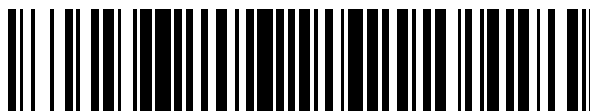


19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 691 246**

51 Int. Cl.:

**C07D 513/04** (2006.01)

**A01N 43/90** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **30.11.2015 PCT/EP2015/078062**

87 Fecha y número de publicación internacional: **09.06.2016 WO16087373**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **30.11.2015 E 15801469 (6)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **11.07.2018 EP 3227302**

54 Título: **Compuestos bicíclicos como pesticidas**

30 Prioridad:

**02.12.2014 EP 14195946**

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

**26.11.2018**

73 Titular/es:

**BAYER CROPSCIENCE AG (100.0%)**

**Alfred-Nobel-Strasse 50**

**40789 Monheim am Rhein, DE**

72 Inventor/es:

**CEREZO-GALVEZ, SILVIA;**

**ARLT, ALEXANDER;**

**BRETSCHNEIDER, THOMAS;**

**FISCHER, REINER;**

**FÜSSLEIN, MARTIN;**

**JESCHKE, PETER;**

**VOERSTE, ARND;**

**ILG, KERSTIN;**

**MALSAM, OLGA y**

**LÖSEL, PETER**

74 Agente/Representante:

**CARPINTERO LÓPEZ, Mario**

ES 2 691 246 T3

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

**DESCRIPCIÓN**

Compuestos bicíclicos como pesticidas

La presente solicitud se refiere a nuevos compuestos bicíclicos, a agentes que contienen estos compuestos, a su uso para la lucha contra plagas animales así como a procedimientos y a productos intermedios para su preparación.

5 Recientemente se han conocido compuestos bicíclicos que tienen propiedades insecticidas (documentos WO 2015/038503 A1 y WO 2014/125651 A1). En el documento WO 2012/102387 A1 se describen compuestos heterocíclicos que pueden usarse en particular como insecticidas y acaricidas.

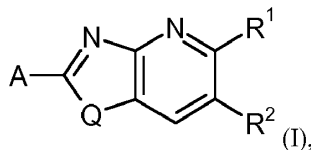
En Synthesis 2003, (13), 2033-2040 se informa sobre un nuevo acceso a oxazolopiridinas a través de derivados de hidroxiamidina.

10 En los documentos US 4.038.396 y DE 2 330 109 A1 se describen la síntesis y la aplicación de oxazolopiridinas y tiazolopiridinas como sustancias antiinflamatorias, analgésicas y antipiréticas.

Los agentes fitosanitarios modernos deben cumplir muchos requerimientos, por ejemplo en relación al nivel, a la duración y al espectro de su acción y al posible uso. Las cuestiones de la toxicidad, de la capacidad de combinación con otros principios activos o coadyuvantes de formulación desempeñan un papel así como la cuestión del gasto que debe gestionarse para la síntesis de un principio activo. Además pueden producirse resistencias. Ya por todos estos motivos no puede considerarse como concluida la búsqueda de nuevos agentes fitosanitarios y existe constantemente la demanda de nuevos compuestos con propiedades mejoradas en comparación con los compuestos conocidos al menos en relación a aspectos individuales.

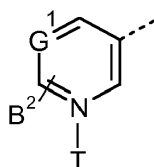
El objetivo de la presente invención era facilitar compuestos mediante los cuales se ampliara el espectro de los pesticidas bajo distintos aspectos.

Se soluciona el objetivo, así como otros objetivos no mencionados de manera explícita que pueden derivarse o pueden deducirse de los contextos discutidos en el presente documento, mediante compuestos de fórmula (I)



en la que

25 A representa el resto (A-a)



(A-a)

en el que la línea discontinua significa el enlace al átomo de carbono del biciclo de fórmula (I),

G<sup>1</sup> representa C-B<sup>1</sup>,

B<sup>1</sup> representa hidrógeno o flúor,

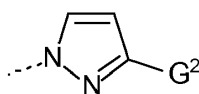
B<sup>2</sup> representa hidrógeno,

T representa un par de electrones o representa oxígeno,

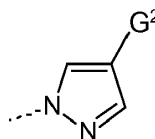
Q representa azufre,

R<sup>1</sup> representa hidrógeno,

R<sup>2</sup> a) representa uno de los restos B siguientes

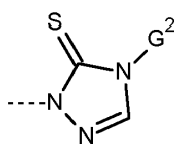


(B-1)

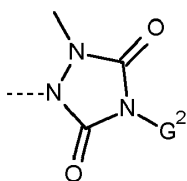


(B-2)

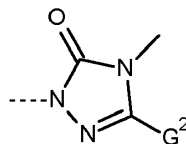
35



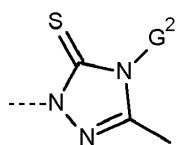
(B-41)



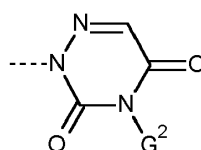
(B-42)



(B-43)

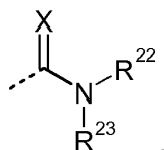


(B-46)



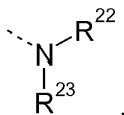
(B-47)

5 en la que la línea discontinua significa la unión al átomo de carbono del biciclo de fórmula (I), o R<sup>2</sup> c) representa un resto de fórmula



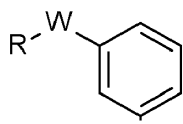
en la que X representa oxígeno o azufre y la línea discontinua significa la unión al átomo de carbono del biciclo de fórmula (I) o R<sup>2</sup> f) representa un resto de fórmula

10



en la que la línea discontinua significa la unión al átomo de carbono del biciclo de fórmula (I), en la que G<sup>2</sup> representa un resto de la serie de hidrógeno, 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>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> y haloalquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> y en el caso de que R<sup>2</sup> represente c) R<sup>22</sup> representa el resto D

15



(D-2)

en el que

R representa alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> eventualmente mono-, di-, tri-, tetra- o pentasustituido con flúor, cloro,  
 W representa un resto de la serie de S, SO y SO<sub>2</sub> y en el caso de que R<sup>2</sup> represente f),  
 R<sup>22</sup> representa fenilo eventualmente sustituido con flúor, cloro o bromo y  
 R<sup>23</sup> representa hidrógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>.

20

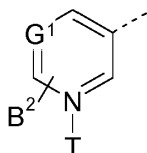
En las definiciones, halógeno representa flúor, cloro, bromo y yodo, preferentemente a su vez representa flúor, cloro y bromo.

Los restos sustituidos con halógeno, por ejemplo halogenoalquilo (= haloalquilo), están monohalogenados o

polihalogenados hasta como máximo el posible número de sustituyentes. En el caso de la polihalogenación pueden ser los átomos de halógeno iguales o distintos. El halógeno representa a este respecto flúor, cloro, bromo o yodo, en particular representa flúor, cloro o bromo.

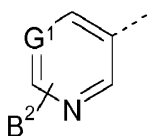
- 5 Los restos de hidrocarburo saturados o insaturados tal como alquilo o alqueniilo pueden ser, también en unión con heteroátomos, tal como por ejemplo en alcoxi, en tanto que sea posible, en cada caso de cadena lineal o ramificados. Los restos eventualmente sustituidos pueden estar, cuando no se menciona lo contrario, monosustituidos o polisustituidos, pudiendo ser los sustituyentes iguales o distintos en el caso de polisustitución.

Cuando T en el resto A de fórmula (A-a)

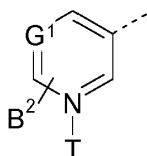


(A-a)

- 10 representa un par de electrones, se encuentra el resto como derivado de piridina de fórmula

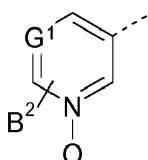


Cuando T en el resto A de fórmula (A-a)



(A-a)

representa oxígeno, se encuentra el resto como derivado de *N*-óxido de piridina de fórmula



- 15 En el presente documento se prescinde de la representación de las cargas formales (+ en el nitrógeno y – en el oxígeno).

- 20 Las definiciones o bien explicaciones de restos generales expuestas anteriormente o expuestas en intervalos de preferencia se aplican para los productos finales y para los productos de partida y productos intermedios de manera correspondiente. Estas definiciones de restos pueden combinarse entre sí, o sea también entre los respectivos intervalos de preferencia, de manera discrecional.

Una forma de realización preferente de la invención se refiere a compuestos de fórmula (I), en los que A representa piridin-3-ilo.

- 25 Otra forma de realización preferente de la invención se refiere a compuestos de fórmula (I), en los que A representa 5-fluoro-piridin-3-ilo.

Otra forma de realización preferente de la invención se refiere a compuestos de fórmula (I), en los que  $R^2$  tiene los significados mencionados en a).

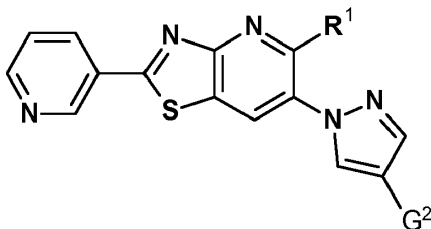
Otra forma de realización preferente de la invención se refiere a compuestos de fórmula (I), en los que  $R^2$  tiene los significados mencionados en c).

- 30 Otra forma de realización preferente de la invención se refiere a compuestos de fórmula (I), en los que  $R^2$  tiene los significados mencionados en f).

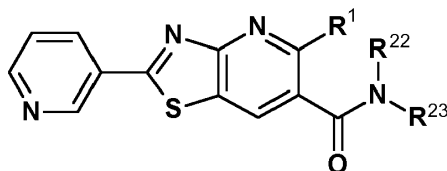
Las definiciones o bien explicaciones de restos generales expuestas anteriormente o expuestas en intervalos de preferencia se aplican para los productos finales (también para los compuestos de fórmulas (I-A) a (I-P) mencionadas posteriormente) y para los productos de partida y productos intermedios de manera correspondiente. Estas definiciones de restos pueden combinarse entre sí, o sea también entre los respectivos intervalos de preferencia, de manera discrecional.

5

En una forma de realización preferente, la invención se refiere a compuestos de fórmula (I-A)

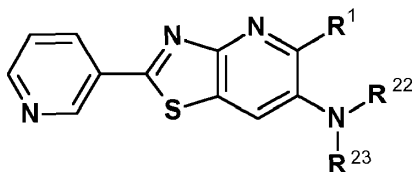


En otra forma de realización preferente, la invención se refiere a compuestos de fórmula (I-E)

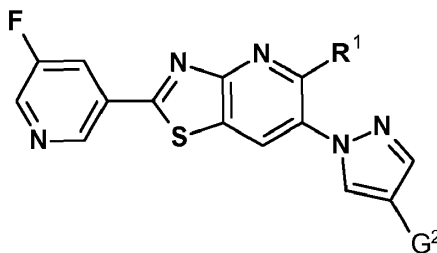


10

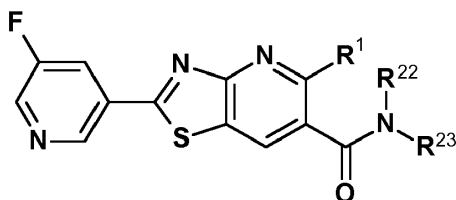
En otra forma de realización preferente, la invención se refiere a compuestos de fórmula (I-H)



En otra forma de realización preferente, la invención se refiere a compuestos de fórmula (I-I)

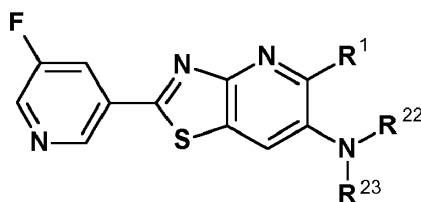


En otra forma de realización preferente, la invención se refiere a compuestos de fórmula (I-M)



15

En otra forma de realización preferente, la invención se refiere a compuestos de fórmula (I-P)



En las fórmulas (I-A) a (I-P), las variables tienen los significados mencionados anteriormente.

Los compuestos de fórmula (I) y sus sales de adición de ácido y complejos de sal metálica tienen buena actividad, en particular para la lucha contra parásitos animales, a los que pertenecen artrópodos y en particular insectos.

5 Como sales adecuadas de los compuestos de fórmula general (I) pueden mencionarse sales usuales no tóxicas, es decir sales con correspondientes bases y sales con ácidos añadidos. Preferentemente pueden mencionarse sales con bases inorgánicas, tales como sales de metal alcalino, por ejemplo sales de sodio, de potasio o de cesio, sales de metal alcalinotérreo, por ejemplo sales de calcio o de magnesio, sales de amonio, sales con bases orgánicas así como con aminas inorgánicas, por ejemplo sales de trietilamonio, de dicitlohexilamonio, N,N'-dibenciletilendiamonio, de piridinio, de picolinio o de etanolamonio, sales con ácidos inorgánicos, por ejemplo clorhidratos, bromhidratos, 10 dihidrosulfatos, trihidrosulfatos o fosfatos, sales con ácidos carboxílicos orgánicos o ácido sulfónico orgánico, por ejemplo formiatos, acetatos, trifluoroacetatos, maleatos, tartratos, metansulfonatos, bencensulfonatos o para-toluensulfonatos, sales con aminoácidos básicos, por ejemplo arginatos, aspartatos o glutamatos y similares.

15 Los compuestos de fórmula (I) pueden encontrarse eventualmente también, dependiendo del tipo de los sustituyentes, como estereoisómeros, es decir como isómeros geométricos y/o como isómeros ópticos o mezclas de isómeros en distintas composiciones. Tanto los estereoisómeros puros como también mezclas discretionales de estos isómeros son objeto de esta invención, aunque se hable en el presente documento en general solo de compuestos de fórmula (I).

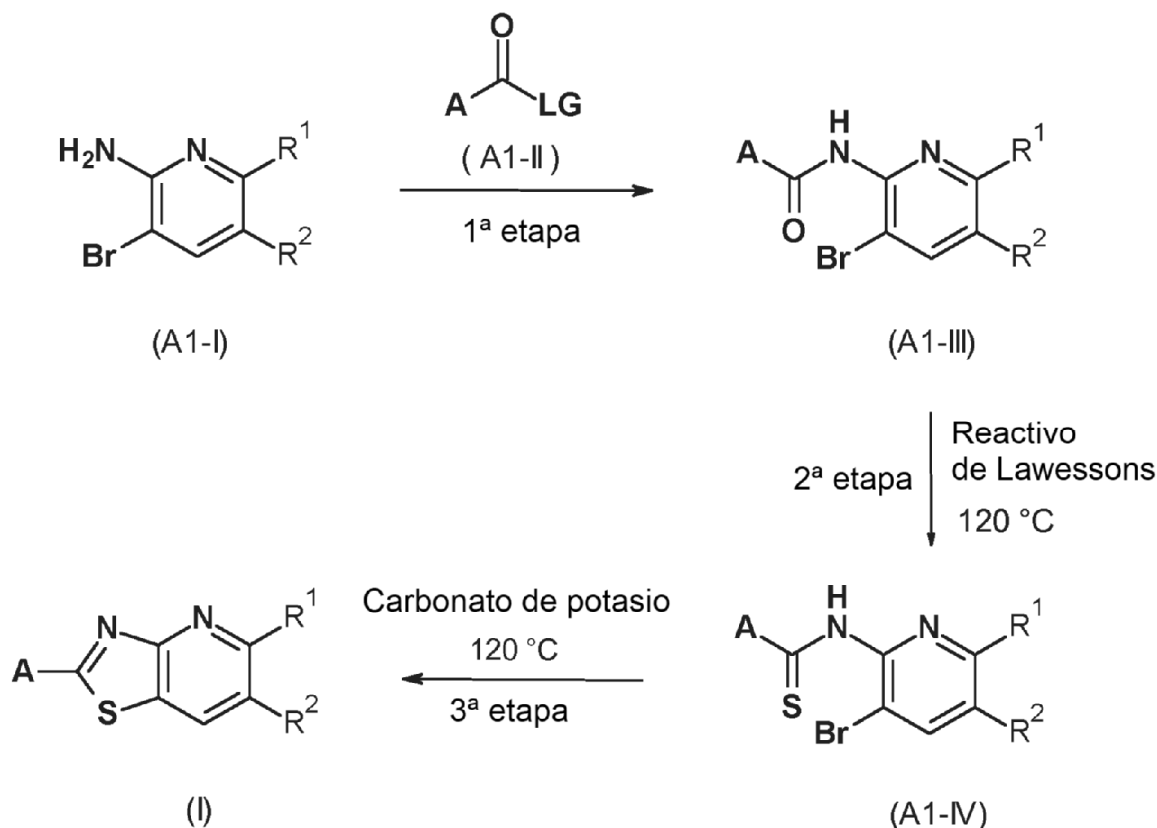
Por tanto, la invención se refiere tanto a los enantiómeros puros y diastereómeros, como también a sus mezclas para la lucha contra parásitos animales, a los que pertenecen artrópodos y en particular insectos.

20 Preferentemente se usan de acuerdo con la invención, sin embargo, las formas estereoisoméricas ópticamente activas de los compuestos de fórmula (I) y sus sales.

A continuación se usan de manera sinónima los términos "ejemplo de síntesis" y "ejemplo de aplicación", siempre que no se indique lo contrario.

25 Además se ha encontrado que pueden prepararse los compuestos de fórmula (I) y también aquéllos compuestos mencionados en la tabla 1, que no se encuentran bajo la fórmula (I), según los procedimientos descritos a continuación.

30 **Procedimiento A:** Los compuestos de fórmula (I), en los que el heterociclo A representa pirimidin-5-ilo eventualmente sustituido con un resto B<sup>2</sup> (A-a; G<sup>1</sup> = N), piridin-3-ilo (A-a; G<sup>1</sup> = C-B<sup>1</sup>), pirazin-2-ilo (A-b), piridazin-3-ilo (A-c), tiazol-5-ilo (A-d), isotiazol-4-ilo (A-e) y pirazol-4-ilo (A-f), pueden prepararse por ejemplo de acuerdo con el procedimiento A (véase esquema de reacción I) en tres etapas.

**Esquema de reacción I – Procedimiento A**

LG = grupo saliente, por ejemplo halógeno, CO-OR (R = arilo, alquilo)  
N-imidazol-1-ilo, OH etc.

En el esquema de reacción I tienen A, R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup>, siempre que no se indique lo contrario, los significados mencionados anteriormente.

5 Por ejemplo, las anilinas sustituidas de fórmula (A1-I) pueden hacerse reaccionar con los correspondientes ácidos carboxílicos activados (por ejemplo como cloruro de ácido carbónico o su clorhidrato) de fórmula (A1-II) en presencia de coadyuvantes de reacción básicos en una primera etapa de reacción para dar compuestos de fórmula (A1-III). Éstos se tionizan entonces mediante correspondientes donadores de azufre tal como por ejemplo reactivo de Lawesson para dar compuestos de fórmula (A1-IV). En una tercera etapa de reacción pueden ciclarse estos  
10 entonces en presencia de una base adecuada, por ejemplo carbonato de potasio, con formación de los compuestos (I).

**Procedimiento A – etapa 1:** Los compuestos de fórmula (A1-I) se conocen parcialmente y pueden obtenerse comercialmente o bien pueden obtenerse según procedimientos de preparación conocidos en principio (por ejemplo para R<sup>1</sup> = H, R<sup>2</sup> = Br; 3,5-dibrompiridin-2-amina (Tetrahedron Letters (2014), 55(36), 5058-5061)).

15 Los compuestos de fórmula (A1-II) se conocen parcialmente y pueden obtenerse comercialmente o bien pueden obtenerse según procedimientos de preparación conocidos en principio (por ejemplo para A = piridin-3-ilo, LG = Cl; cloruro de ácido nicotínico (Journal of the American Chemical Society (1953), 75, 4364) o para A = 5-fluoro-piridin-3-ilo, LG = Cl; cloruro de 5-fluoronicotinoilo (documento US 2.516.830).

20 Para la etapa de amidación se han descrito numerosas condiciones de reacción, por ejemplo G. Benz en Comprehensive Organic Synthesis, 1ª ed., Pergamon Press, Oxford, 1991, vol. 6, pág. 381-417; P.D. Bailey *et al.* en Comprehensive Organic Functional Group Transformation, 1ª ed., Elsevier Science Ltd., Oxford, 1995, vol. 5, pág. 257-308 y R.C. Larock en Comprehensive Organic Transformations, 2ª ed., Wiley-VCH, New York, Weinheim, 1999, pág. 1929-1994. Algunas de estas reacciones discurren a través de cloruros de ácido carboxílico intermedios que pueden usarse aislados o generados *in situ* a partir de A1-II (LG = OH).

Las reacciones de amidación se realizan eventualmente en presencia de un agente de condensación,

eventualmente en presencia de un aceptor de ácido y eventualmente en presencia de un disolvente.

Como agentes de condensación se tienen en cuenta todos los agentes de condensación que pueden usarse habitualmente para reacciones de amidación de este tipo. A modo de ejemplo se mencionan agentes formadores de haluro de ácido tal como fosgeno, tricloruro de fósforo, cloruro de oxalilo o cloruro de tionilo; carbodiimidas, tal como *N,N'*-diciclohexilcarbodiimida (DCC) y 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etil-carbodiimida (EDCI), u otros agentes de condensación habituales, tal como pentóxido de fósforo, ácido polifosfórico, *N,N'*-carbonildiimidazol, 2-cloropiridina, 1-metoyoduro (reactivo de Mukaiyama), 2-etoxi-*N*-etoxicarbonil-1,2-dihidroquinolina (EEDQ), trifetilfosfina/tetracloruro de carbono, hexafluorofosfato de bromotripirrolidino-fosfonio (BROP), hexafluorofosfato de *O*-(1*H*-benzotriazol-1-iloxi)tris(dimetil-amino)fosfonio (BOP), tetrafluoroborato de *N,N,N,N'*-bis(tetrametilen)cloruronio, hexafluorofosfato de *O*-(1*H*-benzotriazol-1-il)-*N,N,N,N'*-tetrametiluronio (HBTU), hexafluorofosfato de *O*-(1*H*-benzotriazol-1-il)-*N,N,N,N'*-bis(tetrametilen)uronio, tetrafluoroborato de *O*-(1*H*-benzotriazol-1-il)-*N,N,N,N'*-tetrametiluronio (TBTU), tetrafluoroborato de *O*-(1*H*-benzotriazol-1-il)-*N,N,N,N'*-bis(tetrametilen)uronio, hexafluorofosfato de *O*-(7-azabenzotriazol-1-il)-*N,N,N,N'*-tetrametiluronio (HATU), 1-hidroxibenzotriazol (HOBt) y sal de 4-(4,6-dimetoxi-1,3,5-triazin-2-il)-4-metilmorfolinio (DMT.MM), disponible en la mayoría de los casos como cloruro. Estos reactivos pueden usarse separadamente o eventualmente en combinación.

Como aceptor de ácido se tienen en cuenta todas las bases inorgánicas u orgánicas habituales, por ejemplo trietilamina, diisopropilamina, *N*-metilmorfolina o *N,N*-dimetilaminopiridina. El procedimiento A de acuerdo con la invención se realiza eventualmente en presencia de un coadyuvante de reacción adecuado tal como por ejemplo *N,N*-dimetilformamida o *N,N*-dimetilaminopiridina.

Como disolventes o diluyentes se tienen en cuenta todos los disolventes orgánicos inertes, por ejemplo hidrocarburos alifáticos o aromáticos (tal como éter de petróleo, tolueno), hidrocarburos halogenados (tal como clorotolueno, diclorometano, cloroformo, 1,2-dicloroetano), éteres (tal como dietiléter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano), ésteres (tal como acetato de etilo o de metilo), hidrocarburos nitrogenados (tal como nitrometano, nitroetano, nitrobenzono), nitrilos (tal como acetonitrilo, benzonitrilo), amidas (tal como *N,N*-dimetilformamida, *N,N*-dimetilacetamidas, *N*-metilformanilida, *N*-metilpirrolidona, triamida de ácido hexametilfosfórico) así como dimetilsulfoxido o agua o mezclas de los disolventes mencionados.

Para la síntesis de los compuestos con la fórmula (A1-III) pueden usarse sin embargo también anhídridos mixtos (LG = COOR) (véase G. W. Anderson *et al.* J. Am. Chem. Soc. 1967, 89, 5012-5017). En este procedimiento que se conduce a través de compuestos de fórmula (A1-II, LG = CO-OR, R = alquilo, arilo), pueden usarse ésteres de ácido clorofórmico, por ejemplo cloroformiato de isobutilo (LG = COOR con R = iso-butilo) y cloroformiato de isopropilo (LG = COOR con R = iso-propilo). Igualmente pueden usarse para ello cloruro de dietilacetilo, cloruro de trimetilacetilo y compuestos similares.

**Procedimiento A – etapa 2:** La función amida de las amidas de ácido carboxílico del tipo (A1-III) puede transformarse mediante reactivos de sulfurización adecuados, por ejemplo reactivos de Lawesson o sulfuro de fósforo(V), con calentamiento en un disolvente adecuado, por ejemplo tolueno o anisol, en una función tioamida, de manera que se producen compuestos del tipo (A1-IV) (véase por ejemplo el documento WO 2013/33901 para 5-bromo-*N*-(2,6-difluorofenil)piridin-3-carbotioamida). Con este tipo de reacción puede realizarse ya parcialmente una ciclación para dar compuestos de fórmula (I).

**Procedimiento A – etapa 3:** Finalmente pueden transformarse los compuestos de fórmula (I) según procedimientos conocidos en la bibliografía (véase por ejemplo el documento WO 2013/33901 para 2-(5-bromopiridin-3-il)-4-fluoro-1,3-benzotiazol) mediante calentamiento en disolventes adecuados, por ejemplo tolueno o DMF, en ausencia de una base tal como por ejemplo hidruro de sodio o carbonato de potasio, en los tiazoles bicíclicos del tipo (I).

Si en el procedimiento de acuerdo con la invención para la preparación de los compuestos de fórmula (I) se usa como compuesto de fórmula (A1-I) 3,5-dibromopiridin-2-amina ( $R^1 = H$ ,  $R^2 = Br$ ) y como compuesto de fórmula (A1-II) cloruro de 3-(clorocarbonil)piridinio (A = 3-piridin-3-ilo), entonces se produce en primer lugar la *N*-(3,5-dibromopiridin-2-il)nicotinamida (A = 3-piridin-3-ilo,  $R^1 = H$ ,  $R^2 = Br$ ). La posterior tionización y ciclación conduce entonces a la 6-bromo-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-*b*]piridina (I-a-1)), A = piridin-3-ilo,  $R^1 = H$ ,  $R^2 = Br$  [véase el ejemplo de síntesis I-a-1].

Los compuestos de fórmula (I), en los que  $R^2$  representa halógeno, por ejemplo bromo o yodo, pueden obtenerse de acuerdo con el esquema de reacción I a partir de derivados halogenados de 2-bromo-anilina (A1-I). A partir de esto pueden generarse, según procedimientos conocidos en la bibliografía (B a F), otros compuestos de fórmula (I). A modo de ejemplo están representados los procedimientos B a F y los tipos de productos que resultan de esto en el esquema de reacción II.

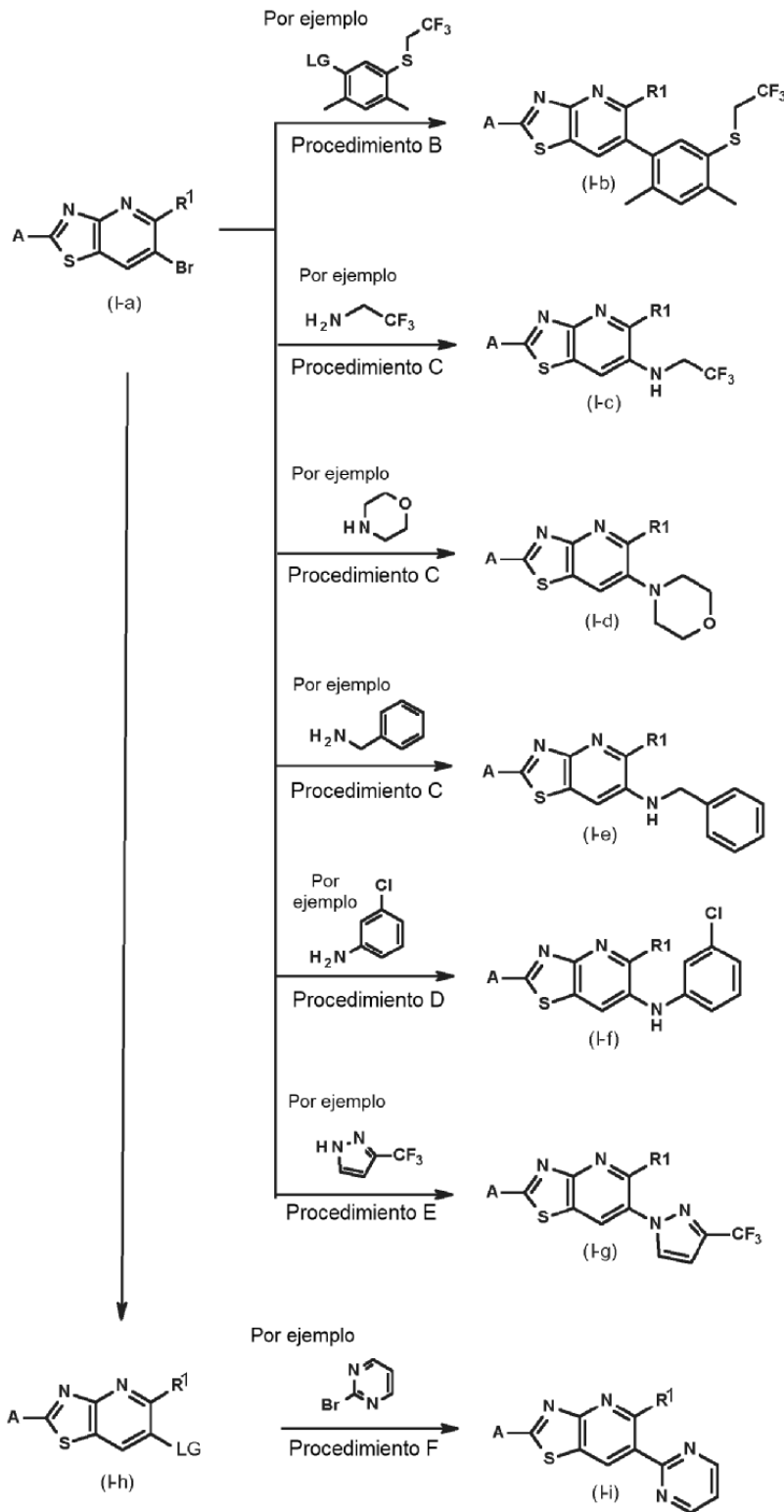
**Procedimiento B/F:** de acuerdo con el documento WO 2010/71819 o bien Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters (2009), 19(21), 6176 - 6180 pueden arilarse tiazolopiridinas bromadas con ácidos arilborónicos o bien arilboronatos de pinacol sustituidos, generados eventualmente in situ, en presencia de catalizadores de acoplamiento adecuados, tal como por ejemplo tetrakis(trifenilfosfina)-paladio(0) o cloruro de bis-trifenilfosfina-



5 paladio(II) en presencia de una base, tal como por ejemplo carbonato de sodio, en un disolvente o bien diluyente orgánico, inerte, por ejemplo tolueno en combinación con etanol (procedimiento B), de manera que pueden obtenerse compuestos enlazados con carbono del tipo (I-b) [véase también el ejemplo de síntesis (19)]. También ácidos borónicos heteroaromáticos eventualmente sustituidos o bien sus ésteres de pinacol pueden hacerse reaccionar de manera análoga con sistemas heteroaromáticos bicíclicos bromatos según el procedimiento B (véase por ejemplo el documento EP 1 214 319 B1 para 3-[6-(3-furil)-3H-imidazo[4,5-b]piridin-3-il]fenol).

10 Como alternativa, los compuestos de fórmula (I-a) pueden transformarse en primer lugar por medio de procedimientos conocidos en la bibliografía en compuestos del tipo (I-h), que reaccionan posteriormente entonces a continuación con heterociclos activados con halógeno, eventualmente sustituidos adicionalmente de acuerdo con el esquema de reacción II (procedimiento F) [véase T. Ishiyama *et al.*, J. Org. Chem., 1995, 60, 7508 - 7510; documento WO 2010/151601] en un disolvente o bien diluyente inerte, orgánico para dar compuestos enlazados con carbono del tipo (I-i).

### **Esquema de reacción II – Procedimiento B a F**



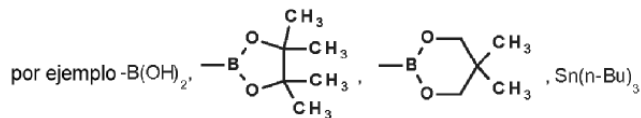
Para A= piridin-3-ilo y R1= H compárese también

Ejemplo de aplicación (19)

Ejemplo de aplicación (25)

Ejemplo de aplicación (27)

LG = grupo saliente nucleófilo generado eventualmente in situ LG (leaving group)



Como catalizadores de acoplamiento se tienen en consideración catalizadores de paladio tal como [1,1'-bis

(difenílfosfino)ferrocen]dicloropaladio(II)] o tetrakis(trifenílfosfin)paladio(0).

Como coadyuvantes de reacción básicos adecuados para la realización de los procedimientos de acuerdo con el esquema de reacción II se usan preferentemente carbonatos del sodio o potasio.

5 Como disolventes se usan preferentemente nitrilos tal como acetonitrilo, benzonitrilo, en particular acetonitrilo, o éteres tal como dietiléter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, en particular 1,2-dimetoxietano en combinación con agua.

10 **Procedimiento C:** Preferentemente por medio de catálisis mediante catalizadores de acoplamiento adecuados, tal como por ejemplo tris-(dibencilidenacetona)-dipaladio(O) usando ligandos adecuados, por ejemplo 2,2'-bis-(difenílfosfino)-1,1'-binaftilo (BINAP), y una base tal como por ejemplo terc-butanolato de sodio pueden hacerse reaccionar bicíclicos heteroaromáticos bromados en un disolvente o bien diluyente orgánico, inerte también con aminas primarias o bien secundarias alifáticas eventualmente sustituidas o arilmetil- o bien hetarilmetilaminas (tipo de ejemplo (I-e)) [véase por ejemplo el documento WO 2013/123215 A2 para la síntesis de 3-(4-etoxibencil)-N-(4-etilbencil)-3H-imidazo[4,5-b]piridin-6-amina].

