>C (D6-DMSO) δ ppm: 166,0 (ancho), 156,1, 142,1, 131,7, 129,4, 126,1, 120,6, 118,6, 41,3, 34,9, 26,6, 20,6  
 logP(HCOOH): 1,34

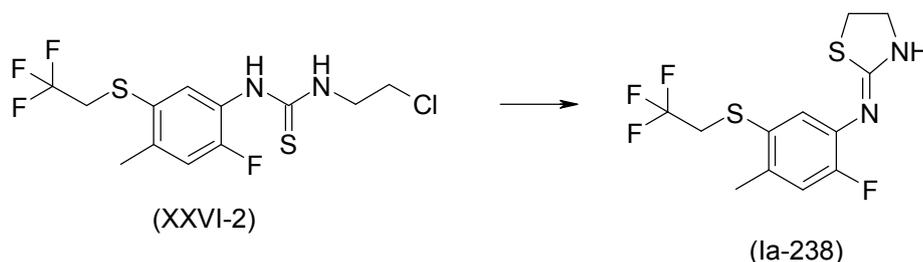
**Etapas 2:** 2-Fluoro-4-metil-N-[1,3-tiazinan-2-iliden]-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]anilina (Ia-279)

Se disuelven 2,2 g (5,87 mmol) de cloruro de 2-fluoro-4-metil-N-[1,3-tiazinan-2-iliden]-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]anilino (Ia-278) en 50 ml de agua y se alcaliniza con hidróxido de amonio (solución al 28-30 % de NH<sub>3</sub> en agua). La mezcla se extrae repetidamente con diclorometano. Las fases orgánicas reunidas se separan, se secan sobre sulfato de sodio y se elimina el disolvente a presión reducida. Esto deja un residuo de 1,56 g de producto (68,3 % del teórico, pureza 100 % de acuerdo con la RMN de <sup>1</sup>H) como cristales color ámbar brillante.

**Ejemplo de preparación 22: 2-Fluoro-4-metil-N-[1,3-tiazolidin-2-iliden]-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]anilina****Etapas 1:** 1-(2-Cloroetil)-3-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}tiourea

Poco a poco, se añaden 1,9 g (7,94 mmol) de 2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]anilina a una solución de 1 g (8,22 mmol) de isocianato de 2-cloroetilo en 50 ml de éter terc-butil metílico y una cantidad catalítica de 1,8-diazabicyclo[5,4,0]undec-7-eno (DBU) y seguidamente se agita a temperatura ambiente durante otras 18 h. A presión reducida, se elimina de la mezcla casi todo el disolvente, y el sólido blanco resultante se separa por filtración con succión. Esto deja 2,88 g de producto (97,1 % del teórico, pureza 100 % de acuerdo con la RMN de <sup>1</sup>H).  
 RMN de <sup>1</sup>H (D6-DMSO) δ ppm: 7,68-7,67(m,1H), 7,43-7,40(m,1H), 4,03-3,93(m,4H), 3,61(t,2H), 2,41(s,3H).

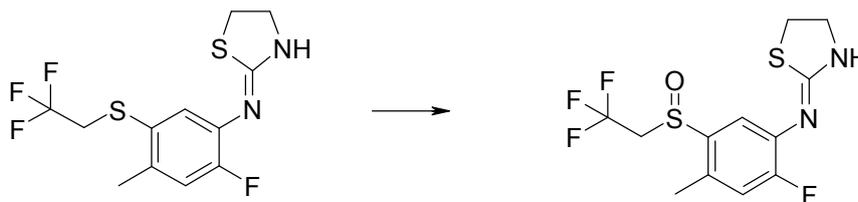
**Etapas 2:** 2-Fluoro-4-metil-N-[1,3-tiazolidin-2-iliden]-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]anilina (Ia-238)



Se calientan a reflujo durante 48 h 2,75 g (7,62 mmol) de 1-(2-cloroetil)-3-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}urea en una mezcla de 3 ml de agua y 100 ml de propionitrilo con 2 g de carbonato de potasio, 3,5 g de carbonato de cesio, 0,1 g de hidróxido de sodio y 0,1 g de yoduro de potasio. A presión reducida, se elimina el disolvente de la mezcla y la suspensión de sólidos que queda se neutraliza con ácido clorhídrico diluido. La mezcla se extrae repetidamente con diclorometano. Las fases orgánicas reunidas se separan, se secan sobre sulfato de magnesio y se elimina el disolvente a presión reducida. Esto da 2,38 g de un aceite pardo como un producto bruto. La purificación por cromatografía en columna usando una Biotage Isolera One usando un cartucho de 50 g Snap y acetato de etilo / ciclohexano 1:1 v/v como fase móvil da 590 mg de producto (23,9 % del teórico, pureza de acuerdo con la CL/EM 92,9 %).

RMN de  $^{13}\text{C}$  (D6-DMSO)  $\delta$  ppm: 163,3, 153,7, 134,8, 126,9(ancho), 126,9, 126,0, 117,0, 45,0(ancho), 35,5, 29,8, 19,4

**Etapas 3:** 2-Fluoro-4-metil-N-[1,3-tiazolidin-2-iliden]-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]anilina

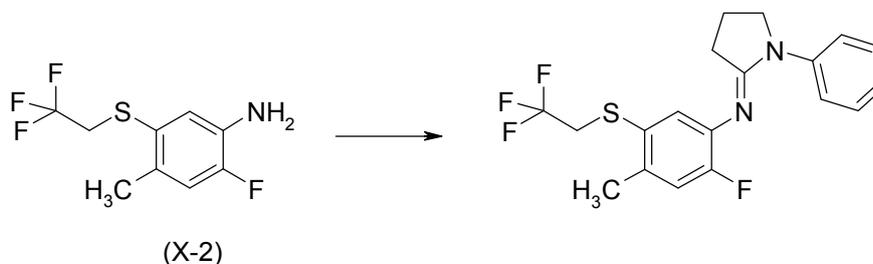


A 0-4 °C, se cargan inicialmente en 10 ml de triclorometano 99 mg (0,305 mmol) de 2-fluoro-4-metil-N-[1,3-tiazolidin-2-iliden]-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]anilina (Ia-238). Después de la adición de 120 mg de solución tampón pH 7 ( $\text{KH}_2\text{PO}_4/\text{Na}_2\text{HPO}_4$ ) y 20 mg de cloruro de benciltriethylamonio, se añaden poco a poco a 0-4 °C 80 mg (70 %, 0,357 mmol) de ácido m-cloroperbenzoico y la mezcla de reacción se agita a temperatura ambiente durante 24 h. Se añade una solución acuosa concentrada al 33 % de bisulfito de sodio, y la mezcla se extrae seguidamente dos veces con diclorometano. Las fases orgánicas reunidas se lavan con agua, se seca sobre sulfato de sodio y se filtra. Después de eliminar el disolvente a presión reducida, el residuo se purifica por cromatografía en columna usando MPLC sobre FI(C-18) con agua/acetonitrilo. Esto da 15 mg de producto (14,4 % del teórico, pureza 100 % de acuerdo con la CL/EM).

RMN de  $^{13}\text{C}$  (D6-DMSO)  $\delta$  ppm: 165,3, 157,5, 137,2, 131,5, 125,6, 120,6, 119,5, 58,5, 46,4, 31,3  
logP(HCOOH): 0,80

**Ejemplo de preparación 23:** 2-Fluoro-4-metil-N-[(2E)-1-fenilpirrolidin-2-iliden]-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]anilina (Ib-55)

**Etapas 1:** 2-Fluoro-4-metil-N-[(2E)-1-fenilpirrolidin-2-iliden]-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]anilina

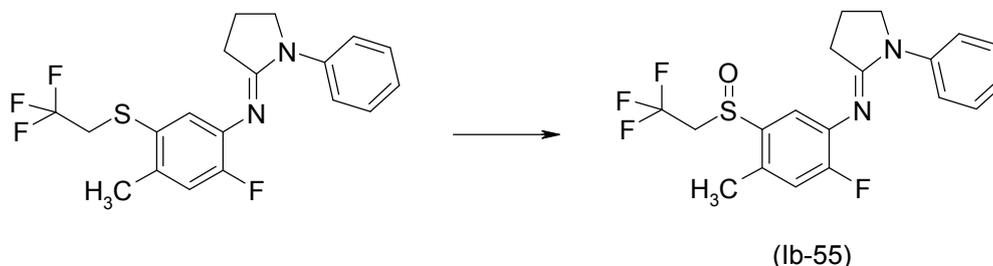


Se cargan inicialmente 150 mg (0,63 mmol) de 2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]anilina y 202 mg (1,25 mmol) de N-fenil-2-pirrolidona. Se añaden lentamente gota a gota 0,29 ml (3,14 mmol) de cloruro de fosforilo y la mezcla de reacción se agita a 100 °C durante 2 h. Después de enfriar, la mezcla se vierte en hielo-agua, se ajusta el pH a 8-9 usando solución acuosa de hidróxido de sodio y la mezcla se extrae tres veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas reunidas se lavan con solución saturada de cloruro de sodio, se seca sobre sulfato de sodio, se filtra

y se concentra. El residuo se recoge en acetonitrilo, se adsorbe sobre RP(C-18) y se purifica por MPLC sobre FI(C-18) usando agua/acetonitrilo. Se aíslan dos fracciones: 89 mg (98 % de pureza, 37 % del teórico) y 65 mg (98 % de pureza, 27 % del teórico) del compuesto del epígrafe.

5 logP(HCOOH): 1,83; logP(neutro): 4,92; RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO, 400 MHz)  $\delta$  ppm 7,85(d,2H), 7,36(dd,2H), 7,12-7,09(m,3H), 3,92-3,84(m,4H), 2H bajo el pico de DMSO, 2,33(s,3H), 2,05-1,97(m,2H)

**Etapa 2:** 2-Fluoro-4-metil-N-[(2E)-1-fenilpirrolidin-2-iliden]-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]anilina (Ib-55)

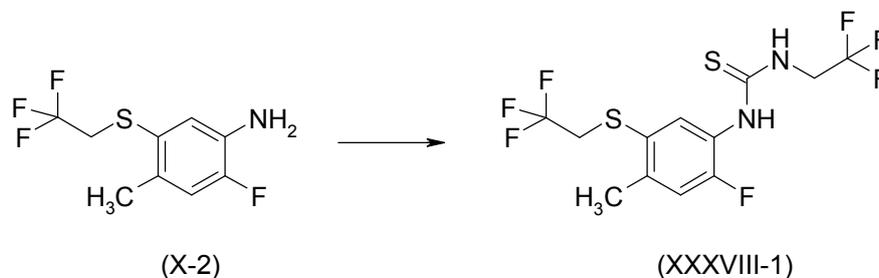


10 A 0-4 °C, se cargan inicialmente en 3 ml de diclorometano 89 g (0,23 mmol) de 2-fluoro-4-metil-N-[(2E)-1-fenilpirrolidin-2-iliden]-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]anilina, se añaden 69 mg (0,28 mmol) de ácido *meta*-cloroperbenzoico (70 %) y la mezcla de reacción se agita a temperatura ambiente durante otras 2 h. Se añade entonces una solución concentrada al 33 % de tiosulfato de sodio (se lleva a cabo la prueba de peróxido) y solución saturada de bicarbonato de sodio, y la mezcla se extrae dos veces con diclorometano. Las fases orgánicas reunidas se lavan con una solución saturada de carbonato de sodio, se seca sobre sulfato de sodio y se filtra, y el disolvente se elimina a presión reducida. El residuo comprende 98 mg (94 % de pureza, 99 % del teórico) del compuesto del epígrafe como un aceite pardo.

15 logP(HCOOH): 1,27; logP(neutro): 3,47; RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO, 400 MHz)  $\delta$  ppm 7,86(d,2H), 7,37(m,3H), 7,22(d,1H), 7,09(dd,1H), 4,14-4,02(m,2H), 3,73(dd,2H), 2,67-2,57(m,2H), 2,33(s,3H), 2,07-1,99(m,2H)

**Ejemplo de preparación 24:** 2-[(2-Fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]fenil)imino]-3-(2,2,2-trifluoroetil)-1,3-tiazolidin-4-ona (Ib-71)

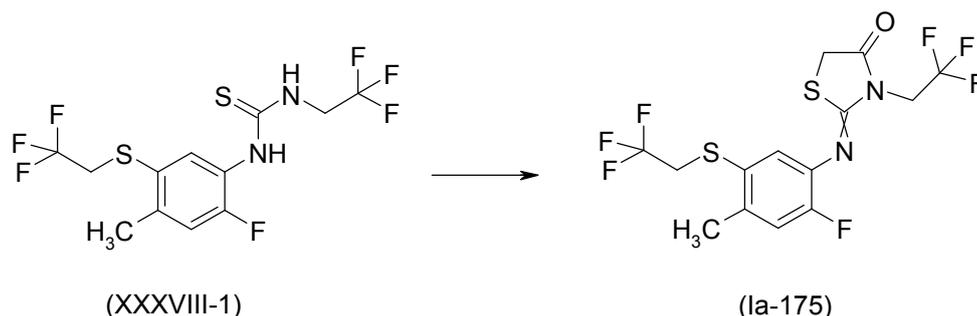
**Etapa 1.a:** 1-[(2-Fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]fenil)-3-(2,2,2-trifluoroetil)tiourea conocida por el documento JP 2011-42611 (Ejemplo 250)



Se carga inicialmente en 5 ml de diclorometano 1,00 g (4,18 mmol) de 2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]anilina y se añaden 0,006 ml (0,042 mmol) de trietilamina. Después de la adición de 0,59 g (4,18 mmol) de 1,1,1-trifluoro-2-isotiocianatoetano, la mezcla de reacción se agita a temperatura ambiente durante una noche. El disolvente se elimina a presión reducida, el residuo se tritura con un poco de tolueno y la fracción insoluble se separa por filtración con succión y se seca. Esto da 0,31 g (100 % de pureza, 20 % del teórico) del compuesto del epígrafe como un sólido blanco. A presión reducida, se elimina el disolvente del filtrado. El residuo de 1,30 g comprende el compuesto del epígrafe en una pureza del 77 %.

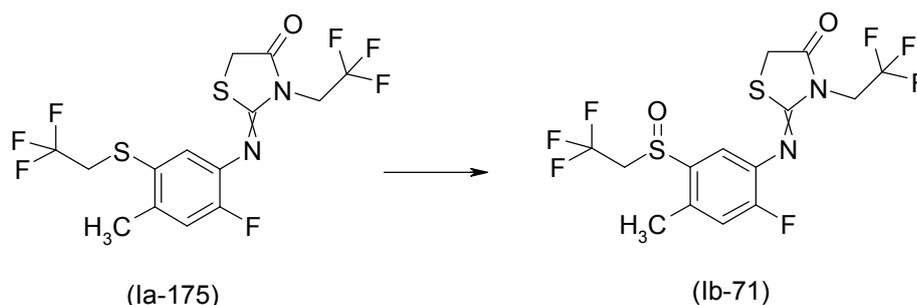
logP(HCOOH): 3,32; logP(neutro): 3,24; RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO, 400 MHz)  $\delta$  ppm 9,62 (s ancho,1H), 8,34 (s ancho,1H), 7,76(d,1H), 7,26(d,1H), 4,46-4,40(m,2H), 3,87(q,2H), 2,38(s,3H)

**Etapa 2.a:** 2-[(2-Fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]fenil)imino]-3-(2,2,2-trifluoroetil)-1,3-tiazolidin-4-ona (Ia-175)



Se cargan inicialmente en 2 ml de tolueno 75 mg (97 % de pureza, 0,19 mmol) de 1-{{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-3-(2,2,2-trifluoroetil)tiourea y 27 mg (0,19 mmol) de ácido bromoacético, y la mezcla se agita a reflujo durante 6 h. Después de enfriar, se añade una solución saturada de cloruro de sodio a la mezcla de reacción y se separa la fase orgánica, se seca sobre sulfato de sodio y se elimina el disolvente a presión reducida. El residuo se aplica a material de FI(C-18) y se purifica por medio de MPLC sobre FI(C-18) usando agua/acetonitrilo. Se aíslan 18 mg (100 % de pureza, 23 % del teórico) del compuesto del epígrafe como un sólido blanco. logP(HCOOH): 4,09; logP(neutro): 3,99; RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO, 400 MHz)  $\delta$  ppm 7,27(d,1H), 7,21(d,1H), 4,58(q,2H), 4,24(s,2H), 3,87(q,2H), 2,39(s,3H)

**Etapa 3.a:** 2-{{2-Fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}imino)-3-(2,2,2-trifluoroetil)-1,3-tiazolidin-4-ona (Ib-71)

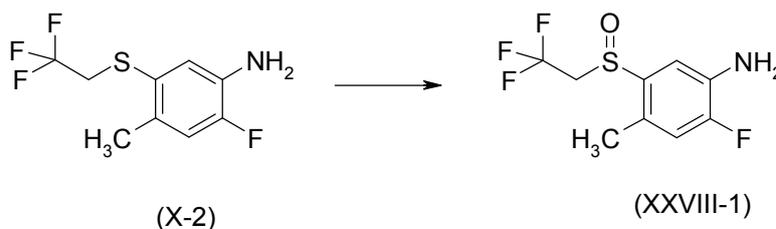


A 0-4 °C, se cargan inicialmente en 3 ml de diclorometano 136 g (0,32 mmol) de 2-{{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}imino)-3-(2,2,2-trifluoroetil)-1,3-tiazolidin-4-ona, se añaden 84 mg (0,32 mmol) de ácido *meta*-cloroperbenzoico (70 %) y la mezcla de reacción se agita a temperatura ambiente durante otras 2 h. Se añade entonces una solución concentrada al 33 % de tiosulfato de sodio (se lleva a cabo la prueba de peróxido) y solución saturada de bicarbonato de sodio, y la mezcla se extrae dos veces con diclorometano. Las fases orgánicas reunidas se lavan con una solución saturada de carbonato de sodio, se seca sobre sulfato de sodio y se filtra, y el disolvente se elimina a presión reducida. El residuo comprende 136 mg (100 % de pureza, 96 % del teórico) del compuesto del epígrafe como un aceite levemente coloreado que, con el tiempo, cristaliza dando un sólido blanco.

logP(HCOOH): 2,93; logP(neutro): 2,87; RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO, 400 MHz)  $\delta$  ppm 7,51(d,1H), 7,38(d,1H), 4,62-4,57(m,2H), 4,26-4,14(m,3H), 4,04-3,94(m,1H), 2,36(s,3H)

De forma alternativa, se puede llevar a cabo la síntesis como sigue:

**Etapa 1.b:** 2-Fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]anilina

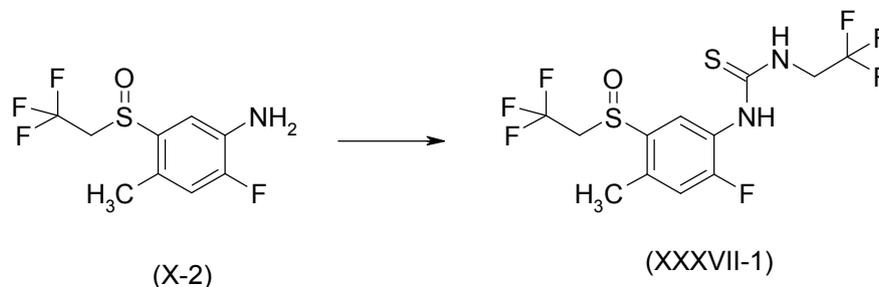


A 0-4 °C, se cargan inicialmente en 100 ml de diclorometano 5,00 g (0,21 mmol) de 2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]anilina, se añaden 6,18 g (0,25 mmol) de ácido *meta*-cloroperbenzoico y la mezcla de reacción se agita a temperatura ambiente durante 2 h. Se añade entonces una solución concentrada al 33 % de tiosulfato de sodio (se lleva a cabo la prueba de peróxido) y la mezcla se extrae dos veces con diclorometano. Las fases orgánicas reunidas se lavan con una solución saturada de carbonato de sodio, se seca sobre sulfato de sodio y se

filtra, y el disolvente se elimina a presión reducida. El residuo comprende 5,10 g (90 % de pureza, 86 % del teórico) del compuesto del epígrafe como un aceite pardo.

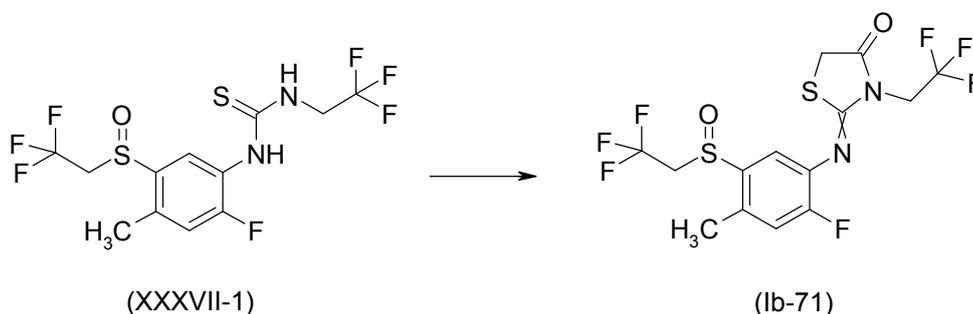
logP(HCOOH): 1,77; logP(neutro): 1,72; RMN de <sup>1</sup>H (D6-DMSO, 400 MHz) δ ppm 7,26(d,1H), 7,02(d,1H), 5,45 (s ancho,2H), 4,08-3,95(m,1H), 3,88-3,75(m,1H), 2,19(s,3H)

5 **Etapa 2.b:** 1-{2-Fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfonil]fenil}-3-(2,2,2-trifluoroetil)tiourea



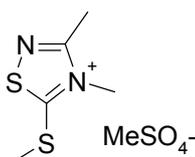
10 Se cargan inicialmente en 5 ml de diclorometano 1,00 g (3,53 mmol) de 2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfonil]anilina (90 % de pureza), y se añaden 0,005 ml (0,035 mmol) de trietilamina. Después de la adición de 0,50 g (3,53 mmol) de 1,1,1-trifluoro-2-isotiocianatoetano, la mezcla de reacción se agita a temperatura ambiente durante una noche. La fracción insoluble se separa por filtración con succión y se seca. Esto da 0,60 g (100 % de pureza, 43 % del teórico) del compuesto del epígrafe como un sólido blanco. A presión reducida, se elimina el disolvente del filtrado. El residuo de 0,81 g comprende el compuesto del epígrafe en una pureza del 54 %.

15 **Etapa 3.c:** 2-({2-Fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfonil]fenil}imino)-3-(2,2,2-trifluoroetil)-1,3-tiazolidin-4-ona (Ib-71)



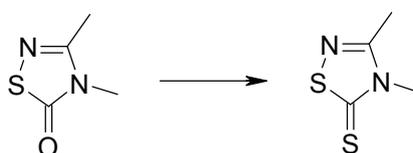
20 Se cargan inicialmente en 2 ml de tolueno 200 mg (0,51 mmol) de 1-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfonil]fenil}-3-(2,2,2-trifluoroetil)tiourea y 70 mg (0,51 mmol) de ácido bromoacético, y la mezcla se agita a reflujo durante 6 h. Se añade a la mezcla de reacción una solución saturada de cloruro de sodio y se separa la fase orgánica, se seca sobre sulfato de sodio y se elimina el disolvente a presión reducida. El residuo se aplica a material FI (C-18) y se purifica por medio de MPLC sobre FI(C-18) usando agua/acetonitrilo. Se aíslan 63 mg (97 % de pureza, 28 % del teórico) del compuesto del epígrafe como un sólido blanco.

**Ejemplo de preparación 25: Síntesis de metilsulfato de 3,4-dimetil-5-(metilsulfanil)-1,2,4-tiadiazol-4-ona**



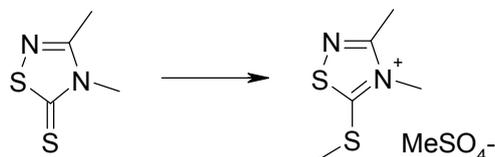
25

**Etapa 1:** 3,4-Dimetil-1,2,4-tiadiazol-5(4H)-ona



A 0 °C, se añaden 6,13 g (27,6 mmol) de pentasulfuro de fósforo a una solución de 1,80 g (13,80 mmol) de 3,4-dimetil-1,2,4-tiadiazol-5(4H)-ona (bruta, preparada de acuerdo con J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1 1983, 4, 687-691) en xileno, y la mezcla se calienta a continuación a 100 °C durante 4 h. Después de tratamiento acuoso y purificación cromatográfica, se obtienen 0,60 g (30 % del teórico) del compuesto del epígrafe.

5 **Etapla 2:** Metilsulfato de 3,4-dimetil-5-(metilsulfanil)-1,2,4-tiadiazol-4-io

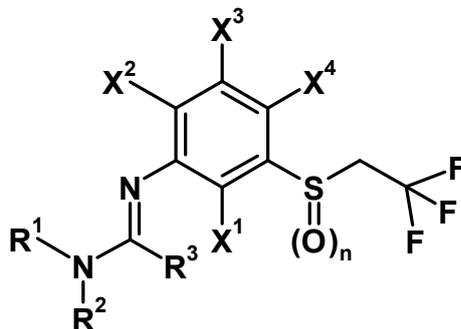


Con agitación, se añaden 0,62 g (4,52 mmol) de sulfato de dimetilo a una solución de 0,60 g (4,10 mmol) de 3,4-dimetil-1,2,4-tiadiazol-5(4H)-tione en acetonitrilo, y la mezcla se agita a reflujo durante 5 h. Después de enfriar, el disolvente se elimina a presión reducida y el residuo obtenido (1,50 g) se hace reaccionar seguidamente en bruto.

10 **Ejemplo de preparación 26:** *N*-(3,4-Dimetil-1,2,4-tiadiazol-5(4H)-iliden)-2,4-dimetil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]anilina (Ib-173)

**Etapla 1:** *N*-(3,4-Dimetil-1,2,4-tiadiazol-5(4H)-iliden)-2,4-dimetil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]anilina

Los procedimientos de preparación descritos antes se pueden usar para proporcionar los compuestos de la fórmula (I) - por ejemplo los siguientes compuestos de la fórmula (I), no siendo objeto de la invención los compuestos con los números la 1-26, 28, 30-32, 35, 37-39, 41, 43, 45, 47-48, 51-57, 62, 65, 68, 70, 76-78, 85, 87-90, 96-97, 103, 105, 109, 111-113, 115, 121-122, 124-125, 127, 129, 133, 155, 171, 178, 180, 184, 189, 191, 201-202, 204-205, 210, 213, 216-217, 222, 225-226, 233, 236, 240, 243, y los compuestos con los números Ib 1-18, 20-21, 23-26, 29-36, 38, 40-44, 49-50, 52, 54-57, 59, 68, 74,78, 80, 85-86, 90-91, 96, 101, 108, 110-112, 115, 125-128 y 169:



Ej.	n	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	X <sup>3</sup>	X <sup>4</sup>	log P
Ia-01	0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	F	H	CH <sub>3</sub>	4,48 <sup>[a]</sup> ;4,5 <sup>[b]</sup>
Ia-02	0	propilo	H	CF <sub>3</sub>	H	F	H	CH <sub>3</sub>	4,45 <sup>[a]</sup> ;4,43 <sup>[b]</sup>
Ia-03	0	H	H	CHF <sub>2</sub>	H	F	H	CH <sub>3</sub>	2,2 <sup>[c]</sup>
Ia-04	0	piridin-2-ilmetilo	H	CF <sub>3</sub>	H	F	H	CH <sub>3</sub>	3,68 <sup>[a]</sup>
Ia-05	0	propan-2-ilo	H	CF <sub>3</sub>	H	F	H	CH <sub>3</sub>	4,51 <sup>[a]</sup> ;4,52 <sup>[b]</sup>
Ia-06	0	H	H	PD-F-heptilo	H	F	H	CH <sub>3</sub>	
Ia-07	0	H	H	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	3,36 <sup>[a]</sup> ;3,4 <sup>[b]</sup>
Ia-08	0	piridin-2-ilmetilo	piridin-2-ilmetilo	CF <sub>3</sub>	H	F	H	CH <sub>3</sub>	
Ia-09	0	CH <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	F	3,72 <sup>[a]</sup> ;3,69 <sup>[b]</sup>
Ia-10	0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	DD-F-hexilo	H	F	H	CH <sub>3</sub>	
Ia-11	0	metilsulfonilo	H	CF <sub>3</sub>	H	F	H	CH <sub>3</sub>	3,05 <sup>[a]</sup>

(continuación)

Ej.	n	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	X <sup>3</sup>	X <sup>4</sup>	log P
la-12	0	CH <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	3,95 <sup>[a]</sup> ;4,01 <sup>[b]</sup>
la-13	0	CH <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>	H	F	H	CH <sub>3</sub>	3,7 <sup>[a]</sup> ;3,71 <sup>[b]</sup>
la-14	0	H	H	CF <sub>3</sub>	H	Cl	H	Cl	
la-15	0	CH <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>	H	Cl	H	Cl	4,2 <sup>[a]</sup> ;4,2 <sup>[b]</sup>
la-16	0	(trifluorometil) sulfonilo	H	CF <sub>3</sub>	H	F	H	CH <sub>3</sub>	
la-17	0	H	H	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	F	3,16 <sup>[a]</sup> ;3,14 <sup>[b]</sup>
la-18	0	etilo	H	CF <sub>3</sub>	H	F	H	CH <sub>3</sub>	4,12 <sup>[a]</sup> ;4,12 <sup>[b]</sup>
la-19	0	CH <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CF <sub>3</sub>	
la-20	0	CH <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>	H	Cl	H	CH <sub>3</sub>	
la-21	0	H	H	CF <sub>3</sub>	H	F	H	CH <sub>3</sub>	3,13 <sup>[a]</sup> ;3,17 <sup>[a]</sup> ;3,12 <sup>[b]</sup>
la-22	0	H	H	DD-F- hexilo	H	F	H	CH <sub>3</sub>	
la-23	0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	4,87 <sup>[a]</sup> ;4,87 <sup>[b]</sup>
la-24	0	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	F	4,53 <sup>[a]</sup> ;4,47 <sup>[b]</sup>
la-25	0	H	H	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CF <sub>3</sub>	
la-26	0	Cpr	H	CF <sub>3</sub>	H	F	H	CH <sub>3</sub>	4,03 <sup>[a]</sup> ;4,02 <sup>[b]</sup>
lb-01	1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	F	H	CH <sub>3</sub>	
lb-02	1	etilo	H	CF <sub>3</sub>	H	F	H	CH <sub>3</sub>	
lb-03	1	propan-2-ilo		H	CF <sub>3</sub>	H	F	H	CH <sub>3</sub>
lb-04	1	CH <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	3,15 <sup>[a]</sup> ;3,09 <sup>[b]</sup>
lb-05	1	CH <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	F	2,86 <sup>[a]</sup> ;2,79 <sup>[b]</sup>
lb-06	1	propilo	H	CF <sub>3</sub>	H	F	H	CH <sub>3</sub>	3,24 <sup>[a]</sup> ;3,17 <sup>[b]</sup>
lb-07	1	CH <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>	H	F	H	CH <sub>3</sub>	2,64 <sup>[a]</sup> ;2,61 <sup>[b]</sup>
lb-08	1	Cpr	H	CF <sub>3</sub>	H	F	H	CH <sub>3</sub>	2,68 <sup>[a]</sup> ;2,67 <sup>[b]</sup>
lb-09	1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	3,23 <sup>[a]</sup> ;3,19 <sup>[b]</sup>
lb-10	1	CH <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CF <sub>3</sub>	2,52 <sup>[a]</sup> ;2,49 <sup>[b]</sup>
lb-11	1	H	H	CF <sub>3</sub>	H	F	H	CH <sub>3</sub>	2,77 <sup>[a]</sup> ;2,71 <sup>[b]</sup>
lb-12	1	H	H	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	3,36 <sup>[a]</sup> ;3,3 <sup>[b]</sup>
lb-13	1	H	H	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	F	
lb-14	1	H	H	CF <sub>3</sub>	H	Cl	H	Cl	2,05 <sup>[a]</sup> ;2,02 <sup>[b]</sup>
lb-15	1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	F	2,17 <sup>[a]</sup> ;2,14 <sup>[b]</sup>
lb-16	1	H	H	CF <sub>3</sub>	H	H	H	CF <sub>3</sub>	2,2 <sup>[a]</sup> ;2,19 <sup>[b]</sup>

(continuación)

Ej.	n	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	X <sup>3</sup>	X <sup>4</sup>	log P
<b>Abreviaturas:</b> PD-F-heptilo = pentadecafluoroheptilo; DD-F-hexilo = 1,1,2,2,3,3,4,4,5,5,6,6-dodecafluorohexilo; CHF <sub>2</sub> = difluorometilo; Cpr = ciclopropilo; Cl = cloro; F = flúor. Los valores de logP se determinaron de acuerdo con la Directiva CEE 79/831 Anexo V.A8 por HPLC (Cromatografía Líquida de Alta Resolución) usando columnas de fase inversa (FI) (C 18) por los siguientes procedimientos: <sup>[a]</sup> La determinación de CL-EM en el intervalo ácido se lleva a cabo a pH 2,7 usando ácido fórmico acuoso al 0,1 % y acetonitrilo (contiene ácido fórmico al 0,1 %) como fases móviles; gradiente lineal desde acetonitrilo al 10 % hasta acetonitrilo al 95 %. También se hace referencia al mismo como logP(HCOOH). <sup>[b]</sup> La determinación de CL-EM en el intervalo neutro se lleva a cabo a pH 7,8 usando solución acuosa 0,001 molar de bicarbonato de amonio y acetonitrilo como fases móviles; gradiente lineal desde acetonitrilo al 10 % hasta acetonitrilo al 95 %. También se hace referencia al mismo como logP(neutro). <sup>[c]</sup> La determinación de CL-EM en el intervalo ácido se lleva a cabo a pH 2,3 usando ácido fosfórico acuoso al 0,1 % y acetonitrilo como fases móviles; gradiente lineal desde acetonitrilo al 10 % hasta acetonitrilo al 95 %.									

La calibración se lleva a cabo usando alcan-2-onas no ramificadas (que tienen de 3 a 16 átomos de carbono) con valores conocidos de logP (los valores de logP se determinan por los tiempos de retención usando interpolación lineal entre dos alcanonas sucesivas).

- 5 Los valores de lambda-max se determinaron en los máximos de las señales cromatográficas usando los espectros UV desde 200 nm a 400 nm.

#### Datos de RMN de ejemplos seleccionados

Los datos de RMN para ejemplos seleccionados se listan en la forma convencional (valores  $\delta$ , número de átomos de hidrógeno, desdoblamiento de multipletes) o como listas de picos de RMN.

- 10 Procedimiento de la lista de picos de NMR:

Cuando los datos de RMN de <sup>1</sup>H para ejemplos seleccionados se indican en la forma de listas de picos de RMN de <sup>1</sup>H, primero se enumera el valor  $\delta$  en ppm y luego la intensidad de la señal para cada pico de señal, separados por un espacio. Las parejas numéricas valor  $\delta$  – intensidad de la señal para diferentes picos se enumeran separando unas de otras por punto y coma.

- 15 La lista de picos para un ejemplo, por tanto, adopta la forma de:

$\delta_1$  intensidad<sub>1</sub>;  $\delta_2$  intensidad<sub>2</sub>; .....;  $\delta_i$  intensidad<sub>i</sub>; .....;  $\delta_n$  intensidad<sub>n</sub>

El disolvente en el que se registró el espectro de RMN se lista entre corchetes después del número de ejemplo y antes de la lista de picos de RMN o la lista de interpretación de RMN convencional.

Ejemplo número	Datos de RMN de <sup>1</sup> H
la-01	RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,12(d,1H), 7,07(d,1H), 3,84-3,92(m,2H), 2,98(ancho, 6H), 2,33(s,3H)
la-02	RMN de <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> ): 7,03-7,09(m,1H), 6,91-6,93(m,1H), 5,29(ancho, 1H), 3,28-3,38 (m,4H), 2,42(s,3H), 1,69 (ancho, 2H), 1,01(ancho, 2H), 0,83-0,88(m,1H)
la-03	RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,11-7,14(m,1H), 7,06-7,04(m,1H), 6,92-6,98(ancho, 2H), 6,30(tt,1H), 3,83-3,91(q,2H), 2,34(s,3H)
la-05	[CDCl <sub>3</sub> ] 7,26 45,31;7,09 0,35;7,03 0,72;6,93 0,95;6,91 0,85;5,09 0,50;4,13 0,50;3,30 1,93;3,28 1,82;2,42 16,00;1,57 44,22;1,43 0,36;1,33 0,54;1,29 4,62;1,28 4,60;1,26 1,33;1,25 1,06;1,25 1,27;1,23 0,74;1,08 0,47;0,01 0,72;0,00 24,21;-0,01 0,77
la-07	RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,10(s,1H), 6,98(ancho, 2H), 6,85(s,1H), 3,87(q,2H), 2,30(s,3H), 1,98(s,3H)

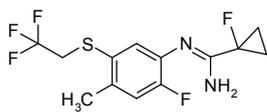
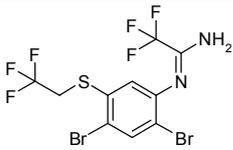
ES 2 686 044 T3

(continuación)

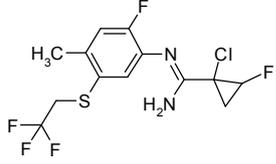
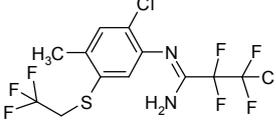
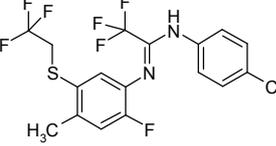
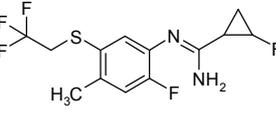
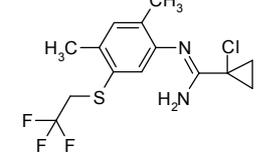
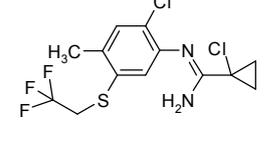
Ejemplo número	Datos de RMN de <sup>1</sup> H
la-09	[DMSO-D <sub>6</sub> ] 7,09 3,30;7,07 3,26;6,87 0,35;6,85 0,33;4,06 0,56;4,04 1,74;4,02 1,77;4,00 0,62;3,92 0,37;3,86 1,00;3,35 143,04;3,34 312,18;2,79 0,68;2,78 0,62;2,74 0,37;2,73 0,35;2,68 0,56;2,67 0,68;2,67 0,49;2,54 0,38;2,53 0,96;2,51 54,21;2,50 72,95;2,34 0,46;2,33 0,64;2,33 0,79;2,33 0,64;2,32 0,46;2,07 1,95;2,04 0,35;2,01 16,00;1,99 8,08;1,36 0,69;1,24 0,46;1,19 2,26;1,17 4,49;1,16 2,17;0,88 0,50;0,86 0,36;0,00 9,11
la-12	[DMSO-D <sub>6</sub> ] 7,01 4,28;4,03 0,82;4,02 0,83;3,79 0,35;3,37 0,42;3,34 331,71;3,33 0,37;3,32 2,34;2,79 0,50;2,62 0,35;2,61 0,48;2,61 0,35;2,52 0,66;2,52 0,84;2,52 0,90;2,51 23,83;2,51 51,40;2,50 70,93;2,50 51,33;2,50 23,51;2,44 0,53;2,39 0,35;2,39 0,53;2,38 0,38;2,36 0,58;2,33 0,49;2,31 0,74;2,28 16,00;2,19 0,55;1,99 3,80;1,97 7,19;1,19 0,93;1,17 1,84;1,16 0,90;0,01 0,74;0,00 23,54;-0,01 0,71
la-13	[CDCl <sub>3</sub> ] 7,26 51,97;7,09 0,34;7,04 0,43;6,93 0,64;6,92 0,56;3,73 0,51;3,72 0,51;3,49 0,37;3,30 1,06;3,29 1,10;3,29 0,94;3,28 0,80;3,01 1,54;2,42 16,00;2,36 0,92;1,57 10,32;1,26 0,76;1,25 1,28;1,23 0,63;0,01 0,86;0,00 28,20;-0,01 0,93
la-14	RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,67(s,1H), 7,15(s,1H), 4,16(q,2H)
la-15	RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,30(ancho, 1H), 7,61(s,1H), 7,20(s,1H), 4,14(q,2H), 2,62(ancho, 3H)
la-17	RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,15(d,1H), 7,10(ancho, 2H), 6,92(d,1H), 3,90(q,2H), 2,01(s,3H)
la-18	[CDCl <sub>3</sub> ] 7,26 18,05;7,26 0,39;7,25 0,35;7,24 0,34;7,04 0,64;6,94 0,46;6,93 1,00;6,92 0,76;6,91 0,76;6,84 0,35;6,82 0,33;5,26 0,47;3,45 1,08;3,41 0,41;3,39 0,32;3,30 1,56;3,28 1,39;2,47 0,74;2,42 16,00;1,58 15,92;1,29 1,95;1,26 0,51;1,25 0,43;1,25 0,48;1,09 0,37;0,00 9,63;-0,01 0,33
la-19	RMN de <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> ): 7,58 (d,1H), 7,13 (s,1H), 6,85 (d,1H), 5,31 (ancho, 1H), 3,45 (q,2H), 2,93 (ancho, 3H)
la-21	RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,17(d,1H), 7,09(d,1H), 3,91(q,2H), 2,34(s,3H)
la-23	RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,02(s,1H), 6,79(s,1H), 3,83(q,2H), 2,87(ancho, 6H), 2,28(s,3H), 1,96(s,3H)
la-24	RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,09(d,1H), 6,86(ancho, 1H), 3,89(q,2H), 2,90(ancho, 3H), 2,00(s,3H)
la-25	RMN de <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> ): 7,72 (d,1H), 7,24 (m,1H), 6,96-6,99 (m,1H), 4,98 (ancho, 2H), 3,48(q,2H)
la-26	[CDCl <sub>3</sub> ] 7,26 29,38;6,94 1,54;6,92 1,55;3,73 0,38;3,72 0,38;3,49 0,34;3,33 0,70;3,32 0,83;2,47 0,43;2,42 16,00;1,57 6,79;1,26 0,58;1,25 1,07;1,23 0,54;0,48 0,53;0,43 0,39;0,01 0,45;0,00 15,80;-0,01 0,53
lb-01	RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,29(d,1H), 7,23(d,1H), 4,02-4,14(m,2H), 3,01(ancho, 6H), 2,31(s,3H)
lb-02	RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,30(ancho, 1H), 7,29(d,1H), 7,22(d,1H), 4,08-4,14(m,2H), 3,99(ancho, 2H), 2,31(s,3H), 1,11(ancho, 3H)
lb-03	RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,02(ancho, 1H), 7,28(d,1H), 7,21(d,1H), 4,08-4,14(m,2H), 3,96-4,00(m,1H), 2,31(s,3H), 1,12-1,17(ancho, 6H)
lb-04	RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,01(ancho, 1H), 7,00-7,20(m,2H), 3,70-4,10(m,2H), 2,80(ancho, 3H), 2,27(s,3H), 2,07(s,3H)

(continuación)