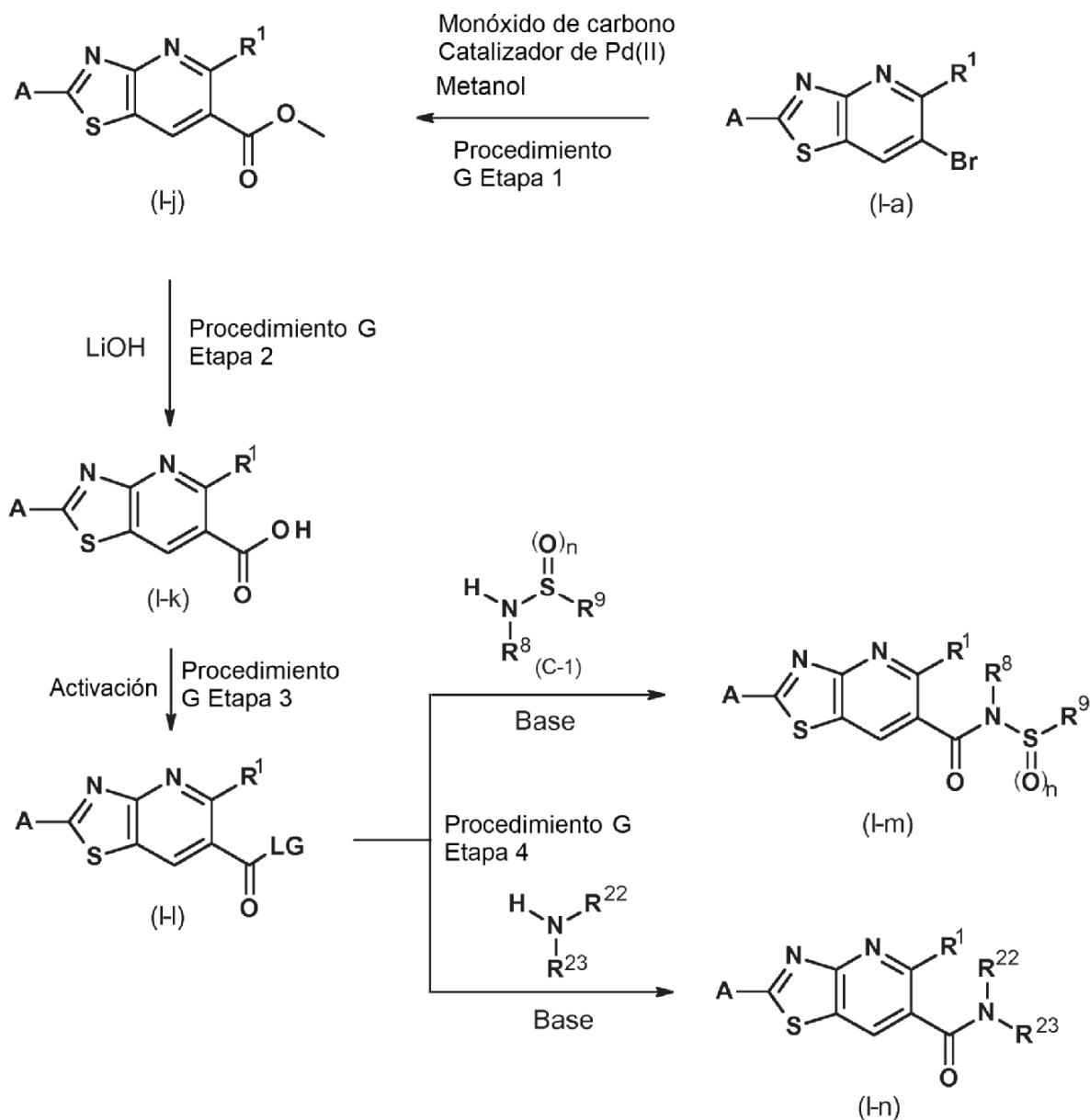
15 Como disolventes o diluyentes se tienen en consideración todos los disolventes orgánicos inertes, por ejemplo hidrocarburos alifáticos o aromáticos. Preferentemente se usan hidrocarburos aromáticos tal como por ejemplo tolueno.

20 **Procedimiento D:** Bicíclicos heteroaromáticos bromados que reaccionan con anilinas eventualmente sustituidas en un disolvente o bien diluyente orgánico inerte para dar los correspondientes compuestos de arilamino (véase el tipo de ejemplo (I-f) y ejemplo de aplicación (25)), preferentemente con catálisis mediante catalizadores de acoplamiento adecuados tal como por ejemplo tris-(dibencilidenacetona)-dipaladio(0), en presencia de un ligando adecuado, tal como por ejemplo xantphos, y una base, por ejemplo carbonato de cesio (véase por ejemplo el documento EP 2 341 052 para la preparación de 7-anilino-N-fenil-4H-pirido[3,2-b][1,4]oxazin-4-carboxamida). También compuestos amino-heteroaromáticos eventualmente sustituidos pueden hacerse reaccionar en un disolvente o bien diluyente orgánico, inerte de manera análoga, por ejemplo con catálisis mediante catalizadores de acoplamiento adecuados tal como tris-(dibencilidenacetona)-dipaladio(0), con ligandos adecuados, por ejemplo 2,2'-bis-(difenílfosfino)-1,1'-binaftilo (BINAP) y una base, por ejemplo terc-butanolato de sodio.

Como disolventes o diluyentes se tienen en consideración todos los disolventes orgánicos inertes, por ejemplo hidrocarburos alifáticos o aromáticos. Preferentemente se usan hidrocarburos aromáticos (por ejemplo tolueno).

30 **Procedimiento E:** Las aminas heterocíclicas tal como por ejemplo imidazoles, pirazoles o triazoles, eventualmente sustituidas, de acuerdo con el procedimiento E mostrado en el esquema de reacción II [véase el documento US 2012/122843 para la preparación de 6-amino-3-(4-metil-1H-imidazol-1-il)piridin-2-carbonitrilo] preferentemente en presencia de catalizadores adecuados tal como yoduro de cobre(I), en presencia de ligandos básicos, por ejemplo L-prolina o *trans*-N,N'-dimetilciclohexano-1,2-diamina, y una base tal como carbonato de cesio o carbonato de potasio, en un disolvente o bien diluyente orgánico inerte pueden introducirse en sistemas bicíclicos bromados (véase el tipo de ejemplo (I-g) y el ejemplo de aplicación (27)).

40 Como disolventes o diluyentes se tienen en consideración todos los disolventes orgánicos inertes, por ejemplo hidrocarburos alifáticos o aromáticos. Preferentemente se usan hidrocarburos aromáticos tal como por ejemplo tolueno, sin embargo también disolventes más polares tal como DMF. Los compuestos de fórmula (I), en los que R<sup>2</sup> representa halógeno, por ejemplo bromo o yodo, pueden obtenerse de acuerdo con el esquema de reacción I a partir de derivados halogenados de 2-bromo-anilina. A partir de esto pueden generarse según procedimientos conocidos en la bibliografía (G) otros compuestos de fórmula (I), tal como se describe en el esquema de reacción III.

**Esquema de reacción III – Procedimiento G**

LG = grupo saliente, por ejemplo halógeno, CO-OR (R = arilo, alquilo)  
N-imidazol-1-ilo, OH etc.

- Procedimiento G – etapa 1:** Los compuestos de fórmula (l-a), en los que R<sup>2</sup> representa halógeno, por ejemplo bromo o yodo, pueden hacerse reaccionar según procedimientos conocidos en la bibliografía con monóxido de carbono y un alcohol, por ejemplo metanol, bajo catálisis mediante compuestos de metal adecuados tal como por ejemplo dicloruro de (1,1'-bis(difenilfosfino)ferrocen)-paladio(II), y en presencia de bases tal como trietilamina, en disolventes adecuados tal como por ejemplo el propio alcohol usado, THF y/o DMF, para dar los correspondientes ésteres de ácido carboxílico (l-j) [véase por ejemplo el documento WO 2009/152072 para 2-[[terc-butoxicarbonil]amino]metil]-3H-imidazo[4,5-b]piridin-6-carboxilato de metilo].
- Procedimiento G – etapa 2:** Los ésteres del tipo (l-j) pueden transformarse según procedimientos conocidos en la bibliografía por medio de bases adecuadas, tal como por ejemplo solución acuosa de hidróxido de litio o de hidróxido de sodio, en disolventes adecuados tal como por ejemplo dioxano o THF, en los compuestos (l-k) con función ácido libre.
- Procedimiento G – etapa 3 y 4:** Los compuestos de fórmula (l), en los que R<sup>2</sup> representa un resto de la serie (C-1) a (C-9) (tipo l-m) o un grupo de fórmula C(X)-NR<sup>22</sup>R<sup>23</sup> (tipo l-n), pueden prepararse por ejemplo a partir de compuestos de fórmula (l), en los que R<sup>2</sup> representa un grupo carboxilo (tipo l-k), tras activación adecuada (es decir LG representa un grupo saliente "leaving group" nucleófilo generado eventualmente *in situ*) por medio de

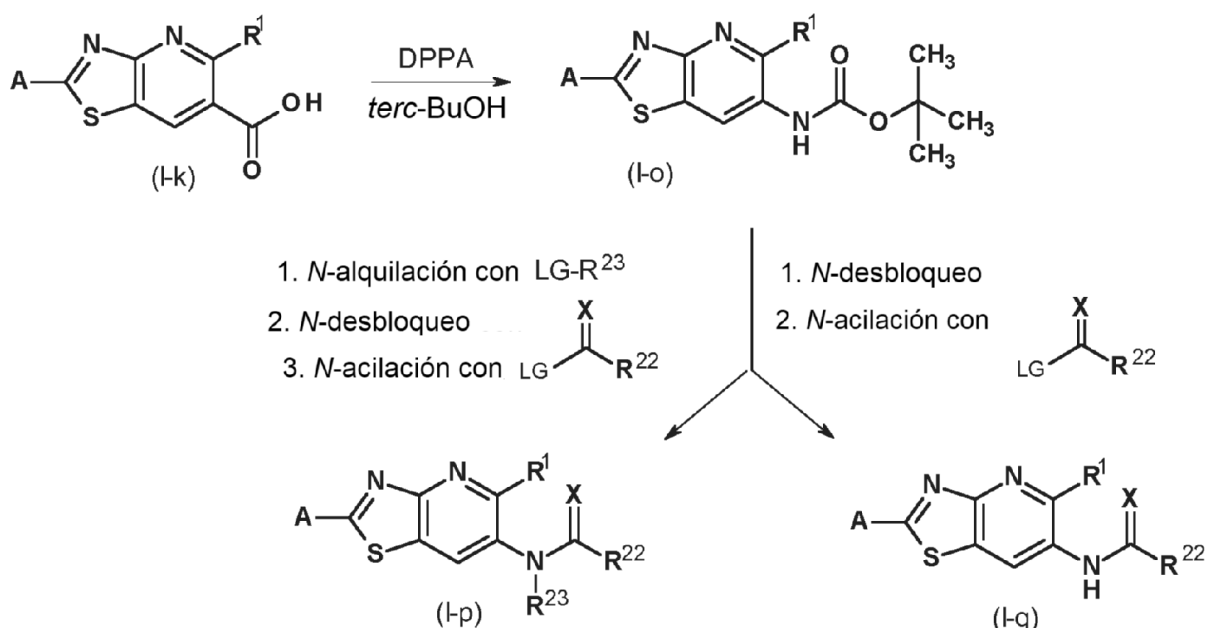
procedimientos conocidos generalmente [véase el procedimiento A, etapa 1].

Las siguientes reacciones de los compuestos de fórmula (I) activados con los respectivos componentes amino según el esquema de reacción III se realiza eventualmente en presencia de un coadyuvante de reacción adecuado y en presencia de un disolvente o diluyente adecuado.

- 5 Los compuestos de fórmula (I), en los que  $R^2$  representa  $-NR^{23}-C(X)-R^{22}$ , pueden obtenerse por ejemplo a partir de compuestos de fórmula (I), en los que  $R^2$  representa  $-NHR^{23}$ , por medio de reacción de N-acilación usando compuestos de fórmula  $LG-C(X)-R^{22}$  activados, en la que LG representa un grupo saliente nucleófilo generado eventualmente *in situ*.

- 10 Estos compuestos de fórmula (I), en los que  $R^2$  representa un grupo de fórmula  $-NHR^{23}$ , pueden prepararse a partir de compuestos de fórmula (I), en los que  $R^2$  representa un grupo carboxilo, de acuerdo con el esquema de reacción IV según procedimientos conocidos.

### Esquema de reacción IV – Procedimiento H1



LG = grupo saliente, por ejemplo halógeno  
 DPPA = difenilfosforilazida

- 15 **Procedimiento H1:** Por ejemplo pueden obtenerse los compuestos de fórmula (I-o) por medio de degradación de Curtius, tal como se describe por ejemplo en Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, tomo XI/1 (Georg Thieme Verlag Stuttgart), pág. 865.

Según esto pueden reaccionar los compuestos de fórmula (I-k) por ejemplo con difenilfosforilazida (DPPA) en presencia de *tert*-butanol directamente para dar compuestos de fórmula (I-o).

- 20 A partir de los compuestos de fórmula (I-o) pueden obtenerse los compuestos de fórmula (I-p) mediante N-alkilación en una primera etapa de reacción, N-desbloqueo (es decir separación del grupo Boc) en una segunda etapa de reacción y posterior N-acilación en una tercera etapa de reacción.

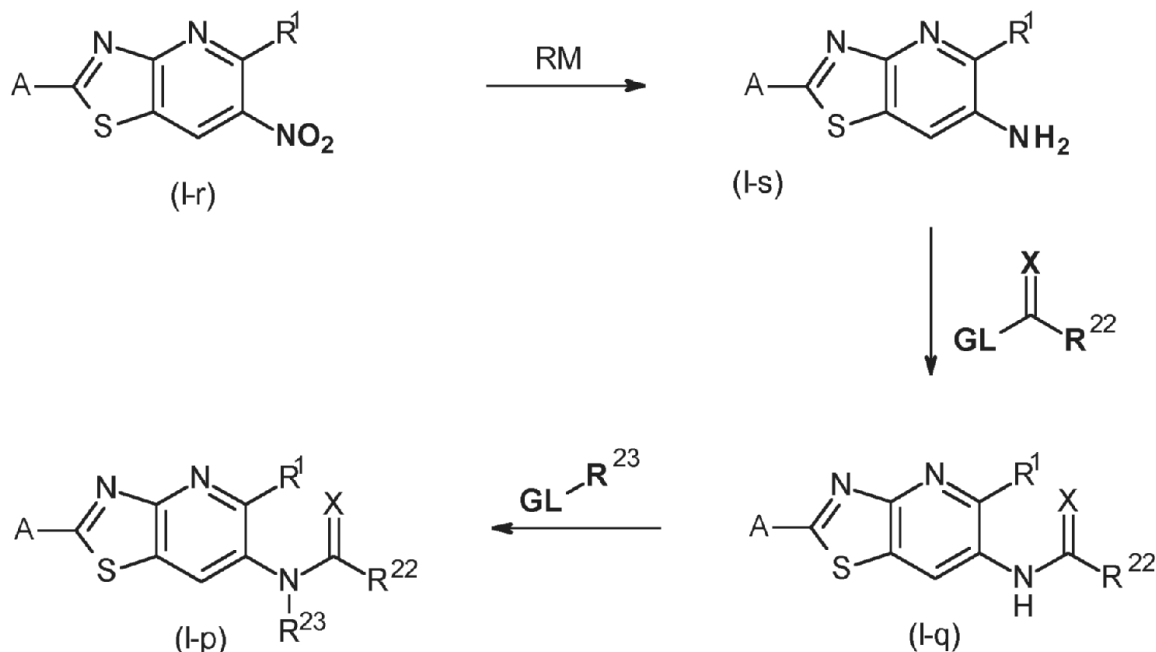
Los compuestos de fórmula (I-q) pueden prepararse por medio de N-desbloqueo (es decir separación del grupo Boc) en una primera etapa de reacción y posterior N-acilación en una segunda etapa de reacción.

- 25 En general, para la separación del grupo protector pueden usarse coadyuvantes de reacción ácidos o básicos según el modo de procedimiento conocido en la bibliografía. En el caso del uso de grupos protectores del tipo carbamato se usan preferentemente coadyuvantes de reacción ácidos. En el caso del uso del grupo protector carbamato de *tert*-butilo (grupo Boc) se usan por ejemplo mezcla de ácidos minerales tal como ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido nítrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico o de ácidos orgánicos tal como ácido benzoico, ácido fórmico, ácido acético, ácido trifluoroacético, ácido metansulfónico, ácido bencensulfónico o ácido toluensulfónico en un diluyente adecuado tal como agua y/o un disolvente orgánico tal como tetrahidrofurano, dioxano, diclorometano, cloroformo, acetato de etilo, etanol o metanol. Se prefieren mezclas de ácido clorhídrico o ácido acético con agua y/o
- 30

un disolvente orgánico tal como acetato de etilo.

Como alternativa al procedimiento H1, los compuestos de los tipos I-p o bien I-q pueden prepararse también a partir de compuestos sintetizados según el procedimiento A, mediante el procedimiento H2 descrito a continuación:

### Esquema de reacción V – Procedimiento H2:



RM = agente de reducción, por ejemplo Fe, Zn, Sn (II), cianoborohidruro de sodio, hidrógeno en Pd/C etc.  
 LG = grupo saliente, por ejemplo halógeno o OH

- 5 **Procedimiento H2:** Los compuestos preparados según el procedimiento A, en los que R<sup>2</sup> representa nitro (I-r), pueden transformarse mediante reducción del grupo nitro según procedimientos conocidos en la bibliografía en los correspondientes compuestos amino (I-s) (véase por ejemplo el documento WO2009/14674 A1, 2009 para la reducción mediante Fe(0); el documento US2005/197331 A1, 2005 para la reducción mediante Sn(II)Cl<sub>2</sub>; el documento WO2007/86800 A1, 2007 para la reducción mediante cianoborohidruro de sodio). Éstos pueden  
 10 convertirse mediante acilación y eventualmente posterior alquilación según procedimientos conocidos en la bibliografía en los compuestos del tipo (I-q) o bien (I-p) de acuerdo con la invención.

### Procedimiento I – Procedimientos generales para la oxidación de tioéteres para dar sulfóxidos y sulfonas

- 15 Los compuestos de fórmula (I), en los que W representa SO (sulfóxidos) o representa SO<sub>2</sub> (sulfonas), pueden prepararse según procedimientos conocidos en la bibliografía mediante oxidación de compuestos de fórmula (I), en los que W representa S (tioéteres), por ejemplo mediante un agente de oxidación en un disolvente o bien diluyente adecuado. Como agentes de oxidación son adecuados por ejemplo ácido nítrico diluido, peróxido de hidrógeno, Oxone® y ácidos peroxycarboxílicos, tal como por ejemplo ácido *meta*-cloroperbenzoico. Como disolventes o bien diluyentes son adecuados disolventes orgánicos inertes, normalmente acetonitrilo y disolventes halogenados tal como diclorometano, cloroformo o dicloroetano, así como agua y alcoholes tal como metanol para la reacción con Oxone®.  
 20

Es posible también la introducción de anilinas adecuadas R<sup>1</sup>-NH<sub>2</sub> o ácidos borónicos R<sup>1</sup>-B(OH)<sub>2</sub>, en los que W representa SO o SO<sub>2</sub>, según el procedimiento □□ o bien D. Éstas pueden oxidarse a partir de los correspondientes precursores, en los que W representa S, según procedimientos conocidos por la bibliografía, tal como se describe por ejemplo en el documento WO 2013/092350.

- 25 Para la generación de sulfóxidos enriquecidos enantioméricos es adecuado una multiplicidad de procedimientos, tal como se describen por G. E. O'Mahony *et al.*, en ARKIVOC (Gainesville, FL, Estados Unidos), 2011, 1, 1-110: oxidaciones asimétricas catalizadas con metal de tioéteres, por ejemplo con titanio o vanadio como fuentes de catalizador usadas en la mayoría de los casos, en forma de Ti(O<sup>i</sup>Pr)<sub>4</sub> o VO(acac)<sub>2</sub>, junto con un ligando quirral y un agente de oxidación tal como hidroperóxido de terc-butilo (TBHP), hidroperóxido de 2-fenilpropan-2-ilo (CHP) o

peróxido de hidrógeno; oxidaciones asimétricas catalizadas no con metal mediante uso de agentes de oxidación quirales o catalizadores quirales; oxidaciones electroquímicas o biológicas así como resolución cinética de sulfóxidos y desplazamiento nucleofílico (según el procedimiento de Andersens).

5 Los enantiómeros pueden obtenerse también del racemato, por ejemplo mediante separación preparativa por medio de un HPLC quiral.

Cuando se habla a continuación de compuestos de fórmula (I), están incluidos también aquellos compuestos en la tabla 1 que no se encuentran bajo la fórmula (I) (excepto productos intermedios).

Isómeros

10 Los compuestos de fórmula (I) pueden encontrarse dependiendo del tipo de los sustituyentes como isómeros geométricos y/o como isómeros ópticamente activos o correspondientes mezclas de isómeros en distinta composición. Estos estereoisómeros son por ejemplo enantiómeros, diastereómeros, atropisómeros o isómeros geométricos. La invención comprende por consiguiente estereoisómeros puros como también mezclas discretionales de estos isómeros.

Procedimientos y Usos

15 La invención se refiere a un procedimiento no terapéutico para el control de plagas animales, en el que los compuestos de la fórmula (I) se dejan actuar sobre las plagas animales y/o su hábitat. El control de las plagas animales se realiza preferentemente en agricultura y silvicultura y en la protección de los materiales. Se excluyen de esto preferentemente procedimientos para el tratamiento quirúrgico o terapéutico del cuerpo humano o animal y procedimientos de diagnóstico que se realizan en el cuerpo humano o animal.

20 La invención se refiere además al uso de los compuestos de la fórmula (I) como pesticidas, en particular productos fitosanitarios.

En el marco de la presente solicitud, el término pesticidas también comprende siempre el término productos fitosanitarios.

25 Los compuestos de fórmula (I) dada la buena tolerancia en las plantas, la toxicidad homeoterma favorable y la buena compatibilidad ambiental, son adecuados para proteger las plantas y los órganos de las plantas frente a factores de estrés biótico y abiótico, para aumentar los rendimientos de la cosecha, para mejorar la calidad del material cosechado y para controlar las plagas animales, especialmente insectos, arácnidos, helmintos, nematodos y moluscos, los cuales se encuentran en la agricultura, en la horticultura, en la ganadería, en cultivos acuáticos, en bosques, en jardines e instalaciones para el ocio, en la protección de productos almacenados y de materiales así como en el sector de la higiene. Preferentemente pueden usarse en forma de pesticidas. Son eficaces contra las especies normalmente sensibles y resistentes y contra todas o algunas etapas del desarrollo. A las plagas mencionadas anteriormente pertenecen:

35 plagas de la cepa de Arthropoda, en particular de la clase de Arachnida por ejemplo *Acarus* spp., por ejemplo *Acarus siro*, *Aceria kuko*, *Aceria sheldoni*, *Aculops* spp., *Aculus* spp., por ejemplo *Aculus fockeui*, *Aculus schlechtendali*, *Amblyomma* spp., *Amphitetranychus viennensis*, *Argas* spp., *Boophilus* spp., *Brevipalpus* spp., por ejemplo *Brevipalpus phoenicis*, *Bryobia graminum*, *Bryobia praetiosa*, *Centruroides* spp., *Choriotptes* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Dermatophagoides pteronyssinus*, *Dermatophagoides farinae*, *Dermacentor* spp., *Eotetranychus* spp., por ejemplo *Eotetranychus hicoriae*, *Epitrimerus pyri*, *Eutetranychus* spp., por ejemplo *Eutetranychus banksi*, *Eriophyes* spp., por ejemplo *Eriophyes pyri*, *Glycyphagus domesticus*, *Halotydeus destructor*, *Hemitarsonemus* spp., por ejemplo *Hemitarsonemus latus* (= *Polyphagotarsonemus latus*), *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Latrodectus* spp., *Loxosceles* spp., *Neutrombicula autumnalis*, *Nupharsa* spp., *Oligonychus* spp., por ejemplo *Oligonychus coniferarum*, *Oligonychus ilicis*, *Oligonychus indicus*, *Oligonychus mangiferus*, *Oligonychus pratensis*, *Oligonychus punicae*, *Oligonychus yothersi*, *Ornithodoros* spp., *Ornithonyssus* spp., *Panonychus* spp., por ejemplo *Panonychus citri* (= *Metatetranychus citri*), *Panonychus ulmi* (= *Metatetranychus ulmi*), *Phyllocoptura oleivora*, *Platytetranychus multidigituli*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Psoroptes* spp., *Rhipicephalus* spp., *Rhizoglyphus* spp., *Sarcoptes* spp., *Scorpio maurus*, *Steneotarsonemus* spp., *Steneotarsonemus spinki*, *Tarsonemus* spp., por ejemplo *Tarsonemus confusus*, *Tarsonemus pallidus*, *Tetranychus* spp., por ejemplo *Tetranychus canadensis*, *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus turkestanii*, *Tetranychus urticae*, *Trombicula alfreddugesi*, *Vaejovis* spp., *Vasates lycopersici*,

50 de la clase de Chilopoda por ejemplo *Geophilus* spp., *Scutigera* spp.;

del orden o de la clase de Collembola por ejemplo *Onychiurus armatus*; *Sminthurus viridis*;

de la clase de Diplopoda por ejemplo *Blaniulus guttulatus*;

de la clase de Insecta, por ejemplo del orden der Blattodea por ejemplo *Blatta orientalis*, *Blattella asahinai*, *Blattella germanica*, *Leucophaea maderae*, *Panchlora* spp., *Parcoblatta* spp., *Periplaneta* spp., por ejemplo

*Periplaneta americana*, *Periplaneta australasiae*, *Supella longipalpa*;

del orden de Coleoptera por ejemplo *Acalymma vittatum*, *Acanthoscelides obtectus*, *Adoretus* spp., *Agelastica alni*, *Agriotes* spp., por ejemplo *Agriotes linneatus*, *Agriotes mancus*, *Alphitobius diaperinus*, *Amphimallon solstitialis*, *Anobium punctatum*, *Anoplophora* spp., *Anthonomus* spp., por ejemplo *Anthonomus grandis*,  
 5 *Anthrenus* spp., *Apion* spp., *Apogonia* spp., *Atomaria* spp., por ejemplo *Atomaria linearis*, *Attagenus* spp., *Baris caerulescens*, *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp., por ejemplo *Bruchus pisorum*, *Bruchus rufimanus*, *Cassida* spp., *Cerotoma trifurcata*, *Ceutorrhynchus* spp., por ejemplo *Ceutorrhynchus assimilis*, *Ceutorrhynchus quadridens*, *Ceutorrhynchus rapae*, *Chaetocnema* spp., por ejemplo *Chaetocnema confinis*, *Chaetocnema denticulata*, *Chaetocnema ectypa*, *Cleonus mendicus*, *Conoderus* spp., *Cosmopolites* spp., por ejemplo  
 10 *Cosmopolites sordidus*, *Costelytra zealandica*, *Ctenicera* spp., *Curculio* spp., por ejemplo *Curculio caryae*, *Curculio caryatrypes*, *Curculio obtusus*, *Curculio sayi*, *Cryptolestes ferrugineus*, *Cryptolestes pusillus*, *Cryptorhynchus lapathi*, *Cryptorhynchus mangiferae*, *Cylindrocopturus* spp., *Cylindrocopturus adpersus*, *Cylindrocopturus fumissi*, *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp., por ejemplo *Diabrotica balteata*, *Diabrotica barberi*, *Diabrotica undecimpunctata howardi*, *Diabrotica undecimpunctata undecimpunctata*, *Diabrotica virgifera virgifera*,  
 15 *Diabrotica virgifera zea*, *Dichocrocis* spp., *Di cladispa armigera*, *Diloboderus* spp., *Epilachna* spp., por ejemplo *Epilachna borealis*, *Epilachna varivestis*, *Epitrix* spp., por ejemplo *Epitrix cucumeris*, *Epitrix fuscula*, *Epitrix hirtipennis*, *Epitrix subcrinita*, *Epitrix tuberis*, *Faustinus* spp., *Gibbium psyllodes*, *Gnathocerus cornutus*, *Hellula undalis*, *Heteronychus arator*, *Heteronyx* spp., *Hylamorpha elegans*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera postica*, *Hypomeces squamosus*, *Hypothenemus* spp., por ejemplo *Hypothenemus hampei*, *Hypothenemus obscurus*,  
 20 *Hypothenemus pubescens*, *Lachnosterna consanguinea*, *Lasioderma serricornis*, *Latheticus oryzae*, *Lathridius* spp., *Lema* spp., *Leptinotarsa decemlineata*, *Leucoptera* spp., por ejemplo *Leucoptera coffeella*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lixus* spp., *Luperomorpha xanthodera*, *Luperodes* spp., *Lyctus* spp., *Megascelis* spp., *Melanotus* spp., por ejemplo *Melanotus longulus oregonensis*, *Meligethes aeneus*, *Melolontha* spp., por ejemplo *Melolontha melolontha*, *Migdolus* spp., *Monochamus* spp., *Naupactus xanthographus*, *Necrobia* spp., *Niptus hololeucus*,  
 25 *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Oryzaphagus oryzae*, *Otiorhynchus* spp., por ejemplo *Otiorhynchus cribricollis*, *Otiorhynchus ligustici*, *Otiorhynchus ovatus*, *Otiorhynchus rugosostriatus*, *Otiorhynchus sulcatus*, *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllophaga* spp., *Phyllophaga helleri*, *Phyllotreta* spp., por ejemplo *Phyllotreta armoraciae*, *Phyllotreta pusilla*, *Phyllotreta ramosa*, *Phyllotreta striolata*, *Popillia japonica*, *Premnotrypes* spp., *Prostephanus truncatus*, *Psylliodes* spp., por ejemplo *Psylliodes affinis*, *Psylliodes chrysocephala*, *Psylliodes punctulata*, *Ptinus* spp., *Rhizobius ventralis*, *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus* spp., por ejemplo *Sitophilus granarius*, *Sitophilus linearis*, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Sphenophorus* spp.,  
 30 *Stegobium paniceum*, *Sternechus* spp., por ejemplo *Sternechus paludatus*, *Symphyletes* spp., *Tanymecus* spp., por ejemplo *Tanymecus dilaticollis*, *Tanymecus indicus*, *Tanymecus palliatus*, *Tenebrio molitor*, *Tenebrioides mauritanicus*, *Tribolium* spp., por ejemplo *Tribolium audax*, *Tribolium castaneum*, *Tribolium confusum*,  
 35 *Trogoderma* spp., *Tychius* spp., *Xylotrechus* spp., *Zabrus* spp., por ejemplo *Zabrus tenebrioides*;

del orden de Diptera por ejemplo *Aedes* spp., por ejemplo *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes sticticus*, *Aedes vexans*, *Agromyza* spp., por ejemplo *Agromyza frontella*, *Agromyza parvicornis*, *Anastrepha* spp., *Anopheles* spp., por ejemplo *Anopheles quadrimaculatus*, *Anopheles gambiae*, *Asphondylia* spp., *Bactrocera* spp., por ejemplo *Bactrocera cucurbitae*, *Bactrocera dorsalis*, *Bactrocera oleae*, *Bibio hortulanus*, *Calliphora erythrocephala*, *Calliphora vicina*, *Ceratitis capitata*, *Chironomus* spp., *Chrysomya* spp., *Chrysops* spp., *Chrysozona pluvialis*, *Cochliomya* spp., *Contarinia* spp., por ejemplo *Contarinia johnsoni*, *Contarinia nasturtii*, *Contarinia pyrivora*, *Contarinia schulzi*, *Contarinia sorghicola*, *Contarinia tritici*, *Cordylobia anthropophaga*, *Cricotopus sylvestris*, *Culex* spp., por ejemplo *Culex pipiens*, *Culex quinquefasciatus*, *Culicoides* spp., *Culiseta* spp., *Cuterebra* spp., *Dacus oleae*, *Dasineura* spp., por ejemplo *Dasineura brassicae*, *Delia* spp., por ejemplo  
 40 *Delia antiqua*, *Delia coarctata*, *Delia florilega*, *Delia platura*, *Delia radicum*, *Dermatobia hominis*, *Drosophila* spp., por ejemplo *Drosophila melanogaster*, *Drosophila suzukii*, *Echinocnemus* spp., *Fannia* spp., *Gasterophilus* spp., *Glossina* spp., *Haematopota* spp., *Hydrellia* spp., *Hydrellia griseola*, *Hylemya* spp., *Hippobosca* spp., *Hypoderma* spp., *Liriomyza* spp., por ejemplo *Liriomyza brassicae*, *Liriomyza huidobrensis*, *Liriomyza sativae*, *Lucilia* spp., por ejemplo *Lucilia cuprina*, *Lutzomyia* spp., *Mansonina* spp., *Musca* spp., por ejemplo *Musca domestica*, *Musca domestica vicina*, *Oestrus* spp., *Oscinella frit*, *Paratanytarsus* spp., *Paralauterborniella subcincta*, *Pegomya* spp., por ejemplo *Pegomya betae*, *Pegomya hyoscyami*, *Pegomya rubivora*, *Phlebotomus* spp., *Phorbia* spp., *Phormia* spp., *Piophilina casei*, *Prodiplosis* spp., *Psila rosae*, *Rhagoletis* spp., por ejemplo *Rhagoletis cingulata*, *Rhagoletis completa*, *Rhagoletis fausta*, *Rhagoletis indifferens*, *Rhagoletis mendax*, *Rhagoletis pomonella*, *Sarcophaga* spp.,  
 50 *Simulium* spp., por ejemplo *Simulium meridionale*, *Stomoxys* spp., *Tabanus* spp., *Tetanops* spp., *Tipula* spp., por ejemplo *Tipula paludosa*, *Tipula simplex*;

del orden de Hemiptera por ejemplo *Acizzia acaciaebaileyanae*, *Acizzia dodonaeae*, *Acizzia uncatoides*, *Acrida turrita*, *Acyrtosiphon* spp., por ejemplo *Acyrtosiphon pisum*, *Acrogonia* spp., *Aeneolamia* spp., *Agonoscena* spp., *Aleyrodes proletella*, *Aleurolobus barodensis*, *Aleurothrixus floccosus*, *Allocaidara malayensis*, *Amrasca* spp., por ejemplo *Amrasca bigutulla*, *Amrasca devastans*, *Anuraphis cardui*, *Aonidiella* spp., por ejemplo *Aonidiella aurantii*, *Aonidiella citrina*, *Aonidiella inornata*, *Aphanostigma piri*, *Aphis* spp., por ejemplo *Aphis citricola*, *Aphis craccivora*, *Aphis fabae*, *Aphis forbesi*, *Aphis glycines*, *Aphis gossypii*, *Aphis hederiae*, *Aphis illinoisensis*, *Aphis middletoni*, *Aphis nasturtii*, *Aphis nerii*, *Aphis pomi*, *Aphis spiraeicola*, *Aphis viburniphila*, *Arboridia apicalis*, *Arytainilla* spp., *Aspidiella* spp., *Aspidiotus* spp., por ejemplo *Aspidiotus nerii*, *Atanus* spp., *Aulacorthum solani*,



*Bemisia tabaci*, *Blastopsylla occidentalis*, *Boreioglycaspis melaleucae*, *Brachycaudus helichrysi*, *Brachycolus* spp., *Brevicoryne brassicae*, *Cacopsylla* spp., por ejemplo *Cacopsylla pyricola*, *Calligypona marginata*, *Carneiocephala fulgida*, *Ceratovacuna lanigera*, *Cercopidae*, *Ceroplastes* spp., *Chaetosiphon fragaefolii*, *Chionaspis tegalensis*, *Chlorita onukii*, *Chondracris rosea*, *Chromaphis juglandicola*, *Chrysomphalus ficus*,  
 5 *Cicadulina mbila*, *Coccoxymylus halli*, *Coccus* spp., por ejemplo *Coccus hesperidum*, *Coccus longulus*, *Coccus pseudomagnoliarum*, *Coccus viridis*, *Cryptomyzus ribis*, *Cryptoneoassa* spp., *Ctenarytaina* spp., *Dalbulus* spp., *Dialeurodes citri*, *Diaphorina citri*, *Diaspis* spp., *Drosicha* spp., *Dysaphis* spp., por ejemplo *Dysaphis apiifolia*, *Dysaphis plantaginea*, *Dysaphis tulipae*, *Dysmicoccus* spp., *Empoasca* spp., por ejemplo *Empoasca abrupta*,  
 10 *Empoasca fabae*, *Empoasca maligna*, *Empoasca solana*, *Empoasca stevensi*, *Eriosoma* spp., por ejemplo *Eriosoma americanum*, *Eriosoma lanigerum*, *Eriosoma pyricola*, *Erythroneura* spp., *Eucalyptolyma* spp., *Euphyllura* spp., *Euscelis bilobatus*, *Ferrisia* spp., *Geococcus coffeae*, *Glycaspis* spp., *Heteropsylla cubana*, *Heteropsylla spinulosa*, *Homalodisca coagulata*, *Hyalopterus arundinis*, *Hyalopterus pruni*, *Icerya* spp., por ejemplo *Icerya purchasi*, *Idiocerus* spp., *Idioscopus* spp., *Laodelphax striatellus*, *Lecanium* spp., por ejemplo *Lecanium corni* (=Parthenolecanium corni), *Lepidosaphes* spp., por ejemplo *Lepidosaphes ulmi*, *Lipaphis erysimi*,  
 15 *Lycorma delicatula*, *Macrosiphum* spp., por ejemplo *Macrosiphum euphorbiae*, *Macrosiphum lillii*, *Macrosiphum rosae*, *Macrosteles facifrons*, *Mahanarva* spp., *Melanaphis sacchari*, *Metcalfiella* spp., *Metcalfa pruinosa*, *Metopolophium dirhodum*, *Monellia costalis*, *Monelliopsis pecanis*, *Myzus* spp., por ejemplo *Myzus ascalonicus*, *Myzus cerasi*, *Myzus ligustri*, *Myzus ornatus*, *Myzus persicae*, *Myzus nicotianae*, *Nasonovia ribisnigri*, *Nephotettix* spp., por ejemplo *Nephotettix cincticeps*, *Nephotettix nigropictus*, *Nilaparvata lugens*, *Oncometopia* spp.,  
 20 *Orthezia praelonga*, *Oxya chinensis*, *Pachyopsylla* spp., *Parabemisia myricae*, *Paratrioza* spp., por ejemplo *Paratrioza cockerelli*, *Parlatoria* spp., *Pemphigus* spp., por ejemplo *Pemphigus bursarius*, *Pemphigus populivivae*, *Peregrinus maidis*, *Phenacoccus* spp., por ejemplo *Phenacoccus madeirensis*, *Phloeomyzus passerinii*, *Phorodon humuli*, *Phylloxera* spp., por ejemplo *Phylloxera devastatrix*, *Phylloxera notabilis*, *Pinnaspis aspidistrae*, *Planococcus* spp., por ejemplo *Planococcus citri*, *Prosopidopsylla flava*, *Protopulvinaria pyriformis*,  
 25 *Pseudaulacaspis pentagona*, *Pseudococcus* spp., por ejemplo *Pseudococcus calceolariae*, *Pseudococcus comstocki*, *Pseudococcus longispinus*, *Pseudococcus maritimus*, *Pseudococcus viburni*, *Psyllopsis* spp., *Psylla* spp., por ejemplo *Psylla buxi*, *Psylla mali*, *Psylla pyri*, *Pteromalus* spp., *Pyrilla* spp., *Quadraspidiotus* spp., por ejemplo *Quadraspidiotus juglansregiae*, *Quadraspidiotus ostreaeformis*, *Quadraspidiotus perniciosus*, *Quesada gigas*, *Rastrococcus* spp., *Rhopalosiphum* spp., por ejemplo *Rhopalosiphum maidis*, *Rhopalosiphum oxyacanthae*, *Rhopalosiphum padi*, *Rhopalosiphum rufiabdominale*, *Saissetia* spp., por ejemplo *Saissetia coffeae*, *Saissetia miranda*, *Saissetia neglecta*, *Saissetia oleae*, *Scaphoideus titanus*, *Schizaphis graminum*, *Selenaspis articulatus*, *Sitobion avenae*, *Sogata* spp., *Sogatella furcifera*, *Sogatodes* spp., *Stictocephala festina*, *Siphoninus phillyreae*, *Tenalaphara malayensis*, *Tetragonocephala* spp., *Tinocallis caryaefoliae*,  
 30 *Tomaspis* spp., *Toxoptera* spp., por ejemplo *Toxoptera aurantii*, *Toxoptera citricidus*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Triozia* spp., por ejemplo *Triozia diospyri*, *Typhlocyba* spp., *Unaspis* spp., *Viteus vitifolii*, *Zygina* spp.;

del suborden de Heteroptera por ejemplo *Anasa tristis*, *Antestiopsis* spp., *Boisea* spp., *Blissus* spp., *Calocoris* spp., *Campylomma livida*, *Cavelerius* spp., *Cimex* spp., por ejemplo *Cimex adjunctus*, *Cimex hemipterus*, *Cimex lectularius*, *Cimex pilosellus*, *Collaria* spp., *Creontiades dilutus*, *Dasynus piperis*, *Dichelops furcatus*, *Diconocoris hewetti*, *Dysdercus* spp., *Euschistus* spp., por ejemplo *Euschistus heros*, *Euschistus servus*, *Euschistus tristigmus*, *Euschistus variolarius*, *Eurygaster* spp., *Halyomorpha halys*, *Heliopeletis* spp., *Horcias nobilellus*, *Leptocoris* spp., *Leptocoris varicornis*, *Leptoglossus occidentalis*, *Leptoglossus phyllopus*, *Lygocoris* spp., por ejemplo *Lygocoris pabulinus*, *Lygus* spp., por ejemplo *Lygus elisus*, *Lygus hesperus*, *Lygus lineolaris*, *Macropes excavatus*, *Monalonion atratum*, *Nezara* spp., por ejemplo *Nezara viridula*, *Oebalus* spp., *Piesma quadrata*, *Piezodorus* spp., por ejemplo *Piezodorus guildinii*, *Psallus* spp., *Pseudacysta perseae*, *Rhodnius* spp.,  
 40 *Sahlbergella singularis*, *Scaptocoris castanea*, *Scotinophora* spp., *Stephanitis nashi*, *Tibraca* spp., *Triatoma* spp.;

del orden de Hymenoptera por ejemplo *Acromyrmex* spp., *Athalia* spp., por ejemplo *Athalia rosae*, *Atta* spp., *Diprion* spp., por ejemplo *Diprion similis*, *Hoplocampa* spp., por ejemplo *Hoplocampa cookei*, *Hoplocampa testudinea*, *Lasius* spp., *Linepithema humile*, *Monomorium pharaonis*, *Sirex* spp., *Solenopsis invicta*, *Tapinoma* spp., *Urocerus* spp., *Vespa* spp., por ejemplo *Vespa crabro*, *Xeris* spp.;

50 del orden de Isopoda por ejemplo *Armadillidium vulgare*, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*;

del orden de Isoptera por ejemplo *Coptotermes* spp., por ejemplo *Coptotermes formosanus*, *Cornitermes cumulans*, *Cryptotermes* spp., *Incisitermes* spp., *Microtermes obesi*, *Odontotermes* spp., *Reticulitermes* spp., por ejemplo *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes hesperus*;

del orden de Lepidoptera por ejemplo *Achroia grisella*, *Acronicta major*, *Adoxophyes* spp., por ejemplo *Adoxophyes orana*, *Aedia leucomelas*, *Agrotis* spp., por ejemplo *Agrotis segetum*, *Agrotis ipsilon*, *Alabama* spp., por ejemplo *Alabama argillacea*, *Amyelois transitella*, *Anarsia* spp., *Anticarsia* spp., por ejemplo *Anticarsia gemmatalis*, *Argyroproce* spp., *Barathra brassicae*, *Borbo cinnara*, *Bucculatrix thurberiella*, *Bupalus piniarius*, *Busseola* spp., *Cacoecia* spp., *Caloptilia theivora*, *Capua reticulana*, *Carpocapsa pomonella*, *Carposina niponensis*, *Cheimatobia brumata*, *Chilo* spp., por ejemplo *Chilo plejadellus*, *Chilo suppressalis*, *Choristoneura* spp., *Clysia ambiguella*, *Cnaphalocerus* spp., *Cnaphalocrocis medinalis*, *Cnephasia* spp., *Conopomorpha* spp., *Conotrachelus* spp., *Copitarsia* spp., *Cydia* spp., por ejemplo *Cydia nigricana*, *Cydia pomonella*, *Dalaca noctuides*, *Diaphania* spp., *Diatraea saccharalis*, *Earias* spp., *Ecdytolopha aurantium*, *Elasmopalpus lignosellus*,

5 *Eldana saccharina*, *Ephestia* spp., por ejemplo *Ephestia elutella*, *Ephestia kuehniella*, *Epinotia* spp., *Epiphyas postvittana*, *Etiella* spp., *Eulia* spp., *Eupoecilia ambiguella*, *Euproctis* spp., por ejemplo *Euproctis chrysorrhoea*, *Euxoa* spp., *Feltia* spp., *Galleria mellonella*, *Gracillaria* spp., *Grapholitha* spp., por ejemplo *Grapholitha molesta*, *Grapholitha prunivora*, *Hedylepta* spp., *Helicoverpa* spp., por ejemplo *Helicoverpa armigera*, *Helicoverpa zea*,  
 10 *Heliothis* spp., por ejemplo *Heliothis virescens* *Hofmannophila pseudospretella*, *Homoeosoma* spp., *Homona* spp., *Hyponomeuta padella*, *Kakivoria flavofasciata*, *Laphygma* spp., *Leucinodes orbonalis*, *Leucoptera* spp., por ejemplo *Leucoptera coffeella*, *Lithocolletis* spp., por ejemplo *Lithocolletis blancardella*, *Lithophane antennata*, *Lobesia* spp., por ejemplo *Lobesia botrana*, *Loxagrotis albicosta*, *Lymantria* spp., por ejemplo *Lymantria dispar*, *Lyonetia* spp., por ejemplo *Lyonetia clerkella*, *Malacosoma neustria*, *Maruca testulalis*, *Mamestra brassicae*,  
 15 *Melanitis leda*, *Mocis* spp., *Monopis obviella*, *Mythimna separata*, *Nemapogon cloacellus*, *Nymphula* spp., *Oiketicus* spp., *Oria* spp., *Orthaga* spp., *Ostrinia* spp., por ejemplo *Ostrinia nubilalis*, *Oulema melanopus*, *Oulema oryzae*, *Panolis flammea*, *Parnara* spp., *Pectinophora* spp., por ejemplo *Pectinophora gossypiella*, *Perileucoptera* spp., *Phthorimaea* spp., por ejemplo *Phthorimaea operculella*, *Phyllocnistis citrella*, *Phyllonorycter* spp., por ejemplo *Phyllonorycter blancardella*, *Phyllonorycter crataegella*, *Pieris* spp., por ejemplo *Pieris rapae*, *Platynota stultana*, *Plodia interpunctella*, *Plusia* spp., *Plutella xylostella* (= *Plutella maculipennis*), *Prays* spp., *Prodenia* spp., *Protoparce* spp., *Pseudaletia* spp., por ejemplo *Pseudaletia unipuncta*, *Pseudoplusia includens*, *Pyrausta nubilalis*, *Rachiplusia nu*, *Schoenobius* spp., por ejemplo *Schoenobius bipunctifer*, *Scirpophaga* spp., por ejemplo *Scirpophaga innotata*, *Scotia segetum*, *Sesamia* spp., por ejemplo *Sesamia inferens*, *Sparganothis* spp., *Spodoptera* spp., por ejemplo *Spodoptera eradiana*, *Spodoptera exigua*, *Spodoptera frugiperda*, *Spodoptera praefica*, *Stathmopoda* spp., *Stomopteryx subsecivella*, *Synanthedon* spp., *Tecia solanivora*, *Thermesia gemmatalis*, *Tinea cloacella*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*, *Tortrix* spp., *Trichophaga tapetzella*, *Trichoplusia* spp., por ejemplo *Trichoplusia ni*, *Tryporyza incertulas*, *Tuta absoluta*, *Virachola* spp.;

25 del orden de Orthoptera o Saltatoria por ejemplo *Acheta domesticus*, *Dichroplus* spp., *Gryllotalpa* spp., por ejemplo *Gryllotalpa gryllotalpa*, *Hieroglyphus* spp., *Locusta* spp., por ejemplo *Locusta migratoria*, *Melanoplus* spp., por ejemplo *Melanoplus devastator*, *Paratlanticus ussuriensis*, *Schistocerca gregaria*;

del orden de Phthiraptera por ejemplo *Damalinia* spp., *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phylloxera vastatrix*, *Phthirus pubis*, *Trichodectes* spp.;

del orden de Psocoptera por ejemplo *Lepinotus* spp., *Liposcelis* spp.;

30 del orden de Siphonaptera por ejemplo *Ceratophyllus* spp., *Ctenocephalides* spp., por ejemplo *Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, *Xenopsylla cheopis*;

35 del orden de Thysanoptera por ejemplo *Anaphothrips obscurus*, *Baliothrips biformis*, *Drepanothrips reuteri*, *Enneothrips flavens*, *Frankliniella* spp., por ejemplo *Frankliniella fusca*, *Frankliniella occidentalis*, *Frankliniella schultzei*, *Frankliniella tritici*, *Frankliniella vaccinii*, *Frankliniella williamsi*, *Heliothrips spp.*, *Hercinothrips femoralis*, *Rhipiphorothrips cruentatus*, *Scirtothrips* spp., *Taeniothrips cardamomi*, *Thrips* spp., por ejemplo *Thrips palmi*, *Thrips tabaci*;

del orden de Zygentoma (= Thysanura), por ejemplo *Ctenolepisma* spp., *Lepisma saccharina*, *Lepismodes inquilinus*, *Thermobia domestica*;

de la clase de Symphyla por ejemplo *Scutigera* spp., por ejemplo *Scutigera immaculata*;

plagas de la cepa de Mollusca, en particular de la clase de Bivalvia, por ejemplo *Dreissena* spp.;

40 así como de la clase de Gastropoda por ejemplo *Arion* spp., por ejemplo *Arion ater rufus*, *Biomphalaria* spp., *Bulinus* spp., *Deroceras* spp., por ejemplo *Deroceras laeve*, *Galba* spp., *Lymnaea* spp., *Oncomelania* spp., *Pomacea* spp., *Succinea* spp.;

45 parásitos de animales y humanos de las cepas de Platyhelminthes y Nematoda, por ejemplo *Aelurostrongylus* spp., *Amidostomum* spp., *Ancylostoma* spp., *Angiostrongylus* spp., *Anisakis* spp., *Anoplocephala* spp., *Ascaris* spp., *Ascaridia* spp., *Baylisascaris* spp., *Brugia* spp., *Bunostomum* spp., *Capillaria* spp., *Chabertia* spp., *Clonorchis* spp., *Cooperia* spp., *Crenosoma* spp., *Cyathostoma* spp., *Dicrocoelium* spp., *Dictyocaulus* spp., *Diphyllobothrium* spp., *Dipylidium* spp., *Dirofilaria* spp., *Dracunculus* spp., *Echinococcus* spp., *Echinostoma* spp., *Enterobius* spp., *Eucoleus* spp., *Fasciola* spp., *Fascioloides* spp., *Fasciolopsis* spp., *Filaroides* spp., *Gongylonema* spp., *Gyrodactylus* spp., *Habronema* spp., *Haemonchus* spp., *Heligmosomoides* spp., *Heterakis* spp., *Hymenolepis* spp., *Hyostrongylus* spp., *Litomosoides* spp., *Loa* spp., *Metastrongylus* spp., *Metorchis* spp., *Mesocestoides* spp., *Moniezia* spp., *Muellerius* spp., *Necator* spp., *Nematodirus* spp., *Nippostrongylus* spp., *Oesophagostomum* spp., *Ollulanus* spp., *Onchocerca* spp., *Opisthorchis* spp., *Oslerus* spp., *Ostertagia* spp., *Oxyuris* spp., *Paracapillaria* spp., *Parafilaria* spp., *Paragonimus* spp., *Paramphistomum* spp., *Paranoplocephala* spp., *Parascaris* spp., *Passalurus* spp., *Protostrongylus* spp., *Schistosoma* spp., *Setaria* spp., *Spirocerca* spp., *Stephanofilaria* spp., *Stephanurus* spp., *Strongyloides* spp., *Strongylus* spp., *Syngamus* spp., *Taenia* spp., *Teladorsagia* spp., *Thelazia* spp., *Toxascaris* spp., *Toxocara* spp., *Trichinella* spp., *Trichobilharzia* spp., *Trichostrongylus* spp., *Trichuris* spp., *Uncinaria* spp., *Wuchereria* spp.;

plagas de plantas de la cepa de Nematoda, es decir nematodos parasitarios de plantas, en particular *Aglenchus* spp., por ejemplo *Aglenchus agricola*, *Anguina* spp., por ejemplo *Anguina tritici*, *Aphelenchoides* spp., por ejemplo *Aphelenchoides arachidis*, *Aphelenchoides fragariae*, *Belonolaimus* spp., por ejemplo *Belonolaimus gracilis*, *Belonolaimus longicaudatus*, *Belonolaimus nortoni*, *Bursaphelenchus* spp., por ejemplo *Bursaphelenchus cocophilus*, *Bursaphelenchus eremus*, *Bursaphelenchus xylophilus*, *Cacopaurus* spp., por ejemplo *Cacopaurus pestis*, *Criconemella* spp., por ejemplo *Criconemella curvata*, *Criconemella onoensis*, *Criconemella ornata*, *Criconemella rusium*, *Criconemella xenoplax* (= *Mesocriconema xenoplax*), *Criconemoides* spp., por ejemplo *Criconemoides ferniae*, *Criconemoides onoense*, *Criconemoides ornatum*, *Ditylenchus* spp., por ejemplo *Ditylenchus dipsaci*, *Dolichodorus* spp., *Globodera* spp., por ejemplo *Globodera pallida*, *Globodera rostochiensis*, *Helicotylenchus* spp., por ejemplo *Helicotylenchus dihystera*, *Hemicriconemoides* spp., *Hemicycliophora* spp., *Heterodera* spp., por ejemplo *Heterodera avenae*, *Heterodera glycines*, *Heterodera schachtii*, *Hoplolaimus* spp., *Longidorus* spp., por ejemplo *Longidorus africanus*, *Meloidogyne* spp., por ejemplo *Meloidogyne chitwoodi*, *Meloidogyne fallax*, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne incognita*, *Meloinema* spp., *Nacobbus* spp., *Neotylenchus* spp., *Paraphelenchus* spp., *Paratrichodorus* spp., por ejemplo *Paratrichodorus minor*, *Pratylenchus* spp., por ejemplo *Pratylenchus penetrans*, *Pseudohalenchus* spp., *Psilenchus* spp., *Punctodera* spp., *Quinisulcius* spp., *Radopholus* spp., por ejemplo *Radopholus citrophilus*, *Radopholus similis*, *Rotylenchulus* spp., *Rotylenchus* spp., *Scutellonema* spp., *Subanguina* spp., *Trichodorus* spp., por ejemplo *Trichodorus obtusus*, *Trichodorus primitivus*, *Tylenchorhynchus* spp., por ejemplo *Tylenchorhynchus annulatus*, *Tylenchulus* spp., por ejemplo *Tylenchulus semipenetrans*, *Xiphinema* spp., por ejemplo *Xiphinema index*.

Además en el subconjunto de los protozoos puede combatirse el orden de *Coccidia* por ejemplo *Eimeria* spp..

Los compuestos de fórmula (I) pueden usarse opcionalmente, en ciertas concentraciones o tasas de aplicación, además como herbicidas, protectores, reguladores del crecimiento o agentes para mejorar las propiedades de las plantas, o como microbicidas o gametocidas, por ejemplo como fungicidas, antimicóticos, bactericidas, viricidas (incluyendo agentes contra viroides) o como agentes contra MLO (organismos tipo micoplasma) y RLO (organismos tipo rickettsia). De ser apropiado, además se pueden usar como productos intermedios o precursores para la síntesis de otros principios activos.

#### Formulaciones

La presente invención además se refiere a formulaciones y formas de aplicación preparadas a partir de las mismas en forma de pesticidas, como por ejemplo licores para goteo, rociado y pulverización, que comprenden al menos un compuesto de fórmula (I). Eventualmente, las formas de aplicación contienen otros pesticidas y/o adyuvantes que mejoran la acción, tales como agentes que favorecen la penetración, por ejemplo, aceites vegetales, como por ejemplo aceite de colza, aceite de girasol, aceites minerales, como por ejemplo aceites de parafina, ésteres de alquilo de ácidos grasos vegetales, como por ejemplo éster metílico de aceite de colza, o éster metílico de aceite de soja, o alcoxiatos de alcanol y/o dispersantes, como por ejemplo alquilsiloxanos y/o sales, por ejemplo sales de amonio o fosfonio orgánicas o inorgánicas, como por ejemplo sulfato de amonio o hidrogenofosfato de diamonio y/o promotores de retención, como por ejemplo sulfosuccinato de dioctilo o polímeros de hidroxipropil-guar y/o humectantes, como por ejemplo glicerol y/o fertilizantes, como por ejemplo fertilizantes que contienen amonio, potasio o fósforo.

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 Pesticide Specifications, Manual on development and use of FAO and WHO specifications for pesticides, FAO Plant Production and Protection Papers - 173, prepared by the FAO/WHO Joint Meeting on Pesticide Specifications, 2004, ISBN: 9251048576. Las formulaciones opcionalmente comprenden, junto a uno o más principios activos de la invención, otros principios activos agroquímicos.

Preferentemente se trata de formulaciones o formas de aplicación que contienen coadyuvantes, tales como por ejemplo diluyentes, disolventes, promotores de la espontaneidad, vehículos, emulsionantes, dispersantes, agentes anticongelantes, biocidas, espesantes y/u otros coadyuvantes, tal como por ejemplo adyuvantes. Un adyuvante en este contexto es un componente que mejora la acción biológica de la formulación sin que el componente tenga por sí mismo una acción biológica. Ejemplos de adyuvantes son agentes que promueven la retención, el comportamiento de esparcimiento, la adhesión a la superficie de la hoja o la penetración.

Estas formulaciones se preparan de manera conocida, por ejemplo mediante mezclado de los compuestos de fórmula (I) con coadyuvantes tal como por ejemplo diluyentes, disolventes y/o vehículos sólidos y/u otros coadyuvantes, como por ejemplo tensioactivos. La preparación de las formulaciones se realiza o bien en plantas adecuadas o también antes o durante la aplicación.

Como coadyuvantes pueden usarse aquellas sustancias que son adecuadas para impartir propiedades especiales, tales como ciertas propiedades físicas, técnicas y/o biológicas, a la formulación de los compuestos de fórmula (I) o a las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones (por ejemplo pesticidas listos para usar tales como licores para pulverización o productos para el tratamiento de semillas).

Como diluyentes son adecuados por ejemplo agua, líquidos químicos orgánicos polares y apolares por ejemplo de las clases de los hidrocarburos aromáticos y no aromáticos (tales como parafinas, alquilbencenos, alquilnaftalenos, clorobencenos), de los alcoholes y polioles (que eventualmente también pueden estar sustituidos eterificados y/o esterificados), de las cetonas (tales como acetona, ciclohexanona), ésteres (también grasas y aceites) y (poli)éteres, de las aminas, amidas, lactamas (tales como N-alquilpirrolidonas) y lactonas simples y sustituidas, de las sulfonas y sulfóxidos (tales como dimetilsulfóxido).

En el caso del uso de agua como diluyente, pueden usarse también por ejemplo disolventes orgánicos como disolventes auxiliares. Como disolventes líquidos se tienen en cuenta esencialmente: compuestos aromáticos, tal como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, compuestos aromáticos clorados e hidrocarburos alifáticos clorados, tal como clorobenceno, cloroetileno o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos, tal como ciclohexano o parafina, por ejemplo fracciones de petróleo, aceites minerales y vegetales, alcoholes, tales como butanol o glicol así como sus éteres y ésteres, cetonas tal como acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona o ciclohexanona, disolventes muy polares, tal como dimetilformamida y dimetilsulfóxido así como agua.

Básicamente pueden usarse todos los disolventes adecuados. Los disolventes adecuados son por ejemplo hidrocarburos aromáticos tal como por ejemplo xileno, tolueno o alquilnaftalenos, hidrocarburos aromáticos o alifáticos clorados, tal como clorobenceno, cloroetileno o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos, tal como ciclohexano, parafinas, fracciones de petróleo, aceites minerales y vegetales, alcoholes, tal como metanol, etanol, isopropanol, butanol o glicol así como sus éteres y ésteres, cetonas, tal como acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona o ciclohexanona, disolventes fuertemente polares, tal como dimetilsulfóxido, así como agua.

Básicamente pueden usarse todos los vehículos adecuados. Como vehículos se tienen en cuenta en particular: por ejemplo sales de amonio y harinas de rocas naturales, tal como caolinas, arcillas, talco, creta, cuarzo, atapulgita, montmorillonita o tierra de diatomeas, y harina de roca sintética, tal como ácido silícico altamente disperso, alúmina y silicatos naturales o sintéticos, resinas, ceras y/o fertilizantes sólidos. Las mezclas de estos vehículos pueden usarse de igual modo. Como vehículos para gránulos se tienen en cuenta: por ejemplo rocas naturales molidas y fraccionadas, tal como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita así como gránulos sintéticos de harinas inorgánicas y orgánicas así como gránulos de material orgánico, tal como aserrín, papel, cáscaras de coco, mazorcas de maíz y tallos de tabaco.

También pueden usarse diluyentes o disolventes gaseosos licuados. En particular son adecuados tales diluyentes o vehículos que son gaseosos a temperatura ambiente y a presión atmosférica, por ejemplo gases propulsores en aerosol, tal como los halohidrocarburos, así como butano, propano, nitrógeno y dióxido de carbono.

Ejemplos de emulsionantes y/o espumantes, dispersantes o humectantes con propiedades iónicas o no iónicas, o mezclas de estos tensioactivos son sales de poli(ácido acrílico), sales de ácido lignosulfónico, sales de ácido fenolsulfónico o ácido naftalenosulfónico, policondensados de óxido de etileno con alcoholes grasos o con ácidos grasos o con aminas grasas, con fenoles sustituidos (preferentemente alquilfenoles o arilfenoles), sales de ésteres sulfosuccínicos, derivados de taurina (preferentemente tauratos de alquilo), ésteres fosfóricos de alcoholes polietoxilados o fenoles, 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 proteínas, licores residuales de lignosulfito y metilcelulosa. La presencia de un tensioactivo es ventajosa cuando uno de los compuestos de fórmula (I) y/o uno de los vehículos inertes es insoluble en agua y cuando la aplicación se realiza en agua.

Otros coadyuvantes que pueden estar presentes en las formulaciones y las formas de aplicación que derivan de las mismas incluyen colorantes tal como pigmentos inorgánicos, por ejemplo, óxido de hierro, óxido de titanio, azul de Prusia y colorantes orgánicos, tal como colorantes de alizarina, colorantes azoicos y colorantes de ftalocianina metálica y nutrientes y oligonutrientes, tal como las sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc.

Además pueden estar contenidos estabilizadores, tal como criostabilizadores, conservantes, antioxidantes, agentes fotoprotectores u otros agentes que mejoran la estabilidad química y/o física. Además pueden estar contenidos espumantes o antiespumantes.

Además pueden contener las formulaciones y las formas de aplicación que derivan de las mismas como coadyuvantes adicionales también agentes de pegajosidad, tal como carboximetilcelulosa, polímeros naturales y sintéticos en forma de polvos, gránulos o redes cristalinas, tal como goma arábiga, poli(alcohol vinílico), poli(acetato de vinilo) así como fosfolípidos naturales, tal como cefalinas y lecitinas y fosfolípidos sintéticos. Otros coadyuvantes pueden ser aceites minerales y vegetales.

Eventualmente pueden estar contenidos aún otros coadyuvantes en las formulaciones y las formas de aplicación que derivan de las mismas. Tales aditivos son por ejemplo fragancias, coloides protectores, aglutinantes, adhesivos, espesantes, agentes tixotrópicos, agentes que favorecen la penetración, promotores de retención, estabilizadores, secuestrantes, agentes formadores de complejos, humectantes, dispersantes. En general, los compuestos de fórmula (I) pueden combinarse con cualquier aditivo sólido o líquido que se usa habitualmente para fines de

formulación.

Como promotores de retención se tienen en consideración todas aquellas sustancias que reducen la tensión superficial dinámica, como por ejemplo sulfosuccinato de dioctilo, o aumentan la viscoelasticidad, como por ejemplo polímeros de hidroxipropil-guar.

- 5 Como agentes que favorecen la penetración se tienen en consideración en el presente contexto todas aquellas sustancias que se usan habitualmente para mejorar la penetración de los principios activos agroquímicos en plantas. Los agentes que favorecen la penetración se definen en este contexto por su capacidad para penetrar desde el licor de aplicación (generalmente acuoso) y/o desde el recubrimiento de pulverización dentro de la cutícula de la planta y de este modo incrementar la movilidad de los principios activos en la cutícula. El procedimiento que se describe en la bibliografía (Baur *et al.*, 1997, Pesticide Science 51, 131-152) puede usarse para determinar esta propiedad. A modo de ejemplo se mencionan alcoxilatos de alcohol tal como por ejemplo etoxilato graso de coco (10) o etoxilato de isotridecilo (12), ésteres de ácido graso, como por ejemplo éster metílico de aceite de colza o éster metílico de aceite de soja, alcoxilatos de amina graso, como por ejemplo etoxilato de amina de sebo (15) o sales de amonio y/o fosfonio, tal como por ejemplo sulfato de amonio o hidrógeno fosfato de diamonio.
- 10
- 15 Las formulaciones contienen preferentemente entre el 0,00000001 y el 98 % en peso del compuesto de fórmula (I), de manera especialmente preferente entre el 0,01 y el 95 % en peso del compuesto de fórmula (I), de manera muy especialmente preferente entre el 0,5 y el 90 % en peso del compuesto de fórmula (I), con respecto al peso de la formulación.

- 20 El contenido del compuesto de fórmula (I) en las formas de aplicación (en particular pesticidas) preparadas a partir de las formulaciones puede variar dentro de límites amplios. La concentración del compuesto de fórmula (I) en las formas de aplicación puede encontrarse habitualmente entre el 0,00000001 % y el 95 % en peso del compuesto de fórmula (I), preferentemente entre el 0,00001 % y el 1 % en peso, con respecto al peso de la forma de aplicación. La aplicación se realiza de una manera habitual adaptada a las formas de aplicación.

Mezclas

- 25 Los compuestos de fórmula (I) pueden usarse en mezcla con uno o varios fungicidas, bactericidas, acaricidas, molusquicidas, nematocidas, insecticidas, productos microbiológicos, organismos beneficiosos, herbicidas, fertilizantes, agentes repelentes de pájaros, fitotónicos, esterilizantes, sustancias protectoras, semioquímicos y/o agentes reguladores del crecimiento de la planta para ampliar así por ejemplo el espectro de acción, prolongar la duración de acción, aumentar la velocidad de acción, impedir la repelencia o prevenir el desarrollo de la resistencia.
- 30 Además, tales combinaciones de principios activos pueden mejorar el crecimiento de la planta y/o la tolerancia frente a factores abióticos tal como por ejemplo altas o bajas temperaturas, frente a la sequedad o frente a contenido elevado de sal en agua o bien en suelo. También puede mejorarse la capacidad de florecer y obtener fruto, puede optimizarse la capacidad de germinación y la radicación, puede simplificarse la cosecha y aumentarse el rendimiento de la cosecha, puede influirse en la madurez, puede aumentarse la calidad y/o el valor nutritivo de los productos de cosecha, puede prolongarse la estabilidad de almacenamiento y/o puede mejorarse la procesabilidad de los productos de cosecha.
- 35

- Además pueden encontrarse los compuestos de fórmula (I) en mezcla con otros principios activos o semioquímicos, tal como agentes atrayentes y/o agentes repelente de pájaros y/o activadores de plantas y/o agentes reguladores del crecimiento y/o fertilizantes. Igualmente pueden usarse los compuestos de fórmula (I) en mezclas con agentes para la mejora de las propiedades de plantas tal como por ejemplo crecimiento, cosecha y la calidad del producto de cosecha.
- 40

En una forma de realización de acuerdo con la invención especial, los compuestos de fórmula (I) en formulaciones o bien en las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones se encuentran en mezcla con otros compuestos, preferentemente aquellos tal como se describen a continuación.