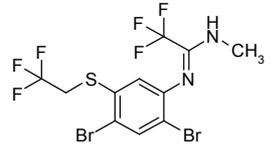
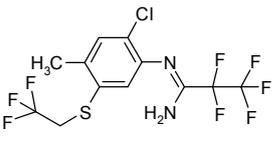
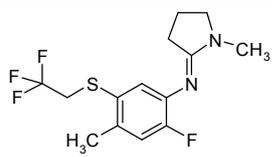
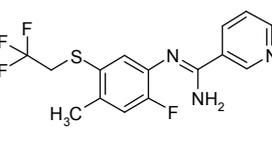
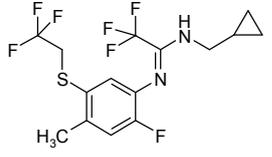
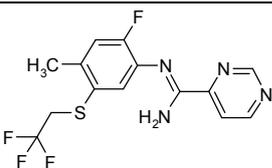
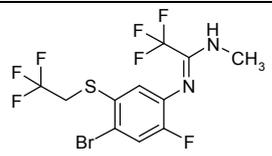
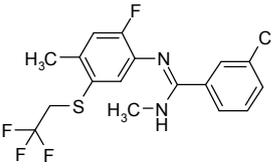
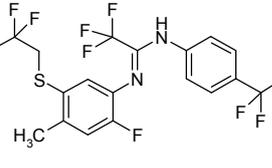
Ejemplo número	Datos de RMN de <sup>1</sup> H
lb-05	[DMSO-D <sub>6</sub> ] 7,76 0,68;7,75 0,68;7,48 0,42;7,46 0,41;7,27 5,26;7,26 5,26;7,09 0,34;7,02 0,49;4,32 0,34;4,30 0,38;4,27 0,47;4,26 0,80;4,24 1,46;4,22 2,04;4,20 1,69;4,18 0,75;3,35 821,56;3,34 2,15;3,33 2,32;3,17 0,58;3,16 0,56;2,81 0,80;2,73 0,36;2,62 0,57;2,62 1,01;2,62 1,31;2,61 0,98;2,61 0,52;2,54 1,16;2,52 3,60;2,52 4,50;2,52 5,20;2,51 63,77;2,51 130,55;2,50 175,10;2,50 122,46;2,50 53,43;2,48 0,53;2,39 0,67;2,39 1,11;2,39 1,41;2,38 1,11;2,38 0,73;2,37 6,18;2,33 0,38;2,31 0,37;2,27 4,25;2,11 16,00;2,09 5,30;2,08 1,22;2,02 0,44;1,91 0,99;1,23 0,51;1,14 1,46;0,01 0,51;0,00 12,92
lb-06	RMN de <sup>1</sup> H (D <sub>6</sub> -DMSO): 7,28(d,1H), 7,22(d,1H), 4,10-4,14(m,1H), 3,90-4,09(m,1H), 3,10-3,30(ancho, 2H), 2,31(s,3H), 1,51-1,56(ancho, 2H), 0,84-0,91(ancho, 3H)
lb-07	RMN de <sup>1</sup> H (D <sub>6</sub> -DMSO): 7,30(d,1H), 7,22(d,1H), 3,99-4,15(m,2H), 2,66-2,73(ancho, 3H), 2,31(s,3H)
lb-08	[DMSO-D <sub>6</sub> ] 8,43 0,75;7,39 0,32;7,22 1,80;7,20 1,79;4,37 0,45;4,13 0,35;4,11 0,82;4,09 0,84;4,07 0,47;4,05 0,32;4,03 0,53;4,02 0,49;3,45 0,50;3,44 0,51;3,44 0,56;3,43 0,58;3,43 0,36;3,42 0,38;3,40 0,48;3,40 0,57;3,39 1,02;3,38 1,14;3,35 1478,79;3,33 18,72;2,62 0,34;2,62 0,79;2,62 1,07;2,61 0,78;2,61 0,36;2,54 0,67;2,52 1,59;2,52 2,06;2,52 2,16;2,51 57,91;2,51 127,88;2,50 173,56;2,50 123,42;2,50 53,41;2,39 0,33;2,39 0,75;2,39 1,04;2,38 0,74;2,38 0,33;2,31 16,00;2,08 2,40;1,99 1,93;1,23 0,45;1,19 0,50;1,17 1,09;1,16 0,49;1,07 0,79;1,05 1,55;1,04 0,73;0,42 0,41;0,41 0,44;0,01 0,39;0,00 13,49;-0,01 0,41
lb-09	RMN de <sup>1</sup> H (D <sub>6</sub> -DMSO): 7,12(s,1H), 7,03(s,1H), 4,03-4,07(m,2H), 2,91(ancho, 6H), 2,27(s,3H), 2,07(s,3H)
lb-10	RMN de <sup>1</sup> H (CDCl <sub>3</sub> ): 7,63-7,71 (m,2H), 7,07 (d,1H), 5,63 (ancho, 1H), 3,25-3,58 (m,2H), 2,94 (d,3H)
lb-11	RMN de <sup>1</sup> H (D <sub>6</sub> -DMSO): 7,37(d,1H), 7,28(d,1H), 4,03-4,10(m,2H), 2,34(s,3H)
lb-12	RMN de <sup>1</sup> H (D <sub>6</sub> -DMSO): 7,19(s,1H), 7,17(s,1H), 3,96-4,04(m,2H), 2,30(s,3H), 2,07(s,3H)
lb-13	RMN de <sup>1</sup> H (D <sub>6</sub> -DMSO): 7,31(d,1H), 7,10(d,1H), 4,23-4,29(m,1H), 4,13-4,18(m,1H), 2,10(s,3H)
lb-14	RMN de <sup>1</sup> H (D <sub>6</sub> -DMSO): 7,87(s,1H), 7,54(ancho, 2H), 7,33(s,1H), 4,10-4,18(m,2H)
lb-15	RMN de <sup>1</sup> H (D <sub>6</sub> -DMSO): 7,27(d,1H), 6,98(d,1H), 4,23(m,2H), 2,94(ancho, 6H), 2,09(s,3H)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
la-27		RMN de <sup>1</sup> H (D <sub>6</sub> -DMSO): 7,11-7,08(m,1H), 7,04-7,02(m,1H), 6,68(ancho, 2H), 3,89-3,81(q,2H), 2,33(s,3H), 1,37-1,30(m,4H)
la-28		RMN de <sup>1</sup> H (D <sub>6</sub> -DMSO): 7,87(s,1H), 7,60-7,27(ancho, 2H), 7,10(s,1H), 4,15(q,2H)

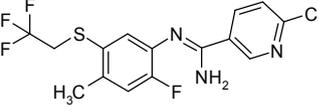
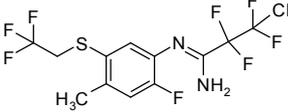
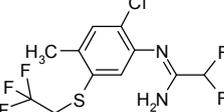
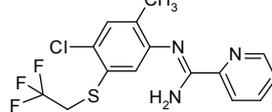
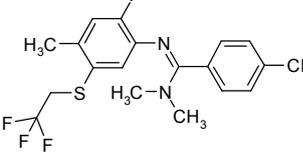
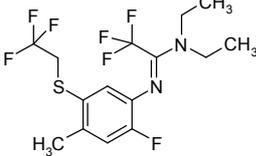
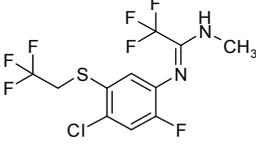
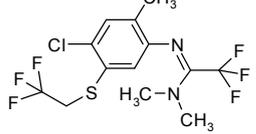
(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
la-29		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,10-7,07(m,1H), 7,00-6,98(m,1H), 6,60(ancho, 2H), 5,03(m,1H), 3,88-3,80(q,2H), 2,32(s,3H), 2,05-1,98(m,1H), 1,72-1,63(m,1H)
la-30		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,37(s,1H), 7,26(ancho, 2H), 6,99(s,1H), 4,00-3,92(q,2H), 2,32(s,3H)
la-31		logP(HCOOH)=4,73, logP(neutro)=4,67
la-32		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,82(s,1H), 7,12(s,1H), 4,14(q,2H), 3,00(s,6H)
la-33		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,06-7,03(m,1H), 6,94-6,92(m,1H), 6,37(ancho, 2H), 4,93-4,76(m,1H), 3,86-3,78(q,2H), 2,31(s,3H), 2,09-2,05(m,1H), 1,42-1,24(m,2H)
la-34		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,03(s,1H), 6,76(s,1H), 5,99(ancho, 2H), 3,86-3,78(q,2H), 2,29(s,3H), 1,91(s,3H), 1,59-1,55(m,2H), 1,29-1,26(m,2H)
la-35		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,48(d,1H), 7,20(d,1H), 4,05(q,2H), 3,01(s,6H)
la-36		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,29(m,1H), 6,94(m,1H), 6,32(ancho, 2H), 3,97-3,89(q,2H), 2,29(s,3H), 1,60(m,2H), 1,28(m,2H)

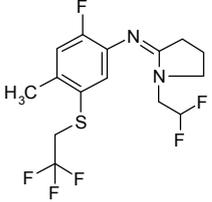
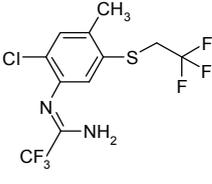
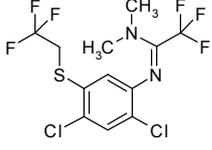
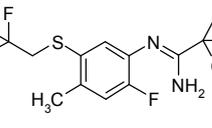
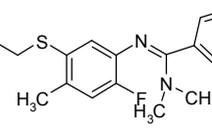
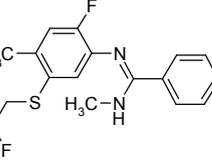
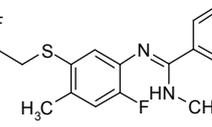
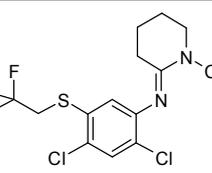
(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
la-37		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,22(ancho, 1H), 7,82(s,1H), 7,16(s,1H), 4,13(q,2H), 2,65 (s ancho,3H)
la-38		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,37(s,1H), 7,32(ancho, 2H), 7,00(s,1H), 4,01-3,93(q,2H), 2,31(s,3H)
la-39		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,01(m,2H), 3,84(q,2H), 3,38-3,32(m,2H), 2,88(s,3H), 2,30(s,3H), 2,25(t,2H), 1,88(q,2H)
la-40		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 9,12-9,11(m,1H), 8,68-8,67(m,1H), 8,32-8,28(m,1H), 7,50-7,47(m,1H), 7,17-7,12(m,2H), 6,79(ancho, 2H), 3,93-3,85(q,2H), 2,36(s,3H)
la-41		logP(HCOOH)= 4,62
la-42		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 9,32(m,1H), 9,00-8,98(m,1H), 8,27-8,26(m,1H), 7,19-7,16(m,2H), 7,05-6,98(ancho, 2H), 3,93-3,85(q,2H), 2,37(s,3H)
la-43		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,32 (s ancho,1H), 7,58(d,1H), 7,22-7,20(m,1H), 4,05(q,2H), 2,80-2,60(ancho, 3H) - picos del isómero principal
la-44		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,42-7,35(m,2H), 7,28-7,24(m,2H), 7,08-7,06(m,1H), 6,88-6,83(m,2H), 3,65-3,57(q,2H), 2,86-2,85(d,3H), 2,21(s,3H)
la-45		LogP(HCOOH)=4,82, logP(neutro)=4,71

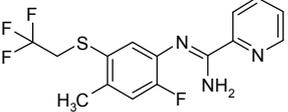
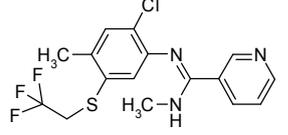
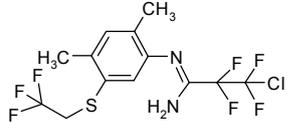
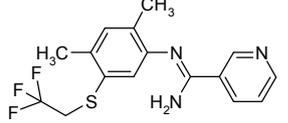
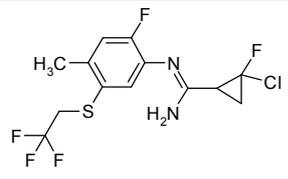
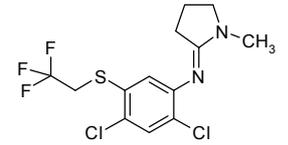
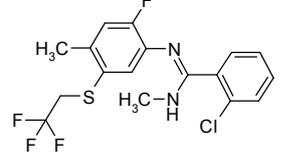
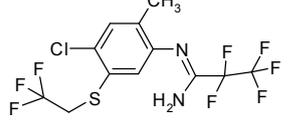
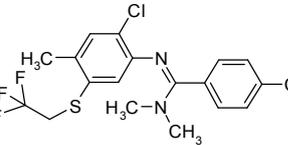
(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
la-46		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,94(m,1H), 8,37-8,34(m,1H), 7,63-7,61(m,1H), 7,17-7,12(m,2H), 6,86(ancho, 2H), 3,92-3,84(q,2H), 2,36(s,3H)
la-47		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,35(ancho, 2H), 7,17-7,15(m,1H), 7,06-7,04(m,1H), 3,92-3,85(q,2H), 2,35(s,3H)
la-48		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,34(m,1H), 6,99(s,1H), 6,84(ancho, 2H), 6,31(t,1H), 3,99-3,91(q,2H), 2,30(s,3H)
la-49		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,63-8,64(m,1H), 8,34-8,32(m,1H), 7,98-7,94(m,1H), 7,59-7,55(m,1H), 7,36(s,1H), 7,02(s,1H), 6,60(ancho, 2H), 4,05-3,98(q,2H), 2,05(s,3H)
la-50		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,51-6,74(m,6H), 3,64-3,56(q,2H), 2,98(s,3H), 2,89(s,3H), 2,18(s,3H)
la-51		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,10(d,1H), 7,04(d,1H), 3,86(q,2H), 3,40-3,36(m,4H), 2,32(s,3H), 1,15-1,11(m,6H)
la-52		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,32 (s ancho,1H), 7,49-7,44(m,1H), 7,32-7,21(m,1H), 4,04(q,2H), 2,70 (s ancho,3H)
la-53		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,29(s,1H), 6,90(s,1H), 4,04-3,98(q,2H), 2,92(ancho, 6H), 1,98(s,3H)
la-54		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,86(ancho, 1H), 7,13-7,05(ancho, 2H), 4,77(ancho, 2H), 4,60(ancho, 2H), 4,40(ancho, 1H), 3,85(ancho, 2H), 2,33(s,3H)

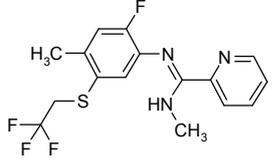
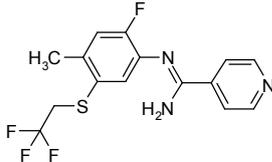
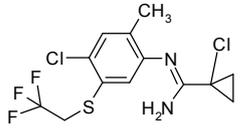
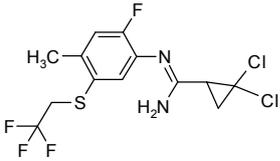
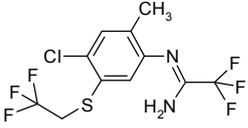
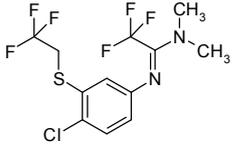
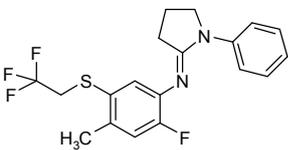
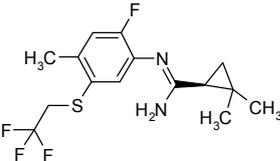
(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
la-55		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,08-7,04(m,2H), 6,23(tt,1H), 3,87-3,77(m,4H), 3,48-3,46(t,2H), 2,31(s,3H), 2,32-2,29(t,2H); 1,94-1,90(m,2H)
la-56		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,37(s,1H), 7,27(ancho, 2H), 7,03(s,1H), 4,03-3,95(q,2H), 2,31(s,3H)
la-57		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,62(s,1H), 7,17(s,1H), 4,17-4,12(m,2H), 3,00(s,6H)
la-58		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,10-7,07(m,1H), 7,00-6,98(m,1H), 6,42(ancho, 2H), 3,88-3,80(q,2H), 2,32(s,3H), 1,57(m, 2H), 1,29(m,2H)
la-59		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,46-8,44(m,1H), 8,32-8,31(m,1H), 7,60-7,58(m,1H), 7,33-7,30(m,1H), 6,83-6,80(m,2H), 3,69-3,61(q,2H), 3,01(s,3H), 2,93(s,3H), 2,17(s,3H)
la-60		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,37-7,32(m,3H), 7,19-7,17(m,2H), 6,88-6,85(m,1H), 6,80-6,78(m,1H), 3,64-3,56(q,2H), 2,86-2,85(d,3H), 2,21(s,3H)
la-61		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,47-8,46(m,1H), 8,36(m,1H), 7,57-7,55(m,1H), 7,51-7,48(m,1H), 7,30-7,27(m,1H), 6,89-6,83(m,2H), 3,70-3,62(q,2H), 2,89-2,88(d,3H), 2,20(s,3H)
la-62		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,54(s,1H), 7,02(ancho, 1H), 4,11(q,2H), 3,28(t,2H), 2,96(s,3H), 2,08(t,2H), 1,77-1,71(m,2H), 1,62-1,56(m,2H)

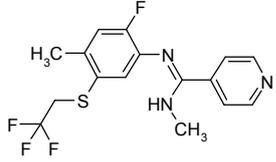
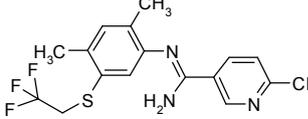
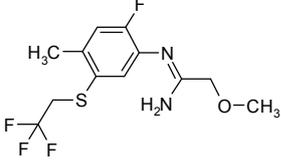
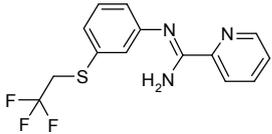
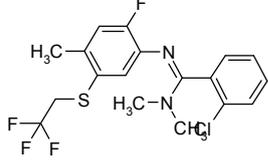
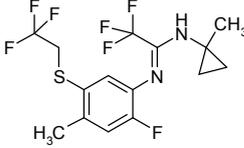
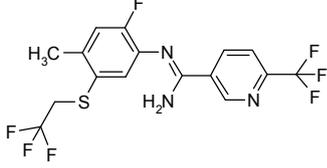
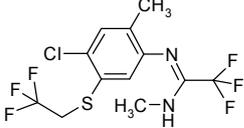
(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
la-63		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,65-8,64(m,1H), 8,31-8,29(m, 1H), 7,98-7,94(m,1H), 7,59-7,56(m,1H), 7,17-7,14(m,2H), 6,80(ancho, 2H), 3,93-3,85(q,2H), 2,36(s,3H)
la-64		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,46-8,45(m,1H), 8,37(s,1H), 7,57-7,55(m,1H), 7,49-7,48(ancho, 1H), 7,30-7,27(m,1H), 7,13(s,1H), 6,78(s,1H), 3,73-3,65(q,2H), 2,90-2,88(d,3H), 2,17(s,3H)
la-65		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,10(s,1H), 6,98(ancho, 2H), 6,83(s,1H), 3,89-3,81(q,2H), 2,31(s,3H), 1,98(s,3H)
la-66		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 9,14(m,1H), 8,67-8,66(m,1H), 8,33-8,30(m,1H), 7,50-7,46(m,1H), 7,10(s,1H), 6,91(s,1H), 6,41(ancho, 2H), 3,89-3,81(q,2H), 2,33(s,3H), 2,04(s,3H)
la-67		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,09-7,06(m,1H), 6,94-6,92(m,1H), 6,53(ancho, 2H), 3,86-3,78(m,2H), 2,67(m,1H), 2,33(s,3H), 1,96-1,90(m,1H), 1,76-1,70(m,1H)
la-68		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,53(s,1H), 7,10(s,1H), 4,11(q,2H), 3,39(t,2H), 2,90(s,3H), 2,26(t,2H), 1,90(q,2H)
la-69		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,33(ancho, 1H), 7,50-7,24(m,4H), 6,88-6,85(m,1H), 6,76-6,73(m,1H), 3,49-3,45(q,2H), 2,89-2,88(d,3H), 2,18(s,3H)
la-70		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,36(s,1H), 7,22(ancho, 2H), 6,92(s,1H), 4,07-3,99(q,2H), 1,98(s,3H)
la-71		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,35-7,32(m,2H), 7,19-7,16(m,2H), 7,09(s,1H), 6,70(s,1H), 3,68-3,60(q,2H), 2,90(ancho, 6H), 2,15(s,3H)

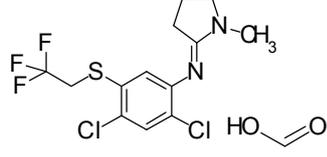
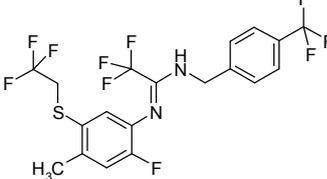
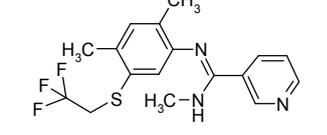
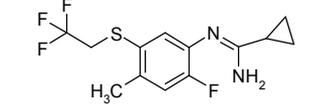
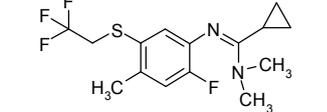
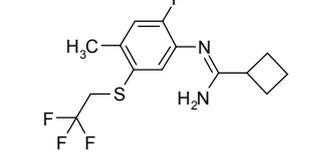
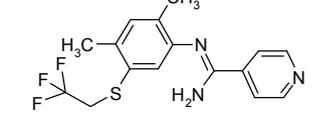
(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
1a-72		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,55-8,54(m,1H), 8,04-7,96(m,2H), 7,72(m,1H), 7,60-7,57(m,1H), 7,37(m,1H), 6,93-6,90(m,1H), 3,63(q,2H), 2,83-2,81(d,3H), 2,24(s,3H)
1a-73		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,69-8,68(m,2H), 7,90-7,89(m,2H), 7,17-7,11(m,2H), 6,85(ancho, 2H), 3,93-3,85(q,2H), 2,36(s,3H)
1a-74		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,27(s,1H), 6,84(s,1H), 6,21(ancho, 2H), 4,04-3,94(q,2H), 1,93(s,3H), 1,30-1,15(m,4H)
1a-75		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,09-7,06(m,1H), 6,94-6,92(m,1H), 6,65(ancho, 2H), 3,85-3,77(q,2H), 2,68-2,62(m,1H), 2,33(s,3H), 2,17-2,14(m,1H), 1,91-1,87(m,1H)
1a-76		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,36(m,1H), 7,15(ancho, 2H), 6,95(s,1H), 4,08-4,00(q,2H), 1,99(s,3H)
1a-77		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,33(d,1H), 6,99(d,1H), 6,64-6,61(m,1H), 4,15-4,07(m,2H), 2,92(s,6H)
1a-78		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,85(d,2H), 7,36(dd,2H), 7,12-7,09(m,3H), 3,92-3,84(m,4H), 2H bajo el pico de DMSO, 2,33(s,3H), 2,05-1,97(m,2H)
1a-79		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,05-7,01(m,2H), 6,10(ancho, 2H), 3,88-3,80(q,2H), 2,32(s,3H), 2,31(s,3H), 2,30(s,3H), 1,74(m,1H), 1,17(m,2H)

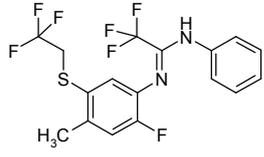
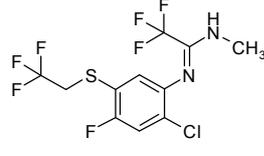
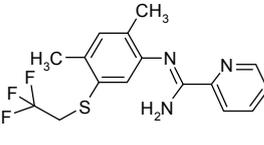
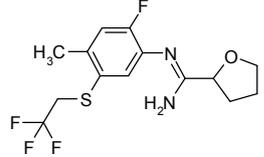
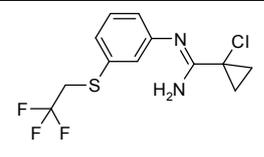
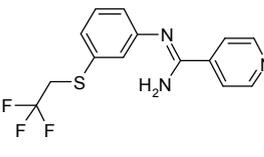
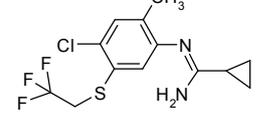
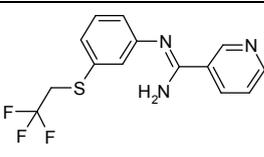
(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
la-80		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,49-8,48(m,2H), 7,51-7,49(m,1H), 7,15-7,14(m,2H), 6,87-6,85(m,2H), 3,69-3,61(q,2H), 2,88-2,87(d,3H), 2,20(s,3H)
la-81		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,95-8,96(m,1H), 8,36-8,39(m,1H), 7,61-7,63(m,1H), 7,10(s,1H), 6,91(s,1H), 6,49(ancho, 2H), 3,81-3,89(q,2H), 2,32(s,3H), 2,03(s,3H)
la-82		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,09-7,06(m,1H), 7,01-6,99(m,1H), 6,19(ancho, 2H), 3,95(s,2H), 3,88-3,80(q,2H), 3,33(s,3H), 2,32(s,3H)
la-83		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,64-8,63(m,1H), 8,30-8,28(m,1H), 7,98-7,93(m,1H), 7,58-7,55(m,1H), 7,33-7,29(m,1H), 7,13-7,11(m,1H), 7,02(s,1H), 6,84-6,82(m,1H), 6,64(ancho, 2H), 4,04-3,96(q,2H)
la-84		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,40-7,17(m,4H), 6,87-6,84(m,1H), 6,77-6,75(m,1H), 3,59-3,46(m,2H), 3,14(ancho, 3H), 2,71(ancho, 3H), 2,17(s,3H)
la-85		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,33(ancho, 1H), 7,11-7,06(m,2H), 3,83(q,2H), 2,33(s,3H), 1,34(ancho, 3H), 0,76(ancho, 2H), 0,57(ancho, 2H)
la-86		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 9,27-9,25(m,1H), 8,58-8,56(m,1H), 8,03-8,01(m,1H), 7,18-7,14(m,2H), 7,01(ancho, 2H), 3,93-3,85(q,2H), 2,37(s,3H)
la-87		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,00(ancho, 1H), 7,28(s,1H), 6,95(ancho, 1H), 4,09-4,01(q,2H), 2,68-2,67(ancho, 3H), 2,00(s,3H)

(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
la-88		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,53(s,1H), 7,102(s,1H), 4,12(q,2H), 3,39(dd,2H), 2,90(s,3H), 2,26(dd,2H), 1,90(m,2H)
la-89		logP(HCOOH)=5,15, logP(neutro)=5,15
la-90		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,03(d,1H), 6,93(d,1H), 3,84(q,2H), 3,25(t,2H), 2,94(s,3H), 2,30(s,3H), 2,10(t,2H), 1,76-1,70(m,2H), 1,60-1,54(m,2H)
la-91		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,44-8,43(m,1H), 8,32(m,1H), 7,51-7,48(m,1H), 7,28-7,21(m,2H), 6,89(s,1H), 6,41(ancho, 1H), 3,47-3,39(q,2H), 2,88(ancho, 3H), 2,17(s,3H), 2,07(s,3H)
la-92		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,04-7,01(m,1H), 6,93-6,91(m,1H), 6,12(ancho, 2H), 3,86-3,78(q,2H), 2,31(s,3H), 1,52(m,1H), 0,88-0,84(m,2H), 0,72-0,71(m,2H)
la-93		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,10-7,07(m,2H), 3,87-3,79(q,2H), 3,11(ancho, 6H), 2,34(s,3H), 1,69-1,68(m,1H), 0,68-0,66(m,2H), 0,33(m,2H)
la-94		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,10-7,07(m,1H), 6,98-6,96(m,1H), 6,15(ancho, 2H), 3,88-3,81(q,2H), 3,12-3,08(m,1H), 2,33(s,3H), 2,37-1,71(m,6H)
la-95		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,69-8,67(m,2H), 7,92-7,91(m,2H), 7,11(s,1H), 6,90(s,1H), 6,47(ancho, 2H), 3,89-3,81(q,2H), 2,32(s,3H), 2,02(s,3H)

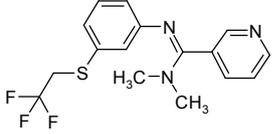
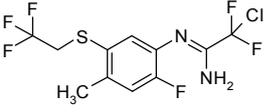
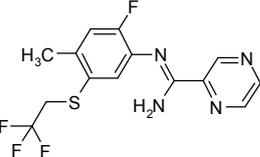
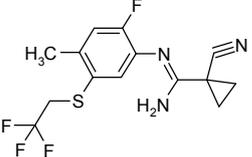
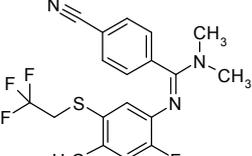
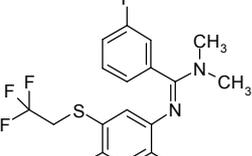
(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
Ia-96		logP(HCOOH)=4,37, logP(neutro)=4,37
Ia-97		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,20 (s ancho, 1H), 7,48(d, 1H), 7,32-7,17(m, 1H), 3,98(q, 2H), 2,90-2,50(ancho, 3H)
Ia-98		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,64-8,63(m, 1H), 8,35-8,33(m, 1H), 7,98-7,93(m, 1H), 7,58-7,54(m, 1H), 7,11(s, 1H), 6,94(s, 1H), 6,41(ancho, 2H), 3,89-3,82(q, 2H), 2,33(s, 3H), 2,03(s, 3H)
Ia-99		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,09-7,02(m, 2H), 6,22(ancho, 2H), 4,40-4,36(t, 1H), 3,97-3,92(m, 1H), 3,88-3,80(q, 2H), 3,76-3,72(m, 1H), 2,33(s, 3H), 2,23-2,16(m, 1H), 2,06-1,98(m, 1H), 1,89-1,77(m, 2H)
Ia-100		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,25-7,21(m, 1H), 7,07-7,05(m, 1H), 6,83(m, 1H), 6,65-6,63(m, 1H), 6,18(ancho, 2H), 4,00-3,92(q, 2H), 1,55(m, 2H), 1,26(m, 2H)
Ia-101		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,69-8,67(m, 2H), 7,91-7,89(m, 2H), 7,32-7,29(m, 1H), 7,12-7,10(m, 1H), 6,98(s, 1H), 6,79-6,77(m, 1H), 6,65(ancho, 2H), 4,04-3,96(q, 2H)
Ia-102		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,24(s, 1H), 6,79(s, 1H), 5,95(ancho, 2H), 4,00-3,92(q, 2H), 1,93(s, 3H), 1,51(ancho, 1H), 0,89-0,86(m, 2H), 0,73-0,70(m, 2H)
Ia-103		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,54 (s ancho, 1H), 7,02 (s ancho, 1H), 4,11(q, 2H), 3,33(dd, 2H), 2,96(s, 3H), 2,08(dd, 2H), 1,74(m, 2H), 1,58(m, 2H)
Ia-104		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 9,12(s, 1H), 8,67-8,66(m, 1H), 8,31-8,29(m, 1H), 7,50-7,46(m, 1H), 7,32-7,28(m, 1H), 7,12-7,10(m, 1H), 6,99(s, 1H), 6,80-6,78(m, 1H), 6,66-6,59(ancho, 2H), 4,04-3,96(q, 2H)

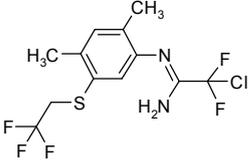
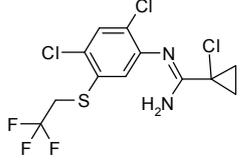
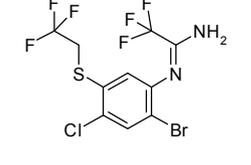
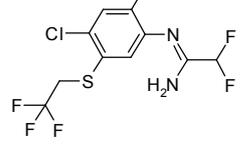
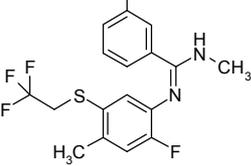
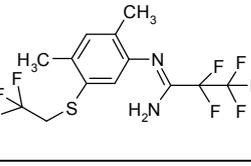
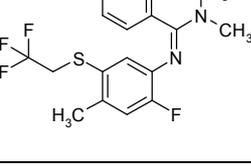
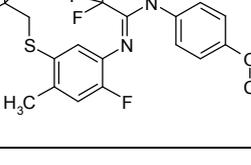
(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
Ia-105		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,33 (s ancho,1H), 7,20 (s ancho,1H), 3,92(q,2H), 3,66 (s ancho,2H), 3,34(m,2H), 3,13 (s ancho,3H), 2,33 (s ancho,3H), 2,16 (s ancho,3H), 2,02-1,95(m,2H)
Ia-106		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,05(m,1H), 6,88(m,1H), 3,75(q,2H), 2,98(s,3H), 2,87(s,3H), 2,33(s,3H), 1,83(m,2H), 0,95-0,93(m,7H)
Ia-107		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,94-8,93(m,1H), 8,41-8,34(m,2H), 7,82-7,80(m,1H), 7,63-7,61(m,1H), 7,32-7,28(m,1H), 6,99(s,1H), 6,68-6,65(ancho, 2H), 4,00(q,2H)
Ia-108		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,15-7,09(m,2H), 3,89-3,81(q,2H), 2,61(m,1H), 2,33(s,3H), 1,45(m,1H), 0,84-0,80(m,3H), 0,69-0,61(m,4H), 0,50(m,2H)
Ia-109		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,48(d,1H), 7,15(d,1H), 4,00(q,2H), 2,98(s,6H)
Ia-110		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,18(d,1H), 7,04-6,97(m,2H), 3,83(q,2H), 3,15(m,2H), 2,31(s,3H), 1,35(m,1H), 0,99(t,3H), 0,79-0,77(m,2H), 0,60-0,57(m,2H)
Ia-111		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,40(ancho, 2H), 7,18-7,15(m,1H), 7,07-7,05(m,1H), 3,93-3,85(q,2H), 2,35(s,3H)
Ia-112		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,14-7,12(m,1H), 7,06-7,04(m,1H), 6,75(ancho, 2H), 4,18(s,2H), 3,90-3,82(q,2H), 2,34(s,3H)
Ia-113		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,15(s,1H), 7,33 (s ancho,1H), 7,21(d,1H), 3,94(q,2H), 3,49(ancho, 2H), 3,19(ancho, 3H), 2,34(s,3H), 2,24-2,06(m,5H), 1,78(ancho, 2H), 1,61(ancho, 2H)

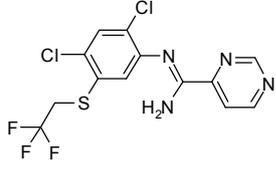
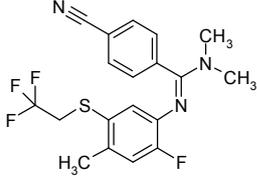
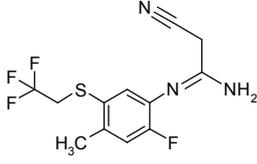
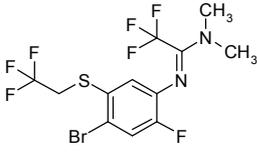
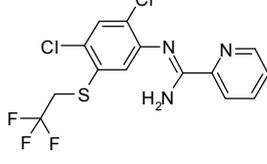
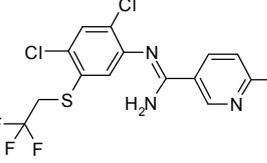
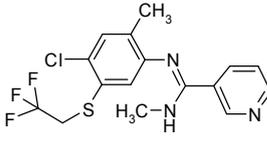
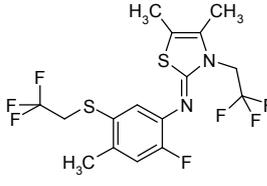
(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
Ia-114		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,44-8,42(m,1H), 8,31-8,30(m,1H), 7,60-7,58(m,1H), 7,32-7,29(m,1H), 6,96-6,92(m,1H), 6,79-6,77(m,1H), 6,60-6,59(m,1H), 6,41-6,38(m,1H), 3,79-3,71(q,2H), 3,00(ancho, 3H); 2,92(ancho, 3H)
Ia-115		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,36-7,28(ancho, 2H), 7,17-7,15(m,1H), 7,09-7,06(s,1H), 3,94-3,86(q,2H), 2,34(s,3H)
Ia-116		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,04-8,01(m,2H), 7,29-7,25(m,2H), 7,14-7,09(m,2H), 6,61(ancho, 2H), 3,87(q,2H), 2,36(s,3H)
Ia-117		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 9,45-9,44(m,1H), 8,83-8,82(m,1H), 8,72-8,71(m,1H), 7,20-7,16(m,2H), 6,98-6,92(ancho, 2H), 3,93-3,85(q, 2H), 2,37(s,3H)
Ia-118		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,11-7,08(m,1H), 7,01-6,99(m,1H), 6,26(ancho, 2H), 3,90-3,82(q,2H), 2,32(s,3H), 1,66-1,56(m,4H)
Ia-119		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,77-7,75(m,2H), 7,36-7,34(m,2H), 6,83(d,1H), 6,74(d,1H), 3,57(q,2H), 3,10(ancho, 3H), 2,73(ancho, 3H), 2,17(s,3H)
Ia-120		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,35-7,29(m,1H), 7,12-7,07(m,1H), 7,02-7,01(m,1H), 7,00-6,93(m,1H), 6,84-6,78(m,2H), 3,60(q,2H), 3,07(ancho, 3H), 2,73(ancho, 3H), 2,17(s,3H)
Ia-121		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,76(s,1H), 7,48-7,33(ancho, 2H), 7,13(s,1H), 4,20-4,12(m,2H)

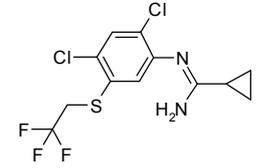
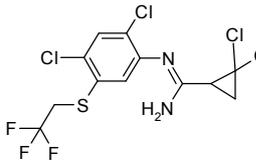
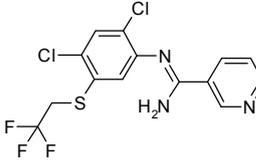
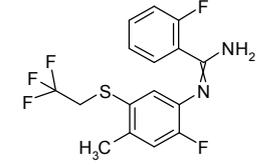
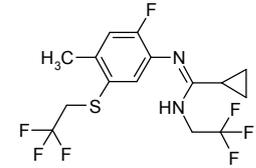
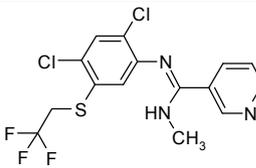
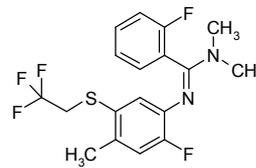
(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
Ia-122		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,09(s,1H), 6,90(ancho, 2H), 6,84(s,1H), 3,90-3,82(q,2H), 2,31(s,3H), 1,99(s, 3H)
Ia-123		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,56(s,1H), 7,04(s,1H), 6,53(ancho, 2H), 4,13-4,05(q,2H), 1,62-1,59(m,2H), 1,31-1,28(m,2H)
Ia-124		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,78(s,1H), 7,57-7,33(ancho, 1H), 7,12(s,1H), 4,19-4,11(2H)
Ia-125		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,63(s,1H), 7,09(s,1H), 7,02-6,97(ancho, 2H), 6,34(t,1H), 4,16-4,09(q,2H)
Ia-126		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,40-7,39(m,1H), 7,33-7,27(m,1H), 7,16-7,11(m,1H), 7,02-6,97(m,2H), 6,87-6,82(t,2H), 3,64-3,56(q,2H), 2,87-2,86(m,3H), 2,21(s,3H)
Ia-127		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,10(s,1H), 7,05(ancho, 2H), 6,84(s,1H), 3,90-3,82(q,2H), 2,31(s,3H), 1,96(s,3H)
Ia-128		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,19-7,16(m,2H), 7,13-7,08(m,2H), 6,82(d,1H), 6,72(d,1H), 3,58(q,2H), 3,01(ancho, 3H), 2,72(ancho, 3H), 2,17(s,3H)
Ia-129		logP(HCOOH)=4,2, logP(neutro)=4,2

(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
Ia-130		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 9,33(m,1H), 9,01-9,00(m,1H), 8,28-8,27(m,1H), 7,66(s,1H), 7,21(s,1H), 7,12-7,00(ancho, 2H), 4,16-4,08(q,2H)
Ia-131		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,77-7,75(m,2H), 7,36-7,34(m,2H), 6,83(d,1H), 6,74(d,1H), 3,58(q,2H), 3,10(ancho, 3H), 2,70(ancho, 3H), 2,17(s,3H)
Ia-132		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,11-7,10(m,1H), 7,07-7,01(m,1H), 6,49(ancho, 2H), 3,88-3,83(q,2H), 3,65(s,2H), 2,33(s,3H)
Ia-133		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO, 400 MHz): 7,58(d,1H), 7,18(d,1H), 4,06(q,2H), 3,01(s,6H)
Ia-134		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,66-8,65(m,1H), 8,32-8,30(m,1H), 8,00-7,95(m,1H), 7,64(s,1H), 7,60-7,57(m,1H), 7,20(s,1H), 6,95(ancho, 2H), 4,16-4,08(m,2H)
Ia-135		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,95(ancho, 1H), 8,38-8,32(m,1H), 7,64(m,2H), 7,19(s,1H), 6,94(ancho, 2H), 4,15-4,08(q,2H)
Ia-136		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,47-8,45(m,1H), 8,35(s,1H), 7,56-7,54(m,1H), 7,39-7,38(m,1H), 7,31-7,27(m,1H), 7,15(s,1H), 6,54(ancho, 1H), 3,71-3,64(q,2H), 2,89-2,88(d,3H), 2,08(s,3H),
Ia-138		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,20-7,16(m,2H), 4,79(q,2H), 3,83(q,2H), 2,35(s,3H), 2,10(s,3H), 2,03(s,3H)

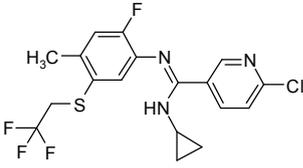
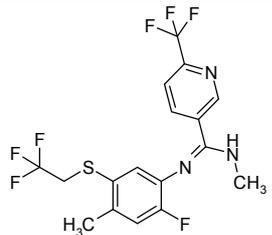
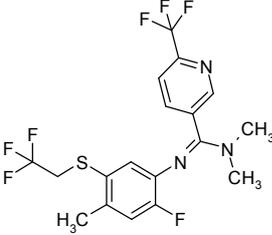
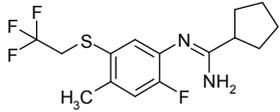
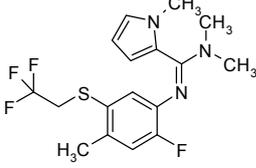
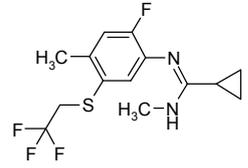
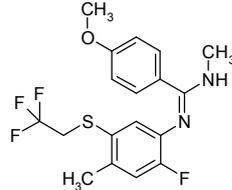
(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
Ia-139		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,52(s,1H), 6,98(s,1H), 6,24-6,15(ancho, 2H), 4,11-4,03(q,2H), 1,51(m,1H), 0,92-0,88(m,2H), 0,76-0,71(m,2H)
Ia-140		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,58(s,1H), 6,95(s,1H), 6,70(ancho, 2H), 4,07-4,00(m,2H), 2,17-2,14(m,1H), 1,95-1,93(m,1H)
Ia-141		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 9,13(m,1H), 8,69(m,1H), 8,32(m,1H), 7,64(s,1H), 7,49(m,1H), 7,18(s,1H), 6,89(ancho, 2H), 4,16-4,08(ancho, 2H)
Ia-143		logP(HCOOH)=1,37, logP(neutro)=3,25
Ia-144		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,34-7,33(m,1H), 7,23-7,20(m,2H), 7,12-7,07(m,2H), 6,85(d,1H), 6,77(d,1H), 3,58(q,2H), 2,86-2,85(m,3H), 2,21(s,3H)
Ia-145		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,09-7,07(m,1H), 6,99-6,98(m,1H), 6,72(ancho, 1H), 3,85-3,79(m,4H), 2,33(s,3H), 1,41(ancho, 1H), 0,85-0,83(m,2H), 0,68-0,65(m,2H)
Ia-146		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,50-8,49(m,1H), 8,41(s,1H), 7,71(ancho, 1H), 7,50-7,58(m,1H), 7,52-7,48(m,1H), 7,34-7,30(m,1H), 6,95(ancho, 1H), 3,96-3,88(q,2H), 2,92-2,90(d,3H)
Ia-147		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,36-7,30(m,1H), 7,17-7,08(m,3H), 6,83(d,1H), 6,73(d,1H), 3,55(q,2H), 3,13(ancho, 3H), 2,76(ancho, 3H), 2,17(s,3H)