- 45 Cuando uno de los compuestos mencionados a continuación puede aparecer en distintas formas tautoméricas, estas formas están también comprendidas de manera conjunta, aunque no se hayan mencionado éstas en cualquier caso de manera explícita.

Insecticidas / acaricidas / nematocidas

- 50 Los principios activos mencionados en el presente documento con su "nombre común" se conocen y se describen por ejemplo en el manual de pesticidas ("The Pesticide Manual" 16ª ed., British Crop Protection Council 2012) o se buscan en internet (por ejemplo <http://www.alanwood.net/pesticides>).

- (1) Inhibidores de acetilcolinesterasa (AChE), tal como por ejemplo carbamatos, por ejemplo, alanicarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxicarboxim, carbaril, carbofuran, carbosulfan, etiofencarb, fenobucarb, formetanato, furatiocarb, isoprocarb, metiocarb, metomil, metolcarb, oxamil, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, triazamato, trimetacarb, XMC, y xililcarb u organofosfatos, por ejemplo, acefatos, azametifos, azinfos-etílico, azinfos-metílico, cadusafos, cloretoxifos, clorfenvinfos, clormefos, clorpirifos, clorpirifos-metílico,
- 55

- 5 coumafos, cianofos, demeton-s-metilico, diazinon, diclorvos/DDVP, dicrotofos, dimetoato, dimetilvinfos, disulfoton, EPN, etion, etoprofos, fampur, fenamifos, fenitroton, fention, fostiazato, heptenofos, imiciafos, isofenfos, o-(metoxiaminotio-fosforil) salicilato de isopropilo, isoxation, malation, mecarbam, metamidofos, metidation, mevinfos, monocrotofos, naled, ometoato, oxidemeton-metilico, paration, paration-metilico, fentoato, forato, fosadona, fosmet, fosfamidona, foxim, pirimifos-metilico, profenofos, propetamfos, protiofos, piraclofos, piridafention, quinalfos, sulfotep, tebupirimfos, temefos, terbufos, tetraclorvinfos, tiometon, triazofos, triclorfon y vamidotion.
- (2) Antagonistas de los canales de cloruro activados por GABA, tal como por ejemplo organocloros de ciclodieno, por ejemplo clordano y endosulfan o fenilpirazoles (fiproles), por ejemplo etiprol y fipronilo.
- 10 (3) Moduladores del canal de sodio / bloqueadores del canal de sodio dependiente del voltaje, tal como por ejemplo piretroides, por ejemplo, acrinatrina, aletrina, aletrina d-cis-trans, aletrina d-trans, bifentrina, bioaletrina, isómero s-ciclopentenilo de bioaletrina, bioresmetrina, cicloprotrina, ciflutrina, 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, piretrina (piretrum), resmetrina, silafluofeno, teflutrina, tetrametrina, tetrametrina [isómeros (1R)], tralometrina y transflutrina o DDT o metoxiclor.
- 15 (4) Agonistas del receptor nicotínico de acetilcolina (nAChR), tal como por ejemplo neonicotinoides, por ejemplo, acetamiprid, clotianidin, dinotefuran, imidacloprid, nitenpiram, tiacloprid y tiametoxam o nicotina o sulfoxaflor o flupiradifurona.
- (5) Activadores alostéricos del receptor nicotínico de acetilcolina (nAChR), tal como por ejemplo espinosinas, por ejemplo espinetoram y espinosad.
- (6) Activadores de los canales de cloruro, tal como por ejemplo avermectina/milbemicina, por ejemplo abamectina, benzoato de emamectina, lepimectina y milbemectina.
- 20 (7) Miméticos de hormonas juveniles, tal como por ejemplo análogos de hormonas juveniles, por ejemplo, hidropreno, quinopreno y metopreno o fenoxicarb o piriproxifeno.
- (8) Principios activos con mecanismos de acción no conocidos o no específicos, tal como por ejemplo haluros de alquilo, por ejemplo, bromuro de metilo y otros haluros de alquilo; o cloropirina o fluoruro de sulfurilo o bórax o tártaro emético.
- 30 (9) Bloqueantes selectivos de la alimentación, por ejemplo pimetozina o flonicamid.
- (10) Inhibidores del crecimiento de ácaros, por ejemplo clofentezina, hexitiazox y diflovidazina o etoxazol.
- (11) Disruptores microbianos de las membranas del intestino medio de insectos, por ejemplo *Bacillus thuringiensis* subespecie *israelensis*, *Bacillus thuringiensis* subespecie *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subespecie *kurstaki*, *Bacillus thuringiensis* subespecie *tenebrionis*, y proteínas del cultivo BT: Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry2Ab, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb, Cry34/35Ab1.
- 35 (12) Inhibidores de la fosforilación oxidativa, disruptores de ATP, tal como por ejemplo diafenturión o compuestos de organoestaño, por ejemplo azociclotina, cihexatina y óxido de fenbutatina o propargita o tetradifón.
- (13) Desacopladores de fosforilación oxidativa por medio de interrupción del gradiente de protones H, tal como por ejemplo clorfenapir, DNOC y sulfuramida.
- 40 (14) Antagonistas del receptor nicotínico de acetilcolina, tal como por ejemplo bensultap, clorhidrato de cartap, tiociclam y tiosultap-sodio.
- (15) Inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 0, tal como por ejemplo bistriflurona, clorfluazurona, diflubenzurona, flucicloxurona, flufenoxurona, hexaflumurona, lufenurona, novalurona, noviflumurona, teflubenzurona y triflumurona.
- 45 (16) Inhibidores de biosíntesis de quitina, tipo 1, tal como por ejemplo buprofezina.
- (17) Principios activos que interfieren en la muda (en particular en dípteros, es decir insectos de dos alas), tal como por ejemplo ciromazina.
- (18) Agonistas del receptor de ecdisona, tal como por ejemplo cromafenozida, halofenozida, metoxifenozida y tebufenozida.
- 50 (19) Agonistas octopaminérgicos, tal como por ejemplo amitraz.

(20) Inhibidores de transporte de electrones del complejo III, tal como por ejemplo hidrametilnona o acequincilo o fluacripirim.

(21) Inhibidores de transporte de electrones del complejo I, por ejemplo acaricidas METI, por ejemplo fenazaquina, fenpiroximato, pirimidifeno, piridabeno, tebufenpirad y tolfenpirad o rotenona (Derris).

5 (22) Bloqueantes de canales de sodio dependientes de voltaje, por ejemplo indoxacarb o metaflumizona.

(23) Inhibidores de acetil-CoA carboxilasa, tal como por ejemplo derivados del ácido tetrónico y tetrámico, por ejemplo espirodiclofeno, espiromesifeno y espirotetramato.

(24) Inhibidores del transporte de electrones del complejo IV, tal como por ejemplo fosfinas, por ejemplo fosfuro de aluminio, fosfuro de calcio, fosfina y fosfuro de cinc o cianuro.

10 (25) Inhibidores de transporte de electrones del complejo II, tal como por ejemplo cienopirafeno y ciflumetofeno.

(28) Efectores del receptor de rianodina, tal como por ejemplo diamidas, por ejemplo clorantraniliprol, ciantraniliprol y flubendiamida.

Otros principios activos con mecanismo de acción desconocido o no unívoco, tal como por ejemplo afidopiropeno, afoxolaner, azadiractina, benclotiaz, benzoximato, bifenazato, bromopropilato, quinometionato, criolita, ciclaniliprol, cicloxaprid, cihalodiamida, dicloromezotiaz, dicofol, diflovidazina, flometoquina, fluensulfona, flufenerim, flufenoxistrobina, flufiprol, fluhexafona, fluopiram, fluralaner, fufenozida, guadipir, heptaflutrina, imidaclotiz, iprodiona, meperflutrina, paichongding, piflubumida, piridalilo, pirifluquinazona, piriminostrobina, tetrametilflutrina, traniliprol, tetraclorantraniliprol, tioazafeno, triflumezopirim y yodometano; además preparados a base de *Bacillus firmus* (1-1582, BioNeem, Votivo), así como los siguientes compuestos activos conocidos: 1-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]fenil}-3-(trifluorometil)-1H-1,2,4-triazol-5-amina (conocida por el documento WO2006/043635), {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 WO2003/106457), 2-cloro-N-[2-{1-[(2E)-3-(4-clorofenil)prop-2-en-1-il]piperidin-4-il}-4-(trifluorometil)fenil]isonicotinamida (conocida por el documento WO2006/003494), 3-(2,5-dimetilfenil)-4-hidroxi-8-metoxi-1,8-diazaespiro[4.5]dec-3-en-2-ona (conocida por el documento WO2009/049851), 3-(2,5-dimetilfenil)-8-metoxi-2-oxo-1,8-diazaespiro[4.5]dec-3-en-4-il-carbonato de etilo (conocido por el documento WO2009/049851), 4-(but-2-in-1-iloxi)-6-(3,5-dimetilpiperidin-1-il)-5-fluoropirimidina (conocida por el documento WO2004/099160), 4-(but-2-in-1-iloxi)-6-(3-clorofenil)pirimidina (conocida por el documento WO2003/076415), PF1364 (n.º reg. CAS 1204776-60-2), 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 WO2005/085216), 2-[2-({[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil}amino)-5-cian-3-metilbenzoil]-2-etilhidrazincarboxilato de metilo (conocido por el documento WO2005/085216), 2-[2-({[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil}amino)-5-cian-3-metilbenzoil]-2-metilhidrazincarboxilato de metilo (conocido por el documento WO2005/085216), 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 WO2005/085216), 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), 8-cloro-N-[(2-cloro-5-metoxifenil)sulfonyl]-6-(trifluorometil)imidazo[1,2-a]piridin-2-carboxamida (conocida por el documento WO2010/129500), 4-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-2-metil-N-(1-oxidotietan-3-il)benzamida (conocida por el documento WO2009/080250), N-[(2E)-1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]piridin-2(1H)-iliden]-2,2,2-trifluoroacetamida (conocida por el documento WO2012/029672), 1-[(2-cloro-1,3-tiazol-5-il)metil]-4-oxo-3-fenil-4H-pirido[1,2-a]pirimidin-1-io-2-olato (conocido por el documento WO2009/099929), 1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]-4-oxo-3-fenil-4H-pirido[1,2-a]pirimidin-1-io-2-olato (conocido por el documento WO2009/099929), 4-(3-{2,6-dicloro-4-[(3,3-dicloroprop-2-en-1-il)oxil]fenoxi}propoxi)-2-metoxi-6-(trifluorometil)pirimidina (conocida por el documento CN101337940), N-[2-(terc-butilcarbamoil)-4-cloro-6-metilfenil]-1-(3-cloropiridin-2-il)-3-(fluorometoxi)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocida por el documento WO2008/134969), 3-[benzoil(metil)amino]-N-[2-bromo-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]-6-(trifluorometil)fenil]-2-fluoro-benzamida (conocida por el documento WO 2010018714), [2-(2,4-diclorofenil)-3-oxo-4-oxaespiro[4.5]dec-1-en-1-il]-carbonato de butilo (conocido por el documento CN 102060818), 4-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4H-isoxazol-3-il]-N-(Z)-metoxiimino-metil]-2-metil-benzamida (conocida por el documento WO2007/026965), 3E)-3-[1-[(6-cloro-3-piridil)metil]-2-piridiliden]-1,1,1-trifluoro-propan-2-ona (conocida por el documento WO2013/144213), N-(metilsulfonyl)-6-[2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-il]piridin-2-carboxamida (conocida por el documento WO2012/000896), N-[3-(bencilcarbamoil)-4-clorofenil]-1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carboxamida conocida por el documento WO2010/051926).

#### Fungicidas

Los principios activos especificados en el presente documento con su "nombre común" se conocen, por ejemplo se describen en "Pesticide Manual" o en la internet (por ejemplo: <http://www.alanwood.net/pesticides>).

55 Todos los asociados de mezcla fungicidas mencionados de las clases (1) a (15) pueden formar opcionalmente sales con correspondientes bases o ácidos, siempre que existan grupos funcionales adecuados. Además, para los asociados de mezcla fungicidas mencionados de las clases (1) a (15) están incluidas también formas tautoméricas, siempre que se a posible la tautomería.

- (1) Inhibidores de la biosíntesis de ergosterol, por ejemplo (1.01) aldimorph, (1.02) azaconazol, (1.03) bitertanol, (1.04) bromouconazol, (1.05) ciproconazol, (1.06) diclobutrazol, (1.07) difenoconazol, (1.08) diniconazol, (1.09) diniconazol-M, (1.10) dodemorph, (1.11) acetato de dodemorph, (1.12) epoxiconazol, (1.13) etaconazol, (1.14) fenarimol, (1.15) fenbuconazol, (1.16) fenhexamida, (1.17) fenpropidina, (1.18) fenpropimorph, (1.19) fluquinconazol, (1.20) flurprimidol, (1.21) flusilazol, (1.22) flutriafol, (1.23) furconazol, (1.24) furconazol-cis, (1.25) hexaconazol, (1.26) imazalilo, (1.27) sulfato de imazalilo, (1.28) imibenconazol, (1.29) ipconazol, (1.30) metconazol, (1.31) miclobutanilo, (1.32) naftifin, (1.33) nuarimol, (1.34) oxpoconazol, (1.35) paclobutrazol, (1.36) pefurazoat, (1.37) penconazol, (1.38) piperalina, (1.39) procloroaz, (1.40) propiconazol, (1.41) protioconazol, (1.42) piributicarb, (1.43) pirifenox, (1.44) quinconazol, (1.45) simeconazol, (1.46) espiroxamina, (1.47) tebuconazol, (1.48) terbinafina, (1.49) tetraconazol, (1.50) triadimefona, (1.51) triadimenol, (1.52) tridemorph, (1.53) triflumizol, (1.54) triforina, (1.55) triticonazol, (1.56) uniconazol, (1.57) uniconazol-p, (1.58) viniconazol, (1.59) voriconazol, (1.60) 1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)cicloheptanol, (1.61) 1-(2,2-dimetil-2,3-dihidro-1H-inden-1-il)-1H-imidazol-5-carboxilato de metilo, (1.62) N'-5-(difluorometil)-2-metil-4-[3-(trimetilsilil)propoxi]fenil]-N-etil-N-metilimidoforamida, (1.63) N-etil-N-metil-N'-{2-metil-5-(trifluorometil)-4-[3-(trimetilsilil)propoxi]fenil}imidoforamida, (1.64) O-[1-(4-metoxifenoxi)-3,3-dimetilbutan-2-il]-1H-imidazol-1-carbotioato, (1.65) pirisoxazol, (1.66) 2-[[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.67) 1-[[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol-5-iltiocianato, (1.68) 5-(alilsulfanil)-1-[[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol, (1.69) 2-[1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.70) 2-[[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.71) 2-[[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.72) 1-[[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol-5-iltiocianato, (1.73) 1-[[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol-5-iltiocianato, (1.74) 5-(alilsulfanil)-1-[[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol, (1.75) 5-(alilsulfanil)-1-[[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol, (1.76) 2-[(2S,4S,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.77) 2-[(2R,4S,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.78) 2-[(2R,4R,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.79) 2-[(2S,4R,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.80) 2-[(2S,4S,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.81) 2-[(2R,4S,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.82) 2-[(2R,4R,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.83) 2-[(2S,4R,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.84) 2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol, (1.85) 2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.86) 2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)pentan-2-ol, (1.87) 2-[2-cloro-4-(4-clorofenoxi)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.88) 2-[2-cloro-4-(2,4-diclorofenoxi)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol, (1.89) (2R)-2-(1-clorociclopropil)-4-[(1R)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.90) (2R)-2-(1-clorociclopropil)-4-[(1S)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.91) (2S)-2-(1-clorociclopropil)-4-[(1R)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.92) (2S)-2-(1-clorociclopropil)-4-[(1R)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.93) (1S,2R,5R)-5-(4-clorobencil)-2-(clorometil)-2-metil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ilmetil)ciclopentanol, (1.94) (1R,2S,5S)-5-(4-clorobencil)-2-(clorometil)-2-metil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ilmetil)ciclopentanol, (1.95) 5-(4-clorobencil)-2-(clorometil)-2-metil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ilmetil)ciclopentanol.
- 2) Inhibidores de la cadena respiratoria en el complejo I o II, por ejemplo (2.01) bixafeno, (2.02) boscalida, (2.03) carboxina, (2.04) diflumetorim, (2.05) fenfuram, (2.06) fluopiram, (2.07) flutolanilo, (2.08) fluxapiraxad, (2.09) furametpir, (2.10) furmecicloz, (2.11) isopirazam (mezcla del racemato syn-epímero 1RS,4SR,9RS y del racemato anti-epímero 1RS,4SR,9SR), (2.12) isopirazam (racemato anti-epímero 1RS,4SR,9SR), (2.13) isopirazam (enantiómero anti-epímero 1R,4S,9S), (2.14) isopirazam (enantiómero anti-epímero 1S,4R,9R), (2.15) isopirazam (racemato syn-epímero 1RS,4SR,9RS), (2.16) isopirazam (enantiómero syn-epímero 1R,4S,9R), (2.17) isopirazam (enantiómero syn-epímero 1S,4R,9S), (2.18) mepronilo, (2.19) oxicarboxina, (2.20) penflufeno, (2.21) pentiopirad, (2.22) sedaxano, (2.23) tifulzamida, (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, (2.28) 5,8-difluoro-N-[2-(2-fluoro-4-[4-(trifluorometil)piridin-2-ilo]oxi)fenil]etil]quinazolin-4-amina, (2.29) benzovindiflupir, (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, (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, (2.32) 3-(difluorometil)-1-metil-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.33) 1,3,5-trimetil-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.34) 1-metil-3-(trifluorometil)-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.35) 1-metil-3-(trifluorometil)-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.36) 1-metil-3-(trifluorometil)-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.37) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.38) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.39) 1,3,5-trimetil-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida,



- (2.40) 1,3,5-trimetil-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.41) benodanilo, (2.42) 2-cloro-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)piridin-3-carboxamida, (2.43) isofetamida, (2.44) 1-metil-3-(trifluorometil)-N-[2'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.45) N-(4'-clorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.46) N-(2',4'-diclorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.47) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[4'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.48) N-(2',5'-difluorobifenil-2-il)-1-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.49) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[4'-(prop-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.50) 5-fluoro-1,3-dimetil-N-[4'-(prop-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.51) 2-cloro-N-[4'-(prop-1-in-1-il)bifenil-2-il]nicotinamida, (2.52) 3-(difluorometil)-N-[4'-(3,3-dimetilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.53) N-[4'-(3,3-dimetilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.54) 3-(difluorometil)-N-(4'-etinilbifenil-2-il)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.55) N-(4'-etinilbifenil-2-il)-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.56) 2-cloro-N-(4'-etinilbifenil-2-il)nicotinamida, (2.57) 2-cloro-N-[4'-(3,3-dimetilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]nicotinamida, (2.58) 4-(difluorometil)-2-metil-N-[4'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1,3-tiazol-5-carboxamida, (2.59) 5-fluoro-N-[4'-(3-hidroxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.60) 2-cloro-N-[4'-(3-hidroxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]nicotinamida, (2.61) 3-(difluorometil)-N-[4'-(3-metoxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.62) 5-fluoro-N-[4'-(3-metoxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.63) 2-cloro-N-[4'-(3-metoxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]nicotinamida, (2.64) 1,3-dimetil-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.65) 1,3-dimetil-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.66) 1,3-dimetil-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.67) 3-(difluorometil)-N-metoxi-1-metil-N-[1-(2,4,6-tricloro-fenil)propan-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.68) 3-(difluorometil)-N-(7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.69) 3-(difluorometil)-N-[(3R)-7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.70) 3-(difluorometil)-N-[(3S)-7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida.
- 3) Inhibidores de la cadena respiratoria en el complejo III, por ejemplo (3.01) ametoctradina, (3.02) amisulbrom, (3.03) azoxiestroquina, (3.04) ciazofamida, (3.05) coumetoxiestroquina, (3.06) coumoxiestroquina, (3.07) dimoxiestroquina, (3.08) enoxaestroquina, (3.09) famoxadona, (3.10) fenamidona, (3.11) flufenoxiestroquina, (3.12) fluoxaestroquina, (3.13) kresoxim-metilo, (3.14) metominoestroquina, (3.15) orisaestroquina, (3.16) picoxiestroquina, (3.17) piraclastroquina, (3.18) pirametoestroquina, (3.19) piraioxiestroquina, (3.20) piribencarb, (3.21) triclopircarb, (3.22) trifloxiestroquina, (3.23) (2E)-2-(2-[[6-(3-cloro-2-metilfenoxi)-5-fluoropirimidin-4-il]oxi]fenil)-2-(metoxiimino)-N-metil-acetamida, (3.24) (2E)-2-(metoxiimino)-N-metil-2-(2-[[{(1E)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etiliden}amino]oxi]metil]fenil)acetamida, (3.25) (2E)-2-(metoxiimino)-N-metil-2-(2-[[(E)-{(1E)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etoxi]imino]metil]fenil)etanamida, (3.26) (2E)-2-(2-[[{(1E)-1-(3-[[{(E)-1-fluoro-2-feniletetil]oxi]fenil]etiliden}amino]oxi]metil]fenil)-2-(metoxiimino)-N-metil-acetamida, (3.27) fenaminoestroquina, (3.28) 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, (3.29) (2E)-2-(2-[[{(ciclopropil[(4-metoxifenil)imino]metil]sulfanil)metil]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (3.30) N-(3-etil-3,5,5-trimetilciclohexil)-3-formamido-2-hidroxibenzamida, (3.31) 2-(2-[[{(2,5-dimetilfenoxi)metil]fenil]-2-metoxi-N-metilacetamida, (3.32) 2-(2-[[{(2,5-dimetilfenoxi)metil]fenil]-2-metoxi-N-metilacetamida (3.33) (2E,3Z)-5-[[1-(4-clorofenil)-1H-pirazol-3-il]oxi]-2-(metoxiimino)-N,3-dimetilpent-3-enamida.
- 4) Inhibidores de la mitosis y la división celular, por ejemplo (4.01) benomilo, (4.02) carbendazima, (4.03) clorfenazol, (4.04) dietofencarb, (4.05) etaboxam, (4.06) fluopicolid, (4.07) fuberidazol, (4.08) pencicurona, (4.09) tiabendazol, (4.10) tiofanato-metilo, (4.11) tiofanato, (4.12) zoxamida, (4.13) 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorfenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina, (4.14) 3-cloro-5-(6-cloropiridin-3-il)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorfenil)piridazina.
- 5) Compuestos que tienen la capacidad de atacar a múltiples sitios ("*multisite action*"), por ejemplo (5.01) mezcla de Burdeos, (5.02) captafol, (5.03) captano, (5.04) clorotalonilo, (5.05) hidróxido de cobre, (5.06) nafenato de cobre, (5.07) óxido de cobre, (5.08) oxiclورو de cobre, (5.09) sulfato de cobre(2+), (5.10) diclofluanida, (5.11) ditianona, (5.12) dodina, (5.13) dodina base libre, (5.14) ferbam, (5.15) fluorofolpet, (5.16) folpet, (5.17) guazatina, (5.18) acetato de guazatina, (5.19) iminoctadina, (5.20) besilato de iminoctadinal, (5.21) triacetato de iminoctadina, (5.22) mancozeb, (5.23) mancozeb, (5.24) maneb, (5.25) metiram, (5.26) metiram de cinc, (5.27) oxina de cobre, (5.28) propamidina, (5.29) propineb, (5.30) azufre y preparaciones de azufre incluyendo polisulfuro de calcio, (5.31) tiram, (5.32) tolilfluanida, (5.33) zineb, (5.34) ziram, (5.35) anilazina.
- 6) Compuestos que tienen la capacidad de inducir una reacción de defensa del huésped, por ejemplo (6.01) acibenzolar-S-metilo, (6.02) isotianilo, (6.03) probenazol, (6.04) tiadinilo, (6.05) laminarina.
- 7) Inhibidores de la biosíntesis de aminoácidos y proteínas, por ejemplo (7.01) andoprim, (7.02) blasticidin-S, (7.03) ciprodinilo, (7.04) kasugamicina, (7.05) clorhidrato de kasugamicina hidratado, (7.06) mepanipirim, (7.07) pirimetanilo, (7.08) 3-(5-fluoro-3,3,4,4-tetrametil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina, (7.09) oxitetraciclina, (7.10) estreptomina.
- 8) Inhibidores de la producción de ATP, por ejemplo (8.01) acetato de fentina, (8.02) cloruro de fentina, (8.03) hidróxido de fentina, (8.04) siltiofam.

- 9) Inhibidores de la síntesis de pared celular, por ejemplo (9.01) bentiavalicarb, (9.02) dimetomorph, (9.03) flumorph, (9.04) iprovalicarb, (9.05) mandipropamida, (9.06) polioxina, (9.07) polioxorim, (9.08) validamicina A, (9.09) valifenalata, (9.10) polioxina B, (9.11) (2E)-3-(4-terc-butilfenil)-3-(2-cloropiridin-4-il)-1-(morfolin-4-il)prop-2-en-1-ona, (9.12) (2Z)-3-(4-terc-butilfenil)-3-(2-cloropiridin-4-il)-1-(morfolin-4-il)prop-2-en-1-ona.
- 5 10) Inhibidores de la síntesis de lípidos y membrana, por ejemplo (10.01) bifenilo, (10.02) cloroneb, (10.03) dicloran, (10.04) edifenfos, (10.05) etridiazol, (10.06) yodoocarb, (10.07) iprobenfos, (10.08) isoprotiolan, (10.09) propamocarb, (10.10) clorhidrato de propamocarb, (10.11) protiocarb, (10.12) pirazofos, (10.13) quintozen, (10.14) tecnazeno y (10.15) tolclofos-metilo.
- 10 11) Inhibidores de la biosíntesis de melanina, por ejemplo (11.01) carpropamida, (11.02) diclocimet, (11.03) fenoxanilo, (11.04) ftalida, (11.05) piroquilona, (11.06) triciclazol, y (11.07) {3-metil-1-[(4-metilbenzoil)amino]butan-2-il}carbamato de 2,2,2-trifluoroetilo.
- 15 12) Inhibidores de la síntesis de ácidos nucleicos, por ejemplo (12.01) benalaxilo, (12.02) benalaxil-M (kiralaxilo), (12.03) bupirinato, (12.04) clozilacona, (12.05) dimetirimol, (12.06) etirimol, (12.07) furalaxilo, (12.08) himexazol, (12.09) metalaxilo, (12.10) metalaxil-M (mefenoxam), (12.11) ofurace, (12.12) oxadixilo, (12.13) ácido oxolínico, (12.14) octilina.
- 13) Inhibidores de la transmisión de señales, por ejemplo (13.01) clozolinato, (13.02) fenciclonilo, (13.03) fludioxonilo, (13.04) iprodiona, (13.05) procimidona, (13.06) quinoxifeno, (13.07) vinclozolina, (13.08) proquinazida.
- 20 14) Compuestos que pueden actuar como desacopladores, por ejemplo (14.01) binapacril, (14.02) dinocap, (14.03) ferimzona, (14.04) fluazinam, (14.05) meptildinocap.
- 25 15) Otros compuestos, por ejemplo (15.001) bentiazol, (15.002) betoxazina, (15.003) capsimicina, (15.004) carvona, (15.005) quinometionato, (15.006) piriofenona (clazafenona), (15.007) cufraneb, (15.008) ciflufenamida, (15.009) cimoxanilo, (15.010) ciprosulfamida, (15.011) dazomet, (15.012) debacarb, (15.013) diclorofeno, (15.014) diclomezina, (15.015) difenzoquat, (15.016) difenzoquat metilsulfato, (15.017) difenilamina, (15.018) ecomat, (15.019) fempirazamina, (15.020) flumetover, (15.021) fluoroimida, (15.022) flusulfamida, (15.023) flutianilo, (15.024) fosetil-aluminio, (15.025) fosetil-calcio, (15.026) fosetil-sodio, (15.027) hexaclorobenceno, (15.028) irumamicina, (15.029) metasulfocarb, (15.030) metilisotiocianato, (15.031) metrafenona, (15.032) mildiomicina, (15.033) natamicina, (15.034) dimetilditiocarbamato de níquel, (15.035) nitrotalisopropilo, (15.036) oxamocarb, (15.037) oxifenthiina, (15.038) pentaclorofenol y sales, (15.039) fenotrina, (15.040) ácido fosforoso y sus sales, (15.041) propamocarb-fosetilato, (15.042) propanosin-sodio, (15.043) pirimorph, (15.044) pirrolnitrina, (15.045) tebufloquin, (15.046) tecloftalam, (15.047) tolnifanida, (15.048) triazoxid, (15.049) triclamid, (15.050) zarilamid, (15.051) 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, (15.052) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona, (15.053) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona, (15.054) oxatiapirolina, (15.055) 1H-imidazol-1-carboxilato de 1-(4-metoxifenoxi)-3,3-dimetilbutan-2-ilo, (15.056) 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)piridina, (15.057) 2,3-dibutil-6-clorotieno[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona, (15.058) 2,6-dimetil-1H,5H-[1,4]ditiino[2,3-c:5,6-c']dipirrol-1,3,5,7(2H,6H)-tetrona, (15.059) 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(5R)-5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona, (15.060) 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(5S)-5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona, (15.061) 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, (15.062) 2-butoxi-6-yodo-3-propil-4H-cromen-4-ona, (15.063) 2-cloro-5-[2-cloro-1-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-4-metil-1H-imidazol-5-il]piridina, (15.064) 2-fenilfenol y sales, (15.065) 3-(4,4,5-trifluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina, (15.066) nitrilo de ácido 3,4,5-tricloropiridin-2,6-dicarboxílico, (15.067) 3-cloro-5-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-6-metilpiridazina, (15.068) 4-(4-clorofenil)-5-(2,6-difluorofenil)-3,6-dimetilpiridazina, (15.069) 5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-tiol, (15.070) 5-cloro-N'-fenil-N'-(prop-2-in-1-il)tiopen-2-sulfonohidrazida, (15.071) 5-fluoro-2-[(4-fluorbencil)oxi]pirimidin-4-amina, (15.072) 5-fluoro-2-[(4-metilbencil)oxi]pirimidin-4-amina, (15.073) 5-metil-6-octil[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-amina, (15.074) (2Z)-3-amino-2-ciano-3-fenilacrilato de etilo, (15.075) N'-(4-{3-(4-clorobencil)-1,2,4-tiadiazol-5-il}oxi)-2,5-dimetilfenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (15.076) N-(4-clorobencil)-3-[3-metoxi-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]propanamida, (15.077) N-[(4-clorofenil)(ciano)metil]-3-[3-metoxi-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]propanamida, (15.078) N-[(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2,4-dicloropiridin-2-il)metil]-2,4-dicloro-nicotinamida, (15.079) N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2-fluoro-4-yodonicotinamida, (15.080) N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2-fluoro-4-yodonicotinamida, (15.081) N-[(E)-[(ciclopropil-metoxi)imino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil]-2-fenilacetamida, (15.082) N-[(Z)-[(ciclopropilmetoxi)imino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil]-2-fenilacetamida, (15.083) N'-4-[(3-terc-butil-4-ciano-1,2-tiazol-5-il)oxi]-2-cloro-5-metilfenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (15.084) N-metil-2-(1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-N-(1,2,3,4-tetrahidronaftal-1-il)-1,3-tiazol-4-carboxamida, (15.085) N-metil-2-(1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-N-(1,2,3,4-tetrahidronaftal-1-il)-1,3-tiazol-4-carboxamida, (15.086) N-metil-2-(1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-N-[(1S)-1,2,3,4-tetrahidronaftal-1-il]-1,3-tiazol-4-carboxamida, (15.087) {6-[[[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metil]amino]oxi]metil]piridin-2-il}carbamidato de pentilo, (15.088) ácido fenazin-1-carboxílico,
- 60

(15.089) quinolin-8-ol, (15.090) sulfato de quinolin-8-ol (2:1), (15.091) {6-[[[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilen]amino]oxi]metil]piridin-2-il}carbamidato de terc-butilo, (15.092) (5-bromo-2-metoxi-4-metil-piridin-3-il)(2,3,4-trimetoxi-6-metilfenil)metanona, (15.093) N-[2-(4-[[3-(4-clorofenil)prop-2-in-1-il]oxi]-3-metoxifenil)etil]-N2-(metilsulfonil)valinamida, (15.094) ácido 4-oxo-4-[(2-feniletil)amino]butanoico, (15.095) {6-[[[(Z)-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilen]amino]oxi]metil]piridin-2-il}carbamidato de but-3-in-1-ilo, (15.096) 4-amino-5-fluoropirimidin-2-ol (forma tautomérica: 4-amino-5-fluoropirimidin-2(1H)-ona), (15.097) 3,4,5-trihidroxibenzoato de propilo, (15.098) [3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (15.099) (S)-[3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (15.100) (R)-[3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (15.101) 2-fluoro-6-(trifluorometil)-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)benzamida, (15.102) 2-(6-bencilpiridin-2-il)quinazolina, (15.103) 2-[6-(3-fluoro-4-metoxifenil)-5-metilpiridin-2-il]quinazolina, (15.104) 3-(4,4-difluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina, (15.105) ácido abscísico, (15.106) N'-[5-bromo-6-(2,3-dihidro-1H-inden-2-iloxi)-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.107) N'-[5-bromo-6-[1-(3,5-difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.108) N'-[5-bromo-6-[(1R)-1-(3,5-difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.109) N'-[5-bromo-6-[(1S)-1-(3,5-difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.110) N'-[5-bromo-6-[(cis-4-isopropilciclohexil)oxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.111) N'-[5-bromo-6-[(trans-4-isopropilciclohexil)oxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.112) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.113) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropilbencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.114) N-(2-terc-butilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.115) N-(5-cloro-2-etilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.116) N-(5-cloro-2-isopropilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.117) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-5-fluorbencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.118) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(5-fluoro-2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.119) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropil-5-fluorbencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.120) N-(2-ciclopropil-5-fluorbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.121) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-fluoro-6-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.122) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-5-metilbencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.123) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropil-5-metilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.124) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropil-5-metilbencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.125) N-(2-terc-butil-5-metilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.126) N-[5-cloro-2-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.127) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-N-[5-metil-2-(trifluorometil)bencil]-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.128) N-[2-cloro-6-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.129) N-[3-cloro-2-fluoro-6-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.130) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-4,5-dimetilbencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.131) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.132) N'-(2,5-dimetil-4-fenoxifenil)-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.133) N'-[4-[(4,5-dicloro-1,3-tiazol-2-il)oxi]-2,5-dimetilfenil]-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.134) N-(4-cloro-2,6-difluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15.135) 9-fluoro-2,2-dimetil-5-(quinolin-3-il)-2,3-dihidro-1,4-benzoxazepina, (15.136) 2-[2-fluoro-6-[(8-fluoro-2-metilquinolin-3-il)oxi]fenil]propan-2-ol, (15.137) 2-[2-[(7,8-difluoro-2-metilquinolin-3-il)oxi]-6-fluorofenil]propan-2-ol, (15.138) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-N-(2-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15.139) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-N-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15.140) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-N-(2-cloro-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15.141) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-cloro-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15.142) N-(2-bromo-6-fluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15.143) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-bromofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15.144) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-bromo-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15.145) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-clorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15.146) N-(2-bromofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15.147) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-N-(2-clorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15.148) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15.149) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15.150) N'-(4-{3-[(difluorometil)sulfanil]fenoxi}-2,5-dimetilfenil)-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.151) N'-(2,5-dimetil-4-{3-[(1,1,2,2-tetrafluoroetil)sulfanil]fenoxi}fenil)-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.152) N'-(2,5-dimetil-4-{3-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenoxi}fenil)-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.153) N'-(2,5-dimetil-4-{3-[(2,2,3,3-tetrafluoropropil)sulfanil]fenoxi}fenil)-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.154) N'-(2,5-dimetil-4-{3-[(pentafluoroetil)sulfanil]fenoxi}fenil)-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.155) N'-(4-{3-(difluorometoxi)fenil}sulfanil)-2,5-dimetilfenil)-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.156) N'-(2,5-dimetil-4-{3-(1,1,2,2-tetrafluoroetil)sulfanil]fenil)-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.157) N'-(2,5-dimetil-4-{3-(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil)-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.158) N'-(2,5-dimetil-4-{3-(2,2,3,3-tetrafluoropropoxi)fenil}sulfanil]fenil)-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.159) N'-(2,5-dimetil-4-{3-(pentafluoroetil)sulfanil]fenil)-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.160) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{5-[2-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona, (15.161) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{5-[2-fluoro-6-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona, (15.162) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{5-[2-cloro-6-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona, (15.163) 2-[3-[2-(1-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il]fenilmetansulfonato,

(15.164) 2-{3-[2-(1-[[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil)piperidin-4-il]-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il}-3-clorofenil-metansulfonato, (15.165) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{{(5S)-5-[2-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il}-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]etanona, (15.166) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{{(5R)-5-[2-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il}-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]etanona, (15.167) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{{(5S)-5-[2-fluoro-6-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il}-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]etanona, (15.168) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{{(5R)-5-[2-fluoro-6-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il}-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]etanona, (15.169) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{{(5S)-5-[2-cloro-6-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il}-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]etanona, (15.170) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{{(5R)-5-[2-cloro-6-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il}-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]etanona, (15.171) 2-{{(5S)-3-[2-(1-[[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil)piperidin-4-il]-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il}fenilmetansulfonato, (15.172) 2-{{(5R)-3-[2-(1-[[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil)piperidin-4-il]-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il}fenilmetansulfonato, (15.173) 2-{{(5S)-3-[2-(1-[[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil)piperidin-4-il]-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il}-3-clorofenilmetansulfonato, (15.174) 2-{{(5R)-3-[2-(1-[[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil)piperidin-4-il]-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il}-3-clorofenilmetansulfonato.