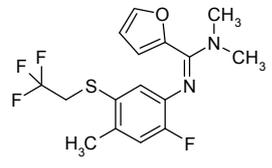
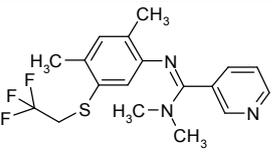
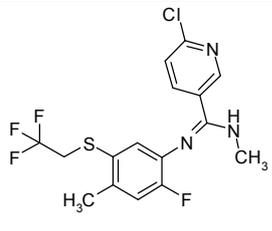
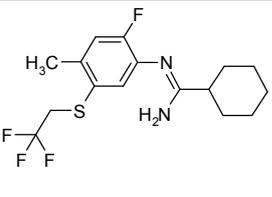
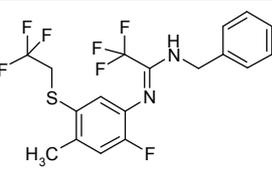
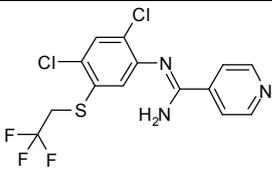
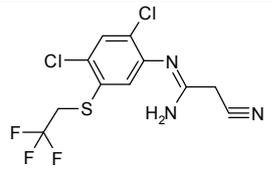
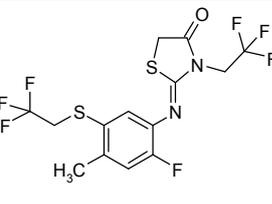
(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
Ia-148		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,46-8,45(m,1H), 8,03(s,1H), 7,64-7,63(q,1H), 6,90-6,94(m,2H), 3,72-3,64(q,2H), 2,89(d,3H), 2,22(s,3H)
Ia-149		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,00(m,1H), 6,94-6,91(d,1H), 6,86-6,84(m,2H), 3,68(q,2H), 2,97(s,6H), 2,23(s,3H)
Ia-150		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,24-8,23(m,1H), 7,76(ancho, 1H), 7,66-7,63(m,1H), 7,45-7,43(m,1H), 6,90-6,87(m,2H), 6,03-5,97(m,1H), 5,32-5,28(m,1H), 5,16-5,13(m,1H), 4,02(ancho, 2H), 3,72-3,64(q,2H), 2,22(s,3H)
Ia-151		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,90(m,1H), 8,67(m,2H), 7,89-7,88(m,1H), 7,67-7,66(m,1H), 7,46-7,45(m,1H), 7,22-7,19(m,1H), 3,89-3,73(m,4H), 2,30(s,3H), 1,38-1,35(t,3H)
Ia-152		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,25-8,20(m,2H), 7,73(ancho, 1H), 7,66-7,61(m,1H), 7,48-7,46(m,1H), 6,94(ancho, 1H), 3,97-3,89(q,2H), 2,91-2,90(d,3H)
Ia-153		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,58(t,1H), 7,60(m,1H), 7,10(m,1H), 4,10-3,87(m,4H), 1,38(m,1H), 0,88(m,2H), 0,71(m,2H)
Ia-155		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,96 (s ancho,1H), 7,48(d,1H), 7,33 (s ancho,2H), 6,51(d,1H), 3,90-3,70(m,2H)
Ia-156		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,54(s,1H), 6,98(s,1H), 6,10(ancho, 2H), 4,10-4,02(q,2H), 2,14(m,1H), 1,84-1,15(m,10H)

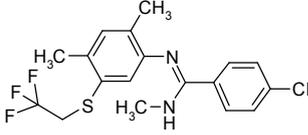
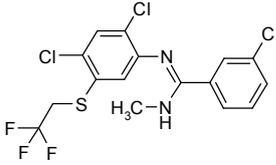
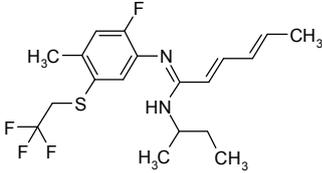
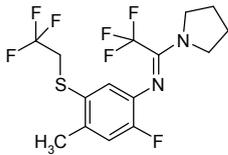
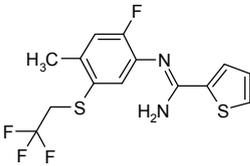
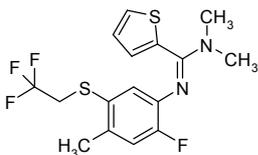
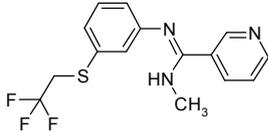
(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
Ia-158		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,21-8,18(m,1H), 7,65-7,58(m,2H), 7,43-7,41(m,1H), 6,90-6,87(m,2H), 3,73-3,66(q,2H), 2,22(s,3H), 2,92(m,1H), 0,74-0,67(m,2H), 0,60-0,56(m,2H)
Ia-159		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,84(m,1H), 8,21-8,19(m,1H), 8,02-8,00(m,1H), 7,61-7,59(m,1H), 7,29-7,26(m,2H), 3,76-3,69(q,2H), 2,84(ancho, 3H), 2,30(s,3H)
Ia-160		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,57(m,1H), 7,96-7,94(m,1H), 7,86-7,84(m,1H), 6,91-6,88(m,2H), 3,65-3,57(q,2H), 3,15(ancho, 3H), 2,80(ancho, 3H), 2,18(s,3H)
Ia-161		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,08-7,05(m,1H), 6,98(m,1H), 6,20(ancho, 2H), 3,87-3,79(q,2H), 2,33(s,3H), 2,30(m,1H), 1,84-1,52(m,8H)
Ia-162		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 6,88(d,1H), 6,70-6,69(m,1H), 6,63(d,1H), 5,91-5,89(m,2H), 3,58(q,2H), 3,39(s,3H), 3,05(ancho, 3H), 2,77(ancho, 3H), 2,21(s,3H)
Ia-163		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,05-6,99(m,2H), 6,24(ancho, 1H), 3,86-3,78(q,2H), 2,65-2,64(d,3H), 2,31(s,3H) 1,35(m,1H), 0,79-0,75(m,2H), 0,62-0,57(m,2H)
Ia-165		logP(HCOOH)=1,68, logP(neutro)=3,49

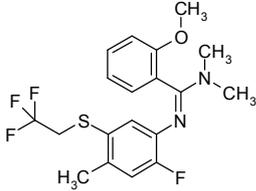
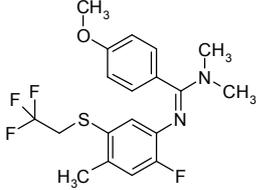
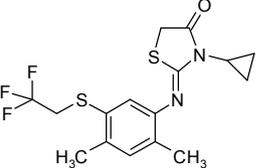
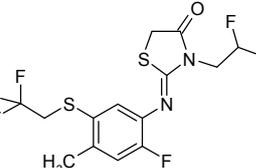
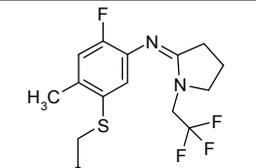
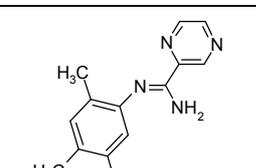
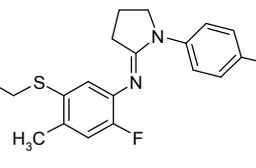
(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
Ia-166		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,68(m,1H), 6,91(d,1H), 6,75(d,1H), 6,42-6,41(m,1H), 6,25-6,24(m,1H), 3,69(q,2H), 2,94(s,6H), 2,24(s,3H)
Ia-167		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,42-8,40(m,1H), 8,29(m,1H), 7,59-7,56(m,1H), 7,30-7,27(m,1H), 6,83(s,1H) 2,04(s,3H), 6,42(s,1H), 2,13(s,3H), 3,51-3,43(q,2H), 2,92(ancho, 6H)
Ia-168		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,35-8,33(m,1H), 7,76(m,1H), 7,54-7,52(m,1H), 7,25(m,1H), 7,07(m,2H), 3,74(q,2H), 3,07(d,3H), 2,27(s,3H)
Ia-169		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,05-7,02(m,1H), 6,93-6,91(m,1H), 5,90(ancho, 2H), 3,85-3,77(q,2H), 2,3(s,3H), 2,16-2,10(m,1H), 1,83-1,15(m,10H)
Ia-171		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,73(ancho, 1H), 7,32-7,25(ancho, 5H), 7,08-7,05(m,1H), 6,96-6,94(m,1H), 4,48(ancho, 2H) 3,78(q,2H), 2,32(s,3H)
Ia-172		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,70(m,2H), 7,90-7,87(m,2H), 7,64(m,1H), 7,18(s,1H), 6,94(ancho, 2H), 4,15-4,08(q,2H)
Ia-173		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,60(s,1H), 7,06(s,1H), 6,63-6,54(ancho, 2H), 4,14-4,07(q,2H), 3,67(s,2H)
Ia-175		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,27(d,1H), 7,21(d,1H), 4,58(q,2H), 4,24(s,2H), 3,87(q,2H), 2,39(s,3H)

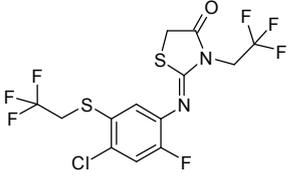
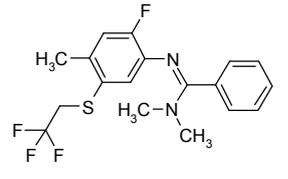
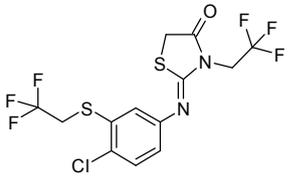
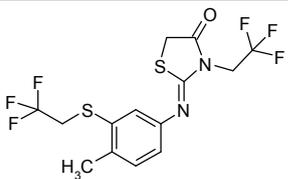
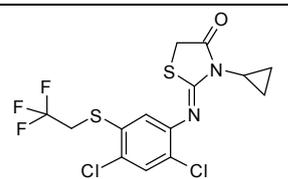
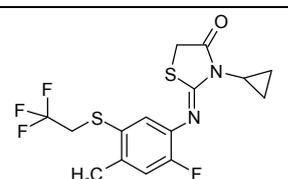
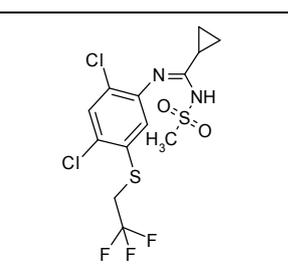
(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
Ia-176		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,31-7,29(m,2H), 7,14-7,08(m,3H), 6,89(s,1H), 6,36(s,1H), 3,41-3,33(q,2H), 2,85(ancho, 3H), 2,18(s,3H), 2,07(s,3H)
Ia-177		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,59-7,58(m,1H), 7,43(s,1H), 7,40-7,27(m,3H), 7,08-7,06(m,1H), 6,88(s,1H), 3,90-3,82(q,2H), 2,88-2,87(d,3H)
Ia-178		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,73(m,1H), 7,03-6,93(m,3H), 6,19-5,87(m,3H), 3,80-3,71(m,3H), 2,32(s,3H), 1,80-1,78(d,3H), 1,48(m,2H), 1,03-1,02(d,3H), 0,81(t,3H)
Ia-180		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,07-7,04(m,2H), 3,80(q,2H), 3,18(ancho, 4H), 2,33(s,3H), 1,84(ancho, 4H)
Ia-181		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,76(m,1H), 7,65-7,64(m,1H), 7,15-7,08(m,3H), 6,68(ancho, 2H), 3,92-3,84(q,2H), 2,35(s,3H)
Ia-182		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,59-7,56(m,1H), 6,98-6,95(m,2H), 6,87(d,1H), 6,77(d,1H), 3,63(q,2H), 2,96(s,6H), 2,20(s,3H)
Ia-183		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,46-8,45(m,1H), 8,36(s,1H), 7,57-7,55(m,1H), 7,33-7,27(m,2H), 7,01-6,97(m,1H), 6,84-6,82(m,1H), 6,64(s,1H), 6,44-6,42(m,1H), 3,79-3,71(q,2H), 2,87-2,86(d,3H)
Ia-184		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,48(ancho, 1H), 7,11-7,01(m,2H), 4,90(ancho, 1H), 3,79(q,2H), 3,50(ancho, 2H), 3,18(ancho, 2H), 2,34(s,3H)

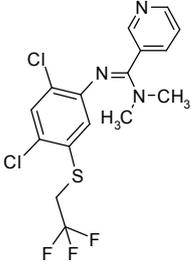
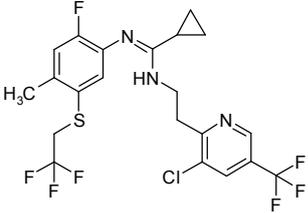
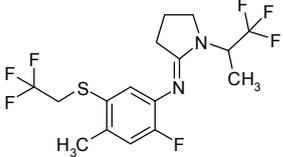
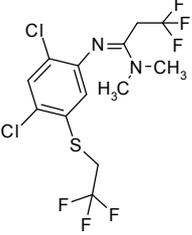
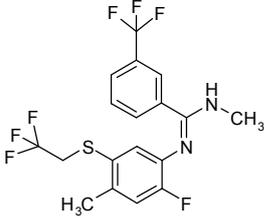
(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
Ia-185		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,25-7,21(m,1H), 6,96-6,90(m,2H), 6,84-6,81(m,2H), 6,60(d,1H), 3,73(s,3H), 3,50-3,37(m,2H), 3,10(ancho, 3H), 2,69(ancho, 3H), 2,17(s,3H)
Ia-186		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,06-7,02(m,2H), 6,84-6,80(m,3H), 6,70(d,1H), 3,68(s,3H), 3,54(q,2H), 2,91(ancho, 6H), 2,17(s,3H)
Ia-187		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,14(s,1H), 7,00(s,1H), 3,92(s,2H), 3,82(q,2H), 2,71(septuplete,1H), 2,33(s,3H), 2,06(s,3H), 1,00-0,90(m,4H)
Ia-188		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,28-7,25(m,2H), 6,32(tt,1H), 4,21-4,12(m,4H), 3,87(q,2H), 2,38(s,3H)
Ia-189		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO) 7,09-7,01(m,2H), 4,24(q,2H), 3,85(q,2H), 3,49(t,2H), 2,33(t,3H), 2,32(s,3H), 1,98-1,90(m,2H)
Ia-190		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 9,49(m,1H), 8,81(m,1H), 8,71(m,1H), 7,13(s,1H), 6,98(s,1H), 6,53(ancho, 2H), 3,86(q,2H), 2,33(s,3H), 2,06(s,3H)
Ia-191		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,15(d,2H), 7,72(d,2H), 7,14(d,2H), 3,95-3,85(m,2x2H), 2,54(m,2H), 2,34(s,3H), 2,04(m,2H)

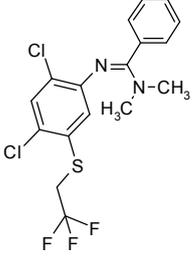
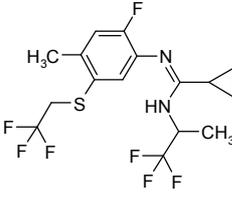
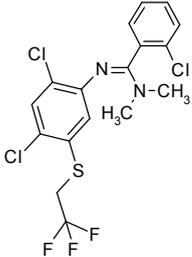
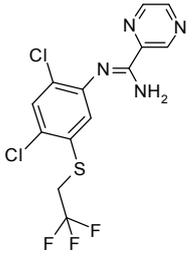
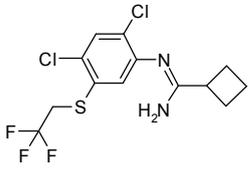
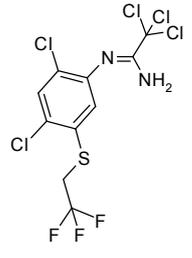
(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
Ia-192		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,67(d,1H), 7,36(d,1H), 4,59(q,2H), 4,27(s,2H), 4,06(q,2H)
Ia-193		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,30-7,25(m,3H), 7,13-7,11(m,2H), 6,81-6,78(m,1H), 6,73-6,71(m,1H), 3,54(q,2H), 3,08(ancho, 3H), 2,75(ancho, 3H), 2,16(s,3H)
Ia-194		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,51(d,1H), 7,19(d,1H), 6,85(dd,1H), 4,57(q,2H), 4,21(s,2H), 4,12(q,2H)
Ia-195		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,27(d,1H), 7,09(d,1H), 6,79(dd,1H), 4,57(q,2H), 4,18(s,2H), 3,94(q,2H), 2,35(s,3H)
Ia-196		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,76(s,1H), 7,35(s,1H), 4,13(q,2H), 4,02(s,2H), 2,71(septuplete,1H), 1,02-0,94(m,4H)
Ia-197		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,25-7,20(m,2H), 3,98(s,2H), 3,87(q,2H), 2,74-2,60(m,1H), 2,40(s,3H), 1,00-0,87(m,4H)
Ia-198		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 9,30(ancho, 1H), 7,85(s,1H), 7,75(s,1H), 4,21(q,2H), 2,87(s,3H), 1,20(m,2H), 1,05(m,2H)

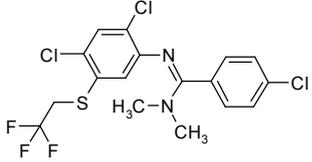
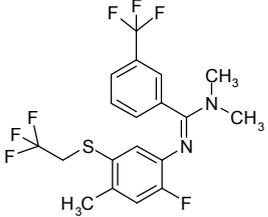
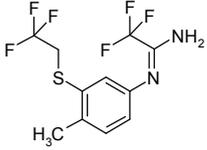
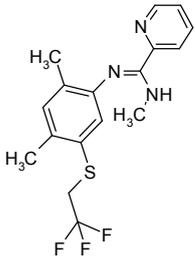
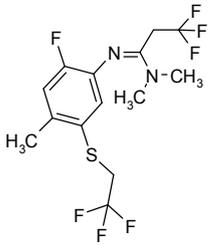
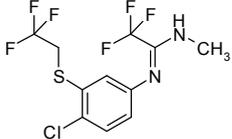
(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
Ia-199		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,47-8,46(m,1H), 8,37-8,36(m,1H), 7,66-7,63(m,1H), 7,37(s,1H), 7,35-7,31(m,1H), 6,92(s,1H), 3,92(q,2H), 3,08(ancho, 3H), 2,85(ancho, 3H)
Ia-200		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,87(s,1H), 8,38(m,1H), 7,04-7,02(m,1H), 6,94(s,1H), 6,33(ancho, 1H), 3,79(q,2H), 3,63-3,58(m,2H), 3,23(t,2H), 2,31(s,3H), 1,34(m,1H), 0,76-0,72(m,2H), 0,60-0,55(m,2H)
Ia-201		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,10-7,05(m,2H), 5,14-5,06(m,1H), 3,89-3,81(q,2H), 3,51-3,49(m,2H), 2,32(s,3H), 2,30-2,28(m,2H), 1,98-1,89(m,2H), 1,38-1,36(ancho, 3H)
Ia-202		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,59(s,1H), 7,05(s,1H), 4,10(q,2H), 3,70(s,2H), 3,08(ancho, 6H)
Ia-203		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,66(d,1H), 7,55-7,41(m,4H), 6,87-6,83(m,2H), 3,56(q,2H), 2,89(d,3H), 2,19(s,3H)
Ia-204		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,42(d,1H), 7,26(ancho, 2H), 7,05(d,1H), 6,75-6,72(m,1H), 4,13(q,2H)

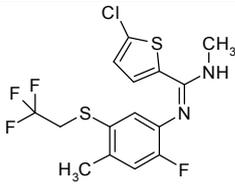
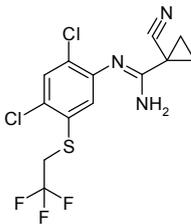
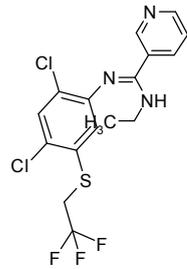
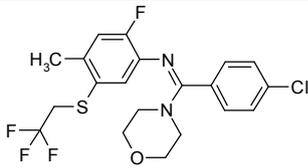
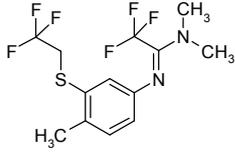
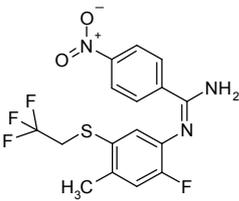
(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
Ia-205		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,35(s,1H), 7,31-7,27(m,3H), 7,18-7,16(m,2H), 6,81(s,1H), 3,82(q,2H), 3,10(ancho, 3H), 2,82(d,3H)
Ia-206		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,09-7,06(m,1H), 7,01-6,99(m,1H), 6,47-6,44(m,1H), 3,85(q,2H), 2,65-2,59(m,2H), 2,33(s,3H), 1,41(m,1H), 1,27(d,3H), 0,96-0,61(m,4H)
Ia-207		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,45-6,76(m,6H), 3,86(q,2H), 3,17(ancho, 3H), 2,73(ancho, 3H)
Ia-208		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 9,45(s,1H), 8,84(m,1H), 8,74-8,73(m,1H), 7,66(s,1H), 7,23(s,1H), 7,03(ancho, 2H), 4,12(q,2H)
Ia-209		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,61(ancho, 1H), 7,11(ancho, 1H), 6,20(ancho, 2H), 4,10(q,2H), 3,14(m,1H), 2,32-1,78(m,6H)
Ia-210		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,65(s,1H), 7,15(ancho, 2H), 7,10(s,1H), 4,15(q,2H)

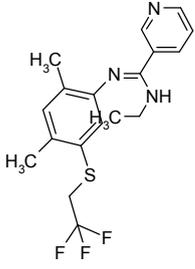
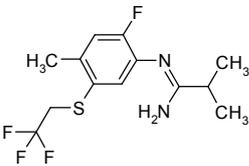
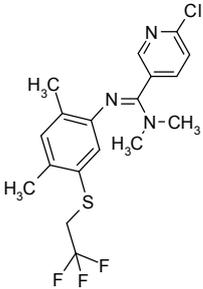
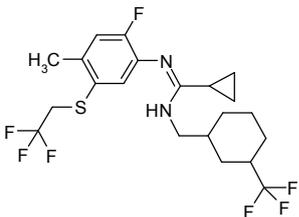
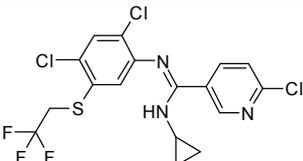
(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
Ia-211		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,39-7,35(m,3H), 7,21-7,19(m,2H), 6,85(s,1H), 3,86(q,2H), 3,07(ancho, 3H), 2,79(ancho, 3H)
Ia-212		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,63(d,1H), 7,54-7,46(m,2H), 7,42(d,1H), 6,83-6,78(m,2H), 3,56(q,2H), 3,11(ancho, 3H), 2,76(ancho, 3H), 2,16(s,3H)
Ia-213		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,20(d,1H), 7,10(ancho, 2H), 6,96(d,1H), 6,69-6,67(m,1H), 3,97(q,2H), 2,31(s,3H)
Ia-214		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,56-8,55(m,1H), 7,69-7,68(m,2H), 7,38-7,22(m,3H), 6,93(s,1H), 3,48(ancho, 2H), 2,77(ancho, 3H), 2,22(s,3H), 2,06(s,3H)
Ia-215		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,99(d,2H), 7,51(d,2H), 7,14-7,09(m,2H), 6,65(ancho, 2H), 3,87(q,2H), 2,35(s,3H)
Ia-216		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,10-7,07(m,1H), 6,94-6,92(m,1H), 3,83(q,2H), 3,52(q,2H), 3,04(ancho, 6H), 2,32(s,3H)
Ia-217		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,05(ancho, 1H), 7,32(d,1H), 7,03(ancho, 1H), 6,65(ancho, 1H), 4,09(q,2H), 2,70(ancho, 3H)

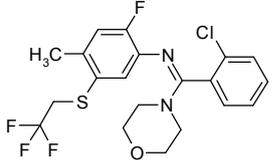
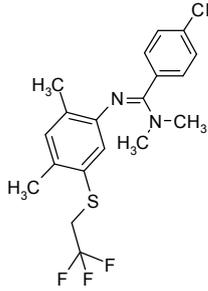
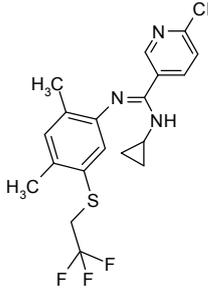
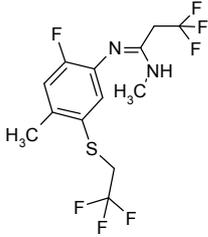
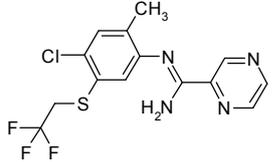
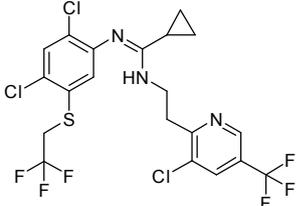
(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
Ia-218		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,57(d,1H), 7,49(ancho, 1H), 7,17(d,1H), 7,05-6,99(m,2H), 3.
Ia-219		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,58(s,1H), 7,07(s,1H), 6,40(ancho, 2H), 3,93(q,2H), 1,75-1,61(m,4H)
Ia-220		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,49-8,47(m,1H), 8,39(m,1H), 7,65(t,1H), 7,59-7,57(m,1H), 7,42(s,1H), 7,37-7,29(m,1H), 6,90(s,1H), 3,90(q,2H), 3,43-3,38(m,2H), 1,23(t,3H)
Ia-221		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,36-7,34(m,2H), 7,20-7,18(m,2H), 6,87-6,84(m,1H), 6,82-6,80(m,1H), 3,66-3,58(m,8H), 3,30(ancho, 2H), 2,19(s,3H)
Ia-222		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,10(d,1H), 6,89(ancho, 1H), 6,55(d,1H), 3,93(q,2H), 2,87(ancho, 6H), 2,29(s,3H)
Ia-223		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,30(d,2H), 8,21(d,2H), 7,17-7,13(m,2H), 6,89(ancho, 2H), 3,89(q,2H), 2,37(s,3H)

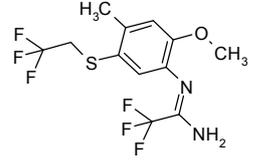
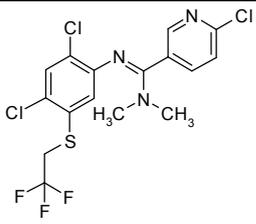
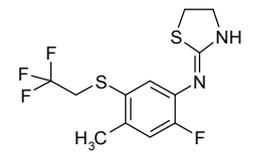
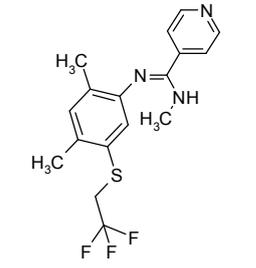
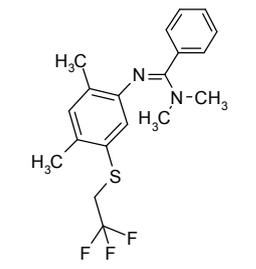
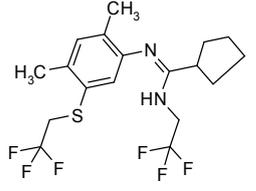
(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
Ia-224		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,43-8,42(m,1H), 8,31(m,1H), 7,52-7,50(m,1H), 7,27-7,20(m,2H), 6,89(s,1H), 6,39(s,1H), 3,45-3,33(m,4H), 2,17(s,3H), 2,07(s,3H), 1,22(t,3H)
Ia-225		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,07-7,04(m,1H), 6,95-6,94(m,1H), 5,95(ancho, 2H), 3,82(q,2H), 2,32(s,3H), 1,14(d,6H)
Ia-226		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,90(ancho, 1H), 7,09(d,1H), 6,89(ancho, 1H), 6,58(ancho, 1H), 4,03(q,2H) 2,76(ancho, 3H), 2,29(s,3H)
Ia-227		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,15(m,1H), 7,68-7,65(m,1H), 7,42-7,40(m,1H), 6,86(s,1H), 6,45(s,1H), 3,52(q,2H), 2,92(ancho, 6H), 2,16(s,3H), 2,04(s,3H)
Ia-228		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,05-6,95(m,2H), 6,26(ancho, 1H), 3,80(q,2H), 3,09-3,01(m,2H), 2,32(s,3H), 2,22-0,60(m,15H)
Ia-229		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,32-8,27(m,1H), 7,82(ancho, 1H), 7,65(m,1H), 7,48-7,46(m,2H), 7,02(ancho, 1H), 3,97(q,2H), 2,83(m,1H), 0,69-0,61(m,4H)

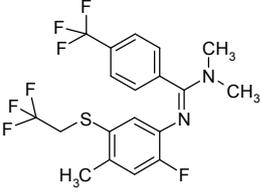
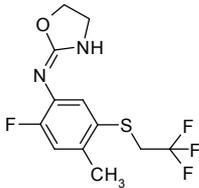
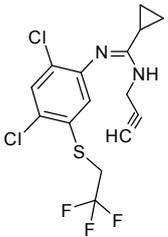
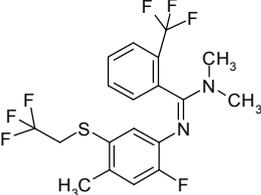
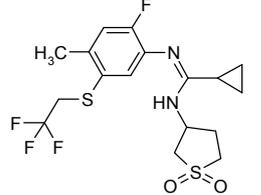
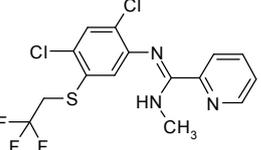
(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
Ia-230		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,40-7,23(m,4H), 6,89-6,86(m,1H), 6,81-6,79(m,1H), 3,65-3,49(m,8H), 3,02-3,00(m,2H), 2,18(s,3H)
Ia-231		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,32-7,30(m,2H), 7,14-7,12(m,2H), 6,83(s,1H), 6,39(s,1H), 3,44(q,2H), 2,89(ancho, 6H), 2,15(s,3H), 2,04(s,3H)
Ia-232		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,14(m,1H), 7,55-7,53(m,1H), 7,38-7,37(m,2H), 6,91(s,1H), 6,47(s,1H), 3,50(q,2H), 2,87(m,1H), 2,19(s,3H), 2,08(s,3H), 0,71(m,2H), 0,58(m,2H)
Ia-233		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,26(ancho, 1H), 7,09-7,06(m,1H), 6,97-6,95(m,1H), 3,84(q,2H), 3,14(q,2H), 2,77(d,3H), 2,32(s,3H)
Ia-234		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 9,50-9,49(m,1H), 8,83-8,82(m,1H), 8,72(s,1H), 7,37(s,1H), 7,07(s,1H), 6,75(ancho, 2H), 4,03(q,2H), 2,08(s,3H)
Ia-235		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,88(s,1H), 8,39(m,1H), 7,54(s,1H), 7,05(s,1H), 6,53(ancho, 1H), 4,07(q,2H), 3,64-3,59(m,2H), 3,27(t,2H), 1,35-1,30(m,1H), 0,79-0,76(m,2H), 0,60-0,59(m,2H)

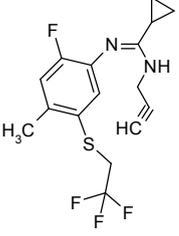
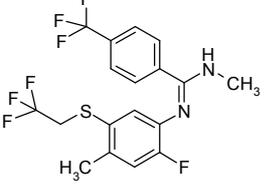
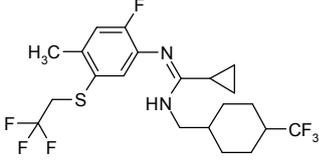
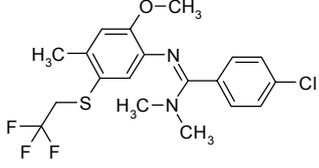
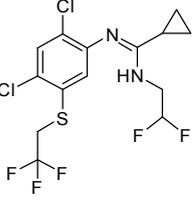
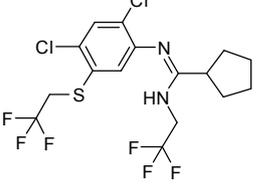
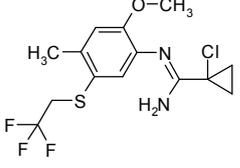
(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
Ia-236		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 6,96-6,92(m,4H), 3,75(q,2H), 3,73(s,3H), 2,39(s,3H)
Ia-237		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,23-8,22(m,1H), 7,73-7,70(m,1H), 7,49-7,47(m,1H), 7,42(s,1H), 6,95(s,1H), 3,94(q,2H), 3,10(ancho, 3H), 2,83(ancho, 3H)
Ia-238		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,78(ancho, 1H), 7,12-7,07(m,2H), 3,83-3,75(m,2H), 3,55(ancho, 2H), 3,29(t,2H), 2,33(s,3H)
Ia-239		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,46-8,45(m,2H), 7,19(ancho, 1H), 7,11(m,2H), 6,90(s,1H), 6,42(ancho, 1H), 3,44(q,2H), 2,87(ancho, 3H), 2,17(s,3H), 2,07(s,3H)
Ia-240		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,28-7,22(m,3H), 7,10-7,08(m,2H), 6,81(s,1H), 6,37(s,1H), 3,36(q,2H), 2,90(ancho, 6H), 2,13(s,3H), 2,05(s,3H)
Ia-241		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,01(s,1H), 6,89(t,1H), 6,63(s,1H), 4,10-4,02(m,2H), 3,77(q,2H), 2,50(m,1H), 2,29(s,3H), 1,92(s,3H), 1,67-1,63(m,6H), 1,36-1,35(m,2H)

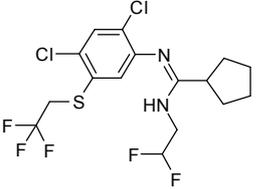
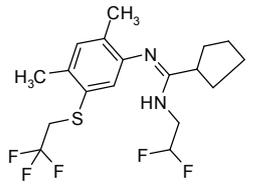
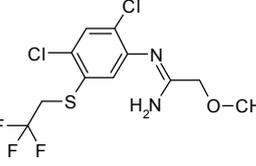
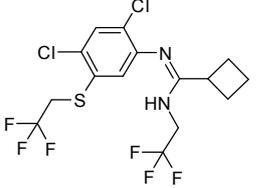
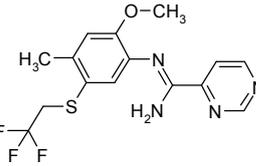
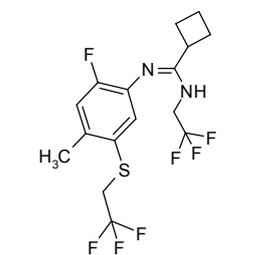
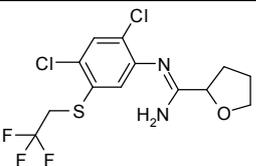
(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
Ia-242		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,65(d,2H), 7,38(d,2H), 6,84(d,1H), 6,73(d,1H), 3,53(q,2H), 3,11(ancho, 3H), 2,73(ancho, 3H), 2,17(s,3H)
Ia-243		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,65(s,1H), 7,20(s,1H), 7,03-7,01(m,1H), 4,36(t,2H), 3,80(q,2H), 3,50(ancho, 2H), 2,31(s,3H)
Ia-244		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,04(s,1H), 7,95(s,1H), 6,63(s,1H), 4,32(q,2H), 1,88(s,2H), 1,41-1,34(m,1H), 0,83-0,67(m,4H)
Ia-245		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,68-7,60(m,2H), 7,54-7,49(m,1H), 7,40(d,1H), 6,85(d,1H), 6,66(d,1H), 3,55-3,43(m,2H), 3,12(ancho, 3H), 2,63(ancho, 3H), 2,17(s,3H)
Ia-247		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,09-7,04(m,2H), 6,40-6,39(m,1H), 4,60-4,55(m,1H), 3,84(q,2H), 3,49-2,04(m,6H), 1,37-1,36(m,1H), 0,86-0,83(m,2H), 0,65-0,61(m,2H)
Ia-248		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,56-8,55(m,1H), 7,79-7,75(m,2H), 7,47(s,1H), 7,42-7,39(m,2H), 6,86(s,1H), 3,89(q,2H), 2,81(d,3H)

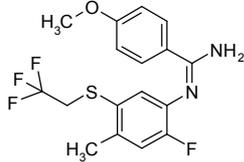
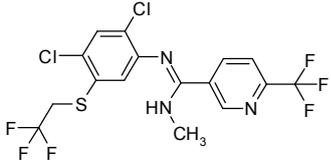
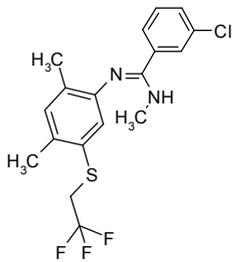
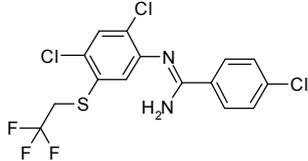
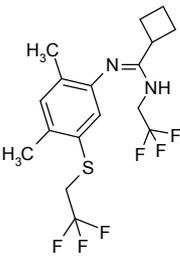
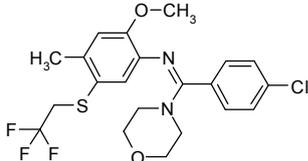
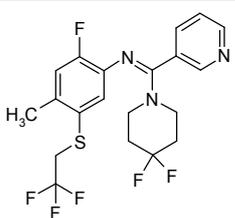
(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
Ia-249		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,74-7,72(m,1H), 7,50-7,48(m,1H), 6,61(s,1H), 4,08(q,2H), 2,44(s,3H), 1,91(s,3H), 1,46-1,40(m,1H), 0,82-0,68(m,4H)
Ia-250		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,64(d,2H), 7,46(d,1H), 7,39(d,2H), 6,88(d,1H), 7,76(d,1H), 3,53(q,2H), 2,89(d,3H), 2,20(s,3H),
Ia-251		logP(HCOOH)=2,23
Ia-252		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,29-7,27(m,2H), 7,10-7,08(m,2H), 6,59(m,2H), 3,60(s,3H), 3,46(q,2H), 2,87(ancho, 6H), 2,22(s,3H)
Ia-253		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,59(s,1H), 7,14(s,1H), 6,85(ancho, 1H), 6,20(tt,1H), 4,11(q,2H), 3,57-3,47(m,2H), 1,34(m,1H), 0,86-0,82(m,2H), 0,69-0,64(m,2H)
Ia-254		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,58(s,1H), 7,27(ancho, 1H), 6,96(s,1H), 4,14-4,02(m,4H), 2,46-2,44(m,1H), 1,67-1,63(m,6H), 1,39-1,38(m,2H)
Ia-255		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 6,87(s,1H), 6,81(s,1H), 5,98(ancho, 2H), 3,72(q,2H), 3,69(s,3H), 2,37(s,3H), 1,57-1,54(m,2H), 1,27-1,24(m,2H)

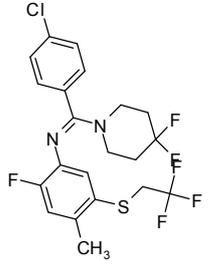
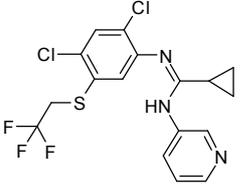
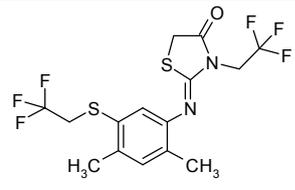
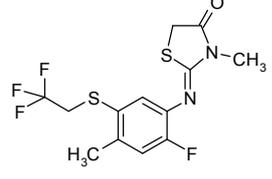
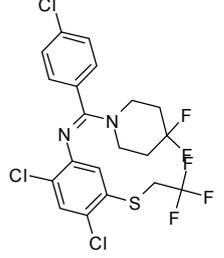
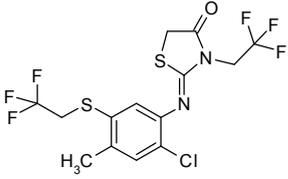
(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
Ia-256		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,58(s,1H), 7,23(ancho, 1H), 7,04(s,1H), 6,23(tt,1H), 4,12(q,2H), 3,62-3,52(m,2H), 2,45-2,41(m,1H), 1,68-1,60(m,6H), 1,39-1,37(m,2H)
Ia-257		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,00(s,1H), 6,79(ancho, 1H), 6,68(s,1H), 6,16(tt,1H), 3,78(q,2H), 3,57(m,2H), 2,49(m,1H), 2,28(s,3H), 1,93(s,3H), 1,68-1,61(m,6H), 1,35-1,34(m,2H)
Ia-258		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,56(s,1H), 7,05(s,1H), 6,32(ancho, 2H), 4,09(q,2H), 3,98-3,96(m,2H), 3,33(s,3H)
Ia-259		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,55(s,1H), 7,34(ancho, 1H), 6,99(s,1H), 4,14-4,02(m,4H), 3,26-3,17(m,1H), 2,12-1,56(m,6H)
Ia-260		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 9,30-9,29(m,1H), 8,97-8,96(m,1H), 8,26-8,25(m,1H), 7,01(s,1H), 6,96(s,1H), 6,60(ancho, 2H), 3,75(q,2H), 3,73(s,3H), 2,42(s,3H)
Ia-261		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,22(t,1H), 7,06-7,03(m,1H), 6,90-6,88(m,1H), 4,10-4,01(m,2H), 3,82(q,2H), 3,20-3,16(m,1H), 2,32(s,3H), 2,11-2,06(m,2H), 1,79-1,59(m,4H)
Ia-262		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,56(s,1H), 7,06(s,1H), 6,26(ancho, 2H), 4,39(m,1H), 4,09(q,2H), 3,98-3,92(m,1H), 3,77-3,75(m,1H), 2,17-2,08(m,2H), 1,92-1,86(m,2H)

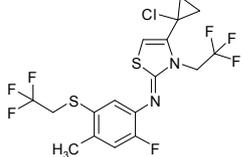
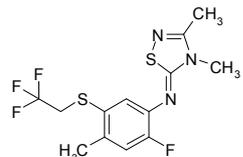
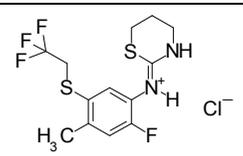
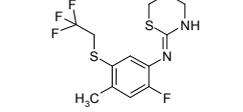
(continuación)

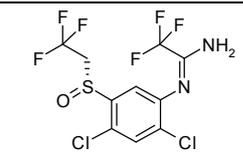
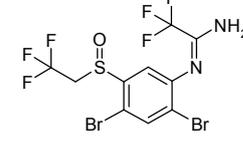
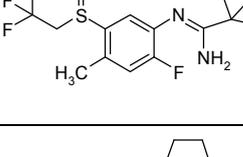
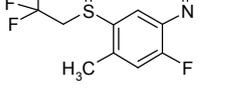
Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
Ia-263		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,94(d,2H), 7,13-7,07(m,2H), 6,97(d,2H), 6,44(ancho, 2H), 3,86(q,2H), 3,81(s,3H), 2,35(s,3H)
Ia-264		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,59(s,1H), 7,88-7,82(m,3H), 7,48(s,1H), 6,91(s,1H), 3,87(q,2H), 2,93(d,3H)
Ia-265		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,34-7,01(m,5H), 6,89(s,1H), 6,41(s,1H), 3,39(q,2H), 2,86(ancho, 3H), 2,18(s,3H), 2,07(s,3H)
Ia-266		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,03-7,99(m,2H), 7,62(s,1H), 7,53-7,51(m,2H), 7,15(s,1H), 6,75(ancho, 2H), 4,13(q,2H)
Ia-267		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,02(t,1H), 6,98(s,1H), 6,63(s,1H), 4,11-4,02(m,2H), 3,78(q,2H), 3,14(m,1H), 2,28(s,3H), 2,12-2,04(m,2H), 1,91(s,3H), 1,75-1,59(m,4H)
Ia-268		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,30-7,28(m,2H), 7,14-7,11(m,2H), 6,64-6,62(m,2H), 3,63(m,6H), 3,59(s,3H), 3,48(q,2H), 3,34-3,29(ancho, 2H), 2,23(s,3H)
Ia-269		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,48-8,46(m,1H), 8,40-8,39(m,1H), 7,67-7,65(m,1H), 7,33-7,30(m,1H), 6,90-6,83(m,2H), 3,66(q,2H), 3,59-3,49(m,4H), 2,18(s,3H), 2,15-2,06(m,4H)

(continuación)

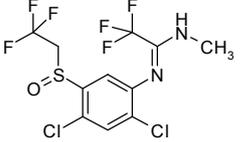
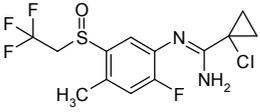
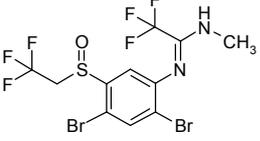
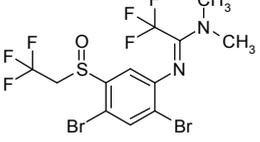
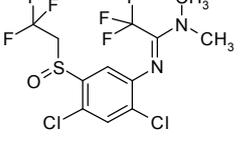
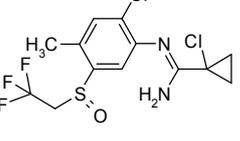
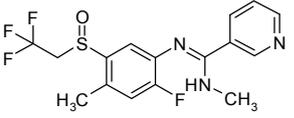
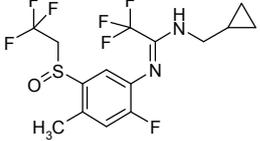
Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
Ia-270		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,37-7,35(m,2H), 7,25-7,23(m,2H), 6,87-6,82(m,2H), 3,61(q,2H), 3,47(m,4H), 2,19(s,3H), 2,03(m,4H)
Ia-271		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,14(m,1H), 8,02(m,1H), 7,86-7,83(m,2H), 7,23-7,22(m,1H), 7,15-7,14(m,1H), 4,26-4,18(m,2H), 1,52(m,1H), 1,28(m,2H), 0,85-0,83(m,2H)
Ia-272		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,17(s,1H), 7,00(s,1H), 4,59(q,2H), 4,18(s,2H), 3,81(q,2H), 2,33(s,3H), 2,04(s,3H)
Ia-273		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,26-7,23(m,2H), 4,09(s,2H), 3,87(q,2H), 3,17(s,3H), 2,37(s,3H)
Ia-274		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,44(m,1H), 7,39-7,37(m,2H), 7,28-7,26(m,2H), 6,92(s,1H), 3,90-3,83(q,2H), 3,60(m,4H), 2,06(m,4H)
Ia-275		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,47(s,1H), 7,20(s,1H), 4,60(q,2H), 4,25(s,2H), 3,94(q,2H), 2,35(s,3H)

(continuación)

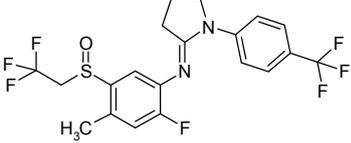
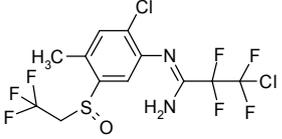
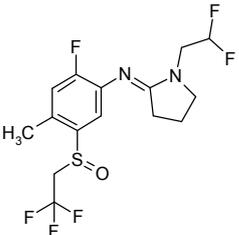
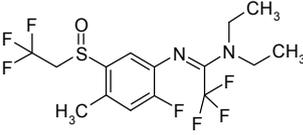
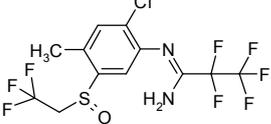
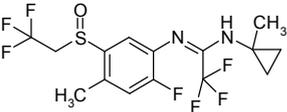
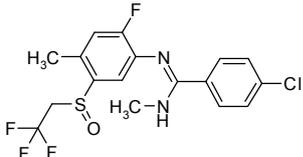
Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
1a-276		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,24-7,19(m,2H), 6,72(s,1H), 4,93(q,2H), 3,86(q,2H), 2,36(s,3H), 1,52-1,44(m,4H)
1a-277		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,24-7,19(m,2H), 3,86(q,2H), 3,44(s,3H), 2,36(s,6H)
1a-278		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,65-7,64(m,1H), 7,42-7,40(m,1H), 4,02-3,96(q,2H), 3,45(t,2H), 3,41(ancho, 1H), 3,27(t,2H), 2,41(s,3H), 2,09-2,05(m,2H)
1a-279		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,55(ancho, 1H), 7,05(s,1H), 7,02(s,1H), 3,83-3,75(q,2H), 3,26-3,23(m,2H), 2,97-2,94(m,2H), 2,31(s,3H), 1,96-1,90(m,2H).