Pesticidas biológicos como asociados de mezcla

Los compuestos de la fórmula (I) pueden combinarse con pesticidas biológicos.

Los pesticidas biológicos comprenden en particular bacterias, hongos, levaduras, extractos de plantas y aquellos productos que fueron formados por microorganismos, inclusive proteínas y productos secundarios del metabolismo.

Los pesticidas biológicos comprenden bacterias como bacterias que forman esporas, bacterias que colonizan las raíces y bacterias que actúan como insecticidas, fungicidas o nematocidas biológicos.

Ejemplos de tales bacterias que se usan o pueden usarse como pesticidas biológicos son:

*Bacillus amiloliquefaciens*, cepa FZB42 (DSM 231179), o *Bacillus cereus*, en particular *B. cereus* cepa CNCM I-1562 o *Bacillus firmus*, cepa I-1582 (número de acceso CNCM I-1582) o *Bacillus pumilus*, en particular cepa GB34 (n.º de acceso ATCC 700814) y cepa QST2808 (n.º de acceso NRRL B-30087), o *Bacillus subtilis*, en particular cepa GB03 (n.º de acceso ATCC SD-1397), o *Bacillus subtilis* cepa QST713 (n.º de acceso NRRL B-21661) o *Bacillus subtilis* cepa OST 30002 (n.º de acceso NRRL B-50421) *Bacillus thuringiensis*, en particular *B. thuringiensis* subespecie *israelensis* (serotipo H-14), cepa AM65-52 (n.º de acceso ATCC 1276), o *B. thuringiensis subsp. aizawai*, en particular cepa ABTS-1857 (SD-1372), o *B. thuringiensis subsp. kurstaki* cepa HD-1, o *B. thuringiensis subsp. tenebrionis* cepa NB 176 (SD-5428), *Pasteuria penetrans*, *Pasteuria spp.* (Rotilenchulus reniformis nematode)-PR3 (n.º de acceso ATCC SD-5834), *Streptomyces microflavus* cepa AQ6121 (= QRD 31.013, NRRL B-50550), *Streptomyces galbus* cepa AQ 6047 (número de acceso NRRL 30232).

Ejemplos de hongos y levaduras que se usan o pueden usarse como pesticidas biológicos son:

*Beauveria bassiana*, en particular cepa ATCC 74040, *Coniothyrium minitans*, en particular cepa CON/M/91-8 (n.º de acceso DSM-9660), *Lecanicillium spp.*, en particular cepa HRO LEC 12, *Lecanicillium lecanii*, (conocida anteriormente como *Verticillium lecanii*), en particular cepa KV01, *Metarhizium anisopliae*, en particular cepa F52 (DSM3884/ ATCC 90448), *Metschnikowia fructicola*, en particular cepa NRRL Y-30752, *Paecilomyces fumosoroseus* (nueva: *Isaria fumosorosea*), en particular cepa IFPC 200613, o cepa Apopka 97 (n.º de acceso ATCC 20874), *Paecilomyces lilacinus*, en particular *P. lilacinus* cepa 251 (AGAL 89/030550), *Talaromyces flavus*, en particular cepa V117b, *Trichoderma atroviride*, en particular cepa SC1 (n.º de acceso CBS 122089), *Trichoderma harzianum*, en particular *T. harzianum rifai T39*. (n.º de acceso CNCM I-952).

Ejemplos de virus que se usan o pueden usarse como pesticidas biológicos son:

granulovirus (VG) de *Adoxophyes orana* (oruga de la cáscara de manzana), granulovirus (VG) de *Cydia pomonella* (gusano de la manzana), virus de la polihedrosis nuclear (VPN) de *Helicoverpa armigera* (gusano de la cápsula del algodón), mVPN de *Spodoptera exigua* (gardama de la remolacha azucarera), mVPN de *Spodoptera frugiperda* (gusano soldado), VPN de *Spodoptera littoralis* (gusano africano del algodón).

También se incluyen bacterias y hongos que se adicionan a las plantas o las partes de plantas u órganos de las plantas como 'inoculantes' y fomentan el crecimiento y la salud de las plantas debido a sus características especiales. Se mencionan como ejemplos:

*Agrobacterium spp.*, *Azorhizobium caulinodans*, *Azospirillum spp.*, *Azotobacter spp.*, *Bradyrhizobium spp.*, *Burkholderia spp.*, en particular *Burkholderia cepacia* (conocida anteriormente como *Pseudomonas cepacia*), *Gigaspora spp.*, o *Gigaspora monosporum*, *Glomus spp.*, *Laccaria spp.*, *Lactobacillus buchneri*, *Paraglomus spp.*, *Pisolithus tinctorius*, *Pseudomonas spp.*, *Rhizobium spp.*, en particular *Rhizobium trifolii*, *Rhizopogon spp.*, *Scleroderma spp.*, *Suillus spp.*, *Streptomyces spp.*.

Ejemplos de extractos de plantas y aquellos productos formados por microorganismos, incluyendo proteínas y productos secundarios del metabolismo que se usan o pueden usarse como pesticidas biológicos son:

*Allium sativum*, *Artemisia absinthium*, azadiractina, Biokeeper WP, *Cassia nigricans*, *Celastrus angulatus*,

*Chenopodium anthelminticum*, quitina, Armour-Zen, *Dryopteris filix-mas*, *Equisetum arvense*, Fortune aza, Fungastop, Heads Up (extracto de saponina de *Chenopodium quinoa*), piretro/piretrinas, *Quassia amara*, Quercus, Quillaja, Regalia, "Requiem™ Insecticide", rotenona, riania/rianodina, *Symphytum officinale*, *Tanacetum vulgare*, timol, Triact 70, TriCon, *Tropaeolum majus*, *Urtica dioica*, veratrina, *Viscum album*, extracto de Brassicaceae, en particular colza o mostaza en polvo.

Sustancias protectoras como asociados de mezcla

Los compuestos de fórmula (I) pueden combinarse con sustancias protectoras, tal como por ejemplo benoxacor, cloquintocet (-metilo), ciometrinilo, ciprosulfamida, dicloromida, fenclorazol (-etilo), fenclorim, flurazol, fluxofenim, furilazol, isoxadifeno (-etilo), mfenpir (-dietilo), anhídrido naftálico, oxabetrinilo, 2-metoxi-N-([4-[(metilcarbamoil)amino]fenil]sulfonil)benzamida (CAS 129531-12-0), 4-(dicloroacetil)-1-oxa-4-azaespiro[4.5]decano (CAS 71526-07-3), 2,2,5-trimetil-3-(dicloroacetil)-1,3-oxazolidina (CAS 52836-31-4).

Plantas y partes de plantas

De acuerdo con la invención, pueden tratarse todas las plantas y las partes de las plantas. Se entiende según esto por plantas todas las plantas y poblaciones de plantas, como plantas silvestres tanto deseadas como indeseadas o plantas de cultivo (incluyendo plantas de cultivo de origen natural), por ejemplo cereales (trigo, arroz, triticale, cebada, centeno, avena), maíz, soja, patata, remolacha azucarera, caña de azúcar, tomate, guisantes y otros tipos de hortalizas, algodón, tabaco, colza, así como plantaciones frutales (con las frutas manzana, pera, frutos cítricos y uvas). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que pueden obtenerse por medio de métodos de reproducción y optimización convencionales o mediante métodos biotecnológicos y de ingeniería genética o las combinaciones de estos métodos, incluyendo plantas transgénicas e incluyendo variedades de plantas protegibles o no alcanzadas por las reglamentaciones sobre variedades protegibles. Por partes de plantas debe entenderse todas las partes y órganos de plantas subterráneos y ubicados encima de la superficie, como brote, hoja, flor y raíz, y en este sentido se citan, a modo de ejemplo, hojas, acículas, tallos, troncos, flores, cuerpos fructíferos, frutos y semilla así como raíces, bulbos y rizoma. También pertenece a partes de plantas la cosecha así como material de propagación vegetativo y generativo, por ejemplo, esquejes, bulbos, rizoma, acodos y semillas.

El tratamiento de acuerdo con la invención de las plantas y partes de plantas con los compuestos de fórmula (I) se realiza en forma directa o por la influencia sobre su entorno, hábitat o lugar de almacenamiento según los procedimientos de tratamiento usuales, por ejemplo, mediante inmersión, rociado, vaporizado, atomización, dispersión, aplicación con pincel, inyección y en el material de propagación, especialmente en semillas, además mediante revestimiento de una o más capas.

Como ya se mencionó anteriormente, todas las plantas y sus partes pueden tratarse de acuerdo con la invención. En una forma de realización preferente se tratan especies y variedades de plantas y sus partes de origen silvestre u obtenidas mediante procedimientos biológicos de cultivo selectivo convencionales, como hibridación o fusión de protoplastos. En otra forma de realización preferente se tratan plantas transgénicas y variedades de plantas y sus partes que fueron obtenidas mediante procedimientos de ingeniería genética, en su caso en combinación con procedimientos convencionales (*Genetically Modified Organisms*). Los términos "partes" o bien "partes de plantas" o "partes de las plantas" fueron explicados anteriormente. Con particular preferencia de acuerdo con la invención se tratan plantas de las correspondientes variedades de plantas usuales en el comercio o en aplicación. Por variedades de plantas se entiende las plantas con nuevas características ("rasgos") que se han obtenido por cultivo en la forma convencional, mediante mutagénesis o mediante técnicas recombinantes de ADN. Éstas pueden ser variedades, razas, biotipos y genotipos.

Plantas transgénicas, tratamiento de semilla y resultados de la integración

Las plantas transgénicas o los cultivares de plantas (las que se obtienen por ingeniería genética) que van a tratarse con preferencia de acuerdo con la presente invención incluyen todas las plantas que, a través de la modificación genética, recibieron material genético el cual imparte propiedades ("rasgos") particulares útiles ventajosas a estas plantas. Ejemplos de estas propiedades son un mejor desarrollo de la planta, tolerancia aumentada a temperaturas altas o bajas, tolerancia aumentada a la sequía o al agua o al contenido salobre del suelo, rendimiento aumentado de la floración, cosechas más fáciles, maduración acelerada, rendimientos más altos, mejor calidad y/o un valor nutricional más alto de los productos cosechados, vida más prolongada en el almacenamiento y/o procesamientos de los productos cosechados. Otros ejemplos y especialmente destacados de estas propiedades son una defensa mejorada de las plantas contra las plagas animales y microbianas, como insectos, arácnidos, nematodos, ácaros y caracoles, provocada por ejemplo por las toxinas formadas en las plantas, en particular las que se forman en las plantas por el material genético de *Bacillus thuringiensis* (por ejemplo por los genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb y CryIF así como sus combinaciones), además una defensa mejorada de las plantas contra los hongos fitopatógenos, bacterias y virus provocada por ejemplo por resistencia adquirida sistémica (RAS), sistemina, fitoalexinas, desencadenantes y además genes de resistencia y proteínas y toxinas expresadas de manera correspondiente. Así como una tolerancia aumentada de las plantas frente a ciertos principios activos herbicidas, por ejemplo, imidazolinonas, sulfonilureas, glifosatos o fosfinotricina (por ejemplo, el gen "PAT"). Los genes que imparten las propiedades ("rasgos") deseadas en cuestión además pueden estar

presentes en combinaciones entre sí en las plantas transgénicas. Los ejemplos de plantas transgénicas incluyen las plantas de cultivo importantes, tales como cereales (trigo, arroz, triticale, cebada, centeno, avena), maíz, soja, patata, remolacha azucarera, caña de azúcar, tomates, guisantes y otros tipos de vegetales, algodón, tabaco, colza y además plantas con frutos (con los frutos de manzanas, peras, frutas cítricas y uvas), y se da un énfasis particular al maíz, soja, trigo, arroz, patata, algodón, tabaco y colza. Como propiedades ("rasgos") se destacan en particular la defensa mejorada de las plantas contra los insectos, arácnidos, nematodos y caracoles.

#### Protección de plantas – tipos de tratamiento

El tratamiento de las plantas y las partes de las plantas con los compuestos de fórmula (I) se realiza directamente o por la acción en su entorno, hábitat o espacio de almacenamiento mediante los procedimientos de tratamiento habituales, por ejemplo inmersión, pulverización, atomizado, irrigación, evaporación, espolvoreo, nebulización, voleo, espumado, pintura, dispersión, inyección, riego (empapado), irrigación por goteo y, en el caso del material de propagación, especialmente en el caso de semillas, además mediante tratamiento en seco de la semilla, tratamiento húmedo de la semilla, tratamiento con la suspensión, incrustación, recubrimiento de una o varias capas, etc. Además es posible emplear los compuestos de fórmula (I) mediante el procedimiento de volumen ultra bajo o inyectar la forma de aplicación o el compuesto de fórmula (I) mismo en el suelo.

Un tratamiento directo preferente de las plantas es la aplicación foliar, es decir, los compuestos de fórmula (I) se aplican al follaje, siendo posible ajustar la frecuencia del tratamiento y la cantidad de aplicación de acuerdo con el nivel de infestación con la plaga en cuestión.

En el caso de compuestos de efecto sistémico, los compuestos de fórmula (I) también acceden a las plantas a través del sistema radicular. El tratamiento de las plantas se realiza entonces mediante acción de los compuestos de fórmula (I) sobre el hábitat de la planta. Esto puede realizarse, por ejemplo, por empapado, mezclado en el suelo o el fertilizante líquido, es decir, el sitio de la planta (por ej., sistemas edafológicos o hidropónicos) se embebe con una forma líquida de los compuestos de fórmula (I), o mediante la aplicación al suelo, es decir los compuestos de fórmula (I) se introducen en forma sólida (por ejemplo en forma de un granulado) en el sitio de las plantas. En el caso de cultivos de arroz con cáscara, esto además puede realizarse mediante dosificación del compuesto de fórmula (I) en una forma de aplicación sólida (por ejemplo como granulado) dentro de un arrozal inundado.

#### Tratamiento de semilla

La lucha contra plagas animales mediante el tratamiento de semillas de las plantas se conoce desde hace mucho tiempo y es objeto de constantes mejoras. Pero a pesar de ello resultan una serie de inconvenientes durante el tratamiento de las semillas que no siempre pueden solucionarse de manera satisfactoria. Así debe aspirarse a desarrollar procedimientos para la protección de las semillas y de la planta en proceso de germinación por los que pueda prescindirse o al menos pueda reducirse notoriamente la aplicación adicional de pesticidas durante el almacenamiento, tras la siembra o después de la emergencia de las plantas. Además es deseable optimizar la cantidad del principio activo usado de manera tal que se protejan de la mejor manera posible las semillas y la planta en proceso de germinación frente a la infestación con plagas animales, pero sin que se dañe la planta misma por el principio activo usado. En particular, los procedimientos para el tratamiento de semillas deberían incluir también las propiedades insecticidas o bien nematocidas intrínsecas de plantas transgénicas resistentes a las plagas o bien que presentan tolerancia a ellas, para lograr una protección óptima de las semillas y de la planta que germina con un dispendio mínimo de pesticidas.

La presente invención, por lo tanto, también se refiere en particular a un procedimiento para la protección de semillas y de plantas en etapa de germinación antes de la infestación con plagas, en el que las semillas se tratan con uno de los compuestos de fórmula (I). El procedimiento de acuerdo con la invención para la protección de semillas y de plantas en etapa de germinación antes de la infestación con plagas comprende además un procedimiento en el que se trata la semilla simultáneamente en un proceso o secuencialmente con un compuesto de la fórmula (I) y asociados de mezcla. También comprende además un procedimiento en el que se trata la semilla en momentos diferentes con un compuesto de fórmula (I) y asociados de mezcla. La invención se refiere igualmente al uso de los compuestos de fórmula (I) para el tratamiento de semillas para la protección de las semillas y de la planta que se forma de ellas ante plagas animales.

La invención además se refiere a semillas que fueron tratadas para la protección ante plagas animales con un compuesto de fórmula (I) y asociados de mezcla. La invención además se refiere a semillas que fueron tratadas en momentos diferentes con un compuesto de fórmula (I) y asociados de mezcla. En semillas que fueron tratadas en momentos diferentes con un compuesto de fórmula (I) y asociados de mezcla, las sustancias individuales pueden estar contenidas en distintas capas en las semillas. En ese caso, las capas que contienen un compuesto de fórmula (I) y asociados de mezcla pueden estar separadas eventualmente por una capa intermedia. La invención también se refiere a semillas en las que un compuesto de fórmula (I) y asociados de mezcla como componente de una envoltura o como capa adicional o capas adicionales se aplicaron adicionalmente a una envoltura.

Por lo demás, la invención se refiere a semillas que después del tratamiento con un compuesto de fórmula (I), se somete a un procedimiento de revestimiento con una película para evitar la fricción del polvo en las semillas.

Una de las ventajas que se producen cuando uno de los compuestos de fórmula (I) actúa de manera sistémica es que el tratamiento de las semillas no solo protege a las propias semillas, sino también a las plantas que surjan de éstas después de la emergencia ante plagas animales. De este modo se puede prescindir del tratamiento inmediato del cultivo al momento de la siembra o poco después.

- 5 Otra ventaja debe considerarse en que mediante el tratamiento de las semillas con el compuesto de fórmula (I) es posible fomentar la germinación y la emergencia de las semillas tratadas.

Además debe considerarse ventajoso que los compuestos de fórmula (I) pueden usarse especialmente también en semillas transgénicas.

- 10 Los compuestos de fórmula (I) pueden usarse además en combinación con agentes de la tecnología de señales, por lo que a modo de ejemplo tiene lugar una mejor colonización con simbioses, como por ejemplo, Rhizobios, Mycorrhiza y/o bacterias endofíticas u hongos y/o se produce una fijación optimizada de nitrógeno.

- 15 Los compuestos de fórmula (I) son apropiados para la protección de semillas de cualquier tipo de plantas que se utilizan en la agricultura, en el invernadero, en bosques o en horticultura. Especialmente se trata aquí de semillas de cereales (por ejemplo trigo, cebada, centeno, triticale, mijo y avena), maíz, algodón, soja, arroz, patatas, girasol, café, tabaco, canola, colza, remolacha (p. ej., remolacha azucarera y remolacha forrajera), cacahuete, verduras (por ejemplo tomate, pepino, judías, coles, cebollas y lechuga), árboles frutales, césped y plantas ornamentales. Especial importancia tiene el tratamiento de las semillas de cereales (como trigo, cebada, centeno y avena), maíz, soja, algodón, canola, colza y arroz.

- 20 Tal como se ha mencionado ya anteriormente, el tratamiento de semillas transgénicas con un compuesto de fórmula (I) es de especial importancia. Esto se refiere a semillas de plantas que contienen por regla general al menos un gen heterólogo que permite la expresión de un polipéptido con propiedades en particular insecticidas o bien nematocidas. Los genes heterólogos en semillas transgénicas pueden provenir a este respecto de microorganismos, tal como Bacillus, Rhizobium, Pseudomonas, Serratia, Trichoderma, Clavibacter, Glomus o Gliocladium. La presente invención es adecuada especialmente para el tratamiento de semillas transgénicas que contienen al menos un gen heterólogo que proviene de *Bacillus* sp. De manera especialmente preferente a este respecto se trata de un gen heterólogo que proviene de *Bacillus thuringiensis*.

- 30 En el contexto de la presente invención se aplica el compuesto de fórmula (I) sobre la semilla. Preferentemente se trata la semilla en un estado en el cual sea tan estable que no se produzcan daños durante el tratamiento. En general, el tratamiento de la semilla puede realizarse en cualquier momento entre la cosecha y la siembra. Usualmente se usa la semilla que se separa de la planta y que se ha limpiado de mazorca, cáscara, tallos, vainas, lana o pulpa. Así, por ejemplo, puede usarse la semilla cosechada, limpiada y secada hasta un contenido de humedad de manera que pueda almacenarse. En forma alternativa, también puede usarse la semilla que tras el secado se trató, por ejemplo, con agua y que luego nuevamente se secó, por ejemplo *priming*. En el caso de semillas de arroz es también posible usar semillas que se han hinchado previamente por ejemplo en agua hasta un determinado estadio (estadio *pigeon breast*), lo que conduce a una germinación mejorada y a una emergencia más uniforme.

- 40 En general, en el tratamiento de la semilla debe cuidarse que la cantidad del compuesto de fórmula (I) y/u otros aditivos aplicados a la semilla se elija de modo que no se perturbe la germinación de la semilla o bien que no se dañe la planta que surja de ella. Esto se debe cuidar sobre todo en los principios activos que en determinadas cantidades de aplicación pueden exhibir efectos fitotóxicos.

Los compuestos de fórmula (I) se aplican por regla general en forma de una formulación adecuada sobre la semilla. El especialista conoce las formulaciones adecuadas y los procedimientos para el tratamiento de la semilla.

- 45 Los compuestos de fórmula (I) pueden transformarse en las formulaciones habituales de desinfectantes, como soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, espumas, dispersiones u otros masas de revestimiento para semillas, así como formulaciones de tipo ULV.

Estas formulaciones se preparan de manera conocida, mezclando los compuestos de fórmula (I) con aditivos habituales, como por ejemplo los diluyentes habituales como disolventes o diluyentes, colorantes, agentes humectantes, dispersantes, emulsionantes, antiespumantes, conservantes, espesantes secundarios, adhesivos, giberelinas y también agua.

- 50 Como colorantes que pueden estar contenidos en las formulaciones de desinfectantes que pueden usarse de acuerdo con la invención, se tienen en consideración todos los colorantes habituales para el dicho fin. En este sentido son aplicables tanto los pigmentos poco solubles en agua, como también los colorantes solubles en agua. Como ejemplos se mencionan los colorantes conocidos bajo las denominaciones Rhodamin B, C.I. Pigment Red 112 y C.I. Solvent Red 1.

- 55 Como agentes humectantes que pueden estar contenidos en las formulaciones de desinfectantes que pueden usarse de acuerdo con la invención se tienen en cuenta todas las sustancias habituales para la formulación de

principios activos agroquímicos, que favorecen la humectación. Preferentemente son aplicables los alquilnaftaleno-sulfonatos, tal como diisopropilnaftaleno-sulfonato o diisobutilnaftaleno-sulfonato.

5 Como dispersantes y/o emulsionantes que pueden estar contenidos en las formulaciones de desinfectantes aplicables de acuerdo con la invención se tienen en consideración todos los dispersantes no iónicos, aniónicos y catiónicos habituales para la formulación de principios activos agroquímicos. Preferentemente son aplicables los dispersantes no iónicos o aniónicos o mezclas de dispersantes no iónicos o aniónicos. Como dispersantes no iónicos adecuados pueden mencionarse especialmente los polímeros de bloque de óxido de etilo-óxido de propileno, éteres alquilfenolpoliglicólicos así como éteres trisilfenolpoliglicólicos y sus derivados fosfatados o sulfatados. Son dispersantes aniónicos adecuados especialmente los sulfonatos de lignina, las sales de poli(ácido acrílico) y los productos de condensación de arilsulfonato y formaldehído.

10 Como antiespumantes pueden estar contenidos en las formulaciones de desinfectantes que pueden usarse de acuerdo con la invención todas las sustancias inhibidoras de espuma habituales para la formulación de principios activos agroquímicos. Preferentemente pueden usarse los antiespumantes de silicona y estearato de magnesio.

15 Como conservantes pueden estar presentes en las formulaciones de desinfectantes que pueden usarse de acuerdo con la invención todas las sustancias aplicables en los agentes agroquímicos para tal fin. A modo de ejemplo se mencionan diclorofeno y hemiformal de alcohol bencílico.

20 Como espesantes secundarios que pueden estar contenidos en las formulaciones de desinfectantes que pueden usarse de acuerdo con la invención, se indican todas las sustancias aplicables en agentes agroquímicos para tal fin. Preferentemente entran en consideración los derivados de celulosa, derivados de ácido acrílico, goma xantana, arcillas modificadas y ácido silícico altamente disperso.

Como adhesivos que pueden estar contenidos en las formulaciones de desinfectantes que pueden usarse de acuerdo con la invención, se tienen en cuenta todas las aglutinantes usuales que pueden usarse en desinfectantes. Preferentemente pueden nombrarse polivinilpirrolidona, poli(acetato de vinilo), poli(alcohol vinílico) y tilosa.

25 Como giberelinas que pueden estar contenidos en las formulaciones de desinfectantes que pueden usarse de acuerdo con la invención, se tienen en cuenta preferentemente las giberelinas A1, A3 (= ácido giberelínico), A4 y A7, de manera especialmente preferente se usa el ácido giberelínico. Las giberelinas son conocidas (véase R. Wegler "Chemie der Pflanzenschutz- und Schädlingsbekämpfungsmittel", tomo 2, Springer Verlag, 1970, pág. 401-412).

30 Las formulaciones de desinfectantes que pueden usarse de acuerdo con la invención pueden usarse ya sea en forma directa o tras previa dilución con agua para el tratamiento de las semillas de los más variados modos. Así, los concentrados o las preparaciones que se obtienen de ellos mediante la dilución con agua, pueden usarse para la desinfección de las semillas de cereales, tal como trigo, cebada, centeno, avena y triticale, así como de las semillas de maíz, arroz, colza, guisantes, judías, algodón, girasoles y remolachas o también de semillas de verduras de los tipos más diferentes. Las formulaciones de desinfección o sus preparaciones diluidas que pueden usarse de acuerdo con la invención también pueden usarse para la desinfección de semillas de plantas transgénicas.

35 Para el tratamiento de semillas con las formulaciones de desinfectantes o con las formas de aplicación preparadas a partir de éstas que pueden usarse de acuerdo con la invención se tienen en consideración todos los dispositivos de mezcla usuales que pueden usarse para la desinfección. En particular, para la desinfección se procede colocando la semilla en un mezclador en funcionamiento discontinuo o continuo, añadiendo la cantidad deseada en cada caso de formulaciones de desinfectante o como tal o tras previa dilución con agua y mezclándola hasta la distribución uniforme de la formulación sobre la semilla. Eventualmente le sigue un proceso de secado.

40 La cantidad de aplicación de las formulaciones de desinfectantes que pueden usarse de acuerdo con la invención puede variarse en un intervalo más amplio. La cantidad es acorde al contenido respectivo de los compuestos de fórmula (I) en las formulaciones y a las semillas. Las cantidades de aplicación en el caso de compuesto de fórmula (I) en general oscilan entre 0,001 y 50 g por kilogramo de semillas, preferentemente entre 0,01 y 15 g por kilogramo de semillas.

#### Salud animal

45 En el sector de salud animal, es decir en el sector de la medicina veterinaria, los compuestos de fórmula (I) son eficaces contra parásitos animales, especialmente ectoparásitos o endoparásitos. El término endoparásitos incluye especialmente helmintos y protozoos como coccidios. Los ectoparásitos son típica y preferentemente artrópodos, en particular insectos y ácaros.

En el sector de la medicina veterinaria son adecuados los compuestos de fórmula (I) que presentan una toxicidad favorable para animales de sangre caliente, para combatir parásitos que se encuentran en los lugares de tenencia y cría de animales, en los animales domesticados, de cría, de zoológico, de laboratorio, de ensayo y en mascotas. Son efectivos en todos los estadios de desarrollo o en algunos estadios de los parásitos.

55 A los animales útiles de la agricultura pertenecen por ejemplo mamíferos como ovejas, cabras, caballos, asnos,



camellos, búfalos, conejos, renos, ciervos y en particular ganado bovino y porcino; aves, como pavos, patos, gansos, y especialmente gallinas; peces y crustáceos, por ejemplo en cultivos acuáticos y también insectos, como las abejas.

A los animales domésticos pertenecen por ejemplo mamíferos, como hámsteres, cobayas, ratas, ratones, chinchillas, hurones y especialmente perros, gatos, aves en jaula, reptiles, anfibios y peces de acuario.

- 5 De acuerdo con una forma de realización preferente de esta descripción, los compuestos de fórmula (I) se administran a mamíferos.

De acuerdo con otra forma de realización preferente de esta descripción, los compuestos de fórmula (I) se administran a aves, a saber a aves en jaula y en particular a aves de corral.

- 10 Mediante el uso de los compuestos de fórmula (I) para combatir parásitos animales se desea reducir o bien prevenir las enfermedades, los casos de muerte y las mermas de producción (en la carne, leche, lana, pieles, huevos, miel y similares), de modo que sea posible una tenencia de animales más económica y más sencilla y pueda conseguirse un mejor bienestar de los animales. Sin embargo, el uso terapéutico de los compuestos de fórmula (I) no es objeto de la invención. Con respecto al sector de la salud animal, el término de "lucha" o "combatir" significa que mediante los compuestos de fórmula (I) es posible reducir en forma efectiva la aparición de los respectivos parásitos en un animal que está infestado con tales parásitos en una medida inofensiva. Dicho con mayor exactitud "combatir" significa en el presente contexto que el compuesto de fórmula (I) puede eliminar los parásitos respectivos, impedir su crecimiento o su multiplicación.

A los artrópodos pertenecen:

- 20 del orden Anoplurida, por ejemplo *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phtirus* spp., *Solenopotes* spp.; del orden Mallophagida y los subórdenes *Amblycerina* and *Ischnocerina*, por ejemplo *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Damalina* spp., *Trichodectes* spp., *Felicola* spp.; del orden Diptera 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., *Odagmia* spp., *Wilhelmia* 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., *Melophagus* spp., *Rhinoestrus* spp., *Tipula* spp.; del orden Siphonaptera, por ejemplo *Pulex* spp., *Ctenocephalides* spp., *Tunga* spp., *Xenopsylla* spp., *Ceratophyllus* spp.;
- 30 del orden Heteroptera, por ejemplo *Cimex* spp., *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongylus* spp.; así como insectos molestos e insectos nocivos para la higiene del orden *Blattaria*.

Además pertenecen a los artrópodos:

- 35 De la subclase Akari (Acarina) y del orden Metastigmata, por ejemplo de la familia Argasidae, tal como *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Otobius* spp., de la familia Ixodidae, tal como *Ixodes* spp., *Amblyomma* spp., *Rhipicephalus* (*Boophilus*) spp., *Dermacentor* spp., *Haemophysalis* spp., *Hyalomma* spp., *Rhipicephalus* spp. (el género originario de las chinches de diferentes huéspedes); del orden Mesostigmata, tal como *Dermanyssus* spp., *Ornithonyssus* spp., *Pneumonyssus* spp., *Raillietia* spp., *Pneumonyssus* spp., *Sternostoma* spp., *Varroa* spp., *Acarapis* spp.; del orden Actinidida (Prostigmata), por ejemplo *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp., *Ornithocheyletia* spp., *Myobia* spp., *Psorergates* spp., *Demodex* spp., *Trombicula* spp., *Neotrombiculla* spp., *Listrophorus* spp.; y del orden Acaridida (Astigmata), por ejemplo *Acarus* spp., *Tyrophagus* spp., *Caloglyphus* spp., *Hypodectes* spp., *Pterolichus* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Otodectes* spp., *Sarcoptes* spp., *Notoedres* spp., *Knemidocoptes* spp., *Cytodites* spp., *Laminosioptes* spp.

A los protozoos parasitarios pertenecen:

- 45 Mastigophora (Flagellata), tal como por ejemplo Trypanosomatidae, por ejemplo *Trypanosoma b. brucei*, *T.b. gambiense*, *T.b. rhodesiense*, *T. congolense*, *T. cruzi*, *T. evansi*, *T. equinum*, *T. lewisi*, *T. percae*, *T. simiae*, *T. vivax*, *Leishmania brasiliensis*, *L. donovani*, *L. tropica*, tal como por ejemplo Trichomonadidae, por ejemplo *Giardia lamblia*, *G. canis*;
- Sarcomastigophora (Rhizopoda), tal como Entamoebidae, por ejemplo *Entamoeba histolytica*, *Hartmanellidae*, por ejemplo *Acanthamoeba* sp., *Harmanella* sp.;
- 50 Apicomplexa (Sporozoa), tal como Eimeridae, por ejemplo *Eimeria acervulina*, *E. adenoides*, *E. alabamensis*, *E. anatis*, *E. anserina*, *E. arloingi*, *E. ashata*, *E. auburnensis*, *E. bovis*, *E. brunetti*, *E. canis*, *E. chinchillae*, *E. clupearum*, *E. columbae*, *E. contorta*, *E. crandalis*, *E. deblickei*, *E. dispersa*, *E. ellipsoidales*, *E. falciformis*, *E. faurei*, *E. flavescens*, *E. gallopavonis*, *E. hagani*, *E. intestinalis*, *E. iroquoiana*, *E. irrsidua*, *E. labbeana*, *E. leucarti*, *E. magna*, *E. maxima*, *E. media*, *E. meleagridis*, *E. meleagrimitis*, *E. mitis*, *E. necatrix*, *E. ninakohlyakimovae*, *E. ovis*, *E. parva*, *E. pavonis*, *E. perforans*, *E. phasani*, *E. piriformis*, *E. praecox*, *E. residua*, *E. scabra*, *E. spec.*, *E.*

*stiedai*, *E. suis*, *E. tenella*, *E. truncata*, *E. truttae*, *E. zuernii*, *Globidium* spec., *Isospora belli*, *I. canis*, *I. felis*, *I. ohioensis*, *I. rivolta*, *I. spec.*, *I. suis*, *Cystisosporea* spec., *Cryptosporidium* spec., en particular *C. parvum*; tal como *Toxoplasmodidae*, por ejemplo *Toxoplasma gondii*, *Hammondia heydornii*, *Neospora caninum*, *Besnoitia besnoitii*; tal como *Sarcocystidae*, por ejemplo *Sarcocystis bovicanis*, *S. bovihominis*, *S. ovicanis*, *S. ovifelis*, *S. neurona*, *S. spec.*, *S. sui-hominis*, tal como *Leucozoidae*, por ejemplo *Leucozytozoon simondi*, tal como *Plasmodiidae*, por ejemplo *Plasmodium berghei*, *P. falciparum*, *P. malariae*, *P. ovale*, *P. vivax*, *P. spec.*, tal como *Piroplasma*, por ejemplo *Babesia argentina*, *B. bovis*, *B. canis*, *B. spec.*, *Theileria parva*, *Theileria spec.*, tal como *Adeleina*, por ejemplo *Hepatozoon canis*, *H. spec.*

5 A los endoparásitos patógenos, en el caso de los cuales se trata de helmintos, incluyen platelmintos (p. ej., Monogenea, Cestodes y Trematodes), nematodos, acantocéfalos y Pentastoma. A esto pertenecen:

10 Monogenea: por ejemplo: *Gyrodactylus* spp., *Dactylogyrus* spp., *Polystoma* spp.;

Cestodes: del orden Pseudophyllidea por ejemplo: *Diphyllobothrium* spp., *Spirometra* spp., *Schistocephalus* spp., *Ligula* spp., *Bothridium* spp., *Diplogonoporus* spp.;

15 del orden Cyclophyllida por ejemplo: *Mesocestoides* spp., *Anoplocephala* spp., *Paranoplocephala* spp., *Moniezia* spp., *Thysanosoma* spp., *Thysaniezia* spp., *Avitellina* spp., *Stilesia* spp., *Cittotaenia* spp., *Andrya* spp., *Bertiella* spp., *Taenia* spp., *Echinococcus* spp., *Hydatigera* spp., *Davainea* spp., *Raillietina* spp., *Hymenolepis* spp., *Echinolepis* spp., *Echinocotyle* spp., *Diorchis* spp., *Dipylidium* spp., *Joyeuxiella* spp., *Diplopylidium* spp.;

20 Trematodes: de la clase Digenea por ejemplo: *Diplostomum* spp., *Posthodiplostomum* spp., *Schistosoma* spp., *Trichobilharzia* spp., *Ornithobilharzia* spp., *Austrobilharzia* spp., *Gigantobilharzia* spp., *Leucochloridium* spp., *Brachylaima* spp., *Echinostoma* spp., *Echinoparyphium* spp., *Echinochasmus* spp., *Hypoderaeum* spp., *Fasciola* spp., *Fascioloides* spp., *Fasciolopsis* spp., *Cyclocoelum* spp., *Typhlocoelum* spp., *Paramphistomum* spp., *Calicophoron* spp., *Cotylophoron* spp., *Gigantocotyle* spp., *Fischoederius* spp., *Gastrothylacus* spp., *Notocotylus* spp., *Catantropis* spp., *Plagiorchis* spp., *Prosthogonimus* spp., *Dicrocoelium* spp., *Eurytrema* spp., *Troglootrema* spp., *Paragonimus* spp., *Collyriclum* spp., *Nanophyetus* spp., *Opisthorchis* spp., *Clonorchis* spp., *Metorchis* spp., *Heterophyes* spp., *Metagonimus* spp.;

25 Nematodos: Trichinellida por ejemplo: *Trichuris* spp., *Capillaria* spp., *Paracapillaria* spp., *Eucoleus* spp., *Trichomosoides* spp., *Trichinella* spp.;

del orden Tylenchida por ejemplo: *Micronema* spp., *Strongyloides* spp.;

30 del orden Rhabditida por ejemplo: *Strongylus* spp., *Triodontophorus* spp., *Oesophagodontus* spp., *Trichonema* spp., *Gyalocephalus* spp., *Cylindropharynx* spp., *Poteriostomum* spp., *Cyclococercus* spp., *Cylicostephanus* spp., *Oesophagostomum* spp., *Chabertia* spp., *Stephanurus* spp., *Ancylostoma* spp., *Uncinaria* spp., *Necator* spp., *Bunostomum* spp., *Globocephalus* spp., *Syngamus* spp., *Cyathostoma* spp., *Metastrongylus* spp., *Dictyocaulus* spp., *Muellerius* spp., *Protostrongylus* spp., *Neostrongylus* spp., *Cystocaulus* spp., *Pneumostrongylus* spp., *Spicocaulus* spp., *Elaphostrongylus* spp., *Parelaphostrongylus* spp., *Crenosoma* spp., *Paracrenosoma* spp., *Oslerus* spp., *Angiostrongylus* spp., *Aelurostrongylus* spp., *Filaroides* spp., *Parafilaroides* spp., *Trichostrongylus* spp., *Haemonchus* spp., *Ostertagia* spp., *Teladorsagia* spp., *Marshallagia* spp., *Cooperia* spp., *Nippostrongylus* spp., *Heligmosomoides* spp., *Nematodirus* spp., *Hyostromylus* spp., *Obeliscoides* spp., *Amidostomum* spp., *Ollulanus* spp.;

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

45 Acanthocephala: del orden Oligacanthorhynchida por ejemplo: *Macracanthorhynchus* spp., *Prosthenorchis* spp.; del orden Polymorphida por ejemplo: *Filicollis* spp.; del orden Moniliformida por ejemplo: *Moniliformis* spp.;

del orden Echinorhynchida por ejemplo *Acanthocephalus* spp., *Echinorhynchus* spp., *Leptorhynchoides* spp.;

Pentastoma: del orden Porocephalida por ejemplo *Linguatula* spp..

50 En el sector de la medicina veterinaria y la tenencia de animales, la administración de los compuestos de fórmula (I) se realiza según procedimientos conocidos en general por los especialistas, como por vía enteral, parenteral, dérmica o nasal en forma de preparados adecuados. La administración puede ser profiláctica o terapéutica.

Así, una forma de realización de la presente descripción se refiere al uso de un compuesto de la fórmula (I) como fármaco.

Otro aspecto de la descripción se refiere al uso de un compuesto de fórmula (I) como anti-endoparasitario, en particular como un helminticida o un agente contra protozoos. Los compuestos de fórmula (I) son adecuados para su

uso como anti-endoparasitario, en particular como un helminticida o un agente contra protozoos, a modo de ejemplo en la cría de animales, en la tenencia de animales, en establos y en el sector sanitario.

Otro aspecto de la descripción se refiere a su vez al uso de un compuesto de fórmula (I) como antiectoparasitario, en particular un artropodocida como un insecticida o un acaricida. Otro aspecto se refiere al uso de un compuesto de fórmula (I) como antiectoparasitario, en particular un artropodocida como insecticida o acaricida, por ejemplo en la tenencia de animales, en la cría de animales, en establos o en el sector sanitario.

#### Control de vectores

Los compuestos de fórmula (I) también pueden usarse en el control de vectores. Un vector en el sentido de la presente invención es un artrópodo, en particular un insecto o un arácnido que puede transmitir agentes patógenos como por ejemplo virus, gusanos, organismos unicelulares y bacterias de un reservorio (planta, animal, humano, etc.) a un organismo hospedante. Los agentes patógenos pueden transferirse en forma mecánica (por ejemplo, Trachoma mediante moscas que no son picadoras) a un hospedante o tras inyección (por ejemplo, parásitos de malaria por mosquitos) a un hospedante.

Ejemplos de vectores y de agentes patógenos o las enfermedades transmitidos por estos son:

- 1) Mosquitos
  - Anopheles: malaria, filariasis;
  - Culex: encefalitis japonesa, filariasis, otras enfermedades virales, transmisión de gusanos;
  - Aedes: fiebre amarilla, fiebre de dengue, filariasis, otras enfermedades virales;
  - Simulium: transmisión de gusanos, especialmente Onchocerca volvulus;
- 2) Piojos: infecciones de piel, tifus exantemático (tifus epidémico);
- 3) Pulgas: peste, tifus endémico;
- 4) Moscas: enfermedad del sueño (tripanosomiasis); cólera, otras enfermedades bacterianas;
- 5) Ácaros: Acariosis, tifus exantemático, tifus pustuloso, turalemia, encefalitis de Saint-Louis, meningitis viral (FSME), fiebre de Krim-Kongo, tifus exantemático, borreliosis;
- 6) Garrapatas: borreliosis tales como *Borrelia duttoni*, meningoencefalitis de principios de verano, fiebre "Q" (*Coxiella burnetii*), Babesias (*Babesia canis canis*).

Ejemplos de vectores en el sentido de la presente invención son insectos tal como por ejemplo áfidos, moscas, cigarras o *Trips*, los cuales pueden transmitir a plantas virus de plantas. Otros vectores que pueden transmitir virus de plantas son tetránicos, piojos, escarabajos y nematodos.

Otros ejemplos de vectores en el sentido de la presente invención son insectos y arácnidos tales como mosquitos, especialmente de los géneros Aedes, Anopheles, por ejemplo, A. gambiae, A. arabiensis, A. funestus, A. dirus (malaria) y Culex, piojos, pulgas, moscas, ácaros y garrapatas que pueden transmitir agentes patógenos a animales y/o humanos.

Es también posible un control de vectores cuando los compuestos de fórmula (I) son capaces de superar la resistencia.

Los compuestos de fórmula (I) son adecuados para su uso en la prevención de enfermedades o bien de agentes patógenos que pueden ser transmitidos por vectores. Por consiguiente, otro aspecto de la presente invención es el uso de compuestos de fórmula (I) para el control de vectores, por ejemplo, en la agricultura, en la horticultura, en bosques, en jardines e instalaciones de ocio, así como en la protección de materiales y acopios.

#### Protección de materiales técnicos

Los compuestos de fórmula (I) son adecuados para la protección de materiales técnicos contra la infestación o la destrucción por medio de insectos, por ejemplo, del orden de los Coleoptera, Hymenoptera, Isoptera, Lepidoptera, Psocoptera y Zygentoma.

En el presente contexto se entiende por materiales técnicos materiales inertes, como preferentemente plásticos, adhesivos, pegamentos, papeles y cartones, cuero, madera, productos derivados de la madera y pinturas. La aplicación de la invención para la protección de la madera es especialmente preferente.

En otra forma de realización se usan los compuestos de fórmula (I) junto con al menos otro insecticida y/o al menos un fungicida.

En otra forma de realización, los compuestos de fórmula (I) se encuentran como pesticida listo para usar (*ready-to-use*), es decir, puede aplicarse sin otras modificaciones sobre el material correspondiente. Como insecticidas adicionales o como fungicidas se tienen en consideración los mencionados anteriormente.

- 5 Sorprendentemente se ha encontrado que los compuestos de fórmula (I) pueden usarse para la protección de incrustación de objetos, especialmente de cascos de buques, tamices, redes, construcciones, instalaciones de muelles y dispositivos de señalización que entran en contacto con agua de mar o salobre. Del mismo modo, los compuestos de fórmula (I) pueden usarse solos o en combinaciones con otros principios activos como agente anti-putrefacción.

Lucha contra plagas animales en el sector sanitario

- 10 Los compuestos de fórmula (I) son adecuados para luchar contra plagas animales en el sector sanitario. En particular, la invención puede usarse en la protección de viviendas, sanitaria y de acopios, ante todo para luchar contra insectos, arácnidos y ácaros que existen en espacios cerrados, tal como por ejemplo, viviendas, naves industriales, oficinas, cabinas de vehículos. Para la lucha contra las plagas animales se usan los compuestos de fórmula (I) solos o en combinación con otros principios activos y/o coadyuvantes. Preferentemente se usan éstos en  
15 productos insecticidas domésticos. Los compuestos de fórmula (I) son eficaces contra formas sensibles y resistentes, así como contra todos los estadios de desarrollo.

- A estas plagas pertenecen por ejemplo plagas de la clase de los arácnidos, de los órdenes Scorpiones, Araneae y Opiliones, de las clases Chilopoda y Diplopoda, de la clase de insectos del orden Blattodea, de los órdenes Coleoptera, Dermaptera, Diptera, Heteroptera, Hymenoptera, Isoptera, Lepidoptera, Phthiraptera, Psocoptera, Saltatoria o Orthoptera, Siphonaptera y Zygentoma y de la clase Malacostraca, el orden Isopoda.

- 20 La aplicación se realiza por ejemplo en aerosoles, pulverizadores sin presión, por ejemplo, rociadores por bombeo y rociadores atomizadores, fumigadores desinfectantes, nebulizadores, espumas, geles, productos vaporizadores con placa vaporizadora de celulosa o plástico, vaporizadores líquidos, vaporizadores de gel y de membrana, vaporizadores propulsados a hélice, sistemas vaporizadores sin energía o pasivos, papeles antipolilla, bolsitas antipolilla y geles antipolilla, como granulados o como polvos, en cebos o en dispositivos con cebos.  
25

#### **Explicación de los procedimientos y productos intermedios**

Los siguientes ejemplos de preparación y de uso ilustran la invención, sin limitarla. Los productos se caracterizaron por medio de espectroscopía RMN-<sup>1</sup>H y/o CL/EM (espectrometría de masas acoplada a cromatografía de líquidos).

- 30 La determinación de los valores logP se realiza de acuerdo con la directriz de OECD 117 (directiva de CE 92/69/CEE) mediante HPLC (cromatografía de líquidos de alto rendimiento) de columnas (C18) de fase inversa (RP), con los siguientes procedimientos:

[a] La determinación con la CL-EM en el intervalo ácido se realiza con pH 2,7 con ácido fórmico acuoso al 0,1 % y acetonitrilo (que contiene ácido fórmico al 0,1 %) como eluyentes; gradiente lineal desde el 10 % de acetonitrilo hasta el 95 % de acetonitrilo.

- 35 [b] La determinación con la CL-EM en el intervalo neutro se realiza con pH 7,8 con solución acuosa de hidrogenocarbonato de amonio 0,001 molar y acetonitrilo como eluyentes; gradiente lineal desde el 10 % de acetonitrilo hasta el 95 % de acetonitrilo.

- La calibración se realiza con alcan-2-onas no ramificadas (con 3 a 16 átomos de carbono), cuyos valores de logP se conocen (determinación de los valores de logP por medio de los tiempos de retención mediante interpolación lineal entre dos alcanonas consecutivas).  
40

Los espectros de RMN se determinaron con un Bruker Avance 400, equipado con un cabezal de sonda de flujo (volumen 60 µl). En casos particulares se determinaron los espectros de RMN con un Bruker Avance II 600.

- Los datos de RMN-<sup>1</sup>H de ejemplos seleccionados se mencionan en forma de listas de picos de RMN-<sup>1</sup>H. Se menciona para cada pico de señal primero el valor  $\delta$  en ppm y posteriormente la intensidad de señal entre paréntesis. El valor  $\delta$  - pares de números de intensidad de señal para diferentes picos de señal se indican con la separación uno de otro por punto y coma.  
45

Por lo tanto, la lista de picos de un ejemplo toma 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>).

- La intensidad de señales fuertes es correlativa con la altura de las señales en un ejemplo impreso de un espectro de RMN en cm y muestra las verdaderas relaciones de las intensidades de señal. En señales anchas pueden mostrarse varios picos o el centro de la señal y su intensidad relativa en comparación con la señal más intensa en el espectro.  
50

Para la calibración del desplazamiento químico de espectros de RMN-<sup>1</sup>H se usan tetrametilsilano y/o el desplazamiento químico del disolvente, especialmente en el caso de espectros que se miden en DMSO. Por tanto

puede, sin embargo no debe, aparecer en listas de picos de RMN el pico de tetrametilsilano.

Las listas de los picos de RMN-<sup>1</sup>H son similares a las impresiones de RMN-<sup>1</sup>H clásicas y por lo tanto en general incluyen todos los picos que se indican en una interpretación clásica de RMN.

5 Además, como impresiones de RMN-<sup>1</sup>H clásicas pueden mostrar señales de disolventes, señales de estereoisómeros de los compuestos objetivo que también son objeto de la invención y/o picos de impurezas.

Al indicar señales de compuestos en el intervalo delta de disolventes y/o de agua, en nuestras listas de picos de RMN de <sup>1</sup>H se muestran los picos usuales de disolventes, por ejemplo, los picos de DMSO en DMSO-d<sub>6</sub> y el pico de agua, que por lo general presentan en promedio una elevada intensidad.

10 Los picos de estereoisómeros de los compuestos objetivo y/o los picos de impurezas por lo general presentan en promedio una menor intensidad que los picos de los compuestos objetivo (por ejemplo con una pureza de >90 %).

Tales estereoisómeros y/o impurezas pueden ser típicos del respectivo procedimiento de preparación. Por consiguiente, sus picos pueden ayudar a este respecto a reconocer la reproducción del procedimiento de preparación por medio de "huellas digitales del producto secundario".

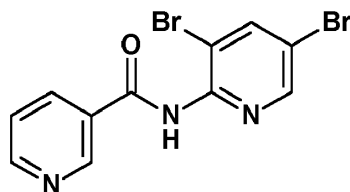
15 Un especialista que calcula los picos de los compuestos objetivo con procedimientos conocidos (MestreC, simulación ACD, pero también con valores esperados evaluados en forma empírica) puede, según necesidad, aislar los picos de los compuestos objetivo, para lo cual en su caso se usan filtros de intensidad adicionales. Este aislamiento sería similar a la correspondiente selección de picos (*peak-picking*) en la interpretación clásica de RMN-<sup>1</sup>H.

20 Más detalles de las listas de picos de RMN-<sup>1</sup>H pueden encontrarse en la base de datos Research Disclosure Database Number 564025.

### Síntesis de benzotiazoles de fórmula (I) según el procedimiento A

#### 6-Bromo-2-(piridin-3-il)-1,3-benzotiazol (I-a-1)

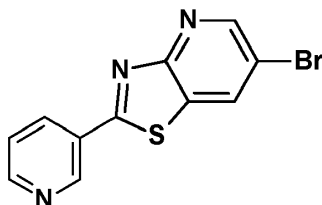
#### Etapa 1: N-(3,5-dibromopiridin-2-il)nicotinamida (A-III-1)



25 Se disuelven 25,0 g (99,2 mmol) de 3,5-dibromopiridin-2-amina en 200 ml de piridina, se enfriaron en un baño de hielo y se mezclaron en porciones con 19,0 g (106,7 mmol) de cloruro de 3-(clorocarbonil)piridinio. La mezcla de reacción se calentó hasta temperatura ambiente, se hizo rotar en un rotavapor en un baño de agua tibio durante 20 minutos y a continuación se concentró a vacío. El residuo obtenido se mezcló con agua y solución acuosa de amoníaco y se separó por succión el sólido precipitado. Éste se recrystalizó en fluorobenceno/metil-THF/etanol,

30 llevándose a ebullición brevemente con carbón activo y filtrándose en caliente. El sólido producido se lavó con solución acuosa de amoníaco, agua y éster de petróleo y se secó. Se obtuvieron así 11,4 g (100 % de pureza, 29,9 % d. t.) del compuesto del título (A-III-1).

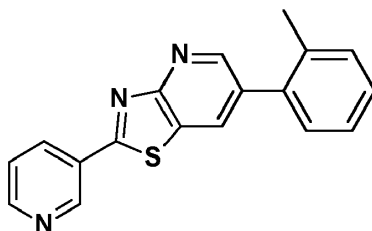
35 **RMN-1H (400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):** δ = 11,050 (9,9); 9,136 (8,3); 9,134 (9,2); 9,130 (8,9); 9,128 (8,6); 8,809 (6,9); 8,805 (7,4); 8,797 (7,3); 8,793 (7,2); 8,674 (13,9); 8,669 (15,7); 8,593 (16,0); 8,588 (14,1); 8,333 (3,9); 8,327 (5,3); 8,323 (3,9); 8,313 (4,3); 8,307 (5,7); 8,303 (4,0); 7,610 (4,7); 7,609 (4,9); 7,598 (4,6); 7,597 (4,8); 7,591 (4,6); 7,589 (4,7); 7,578 (4,4); 7,577 (4,5); 3,327 (53,4); 2,676 (0,3); 2,672 (0,5); 2,667 (0,3); 2,525 (1,4); 2,512 (26,9); 2,507 (54,1); 2,503 (71,3); 2,498 (51,3); 2,494 (24,4); 2,334 (0,3); 2,330 (0,5); 2,325 (0,3); 0,146 (0,5); 0,008 (4,4); 0,000 (110,7); -0,009 (3,9); -0,150 (0,5)

**Etapa 2&3: 6-bromo-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-b]piridin (I-a-1)**

Se disolvieron 14,7 g (41,2 mmol) de N-(3,5-dibromopiridin-2-il)nicotinamida (A-III-1) y 10,0 g (61,8 mmol) de 2,4-bis(4-metoxifenil)-1,3,2,4-ditiadifosfetan-2,4-disulfuro (reactivo de Lawesson) en a ser posible poco anisol y se agitaron durante 2 horas a 120 °C. A continuación se concentró la mezcla de reacción y se enfrió. El residuo se suspendió en acetato de etilo y solución acuosa de carbonato de potasio. La fase acuosa se extrajo aún varias veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se secaron con sulfato de magnesio, se filtraron y se concentraron.

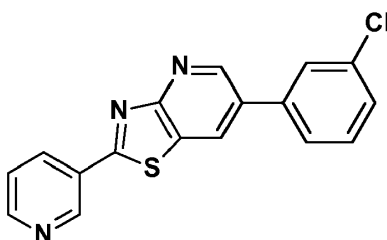
El residuo se suspendió directamente en 400 ml de DMF, se mezcló con 24,0 g (173,7 mmol) de carbonato de potasio y se agitó durante 2 horas a 120 °C. A continuación se concentró la mezcla de reacción y se mezcló con agua y éter de petróleo. El sólido precipitado se separó por filtración, se lavó con solución acuosa de amoníaco y se secó. Se obtuvieron así 9,6 g (100 % de pureza, 79,8 % d. t.) del compuesto del título (I-a-1).

**RMN-1H (400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):**  $\delta$  = 9,339 (8,2); 9,337 (8,7); 9,333 (8,6); 9,332 (8,2); 9,046 (15,3); 9,040 (16,0); 8,842 (15,8); 8,836 (15,1); 8,830 (7,6); 8,827 (7,8); 8,818 (7,7); 8,814 (7,5); 8,548 (4,4); 8,544 (5,4); 8,543 (5,3); 8,538 (4,3); 8,528 (4,7); 8,524 (5,4); 8,523 (5,8); 8,518 (4,4); 8,318 (0,4); 7,679 (5,3); 7,677 (5,4); 7,667 (5,2); 7,665 (5,3); 7,659 (5,2); 7,657 (5,1); 7,647 (5,0); 7,645 (5,0); 3,757 (1,1); 3,329 (112,8); 2,678 (0,5); 2,674 (0,7); 2,669 (0,5); 2,527 (1,9); 2,514 (39,9); 2,509 (80,5); 2,505 (105,7); 2,500 (75,9); 2,496 (35,9); 2,336 (0,5); 2,331 (0,7); 2,327 (0,5); 0,146 (0,7); 0,008 (5,9); 0,000 (157,7); -0,009 (5,5); -0,150 (0,7)

**Síntesis de compuestos de fórmula (I) según el procedimiento B y I****6-(2-Metilfenil)-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-b]piridina (2)**

Bajo argón se pesaron 150,0 mg (0,51 mmol) de 6-bromo-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-b]piridina (I-a-1), 76,8 mg (0,56 mmol) de ácido (2-metilfenil)bórico, 17,8 mg (0,01 mmol) de tetrakis(trifenilfosfina)paladio(0) y 108,8 mg (1,03 mmol) de carbonato de sodio juntos en un recipiente de reacción de microondas y se mezclaron con 3,8 ml de una mezcla 4:1 de dioxano desgasificado y agua. El recipiente se llenó de nuevo con argón, se cerró y se calentó durante 30 minutos a 130 °C en un microondas Biotage Initiator. La mezcla de reacción enfriada se diluyó con agua y se extrajo varias veces con diclorometano. Las fases orgánicas combinadas se filtraron a través de un cartucho de gel de sílice, se lavaron posteriormente con diclorometano y se concentró el filtrado a vacío. El residuo se mezcló mediante agitación con acetonitrilo, se filtró y se secó. Se obtuvieron 53,0 mg (97,5 % de pureza, 33,2 % d. t.) del compuesto del título (2).

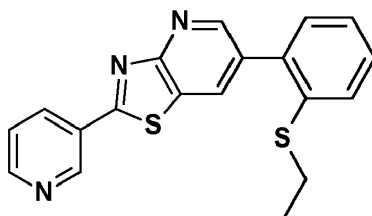
**RMN-1H (400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):**  $\delta$  = 9,366 (2,3); 9,361 (2,3); 8,833 (1,7); 8,829 (1,9); 8,821 (1,8); 8,817 (1,9); 8,753 (2,7); 8,748 (4,7); 8,735 (4,4); 8,730 (2,6); 8,573 (1,0); 8,569 (1,5); 8,564 (1,0); 8,553 (1,1); 8,549 (1,5); 8,544 (1,0); 7,693 (1,4); 7,681 (1,4); 7,673 (1,3); 7,661 (1,3); 7,404 (0,5); 7,393 (2,4); 7,390 (2,7); 7,383 (3,6); 7,376 (3,2); 7,369 (3,3); 7,362 (4,8); 7,355 (1,5); 7,349 (1,1); 7,340 (0,4); 3,329 (15,8); 2,526 (0,8); 2,508 (33,3); 2,504 (44,1); 2,500 (33,0); 2,383 (0,4); 2,331 (0,4); 2,315 (16,0); 0,008 (1,8); 0,000 (50,9); -0,009 (2,0)

**6-(3-Clorofenil)-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-b]piridina (7)**

Bajo argón se pesaron 150 mg (0,51 mmol) de 6-bromo-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-b]piridina (I-a-1), 88,3 mg (0,57 mmol) de ácido (3-clorofenil)bórico, 17,8 mg (0,01 mmol) de tetrakis(trifenilfosfina)paladio(0) y 108,8 mg (1,03 mmol) de carbonato de sodio juntos en un recipiente de reacción de microondas y se mezclaron con 3,8 ml de una mezcla 4:1 de dioxano desgasificado y agua. El recipiente se llenó de nuevo con argón, se cerró y se calentó durante 30 minutos a 130 °C en un microondas Biotage Initiator. La mezcla de reacción enfriada se diluyó con agua y se extrajo varias veces con diclorometano. Las fases orgánicas combinadas se filtraron a través de un cartucho de gel de sílice, se lavaron posteriormente con diclorometano y se concentró el filtrado a vacío. El residuo se mezcló mediante agitación con acetonitrilo, se filtró y se secó. La purificación se realizó de manera cromatográfica por MPLC (eluyente agua/acetonitrilo). Se obtuvieron 14,0 mg (100,0% de pureza, 8,4 % d. t.) del compuesto del título (7).

**RMN-1H(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):** δ = 9,374 (8,4); 9,368 (8,3); 9,117 (11,3); 9,111 (15,3); 9,084 (16,0); 9,078 (11,2); 8,834 (6,6); 8,830 (6,7); 8,822 (6,8); 8,818 (6,5); 8,582 (3,8); 8,577 (5,3); 8,572 (3,6); 8,562 (4,1); 8,557 (5,5); 8,552 (3,5); 8,317 (1,9); 7,969 (6,9); 7,964 (12,0); 7,960 (6,7); 7,857 (5,8); 7,838 (6,5); 7,811 (0,4); 7,693 (5,3); 7,681 (5,2); 7,673 (5,1); 7,661 (4,9); 7,611 (4,5); 7,591 (10,7); 7,572 (7,8); 7,547 (7,4); 7,530 (2,8); 7,527 (3,2); 7,289 (0,4); 6,937 (0,5); 6,925 (0,4); 6,914 (0,4); 5,757 (0,7); 3,744 (3,2); 3,327 (467,3); 2,676 (4,1); 2,671 (5,6); 2,667 (4,1); 2,602 (0,5); 2,524 (15,1); 2,507 (606,6); 2,502 (788,2); 2,498 (575,0); 2,333 (3,8); 2,329 (5,2); 2,325 (3,7); 2,170 (0,5); 1,355 (0,5); 1,277 (0,4); 1,259 (0,5); 1,232 (5,8); 1,154 (0,4); 1,136 (0,6); 1,118 (0,4); 0,853 (0,7); 0,836 (0,4); 0,146 (2,7); 0,082 (0,4); 0,073 (6,2); 0,008 (20,0); 0,000 (579,1); -0,009 (21,1); -0,150 (2,8)

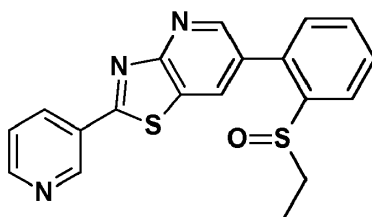
#### 6-[2-(Etilsulfanil)fenil]-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-b]piridina (14)



Bajo argón se pesaron 200,0 mg (0,68 mmol) de 6-bromo-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-b]piridina (I-a-1), 137,1 mg (0,75 mmol) de ácido [4-(etilsulfanil)fenil]bórico, 23,7 mg (0,02 mmol) de tetrakis(trifenilfosfina)-paladio(0) y 145,1 mg (1,4 mmol) de carbonato de sodio juntos en un recipiente de reacción y se mezclaron con 2 ml de una mezcla 1:1 de dioxano desgasificado y agua. El recipiente se llenó de nuevo con argón, se cerró y se calentó durante 30 minutos a 130 °C en un microondas Biotage Initiator. La mezcla de reacción enfriada se diluyó con agua y se extrajo varias veces con diclorometano. Las fases orgánicas combinadas se filtraron a través de un cartucho de gel de sílice, se lavaron posteriormente con diclorometano y se concentró el filtrado a vacío. La purificación se realizó de manera cromatográfica por MPLC (eluyente ciclohexano/acetato de etilo). Se obtuvieron 240,0 mg (81,3 % de pureza, 81,6 % d. t.) del compuesto del título (14).

**RMN-1H (400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):** δ = 9,364 (3,7); 9,359 (3,7); 8,834 (2,8); 8,831 (3,0); 8,823 (3,0); 8,819 (2,9); 8,742 (4,8); 8,736 (6,6); 8,713 (6,5); 8,707 (4,7); 8,572 (1,6); 8,568 (2,3); 8,563 (1,6); 8,553 (1,8); 8,548 (2,4); 8,543 (1,6); 8,317 (0,4); 8,070 (6,5); 7,695 (2,2); 7,683 (2,2); 7,675 (2,1); 7,663 (2,0); 7,540 (2,1); 7,522 (3,9); 7,520 (3,9); 7,493 (1,8); 7,488 (1,9); 7,475 (2,3); 7,471 (2,7); 7,455 (1,1); 7,451 (1,4); 7,414 (1,8); 7,410 (2,1); 7,395 (4,0); 7,391 (3,4); 7,365 (3,2); 7,362 (3,2); 7,345 (4,2); 7,328 (2,3); 7,325 (2,4); 7,315 (0,8); 7,311 (0,7); 7,297 (0,9); 7,294 (0,9); 7,278 (0,4); 7,274 (0,4); 7,177 (0,6); 7,174 (0,7); 7,159 (1,0); 7,156 (1,0); 7,141 (0,4); 7,138 (0,4); 4,038 (0,5); 4,020 (0,6); 3,568 (0,4); 3,328 (165,3); 2,936 (2,2); 2,918 (7,2); 2,904 (3,7); 2,900 (7,5); 2,886 (3,1); 2,882 (2,7); 2,868 (0,9); 2,676 (1,1); 2,671 (1,5); 2,667 (1,1); 2,524 (4,1); 2,507 (166,9); 2,502 (217,8); 2,498 (164,7); 2,334 (1,1); 2,329 (1,5); 2,325 (1,1); 1,989 (2,2); 1,242 (0,4); 1,234 (0,3); 1,212 (2,8); 1,194 (6,2); 1,186 (7,9); 1,175 (4,5); 1,167 (16,0); 1,157 (1,3); 1,149 (7,4); 0,000 (0,5)

#### 6-[2-(Etilsulfonil)fenil]-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-b]piridina (15)

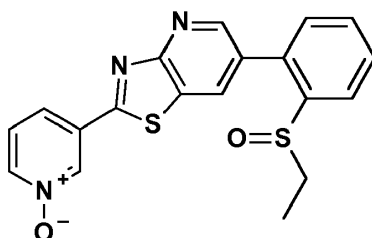


Se dispusieron 100,0 mg (0,28 mmol) de 6-[2-(etilsulfanil)fenil]-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-b]piridina (14) en 10 ml de diclorometano y se mezclaron con 118,8 mg (0,68 mmol) de ácido m-cloroperbenzoico. La mezcla de reacción se agitó durante la noche a temperatura ambiente. A continuación se mezcló la mezcla de reacción con una gota de hidrogenosulfito de sodio acuoso, se lavó con solución acuosa de carbonato de sodio, se secó y se concentró. La purificación se realizó de manera cromatográfica por MPLC (eluyente agua/acetonitrilo). Se obtuvieron 26,0 mg (100,0 % de pureza, 24,9 % d. t.) del compuesto del título (15).