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
1b-17		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,87(s,1H), 7,54(ancho, 2H), 7,33(s,1H), 4,18-4,10(m,2H)
1b-18		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,10(s,1H), 7,80-7,30(ancho, 1H), 7,29(s,1H), 4,16-4,05(m,2H)
1b-19		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,29-7,27(m,1H), 7,18-7,15(m,1H), 6,74(ancho, 2H), 4,06-3,98(m,2H), 2,30(s,3H), 1,39-1,29(m,4H)
1b-20		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,27(d,1H), 7,14(d,1H), 4,09-3,98(m,2H), 3,34-3,33(m,2H), 2,90(s,3H), 2,38-2,22(m,5H), 1,93-1,88(m,2H)

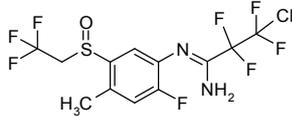
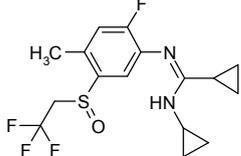
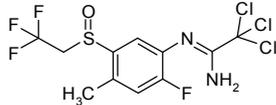
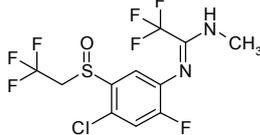
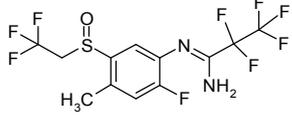
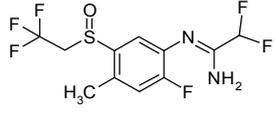
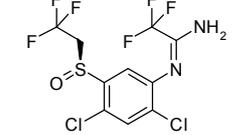
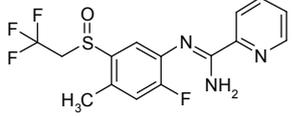
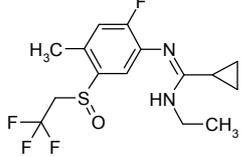
(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
Ib-21		logP(HCOOH)=3,32, logP(neutral)=3,32)
Ib-22		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,27-7,24(m,1H), 7,19-7,16(m,1H), 6,57(ancho, 2H), 4,05-3,97(m,2H), 2,31(s,3H), 1,57(m,2H), 1,31-1,28(m,2H)
Ib-23		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,28(d,1H), 7,21(d,1H), 4,14-3,98(m,2H), 3,48-3,43(m,2H), 2,97(s,3H), 2,31(s,3H), 1,15(t,3H)
Ib-24		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,41(ancho, 1H), 8,04(s, 1H), 7,27(s,1H), 4,25-4,02(m,2H), 2,66(ancho, 3H)
Ib-25		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,03(s,1H), 7,22(s,1H), 4,23-4,05(m,2H), 3,03(ancho, 3H) y 3H bajo el pico de DMSO
Ib-26		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,83(s,1H), 7,25(s,1H), 4,16-4,12(m,1H), 4,27-4,21(m,1H), 3,04(s,6H)
Ib-27		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,41(m,1H), 7,23(m,1H), 6,53(ancho, 2H), 4,06-3,97(m,2H), 2,29(s,3H), 1,62-1,59(m,2H), 1,32-1,29(m,2H)
Ib-28		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,50-8,49(m,1H), 8,38(ancho, 1H), 7,66-7,60(m,2H), 7,34-7,31(m,1H), 7,16-7,14(m,1H), 6,96-6,93(m,1H), 3,97-3,88(m,1H), 3,76-3,70(m,1H), 2,91-2,90(d,3H), 2,20(s,3H)
Ib-29		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,40(s,broad,1H), 7,28(d,1H), 7,21(d,1H), 4,15-4,06(m,1H), 4,00-3,94(m,1H), 3,08(s,broad,2H), 2,31(s,3H), 1,09(s,broad,1H), 0,46-0,44(m,2H), 0,22(s,broad,2H)

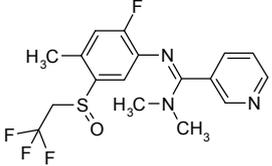
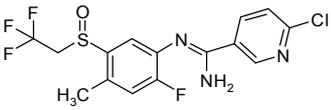
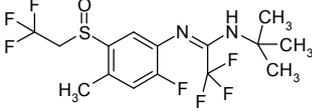
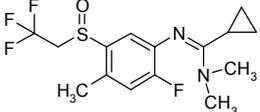
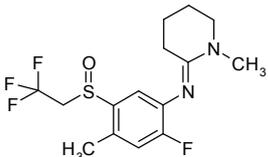
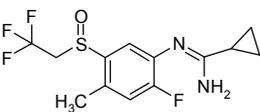
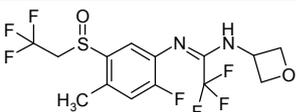
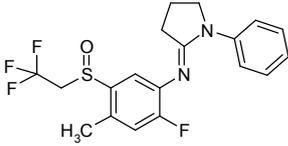
(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
Ib-30		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,12(d,2H), 7,73(d,2H), 7,41(d,1H), 7,26(d,1H), 4,15-4,05(m,2H), 3,96(t,2H), 2,69-2,50(m,4H), 2,34(s,3H), 2,09-2,02(m,2H)
Ib-31		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,50(s,1H), 7,40(ancho, 2H), 7,28(s,1H), 4,10-4,02(q,2H), 2,32(s,3H)
Ib-32		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,68(d,1H), 7,32(d,1H), 4,28-4,10(m,2H), 3,05(s,6H)
Ib-33		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,33-7,31(m,1H), 7,19-7,16(m,1H), 6,26(tt,1H), 4,12-3,98(m,2H), 3,87-3,78(dt,2H), 3,52-3,48(m,2H), 2,35(m,2H), 2,30(s,3H), 1,98-1,90(m,2H)
Ib-34		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,27(d,1H), 7,21(d,1H), 4,15-3,98(m,2H), 3,45-3,40(m,4H), 2,30(s,3H), 1,18-1,14(m,6H)
Ib-35		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,51(s,1H), 7,45(ancho, 2H), 7,29(s,1H), 4,11-4,01(m,2H), 2,32(s,3H)
Ib-36		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,48(s,1H), 7,30(d,1H), 7,21(d,1H), 4,15-3,95(m,2H), 2,31(s,3H), 1,33-1,24(m,3H), 0,77(s,2H), 0,57(s,2H)
Ib-37		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,52(ancho, 1H), 7,37-7,35(m,2H), 7,22-7,20(m,2H), 7,06-7,04(m,1H), 6,97-6,95(m,1H), 3,92-3,83(m,1H), 3,64-3,58(m,1H), 2,89-2,88(d,3H), 2,20(s,3H)

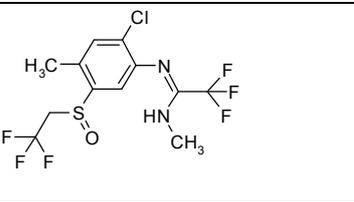
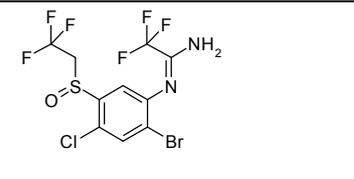
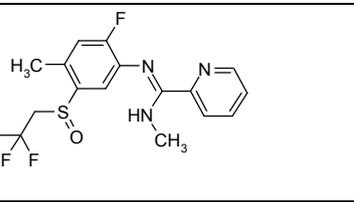
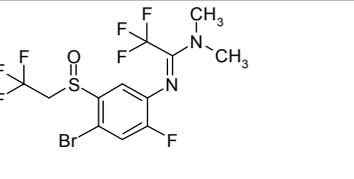
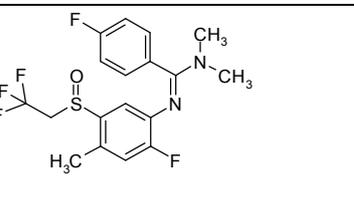
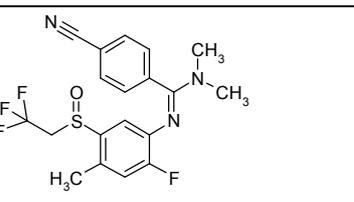
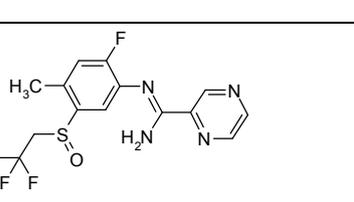
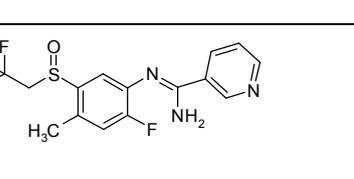
(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
Ib-38		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,50(ancho, 2H), 7,34-7,32(m,1H), 7,28-7,25(m,1H), 4,21-4,02(m,2H), 2,34(s,3H)
Ib-39		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,26-7,25(m,1H), 7,13-7,11(m,1H), 6,45(ancho, 1H), 4,05-3,96(m,2H), 2,29(s,3H), 2,21-2,18(m,1H), 1,87-1,84(m,1H), 0,81-0,80(m,2H), 0,66-0,54(m,4H), 0,44(m,2H)
Ib-40		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,34-7,32(m,1H), 7,29-7,26(m,1H), 7,23(ancho, 2H), 4,13-4,01(m,2H), 2,34(s,3H)
Ib-41		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,48 (s ancho,1H.), 7,68(d,1H), 7,32(d,1H), 4,28-4,05(m,2H), 2,72 (s ancho,3H)
Ib-42		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,55(ancho, 2H), 7,35-7,33(m, 1H), 7,29-7,26(m,1H), 4,12-4,01(m,2H), 2,34(s,3H)
Ib-43		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,22-8,20(m,1H), 7,44-7,41(m, 1H), 6,49(tt,1H), 4,21-3,93(m,2H), 2,36(s,3H)
Ib-44		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,87(s,1H), 7,54(ancho, 2H), 7,33(s,1H), 4,18-4,10(m,2H)
Ib-45		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,66-8,65(m,1H), 8,33-8,31(m,1H), 8,00-7,95(m,1H), 7,60-7,57(m,1H), 7,46-7,44(m, H), 7,27-7,24(m,1H), 6,95(ancho, 2H), 4,11-4,03(q,2H), 2,35(s,3H)
Ib-46		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,28-7,26(m,1H), 7,15-7,12(m, 1H), 6,30(ancho, 1H), 4,02(m,2H), 3,19(m,2H), 2,29(s,3H), 1,90(m,1H), 1,08(t,3H), 0,85-0,81(m,2H), 0,64-0,62(m,2H)

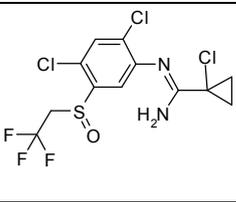
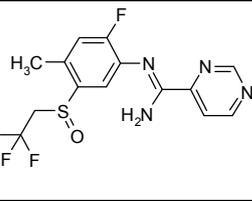
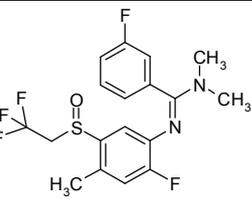
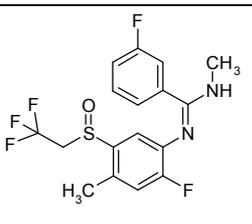
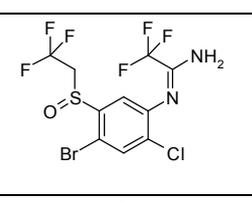
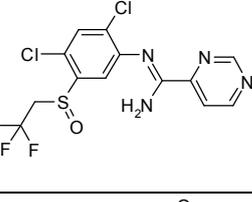
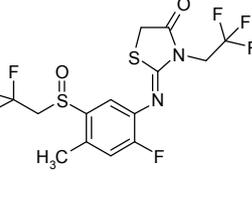
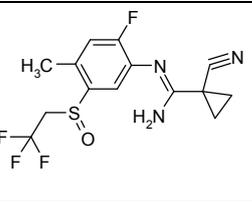
(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
Ib-47		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,48-8,46(m,1H), 8,32(ancho, 1H), 7,65(ancho, 1H), 7,36-7,33(m,1H), 7,07-7,05(m,1H), 6,93-6,90(m,1H), 3,92-3,83(m,1H), 3,68-3,61(m,1H), 3,13(ancho, 3H), 2,81(ancho, 3H), 2,16(s,3H)
Ib-48		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,96-8,95(m,1H), 8,38-8,35(m,1H), 7,65-7,63(m,1H), 7,43-7,41(m,1H), 7,27-7,24(m,1H), 7,00(ancho, 2H), 4,10-4,02(q,2H), 2,35(s,3H)
Ib-49		logP(HCOOH)=3,22, logP(neutro)=3,12
Ib-50		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,40(s,1H), 7,25-7,19(m,2H), 4,11-4,08(m,1H), 4,00-3,97(m,1H), 2,30(s,3H), 1,42(s,9H)
Ib-51		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,24-7,22(m,1H), 7,11-7,08(m,1H), 4,11-3,92(m,2H), 3,08(s,6H), 2,30(s,3H), 1,66(m,1H), 0,68-0,63(m,2H), 0,32-0,30(m,1H), 0,23-0,21(m,1H)
Ib-52		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,20(d,1H), 7,13(d,1H), 4,09-3,97(m,2H), 3,32(s,3H), 3,28(t,2H), 2,22(s,3H), 2,20-2,05(m,2H), 1,78-1,72(m,2H), 1,62-1,56(m,2H)
Ib-53		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,15-7,12(m,1H), 6,94-6,92(m,1H), 4,06-3,88(m,2H), 2,32(s,3H), 1,55(m,1H), 0,88-0,84(m,2H), 0,74(m,2H)
Ib-54		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,97(ancho, 1H), 7,30-7,22(m,2H), 4,77(ancho, 2H), 4,59(ancho, 3H), 4,19-4,07(m,1H), 3,97(ancho, 1H), 2,32(s,3H)
Ib-55		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,86(d,2H), 7,37(m,3H), 7,22(d,1H), 7,09(dd,1H), 4,14-4,02(m,2H), 3,73(dd,2H), 2,67-2,57(m,2H), 2,33(s,3H), 2,07-1,99(m,2H)

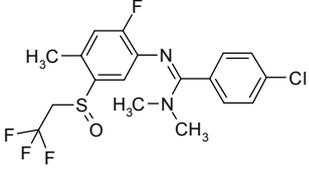
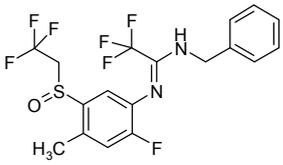
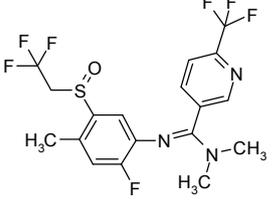
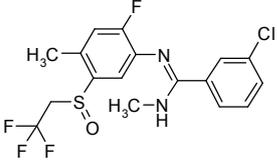
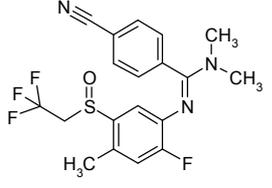
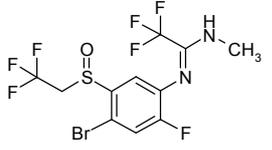
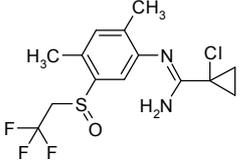
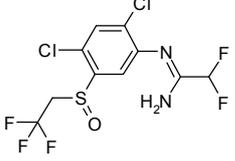
(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
Ib-56		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 2,30(s,3H), 2,62(ancho, 3H), 4,17-3,95(m,2H), 7,28(beat,1H), 7,44(s,1H), 8,22(ancho, 1H)
Ib-57		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,32(s,1H), 7,40-7,36(ancho, 1H), 7,29(s,1H), 4,19-4,14(m,2H)
Ib-58		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,56-8,55(m,1H), 7,77-7,73(m,1H), 7,69(ancho, 1H), 7,41-7,38(m,2H), 7,10-7,08(m,1H), 7,02-6,99(m,1H), 3,97-3,91(m,1H), 3,73-3,67(m,1H), 2,84-2,83(d,3H), 2,23(s,3H)
Ib-59		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,78(d,1H), 7,32(d,1H), 4,20-4,06(m,2H), 3,05(s,3H)
Ib-60		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,29-7,12(m,4H), 6,97(d,1H), 6,93(d,1H), 3,88-3,79(m,1H), 3,62-3,50(m,1H), 3,11(ancho, 3H), 2,79-2,77(ancho, 3H), 2,17(s,3H)
Ib-61		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,81-7,79(m,2H), 7,46(ancho, 1H), 7,29(ancho, 1H), 6,98(d,1H), 6,94(d,1H), 3,88-3,79(m,1H), 3,63-3,52(m,1H), 3,14(ancho, 3H), 2,76(ancho, 3H), 2,16(s,3H)
Ib-62		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 9,46-9,45(m,1H), 8,84(m,1H), 8,74-8,73(m,1H), 7,48-7,46(m,1H), 7,29-7,26(m,1H), 7,12(ancho, 2H), 4,12-4,04(m,2H), 2,36(s,3H)
Ib-63		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 9,13(s,1H), 8,70-8,69(m,1H), 8,32-8,30(m,1H), 7,52-7,49(m,1H), 7,43-7,41(m,1H), 7,26-7,23(m,1H), 6,94(ancho, 2H), 4,11-4,03(m,2H), 2,35(s,3H)

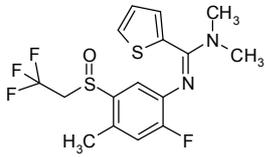
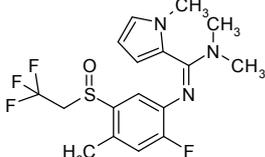
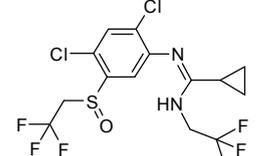
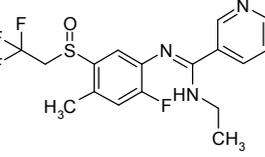
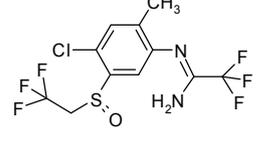
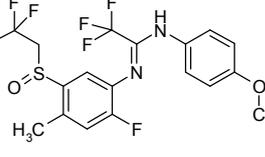
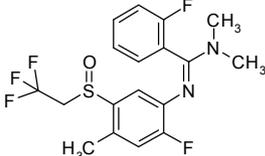
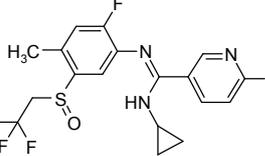
(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
Ib-64		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,84(m,1H), 7,35(m,1H), 6,85(ancho, 2H), 4,16-4,08(m,2H), 1,65(m,2H), 1,37(m,2H)
Ib-65		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 9,34(m,1H), 9,01-9,00(m,1H), 8,28-8,27(m,1H), 7,47-7,45(m,1H), 7,29-7,25(m,1H), 7,16(ancho, 2H), 4,12-4,01(m,2H), 2,36(s,3H)
Ib-66		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,38-7,33(m,1H), 7,15-7,10(m,1H), 7,03(ancho, 2H), 6,98-6,92(m,2H), 3,89-3,82(m,1H), 3,61-3,55(m,1H), 3,12(ancho, 3H), 2,83(ancho, 3H), 2,17(s,3H)
Ib-67		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,56-7,54(m,1H), 7,36-7,30(m,1H), 7,19-6,95(m,5H), 3,94-3,85(m,1H), 3,70-3,64(m,1H), 2,89-2,88(m,3H), 2,21(s,3H)
Ib-68		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,99(s,1H), 7,63(ancho, 2H), 7,32(s,1H), 4,18-4,06(m,2H)
Ib-69		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 9,35(m,1H), 9,03-9,02(m,1H), 8,32-8,28(m,1H), 7,87(s,1H), 7,41(s,1H), 7,08(ancho, 2H), 4,19-4,11(m,2H)
Ib-71		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,51(d,1H), 7,38(d,1H), 4,62-4,57(m,2H), 4,26-4,14(m,3H), 4,04-3,94(m,1H), 2,36(s,3H)
Ib-72		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,29-7,27(m,1H), 7,21-7,18(m,1H), 6,42(ancho, 2H), 4,07-3,99(m,2H), 2,32(s,3H), 1,68-1,59(m,4H)

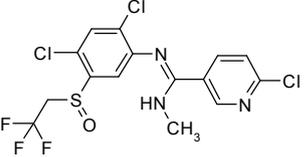
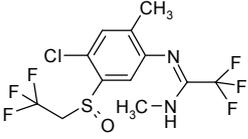
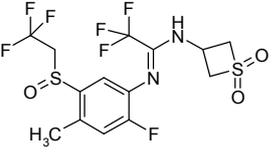
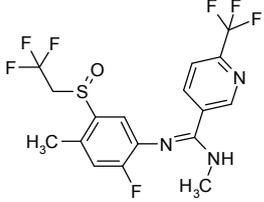
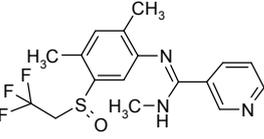
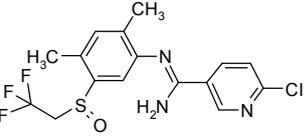
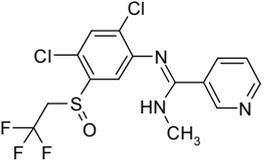
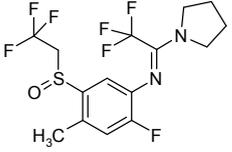
(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
Ib-73		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,3-6,93(m,6H), 3,88-3,79(m,1H), 3,58-3,47(m,1H), 3,10(ancho, 3H), 2,78(ancho, 3H), 2,17(s,3H)
Ib-74		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,87(ancho, 1H), 7,33-7,16(m,7H), 4,47(ancho, 2H), 4,12-4,06(m,1H), 3,90(ancho, 1H), 2,30(s,3H)
Ib-75		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,49(m,1H), 8,09(m,1H), 7,90-7,88(m,1H), 7,03-6,96(m,2H), 3,90-3,84(m,1H), 3,56-3,50(m,1H), 3,17(ancho, 3H), 2,80(ancho, 3H), 2,17(s,3H)
Ib-76		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,57-7,56(q,1H), 7,40-7,38(m,1H), 7,31-7,27(m,2H), 7,13-7,08(m,2H), 6,98-6,95(m,1H), 3,92-3,83(m,1H), 3,70-3,63(m,1H), 2,89-2,87(d,3H), 2,21(s,3H)
Ib-77		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,81-7,79(m,2H), 7,46(ancho, 1H), 7,29(ancho, 1H), 6,98(d,1H), 6,94(d,1H), 3,88-3,79(m,1H), 3,63-3,52(m,1H), 3,14(ancho, 3H), 2,75(ancho, 3H), 2,16(2,3H)
Ib-78		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,49(ancho, 1H), 7,78(d,1H), 7,33(d,1H), 4,24-4,02(m,2H), 2,73(ancho, 3H)
Ib-79		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,11(s,1H), 7,08(s,1H), 6,19(ancho, 2H), 4,00-3,92(m,2H), 2,27(s,3H), 2,00(s,3H), 1,58(m,2H), 1,30-1,29(m,2H)
Ib-80		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,8(s,1H), 7,30(s,1H), 7,15(ancho, 2H), 6,40(t,1H), 4,18-4,10(m,2H)

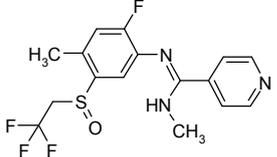
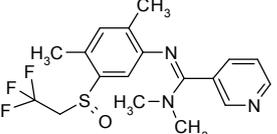
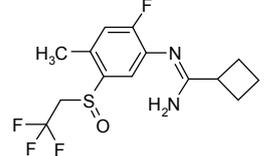
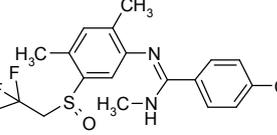
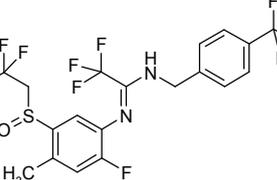
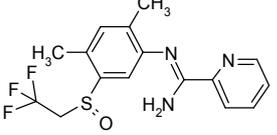
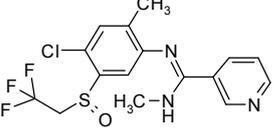
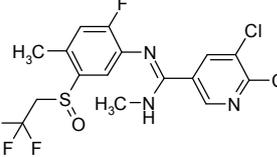
(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
Ib-81		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,61-7,60(m,1H), 7,04-6,97(m,4H), 3,92-3,86(m,1H), 3,65-3,52(m,1H), 3,02(s,6H), 2,20(s,3H)
Ib-82		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 6,96-6,91(m,2H), 6,70(ancho, 1H), 5,90(ancho, 2H), 3,83-3,74(m,2H), 3,18(s,6H), 2,21(ancho, 6H)
Ib-83		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,78(s,1H), 7,26(m,1H), 7,01(ancho, 1H), 4,22-4,01(m,4H), 1,40-1,38(m,1H), 0,96-0,86(m,2H), 0,78-0,71(m,2H)
Ib-84		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,50-8,48(m,1H), 8,38(m,1H), 7,65-7,59(m,2H), 7,33-7,30(m,1H), 7,15-7,13(m,1H), 6,95-6,92(m,1H), 3,97-3,88(m,1H), 3,79-3,70(m,1H), 3,44-3,37(m,2H), 2,20(s,3H), 1,22(t,3H)
Ib-85		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,52-7,51(m,1H), 7,3(ancho, 2H), 7,18(s,1H), 4,16-4,02(m,2H), 2,10(s,3H)
Ib-86		logP(HCOOH)=3,04, logP(neutro)=3,05
Ib-87		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,35-6,92(m,6H), 3,85-3,79(m,1H), 3,58-3,51(m,1H), 3,16(ancho, 3H), 2,79(ancho, 3H), 2,16(s,3H)
Ib-88		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,22(m,1H), 7,80(m,1H), 7,66(m,1H), 7,48-7,46(m,1H), 7,20-7,21(m,1H), 7,01-6,98(m,1H), 4,05-3,93(m,1H), 3,80(m,1H), 2,93(m,1H), 2,22(s,3H), 0,73(m,2H), 0,59(m,2H)

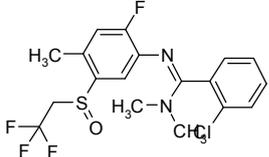
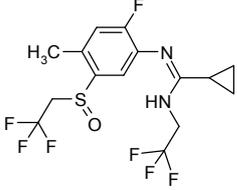
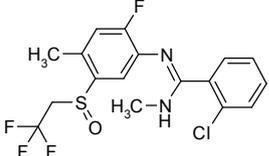
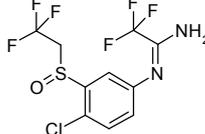
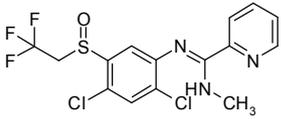
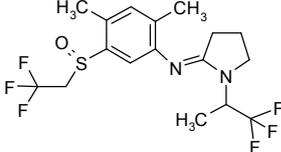
(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
Ib-89		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,28-8,27(m,1H), 7,90(ancho, 1H), 7,67-7,64(m,2H), 7,50-7,48(m,1H), 7,03(s,1H), 4,17-4,05(m,1H), 3,89-3,80(m,1H), 2,92-2,91(d,3H)
Ib-90		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,09(ancho, 1H), 7,44(s,1H), 7,12(ancho, 1H), 4,18-4,05(m,2H), 2,68-2,63(ancho, 3H), 2,11(s,3H)
Ib-91		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 9,01(ancho, 1H), 7,38(d,1H), 7,24(d,1H), 4,58-4,57(m,2H), 4,35(ancho, 3H), 4,16-4,09(m,1H), 3,93(ancho, 1H), 2,32(s,3H)
Ib-92		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,60(s,1H), 7,84-7,81(m,3H), 7,13-7,11(m,1H), 7,02-6,99(m,1H), 3,97-3,88(m,1H), 3,67-3,61(m,1H), 2,94-2,93(d,3H), 2,21(s,3H)
Ib-93		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,46-8,45(m,1H) 8,32(ancho, 1H), 7,58-7,56(m,1H), 7,37-7,29(m,2H), 6,99(s,1H), 6,66(s,1H), 3,74-3,68(m,2H), 2,91-2,90(d,3H), 2,17(s,3H), 2,15(s,3H)
Ib-94		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,98-8,97(m,1H), 8,40-8,37(m,1H), 7,71-7,68(m,1H), 7,40-7,38(m,1H), 7,26-7,24(m,1H), 4,06-3,96(m,2H), 2,33(s,3H), 2,16(s,3H)
Ib-95		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,53-8,51(m,1H), 8,41(m,1H), 7,85(q,1H), 7,63(s,1H), 7,62-7,59(m,1H), 7,36-7,33(m,1H), 7,00(s,1H), 4,12-4,00(m,1H), 3,86-3,75(m,1H), 2,93-2,92(d,3H)
Ib-96		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,29(d,1H), 7,21(d,1H), 4,15-3,99(m,2H), 3,41(ancho, 4H), 2,31(s,3H), 1,86(ancho, 4H)

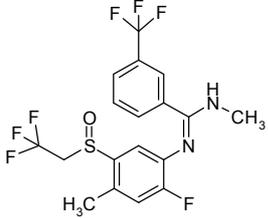
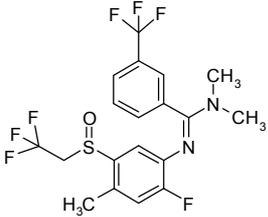
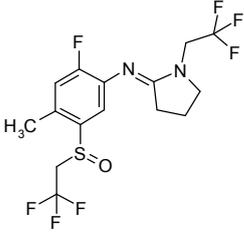
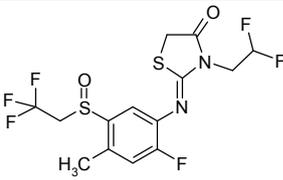
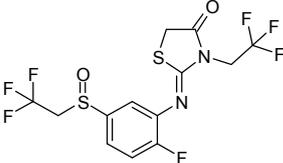
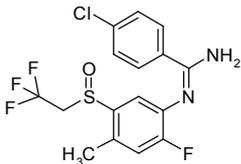
(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
Ib-97		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,52-8,50(m,1H), 7,65-7,64(q,1H), 7,19-7,12(m,3H), 6,97-6,95(m,1H), 3,96-3,87(m,1H), 3,74-3,68(m,1H), 2,90-2,89(d,3H), 2,20(s,3H)
Ib-98		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,44-8,43(m,1H), 8,32-8,29(m,1H), 7,60(m,1H), 7,35-7,31(m,1H), 6,94(s,1H), 6,66(s,1H), 3,70-3,64(m,1H), 3,30-3,24(m,1H), 2,96(ancho, 6H), 2,14(s,3H), 2,13(s,3H)
Ib-99		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,30-7,25(m,1H), 7,09(m,1H), 6,65(ancho, 2H), 4,07-4,02(m,2H), 2,97-2,93(m,1H), 2,33(s,3H), 2,22-1,71(m,6H)
Ib-100		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,35-7,15(m,4H), 6,98-6,96(m,2H), 6,61(s,1H), 3,69-3,63(m,1H), 3,22-3,17(m,1H), 2,88(ancho, 3H), 2,17(s,3H), 2,16(s,3H)
Ib-101		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,98(ancho, 1H), 7,72-7,70(m,2H), 7,52-7,51(ancho, 1H), 7,21-7,19(m,3H), 4,56(ancho, 2H), 4,13-4,06(m,1H), 3,93-3,90(m,1H), 2,28(s,3H)
Ib-102		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,66-8,64(m,1H), 8,37-8,32(m,1H), 7,99-7,95(m,1H), 7,59-7,56(m,1H), 7,27(s,1H), 7,19(s,1H), 6,60(ancho, 2H), 4,05-3,97(m,2H), 2,31(s,3H), 2,13(s,3H)
Ib-103		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,50-8,49(m,1H), 8,36(s,1H), 7,58-7,57(m,2H), 7,34-7,30(m,2H), 6,68(ancho, 1H), 3,91-3,82(m,1H), 3,59-3,53(m,1H), 2,92-2,91(d,3H), 2,20(s,3H)
Ib-104		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,16-8,14(m,2H), 7,78-7,77(ancho, 1H), 7,23-7,21(m,1H), 7,03-7,00(m,1H), 4,02-3,93(m,1H), 3,84-3,77(m,1H), 2,91-2,90(d,3H), 2,23(s,3H)

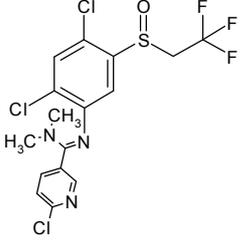
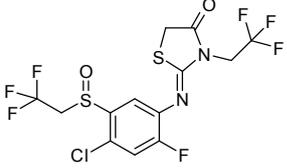
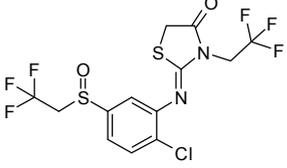
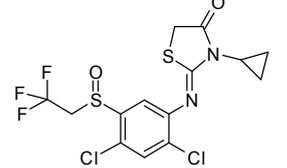
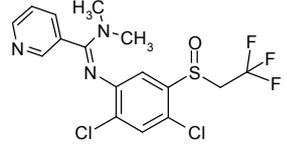
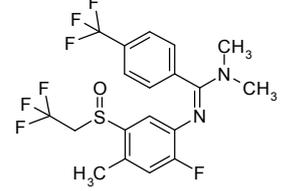
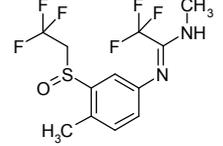
(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
Ib-105		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,46-6,94(m,6H), 3,85-3,74(m,1H), 3,54-3,48(m,1H), 3,17(ancho, 3H), 2,74(ancho, 3H), 2,15(s,3H)
Ib-106		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,29-7,27(m,1H), 7,20-7,17(m,1H), 6,84(ancho, 1H), 4,11-3,64(m,4H), 2,30(s,3H), 1,44-1,41(m,1H), 0,91-0,84(m,2H), 0,72-0,69(m,2H)
Ib-107		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,52-6,95(m,7H), 3,82-3,72(m,2H), 2,91-2,90(d,3H), 2,18(s,3H)
Ib-108		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,57(d,1H), 7,42(ancho, 2H), 7,30(d,1H), 7,10-7,07(m,1H), 4,22-4,04(m,2H)
Ib-109		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,57-8,55(m,1H), 7,91(ancho, 1H), 7,82-7,77(m,1H), 7,66(s,1H), 7,44-7,41(m,2H), 6,96(s,1H), 4,10-4,01(m,1H), 3,87-3,78(m,1H), 2,84-2,83(d,3H)
Ib-110		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,14(ancho, 1H), 7,48(d,1H), 7,22(d,1H), 7,03-7,00(m,1H), 4,25-4,01(m,2H), 3,67(ancho, 3H)
Ib-111		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,31-7,29(m,2H), 7,25(ancho, 2H), 6,98-6,95(m,1H), 4,09-4,00(m,2H), 2,33(s,3H)
Ib-112		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,09(m,2H), 5,17-5,13(m,1H), 4,03-3,93(m,2H), 3,51-3,45(m,1H), 3,32-3,30(m,1H), 2,43-2,07(m,2H), 2,27(s,3H), 2,06(s,3H), 1,95-1,88(m,2H), 1,40-1,38(d,3H)

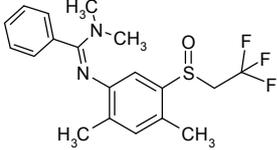
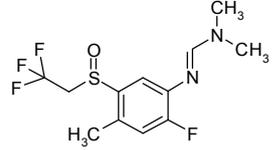
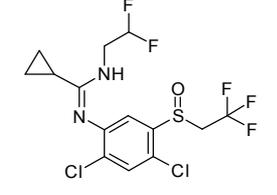
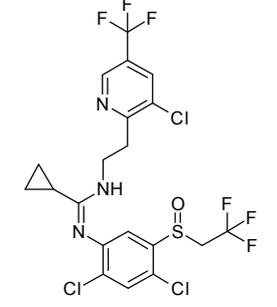
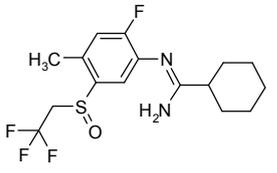
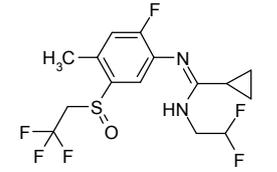
(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
Ib-113		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,70-7,61(m,2H), 7,57(s,1H), 7,53-7,44(m,2H), 7,12(d,1H), 7,65(d,1H), 3,87-3,77(m,1H), 3,66-3,54(m,1H), 2,90(d,3H), 2,19(s,3H)
Ib-114		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,65(d,2H), 7,54(t,1H), 7,39(ancho,1H), 7,04(ancho,1H), 6,92(d,1H), 3,83-3,70(m,2H), 3,14(ancho,3H), 3,28(ancho,3H), 2,16(s,3H)
Ib-115		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,31-7,29(m,1H), 7,20-7,17(m,1H), 4,27(q,2H), 4,12-4,00(m,2H), 3,52(t,2H), 2,47-2,25(m,2H), 2,31(s,3H), 2,00-1,92(m,2H)
Ib-116		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,57(d,1H), 7,37(d,1H), 6,33(tt,1H), 4,25-4,13(m,5H), 4,01-3,89(m,2H), 2,36(s,3H)
Ib-117		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,62-7,56(m,2H), 7,50-7,48(m,1H), 4,60(q,2H), 4,27-4,00(m,4H)
Ib-118		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,00(d,2H), 7,53(d,2H), 7,39(d,1H), 7,23(d,1H), 6,80(ancho,2H), 4,06(q,2H), 2,34(s,3H)

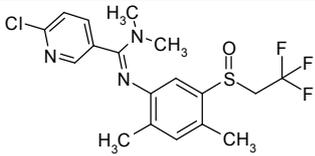
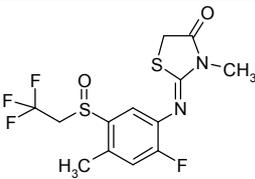
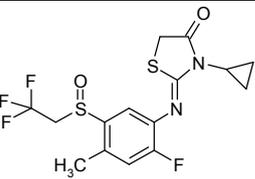
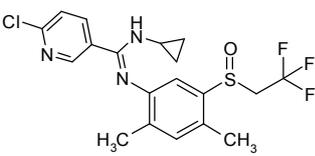
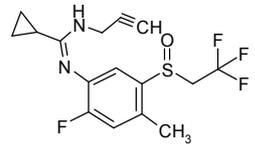
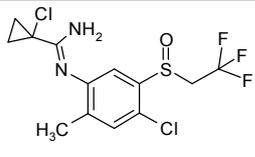
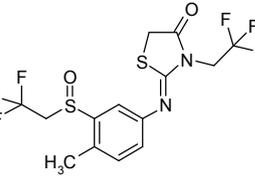
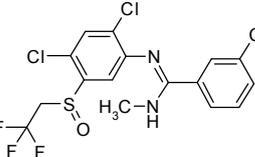
(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
Ib-119		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,23(ancho, 1H), 7,73-7,72(ancho, 1H), 7,62(s,1H), 7,52-7,50(m,1H), 6,97(s,1H), 4,14-4,02(m,1H), 3,82-3,70(m,1H), 3,00(ancho, 6H)
Ib-120		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,86(d,1H), 7,53(d,1H), 4,60(q,2H), 4,36-4,24(m,3H), 4,17-4,06(m,1H)
Ib-121		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,81(d,1H), 7,56(dd,1H), 7,47(d,1H), 4,61(q,2H), 4,31-4,07(m,4H)
Ib-122		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,96(s,1H), 7,51(s,1H), 4,36-4,24(m,1H), 4,14-4,00(m,3H), 2,75-2,70(m,1H), 1,02-0,92(m,4H)
Ib-123		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,50-8,49(m,1H), 8,36(m,1H), 7,67-7,64(m,1H), 7,60(s,1H), 7,39-7,36(m,1H), 6,96(s,1H), 4,05-3,96(m,1H), 3,78-3,66(m,1H), 3,05(ancho, 6H)
Ib-124		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,69(ancho, 2H), 7,54(ancho, 1H), 7,27(ancho, 1H), 6,97-6,14(m,2H), 3,84-3,70(m,1H), 3,43-3,30(m,1H), 3,15(ancho, 3H), 2,77(ancho, 3H), 2,16(s,3H)
Ib-125		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,02(ancho, 1H), 7,22-7,17(m,2H), 6,89(ancho, 1H), 4,12-4,06(m,1H), 3,92(ancho, 1H), 2,76(ancho, 3H), 2,30(s,3H)

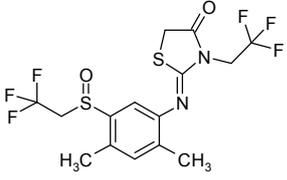
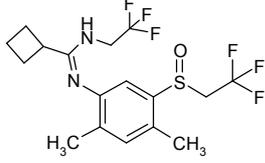
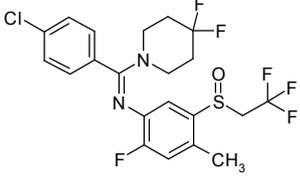
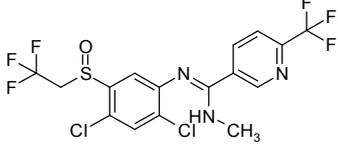
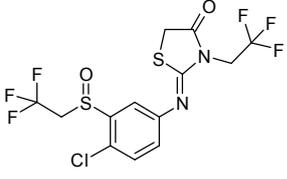
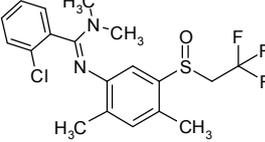
(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
Ib-126		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,27(m,3H), 7,12(ancho, 2H), 6,92(s,1H), 6,62(s,1H), 3,50(m,2H), 2,93(ancho, 6H), 2,16(s,3H), 2,13(s,3H)
Ib-127		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,57(s,1H), 7,34-7,30(m,3H), 7,16(m,2H), 6,86(s,1H), 3,97-3,85(m,1H), 3,61-3,49(m,1H), 3,05(ancho, 6H)
Ib-128		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,86(s,1H), 7,44(d,1H), 7,13(d,1H), 4,10-3,98(m,2H), 3,05 (s ancho,3H), 2,95 (s ancho,3H), 2,30 (s,3H)
Ib-129		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,78(s,1H), 7,34(s,1H), 6,95(ancho, 1H), 6,21(tt,1H), 4,22-4,07(m,2H), 3,59-3,52(m,2H), 1,37(m,1H), 0,90-0,87(m,2H), 0,73-0,71(m,2H)
Ib-130		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 8,88(s,1H), 8,39(m,1H), 7,73(s,1H), 7,27(s,1H), 6,66(m,1H), 4,21-4,05(m,2H), 3,68-3,59(m,2H), 2,50(m,2H), 1,34(m,1H), 0,82-0,81(m,2H), 0,68-0,66(m,2H)
Ib-131		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,73-7,72(m,1H), 7,45(m,1H), 4,19-3,97(m,2H), 2,40(s,3H), 1,93-1,19(m,10H)
Ib-132		RMN de <sup>1</sup> H (D6-DMSO): 7,35-7,33(m,1H), 7,19-7,16(m,1H), 6,75(ancho, 1H), 6,15(tt,1H), 4,11-3,96(m,2H), 3,60-3,50(m,2H), 2,31(s,3H), 1,40(ancho, 1H), 0,90-0,82(m,2H), 0,73-0,67(m,2H)

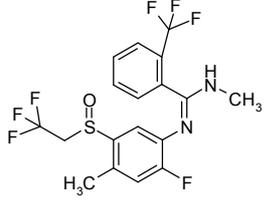
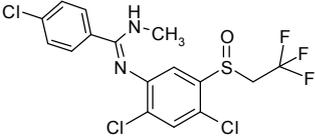
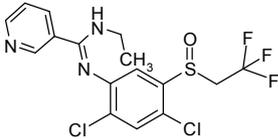
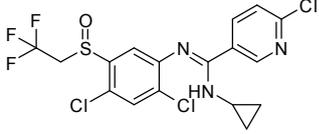
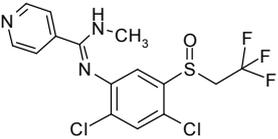
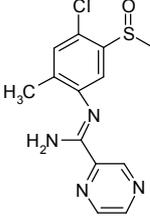
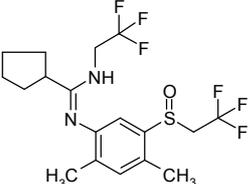
(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
Ib-133		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,15(ancho, 1H), 7,70(ancho, 1H), 7,48-7,46(m,1H), 6,96(s,1H), 6,63(s,1H), 3,77-3,71(m,1H), 3,35-3,26(m,1H), 2,96(ancho, 6H), 2,15(s,3H), 2,13(s,3H)
Ib-134		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,53(d,1H), 7,36(d,1H), 4,22-4,10(m,3H), 4,04-3,92(m,1H), 3,19(s,3H), 2,35(s,3H)
Ib-135		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,50(d,1H), 7,35(d,1H), 4,28-4,12(m,1H), 4,02-3,91(m,3H), 2,75-2,55(m,1H), 2,35(s,3H), 1,01-0,88(m,4H) - picos del isómero principal-
Ib-136		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,15(ancho, 1H), 7,60-7,44(m,3H), 7,01(s,1H), 6,70(s,1H), 3,79(m,2H), 2,90(m,1H), 2,19(s,3H), 2,16(s,3H), 0,72(m,2H), 0,58(m,2H)
Ib-137		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,90-7,86(m,1H), 7,65-7,63(m,1H), 6,66(s,1H), 4,30-4,16(m,2H), 1,95(d,2H), 1,41(m,1H), 0,81-0,70(m,4H)
Ib-138		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,90(s,1H), 7,41(s,1H), 6,41(ancho, 2H), 4,10-3,97(m,2H), 2,04(s,3H), 1,64-1,58(m,2H), 1,32-1,29(m,2H)
Ib-139		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,44(d,1H), 7,37(d,1H), 7,08(dd,1H), 4,58(q,2H), 4,23-4,11(m,3H), 4,00-3,88(m,1H), 2,35(s,3H)
Ib-140		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,77(ancho, 1H), 7,64(s, 1H), 7,43-7,41(m,1H), 7,34-7,30(m,2H), 7,09-7,07(m,1H), 6,97(s,1H), 4,08-3,96(m,1H), 3,81-3,70(m,1H), 2,90(d,3H)

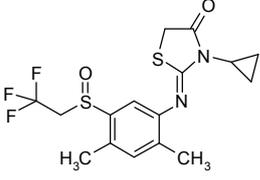
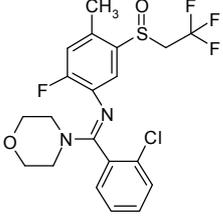
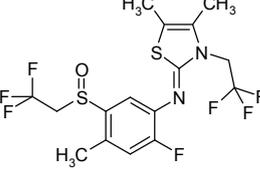
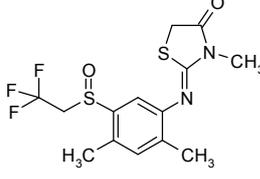
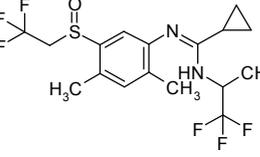
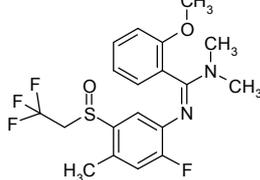
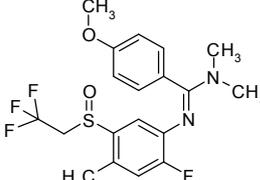
(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
Ib-141		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,34(s,1H), 7,26(s,1H), 4,61(q,2H), 4,20(s,2H), 4,19-4,07(m,1H), 3,91-3,79(m,1H), 2,31(s,3H), 2,14(s,3H)
Ib-142		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,13(t,1H), 7,07(s,1H), 6,92(s,1H), 4,15-3,88(m,4H), 3,16-3,12(m,1H), 2,26(s,3H), 2,17-2,05(m,2H), 2,00(s,3H), 1,80-1,60(m,4H)
Ib-143		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,40-7,38(m,2H), 7,29(ancho, 2H), 7,10-7,08(m,1H), 6,98-6,95(m,1H), 3,94-3,82(m,1H), 3,61-3,48(m,1H), 3,31(ancho, 4H), 2,18(s,3H), 2,06(ancho, 4H)
Ib-144		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,62(ancho, 1H), 7,99(ancho, 1H), 7,91-7,87(m,2H), 7,67(s,1H), 6,98(s,1H), 4,15-4,03(m,1H), 3,79-3,68(m,1H), 2,96-2,95(d,3H)
Ib-145		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,68(d,2H), 7,63(d,1H), 7,42(d,2H), 7,02-7,96(m,2H), 3,90-3,79(m,1H), 3,52-3,40(m,1H), 2,91(d,3H), 2,20(s,3H)
Ib-146		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,66(d,1H), 7,45(d,1H), 7,21(dd,1H), 4,59(q,2H), 4,30-4,21(m,3H), 4,14-4,04(m,1H)
Ib-147		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,47-7,20(m,4H), 6,94(s,1H), 6,80-6,76(m,1H), 3,64-3,51(m,1H), 3,19(ancho, 3H), 3,06-2,97(m,1H), 2,74(ancho, 3H), 2,21(d,3H), 2,13(s,3H)

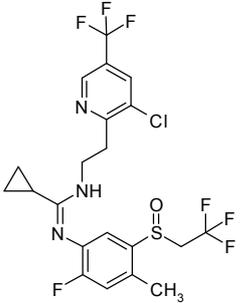
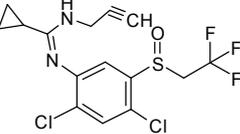
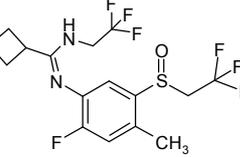
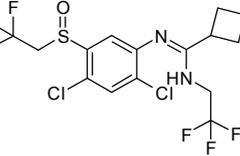
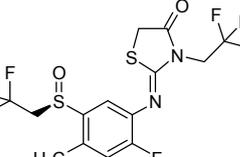
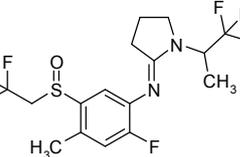
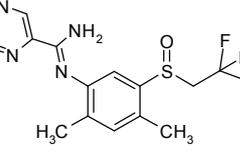
(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
Ib-148		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,70-7,43(m,5H), 7,00-6,95(m,2H), 3,90-3,70(m,1H), 3,47-3,24(m,1H), 2,89(d,3H), 2,16(s,3H)
Ib-149		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,73-7,72(ancho, 1H), 7,63(s,1H), 7,40-7,38(m,2H), 7,22-7,20(m,2H), 6,89(s,1H), 4,05-3,96(m,1H), 3,73-3,66(m,1H), 2,91-2,90(d,3H)
Ib-150		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,52-8,51(m,1H), 8,40(m,1H), 7,85(t,1H), 7,63(s,1H), 7,61-7,58(m,1H), 7,35-7,32(m,1H), 6,97(s,1H), 4,11-4,00(m,1H), 3,83-3,76(m,1H), 3,43(m,2H), 1,25(t,3H)
Ib-151		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,33(ancho, 1H), 7,98(ancho, 1H), 7,72(ancho, 1H), 7,66(s,1H), 7,50-7,48(m,1H), 7,13(ancho, 1H), 4,16-4,07(m,1H), 3,96-3,88(m,1H), 2,77(ancho, 1H), 0,66-0,62(m,4H)
Ib-152		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,55-8,53(m,2H), 7,85-7,84(m,1H), 7,64(s,1H), 7,19-7,18(m,2H), 6,97(s,1H), 4,09-4,00(m,1H), 3,83-3,74(m,1H), 2,92-2,90(d,3H)
Ib-153		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 9,50(s,1H), 8,84-8,83(m,1H), 8,74-8,73(m,1H), 7,51(s,1H), 7,30(s,1H), 6,95(ancho, 2H), 4,16-4,02(m,2H), 2,18(s,3H)
Ib-154		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,36-7,34(m,2H), 7,15(ancho, 2H), 6,93(s,1H), 6,60(s,1H), 3,67-3,60(m,1H), 3,21-3,14(m,1H), 2,94(ancho, 6H), 2,14(s,6H)
Ib-155		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,09(s,1H), 6,99(t,1H), 6,93(s,1H), 4,13-3,84(m,4H), 2,49(m,1H), 2,26(s,3H), 2,00(s,3H), 1,68-1,67(ancho, 6H), 1,38-1,37(ancho, 2H)

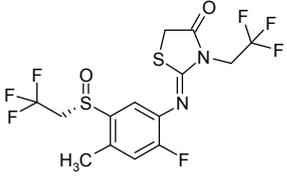
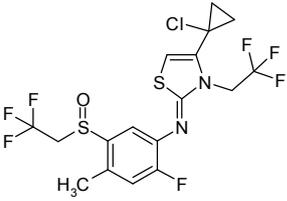
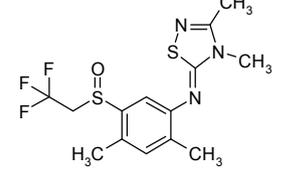
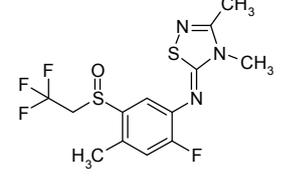
(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
Ib-156		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,32(s,1H), 7,24(s,1H), 4,14-4,05(m,1H), 3,94(s,2H), 3,91-3,82(m,1H), 2,73(septuplete,1H), 2,31(s,3H), 2,15(s,3H), 1,02-0,90(m,4H)
Ib-157		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,45-6,96(m,6H), 3,86-3,47(m,8H), 3,03(m,2H), 2,16(s,3H)
Ib-158		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,54(d,1H), 7,27(d,1H), 4,82(q,2H), 4,17-4,07(m,1H), 4,02-3,93(m,1H), 2,32(s,3H), 2,12(s, 3H), 2,05(s,3H)
Ib-159		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,34(s,1H), 7,24(s,1H), 4,14-4,05(m,3H), 3,87-3,81(m,1H), 3,20(s,3H), 2,31(s,3H), 2,15(s,3H)
Ib-160		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,10-7,09(m,2H), 6,25-6,23(m,1H), 5,10-5,00(m,1H), 4,03-3,87(m,2H), 2,26(s,3H), 2,05(s,3H), 1,36-1,33(m,1H), 1,29-1,28(d,3H), 1,01-0,96(m,1H), 0,82-0,76(m,1H), 0,68-0,61(m,2H)
Ib-161		$\log P(\text{HCOOH})=1,28$ , $\log P(\text{neutro})=2,95$
Ib-162		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,91-7,89(m,2H), 7,72-7,70(m,1H), 7,57-7,53(m,1H), 6,94-6,84(m,2H), 3,84-3,72(m,1H), 3,69(s,3H), 3,44-3,32(m,1H), 2,95(ancho, 6H), 2,17(s,3H)

(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
Ib-163		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,87(m,1H), 8,38(m,1H), 7,28-7,26(m,1H), 7,14-7,12(m,1H), 6,45(m,1H), 4,10-3,93(m,2H), 3,63-3,60(m,2H), 3,25(t,2H), 2,29(s,3H), 1,36(m,1H), 0,78-0,75(m,2H), 0,63-0,61(m,2H)
Ib-165		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 8,30(s,1H), 7,89-7,88(m,1H), 6,69(s,1H), 4,43-4,29(m,2H), 1,94-1,91(d,2H), 1,39(m,1H), 0,81-0,74(m,4H)
Ib-166		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,35(ancho, 1H), 7,17-7,13(m,2H), 4,12-3,98(m,4H), 3,21-3,16(m,1H), 2,30(s,3H), 2,16-2,09(m,2H), 1,84-1,61(m,4H)
Ib-167		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,74(s,1H), 7,50(ancho, 1H), 7,12(s,1H), 4,24-4,07(m,4H), 3,23-3,14(m,1H), 2,18-1,59(m,6H)
Ib-168		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,51(d,1H), 7,38(d,1H), 4,62-4,57(m,2H), 4,26-4,14(m,3H), 4,04-3,94(m,1H), 2,36(s,3H)
Ib-169		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,31-7,29(m,1H), 7,20-7,17(m,1H), 5,14-5,10(m,1H), 4,12-4,01(m,2H), 3,55-3,49(m,2H), 2,47-2,28(m,2H), 2,30(s,3H), 1,96-1,92(m,2H), 1,39-1,38(d,3H)
Ib-170		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 9,51(d,1H), 8,83-8,82(d,1H), 8,73(s,1H), 7,30(s,1H), 7,21(s,1H), 6,75(ancho, 2H), 4,06-3,97(m,2H), 2,32(s,3H), 2,15(s,3H)

(continuación)

Ejemplo número	Estructura	Datos analíticos
Ib-171		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,51(d,1H), 7,38(d,1H), 4,62-4,57(m,2H), 4,26-4,14(m,3H), 4,04-3,94(m,1H), 2,36(s,3H)
Ib-172		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,55(d,1H), 7,31(d,1H), 6,76(s,1H), 4,96(q,2H), 4,18-3,95(m,2H), 2,33(s,3H), 1,52-1,45(m,4H)
Ib-173		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,37(s,1H), 7,22(s,1H), 4,12-4,06(m,1H), 3,89-3,82(m,2H), 3,47(s,3H), 2,37(s,3H), 2,29(s,3H), 2,20(s,3H)
Ib-174		RMN de $^1\text{H}$ (D6-DMSO): 7,55(d,1H), 7,53(d,1H), 4,19-4,13(m,1H), 4,00-3,93(m,1H), 3,45(s,3H), 2,38(s,3H), 2,33(s,3H)

5 La intensidad de las señales bien definidas se correlaciona con la altura de las señales en un ejemplo impreso de un espectro de RMN en cm y muestra las proporciones reales de las intensidades de señal. En el caso de señales anchas, se pueden mostrar varios picos o el centro de la señal y sus intensidades relativas en comparación con la señal más intensa en el espectro.

Las listas de los picos de RMN de  $^1\text{H}$  son similares a las impresiones convencionales de RMN de  $^1\text{H}$  y, así, normalmente contienen todos los picos listados en una interpretación de RMN convencional.

10 Además, al igual que las impresiones de RMN de  $^1\text{H}$  convencionales, estas pueden mostrar señales de disolvente, señales de estereoisómeros de los compuestos deseados que, igualmente, forman parte de la materia objeto de la invención, y/o picos de impurezas.

En la presentación de las señales de compuestos en los intervalos delta de disolventes y/o agua, los listados de picos de RMN de  $^1\text{H}$  de la presente invención muestran picos de disolvente habituales, por ejemplo, picos de DMSO en DMSO- $d_6$  y el pico de agua, que normalmente tiene, como promedio, una elevada intensidad.

15 Los picos de estereoisómeros de los compuestos deseados y/o los picos de impurezas normalmente tienen una menor intensidad, como promedio, que los picos de los compuestos deseados (por ejemplo con una pureza de > 90 %).

Tales estereoisómeros y/o impurezas pueden ser típicos del procedimiento particular de preparación. Sus picos pueden ayudar así en este caso a identificar la reproducción del presente procedimiento de preparación con referencia a "huellas de subproductos".

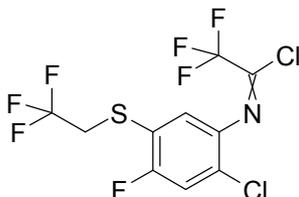
20 Un experto que calcule los picos de los compuestos deseados por procedimientos conocidos (MestreC, simulación ACD, pero con valores esperados evaluados de forma empírica) puede, si fuera necesario, aislar los picos de los compuestos deseados, opcionalmente usando filtros de intensidad adicionales. Este aislamiento sería similar a la

selección de picos relevantes en la interpretación de RMN de  $^1\text{H}$  convencional.

Si, como resultado del redondeo del valor  $\delta$  a dos dígitos decimales, hay señales que tienen el mismo valor  $\delta$ , sus intensidades después de la adición dan la misma imagen que la que se observaría en la impresión de una RMN clásica en la región de este valor  $\delta$ .

- 5 Los procedimientos de preparación descritos antes se pueden usar para obtener los compuestos de la fórmula (II), por ejemplo los siguientes compuestos de la fórmula (II):

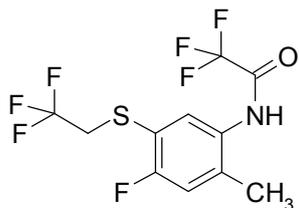
**Cloruro de *N*-(2-cloro-4-fluoro-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil)-2,2,2-trifluoroetanimidóilo (II-4)**



CG-EM: masa por IE (m/z): 373 (2Cl)  $[\text{M}]^+$

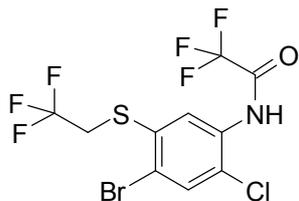
- 10 Los procedimientos de preparación descritos antes se pueden usar para obtener los compuestos de la fórmula (III), por ejemplo los siguientes compuestos de la fórmula (III):

**2,2,2-Trifluoro-*N*-(4-fluoro-2-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil)acetamida (III-4)**



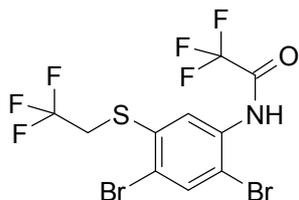
- 15  $\log\text{P}(\text{HCOOH})$ : 3,16;  $\log\text{P}(\text{neutro})$ : 3,1; RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO, 400 MHz)  $\delta$  ppm 11,05(s,1H), 7,59(d,1H), 7,31(d,1H), 3,96(q,2H), 2,17(s,3H)

***N*-(4-Bromo-2-cloro-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil)-2,2,2-trifluoroacetamida (III-5)**



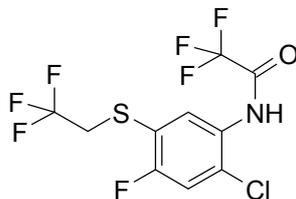
$\log\text{P}(\text{HCOOH})$ : 3,78; RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO, 400 MHz)  $\delta$  ppm 4,17-4,24(m,2H), 7,79(s,1H), 8,01(s,1H), 11,45(s,1H)

***N*-(2,4-Dibromo-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil)-2,2,2-trifluoroacetamida (III-6)**

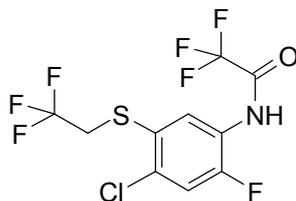


20

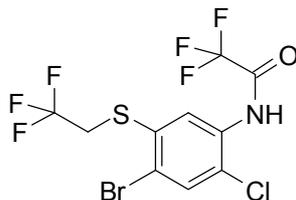
$\log\text{P}(\text{HCOOH})$ : 3,81; RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO, 400 MHz)  $\delta$  ppm 11,21(s,1H), 7,90(s,1H), 7,56(s,1H), 3,99(q,2H)

**N-{2-Cloro-4-fluoro-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-2,2,2-trifluoroacetamida (III-7)**

logP(HCOOH): 3,33; logP(neutro): 3,11; RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO, 400 MHz)  $\delta$  ppm 11,39(s,1H), 7,85(d,1H), 7,76(d,1H), 4,08(q,2H)

5 **N-{4-Cloro-2-fluoro-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-2,2,2-trifluoroacetamida (III-8)**

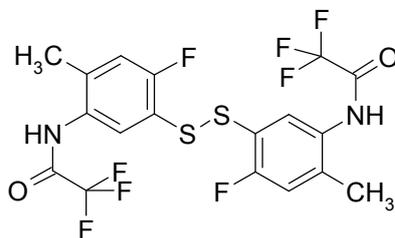
logP(HCOOH): 3,34; logP(neutro): 3,14; RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO, 400 MHz)  $\delta$  ppm 11,47 (s ancho,1H), 7,85(d,1H), 7,76(d,1H), 4,09(q,2H)

**N-{4-Bromo-2-cloro-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-2,2,2-trifluoroacetamida (III-9)**

10

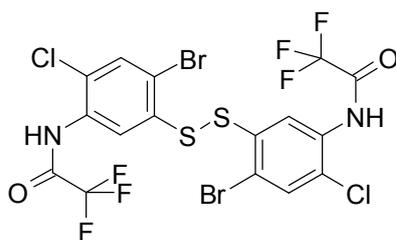
logP(HCOOH): 3,46; logP(neutro): 3,11; RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO, 400 MHz)  $\delta$  ppm 11,46(s,1H), 7,87(d,1H), 7,82(d,1H), 4,11(q,2H)

Los procedimientos de preparación descritos antes se pueden usar para obtener los compuestos de la fórmula (IV), por ejemplo los siguientes compuestos de la fórmula (IV):

15 **N,N'-[Disulfanodiilbis(4-fluoro-6-metilbenceno-3,1-diil)]bis(2,2,2-trifluoroacetamida) (IV-2)**

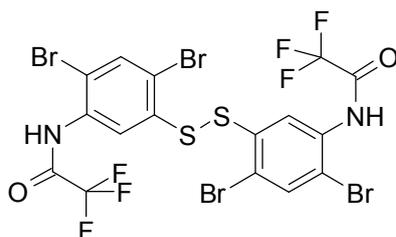
logP(HCOOH): 4,0; logP(neutro): 3,92; RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO, 400 MHz)  $\delta$  ppm 11,04(s,2H), 7,62(d,2H), 7,32(d,2H), 2,19(s,6H)

**N,N'-[Disulfanodiilbis(4-bromo-6-clorobenceno-3,1-diil)]bis(2,2,2-trifluoroacetamida) (IV-3)**



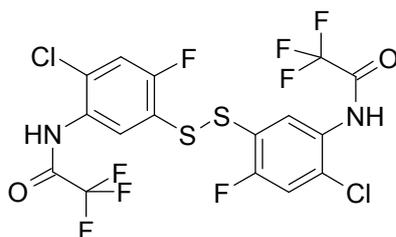
logP(HCOOH): 5,42

***N,N'***-[Disulfanodiilbis(4,6-dibromobenceno-3,1-diil)]bis(2,2,2-trifluoroacetamida) (IV-4)



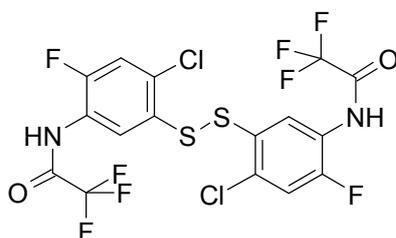
5 logP(HCOOH): 5,62; logP(neutro): 4,49; RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO, 400 MHz)  $\delta$  ppm 11,38(s,2H), 8,18(s,2H), 7,77(d,2H)

***N,N'***-[Disulfanodiilbis(6-cloro-4-fluorobenceno-3,1-diil)]bis(2,2,2-trifluoroacetamida) (IV-5)



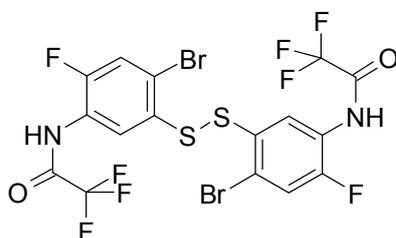
10 logP(HCOOH): 4,45; logP(neutro): 3,81; RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO, 400 MHz)  $\delta$  ppm 11,37(s,2H), 7,88(d,2H), 7,80(d,2H)

***N,N'***-[Disulfanodiilbis(4-cloro-6-fluorobenceno-3,1-diil)]bis(2,2,2-trifluoroacetamida) (IV-6)



logP(HCOOH): 4,60; logP(neutro): 3,82; RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO, 400 MHz)  $\delta$  ppm 11,44(s,2H), 7,95(d,2H), 7,83(d,2H)

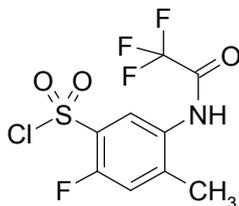
15 ***N,N'***-[Disulfanodiilbis(4-bromo-6-fluorobenceno-3,1-diil)]bis(2,2,2-trifluoroacetamida) (IV-7)



logP(HCOOH): 4,76; logP(neutro): 4,02; RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO, 400 MHz)  $\delta$  ppm 11,44(s,2H), 7,95-7,89 (m,4H)

Los procedimientos de preparación descritos antes se pueden usar para obtener los compuestos de la fórmula (V), por ejemplo los siguientes compuestos de la fórmula (V):

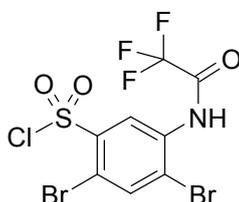
**Cloruro de 2-fluoro-4-metil-5-[(trifluoroacetil)amino]bencenosulfonilo (V-2)**



5

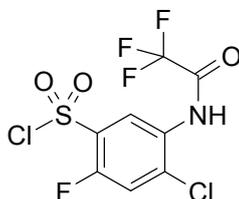
RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO, 400 MHz)  $\delta$  ppm 10,98 (s,1H), 7,48 (d,1H), 7,12 (d,1H), 2,15 (s,3H)

**Cloruro de 2,4-dibromo-5-[(trifluoroacetil)amino]bencenosulfonilo (V-3)**



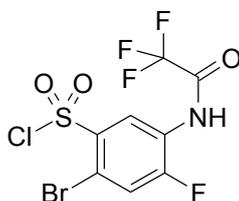
RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO, 400 MHz)  $\delta$  ppm 9,20 (s ancho,1H), 8,56(s,1H), 8,36(s,1H)

10 **Cloruro de 4-cloro-2-fluoro-5-[(trifluoroacetil)amino]bencenosulfonilo (V-4)**



RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO, 400 MHz)  $\delta$  ppm 11,30(s,1H), 7,72-7,67(m,1H), 7,59-7,55(d,1H)

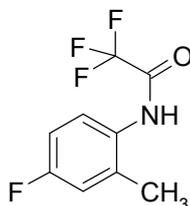
**Cloruro de 2-bromo-4-fluoro-5-[(trifluoroacetil)amino]bencenosulfonilo (V-5)**



15 RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO, 400 MHz)  $\delta$  ppm 9,38 (s ancho,1H), 8,00-7,97(m,1H), 7,68(d,1H)

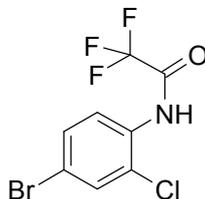
Los procedimientos de preparación descritos antes se pueden usar para obtener los compuestos de la fórmula (VI), por ejemplo los siguientes compuestos de la fórmula (VI):

**2,2,2-Trifluoro-N-(4-fluoro-2-metilfenil)acetamida (VI-2)**



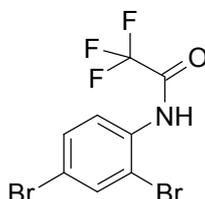
logP(HCOOH): 2,2; logP(neutro): 2,19; RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO, 400 MHz)  $\delta$  ppm 10,97(s,1H), 7,28-7,30(m,1H), 7,19-7,21(m,1H), 7,08-7,11(m,1H), 2,18 (s,3H)

**N-(4-Bromo-2-clorofenil)-2,2,2-trifluoroacetamida (VI-3)**



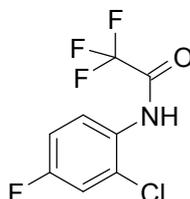
5 logP(HCOOH): 3,01; logP(neutro): 2,81; RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO, 400 MHz)  $\delta$  ppm 11,35 (s,1H), 7,92 (d, 1H), 7,65 (dd,1H), 7,45 (d,1H)

**N-(2,4-Dibromofenil)-2,2,2-trifluoroacetamida (VI-4)**



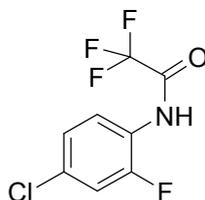
10 logP(HCOOH): 3,10; logP(neutro): 2,89; RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO, 400 MHz)  $\delta$  ppm 11,36(s,1H), 8,04(d,1H), 7,69(dd,1H), 7,43(d,1H)

**N-(2-Cloro-4-fluorofenil)-2,2,2-trifluoroacetamida (VI-5)**



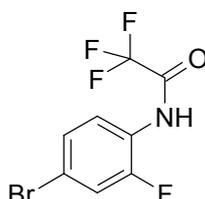
logP(HCOOH): 2,46; logP(neutro): 2,31; RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO, 400 MHz)  $\delta$  ppm 11,29(s,1H), 7,64(dd,1H), 7,53(dd,1H), 7,35-7,30(m,1H)

15 **N-(4-Cloro-2-fluorofenil)-2,2,2-trifluoroacetamida (VI-6)**



logP(HCOOH): 2,53; logP(neutro): 2,40; RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO, 400 MHz)  $\delta$  ppm 11,29(s,1H), 7,62(dd,1H), 7,55(dd,1H), 7,37(dd,1H)

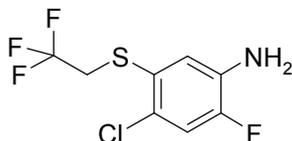
**N-(4-Bromo-2-fluorofenil)-2,2,2-trifluoroacetamida (VI-7)**



logP(HCOOH): 2,73; logP(neutro): 2,51; RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO, 400 MHz)  $\delta$  ppm 11,36(s,1H), 7,74(d,1H), 7,52-7,46(m,2H)

Los procedimientos de preparación descritos antes se pueden usar para obtener los compuestos de la fórmula (X), por ejemplo los siguientes compuestos de la fórmula (X):

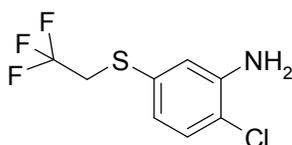
5 **4-Cloro-2-fluoro-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]anilina (X-6)**



10 Se añaden cuidadosamente 11,0 g (30,9 mmol) de *N*-[4-cloro-2-fluoro-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil]-2,2,2-trifluoroacetamida en 150 ml de dioxano a una solución de 10,3 ml (186 mmol) de ácido sulfúrico (concentración del 96 %) en 100 ml de agua. La mezcla de reacción se calienta seguidamente a reflujo durante una noche. Después de enfriar, la solución se ajusta a pH 7 usando una solución saturada de bicarbonato de sodio y un poco de carbonato de sodio y se extrae tres veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas reunidas se lavan con a solución saturada de cloruro de sodio, se seca sobre sulfato de sodio, se filtra y se concentra. El residuo comprende 8,27 g (96 % de pureza, 99 % del teórico) del compuesto del epígrafe como una mezcla aceite/sólido negra.

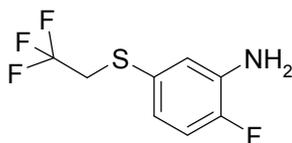
15 logP(HCOOH): 3,02; logP(neutro): 3,00; RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO, 400 MHz)  $\delta$  ppm 7,27(d,1H), 7,04(d,1H), 5,46 (s ancho,2H), 3,85(q,2H)

**2-Cloro-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]anilina (X-7)**



logP(HCOOH): 3,00; logP(neutro): 2,95; RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO, 400 MHz)  $\delta$  ppm 7,16(d,1H), 6,89(d,1H), 6,68-6,65(m,1H), 5,48(ancho, 2H), 3,89(q,2H); CG-EM: masa por IE (m/z): 241 (1Cl) [M]<sup>+</sup>

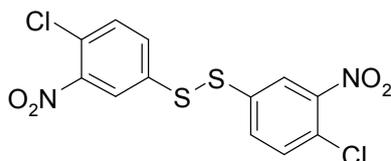
20 **2-Fluoro-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]anilina (X-8)**



logP(HCOOH): 2,57; logP(neutro): 2,53; RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO, 400 MHz)  $\delta$  ppm 7,01-6,97(m,1H), 6,92-6,89(m,1H), 6,69-6,64(m,1H), 5,31(ancho, 2H), 3,82(q,2H); CG-EM: masa por IE (m/z): 225 [M]<sup>+</sup>

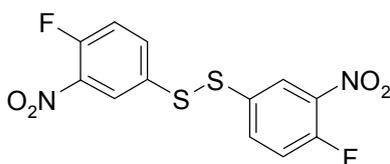
25 Los procedimientos de preparación descritos antes se pueden usar para obtener los compuestos de la fórmula (XXI), por ejemplo los siguientes compuestos de la fórmula (XXI):

**1,1'-Disulfanodilbis(4-cloro-3-nitrobencono) (XXI-2)**



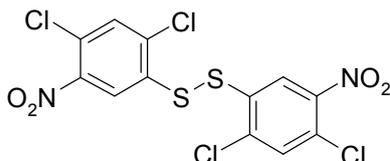
logP(HCOOH): 4,58; logP(neutro): 4,58; RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO, 400 MHz)  $\delta$  ppm 8,29(d,2H), 7,89-7,86(m,2H), 7,81(d,2H); CG-EM: masa por IE (m/z): 376 (2Cl) [M]<sup>+</sup>

30 **1,1'-Disulfanodilbis(4-fluoro-3-nitrobencono) (XXI-3)**



logP(HCOOH): 3,83; logP(neutro): 3,79; RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO, 400 MHz)  $\delta$  ppm 8,32-8,29(m,2H), 8,03-7,97(m,2H), 7,69-7,63(m,2H); CG-EM: masa por IE (m/z): 344 [M]<sup>+</sup>

**1,1'-Disulfanodiilbis(2,4-dicloro-5-nitrobenzene) (XXI-4)**

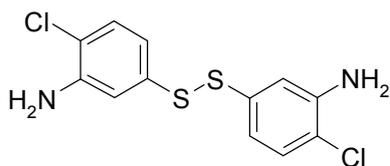


5

logP(HCOOH): 5,69; logP(neutro): 5,64; RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO, 400 MHz)  $\delta$  ppm 8,33(s,2H), 8,21(s,2H)

Los procedimientos de preparación descritos antes se pueden usar para obtener los compuestos de la fórmula (XXII), por ejemplo los siguientes compuestos de la fórmula (XXII):

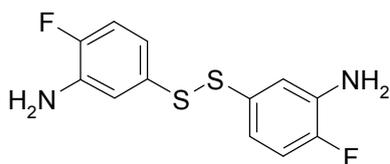
**3,3'-Disulfanodiilbis(6-cloroanilina) (XXII-2)**



10

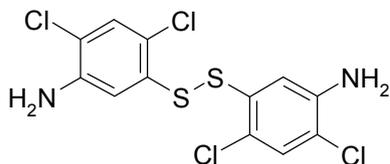
logP(HCOOH): 3,84; logP(neutro): 3,83; RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO, 400 MHz)  $\delta$  ppm 7,18(d,2H), 6,94(d,2H), 6,65-6,62(m,2H), 5,59(ancho, 4H); CG-EM: masa por IE (m/z): 316 (2Cl) [M]<sup>+</sup>

**3,3'-Disulfanodiilbis(6-fluoroanilina) (XXII-3)**



15 logP(HCOOH): 2,98; logP(neutro): 2,97; RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO, 400 MHz)  $\delta$  ppm 7,02-6,95(m,2H), 6,95-6,82(m,2H), 6,62-6,57(m,2H), 5,40(ancho, 4H); CG-EM: masa por IE (m/z): 284 [M]<sup>+</sup>

**3,3'-Disulfanodiilbis(4,6-dicloroanilina) (XXII-4)**



20 logP(HCOOH): 5,14; logP(neutro): 4,95; RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO, 400 MHz)  $\delta$  ppm 7,41(s,2H), 6,95(s,2H), 5,78(ancho, 4H); CG-EM: masa por IE (m/z): 386 (4Cl) [M]<sup>+</sup>

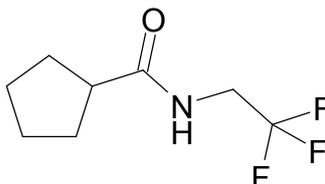
Los procedimientos de preparación descritos antes se pueden usar para obtener los compuestos de la fórmula (XXIV), por ejemplo los siguientes compuestos de la fórmula (XXIV):

**1-Cloro-2-fluorociclopropanocarboxamida (XXIV-1)**



RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO)  $\delta$  ppm : 7,84(ancho, 1H), 7,75(ancho, 1H), 5,05-4,86(m,1H), 1,89-1,81(m,1H), 1,69-1,60(m,1H)

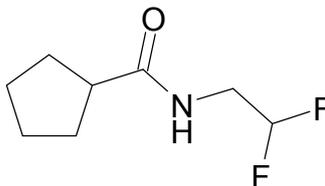
**N-(2,2,2-Trifluoroetil)ciclopentanocarboxamida (XXIV-2)**



5

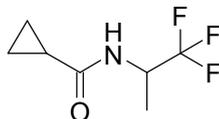
RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO)  $\delta$  ppm: 8,43(ancho, 1H), 3,92-3,83(m,2H), 3,08-3,07(m,1H), 2,67-2,59(m,1H), 1,79-1,49(m,7H)

**N-(2,2-Difluoroetil)ciclopentanocarboxamida (XXIV-3)**



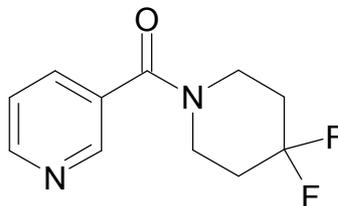
10 RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO)  $\delta$  ppm: 8,18(t,1H), 5,97(tt,1H), 3,50-3,40(m,2H), 3,08-3,06(m,1H), 2,64-2,57(m,1H), 1,78-1,45(m,7H)

**N-(1,1,1-Trifluoropropan-2-il)ciclopropanocarboxamida (XXIV-4)**



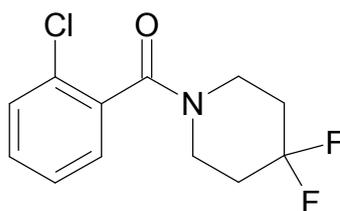
15 RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO)  $\delta$  ppm: 8,62-8,60(d,1H), 4,62-4,55(m,1H), 1,63-1,59(m,1H), 1,24-1,23(d,3H), 0,72-0,70(m,4H)

**(3-Piridil)(4,4-difluoropiperidin-1-il)metanona (XXIV-5)**



RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO)  $\delta$  ppm: 8,67-8,66(m,2H), 7,90-7,87(m,1H), 7,51-7,48(m,1H), 3,73(m,2H), 3,42 (m,2H), 2,06(m,4H)

20 **(2-Clorofenil)(4,4-difluoropiperidin-1-il)metanona (XXIV-6)**



RMN de  $^1\text{H}$  (D6-DMSO)  $\delta$  ppm: 7,56-7,53(m,1H), 7,49-7,41(m,3H), 3,90-3,84(m,1H), 3,70-3,64(m,1H), 3,34-3,22(m,2H), 2,15-1,90(m,4H)

### **Ejemplos de uso**

#### **5 Ensayo con *Phaedon* (tratamiento de pulverización PHAECO)**

Disolventes: 78,0 partes en peso de acetona  
1,5 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: 0,5 partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

10 Para producir una preparación adecuada de principio activo, se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades indicadas de disolvente y emulsionante, y se diluye el concentrado con agua que contiene emulsionante hasta la concentración deseada. Se pulverizan discos de hojas de col china (*Brassica pekinensis*) con una preparación de principio activo de la concentración deseada y, después de secar, se infestan con larvas del escarabajo de la mostaza (*Phaedon cochleariae*).