**RMN-1H (400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):** δ = 9,374 (4,2); 9,370 (4,3); 8,866 (6,3); 8,860 (7,5); 8,843 (3,2); 8,839 (3,5); 8,831

(3,4); 8,827 (3,5); 8,805 (7,3); 8,800 (6,2); 8,585 (1,8); 8,580 (2,5); 8,575 (1,9); 8,565 (2,0); 8,559 (2,7); 8,555 (1,9); 8,318 (0,3); 8,006 (2,9); 8,003 (3,1); 7,987 (3,4); 7,984 (3,5); 7,799 (1,4); 7,795 (1,5); 7,780 (3,2); 7,777 (3,2); 7,761 (2,2); 7,757 (2,2); 7,740 (2,0); 7,736 (2,1); 7,721 (3,3); 7,718 (3,4); 7,701 (3,5); 7,699 (3,7); 7,688 (2,4); 7,681 (2,3); 7,669 (2,2); 7,667 (2,2); 7,571 (3,6); 7,569 (3,6); 7,553 (3,0); 7,550 (2,9); 5,758 (1,5); 3,332 (197,0); 2,783 (0,5); 2,764 (1,8); 2,746 (2,1); 2,731 (2,4); 2,712 (2,2); 2,694 (0,7); 2,677 (0,8); 2,672 (1,0); 2,668 (0,8); 2,542 (0,6); 2,525 (2,5); 2,508 (116,7); 2,503 (153,0); 2,499 (113,2); 2,444 (0,7); 2,426 (2,1); 2,408 (2,4); 2,392 (2,1); 2,374 (1,8); 2,355 (0,6); 2,334 (0,7); 2,330 (1,0); 2,325 (0,8); 0,905 (7,4); 0,887 (16,0); 0,869 (7,1); 0,000 (6,3)

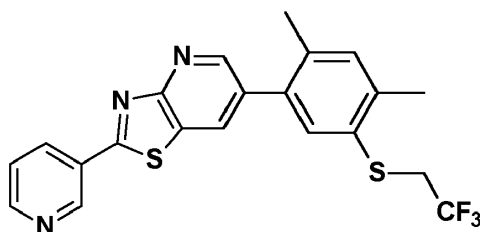
**6-[2-(Etilsulfenil)fenil]-2-(1-oxidopiridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-b]piridina (16)**



10 En la preparación del compuesto (15) se aisló el compuesto (16) como producto secundario. Se obtuvieron 16,7 mg (92,8 % de pureza, 14,2 % d. t.) del compuesto del título (16).

**RMN-1H (400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):**  $\delta$  = 9,371 (4,2); 9,365 (4,1); 8,840 (3,2); 8,836 (3,3); 8,828 (3,3); 8,824 (3,3); 8,764 (5,8); 8,759 (7,2); 8,719 (7,0); 8,713 (5,7); 8,580 (1,8); 8,575 (2,5); 8,571 (1,9); 8,561 (1,9); 8,555 (2,6); 8,551 (1,8); 8,318 (1,8); 8,132 (3,1); 8,115 (3,4); 8,112 (3,4); 7,889 (1,6); 7,873 (3,3); 7,870 (3,3); 7,854 (2,3); 7,851 (2,2); 7,815 (2,1); 7,812 (2,5); 7,795 (3,0); 7,792 (3,1); 7,776 (1,3); 7,773 (1,3); 7,699 (2,5); 7,686 (2,5); 7,679 (2,5); 7,666 (2,4); 7,627 (0,5); 7,601 (3,6); 7,598 (3,7); 7,583 (3,2); 7,580 (3,1); 5,757 (1,7); 4,040 (0,5); 4,022 (0,5); 3,376 (0,5); 3,327 (653,5); 3,012 (2,1); 2,993 (7,0); 2,975 (7,2); 2,957 (2,2); 2,675 (4,7); 2,671 (6,3); 2,667 (4,8); 2,623 (0,3); 2,524 (17,2); 2,510 (380,2); 2,506 (748,3); 2,502 (973,4); 2,497 (719,5); 2,372 (0,3); 2,333 (4,7); 2,328 (6,4); 2,324 (4,8); 2,299 (0,4); 2,206 (0,3); 1,355 (0,3); 1,234 (1,4); 1,165 (1,7); 1,026 (7,4); 1,008 (16,0); 0,989 (7,2); 0,146 (17,1); 0,096 (0,3); 0,086 (0,7); 0,070 (0,7); 0,058 (1,2); 0,047 (1,5); 0,007 (153,7); 0,000 (3211,2); -0,009 (157,6); -0,068 (0,9); -0,075 (0,9); -0,095 (0,6); -0,121 (0,4); -0,150 (16,9)

**6-{2,4-Dimetil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-b]piridina (19)**

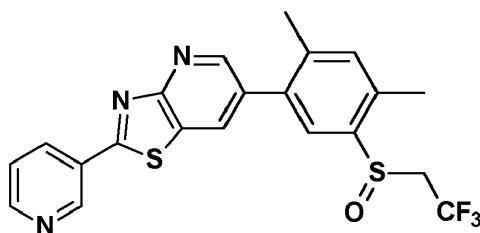


25 Se dispusieron bajo argón 200,0 mg (0,68 mmol) de 6-bromo-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-b]piridina (I-a-1), 198,9 mg (0,75 mmol) de ácido {2,4-dimetil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}bórico y 23,7 mg (0,02 mmol) de tetrakis(trifenilfosfina)-paladio(0) y a continuación se mezclaron con 9,4 ml de acetonitrilo desgasificado y 1,4 ml de solución de carbonato de sodio dos molar. La mezcla de reacción se agitó bajo argón durante la noche a 80 °C. A continuación se concentró la mezcla de reacción enfriada, se mezcló con diclorometano y se lavó con poco agua. La fase orgánica se secó, se filtró y se concentró. La purificación se realizó de manera cromatográfica por MPLC (eluyente agua/acetonitrilo). Se obtuvieron 92,0 mg (97,8 % de pureza, 30,5 % d. t.) del compuesto del título (19).

**RMN-1H (400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):**  $\delta$  = 9,370 (2,7); 9,366 (2,7); 9,365 (2,7); 8,834 (2,3); 8,830 (2,5); 8,822 (2,4); 8,818 (2,5); 8,759 (2,5); 8,753 (8,0); 8,749 (7,8); 8,744 (2,3); 8,578 (1,3); 8,574 (1,7); 8,568 (1,3); 8,558 (1,4); 8,553 (1,8); 8,548 (1,3); 8,318 (0,3); 7,694 (1,6); 7,693 (1,6); 7,682 (1,6); 7,681 (1,6); 7,674 (1,6); 7,673 (1,6); 7,662 (1,5); 7,661 (1,5); 7,536 (5,9); 7,297 (4,6); 4,035 (1,2); 4,009 (3,8); 3,982 (4,0); 3,956 (1,4); 3,328 (100,9); 2,676 (0,7); 2,672 (0,9); 2,667 (0,7); 2,525 (2,7); 2,520 (3,9); 2,512 (49,4); 2,507 (100,6); 2,503 (133,6); 2,498 (97,4); 2,494 (47,0); 2,418 (14,4); 2,334 (0,6); 2,329 (0,9); 2,325 (0,6); 2,275 (16,0); 1,233 (0,4); 0,146 (0,8); 0,019 (0,4); 0,008 (6,1); 0,000 (176,8); -0,009 (6,0); -0,150 (0,8)

**6-{2,4-Dimetil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfenil]fenil}-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-b]piridina (20)**

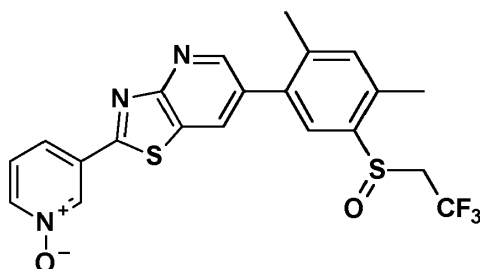




Se dispusieron 60,0 mg (0,14 mmol) de 6-{2,4-dimetil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-b]piridina (19) en 10 ml de diclorometano y se mezclaron con 34,3 mg (0,15 mmol) de ácido m-cloroperbenzoico. La mezcla de reacción se agitó durante la noche a temperatura ambiente. A continuación se mezcló la mezcla de reacción con una gota de hidrogenosulfito de sodio acuoso, se lavó con solución acuosa de carbonato de sodio, se secó y se concentró. La purificación se realizó de manera cromatográfica por MPLC (eluyente agua/acetonitrilo). Se obtuvieron 28 mg (90,0 % de pureza, 40,5 % d. t.) del compuesto del título (20).

**RMN-1H (400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):**  $\delta$  = 9,379 (3,2); 9,374 (3,0); 8,830 (7,8); 8,825 (9,1); 8,586 (1,4); 8,581 (1,9); 8,577 (1,3); 8,566 (1,5); 8,561 (2,0); 8,557 (1,3); 8,317 (0,5); 8,145 (0,6); 7,820 (6,5); 7,697 (1,8); 7,685 (1,8); 7,676 (1,8); 7,664 (1,7); 7,400 (4,8); 5,758 (2,3); 4,197 (1,1); 4,170 (3,3); 4,142 (3,5); 4,115 (1,2); 3,366 (0,8); 3,329 (136,7); 2,891 (0,7); 2,731 (0,6); 2,695 (0,4); 2,676 (1,3); 2,671 (1,7); 2,667 (1,3); 2,539 (1,9); 2,507 (193,1); 2,502 (244,6); 2,498 (184,8); 2,431 (15,1); 2,398 (0,8); 2,378 (16,0); 2,334 (1,3); 2,329 (1,7); 2,325 (1,3); 1,234 (1,0); 1,165 (1,0); 1,150 (0,6); 0,000 (6,2)

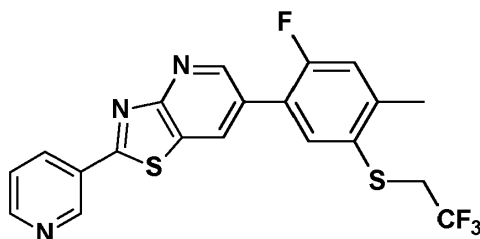
#### 6-{2,4-Dimetil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-b]piridina (21)



En la preparación del compuesto (20) se aisló el compuesto (21) como producto secundario. Se obtuvieron 21 mg (90,0 % de pureza, 29,3 % d. t.) del compuesto del título (21).

**RMN-1H (400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):**  $\delta$  = 8,927 (4,0); 8,861 (2,0); 8,854 (9,9); 8,848 (2,3); 8,841 (0,8); 8,830 (0,4); 8,814 (0,3); 8,690 (0,3); 8,466 (2,0); 8,448 (2,1); 8,317 (1,3); 8,148 (0,5); 8,104 (2,1); 8,084 (2,3); 7,846 (0,5); 7,818 (7,0); 7,680 (2,2); 7,663 (2,3); 7,660 (2,3); 7,643 (1,9); 7,555 (0,4); 7,401 (4,8); 7,383 (0,3); 5,757 (2,2); 4,194 (1,1); 4,167 (3,4); 4,140 (3,6); 4,113 (1,2); 4,037 (0,4); 4,020 (0,4); 3,428 (0,3); 3,416 (0,4); 3,402 (0,5); 3,368 (1,5); 3,330 (615,1); 3,294 (2,0); 2,891 (1,5); 2,731 (1,3); 2,695 (1,2); 2,676 (2,8); 2,671 (3,9); 2,667 (3,0); 2,545 (2,0); 2,540 (2,2); 2,524 (10,1); 2,507 (425,8); 2,502 (566,6); 2,498 (425,9); 2,430 (14,9); 2,392 (2,1); 2,372 (16,0); 2,333 (2,6); 2,329 (3,6); 2,324 (2,8); 1,234 (2,2); 1,165 (1,4); 1,149 (0,8); 0,853 (0,4); 0,008 (0,5); 0,000 (15,0); -0,008 (0,7)

#### 6-{2-Fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-b]piridina (22)

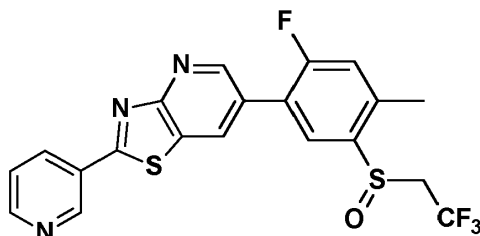


Se pesaron 150,0 mg (0,51 mmol) de 6-bromo-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-b]piridina (I-a-1), 151,4 mg (0,56 mmol) de ácido {2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}bórico, 17,8 mg (0,01 mmol) de tetrakis(trifenilfosfina)paladio(0) y 108,8 mg (1,0 mmol) de carbonato de sodio bajo argón en un recipiente de reacción y se mezcló con 4,8 ml de una mezcla 5:1 de dioxano desgasificado y agua. El recipiente se llenó de nuevo con argón, se cerró y se calentó durante 30 minutos a 130 °C en un microondas Biotage Initiator. La mezcla de reacción enfriada se diluyó con agua y se extrajo varias veces con diclorometano. Las fases orgánicas combinadas se filtraron a través de un cartucho de gel de sílice, se lavaron con diclorometano, a continuación se concentró el filtrado a vacío. El residuo se mezcló mediante agitación con acetonitrilo, se filtró y se secó. Se obtuvieron 75,0 mg (96,2 % de pureza, 32,3 % d. t.) del compuesto del título (22).

**RMN-1H (400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):**  $\delta$  = 9,375 (3,0); 9,370 (3,0); 8,953 (9,2); 8,950 (9,1); 8,836 (2,4); 8,833 (2,6); 8,824 (2,6); 8,821 (2,7); 8,583 (1,3); 8,578 (1,8); 8,573 (1,4); 8,563 (1,5); 8,558 (2,0); 8,553 (1,4); 7,902 (3,1); 7,882 (3,1);

7,693 (1,8); 7,681 (1,8); 7,673 (1,8); 7,663 (1,7); 7,661 (1,8); 7,422 (2,7); 7,393 (2,7); 5,758 (0,6); 4,114 (1,3); 4,088 (4,0); 4,062 (4,2); 4,036 (1,5); 3,328 (42,3); 2,677 (0,5); 2,673 (0,6); 2,668 (0,5); 2,526 (1,6); 2,521 (2,5); 2,512 (35,8); 2,508 (72,9); 2,503 (97,3); 2,499 (72,8); 2,495 (36,8); 2,468 (16,0); 2,403 (0,5); 2,335 (0,5); 2,330 (0,7); 2,326 (0,5); 2,076 (1,5); 0,146 (0,5); 0,008 (3,9); 0,000 (116,1); -0,009 (4,6); -0,150 (0,5)

5 **6-{2-Fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]fenil}-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-b]piridina (23)**



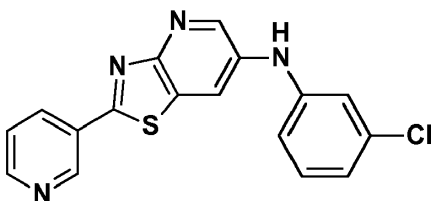
Se dispusieron 155,0 mg (0,35 mmol) de 6-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]fenil}-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-b]piridina (22) en 25 ml de diclorometano y se mezclaron con 87,7 mg (0,39 mmol) de ácido m-cloroperbenzoico. La mezcla de reacción se agitó durante la noche a temperatura ambiente.

10 A continuación se mezcló la mezcla de reacción con una gota de hidrogenosulfito de sodio acuoso, se lavó con solución acuosa de carbonato de sodio, se secó y se concentró. La purificación se realizó de manera cromatográfica por MPLC. Se obtuvieron 43,2 mg (98,3 % de pureza, 26,4 % d. t.) del compuesto del título (23).

**RMN-1H (400,0 MHz,  $d_6$ -DMSO):**  $\delta$  = 9,383 (12,6); 9,378 (12,3); 9,036 (15,7); 9,033 (14,8); 9,022 (12,3); 9,018 (16,0); 9,013 (7,6); 8,841 (9,7); 8,837 (10,6); 8,829 (10,1); 8,825 (10,6); 8,590 (5,6); 8,586 (7,4); 8,581 (5,7); 8,570 (6,1); 8,565 (8,1); 8,560 (5,8); 8,317 (1,4); 8,159 (13,2); 8,139 (13,3); 7,697 (7,3); 7,685 (7,1); 7,679 (6,9); 7,677 (7,0); 7,667 (6,7); 7,665 (6,9); 7,644 (0,6); 7,627 (0,8); 7,624 (0,8); 7,615 (0,7); 7,597 (0,8); 7,575 (0,6); 7,567 (0,7); 7,538 (10,5); 7,509 (10,2); 5,758 (3,5); 4,329 (0,4); 4,302 (1,4); 4,293 (2,2); 4,276 (2,8); 4,266 (7,1); 4,253 (6,9); 4,239 (7,4); 4,225 (7,4); 4,212 (2,8); 4,198 (2,7); 4,189 (1,6); 4,161 (0,5); 4,056 (1,0); 4,038 (2,9); 4,020 (3,0); 4,002 (1,0); 3,827 (0,4); 3,812 (0,5); 3,640 (0,6); 3,407 (0,3); 3,392 (0,7); 3,334 (1093,5); 3,268 (0,5); 3,175 (0,4); 3,162 (0,4); 2,677 (2,9); 2,672 (4,1); 2,668 (2,9); 2,645 (0,3); 2,525 (11,2); 2,512 (231,5); 2,508 (469,6); 2,503 (621,0); 2,499 (458,4); 2,494 (229,3); 2,485 (73,3); 2,434 (0,9); 2,410 (0,6); 2,388 (0,5); 2,372 (0,6); 2,334 (3,1); 2,330 (4,2); 2,325 (3,3); 1,990 (12,4); 1,909 (1,8); 1,298 (1,4); 1,259 (2,1); 1,233 (5,3); 1,193 (3,5); 1,175 (6,8); 1,157 (3,4); 0,853 (0,8); 0,836 (0,4); 0,146 (0,7); 0,008 (6,1); 0,000 (167,9); -0,008 (6,2); -0,150 (0,8)

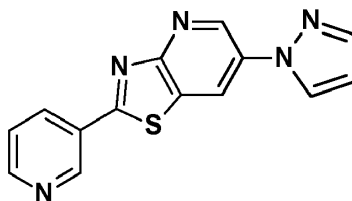
**Síntesis de compuestos de fórmula (I) según el procedimiento D**

25 **N-(3-Clorofenil)-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-b]piridina-6-amina (25)**



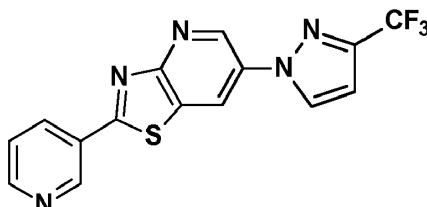
Se dispusieron bajo argón 150 mg (0,51 mmol) de 6-bromo-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-b]piridina (I-a-1), 78,6 mg (0,61 mmol) de 3-cloroanilina, 18,4 mg (0,08 mmol) de acetato de paladio(II), 57,5 mg (0,09) de rac-BINAP y 301,1 mg (0,92 mmol) de carbonato de cesio y a continuación se mezclaron con 5 ml de tolueno desgasificado. El recipiente se llenó de nuevo con argón, se cerró y se calentó durante 60 minutos a 140 °C en un microondas Biotage Initiator. La mezcla de reacción enfriada se diluyó con agua y se extrajo varias veces con diclorometano y acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se filtraron y se concentraron a vacío. La purificación se realizó de manera cromatográfica por MPLC (eluyente agua/acetonitrilo). Se obtuvieron 44,0 mg (96,9 % de pureza, 24,5 % d. t.) del compuesto del título (25).

35 **RMN-1H (400,0 MHz,  $d_6$ -DMSO):**  $\delta$  = 9,269 (6,7); 9,264 (6,8); 8,962 (11,3); 8,772 (5,4); 8,768 (5,9); 8,760 (5,8); 8,756 (5,9); 8,483 (9,8); 8,476 (13,1); 8,465 (3,5); 8,461 (4,5); 8,456 (3,4); 8,445 (3,7); 8,440 (5,6); 8,436 (16,0); 8,429 (10,0); 8,317 (1,2); 7,647 (4,3); 7,646 (4,3); 7,635 (4,1); 7,627 (4,1); 7,626 (4,1); 7,615 (4,0); 7,614 (3,9); 7,356 (0,3); 7,339 (4,5); 7,319 (9,7); 7,299 (6,0); 7,189 (4,3); 7,184 (10,1); 7,179 (7,2); 7,170 (5,9); 7,150 (4,0); 7,146 (3,3); 6,967 (4,5); 6,964 (4,4); 6,947 (3,9); 6,944 (4,1); 5,757 (0,5); 3,326 (236,5); 2,891 (1,4); 2,732 (1,2); 2,680 (1,3); 2,676 (2,6); 2,671 (3,6); 2,667 (2,7); 2,662 (1,3); 2,525 (8,9); 2,520 (13,4); 2,511 (186,4); 2,507 (384,3); 2,502 (519,2); 2,498 (389,2); 2,493 (195,6); 2,338 (1,2); 2,333 (2,5); 2,329 (3,5); 2,325 (2,6); 2,086 (4,0); 2,075 (1,1); 0,146 (2,0); 0,008 (14,5); 0,000 (450,0); -0,009 (17,3); -0,150 (2,0)

**Síntesis de compuestos de fórmula (I) según el procedimiento E****6-(1H-Pirazol-1-il)-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-b]piridina (26)**

5 Bajo argón se pesaron 400,0 mg (1,4 mmol) de 6-bromo-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-b]piridina (I-a-1), 1,0 g (14,7 mmol) de 1H-pirazol, 21 mg (0,1 mmol) de yoduro de cobre(I), 568,0 mg (4,1 mmol) de carbonato de potasio y 40 mg (0,14 mmol) de trans-1,2-bis(2'-piridilidenamino)ciclohexano (racémico) [puede prepararse de acuerdo con Chem. Eur. J. 2005, 2483] en un recipiente de reacción y se añadieron 19,0 g de DMF. La mezcla de reacción se calentó bajo argón a 120 °C durante la noche. La mezcla de reacción enfriada se concentró a vacío, el residuo se mezcló con agua y se extrajo varias veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se secaron, se filtraron y se concentraron. La purificación se realizó de manera cromatográfica por MPLC. Se obtuvieron 20,0 mg (100 % de pureza, 5,2 % d. t.) del compuesto del título (26).

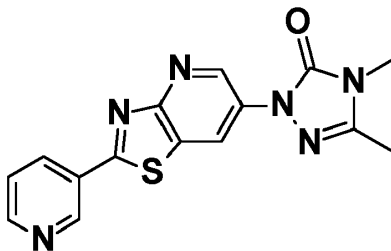
10 **RMN-1H (400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):**  $\delta$  = 11,160 (0,7); 10,721 (0,7); 9,345 (14,2); 9,294 (15,7); 9,162 (14,9); 8,822 (10,6); 8,814 (10,8); 8,761 (0,5); 8,697 (15,8); 8,551 (8,4); 8,531 (8,8); 8,475 (0,5); 8,429 (0,4); 7,894 (16,0); 7,799 (0,4); 7,684 (7,1); 7,667 (8,7); 7,654 (6,8); 7,235 (0,5); 7,220 (0,4); 7,216 (0,4); 6,673 (14,6); 5,935 (0,7); 4,134 (0,5); 3,391 (0,6); 3,326 (63,2); 2,671 (2,1); 2,503 (265,8); 2,329 (2,3); 2,283 (0,7); 2,265 (0,6); 2,244 (0,5); 2,234 (0,5); 2,209 (0,4); 2,205 (0,4); 2,178 (0,4); 2,160 (0,4); 2,155 (0,4); 2,141 (0,4); 2,087 (4,1); 2,058 (0,6); 2,044 (0,4); 1,983 (0,7); 1,926 (0,4); 1,907 (0,5); 1,886 (0,4); 1,870 (0,4); 1,852 (0,4); 1,821 (0,4); 1,743 (1,2); 1,678 (0,5); 1,671 (0,5); 1,625 (1,4); 1,532 (0,7); 1,511 (0,7); 1,463 (0,6); 1,453 (0,6); 1,433 (0,6); 1,416 (0,6); 1,367 (0,9); 1,349 (1,1); 1,297 (3,4); 1,257 (4,8); 1,230 (8,0); 1,171 (2,8); 1,146 (4,1); 1,136 (4,0); 1,088 (1,2); 1,065 (1,0); 1,042 (0,9); 1,036 (0,9); 0,981 (0,6); 0,943 (0,6); 0,928 (0,7); 0,863 (3,1); 0,755 (0,5); 0,724 (0,4); 0,701 (0,4); 0,145 (0,9); 0,123 (0,4); 0,105 (0,5); 0,095 (0,6); -0,001 (131,7); -0,150 (1,2); -0,190 (0,4); -0,201 (0,4)

**6-(1H-Pirazol-1-il)-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-b]piridina (27)**

25 Bajo argón se pesaron 300,0 mg (1,0 mmol) de 6-bromo-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-b]piridina (I-a-1), 1,4 g (10,3 mmol) de 3-(trifluorometil)-1H-pirazol y 147 mg (1,0 mmol) de óxido de cobre(I) en un recipiente de reacción y se añadieron 15,0 g de piridina. La mezcla de reacción se calentó bajo argón a 90 °C durante la noche. A continuación se añadieron otros 300 mg (1,0 mmol) de 6-bromo-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-b]piridina (II-1) y 440 mg (3,0 mmol) de óxido de cobre(I) y se calentó la mezcla de reacción durante otras 7 horas a 115 °C. La mezcla de reacción enfriada se concentró a continuación a vacío. La purificación se realizó de manera cromatográfica por MPLC (en primer lugar gradiente de eluyente agua/acetonitrilo; para fracción enriquecida entonces separación por gradiente de eluyente de éter de petróleo/acetona). Se obtuvieron 20,0 mg (82 % de pureza, 4,6 % d. t.) del compuesto del título (27).

30 **RMN-1H (601,6 MHz, CD<sub>3</sub>CN):**  $\delta$  = 9,373 (4,7); 9,355 (0,8); 9,156 (8,3); 9,151 (8,5); 8,877 (8,9); 8,873 (8,7); 8,789 (3,3); 8,782 (3,4); 8,734 (0,6); 8,729 (0,6); 8,511 (2,6); 8,508 (3,8); 8,505 (2,6); 8,498 (3,3); 8,495 (3,9); 8,492 (3,0); 8,488 (1,3); 8,485 (1,1); 8,476 (0,6); 8,385 (5,8); 8,383 (5,8); 7,585 (3,2); 7,577 (3,3); 7,572 (3,3); 7,564 (3,3); 7,545 (0,5); 7,466 (0,6); 7,452 (1,5); 7,446 (0,9); 7,441 (0,7); 7,433 (0,7); 7,238 (0,5); 7,234 (0,4); 7,224 (0,4); 7,220 (0,4); 6,953 (6,6); 6,949 (6,5); 5,448 (0,7); 2,828 (1,2); 2,748 (0,6); 2,575 (2,2); 2,563 (2,3); 2,501 (0,5); 2,172 (9,1); 2,107 (5,6); 2,087 (3,1); 2,076 (2,7); 2,059 (3,2); 2,055 (4,1); 2,051 (5,1); 2,047 (3,9); 2,043 (2,7); 1,965 (67,2); 1,957 (37,4); 1,952 (51,3); 1,949 (253,4); 1,945 (433,6); 1,940 (624,6); 1,936 (441,3); 1,932 (228,3); 1,916 (4,5); 1,883 (1,7); 1,850 (1,1); 1,842 (1,1); 1,834 (2,0); 1,830 (3,1); 1,826 (4,2); 1,822 (3,0); 1,818 (1,8); 1,567 (0,5); 1,434 (0,5); 1,340 (13,1); 1,319 (2,0); 1,308 (2,5); 1,298 (2,3); 1,285 (16,0); 1,269 (9,4); 1,248 (1,2); 1,227 (1,0); 1,217 (1,0); 1,206 (1,0); 1,184 (1,3); 1,173 (1,2); 1,153 (0,8); 1,134 (0,8); 1,112 (0,7); 1,083 (0,8); 1,071 (0,7); 1,048 (0,6); 1,038 (0,6); 1,022 (4,4); 1,010 (8,3); 0,999 (4,3); 0,914 (0,7); 0,893 (1,2); 0,882 (2,1); 0,870 (1,5); 0,844 (1,3); 0,000 (2,8)

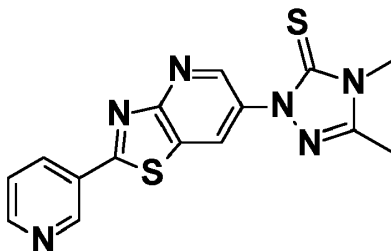
## 4,5-Dimetil-2-[2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-b]piridin-6-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-ona (30)



Bajo argón se dispusieron 250 mg (0,86 mmol) de 6-bromo-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-b]piridina (I-a-1), 136 mg (1,20 mmol) de 4,5-dimetil-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-ona, 16 mg (0,09 mmol) de yoduro de cobre(I), 355 mg (2,57 mmol) de carbonato de potasio y 43 mg (0,26 mmol) de yoduro de potasio en 5 ml de dioxano y el recipiente se llenó con argón. A continuación se añadieron 24 mg (0,17 mmol) de trans-N,N'-dimetilciclohexano-1,2-diamina (racémica), se cerró el recipiente de reacción y se agitó durante la noche a 130 °C. La mezcla de reacción enfriada se diluyó entonces con 5 ml de acetato de etilo, se filtró a través de Celite y se concentró el filtrado a vacío. La purificación se realizó de manera cromatográfica por medio de MPLC (eluyente agua/acetronitrilo). Se obtuvieron 6,0 mg (90,0 % de pureza, 1,95 % d. t.) del compuesto del título (30).

**RMN-1H (400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):**  $\delta$  = 9,336(0,6); 9,317(2,7); 9,310(3,0); 9,307(3,9); 9,300(3,8); 9,119(3,3); 9,113(3,3); 8,808(2,1); 8,800(2,2); 8,796(2,0); 8,712(0,4); 8,543(0,4); 8,522(1,4); 8,518(1,8); 8,512(1,4); 8,502(1,4); 8,497(1,6); 8,493(1,2); 7,673(1,3); 7,661(1,6); 7,655(1,5); 7,643(1,3); 3,556(0,4); 3,322(46,2); 3,255(17,4); 3,177(1,4); 3,141(0,4); 3,127(0,6); 3,122(0,5); 3,076(0,3); 3,060(2,0); 2,755(0,3); 2,736(0,4); 2,728(0,5); 2,670(2,4); 2,666(2,1); 2,505(269,8); 2,501(349,1); 2,497(274,9); 2,356(0,9); 2,338(16,0); 2,250(1,0); 2,227(0,7); 2,119(1,8); 1,234(0,5); 0,883(0,4); 0,000(50,2)

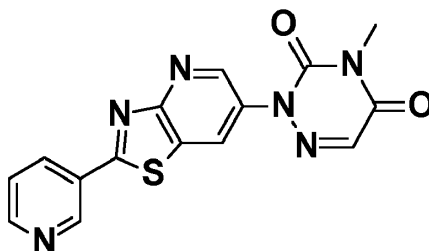
## 4,5-Dimetil-2-[2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-b]piridin-6-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-iona (31)



Bajo argón se dispusieron 250 mg (0,86 mmol) de 6-bromo-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-b]piridina (I-a-1), 155 mg (1,20 mmol) de 4,5-dimetil-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-iona, 16 mg (0,09 mmol) de yoduro de cobre(I), 355 mg (2,57 mmol) de carbonato de potasio y 43 mg (0,26 mmol) de yoduro de potasio en 5 ml de dioxano y se llenó el recipiente con argón. A continuación se añadieron 24 mg (0,17 mmol) de trans-N,N'-dimetilciclohexano-1,2-diamina (racémica), se cerró el recipiente de reacción y se agitó durante la noche a 130 °C. La mezcla de reacción enfriada se diluyó entonces con 5 ml de acetato de etilo, se filtró a través de Celite y se concentró el filtrado a vacío. La purificación se realizó de manera cromatográfica por medio de MPLC (eluyente agua/acetronitrilo). Se obtuvieron 4,0 mg (90,0 % de pureza, 1,24 % d. t.) del compuesto del título (31).

**RMN-1H (400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):**  $\delta$  = 9,318(0,6); 8,816(0,4); 8,806(0,4); 8,701(0,7); 8,695(1,0); 8,668(0,9); 8,662(0,8); 8,524(0,4); 8,504(0,4); 7,669(0,4); 7,657(0,4); 7,649(0,4); 3,557(4,4); 3,387(0,7); 3,319(4,7); 2,506(37,0); 2,501(51,1); 2,497(42,5); 2,406(4,4); 2,328(0,3); 2,291(0,5); 1,158(2,3); 1,069(16,0); 0,000(7,1); -0,002(4,9)

## 4-Metil-2-[2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-b]piridin-6-il]-1,2,4-triazin-3,5(2H,4H)-diona (39)



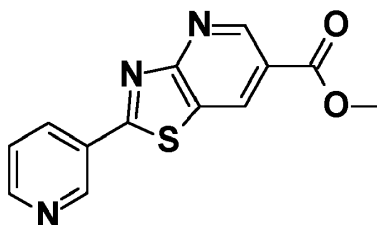
Bajo argón se dispusieron 200 mg (0,69 mmol) de 6-bromo-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-b]piridina (I-a-1), 122 mg (0,96 mmol) de 4-metil-1,2,4-triazin-3,5(2H,4H)-diona, 13 mg (0,07 mmol) de yoduro de cobre(I), 284 mg (2,05 mmol) de carbonato de potasio y 34 mg (0,21 mmol) de yoduro de potasio en 5 ml de dioxano y se llenó el recipiente con argón. A continuación se añadieron 19 mg (0,14 mmol) de trans-N,N'-dimetilciclohexano-1,2-diamina (racémica), se

cerró el recipiente de reacción y se agitó durante la noche a 130 °C. La mezcla de reacción enfriada se diluyó con 5 ml de acetato de etilo, se filtró a través de Celite y se concentró el filtrado a vacío. La purificación se realizó de manera cromatográfica por medio de MPLC (eluyente agua/acetoniitrilo). Se obtuvieron 8,0 mg (88,0 % de pureza, 3,04 % d. t.) del compuesto del título (39).