15 Después de 7 días se determina el efecto en %: 100 % quiere decir que todas las larvas de escarabajo han muerto; 0 % quiere decir que ninguna de las larvas de escarabajo ha muerto.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los Ejemplos de preparación muestran una eficacia del

100 % a una tasa de aplicación de 500 g/ha: la-02, la-04, la-05, la-13, la-14, la-15, la-18, la-19, lb-02, lb-10, lb-11, lb-14, lb-16

#### **Ensayo con *Tetranychus*, resistente a OP (tratamiento por pulverización TETRUR)**

20 Disolventes: 78,0 parte en peso de acetona  
1,5 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: 0,5 partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

25 Para producir una preparación adecuada de principio activo, se mezcla 1 parte en peso de principio activo con la cantidad indicada de disolvente y emulsionante, y se diluye el concentrado con agua que contiene emulsionante hasta la concentración deseada. Se infestan de hojas de judía (*Phaseolus vulgaris*) con todos los estadios de la araña roja de invernadero (*Tetranychus urticae*), se pulverizan con una preparación del principio activo de la concentración deseada.

Después de 6 días se determina el efecto en %: El 100 % significa aquí que todos los ácaros araña han muerto; el 0 % significa que ninguno de los ácaros araña ha muerto.

30 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los Ejemplos de Preparación presentaron una eficacia del 80 % a una tasa de aplicación de 500 g/ha: la-09, la-17, lb-04, lb-05

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los Ejemplos de Preparación presentaron una eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 500 g/ha: la-02, la-03, la-05, la-07, la-12, la-13, la-15, la-18,

la-23, la-26, lb-02, lb-03, lb-06, lb-07, lb-08, lb-09, lb-12, lb-13, lb-15

#### **35 Ensayo con *Meloidogyne incognita* (MELGIN)**

Disolventes: 80,0 partes en peso de acetona

Para preparar una preparación adecuada de principio activo, se mezcla una parte en peso de principio activo con las cantidades indicadas de disolvente y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

40 Los recipientes se llenan con arena, solución del principio activo, una suspensión de huevos/larvas de *Meloidogyne incognita* y semillas de lechuga. Las semillas de lechuga germinan y se desarrollan las plantas. En las raíces se forman agallas.

Después de 14 días, se determina la eficacia en % por la formación de agallas. 100 % significa que no se han encontrado agallas; 0 % significa que el número de agallas sobre las plantas tratadas corresponde al control no tratado.

5 En este ensayo, por ejemplo, el siguiente compuesto de los Ejemplos de preparación muestran una eficacia del 90 % a una tasa de aplicación de 20 ppm: Ia-07

En este ensayo, por ejemplo, el siguiente compuesto de los Ejemplos de preparación muestran una eficacia de 100 % a una tasa de aplicación de 20 ppm: Ib-02

**Ensayo con *Lucilia cuprina* (48h)**

Disolvente: dimetilsulfóxido

10 se disuelven 10 mg de principio activo en 0,5 ml de dimetilsulfóxido. Para preparar una formulación adecuada, se diluye la solución de principio activo con agua hasta la concentración deseada en cada caso. Se introducen en aproximadamente 20 larvas de *Lucilia cuprina* en un tubo de ensayo que contiene aproximadamente 1 cm<sup>3</sup> de carne de caballo y 0,5 ml de la preparación de principio activo a ensayar. Después de 48 horas, la eficacia de la preparación de principio activo se determina como % de mortalidad de las larvas.

15 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los Ejemplos de Preparación muestran una eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 100 ppm: Ia-21, Ib-11

**Ensayo con *Boophilus microplus* (inyección BOOPMI)**

Disolvente: dimetilsulfóxido

20 Para producir una preparación adecuada de principio activo, se mezclan 10 mg de principio activo con 0,5 ml de disolvente, y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada. La solución de principio activo se inyecta en el abdomen (*Boophilus microplus*), y se transfieren los animales a placas y se mantienen en una sala climatizada. La actividad se valora por deposición de huevos fértiles.

Después de 7 días se determina el efecto en %: 100 % significa que ninguna de las garrapatas puso huevos fértiles.

25 En este ensayo, por ejemplo, el siguiente compuesto de los Ejemplos de preparación muestran una eficacia de 80 % a una tasa de aplicación de 20 µg / animal: Ia-04

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los Ejemplos de Preparación mostraron una eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 20 µg/animal: Ia-01, Ia-21, Ia-22, Ib-01, Ib-10, Ib-11, Ib-14, Ib-16

30 A no ser que se indique de otro modo, la solución de ensayo en los siguientes ejemplos se preparó como sigue: se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades indicadas de una mezcla de disolvente y emulsionante (3 partes en peso de dimetilformamida como disolvente y 1 parte en peso de polioxietilenoalquilfeniléter como emulsionante) y la solución se diluye con agua a la concentración deseada.

**Ensayo con araña roja (*Tetranychus urticae*)**

Se colocan 50 a 100 arañas rojas adultas en las hojas de una planta de judía en el estadio de dos hojas que crece en una maceta con un diámetro de 6 cm.

35 Después de un día, usando una pistola pulverizadora de pintura, se pulveriza la planta con una cantidad suficiente de la preparación de principio activo de la concentración deseada y se coloca en un invernadero. Después de 7 días se determina el efecto acaricida. El 100 % significa aquí que todas las arañas rojas han muerto; el 0 % significa que ninguna de las arañas rojas ha muerto.

40 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los Ejemplos de Preparación muestran una eficacia del 100 % a una concentración de principio activo de 100 ppm: Ia-21, Ia-01, Ib-11, Ib-01, Ia-06, Ia-14, Ia-15, Ib-14, Ia-20, Ia-25, Ia-19, Ib-16 and Ib-10

**Ensayo con el escarabajo desfoliador de las cucurbitáceas (*Aulacophora femoralis*)**

45 Se sumergen hojas de calabaza en la solución de ensayo de la concentración apropiada y se secan al aire seguidamente. Se insertan entonces las hojas en una cápsula de plástico rellena con tierra estéril y cinco larvas de *Aulacophora femoralis* en el segundo estadio larvario. Se colocan los discos en una sala climatizada a 25 °C.

Después de 7 días se determina el efecto en %: 100 % quiere decir que todas las larvas de escarabajo han muerto; 0 % quiere decir que ninguna de las larvas de escarabajo ha muerto.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los Ejemplos de Preparación muestran una eficacia del 100 % a una concentración de principio activo de 500 ppm:

la-21, lb-11, lb-01, lb-14, lb-16 and lb-10

**Ensayo de inmersión con *Boophilus microplus* - (BOOPMI)**

Animales de ensayo: garrapatas del ganado vacuno (*Boophilus microplus*) cepa Parkhurst, resistente a SP  
 Disolvente: dimetilsulfóxido

5 Se disuelven 10 mg de principio activo en 0,5 ml de dimetilsulfóxido. Para preparar una formulación adecuada, se diluye la solución de principio activo con agua hasta la concentración deseada en cada caso.

10 Esta preparación de principio activo se pipetea en tubos. Se transfieren 8-10 garrapatas del ganado vacuno adultas hembra engordadas (*Boophilus microplus*) a un tubo con orificios. El tubo se sumerge en la formulación de principio activo y todas las garrapatas quedan totalmente humectadas. A continuación, se deja escurrir el líquido, se transfieren las garrapatas en placas de filtro a placas de plástico y se almacenan en una sala con control climático.

La actividad de valora después de 7 días por deposición de huevos fértiles. Los huevos cuya fertilidad no es visible desde el exterior se almacenan en una cabina con control climático hasta que las larvas eclosionan después de aproximadamente 42 días. Una eficacia de 100 % significa que ninguna de las garrapatas ha depositado huevos fértiles; 0 % significa que todos los huevos son fértiles.

15 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los Ejemplos de Preparación muestran una eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 100 ppm: la-189, lb-115, lb-33

***Boophilus microplus* - ensayo de inmersión (BOOPMI iny)**

Disolvente: dimetilsulfóxido

20 Para producir una preparación adecuada de principio activo, se mezclan 10 mg de principio activo con 0,5 ml de disolvente, y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

Se inyecta 1 µl de solución de principio activo en el abdomen de 5 garrapatas del ganado vacuno hembra adultas engordadas (*Boophilus microplus*). Los animales se transfieren a placas y se mantienen en una sala con control climático.

25 La actividad de valora después de 7 días por deposición de huevos fértiles. Los huevos cuya fertilidad no es visible desde el exterior se almacenan en una cabina con control climático hasta que las larvas eclosionan después de aproximadamente 42 días. Una eficacia de 100 % significa que ninguna de las garrapatas ha depositado huevos fértiles; 0 % significa que todos los huevos son fértiles.

30 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los Ejemplos de Preparación mostraron una eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 20 µg/animal: la-01, la-115, la-116, la-118, la-120, la-13, la-189, la-206, la-21, la-22, la-27, la-34, la-39, la-44, la-50, la-66, la-80, lb-01, lb-02, lb-03, lb-07, lb-10, lb-108, lb-11, lb-115, lb-12, lb-14, lb-14, lb-16, lb-17, lb-18, lb-19, lb-20, lb-33, lb-35, lb-38, lb-40, lb-47, lb-48, lb-58, lb-59, lb-68, lb-85

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los Ejemplos de Preparación mostraron una eficacia del 90 % a una tasa de aplicación de 20 µg/animal: lb-44

35 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los Ejemplos de Preparación mostraron una eficacia del 80 % a una tasa de aplicación de 20 µg/animal: la-04, lb-24, lb-89

**Ensayo con *Cooperia curticei* (COOPCU)**

Disolvente: dimetilsulfóxido

Para producir una preparación adecuada de principio activo, se mezclan 10 mg de principio activo con 0,5 ml de dimetilsulfóxido, y el concentrado se diluye con "solución de Ringer" a la concentración deseada.

40 Se infestan recipientes que contienen la preparación de principio activo de la concentración deseada con aproximadamente 40 larvas de nematodos (*Cooperia curticei*).

Después de 5 días se determina la mortalidad en %: El 100 % significa que todas las larvas han muerto; el 0 % significa que ninguna de las larvas ha muerto.

45 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los Ejemplos de Preparación muestran una eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 100 ppm: la-220

**Ensayo con *Lucilia cuprina* (LUCICU)**

Disolvente: dimetilsulfóxido

Para producir una preparación adecuada de principio activo, se mezclan 10 mg de principio activo con 0,5 ml de dimetilsulfóxido, y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

5 Se transfieren aproximadamente 20 larvas 20 L1 de la mosca miásica del ganado ovino Australiana (*Lucilia cuprina*) a un recipiente de ensayo que contiene carne de caballo picada y la preparación de principio activo de la concentración deseada.

Después de 2 días se determina la mortalidad en %: El 100 % significa que todas las larvas han muerto; el 0 % significa que ninguna de las larvas ha muerto.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los Ejemplos de Preparación muestran una eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 100 ppm: la-21, lb-11

10 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los Ejemplos de Preparación muestran una eficacia del 90 % a una tasa de aplicación de 100 ppm: la-13

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los Ejemplos de Preparación muestran una eficacia del 80 % a una tasa de aplicación de 100 ppm: lb-02

#### **Myzus persicae - ensayo de pulverización (MYZUPE)**

15 Disolventes: 78 parte en peso de acetona  
1,5 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: 0,5 partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

20 Para producir una preparación adecuada de principio activo, se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades indicadas de disolvente y emulsionante, y el concentrado se diluye con agua que contiene emulsionante a la concentración deseada.

Discos de hojas de col china (*Brassica pekinensis*) infestadas con todos los estadios del pulgón verde del melocotonero (*Myzus persicae*) se pulverizan con una preparación del principio activo de la concentración deseada.

Después de 6 días se determina el efecto en %: El 100 % significa que todos los pulgones han muerto; el 0 % significa que ninguno de los pulgones ha muerto.

25 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación exhiben un efecto del 100 % a una tasa de aplicación de 500g/ha: la-206, la-228, lb-44

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación exhiben un efecto del 90 % a una tasa de aplicación de 500g/ha: la-34, la-116, lb-123

30 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación exhiben un efecto del 80 % a una tasa de aplicación de 100g/ha: lb-42

#### **Phaedon cochleariae - ensayo de pulverización (PHAECO)**

Disolventes: 78,0 parte en peso de acetona  
1,5 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: 0,5 partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

35 Para producir una preparación adecuada de principio activo, se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades indicadas de disolvente y emulsionante, y el concentrado se diluye con agua que contiene emulsionante a la concentración deseada.

Se pulverizan discos de col china (*Brassica pekinensis*) con una preparación de principio activo a la concentración deseada y, tras secar, se colonizan con larvas de escarabajo de la mostaza (*Phaedon cochleariae*).

40 Después de 7 días se determina el efecto en %: 100 % quiere decir que todas las larvas de escarabajo han muerto; 0 % quiere decir que ninguna de las larvas de escarabajo ha muerto.

45 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación exhiben un efecto del 100 % a una tasa de aplicación de 500g/ha: la-02, la-04, la-05, la-13, la-14, la-15, la-18, la-19, la-27, la-28, la-29, la-31, la-35, la-36, la-38, la-45, la-78, la-79, la-115, la-118, la-121, la-135, la-139, la-149, la-162, la-191, la-202, la-209, la-229, lb-02, lb-10, lb-11, lb-14, lb-16, lb-17, lb-20, lb-20, lb-27, lb-39, lb-43, lb-44, lb-56, lb-57, lb-68, lb-78, lb-83, lb-101, lb-110, lb-111, lb-115

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación exhiben un efecto del 83 % a una tasa de aplicación de 500g/ha: la-33, la-92, la-130, la-134, la-171, la-204, la-207, la-210, lb-18, lb-30, lb-108,

Ib-137, Ib-143

**Ensayo con *Tetranychus urticae*; resistente a OP (TETRUR aplicación por pulverización)**

Disolventes: 78,0 partes en peso de acetona

1,5 partes en peso de dimetilformamida

5 Emulsionante: 0,5 partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

Para producir una preparación adecuada de principio activo, se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades indicadas de disolvente y emulsionante, y el concentrado se diluye con agua que contiene emulsionante a la concentración deseada.

10 Se pulverizan discos de hojas de judía (*Phaseolus vulgaris*) que están infestadas por todas las fases de la araña roja de invernadero (*Tetranychus urticae*) con una preparación del principio activo de la concentración deseada.

Después de 6 días se determina el efecto en %: El 100 % significa aquí que todos los ácaros araña han muerto; el 0 % significa que ninguno de las arañas rojas ha muerto.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los Ejemplos de Preparación presentaron una eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 500 g/ha: Ia-01, Ia-02, Ia-03, Ia-04, Ia-05, Ia-06, Ia-07, Ia-08, Ia-11, Ia-12, Ia-13, Ia-14, Ia-15, Ia-16, Ia-18, Ia-19, Ia-20, Ia-21, Ia-22, Ia-23, Ia-25, Ia-26, Ia-27, Ia-28, Ia-29, Ia-30, Ia-31, Ia-32, Ia-33, Ia-34, Ia-35, Ia-36, Ia-37, Ia-38, Ia-39, Ia-40, Ia-41, Ia-42, Ia-43, Ia-44, Ia-46, Ia-47, Ia-48, Ia-49, Ia-50, Ia-51, Ia-52, Ia-53, Ia-54, Ia-55, Ia-56, Ia-57, Ia-60, Ia-61, Ia-64, Ia-65, Ia-66, Ia-67, Ia-69, Ia-70, Ia-71, Ia-72, Ia-73, Ia-74, Ia-75, Ia-76, Ia-77, Ia-78, Ia-79, Ia-80, Ia-81, Ia-82, Ia-83, Ia-84, Ia-85, Ia-86, Ia-87, Ia-89, Ia-93, Ia-94, Ia-95, Ia-96, Ia-97, Ia-98, Ia-99, Ia-100, Ia-115, Ia-116, Ia-119, Ia-120, Ia-121, Ia-122, Ia-123, Ia-124, Ia-125, Ia-126, Ia-127, Ia-129, Ia-130, Ia-131, Ia-132, Ia-133, Ia-134, Ia-135, Ia-136, Ia-138, Ia-139, Ia-140, Ia-141, Ia-141, Ia-143, Ia-144, Ia-145, Ia-146, Ia-147, Ia-148, Ia-150, Ia-151, Ia-152, Ia-153, Ia-156, Ia-158, Ia-161, Ia-162, Ia-163, Ia-165, Ia-166, Ia-187, Ia-188, Ia-189, Ia-191, Ia-193, Ia-194, Ia-195, Ia-197, Ia-201, Ia-202, Ia-203, Ia-205, Ia-206, Ia-207, Ia-208, Ia-209, Ia-210, Ia-211, Ia-213, Ia-214, Ia-217, Ia-221, Ia-222, Ia-224, Ia-225, Ia-226, Ia-227, Ia-230, Ia-233, Ia-234, Ia-236, Ia-238, Ia-239, Ia-242, Ia-247, Ia-249, Ia-272, Ia-275, Ia-276, Ib-02, Ib-03, Ib-06, Ib-07, Ib-08, Ib-09, Ib-10, Ib-11, Ib-12, Ib-13, Ib-14, Ib-15, Ib-16, Ib-17, Ib-19, Ib-20, Ib-21, Ib-22, Ib-24, Ib-25, Ib-26, Ib-27, Ib-28, Ib-29, Ib-30, Ib-31, Ib-32, Ib-33, Ib-34, Ib-35, Ib-36, Ib-37, Ib-38, Ib-39, Ib-40, Ib-42, Ib-43, Ib-45, Ib-46, Ib-47, Ib-48, Ib-49, Ib-50, Ib-51, Ib-52, Ib-53, Ib-56, Ib-57, Ib-58, Ib-59, Ib-61, Ib-62, Ib-63, Ib-64, Ib-65, Ib-68, Ib-69, Ib-71, Ib-72, Ib-75, Ib-76, Ib-78, Ib-79, Ib-80, Ib-81, Ib-82, Ib-83, Ib-84, Ib-85, Ib-86, Ib-87, Ib-88, Ib-89, Ib-90, Ib-92, Ib-93, Ib-94, Ib-95, Ib-97, Ib-98, Ib-99, Ib-100, Ib-108, Ib-109, Ib-110, Ib-112, Ib-113, Ib-114, Ib-115, Ib-117, Ib-118, Ib-119, Ib-120, Ib-121, Ib-123, Ib-125, Ib-126, Ib-127, Ib-129, Ib-130, Ib-131, Ib-132, Ib-135, Ib-137, Ib-138, Ib-139, Ib-140, Ib-141, Ib-148, Ib-151, Ib-160, Ib-169, Ib-174

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los Ejemplos de Preparación presentaron una eficacia del 90 % a una tasa de aplicación de 500 g/ha: Ia-59, Ia-62, Ia-63, Ia-68, Ia-83, Ia-88, Ia-91, Ia-92, Ia-101, Ia-102, Ia-103, Ia-104, Ia-105, Ia-106, Ia-107, Ia-117, Ia-118, Ia-128, Ia-149, Ia-155, Ia-159, Ia-160, Ia-167, Ia-168, Ia-169, Ia-171, Ia-172, Ia-173, Ia-175, Ia-176, Ia-177, Ia-178, Ia-180, Ia-190, Ia-192, Ia-196, Ia-204, Ia-205, Ia-212, Ia-215, Ia-216, Ia-218, Ia-219, Ia-220, Ia-223, Ia-228, Ia-229, Ia-231, Ia-232, Ia-235, Ia-237, Ia-240, Ia-241, Ia-243, Ia-244, Ia-245, Ia-248, Ia-250, Ia-251, Ia-252, Ia-253, Ia-254, Ia-255, Ia-256, Ia-257, Ia-258, Ia-259, Ia-260, Ia-261, Ia-262, Ia-263, Ia-264, Ia-265, Ia-266, Ia-267, Ia-268, Ia-269, Ia-270, Ia-278, Ib-01, Ib-23, Ib-41, Ib-54, Ib-60, Ib-66, Ib-67, Ib-73, Ib-74, Ib-77, Ib-91, Ib-96, Ib-101, Ib-102, Ib-103, Ib-104, Ib-111, Ib-116, Ib-122, Ib-124, Ib-128, Ib-133, Ib-134, Ib-136, Ib-142, Ib-143, Ib-144, Ib-145, Ib-146, Ib-147, Ib-149, Ib-150, Ib-152, Ib-153, Ib-154, Ib-155, Ib-156, Ib-157, Ib-158, Ib-166, Ib-167, Ib-172

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los Ejemplos de Preparación presentaron una eficacia del 80 % a una tasa de aplicación de 500 g/ha: Ia-09, Ia-17, Ia-45, Ia-90, Ia-108, Ia-109, Ib-04, Ib-05, Ib-18

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los Ejemplos de Preparación presentaron una eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 100g/ha: Ia-58

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los Ejemplos de Preparación presentaron una eficacia del 90 % a una tasa de aplicación de 100g/ha: Ia-181

**Ensayo con *Tetranychus urticae*; resistente a OP (TETRUR aplicación por pulverización)**

50 Disolventes: 7 partes en peso de dimetilformamida  
Emulsionante: 2 partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

Para producir una preparación adecuada de principio activo, se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades indicadas de disolvente y emulsionante, y el concentrado se diluye con agua que contiene emulsionante a la concentración deseada. Si se requiere la adición de sales de amonio y/o potenciadores de penetración, estos se añaden en cada caso en una concentración de 1000 ppm a la solución de la preparación.

Se pulverizan plantas de judía (*Phaseolus vulgaris*) que están infestadas por todas las fases de la araña roja de invernadero (*Tetranychus urticae*) con una preparación del principio activo de la concentración deseada.

Después de 7 días se determina el efecto en %: El 100 % significa aquí que todos los ácaros araña han muerto; el 0 % significa que ninguna de las arañas rojas ha muerto.

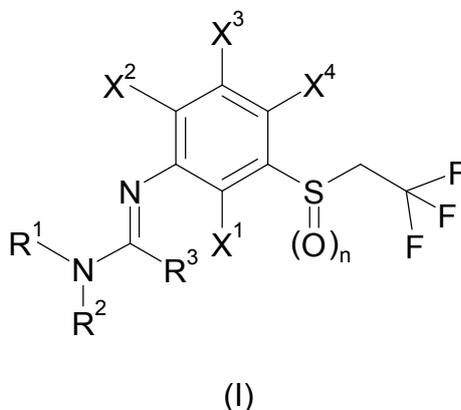
5 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los Ejemplos de Preparación muestran una eficacia del 90 % a una tasa de aplicación de 100 ppm: Ib-44

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los Ejemplos de Preparación muestran una eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 20 ppm: Ib-168

10 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los Ejemplos de Preparación muestran una eficacia  $\geq$  80 % a una tasa de aplicación de 20 ppm: Ib-159

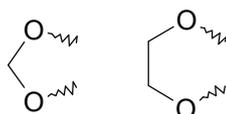
REIVINDICACIONES

1. Derivados de sulfuro de trifluoroetilo sustituido con N-arilamidina de la fórmula (I)

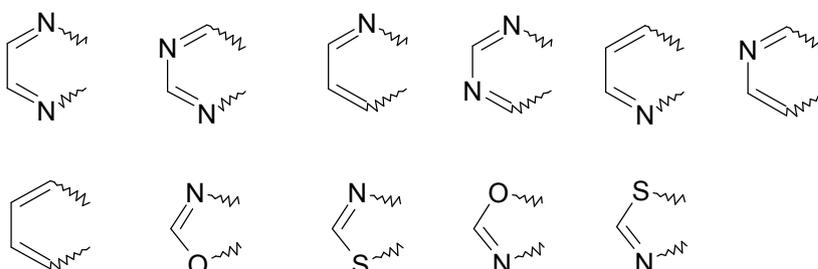


en la que

- 5 n representa los números 0 o 1,  
 $X^1$ ,  $X^2$ ,  $X^3$ ,  $X^4$  independientemente unos de otros representan hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alqueno (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alquino (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), aminotiocarbonilo,  
 10 o representan fenil-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), fenoxi, hetaril-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), hetariloxi, o cicloalquil (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquil (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) eventualmente saturados o insaturados, eventualmente mono- o disustituidos con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) o con cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>) eventualmente saturado o insaturado que está eventualmente interrumpido por un heteroátomo de la serie constituida por O, S o N,  
 15 o representan un cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), fenilo, piridilo, pirimidilo, piridazinilo, pirazinilo, triazinilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, oxadiazolilo, pirazolilo, triazolilo o tetrazolilo que está eventualmente mono- o disustituido con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>),  
 o  $X^2$  y  $X^3$  o  $X^3$  y  $X^4$  pueden formar el siguiente anillo de 5 o 6 miembros que está eventualmente mono- a tetrasustituido con flúor o alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>),



o  $X^2$  y  $X^3$  o  $X^3$  y  $X^4$  pueden formar los anillos condensados siguientes que están eventualmente mono- o disustituidos con sustituyentes iguales o distintos, donde los sustituyentes, independientemente unos de otros, se pueden seleccionar del grupo constituido por hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>),



- 25  $R^3$  representa alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), cianoalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>),  
 o representa un anillo de 3 a 6 miembros saturado o parcialmente saturado que puede contener eventualmente uno a dos heteroátomos de la serie constituida por O, S o N y que está eventualmente mono- o trisustituido con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alqueno (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alquino (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) o sustituido con cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>),  
 30 o representan un anillo aromático de 3 a 6 miembros que está eventualmente mono- o trisustituido con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>),

- haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquenilo (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alquinilo (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), o sustituido con cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>),  
 o representan un anillo aromático de 3 a 6 miembros que contiene uno a dos heteroátomos de la serie constituida por O, S o N y que está eventualmente mono- o trisustituido con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquenilo (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alquinilo (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), o sustituido con cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>),  
 R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup>, independientemente uno de otro, representan hidrógeno, ciano, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), cianoalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), hidroxialquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquenilo (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alquinilo (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>),  
 o representan alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-carbonilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>)-alcoxicarbonilo, arilcarbonilo, tiofenilcarbonilo, piridilcarbonilo, pirimidilcarbonilo, tiazolilcarbonilo, pirazolilcarbonilo, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-sulfínilo, haloalquil (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-sulfínilo, arilsulfínilo, aril-alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-sulfínilo, hetarilsulfínilo, hetaril-alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-sulfínilo, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-sulfonilo, haloalquil (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-sulfonilo, arilsulfonilo, aril-alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-sulfonilo, hetarilsulfonilo, hetaril-alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-sulfonilo eventualmente mono- a trisustituidos de forma independiente unos de otros con sustituyentes del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquenilo (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquenilo (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alquinilo (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-tio, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-sulfínilo, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-sulfonilo, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-amino, di-alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-amino,  
 o representan un anillo saturado o aromático de 3 a 6 miembros que puede contener eventualmente uno a dos heteroátomos de la serie constituida por O, S o N, que puede estar eventualmente interrumpido una o dos veces por C=O y que está eventualmente mono- o trisustituido con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquenilo (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alquinilo (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) o cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>),  
 o representan -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-R<sup>6</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-O-R<sup>6</sup>, donde R<sup>6</sup> representa un anillo de 3 a 6 miembros saturado, parcialmente saturado o aromático que puede contener eventualmente uno a dos heteroátomos de la serie constituida por O, S o N, que puede estar eventualmente interrumpido una o dos veces por C=O y que está eventualmente mono- o trisustituido con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquenilo (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alquinilo (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) o cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), donde m representa los números 1 o 2, o  
 R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos pueden formar un anillo de 3 a 6 miembros saturado o insaturado que está eventualmente mono- o tetrasustituido con flúor, cloro, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) y que puede contener eventualmente otro heteroátomo de la serie constituida por azufre, oxígeno y nitrógeno y/o al menos un grupo carbonilo, o  
 R<sup>1</sup> y R<sup>3</sup> junto con los átomos a los que están unidos pueden formar un anillo de 5 a 6 miembros saturado o insaturado que está eventualmente mono- o polisustituido con metilo, etilo, metoxi, etoxi, flúor, cloro, trifluorometilo, ciclopropilo, ciano, clorociclopropilo, fluorociclopropilo, cianociclopropilo, metilciclopropilo, alcanodiilo (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alquenodiilo (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), butanodienilo (donde el butanodienilo puede estar eventualmente mono- o disustituido con metilo, flúor, cloro, bromo, metoxi o trifluorometilo y/o puede estar eventualmente interrumpido por al menos un átomo de oxígeno o/y nitrógeno) y que contiene otro átomo de azufre o de nitrógeno y puede contener un grupo carbonilo.
2. Compuestos de la fórmula general (I) de acuerdo con la reivindicación 1, en la que  
 n representa los números 0 o 1,  
 X<sup>1</sup> y X<sup>3</sup> representan hidrógeno,  
 X<sup>2</sup> y X<sup>4</sup> independientemente uno de otro representan hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, trifluorometilo, difluorometilo, vinilo, etinilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, OCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, aminotiocarbonilo,  
 o fenilmetilo, fenoxi, piridilmetilo, pirimidilmetilo, tiazolilmetilo, pirazolilmetilo, piridiloxi, pirimidiloxi, tiazoliloxi, pirazoliloxi, ciclopropilmetilo, ciclopropilmetoxi, eventualmente mono- o disustituidos con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, trifluorometoxi, difluorometoxi o ciclopropilo,  
 o representan un cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), fenilo, piridilo, pirimidilo, piridazinilo, pirazinilo, triazinilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, oxadiazolilo, pirazolilo, triazolilo o tetrazolilo que está eventualmente mono- o disustituido con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, trifluorometoxi o con ciclopropilo,  
 en especial, X<sup>2</sup> y X<sup>4</sup> representan las siguientes combinaciones X<sup>2</sup>/X<sup>4</sup>: F/F, Cl/Cl, F/Cl, Cl/F, Br/Br, Br/Cl, Cl/Br, Br/F, F/Br, metilo/metilo, metilo/F, F/metilo, metilo/Cl, Cl/metilo, metilo/Br, Br/metilo, etilo/etilo, etilo/F, F/etilo, etilo/Cl, Cl/etilo, etilo/Br, Br/etilo, metoxi/metilo, metilo/metoxi, metilo/H, etilo/H, cloro/H, bromo/H, flúor/H, metoxi/H, H/cloro, H/flúor, H/bromo, H/metilo, H/metoxi, H/etilo  
 R<sup>3</sup> representa metoximetilo, metoxietilo, cianometilo,  
 o representa un anillo de 3 a 6 miembros saturado o parcialmente saturado que puede contener eventualmente uno a tres heteroátomos de la serie constituida por O, S o N y que puede estar eventualmente mono- o disustituido con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, vinilo, etinilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, trifluoroetoxi o ciclopropilo, en especial, se citan explícitamente los siguientes anillos: ciclopropilo, fenilo, piridilo, pirimidilo, tiazolilo, pirazolilo y tienilo que pueden

estar eventualmente sustituidos con los sustituyentes citados como muy particularmente preferentes,  
o representa un anillo de 3 a 6 miembros aromático que está mono- o disustituido con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, vinilo, etinilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, trifluoroetoxi o ciclopropilo, en especial, se citan explícitamente los siguientes anillos: ciclopropilo, fenilo, piridilo, pirimidilo, tiazolilo, pirazolilo y tienilo que pueden estar sustituidos con los sustituyentes citados como muy particularmente preferentes,

o representa un anillo de 3 a 6 miembros aromático que contiene uno a tres heteroátomos de la serie constituida por O, S o N y que puede estar eventualmente mono- o disustituido con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, vinilo, etinilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, trifluoroetoxi o ciclopropilo, en especial, se citan explícitamente los siguientes anillos: ciclopropilo, fenilo, piridilo, pirimidilo, tiazolilo, pirazolilo y tienilo que pueden estar sustituidos con los sustituyentes citados como muy particularmente preferentes,

$R^1$  representa ciano, cianometilo, metilcarbonilo, etilcarbonilo, propilcarbonilo, isopropilcarbonilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo,

o representa arilcarbonilo, piridilcarbonilo, pirimidilcarbonilo, tiazolilcarbonilo, pirazolilcarbonilo, metilsulfinilo, trifluorometilsulfinilo, metilsulfonilo, trifluorometilsulfonilo eventualmente mono- o disustituidos de forma independiente unos de otros con flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, alilo, butenilo, metoxi, trifluorometoxi, metiltio, metilsulfinilo, metilsulfonilo, metilamino, dimetilamino,

o representa oxetanilo, tietanilo, trimetilenosulfonilo, trimetilenosulfinilo, oxanilo o tianilo que pueden estar eventualmente mono- o polisustituidos con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, vinilo, etinilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, trifluoroetoxi o ciclopropilo,

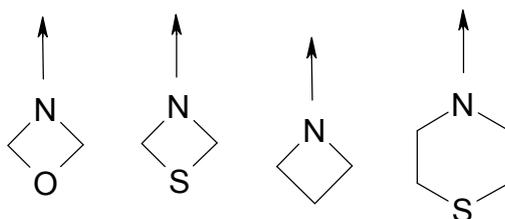
o representa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo que están eventualmente mono- o polisustituidos con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, vinilo, etinilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, trifluoroetoxi o ciclopropilo,

$R^2$  representa hidrógeno, metilo o etilo, o

$R^1$  y  $R^2$  junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos pueden formar un anillo de 3 a 6 miembros saturado o insaturado que está eventualmente mono-, di-, tri- o tetrasustituido con metilo, etilo, metoxi, etoxi, flúor, cloro, bromo, trifluorometilo, difluorometilo y que contiene uno o dos heteroátomos adicionales de la serie constituida por azufre o nitrógeno,

o junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos pueden formar un anillo de 4 miembros saturado o insaturado que está eventualmente mono-, di-, tri- o tetrasustituido con metilo, etilo, metoxi, etoxi, flúor, cloro, bromo, trifluorometilo, difluorometilo y que contiene eventualmente un heteroátomo adicional de la serie constituida por oxígeno, azufre o nitrógeno,

en especial, se citan explícitamente los siguientes anillos,



en los que el átomo de nitrógeno al que  $R^1$  y  $R^2$  están unidos representan el ciclo y la flecha apunta al resto de la molécula, que puede estar eventualmente mono- o disustituido con metilo, etilo, metoxi, etoxi, flúor, cloro, bromo, trifluorometilo, difluorometilo.

3. Compuestos de la fórmula general (I) de acuerdo con la reivindicación 1, en la que

$n$  representa los números 0 o 1,

$X^1$  y  $X^3$  representan hidrógeno,

$X^2$  y  $X^4$  independientemente uno de otro representan hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, trifluorometilo, difluorometilo, vinilo, etinilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi,  $OCH_2CF_3$ , aminotiocarbonilo,

o fenilmetilo, fenoxi, piridilmetilo, pirimidilmetilo, tiazolilmetilo, pirazolilmetilo, piridiloxi, pirimidiloxi, tiazoliloxi, pirazoliloxi, ciclopropilmetilo, ciclopropilmetoxi, eventualmente mono- o disustituidos con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, trifluorometoxi, difluorometoxi o ciclopropilo,

o representan un cicloalquilo ( $C_3-C_6$ ), fenilo, piridilo, pirimidilo, piridazinilo, pirazinilo, triazinilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, oxadiazolilo, pirazolilo, triazolilo o tetrazolilo que están eventualmente mono- o disustituidos con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo,

difluorometilo, metoxi, trifluorometoxi o con ciclopropilo,

en especial,  $X^2$  y  $X^4$  representan las siguientes combinaciones  $X^2/X^4$ : F/F, Cl/Cl, F/Cl, Cl/F, Br/Br, Br/Cl, Cl/Br, Br/F, F/Br, metilo/metilo, metilo/F, F/metilo, metilo/Cl, Cl/metilo, metilo/Br, Br/metilo, etilo/etilo, etilo/F, F/etilo, etilo/Cl, Cl/etilo, etilo/Br, Br/etilo, metoxi/metilo, metilo/metoxi, metilo/H, etilo/H, cloro/H, bromo/H, flúor/H, metoxi/H, H/cloro, H/flúor, H/bromo, H/metilo, H/metoxi, H/etilo

$R^3$  representa metoximetilo, metoxietilo, cianometilo,

o representa ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, piridilo, pirimidilo, pirazinilo, piridazinilo, pirrolilo, furanilo, tiazolilo, pirazolilo o tienilo que pueden estar eventualmente mono- o polisustituidos con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, vinilo, etinilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, trifluoroetoxi o ciclopropilo,

o representa arilo, en particular fenilo, que está mono- o polisustituido con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, vinilo, etinilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, trifluoroetoxi o ciclopropilo,

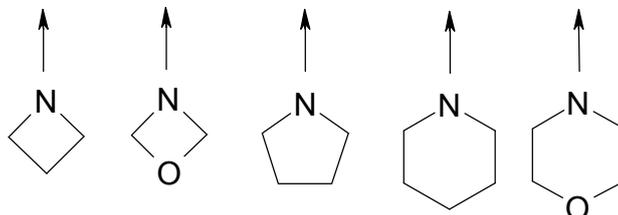
$R^1$  y  $R^2$ , independientemente uno de otro, representan hidrógeno, ciano, metilo, etilo, propilo, butilo, sec-butilo, isopropilo, *terc*-butilo, (2,2,2)-trifluoroetilo, (2,2)-difluorometilo, metoxi, etoxi, cianometilo, metoximetilo, metoxietilo, alilo, butenilo, propinilo, metilcarbonilo, etilcarbonilo, propilcarbonilo, isopropilcarbonilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo,

o representan arilcarbonilo, piridilcarbonilo, pirimidilcarbonilo, tiazolilcarbonilo, pirazolilcarbonilo, metilsulfinilo, trifluorometilsulfinilo, metilsulfonilo, trifluorometilsulfonilo eventualmente mono- o disustituidos de forma independiente unos de otros con flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, alilo, butenilo, metoxi, trifluorometoxi, metiltio, metilsulfinilo, metilsulfonilo, metilamino, dimetilamino,

o representan un anillo saturado o aromático de 3 a 6 miembros que puede contener eventualmente uno a dos heteroátomos de la serie constituida por O, S o N, que puede estar eventualmente interrumpido una, dos o tres veces por C=O y que puede estar eventualmente mono- o trisustituido con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, vinilo, etinilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, trifluoroetoxi y ciclopropilo, en especial, se citan explícitamente los siguientes anillos: ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, oxetano, fenilo, tienilo y piridilo que pueden estar eventualmente sustituidos con los sustituyentes citados como muy particularmente preferentes,

o representan  $-(CH_2)_m-R^6$ , donde  $R^6$  representa un anillo de 3 a 6 miembros saturado, parcialmente saturado o aromático que puede contener eventualmente uno a dos heteroátomos de la serie constituida por O, S o N, que puede estar eventualmente interrumpido una o dos veces por C=O y que puede estar eventualmente mono-, di- o trisustituido con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, vinilo, etinilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, trifluoroetoxi y ciclopropilo, donde m representa el número 1, en especial, los siguientes  $R^6$  se citan explícitamente: ciclopropilo, fenilo y piridilo que pueden estar eventualmente sustituidos con los sustituyentes citados como muy particularmente preferentes, o

$R^1$  y  $R^2$  junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos pueden formar un anillo de 3 a 6 miembros saturado o insaturado que está eventualmente mono-, di-, tri- o tetrasustituido con metilo, etilo, metoxi, etoxi, flúor, cloro, bromo, trifluorometilo, difluorometilo, que puede contener eventualmente uno o dos heteroátomos adicionales de la serie constituida por azufre, oxígeno y nitrógeno (donde los átomos de oxígeno no deben ser directamente adyacentes unos a otros) y/o al menos un grupo  $CH_2$  está reemplazado por un grupo carbonilo, en especial, se citan explícitamente los siguientes anillos:



en los que el átomo de nitrógeno al que  $R^1$  y  $R^2$  están unidos representan el ciclo y la flecha apunta al resto de la molécula, que puede estar mono- o disustituido con metilo, etilo, metoxi, etoxi, flúor, cloro, bromo, trifluorometilo, difluorometilo.

4. Compuesto de la fórmula general (I) de acuerdo con la reivindicación 1, en la que

$n$  representa los números 0 o 1,

$X^1$  y  $X^3$  representan hidrógeno,

$X^2$  y  $X^4$  representan las siguientes combinaciones  $X^2/X^4$ : vinilo/H, H/vinilo, etinilo/H, H/etinilo, metoxi/H, H/metoxi, etoxi/H, H/etoxi, aminotiocarbonilo/H, H/aminotiocarbonilo, vinilo/metilo, metilo/vinilo, etinilo/metilo, metilo/etinilo, metoxi/metilo, metilo/metoxi, etoxi/metilo, metilo/etoxi, aminotiocarbonilo/metilo, metilo/aminotiocarbonilo, vinilo/F,

F/vinilo, etinilo/F, F/etinilo, metoxi/F, F/metoxi, etoxi/F, F/etoxi, aminotiocarbonilo/F, F/aminotiocarbonilo, vinilo/Cl, Cl/vinilo, etinilo/Cl, Cl/etinilo, metoxi/Cl, Cl/metoxi, etoxi/Cl, Cl/etoxi, aminotiocarbonilo/Cl, Cl/aminotiocarbonilo, o fenilmetilo, fenoxi, piridilmetilo, pirimidilmetilo, tiazolilmetilo, pirazolilmetilo, piridiloxi, pirimidiloxi, tiazoliloxi, pirazoliloxi, ciclopropilmetilo, ciclopropilmetoxi eventualmente mono- o disustituidos con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, trifluorometoxi, difluorometoxi o ciclopropilo,

o representan un cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), fenilo, piridilo, pirimidilo, piridazinilo, pirazinilo, triazinilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, oxadiazolilo, pirazolilo, triazolilo o tetrazolilo que está eventualmente mono- o disustituido con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, trifluorometoxi o con ciclopropilo,

R<sup>3</sup> representa metoximetilo, metoxietilo, cianometilo,

o representa un anillo de 3 a 6 miembros saturado o parcialmente saturado que puede contener eventualmente uno a tres heteroátomos de la serie constituida por O, S o N y que puede estar eventualmente mono- o disustituido con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, vinilo, etinilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, trifluoroetoxi o ciclopropilo, en especial, se citan explícitamente los siguientes anillos: ciclopropilo, fenilo, piridilo, pirimidilo, tiazolilo, pirazolilo y tienilo que pueden estar eventualmente sustituidos con los sustituyentes citados como muy particularmente preferentes,

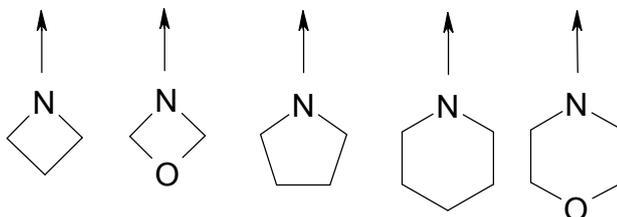
o representa un anillo de 3 a 6 miembros aromático que está mono- o disustituido con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, vinilo, etinilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi o ciclopropilo, en especial, se citan explícitamente los siguientes anillos: ciclopropilo, fenilo, piridilo, pirimidilo, tiazolilo, pirazolilo y tienilo que pueden estar eventualmente sustituidos con los sustituyentes citados como muy particularmente preferentes, o representa un anillo de 3 a 6 miembros aromático que contiene uno a tres heteroátomos de la serie constituida por O, S o N y que puede estar eventualmente mono- o disustituido con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, vinilo, etinilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, trifluoroetoxi o ciclopropilo, en especial, se citan explícitamente los siguientes anillos: ciclopropilo, fenilo, piridilo, pirimidilo, tiazolilo, pirazolilo y tienilo que pueden estar eventualmente sustituidos con los sustituyentes citados como muy particularmente preferentes,

R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup>, independientemente uno de otro, representan hidrógeno, ciano, metilo, etilo, propilo, butilo, *sec*-butilo, isopropilo, *terc*-butilo, (2,2,2)-trifluoroetilo, (2,2)-difluorometilo, metoxi, etoxi, cianometilo, metoximetilo, metoxietilo, alilo, butenilo, propinilo, metilcarbonilo, etilcarbonilo, propilcarbonilo, isopropilcarbonilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo,

o representan arilcarbonilo, piridilcarbonilo, pirimidilcarbonilo, tiazolilcarbonilo, pirazolilcarbonilo, metilsulfinilo, trifluorometilsulfinilo, metilsulfonilo, trifluorometilsulfonilo eventualmente mono- o disustituidos de forma independiente unos de otros con flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, trifluorometilo, alilo, butenilo, metoxi, trifluorometoxi, metiltio, metilsulfinilo, metilsulfonilo, metilamino, dimetilamino,

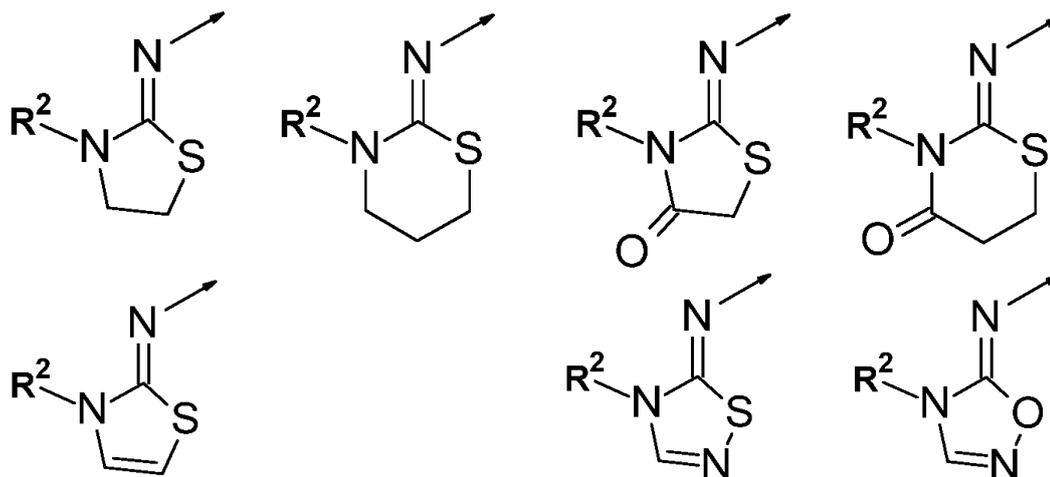
o representan un anillo saturado o aromático de 3 a 6 miembros que puede contener eventualmente uno a dos heteroátomos de la serie constituida por O, S o N, que puede estar eventualmente interrumpido una, dos o tres veces por C=O y que puede estar eventualmente mono- o trisustituido con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, vinilo, etinilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, trifluoroetoxi o ciclopropilo, en especial, se citan explícitamente los siguientes anillos: ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, oxetano, fenilo, tienilo y piridilo que pueden estar eventualmente sustituidos con los sustituyentes citados como muy particularmente preferentes,

o representan -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-R<sup>6</sup>, donde R<sup>6</sup> representa un anillo de 3 a 6 miembros saturado, parcialmente saturado o aromático que puede contener eventualmente uno a dos heteroátomos de la serie constituida por O, S o N, que puede estar eventualmente interrumpido una o dos veces por C=O y que puede estar eventualmente mono-, di- o trisustituido con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, vinilo, etinilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, trifluoroetoxi o ciclopropilo, donde m representa el número 1, en especial, los siguientes R<sup>6</sup> se citan explícitamente: ciclopropilo, fenilo y piridilo que pueden estar eventualmente sustituidos con los sustituyentes citados como muy particularmente preferentes, o R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos pueden formar un anillo de 3 a 6 miembros saturado o insaturado que está eventualmente mono-, di-, tri- o tetrasustituido con metilo, etilo, metoxi, etoxi, flúor, cloro, bromo, trifluorometilo, difluorometilo, que puede contener eventualmente uno o dos heteroátomos adicionales de la serie constituida por azufre, oxígeno y nitrógeno (donde los átomos de oxígeno no deben estar directamente adyacentes unos a otros) y/o al menos un grupo CH<sub>2</sub> está reemplazado por un grupo carbonilo, en especial, se citan explícitamente los siguientes anillos:



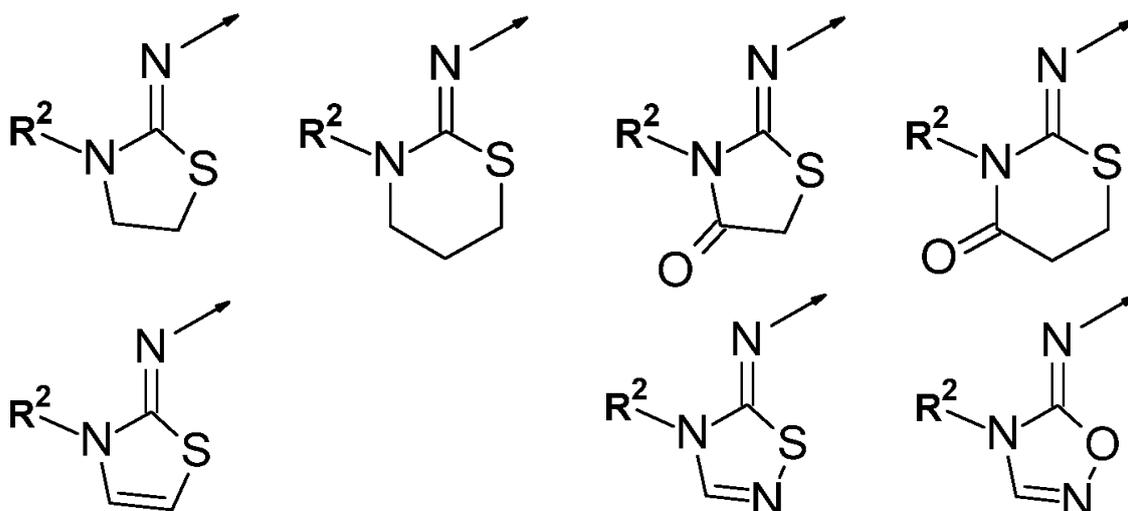
en los que el átomo de nitrógeno al que R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> están unidos representan el ciclo y la flecha apunta al resto de la molécula, que puede estar mono- o disustituido con metilo, etilo, metoxi, etoxi, flúor, cloro, bromo, trifluorometilo, difluorometilo, o

5 R<sup>1</sup> y R<sup>3</sup> junto con los átomos a los que están unidos pueden formar un anillo de 5 a 6 miembros saturado o insaturado y/o uno que está eventualmente mono- o disustituido con metilo, etilo, metoxi, etoxi, flúor, cloro, trifluorometilo, difluorometilo, ciano, ciclopropilo, clorociclopropilo, fluorociclopropilo, cianociclopropilo, metilciclopropilo, alcanodiilo (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>), alquenodiilo (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>), butanodienilo (donde el butanodienilo puede estar eventualmente mono- o disustituido con metilo, flúor, cloro, bromo, metoxi o trifluorometilo y/o puede estar eventualmente interrumpido por al menos un átomo de oxígeno o/y nitrógeno) y que puede contener eventualmente otro átomo de azufre o de nitrógeno adicionales y un grupo carbonilo, en especial R<sup>1</sup> y R<sup>3</sup> junto con los átomos a los que están unidos representan los siguientes grupos,



15 cada uno de los cuales puede estar eventualmente mono- o disustituido con metilo, etilo, metoxi, etoxi, flúor, cloro, trifluorometilo, difluorometilo, ciclopropilo, clorociclopropilo, fluorociclopropilo, cianociclopropilo, metilciclopropilo, donde la flecha apunta al resto de la molécula.

5. Compuestos de la fórmula general (I) de acuerdo con la reivindicación 1, en la que  
 n representa los números 0 o 1,  
 20 X<sup>1</sup> y X<sup>3</sup> representan hidrógeno,  
 X<sup>2</sup> y X<sup>4</sup>, independientemente uno de otro, representan hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, trifluorometilo, difluorometilo, vinilo, etinilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, OCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, aminotiocarbonilo, o fenilmetilo, fenoxi, piridilmetilo, pirimidilmetilo, tiazolilmetilo, pirazolilmetilo, piridiloxi, pirimidiloxi, tiazoliloxi, pirazoliloxi, ciclopropilmetilo, ciclopropilmetoxi, eventualmente mono- o disustituidos con sustituyentes iguales o  
 25 distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, trifluorometoxi, difluorometoxi o ciclopropilo, o representan un cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), fenilo, piridilo, pirimidilo, piridazinilo, pirazinilo, triazinilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, oxadiazolilo, pirazolilo, triazolilo o tetrazolilo que están eventualmente mono- o disustituidos con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, trifluorometoxi o con ciclopropilo,  
 30 en especial, X<sup>2</sup> y X<sup>4</sup> representan las siguientes combinaciones X<sup>2</sup>/X<sup>4</sup>: F/F, Cl/Cl, F/Cl, Cl/F, Br/Br, Br/Cl, Cl/Br, Br/F, F/Br, metilo/metilo, metilo/F, F/metilo, metilo/Cl, Cl/metilo, metilo/Br, Br/metilo, etilo/etilo, etilo/F, F/etilo, etilo/Cl, Cl/etilo, etilo/Br, Br/etilo, metoxi/metilo, metilo/metoxi, metilo/H, etilo/H, cloro/H, bromo/H, flúor/H, metoxi/H, H/cloro, H/flúor, H/bromo, H/metilo, H/metoxi, H/etilo  
 35 R<sup>1</sup> y R<sup>3</sup> junto con los átomos a los que están unidos pueden formar un anillo de 5 a 6 miembros saturado o insaturado y/o que está eventualmente mono- o disustituido con metilo, etilo, metoxi, etoxi, flúor, cloro, trifluorometilo, difluorometilo, ciano, ciclopropilo, clorociclopropilo, fluorociclopropilo, cianociclopropilo, metilciclopropilo, alcanodiilo (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>), alquenodiilo (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>), butanodienilo (donde el butanodienilo puede estar eventualmente mono- o disustituido con metilo, flúor, cloro, bromo, metoxi o trifluorometilo y/o puede estar eventualmente interrumpido por al menos un  
 40 átomo de oxígeno o/y de nitrógeno) y que puede contener otro átomo de azufre o nitrógeno y un grupo carbonilo, en especial R<sup>1</sup> y R<sup>3</sup> junto con los átomos a los que están unidos representan los siguientes grupos,



5 cada uno de los cuales puede estar eventualmente mono- o disustituido con metilo, etilo, metoxi, etoxi, flúor, cloro, trifluorometilo, difluorometilo, ciclopropilo, clorociclopropilo, fluorociclopropilo, cianociclopropilo, metilciclopropilo, donde la flecha apunta al resto de la molécula,

R<sup>2</sup> representa ciano, (2,2,2)-trifluoroetilo, (2,2)-difluorometilo, 2-cloro-(2,2)-difluoroetilo, (2,2)-dicloro-2-fluoroetilo, (2,2,2)-tricloroetilo, pentafluoroetilo, 2-clorotetrafluoroetilo, alilo, butenilo, propinilo, metilsulfinilo, trifluorometilsulfinilo, metilsulfonilo, trifluorometilsulfonilo,

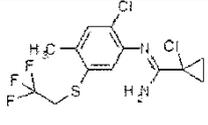
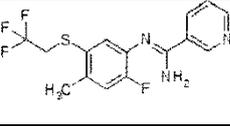
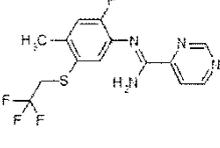
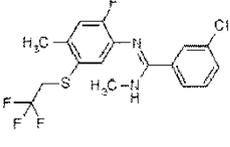
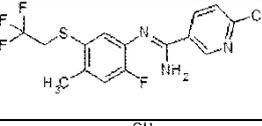
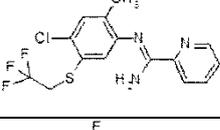
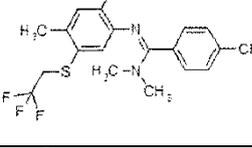
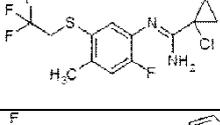
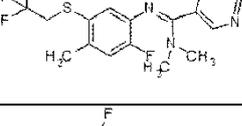
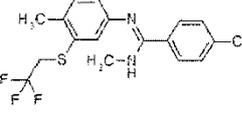
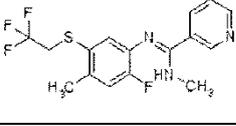
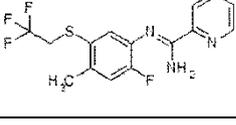
10 o representa un anillo saturado o aromático de 3 a 6 miembros que puede contener eventualmente uno a dos heteroátomos de la serie constituida por O, S o N, que puede estar eventualmente interrumpido una, dos o tres veces por C=O y que puede estar eventualmente mono- o trisustituido con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, vinilo, etinilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, trifluoroetoxi o ciclopropilo, en especial, se citan explícitamente los siguientes anillos: ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, oxetano, fenilo, tienilo y piridilo que pueden estar eventualmente sustituidos con los sustituyentes citados como muy particularmente preferentes,

15 o representan  $-(CH_2)_m-R^6$ , donde R<sup>6</sup> representa un anillo de 3 a 6 miembros saturado, parcialmente saturado o aromático que puede contener eventualmente uno a dos heteroátomos de la serie constituida por O, S o N, que puede estar eventualmente interrumpido una o dos veces por C=O y que puede estar eventualmente mono-, di- o trisustituido con sustituyentes iguales o distintos del grupo constituido por flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, vinilo, etinilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, trifluoroetoxi o ciclopropilo, donde m representa el número 1, en especial, los siguientes R<sup>6</sup> se citan explícitamente: ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, fenilo y piridilo que pueden estar eventualmente sustituidos con los sustituyentes citados como muy particularmente preferentes.

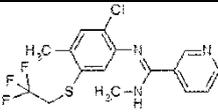
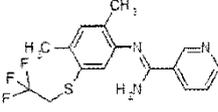
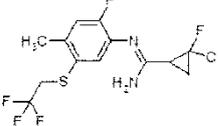
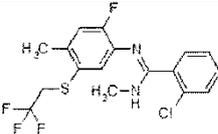
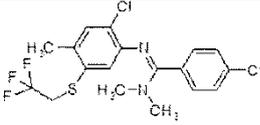
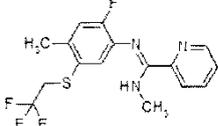
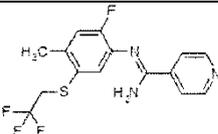
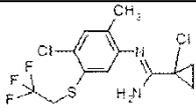
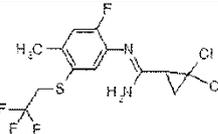
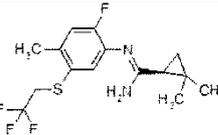
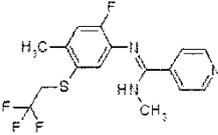
25 6. Compuesto de acuerdo con la fórmula 1, **caracterizado porque** el compuesto presenta una estructura que está seleccionada de

N.º	Estructura
1a-27	
1a-29	
1a-33	
1a-34	

(continuación)

N.º	Estructura
la-36	
la-40	
la-42	
la-44	
la-46	
la-49	
la-50	
la-58	
la-59	
la-60	
la-61	
la-63	

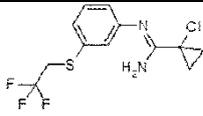
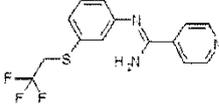
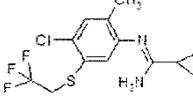
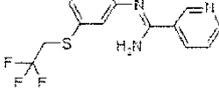
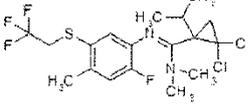
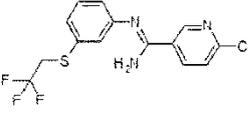
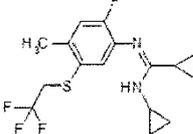
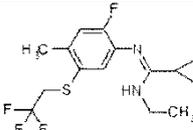
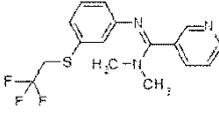
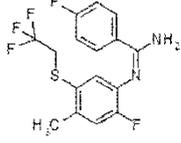
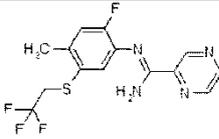
(continuación)

N.º	Estructura
1a-64	
1a-66	
1a-67	
1a-69	
1a-71	
1a-72	
1a-73	
1a-74	
1a-75	
1a-79	
1a-80	

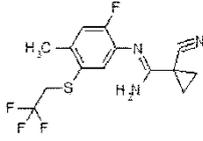
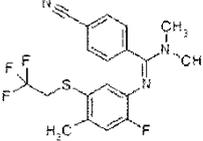
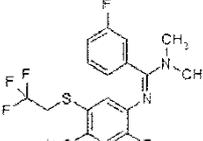
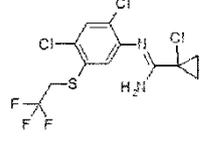
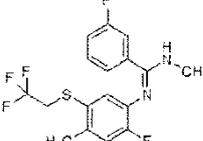
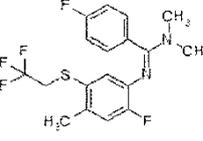
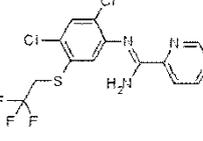
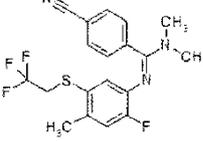
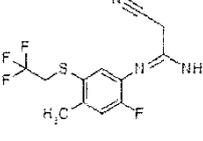
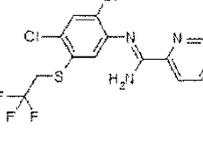
(continuación)

N.º	Estructura
la-81	
la-82	
la-83	
la-84	
la-86	
la-91	
la-92	
la-93	
la-94	
la-95	
la-98	
la-99	

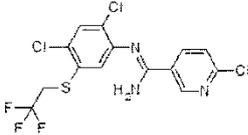
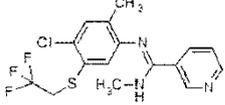
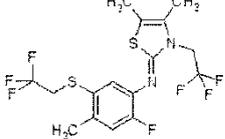
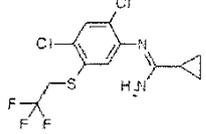
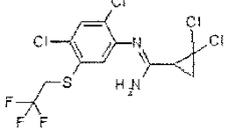
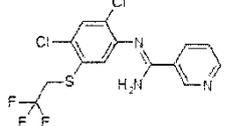
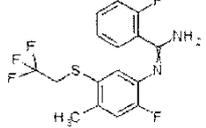
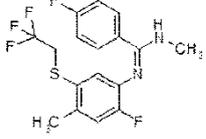
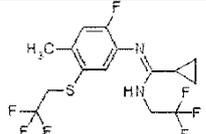
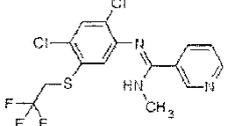
(continuación)

N.º	Estructura
Ia-100	
Ia-101	
Ia-102	
Ia-104	
Ia-106	
Ia-107	
Ia-108	
Ia-110	
Ia-114	
Ia-116	
Ia-117	

(continuación)

N.º	Estructura
la-118	
la-119	
la-120	
la-123	
la-126	
la-128	
la-130	
la-131	
la-132	
la-134	

(continuación)

N.º	Estructura
Ia-135	
Ia-136	
Ia-138	
Ia-139	
Ia-140	
Ia-141	
Ia-143	
Ia-144	
Ia-145	
Ia-146	

(continuación)

N.º	Estructura
la-147	
la-148	
la-149	
la-150	
la-151	
la-152	
la-153	
la-156	
la-158	
la-159	

(continuación)

N.º	Estructura
la-160	
la-161	
la-162	
la-163	
la-165	
la-166	
la-167	
la-168	
la-169	
la-172	

(continuación)

N.º	Estructura
la-173	
la-175	
la-176	
la-177	
la-181	
la-182	
la-183	
la-185	
la-186	
la-187	

(continuación)

N.º	Estructura
1a-188	
1a-190	
1a-192	
1a-193	
1a-194	
1a-195	
1a-196	
1a-197	
1a-198	

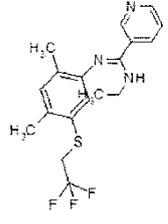
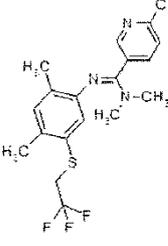
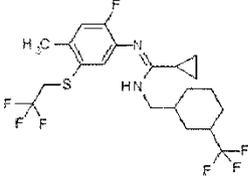
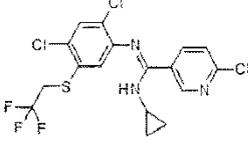
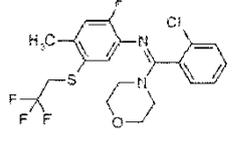
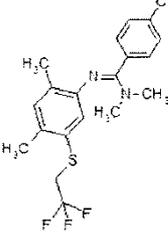
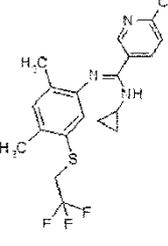
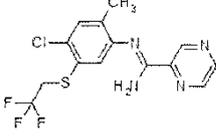
(continuación)

N.º	Estructura
la-199	
la-200	
la-203	
la-206	
la-207	
la-208	
la-209	
la-211	

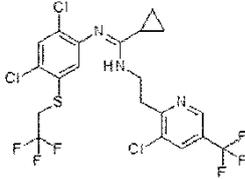
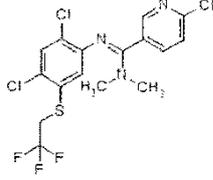
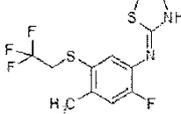
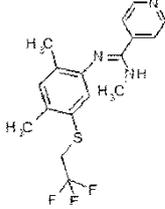
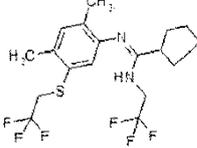
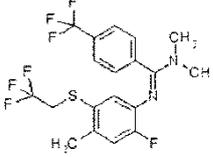
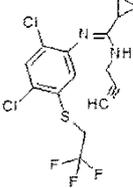
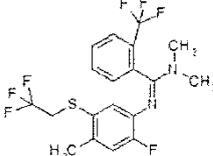
(continuación)

N.º	Estructura
la-212	
la-214	
la-215	
la-218	
la-219	
la-220	
la-221	
la-223	

(continuación)

N.º	Estructura
1a-224	
1a-227	
1a-228	
1a-229	
1a-230	
1a-231	
1a-232	
1a-234	

(continuación)

N.º	Estructura
la-235	
la-237	
la-238	
la-239	
la-241	
la-242	
la-244	
la-245	

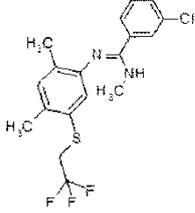
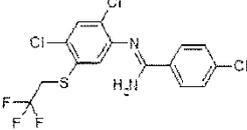
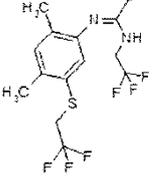
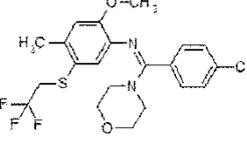
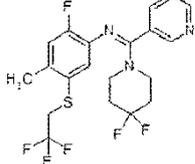
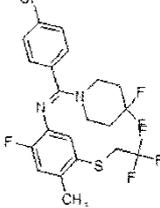
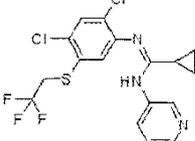
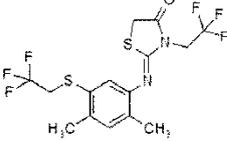
(continuación)

N.º	Estructura
la-247	
la-248	
la-249	
la-250	
la-251	
la-252	
la-253	
la-254	
la-255	

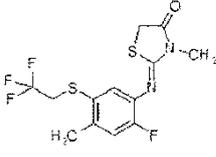
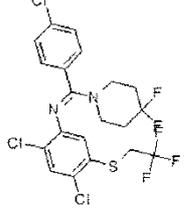
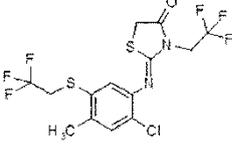
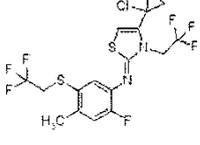
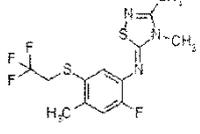
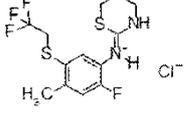
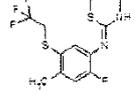
(continuación)

N.º	Estructura
la-256	
la-257	
la-258	
la-259	
la-260	
la-261	
la-262	
la-263	
la-264	

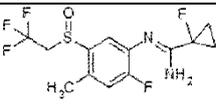
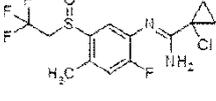
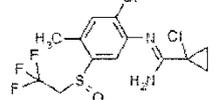
(continuación)

N.º	Estructura
1a-265	
1a-266	
1a-267	
1a-268	
1a-269	
1a-270	
1a-271	
1a-272	

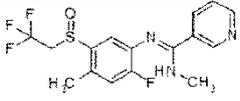
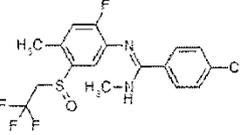
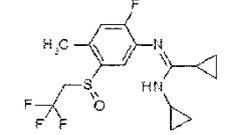
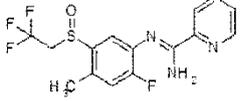
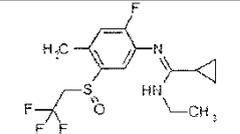
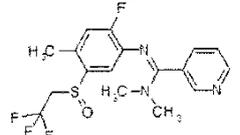
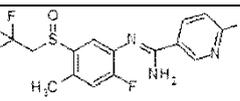
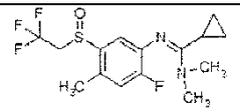
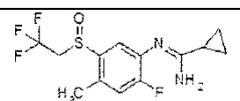
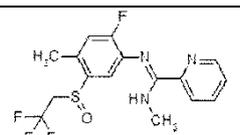
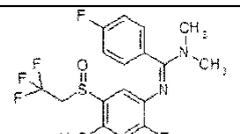
(continuación)

N.º	Estructura
la-273	
la-274	
la-275	
la-276	
la-277	
la-278	
la-279	

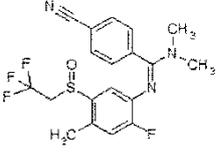
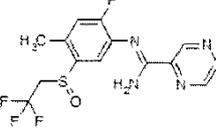
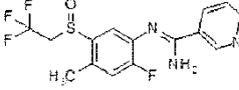
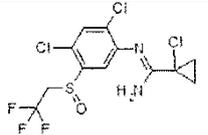
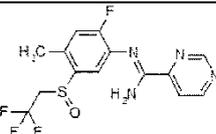
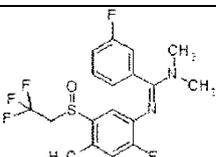
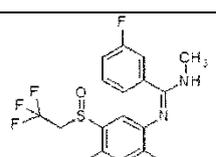
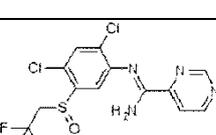
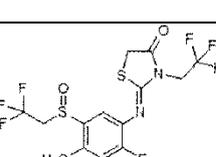
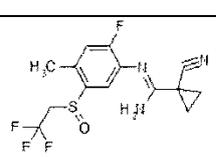
o de

N.º	Estructura
lb-19	
lb-22	
lb-27	

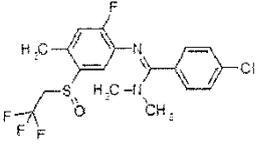
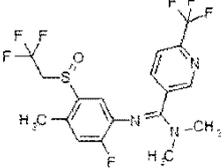
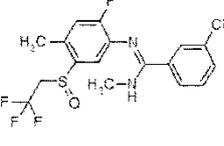
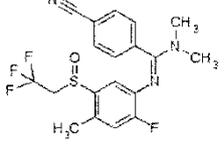
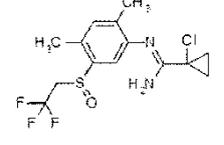
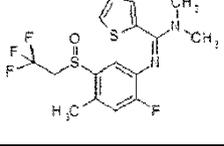
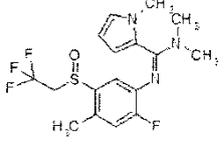
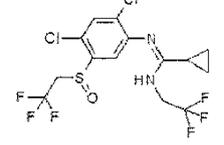
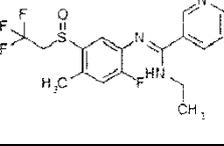
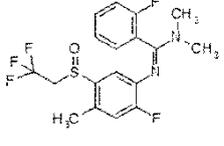
(continuación)

N.º	Estructura
Ib-28	
Ib-37	
Ib-39	
Ib-45	
Ib-46	
Ib-47	
Ib-48	
Ib-51	
Ib-53	
Ib-58	
Ib-60	

(continuación)

N.º	Estructura
lb-61	
lb-62	
lb-63	
lb-64	
lb-65	
lb-66	
lb-67	
lb-69	
lb-71	
lb-72	

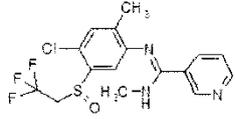
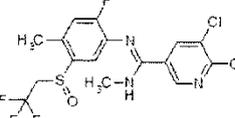
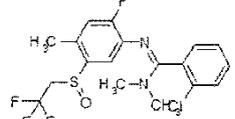
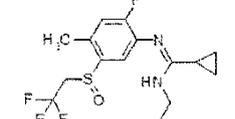
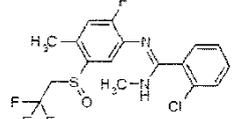
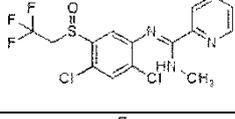
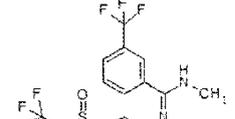
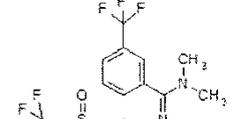
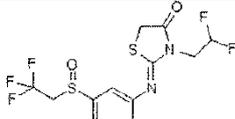
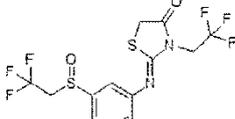
(continuación)

N.º	Estructura
lb-73	
lb-75	
lb-76	
lb-77	
lb-79	
lb-81	
lb-82	
lb-83	
lb-84	
lb-87	

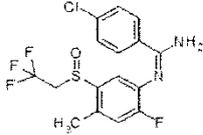
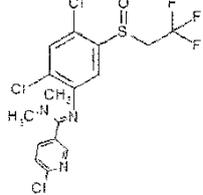
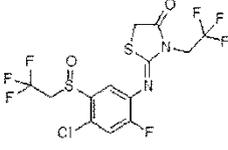
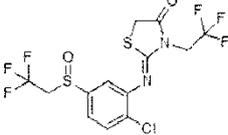
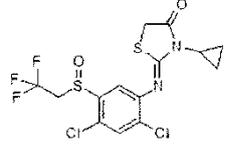
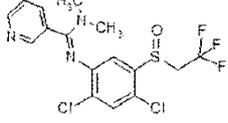
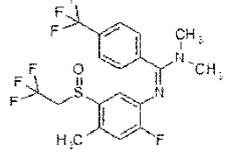
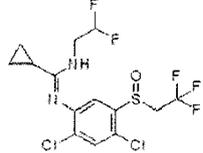
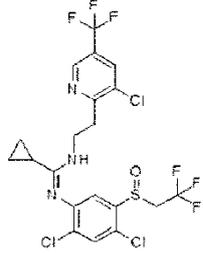
(continuación)

N.º	Estructura
Ib-88	
Ib-89	
Ib-92	
Ib-93	
Ib-94	
Ib-95	
Ib-97	
Ib-98	
Ib-99	
Ib-100	
Ib-102	

(continuación)

N.º	Estructura
Ib-103	
Ib-104	
Ib-105	
Ib-106	
Ib-107	
Ib-109	
Ib-113	
Ib-114	
Ib-116	
Ib-117	

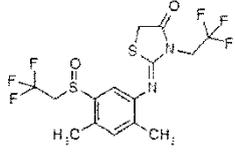
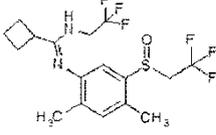
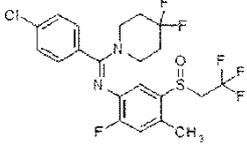
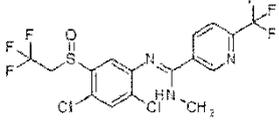
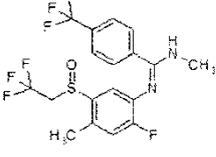
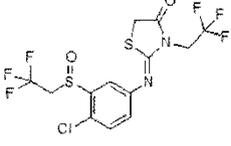
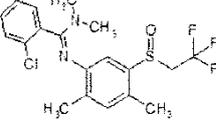
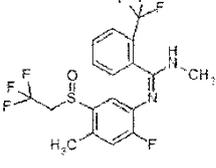
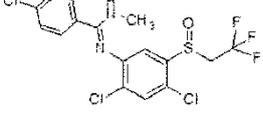
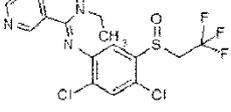
(continuación)

N.º	Estructura
Ib-118	
Ib-119	
Ib-120	
Ib-121	
Ib-122	
Ib-123	
Ib-124	
Ib-129	
Ib-130	

(continuación)

N.º	Estructura
Ib-131	
Ib-132	
Ib-133	
Ib-134	
Ib-135	
Ib-136	
Ib-137	
Ib-138	
Ib-139	
Ib-140	

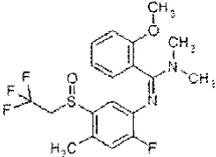
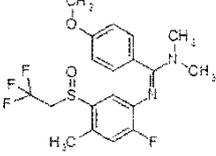
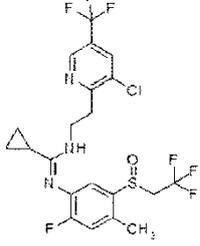
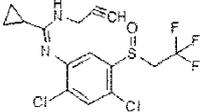
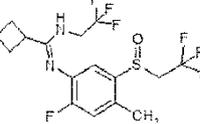
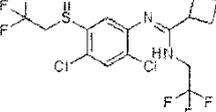
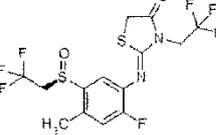
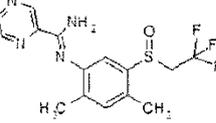
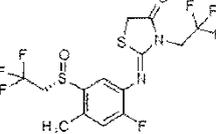
(continuación)

N.º	Estructura
Ib-141	
Ib-142	
Ib-143	
Ib-144	
Ib-145	
Ib-146	
Ib-147	
Ib-148	
Ib-149	
Ib-150	

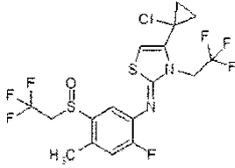
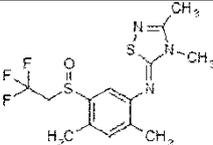
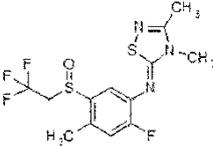
(continuación)

N.º	Estructura
Ib-151	
Ib-152	
Ib-153	
Ib-154	
Ib-155	
Ib-156	
Ib-157	
Ib-158	
Ib-159	
Ib-160	

(continuación)

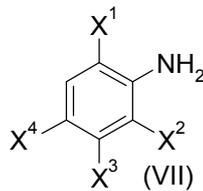
N.º	Estructura
Ib-161	
Ib-162	
Ib-163	
Ib-165	
Ib-166	
Ib-167	
Ib-168	
Ib-170	
Ib-171	

(continuación)

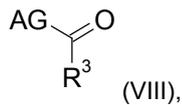
N.º	Estructura
Ib-172	
Ib-173	
Ib-174	

7. Procedimiento de preparación de compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 6, **caracterizado porque**

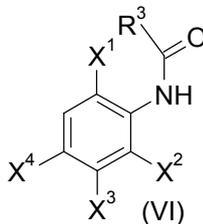
(A) anilinas de la fórmula (VII)



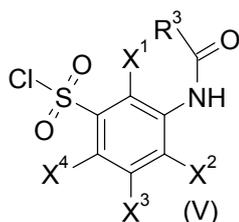
se convierten en presencia de ácidos, anhídridos de ácido o cloruros de ácido de la fórmula (VIII)



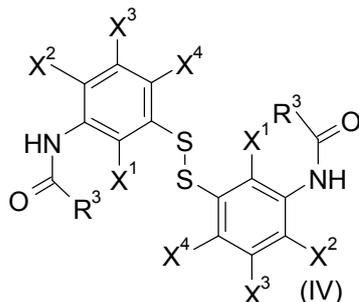
en la que AG representa un grupo saliente, en anilidas de la fórmula general (VI),



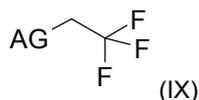
(B) anilidas de la fórmula (VI) se convierten por clorosulfonación con ácido clorosulfónico en cloruros de sulfonilo de la fórmula general (V),



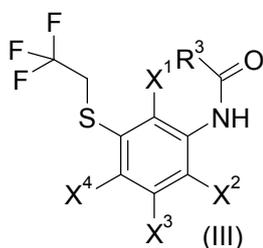
(C) cloruros de sulfonilo de la fórmula (V) se convierten por reducción con hierro en ácido clorhídrico o yoduro en disulfuros de la fórmula general (IV),



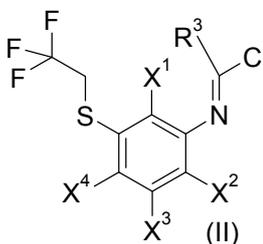
5 (D) disulfuros de la fórmula (IV) se convierten con electrófilos de trifluoroetilo de la fórmula (IX)



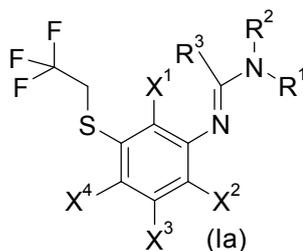
en la que AG representa un grupo saliente tal como, por ejemplo, cloro, bromo, tosilato, mesilato o triflato, en sulfuros de la fórmula general (III)



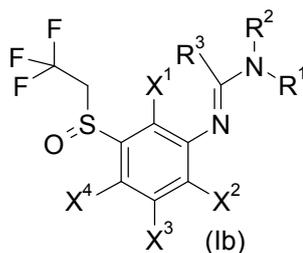
10 (E) los compuestos de la fórmula (III) se convierten con clorofosfato de difenilo o pentacloruro de fósforo en cloruros de imidoilo de la fórmula general (II),



(F) los compuestos de la fórmula general (II) se convierten con aminas en amidinas de la fórmula general (Ia),



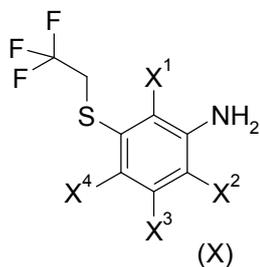
(G) los compuestos de la fórmula (IA) se convierten con agentes oxidantes en sulfóxidos de la fórmula general (Ib),



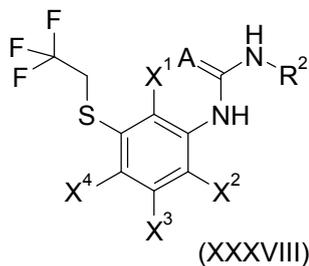
5 en la que  $X^1, X^2, X^3, X^4, R^1, R^2$  y  $R^3$  tienen los significados dados antes.

8. Procedimiento de preparación de compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 6, **caracterizado porque**

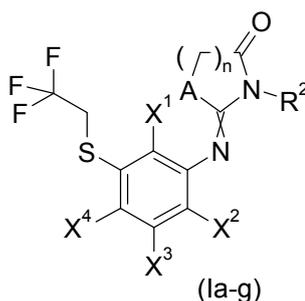
(A) anilinas de la fórmula (X)



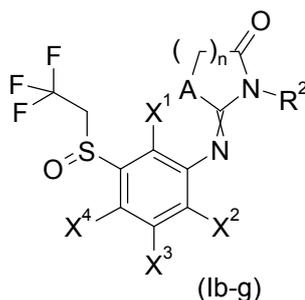
10 se convierten con isocianatos, eventualmente en presencia de una base y eventualmente en presencia de un disolvente orgánico, en compuestos de la fórmula (XXXVIII),



(B) compuestos de la fórmula (XXXVIII) se convierten eventualmente por cicloacilación en compuestos de la fórmula general (Ia-g),



(C) estos compuestos de la fórmula (Ia-g) se oxidan a compuestos de la fórmula (Ib-g),



en la que A representa oxígeno o azufre y  $X^1$ ,  $X^2$ ,  $X^3$ ,  $X^4$  y  $R^2$  tienen los significados dados antes.

- 5 9. Composición de principio activo que contiene al menos un compuesto de la fórmula general (I) de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 6 y al menos otro principio activo con actividad insecticida, acaricida o nematocida seleccionado del grupo constituido por

- (1) Inhibidores de la acetilcolinesterasa (AChE) tales como, por ejemplo, carbamatos, por ejemplo, alanicarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxicarboxim, carbarilo, carbofurano, carbosulfano, etiofencarb, fenobucarb, formetanato, furatiocarb, isoprocarb, metiocarb, metomilo, metolcarb, oxamilo, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, triazamato, trimetacarb, XMC y xililcarb; o organofosfatos, por ejemplo, acefato, azametifos, azinfos-étilo, azinfos-metilo, cadusafos, cloretoxifos, clorfenvinfos, clormefos, clorpirifos, clorpirifos-metilo, cumafos, cianofos, demeton-S-metilo, diazinona, diclorvos/DDVP, dicrotofos, dimetoato, dimetilvinfos, disulfoton, EPN, etion, etoprofos, famfur, fenamifos, fenitrothion, fention, fostiazato, heptenofos, imidiafos, isofenfos, O-(metoxiaminotiofosforil)salicilato de isopropilo, isoxation, malation, mecarbam, metamidofos, metidation, mevinfos, monocrotofos, naled, ometoato, oxidemeton-metilo, paration, paration-metilo, fentoato, forato, fosalona, fosmet, fosfamidon, foxim, pirimifos-metilo, profenofos, propetamfos, protiofos, piraclofos, piridafention, quinalfos, sulfotep, tebupirimfos, temefos, terbufos, tetraclorvinfos, tiometon, triazofos, triclorfon y vamidotion.
- (2) Antagonistas de los canales de cloruro dependientes de GABA tales como, por ejemplo ciclodieno organoclorados, por ejemplo, clordano, endosulfán; o fenilpirazoles (fiproles), por ejemplo, etiprol y fipronilo.
- (3) Moduladores de los canales de sodio/bloqueantes de canales de sodio dependientes de voltaje tales como, por ejemplo piretroides, por ejemplo, acrinatrina, aletrina, d-cis-trans-aletrina, d-trans-aletrina, bifentrina, bioaletrina, isómero S-ciclopentenilo de bioaletrina, bioresmetrina, cicloprotrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, lambda-cihalotrina, gamma-cihalotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, beta-cipermetrina, teta-cipermetrina, zeta-cipermetrina, cifenotrina [isómeros (1R)-trans], deltametrina, empentrina [isómeros (EZ)-(1R)], esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flumetrina, tau-fluvalinato, halfenprox, imiprotrina, kadetrina, permetrina, fenotrina [isómero (1R)-trans], praletrina, piretrinas (piretro), resmetrina, silafluofeno, teflutrina, tetrametrina [isómeros (1R)], tralometrina y transflutrina; o DDT; o metoxiclor.
- (4) Agonistas de los receptores nicotínicos de acetilcolina (nAChR) tales como, por ejemplo neonicotinoides, por ejemplo, acetamiprid, clotianidina, dinotefurano, imidacloprid, nitenpiram, tiacloprid y tiametoxam; o nicotina.
- (5) Activadores alostéricos de los receptores nicotínicos de acetilcolina (nAChR) tales como, por ejemplo espinosinas, por ejemplo, espinetoram y espinosad.
- (6) Activadores de los canales de cloruro tales como, por ejemplo avermectinas/milbemecinas, por ejemplo, abamectina, benzoato de emamectina, lepimectina y milbemectina.
- (7) Miméticos de hormonas juveniles tales como, por ejemplo, análogos de hormonas juveniles, por ejemplo hidropreno, kinopreno y metopreno; o

fenoxicarb o piriproxifeno.

(8) Principios activos con mecanismos de acción desconocidos o no específicos tales como, por ejemplo haluros de alquilo, por ejemplo, bromuro de metilo y otros haluros de alquilo; o cloropricina; o fluoruro de sulfuro; o borax, o tártaro emético.

(9) Bloqueantes selectivos de la nutrición, por ejemplo pimetrozina o flonicamid.

(10) Inhibidores de crecimiento de ácaros, por ejemplo clofentezina, hexitiazox y diflovidazina; o etoxazol.

(11) Alteradores microbianos de la membrana del intestino de insectos, por ejemplo, *Bacillus thuringiensis* subespecie *israelensis*, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus thuringiensis* subespecie *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subespecie *kurstaki*, *Bacillus thuringiensis* subespecie *tenebrionis*, y proteínas vegetales BT: Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry2Ab, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb, Cry34/35Ab1.

(12) Inhibidores de la fosforilación oxidativa, alteradores de la ATP tales como, por ejemplo diafentiuron; o compuestos de organoestaño, por ejemplo, azociclotina, cihexatina y óxido de fenbutatina; o propargita o tetradifon.

(13) Desacopladores de la fosforilación oxidativa por medio de la interrupción del gradiente de protones H tales como, por ejemplo clorfenapir, DNOC y sulfuramid.

(14) Antagonistas del receptor nicotínico de la acetilcolina tales como, por ejemplo, bensultap, clorhidrato de cartap, tiociclam y tiosultap-sodio.

(15) Inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 0, tales como, por ejemplo bistrifluron, clorfluazuron, diflubenzuron, flucicloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, teflubenzuron y triflumuron.

(16) Inhibidores de biosíntesis de quitina, de tipo 1, tales como, por ejemplo, buprofezina.

(17) Agentes de alteración de la muda de dípteros, tales como, por ejemplo, ciromazina.

(18) Agonistas del receptor de ecdisona tales como, por ejemplo, cromafeno, halofeno, metoxifeno y tebufeno.

(19) Agonistas octopaminérgicos tales como, por ejemplo, amitraz.

(20) Inhibidores del transporte de electrones del complejo III, tales como, por ejemplo, hidrametilnona; o acequinocilo; o fluacopirim.

(21) Inhibidores de transporte de electrones del complejo I, por ejemplo, acaricidas METI, por ejemplo, fenazaquina, fenpiroximato, pirimidifeno, piridaben, tebufenpirad y tolfenpirad; o rotenona (Derris).

(22) Bloqueantes de los canales sodio dependientes de tensión, por ejemplo, indoxacarb; o metaflumizona.

(23) Inhibidores de la acetilCoA carboxilasa, tales como, por ejemplo, derivados de ácido tetrónico o tetrámico, por ejemplo espirodiclofeno, espiromesifeno y espirotetramat.

(24) Inhibidores de transporte de electrones del complejo IV, tales como, por ejemplo, fosfuros, por ejemplo, fosfuro de aluminio, fosfuro de calcio, fosfina y fosfuro de cinc; o cianuro.

(25) Inhibidores de transporte de electrones del complejo II, tales como, por ejemplo, cienopirafeno.

(28) Efectores del receptor de rianodina, tales como, por ejemplo,

diamidas, por ejemplo clorantraniliprol, ciantraniliprol y flubendiamida;

otros principios activos con mecanismo de acción desconocido, tales como, por ejemplo, amidoflumet, azadiractina, benclotiaz, benzoximato, bifenazato, bromopropilato, quinometionat, criolita, ciantraniliprol (Cyazypyr), ciflumetofeno, dicofol, diflovidazina, fluensulfona, flufenimer, flupirrol, flupiram, flufenozida, imidacloprid, iprodiona, meperflutrina, piridilol, pirifluquinazon, tetrametilfutrina y yodometano; y además preparaciones basadas en *Bacillus firmus* (en particular, la cepa CNCM I-1582, por ejemplo, VOTIVO™, BioNem) y los siguientes compuestos activos conocidos:

3-bromo-N-{2-bromo-4-cloro-6-[(1-ciclopropil)etil]carbamoil}fenil-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-carboxamida, 4-[[[(6-bromopirid-3-il)metil](2-fluoroetil)amino]furan-2(5H)-ona (conocida por el documento WO 2007/115644), 4-[[[(6-fluoropirid-3-il)metil](2,2-difluoroetil)amino]furan-2(5H)-ona (conocida por el documento WO 2007/115644), 4-[[[(2-cloro-1,3-tiazol-5-il)metil](2-fluoroetil)amino]furan-2(5H)-ona (conocida por el documento WO 2007/115644), 4-[[[(6-cloropirid-3-il)metil](2-fluoroetil)amino]furan-2(5H)-ona (conocida por el documento WO 2007/115644), 4-[[[(6-cloro-5-fluoropirid-3-il)metil](metil)amino]furan-2(5H)-ona (conocida por el documento WO 2007/115643), 4-[[[(5,6-dicloropirid-3-il)metil](2-fluoroetil)amino]furan-2(5H)-ona (conocida por el documento WO 2007/115646), 4-[[[(6-cloro-5-fluoropirid-3-il)metil](ciclopropil)amino]furan-2(5H)-ona (conocida por el documento WO 2007/115643), 4-[[[(6-cloropirid-3-il)metil](ciclopropil)amino]furan-2(5H)-ona (conocida por el documento EP-A-0 539 588), 4-[[[(6-cloropirid-3-il)metil](metil)amino]furan-2(5H)-ona (conocida por el documento EP-A-0 539 588), {1-(6-cloropiridin-3-il)etil}(metil)óxido-λ<sup>4</sup>-sulfaniliden}cianamida (conocida por el documento WO 2007/149134) y sus diastereómeros {[(1R)-1-(6-cloropiridin-3-il)etil](metil)óxido-λ<sup>4</sup>-sulfaniliden}cianamida (A) y {[(1S)-1-(6-cloropiridin-3-il)etil](metil)óxido-λ<sup>4</sup>-sulfanilideo}cianamida (B) (igualmente conocidas por el documento WO 2007/149134) y también sulfoxaflor y sus diastereómeros [(R)-metil(óxido){(1R)-1-[6-(trifluorometil)piridin-3-il]etil}-λ<sup>4</sup>-sulfaniliden]cianamida (A1) y [(S)-metil(óxido){(1S)-1-[6-(trifluorometil)piridin-3-il]etil}-λ<sup>4</sup>-sulfaniliden]cianamida (A2), identificados como grupo de diastereómeros A (conocidas por el documento WO 2010/074747, WO 2010/074751), [(R)-metil(óxido){(1S)-1-[6-(trifluorometil)piridin-3-il]etil}-λ<sup>4</sup>-sulfaniliden]cianamida (B1) y [(S)-metil(óxido){(1R)-1-[6-(trifluorometil)piridin-3-il]etil}-λ<sup>4</sup>-sulfaniliden]cianamida

(B2), identificados como grupo de diastereómeros B (igualmente conocidas por el documento WO 2010/074747, WO 2010/074751) y 11-(4-cloro-2,6-dimetilfenil)-12-hidroxi-1,4-dioxo-9-azadiespiro[4.2.4.2]tetradec-11-en-10-ona (conocida por el documento WO 2006/089633), 3-(4'-fluoro-2,4-dimetilbifenil-3-il)-4-hidroxi-8-oxa-1-azaespiro[4.5]dec-3-en-2-ona (conocida por el documento WO 2008/067911), 1-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfenil]fenil}-3-(trifluorometil)-1H-1,2,4-triazol-5-amina (conocida por el documento WO 2006/043635), ciclopropanocarboxilato de [(3S,4aR,12R,12aS,12bS)-3-[(ciclopropilcarbonil)oxi]-6,12-dihidroxi-4,12b-dimetil-11-oxo-9-(piridin-3-il)-1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-decahidro-2H,11H-benzof]pirano[4,3-b]cromen-4-il]metilo (conocido por el documento WO 2008/066153), 2-ciano-3-(difluorometoxi)-N,N-dimetilbencenosulfonamida (conocida por el documento WO 2006/056433), 2-ciano-3-(difluorometoxi)-N-metilbencenosulfonamida (conocida por el documento WO 2006/100288), 2-ciano-3-(difluorometoxi)-N-etilbencenosulfonamida (conocida por el documento WO 2005/035486), 4-(difluorometoxi)-N-etil-N-metil-1,2-benzotiazol-3-amina 1,1-dióxido (conocido por el documento WO 2007/057407), N-[1-(2,3-dimetilfenil)-2-(3,5-dimetilfenil)etil]-4,5-dihidro-1,3-tiazol-2-amina (conocida por el documento WO 2008/104503), {1'-[(2E)-3-(4-clorofenil)prop-2-en-1-il]-5-fluoroespiro[indol-3,4'-piperidin]-1(2H)-il]}(2-cloropiridin-4-il)metanona (conocida por el documento WO 2003/106457), 3-(2,5-dimetilfenil)-4-hidroxi-8-metoxi-1,8-diazaespiro[4.5]dec-3-en-2-ona (conocida por el documento WO 2009/049851), carbonato de 3-(2,5-dimetilfenil)-8-metoxi-2-oxo-1,8-diazaespiro[4.5]dec-3-en-4-ilo y etilo (conocido por el documento WO 2009/049851), 4-(but-2-in-1-iloxi)-6-(3,5-dimetilpiperidin-1-il)-5-fluoropirimidina (conocida por el documento WO 2004/099160), (2,2,3,3,4,4,5,5-octafluoropentil)(3,3,3-trifluoropropil)malononitrilo (conocido por el documento WO 2005/063094), (2,2,3,3,4,4,5,5-octafluoropentil)(3,3,4,4,4-pentafluorobutil)malononitrilo (conocido por el documento WO 2005/063094), 8-[2-(ciclopropilmetoxi)-4-(trifluorometil)fenoxi]-3-[6-(trifluorometil)piridazin-3-il]-3-azabicyclo[3.2.1]octano (conocido por el documento WO 2007/040280), flometoquina, PF1364 (n.º registro CAS 1204776-60-2) (conocido por el documento JP2010/018586), 5-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)benzonitrilo (conocido por el documento WO 2007/075459), 5-[5-(2-cloropiridin-4-il)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)benzonitrilo (conocido por el documento WO 2007/075459), 4-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-2-metil-N-{2-oxo-2-[(2,2,2-trifluoroetil)amino]etil}benzamida (conocida por el documento WO 2005/085216), 4-[[[(6-cloropiridin-3-il)metil](ciclopropil)amino]-1,3-oxazol-2(5H)-ona, 4-[[[(6-cloropiridin-3-il)metil](2,2-difluoroetil)amino]-1,3-oxazol-2(5H)-ona, 4-[[[(6-cloropiridin-3-il)metil](etil)amino]-1,3-oxazol-2(5H)-ona, 4-[[[(6-cloropiridin-3-il)metil](metil)amino]-1,3-oxazol-2(5H)-ona (todas conocidas por el documento WO 2010/005692), NNI-0711 (conocido por el documento WO 2002/096882), 1-acetil-N-[4-(1,1,1,3,3,3-hexafluoro-2-metoxipropan-2-il)-3-isobutilfenil]-N-isobutil-3,5-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida (conocida por el documento WO 2002/096882), 2-[2-[[[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil]amino]-5-cloro-3-metilbenzoil]-2-metilhidrazincarboxilato de metilo (conocido por el documento WO 2005/085216), 2-[2-[[[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil]amino]-5-ciano-3-metilbenzoil]-2-etilhidrazincarboxilato de metilo (conocido por el documento WO 2005/085216), 2-[2-[[[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil]amino]-5-ciano-3-metilbenzoil]-2-metilhidrazincarboxilato de metilo (conocido por el documento WO 2005/085216), 2-[3,5-dibromo-2-[[[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil]amino]benzoil]-1,2-dietilhidrazincarboxilato de metilo (conocido por el documento WO 2005/085216), 2-[3,5-dibromo-2-[[[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil]amino]benzoil]-2-etilhidrazincarboxilato de metilo (conocido por el documento WO 2005/085216), (5RS,7RS;5RS,7SR)-1-(6-cloro-3-piridilmetil)-1,2,3,5,6,7-hexahidro-7-metil-8-nitro-5-propoximidazol[1,2-a]piridina (conocida por el documento WO 2007/101369), 2-[6-[2-(5-fluoropiridin-3-il)-1,3-tiazol-5-il]piridin-2-il]pirimidina (conocida por el documento WO 2010/006713), 2-[6-[2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-il]piridin-2-il]pirimidina (conocida por el documento WO 2010/006713), 1-(3-cloropiridin-2-il)-N-[4-ciano-2-metil-6-(metilcarbamoil)fenil]-3-[[5-(trifluorometil)-1H-tetrazol-1-il]metil]-1H-pirazol-5-carboxamida (conocida por el documento WO 2010/069502), 1-(3-cloropiridin-2-il)-N-[4-ciano-2-metil-6-(metilcarbamoil)fenil]-3-[[5-(trifluorometil)-2H-tetrazol-2-il]metil]-1H-pirazol-5-carboxamida (conocida por el documento WO 2010/069502), N-[2-(terc-butylcarbamoil)-4-ciano-6-metilfenil]-1-(3-cloropiridin-2-il)-3-[[5-(trifluorometil)-1H-tetrazol-1-il]metil]-1H-pirazol-5-carboxamida (conocida por el documento WO 2010/069502), N-[2-(terc-butylcarbamoil)-4-ciano-6-metilfenil]-1-(3-cloropiridin-2-il)-3-[[5-(trifluorometil)-2H-tetrazol-2-il]metil]-1H-pirazol-5-carboxamida (conocida por el documento WO 2010/069502), (1E)-N-[(6-cloropiridin-3-il)metil]-N'-ciano-N-(2,2-difluoroetil)etanimidamida (conocida por el documento WO 2008/009360), N-[2-(5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-il)-4-cloro-6-metilfenil]-3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocida por el documento CN102057925) y 2-[3,5-dibromo-2-[[[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil]amino]benzoil]-2-etil-1-metilhidrazincarboxilato de metilo (conocido por el documento WO2011/049233), y/o al menos otro principio activo con actividad fungicida seleccionado del grupo constituido por

(1) Inhibidores de la biosíntesis de ergosterol tales como, por ejemplo, (1.1) aldimorf (1704-28-5), (1.2) azaconazol (60207-31-0), (1.3) bitertanol (55179-31-2), (1.4) bromuconazol (116255-48-2), (1.5) ciproconazol (113096-99-4), (1.6) diclobutrazol (75736-33-3), (1.7) difenoconazol (119446-68-3), (1.8) diniconazol (83657-24-3), (1.9) diniconazol-M (83657-18-5), (1.10) dodemorf (1593-77-7), (1.11) dodemorf acetato (31717-87-0), (1.12) epoxiconazol (106325-08-0), (1.13) etaconazol (60207-93-4), (1.14) fenarimol (60168-88-9), (1.15) fenbuconazol (114369-43-6), (1.16) fenhexamid (126833-17-8), (1.17) fenpropidina (67306-00-7), (1.18) fenpropimorf (67306-03-0), (1.19) fluquinconazol (136426-54-5), (1.20) flurprimidol (56425-91-3), (1.21) flusilazol (85509-19-9), (1.22) flutriafol (76674-21-0), (1.23) furconazol (112839-33-5),

- (1.24) furconazol-cis (112839-32-4), (1.25) hexaconazol (79983-71-4), (1.26) imazalilo (60534-80-7), (1.27) imazalilo sulfato (58594-72-2), (1.28) imibenconazol (86598-92-7), (1.29) ipconazol (125225-28-7), (1.30) metconazol (125116-23-6), (1.31) miclobutanilo (88671-89-0), (1.32) naftifina (65472-88-0), (1.33) nuarimol (63284-71-9), (1.34) oxpoconazol (174212-12-5), (1.35) paclobutrazol (76738-62-0), (1.36) pefurazoato (101903-30-4), (1.37) penconazol (66246-88-6), (1.38) piperalina (3478-94-2), (1.39) procloraz (67747-09-5), (1.40) propiconazol (60207-90-1), (1.41) protioconazol (178928-70-6), (1.42) piributicarb (88678-67-5), (1.43) pirifenox (88283-41-4), (1.44) quinconazol (103970-75-8), (1.45) simeconazol (149508-90-7), (1.46) espiroxamina (118134-30-8), (1.47) tebuconazol (107534-96-3), (1.48) terbinafina (91161-71-6), (1.49) tetraconazol (112281-77-3), (1.50) triadimefon (43121-43-3), (1.51) triadimenol (89482-17-7), (1.52) tridemorf (81412-43-3), (1.53) triflumizol (68694-11-1), (1.54) triforina (26644-46-2), (1.55) triticonazol (131983-72-7), (1.56) uniconazol (83657-22-1), (1.57) uniconazol-p (83657-17-4), (1.58) viniconazol (77174-66-4), (1.59) voriconazol (137234-62-9), (1.60) 1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)cicloheptanol (129586-32-9), (1.61) 1-(2,2-dimetil-2,3-dihidro-1H-inden-1-il)-1H-imidazol-5-carboxilato de metilo (110323-95-0), (1.62) N'-[5-(difluorometil)-2-metil-4-[3-(trimetilsilil)propoxi]fenil]-N-etil-N-metilimidoforamida, (1.63) N-etil-N-metil-N'-[2-metil-5-(trifluorometil)-4-[3-(trimetilsilil)propoxi]fenil]imidoforamida y (1.64) 1H-imidazol-1-carbotioato de O-[1-(4-metoxifenoxi)-3,3-dimetilbutan-2-ilo] (111226-71-2).
- (2) Inhibidores de la respiración (inhibidores de la cadena respiratoria) tales como, por ejemplo, (2.1) bixafeno (581809-46-3), (2.2) boscalid (188425-85-6), (2.3) carboxina (5234-68-4), (2.4) diflumetorim (130339-07-0), (2.5) fenfuram (24691-80-3), (2.6) fluopiram (658066-35-4), (2.7) flutolanilo (66332-96-5), (2.8) fluxapiroxad (907204-31-3), (2.9) furametpir (123572-88-3), (2.10) furneciclox (60568-05-3), (2.11) isopirazam mezcla del racemato sin-epimérico 1RS,4SR,9RS y el racemato anti-epimérico 1RS,4SR,9SR (881685-58-1), (2.12) isopirazam (racemato anti-epimérico), (2.13) isopirazam (enantiómero anti-epimérico 1R,4S,9S), (2.14) isopirazam (enantiómero anti-epimérico 1S,4R,9R), (2.15) isopirazam (racemato sin-epimérico 1RS,4SR,9RS), (2.16) isopirazam (enantiómero sin-epimérico 1R,4S,9R), (2.17) isopirazam (enantiómero sin-epimérico 1S,4R,9S), (2.18) mepronilo (55814-41-0), (2.19) oxicarboxina (5259-88-1), (2.20) penflufeno (494793-67-8), (2.21) pentiopirad (183675-82-3), (2.22) sedaxano (874967-67-6), (2.23) tfluzamid (130000-40-7), (2.24) 1-metil-N-[2-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil]-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.25) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[2-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.26) 3-(difluorometil)-N-[4-fluoro-2-(1,1,2,3,3,3-hexafluoropropoxi)fenil]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.27) N-[1-(2,4-diclorofenil)-1-metoxipropan-2-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida (1092400-95-7), (2.28) 5,8-difluoro-N-[2-(2-fluoro-4-[[4-(trifluorometil)piridin-2-il]oxi]fenil)etil]quinazolin-4-amina (1210070-84-0) (conocida por el documento WO 2010025451), (2.29) N-[9-(diclorometilen)-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.30) N-[(1S,4R)-9-(diclorometilen)-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida y (2.31) N-[(1R,4S)-9-(diclorometilen)-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida.
- (3) Inhibidores de la respiración (inhibidores de la cadena respiratoria) que actúan sobre el complejo III de la cadena respiratoria tales como, por ejemplo, (3.1) ametotradina (865318-97-4), (3.2) amisulbrom (348635-87-0), (3.3) azoxistrobina (131860-33-8), (3.4) ciazofamid (120116-88-3), (3.5) cumetoxistrobina (850881-30-0), (3.6) cumoxistrobina (850881-70-8), (3.5) dimoxistrobina (141600-52-4), (3.6) enestroburina (238410-11-2) (conocida por el documento WO 2004/058723), (3.9) famoxadona (131807-57-3) (conocida por el documento WO 2004/058723), (3.10) fenamidona (161326-34-7) (conocida por el documento WO 2004/058723), (3.11) fenoxistrobina (918162-02-4), (3.12) fluoxastrobina (361377-29-9) (conocida por el documento WO 2004/058723), (3.13) kresoxim-metilo (143390-89-0) (conocido por el documento WO 2004/058723), (3.14) metominostrobin (133408-50-1) (conocida por el documento WO 2004/058723), (3.15) orisastrobina (189892-69-1) (conocida por el documento WO 2004/058723), (3.16) picoxistrobina (117428-22-5) (conocida por el documento WO 2004/058723), (3.17) piraclostrobina (175013-18-0) (conocida por el documento WO 2004/058723), (3.18) pirametostrobin (915410-70-7) (conocida por el documento WO 2004/058723), (3.19) piraxistrobina (862588-11-2) (conocida por el documento WO 2004/058723), (3.20) pibencarb (799247-52-2) (conocido por el documento WO 2004/058723), (3.21) triclopicarb (902760-40-1), (3.22) trifloxistrobina (141517-21-7) (conocida por el documento WO 2004/058723), (3.23) (2E)-2-(2-[[[3-(cloro-2-metilfenoxi)-5-fluoropirimidin-4-il]oxi]fenil]-2-(metoxiimino)-N-metiletanamida (conocida por el documento WO 2004/058723), (3.24) (2E)-2-(metoxiimino)-N-metil-2-[[[[(1E)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etiliden]amino]oxi]metil]fenil]etanamida (conocida por el documento WO 2004/058723), (3.25) (2E)-2-(metoxiimino)-N-metil-2-[[[[(E)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etoxi]imino]metil]fenil]etanamida (158169-73-4), (3.26) (2E)-2-[[[[(1E)-1-[3-[[[(E)-1-fluoro-2-feniletetil]oxi]fenil]etiliden]amino]oxi]metil]fenil]-2-(metoxiimino)-N-metiletanamida (326896-28-0), (3.27) (2E)-2-[[[[(2E,3E)-4-(2,6-diclorofenil)but-3-en-2-iliden]amino]oxi]metil]fenil]-2-(metoxiimino)-N-metiletanamida, (3.28) 2-cloro-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)piridin-3-carboxamida (119899-14-8), (3.29) 5-metoxi-2-metil-4-(2-[[[[(1E)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etiliden]amino]oxi]metil]fenil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-ona, (3.30) (2E)-2-[[[[(ciclopropil[[4-metoxifenil]imino]metil]sulfanil]metil]fenil]-3-metoxiprop-2-enoato de metilo (149601-03-6), (3.31) N-(3-etil-3,5,5-trimetilciclohexil)-3-(formilamino)-2-hidroxibenzamida (226551-21-9), (3.32) 2-[[[[(2,5-dimetilfenoxi)metil]fenil]-2-metoxi-N-metilacetamida (173662-97-0) y (3.33) (2R)-2-[[[[(2,5-dimetilfenoxi)metil]fenil]-2-metoxi-N-metilacetamida (394657-24-0).
- (4) Inhibidores de la mitosis y la división celular tales como, por ejemplo, (4.1) benomilo (17804-35-2),

- (4.2) carbendazim (10605-21-7), (4.3) clorfenazol (3574-96-7), (4.4) dietofencarb (87130-20-9), (4.5) etaboxam (162650-77-3), (4.6) fluopicolid (239110-15-7), (4.7) fuberidazol (3878-19-1), (4.8) pencicuron (66063-05-6), (4.9) tiabendazol (148-79-8), (4.10) tiofanato-metilo (23564-05-8), (4.11) tiofanato (23564-06-9), (4.12) zoxamida (156052-68-5), (4.13) 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina (214706-53-3) y (4.14) 3-cloro-5-(6-cloropiridin-3-il)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorofenil)piridazina (1002756-87-7).
- (5) Compuestos capaces de actuar sobre múltiples sitios tales como, por ejemplo, (5.1) caldo bordelés (8011-63-0), (5.2) captafol (2425-06-1), (5.3) captan (133-06-2) (conocido por el documento WO 02/12172), (5.4) clorotalonilo (1897-45-6), (5.5) preparaciones de cobre tales como hidróxido de cobre (20427-59-2), (5.6) naftenato de cobre (1338-02-9), (5.7) óxido de cobre (1317-39-1), (5.8) oxiclورو de cobre (1332-40-7), (5.9) sulfato de cobre (7758-98-7), (5.10) diclofluanid (1085-98-9), (5.11) ditionon (3347-22-6), (5.12) dodina (2439-10-3), (5.13) dodina base libre, (5.14) ferbam (14484-64-1), (5.15) fluorofolpet (719-96-0), (5.16) folpet (133-07-3), (5.17) guazatina (108173-90-6), (5.18) guazatina acetato, (5.19) iminotadina (13516-27-3), (5.20) iminotadina albesilato (169202-06-6), (5.21) iminotadina triacetato (57520-17-9), (5.22) mancofre (53988-93-5), (5.23) mancozeb (8018-01-7), (5.24) maneb (12427-38-2), (5.25) metiram (9006-42-2), (5.26) zinc metiram (9006-42-2), (5.27) cobre-oxina (10380-28-6), (5.28) propamidina (104-32-5), (5.29) propineb (12071-83-9), (5.30) azufre y preparaciones de azufre tales como, por ejemplo, polisulfuro de calcio (7704-34-9), (5.31) tiram (137-26-8), (5.32) lolifluanid (731-27-1), (5.33) zineb (12122-67-7) y (5.34) ziram (137-30-4).
- (6) Inductores de resistencia tales como, por ejemplo, (6.1) acibenzolar-S-metilo (135158-54-2), (6.2) isotianilo (224049-04-1), (6.3) probenazol (27605-76-1) y (6.4) tiadinilo (223580-51-6).
- (7) Inhibidores de la biosíntesis de aminoácidos y proteínas tales como, por ejemplo, (7.1) andoprim (23951-85-1), (7.2) blasticidina-S (2079-00-7), (7.3) ciprodinilo (121552-61-2), (7.4) kasugamicina (6980-18-3), (7.5) hidrato de kasugamicina clorhidrato (19408-46-9), (7.6) mepanipirim (110235-47-7), (7.7) pirimetanilo (53112-28-0) y (7.8) 3-(5-fluoro-3,3,4,4-tetrametil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina (861647-32-7) (conocida por el documento WO 2005070917).
- (8) Inhibidores de la producción de ATP tales como, por ejemplo, (8.1) fentina acetato (900-95-8), (8.2) fentina cloruro (639-58-7), (8.3) fentina hidróxido (76-87-9) y (8.4) siltiofam (175217-20-6).
- (9) Inhibidores de la síntesis de la pared celular tales como, por ejemplo, (9.1) bentiavalicarb (177406-68-7), (9.2) dimetomorf (110488-70-5), (9.3) flumorf (211867-47-9), (9.4) iprovalicarb (140923-17-7), (9.5) mandipropamid (374726-62-2), (9.6) polioxinas (11113-80-7), (9.7) polioxorim (22976-86-9), (9.8) validamicina A (37248-47-8) y (9.9) valifenalato (283159-94-4; 283159-90-0).
- (10) Inhibidores de los lípidos y de la síntesis de membrana tales como, por ejemplo, (10.1) bifenilo (92-52-4), (10.2) cloroneb (2675-77-6), (10.3) dicloran (99-30-9), (10.4) edifenfos (17109-49-8), (10.5) etridiazol (2593-15-9), (10.6) yodocarb (55406-53-6), (10.7) iprobenfos (26087-47-8), (10.8) isoprotilano (50512-35-1), (10.9) propamocarb (25606-41-1), (10.10) propamocarb clorhidrato (25606-41-1), (10.11) protiocarb (19622-08-3), (10.12) pirazofos (13457-18-6), (10.13) quintozeno (82-68-8), (10.14) tecnazeno (117-18-0) y (10.15) tolclofos-metilo (57018-04-9).
- (11) Inhibidores de la biosíntesis de melanina tales como, por ejemplo, (11.1) carpropamid (104030-54-8), (11.2) diclocimet (139920-32-4), (11.3) fenoxanilo (115852-48-7), (11.4) ftalida (27355-22-2), (11.5) piroquilon (57369-32-1), (11.6) triciclazol (41814-78-2) y (11.7) {3-metil-1-[(4-metilbenzoi)amino]butan-2-il}carbamato de 2,2,2-trifluoroetilo (851524-22-6) (conocido por el documento WO 2005042474).
- (12) Inhibidores de la síntesis de ácidos nucleicos tales como, por ejemplo, (12.1) benalaxilo (71626-11-4), (12.2) benalaxilo-M (kiralaxilo) (98243-83-5), (12.3) bupirimato (41483-43-6), (12.4) cloclacon (67932-85-8), (12.5) dimetirimol (5221-53-4), (12.6) etirimol (23947-60-6), (12.7) furalaxilo (57646-30-7), (12.8) himexazol (10004-44-1), (12.9) metalaxilo (57837-19-1), (12.10) metalaxilo-M (mefenoxam) (70630-17-0), (12.11) ofurace (58810-48-3), (12.12) oxadixilo (77732-09-3) y (12.13) ácido oxolínico (14698-29-4).
- (13) Inhibidores de la transducción de señal tales como, por ejemplo, (13.1) clozolinato (84332-86-5), (13.2) fencipclonilo (74738-17-3), (13.3) fludioxonilo (131341-86-1), (13.4) iprodiona (36734-19-7), (13.5) procimidona (32809-16-8), (13.6) quinoxifeno (124495-18-7) y (13.7) vinclozolina (50471-44-8).
- (14) Desacopladores tales como, por ejemplo, (14.1) binapacril (485-31-4), (14.2) dinocap (131-72-6), (14.3) ferimzona (89269-64-7), (14.4) fluazinam (79622-59-6) y (14.5) meptildinocap (131-72-6).
- (15) Otros compuestos tales como, por ejemplo, (15.1) bentiazol (21564-17-0), (15.2) betoxazina (163269-30-5), (15.3) capsimicina (70694-08-5), (15.4) carvona (99-49-0), (15.5) quinometionat (2439-01-2), (15.6) piriufenona (clazafenona) (688046-61-9), (15.7) cufraneb (11096-18-7), (15.8) ciflufenamid (180409-60-3), (15.9) cimoxanilo (57966-95-7), (15.10) ciprosulfamida (221667-31-8), (15.11) dazomet (533-74-4), (15.12) debacarb (62732-91-6), (15.13) diclorofen (97-23-4), (15.14) diclomezina (62865-36-5), (15.15) difenzoquat (49866-87-7), (15.16) difenzoquat metilsulfato (43222-48-6), (15.17) difenilamina (122-39-4), (15.18) EcoMate, (15.19) fempirazamina (473798-59-3), (15.20) flumetover (154025-04-4), (15.21) fluoromid (41205-21-4), (15.22) flusulfamida (106917-52-6), (15.23) flutianilo (304900-25-2), (15.24) fosetil-aluminio (39148-24-8), (15.25) fosetil-calcio, (15.26) fosetil-sodio (39148-16-8), (15.27) hexaclorobenceno (118-74-1), (15.28) irumamicina (81604-73-1), (15.29) metasulfocarb (66952-49-6), (15.30) isotiocianato de metilo (556-61-6), (15.31) metrafenona (220899-03-6), (15.32) mildiomicina (67527-71-3), (15.33) natamicina (7681-93-8), (15.34) dimetilditiocarbamato de níquel (15521-65-0), (15.35) nitrotal-isopropilo (10552-74-6), (15.36) octilnona (26530-20-1), (15.37) oxamocarb (917242-12-7), (15.38) oxifentiina (34407-87-9), (15.39) pentaclorofenol y sus sales (87-86-5), (15.40) fenotrina,

(15.41) ácido fosfórico y sus sales (13598-36-2), (15.42) propamocarb-fosetilato, (15.43) propanosina-sodio (88498-02-6), (15.44) proquinazid (189278-12-4), (15.45) pirimorf (868390-90-3), (15.45e) (2E)-3-(4-terc-butilfenil)-3-(2-cloropiridin-4-il)-1-(morfolin-4-il)prop-2-en-1-ona (1231776-28-5), (15.45z) (2Z)-3-(4-terc-butilfenil)-3-(2-cloropiridin-4-il)-1-(morfolin-4-il)prop-2-en-1-ona (1231776-29-6), (15.46) pirrolnitrina (1018-71-9) (conocida por el documento EP-A 1 559 320), (15.47) tebufloquina (376645-78-2), (15.48) tecloftalam (76280-91-6), (15.49) tolnifanida (304911-98-6), (15.50) triazóxido (72459-58-6), (15.51) triclamida (70193-21-4), (15.52) zarilamid (84527-51-5), (15.53) 2-metilpropanoato de (3S,6S,7R,8R)-8-bencil-3-[(3-[(isobutiriloxi)metoxi]-4-metoxipiridin-2-il)carbonil]amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-ilo (517875-34-2) (conocido por el documento WO 2003035617), (15.54) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona (1003319-79-6), (15.55) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona (1003319-80-9), (15.56) 1-(4-{4-[5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona (1003318-67-9), (15.57) 1H-imidazol-1-carboxilato de 1-(4-metoxifenoxi)-3,3-dimetilbutan-2-ilo (111227-17-9), (15.58) 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)piridina (13108-52-6), (15.59) 2,3-dibutil-6-clorotieno[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona (221451-58-7), (15.60) 2,6-dimetil-1H,5H-[1,4]ditiino[2,3-c:5,6-c']dipirrol-1,3,5,7(2H,6H)-tetrona, (15.61) 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(5R)-5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona (1003316-53-7), (15.62) 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(5S)-5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona (1003316-54-8), (15.63) 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il)etanona (1003316-51-5), (15.64) 2-butoxi-6-yodo-3-propil-4H-cromen-4-ona, (15.65) 2-cloro-5-[2-cloro-1-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-4-metil-1H-imidazol-5-il]piridina, (15.66) 2-fenilfenol y sus sales (90-43-7), (15.67) 3-(4,4,5-trifluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina (861647-85-0) (conocida por el documento WO 2005070917), (15.68) 3,4,5-tricloropiridin-2,6-dicarbonitrilo (17824-85-0), (15.69) 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetil-1,2-oxazolidin-3-il]piridina, (15.70) 3-cloro-5-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-6-metilpiridazina, (15.71) 4-(4-clorofenil)-5-(2,6-difluorofenil)-3,6-dimetilpiridazina, (15.72) 5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-tiol, (15.73) 5-cloro-N'-fenil-N'-(prop-2-in-1-tiofen-2-sulfonohidrazida (134-31-6), (15.74) 5-fluoro-2-[(4-fluorobenzil)oxil]pirimidin-4-amina (1174376-11-4) (conocida por el documento WO 2009094442), (15.75) 5-fluoro-2-[(4-metilbencil)oxil]pirimidin-4-amina (1174376-25-0) (conocida por el documento WO 2009094442), (15.76) 5-metil-6-octil[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-amina, (15.77) (2Z)-3-amino-2-ciano-3-fenilprop-2-enoato de etilo, (15.78) N'-(4-{3-(4-clorobencil)-1,2,4-tiadiazol-5-il}oxi)-2,5-dimetilfenil)-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.79) N-(4-clorobencil)-3-[3-metoxi-4-(prop-2-in-1-ilo)fenil]propanamida, (15.80) N-[(4-clorofenil)(ciano)metil]-3-[3-metoxi-4-(prop-2-in-1-ilo)fenil]propanamida, (15.81) N-[(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)metil]-2,4-dicloropiridin-3-carboxamida, (15.82) N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2,4-dicloropiridin-3-carboxamida, (15.83) N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2-fluoro-4-yodopiridin-3-carboxamida, (15.84) N-[(E)-[(ciclopropilmetoxi)imino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil]-2-fenilacetamida (221201-92-9), (15.85) N-[(Z)-[(ciclopropilmetoxi)imino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil]-2-fenilacetamida (221201-92-9), (15.86) N'-[4-[(3-terc-butyl-4-ciano-1,2-tiazol-5-il)oxi]-2-cloro-5-metilfenil]-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.87) N-metil-2-(1-{[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-N-(1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il)-1,3-tiazol-4-carboxamida (922514-49-6), (15.88) N-metil-2-(1-{[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il]-1,3-tiazol-4-carboxamida (922514-07-6), (15.89) N-metil-2-(1-{[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-N-[(1S)-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il]-1,3-tiazol-4-carboxamida (922514-48-5), (15.90) {6-[[[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metiliden]amino]oxi]metil}piridin-2-il}carbarnato de pentilo, (15.91) ácido fenazina-1-carboxílico, (15.92) quinolin-8-ol (134-31-6), (15.93) sulfato de quinolin-8-ol (2:1) (134-31-6) y (15.94) {6-[[[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metiliden]amino]oxi]metil}piridin-2-il}carbarnato de terc-butilo.

(16) Otros compuestos tales como, por ejemplo, (16.1) 1-metil-3-(trifluorometil)-N-[2'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.2) N-(4'-clorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.3) N-(2',4'-diclorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.4) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[4'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.5) N-(2',5'-difluorobifenil-2-il)-1-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.6) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[4'-(prop-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.7) 5-fluoro-1,3-dimetil-N-[4'-(prop-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.8) 2-cloro-N-[4'-(prop-1-in-1-il)bifenil-2-il]piridin-3-carboxamida, (16.9) 3-(difluorometil)-N-[4'-(3,3-dimetilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.10) N-[4'-(3,3-dimetilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.11) 3-(difluorometil)-N-(4'-etinilbifenil-2-il)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.12) N-(4'-etinilbifenil-2-il)-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.13) 2-cloro-N-(4'-etinilbifenil-2-il)piridin-3-carboxamida, (16.14) 2-cloro-N-[4'-(3,3-dimetilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]piridin-3-carboxamida (conocida por el documento EP-A 1 559 320), (16.15) 4-(difluorometil)-2-metil-N-[4'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1,3-tiazol-5-carboxamida, (16.16) 5-fluoro-N-[4'-(3-hidroxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.17) 2-cloro-N-[4'-(3-hidroxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]piridin-3-carboxamida, (16.18) 3-(difluorometil)-N-[4'-(3-metoxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.19) 5-fluoro-N-[4'-(3-metoxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.20) 2-cloro-N-[4'-(3-metoxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]piridin-3-carboxamida, (16.21) (5-bromo-2-metoxi-4-metilpiridin-3-il)(2,3,4-trimetoxi-6-metilfenil)metanona, (16.22) N-[2-(4-{3-(4-clorofenil)prop-2-in-1-il}oxi)-3-metoxifenil]etil]-N2-

(metilsulfonil)valinamida (220706-93-4), (16.23) ácido 4-oxo-4-[(2-feniletil)amino]butanoico y (16.24) {6-[[{[(Z)-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilen]amino}oxi]metil]piridin-2-il}carbamato de but-3-in-1-ilo.

- 5 10. Composición agroquímica, **caracterizada porque** contiene al menos un compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 6 o una composición de acuerdo con la reivindicación 9, así como diluyentes y/o tensioactivos.
11. Procedimiento de preparación de composiciones agroquímicas, **caracterizado porque** se mezclan compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 6, o una composición de acuerdo con la reivindicación 9, con diluyentes y/o tensioactivos.
- 10 12. Procedimiento de lucha contra plagas animales, **caracterizado porque** se dejan actuar sobre plagas animales y/o su hábitat compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 6 o una composición de acuerdo con la reivindicación 9, estando excluidos procedimientos para el tratamiento quirúrgico o terapéutico del cuerpo humano o animal y procedimientos de diagnóstico que se efectúan en el cuerpo humano o animal.
- 15 13. Uso de compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 6 o de una composición de acuerdo con la reivindicación 9 para combatir plagas animales en protección de cultivos, en la protección de materiales y/o en el sector veterinario, estando excluidos usos en procedimientos para el tratamiento quirúrgico o terapéutico del cuerpo humano o animal y procedimientos de diagnóstico que se efectúan en el cuerpo humano o animal.