5 **RMN-1H (400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):**  $\delta$  = 9,356(8,6); 8,902(8,8); 8,897(11,6); 8,877(11,6); 8,871(8,2); 8,834(6,1); 8,823(6,3); 8,763(1,1); 8,755(1,0); 8,731(0,9); 8,711(0,9); 8,561(5,1); 8,542(5,7); 8,313(0,5); 8,177(0,4); 7,953(1,0); 7,879(16,0); 7,692(4,3); 7,681(5,2); 7,673(4,7); 7,661(4,5); 7,647(0,9); 7,550(0,8); 7,539(0,7); 7,529(0,7); 7,517(0,6); 5,308(0,4); 3,432(0,6); 3,320(260,1); 3,256(48,0); 3,190(0,5); 3,153(0,4); 3,076(0,3); 2,995(3,2); 2,891(4,8); 2,732(4,6); 2,711(1,2); 2,671(2,4); 2,645(0,4); 2,630(0,5); 2,541(215,4); 2,502(389,5); 2,368(2,0); 2,329(3,0); 10 2,295(0,8); 2,277(0,7); 2,243(0,6); 2,220(0,7); 2,200(0,6); 2,189(1,2); 2,173(0,6); 2,131(0,6); 2,117(0,9); 2,105(0,7); 2,086(0,6); 2,073(0,6); 2,036(0,6); 2,005(0,5); 1,997(0,5); 1,990(0,5); 1,980(0,5); 1,942(0,5); 1,909(5,1); 1,840(0,9); 1,816(0,4); 1,809(0,4); 1,762(0,4); 1,754(0,4); 1,722(0,3); 1,704(0,4); 1,673(0,3); 1,621(0,3); 1,610(0,4); 1,605(0,4); 1,603(0,4); 1,585(0,4); 1,574(0,4); 1,536(0,5); 1,514(0,6); 1,507(0,6); 1,500(0,6); 1,490(0,6); 1,466(0,7); 1,458(0,6); 1,386(1,4); 1,380(1,4); 1,347(1,8); 1,335(1,8); 1,298(1,7); 1,259(1,7); 1,234(2,6); 1,201(1,3); 1,141(1,4); 1,085(0,5); 15 1,070(0,6); 1,054(0,5); 1,045(0,5); 0,988(0,5); 0,968(0,4); 0,922(0,3); 0,892(0,4); 0,864(0,6); 0,852(0,9); 0,830(1,3); 0,756(0,5); 0,726(0,3); 0,000(43,1)

### Síntesis de compuestos de fórmula (I) según el procedimiento G

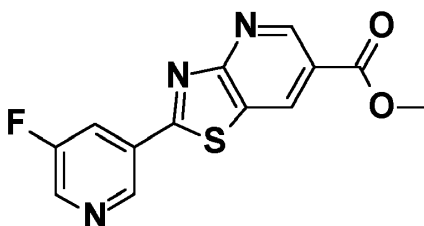
#### 2-(Piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-b]piridin-6-carboxilato de metilo (I-j-1)



20 A una mezcla de 10,8 g (36,97 mmol) de 6-bromo-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-b]piridina (I-a-1) en 200 ml de THF, 100 ml de DMF y 100 ml de metanol se añadieron 11,22 g (110,91 mmol) de trietilamina y 5,41 g (7,39 mmol) de [1,1'-bis(difenilfosfino)ferrocen]dicloro-paladio(II). Se condujo monóxido de carbono en la solución y se agitó la mezcla de reacción a 70 °C y 45 psi de presión de CO durante 16 horas. A continuación se filtró la mezcla y se concentró a vacío. La purificación se realizó de manera cromatográfica por medio de MPLC (gradiente de eluyente de éter de petróleo/acetato de etilo). Se obtuvieron 7,50 g del compuesto objetivo (I-j-1), que se hizo reaccionar sin purificación adicional posteriormente para dar amidas. Para ello se supuso una pureza del 100 %.

25 **CL-EM:**  $m/z$  272 [M+H<sup>+</sup>]

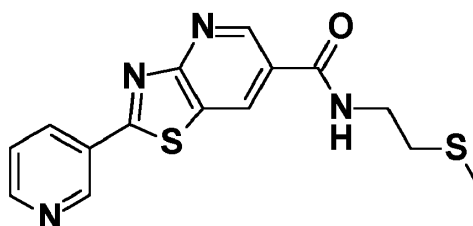
#### 2-(5-Fluoropiridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-b]piridin-6-carboxilato de metilo (I-j-2)



30 La preparación se realizó en analogía a la síntesis de (I-j-1), a diferencia partiendo de cloruro de 3-(clorocarbonil)-5-fluoropiridinio en el procedimiento A, etapa 1.

**CL-EM:**  $m/z$  290 [M+H<sup>+</sup>]

#### N-[2-(Metilsulfanil)etil]-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-b]piridin-6-carboxamida (52)

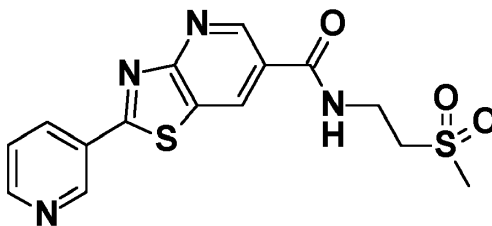


35 A una solución de 300 mg (1,11 mmol, pureza supuesta del 100 %) de 2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-b]piridin-6-carboxilato de metilo (I-j-1) en 8 ml de THF se añadieron 1,2 equivalentes en mol (eq.) de trimetilsilanolato de potasio. La mezcla se agitó aún durante 16 horas a 30 °C y entonces se concentró a vacío. El residuo se suspendió

en 5 ml de DMF y se añadieron 1,2 equivalentes en mol (eq.) de hexafluorofosfato de 2-(7-aza-1H-benzotriazol-1-il)-1,1,3,3-tetrametiluronio (HATU) y 3 equivalentes en mol (eq.) de diisopropiletilamina. La mezcla se agitó durante 30 minutos a 30 °C. A continuación se añadieron 121,4 mg (1,33 mmol, 1,2 eq.) de 2-(metilsulfil)etanamina y se agitó la mezcla de reacción aún durante 16 horas a 30 °C. La mezcla de reacción se concentró después a vacío. La purificación se realizó de manera cromatográfica por medio de MPLC. Se obtuvieron 49,2 mg (95,4 % de pureza, 12,8 % d. t.) del compuesto del título (52).

**RMN-1H (400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):**  $\delta$  = 9,365(1,2); 9,153(2,3); 9,148(2,8); 9,101(2,7); 9,096(2,4); 8,981(0,5); 8,967(1,0); 8,953(0,5); 8,843(0,9); 8,831(0,8); 8,574(0,7); 8,568(1,0); 8,564(0,7); 8,554(0,7); 8,548(1,0); 8,544(0,8); 7,695(0,8); 7,683(0,8); 7,676(0,8); 7,664(0,8); 3,902(4,0); 3,556(0,8); 3,540(1,6); 3,522(1,6); 3,507(0,9); 3,356(130,8); 3,349(200,4); 2,724(1,7); 2,706(2,5); 2,689(1,6); 2,678(0,4); 2,673(0,5); 2,669(0,3); 2,526(1,2); 2,513(24,8); 2,509(53,4); 2,504(76,2); 2,500(58,4); 2,495(28,7); 2,331(0,4); 2,326(0,3); 2,128(16,0); 0,000(2,5)

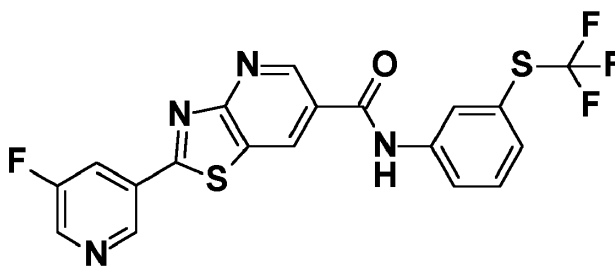
**N-[2-(Metilsulfonyl)etil]-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-b]piridin-6-carboxamida (54)**



A una solución de 300 mg (1,11 mmol, pureza supuesta del 100 %) de 2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-b]piridin-6-carboxilato de metilo (l-j-1) en 8 ml de THF se añadieron 1,2 equivalentes en mol (eq.) de trimetilsilanolato de potasio. La mezcla se agitó aún durante 16 horas a 30 °C y entonces se concentró a vacío. El residuo se suspendió en 5 ml de DMF y se añadieron 1,2 equivalentes en mol (eq.) de hexafluorofosfato de 2-(7-aza-1H-benzotriazol-1-il)-1,1,3,3-tetrametiluronio (HATU) y 3 equivalentes en mol (eq.) de diisopropiletilamina. La mezcla se agitó durante 30 minutos a 30 °C. A continuación se añadieron 163,8 mg (1,33 mmol, 1,2 eq.) de 2-(metilsulfonyl)etanamina y la mezcla de reacción se agitó aún durante 16 horas a 30 °C. La mezcla de reacción se concentró después a vacío. La purificación se realizó de manera cromatográfica por medio de MPLC. Se obtuvieron 74,3 mg (97,6 % de pureza, 18,0 % d. t.) del compuesto del título (54).

**RMN-1H (400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):**  $\delta$  = 9,372(1,9); 9,152(3,4); 9,147(4,5); 9,125(1,7); 9,115(4,8); 9,109(4,2); 8,849(1,3); 8,838(1,3); 8,576(1,0); 8,571(1,4); 8,567(1,1); 8,556(1,1); 8,551(1,5); 8,547(1,1); 7,698(1,2); 7,686(1,2); 7,678(1,2); 7,666(1,1); 3,955(0,6); 3,902(8,0); 3,777(0,9); 3,760(2,4); 3,745(2,5); 3,729(1,2); 3,455(2,2); 3,438(4,0); 3,421(1,9); 3,344(186,2); 3,336(242,0); 3,176(0,6); 3,162(0,6); 3,075(16,0); 2,677(0,6); 2,672(0,8); 2,668(0,6); 2,543(0,6); 2,526(2,1); 2,512(47,9); 2,508(101,9); 2,503(144,1); 2,499(111,8); 2,334(0,6); 2,330(0,8); 2,325(0,6); 0,000(3,8)

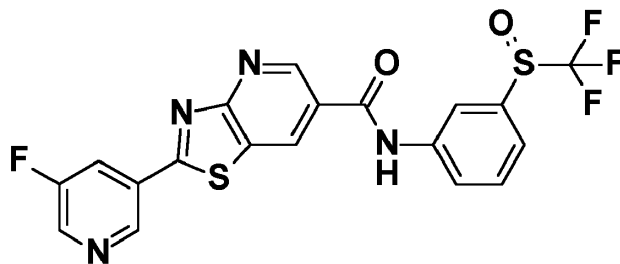
**2-(5-Fluoropiridin-3-il)-N-{3-[(trifluorometil)sulfil]fenil}[1,3]tiazolo[4,5-b]piridin-6-carboxamida (57)**



A una solución de 300 mg (1,11 mmol, pureza supuesta del 100 %) de 2-(5-fluoropiridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-b]piridin-6-carboxilato de metilo (l-j-2) en 8 ml de THF se añadieron 1,2 equivalentes en mol (eq.) de trimetilsilanolato de potasio. La mezcla se agitó aún durante 16 horas a 30 °C y entonces se concentró a vacío. El residuo se suspendió en 5 ml de DMF y se añadieron 1,2 equivalentes en mol (eq.) de hexafluorofosfato de 2-(7-aza-1H-benzotriazol-1-il)-1,1,3,3-tetrametiluronio (HATU) y 3 equivalentes en mol (eq.) de diisopropiletilamina. La mezcla se agitó durante 30 minutos a 30 °C. A continuación se añadieron 256,9 mg (1,33 mmol, 1,2 eq.) de 3-[(trifluorometil)sulfil]anilina y la mezcla de reacción se agitó aún durante 16 horas a 30 °C. La mezcla de reacción se concentró después a vacío. La purificación se realizó de manera cromatográfica por medio de MPLC. Se obtuvieron 41,3 mg (99,5 % de pureza, 8,2 % d. t.) del compuesto del título (57).

**RMN-1H (400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):**  $\delta$  = 10,872(8,7); 9,298(6,5); 9,293(10,8); 9,277(16,0); 8,887(6,9); 8,880(7,1); 8,555(2,2); 8,549(3,3); 8,544(2,4); 8,532(2,3); 8,525(3,3); 8,521(2,3); 8,308(0,3); 8,273(7,1); 8,025(3,4); 8,004(3,7); 7,605(3,2); 7,585(7,0); 7,565(4,6); 7,509(5,1); 7,490(3,2); 3,902(15,3); 3,705(0,4); 3,657(0,4); 3,603(0,6); 3,508(1,4); 3,361(1440,1); 3,174(0,6); 2,678(1,6); 2,674(2,2); 2,670(1,6); 2,582(0,4); 2,544(1,6); 2,509(266,9); 2,505(367,0); 2,500(281,7); 2,336(1,5); 2,331(2,0); 1,233(0,6); 0,000(7,6)

## 2-(5-Fluoropiridin-3-il)-N-{3-[(trifluorometil)sulfinil]fenil}[1,3]tiazolo[4,5-b]piridin-6-carboxamida (58)

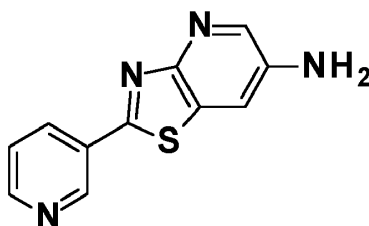


A una solución de 300 mg (0,67 mmol) de 2-(5-fluoropiridin-3-il)-N-{3-[(trifluorometil)sulfinil]fenil}[1,3]tiazolo[4,5-b]piridin-6-carboxamida (57) en 10 ml de diclorometano se añadieron 2 equivalentes en mol (222,5 mg, 1,3 mmol) de ácido meta-cloroperbenzoico a 0 °C. La mezcla de reacción se agitó aún durante 16 horas a 20 °C y a continuación se concentró a vacío. La purificación se realizó de manera cromatográfica por medio de MPLC. Se obtuvieron 17,4 mg (95,5 % de pureza, 5,3 % d. t.) del compuesto del título (58).

**RMN-1H (601,6 MHz,  $d_6$ -DMSO):**  $\delta$  = 11,037(1,3); 9,317(7,8); 9,313(14,4); 9,306(16,0); 9,302(8,6); 9,278(8,6); 8,887(8,8); 8,883(10,4); 8,833(0,9); 8,829(0,8); 8,825(0,9); 8,554(2,8); 8,551(3,7); 8,547(2,8); 8,539(3,0); 8,536(3,8); 8,532(2,6); 8,452(8,0); 8,270(1,6); 8,189(0,8); 8,176(0,9); 8,160(4,1); 8,147(4,3); 8,145(4,3); 8,022(0,8); 8,007(0,8); 7,760(4,0); 7,746(8,2); 7,733(4,8); 7,646(5,2); 7,634(4,1); 7,596(0,7); 7,583(1,5); 7,569(0,9); 7,505(1,0); 7,493(0,8); 3,322(411,9); 2,614(2,3); 2,611(1,7); 2,541(1,0); 2,523(4,5); 2,520(5,8); 2,517(6,8); 2,505(256,7); 2,502(334,0); 2,499(250,5); 2,386(2,0); 1,231(0,6); 0,000(7,3)

**Síntesis de compuestos de fórmula (I) según el procedimiento H**

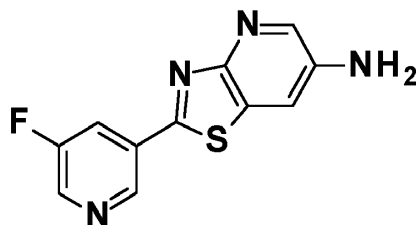
## 2-(Piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-b]piridin-6-amina (I-s-1)



A una solución agitada de 8,0 g (31 mmol) de 6-nitro-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-b]piridina (I-r-1) (preparada de manera análoga a la síntesis para el compuesto (I-a-1), partiendo de 3-bromo-5-nitropiridin-2-amina en el procedimiento A, etapa 1) en 300 ml de THF se añadieron a 30 °C bajo nitrógeno 1,6 g de Pd/C (10 % en peso). La mezcla se agitó a 50 °C bajo hidrógeno (50 psi) durante 48 horas. A continuación se filtró la mezcla de reacción y se concentró el filtrado a vacío. Se obtuvieron 5,0 g de 2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-b]piridin-6-amina (I-s-1) como producto bruto que se hizo reaccionar sin purificación adicional posteriormente para dar amidas. Para ello se supuso una pureza del 100 %.

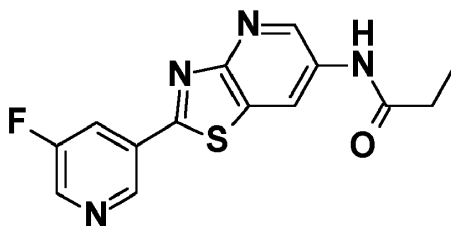
**CL-EM:**  $m/z$  229 [M+H<sup>+</sup>]

## 2-(5-Fluoropiridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-b]piridin-6-amina (I-s-2)

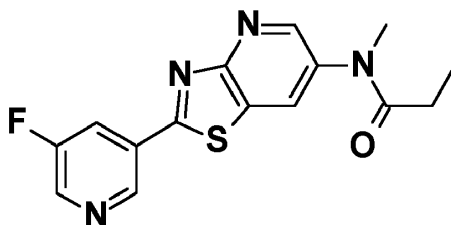


La preparación se realizó en analogía a la síntesis de (I-s-1), a diferencia partiendo de cloruro de 3-(clorocarbonil)-5-fluoropiridinio en el procedimiento A, etapa 1.

**CL-EM:**  $m/z$  247 [M+H<sup>+</sup>]

**N-Metil-N-[2-(piridin-3-il)][1,3]tiazolo[4,5-b]piridin-6-il]propanamida (59)****Etapla 1: N-[2-(piridin-3-il)][1,3]tiazolo[4,5-b]piridin-6-il]propanamida**

5 A una mezcla de 300 mg (1,31 mmol) de 2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-b]piridin-6-amina (I-s-2) y 398 mg (3,93 mmol) de trietilamina en 5 ml de diclorometano se añadieron 121,6 mg (1,31 mmol) de cloruro de propanoilo. La mezcla de reacción se agitó durante 16 horas a 30 °C y a continuación se concentró a vacío. La purificación se realizó de manera cromatográfica por medio de MPLC (gradiente de eluyente de éter de petróleo/acetato de etilo). Se obtuvieron 300 mg (80,5 % d. t., pureza supuesta del 100 %) del compuesto del título N-[2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-b]piridin-6-il]propanamida, que se hizo reaccionar posteriormente de manera directa.

**10 Etapla 2: N-metil-N-[2-(piridin-3-il)][1,3]tiazolo[4,5-b]piridin-6-il]propanamida (59)**

15 Se disolvieron 172 mg (0,605 mmol) de N-[2-(piridin-3-il)-1,3-benzotiazol-6-il]propanamida (ejemplo 59, etapa 1) en 5 ml de THF y se enfriaron hasta 0 °C. A continuación se añadieron 24,2 mg (0,605 mmol) de hidruro de sodio (suspensión al 60 % en parafina) a 0 °C. La mezcla se agitó a esta temperatura aún durante 30 minutos y se añadieron entonces 85,9 mg (0,605 mmol) de yoduro de metilo. La mezcla de reacción se agitó a 30 °C aún durante 16 horas y se mezcló entonces a 0 °C con 1 ml de solución acuosa de cloruro de amonio. Tras concentración de la mezcla a vacío se purificó el residuo de manera cromatográfica por medio de HPLC preparativa. Se obtuvieron 34,8 mg (99,9 % de pureza, 19,3 % d. t.) del compuesto del título (59).

20 **RMN-1H (400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):**  $\delta$  = 9,231(6,6); 8,861(5,8); 8,854(6,1); 8,761(8,3); 8,508(1,9); 8,503(2,6); 8,485(1,9); 8,480(2,6); 8,475(1,8); 3,902(16,0); 3,508(0,4); 3,342(396,2); 3,338(410,6); 3,176(0,7); 3,164(0,7); 2,677(1,1); 2,672(1,5); 2,668(1,2); 2,548(0,6); 2,525(4,3); 2,512(90,4); 2,508(185,6); 2,503(257,8); 2,499(197,1); 2,335(1,2); 2,330(1,5); 2,325(1,2); 2,199(0,5); 2,143(0,6); 2,130(0,6); 2,112(0,6); 2,074(0,4); 1,249(0,3); 1,235(0,3); 0,969(4,6); 0,008(0,4); 0,000(10,5)

25 Los compuestos de fórmula (I) y también aquéllos que no se encuentran bajo la fórmula (I), están expuestos en la siguiente tabla. También los compuestos que no se encuentran bajo la fórmula (I) son objeto de la invención.

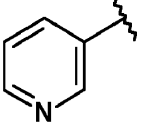
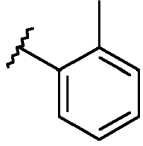
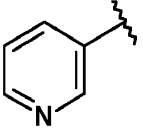
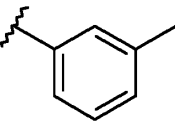
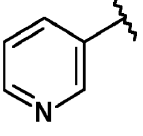
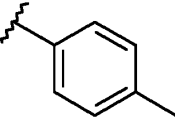
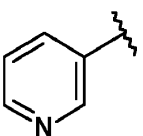
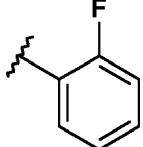
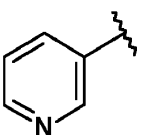
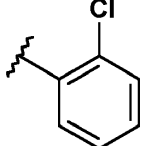
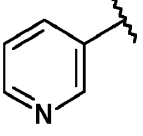
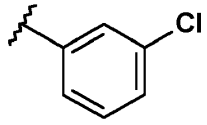
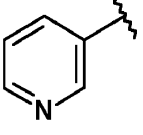
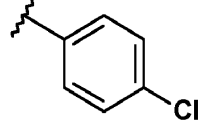
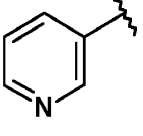
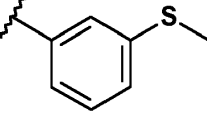
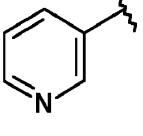
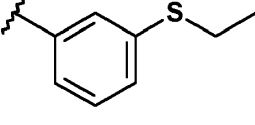
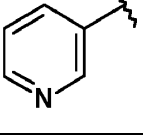
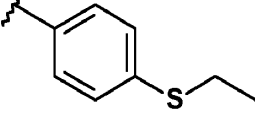
También los compuestos I-a-1, I-j-1, I-j-2, I-s-1 y I-s-2 expuestos en la tabla son objeto de la invención.

**Tabla 1**

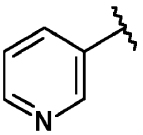
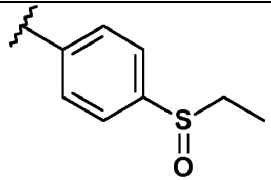
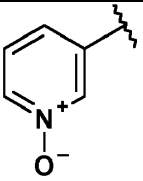
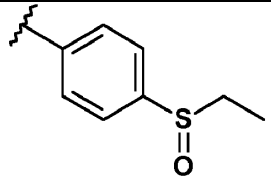
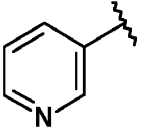
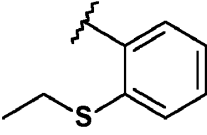
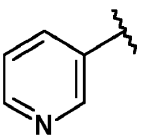
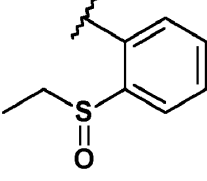
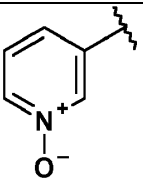
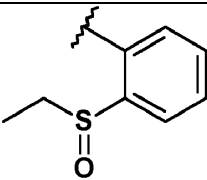
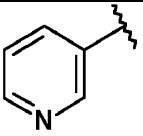
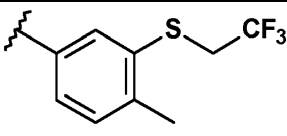
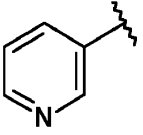
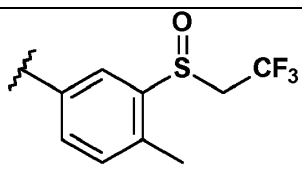
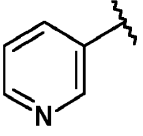
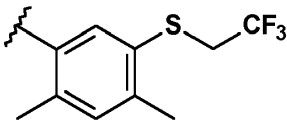
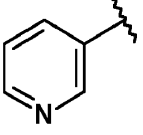
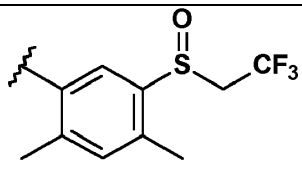
| Compuestos de fórmula        |                |   |   |                |                |
|------------------------------|----------------|---|---|----------------|----------------|
|                              |                |   |   |                |                |
| Procedimiento de preparación | N.º de ejemplo | A | Q | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> |
| B                            | 1              |   | S | H              |                |



(continuación)

| Procedimiento de preparación | N.º de ejemplo | A   | Q | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup>  |
|------------------------------|----------------|---|---|----------------|---|
| B                            | 2              |    | S | H              |    |
| B                            | 3              |    | S | H              |    |
| B                            | 4              |    | S | H              |    |
| B                            | 5              |   | S | H              |   |
| B                            | 6              |  | S | H              |  |
| B                            | 7              |  | S | H              |  |
| B                            | 8              |  | S | H              |  |
| B                            | 9              |  | S | H              |  |
| B                            | 10             |  | S | H              |  |
| B                            | 11             |  | S | H              |  |

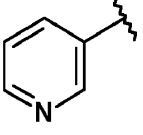
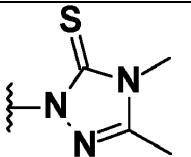
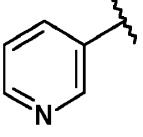
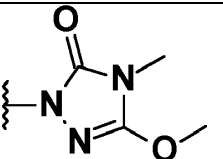
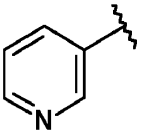
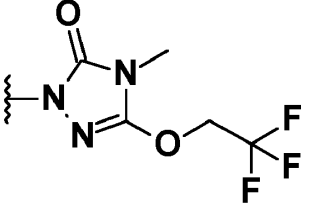
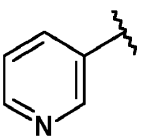
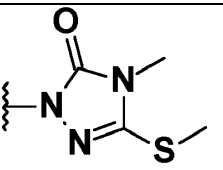
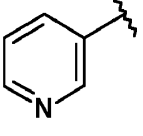
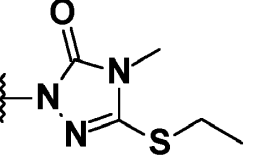
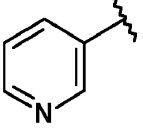
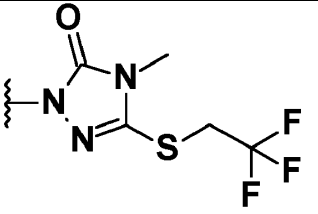
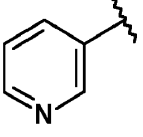
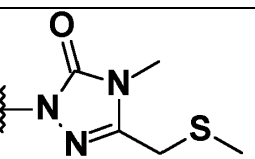
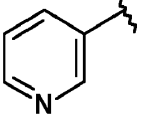
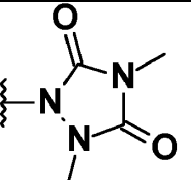
(continuación)

| Procedimiento de preparación | N.º de ejemplo | A   | Q | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup>  |
|------------------------------|----------------|---|---|----------------|---|
| I                            | 12             |    | S | H              |    |
| I                            | 13             |    | S | H              |    |
| B                            | 14             |    | S | H              |    |
| I                            | 15             |   | S | H              |   |
| I                            | 16             |  | S | H              |  |
| B                            | 17             |  | S | H              |  |
| I                            | 18             |  | S | H              |  |
| B                            | 19             |  | S | H              |  |
| I                            | 20             |  | S | H              |  |

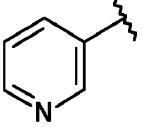
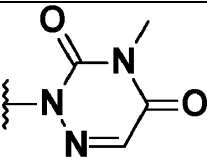
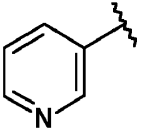
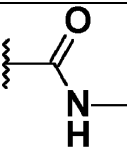
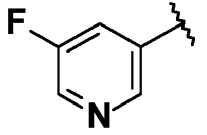
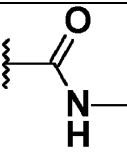
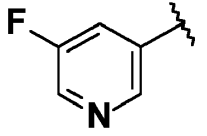
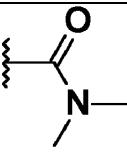
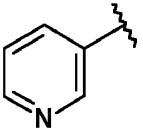
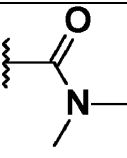
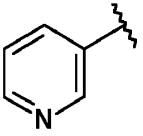
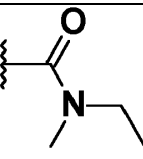
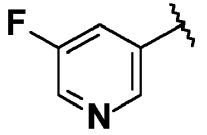
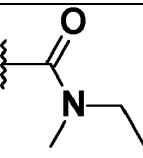
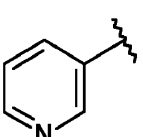
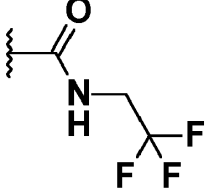
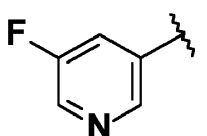
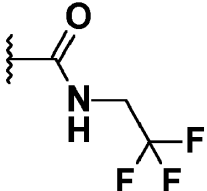
(continuación)

| Procedimiento de preparación | N.º de ejemplo | A | Q | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup> |
|------------------------------|----------------|---|---|----------------|----------------|
| I                            | 21             |   | S | H              |                |
| B                            | 22             |   | S | H              |                |
| I                            | 23             |   | S | H              |                |
| D                            | 24             |   | S | H              |                |
| D                            | 25             |   | S | H              |                |
| E                            | 26             |   | S | H              |                |
| E                            | 27             |   | S | H              |                |
| E                            | 28             |   | S | H              |                |
| E                            | 29             |   | S | H              |                |
| E                            | 30             |   | S | H              |                |

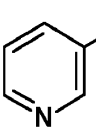
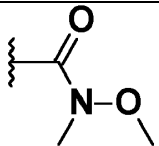
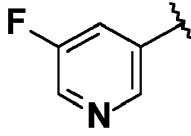
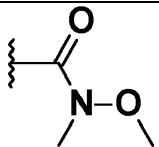
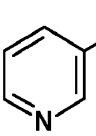
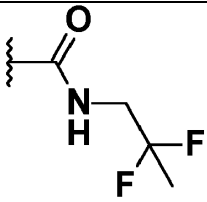
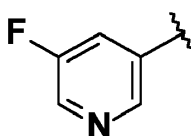
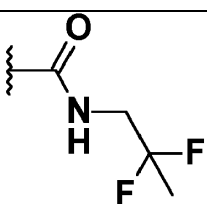
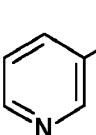
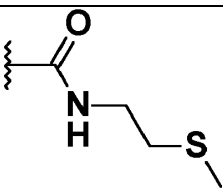
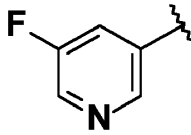
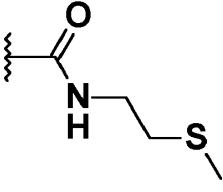
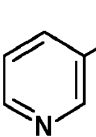
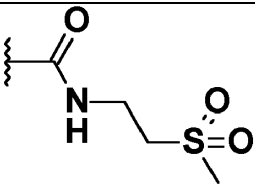
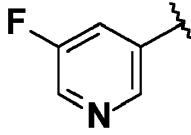
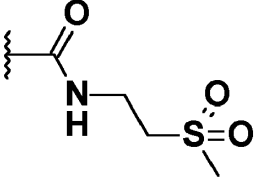
(continuación)

| Procedimiento de preparación | N.º de ejemplo | A   | Q | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup>  |
|------------------------------|----------------|---|---|----------------|---|
| E                            | 31             |    | S | H              |    |
| E                            | 32             |    | S | H              |    |
| E                            | 33             |    | S | H              |    |
| E                            | 34             |   | S | H              |   |
| E                            | 35             |  | S | H              |  |
| E                            | 36             |  | S | H              |  |
| E                            | 37             |  | S | H              |  |
| E                            | 38             |  | S | H              |  |

(continuación)

| Procedimiento de preparación | N.º de ejemplo | A   | Q | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup>  |
|------------------------------|----------------|---|---|----------------|---|
| E                            | 39             |    | S | H              |    |
| G                            | 40             |    | S | H              |    |
| G                            | 41             |    | S | H              |    |
| G                            | 42             |   | S | H              |   |
| G                            | 43             |  | S | H              |  |
| G                            | 44             |  | S | H              |  |
| G                            | 45             |  | S | H              |  |
| G                            | 46             |  | S | H              |  |
| G                            | 47             |  | S | H              |  |

(continuación)

| Procedimiento de preparación | N.º de ejemplo | A   | Q | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup>  |
|------------------------------|----------------|---|---|----------------|---|
| G                            | 48             |    | S | H              |    |
| G                            | 49             |    | S | H              |    |
| G                            | 50             |    | S | H              |    |
| G                            | 51             |   | S | H              |   |
| G                            | 52             |  | S | H              |  |
| G                            | 53             |  | S | H              |  |
| G                            | 54             |  | S | H              |  |
| G                            | 55             |  | S | H              |  |

(continuación)

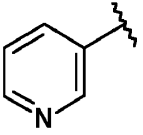
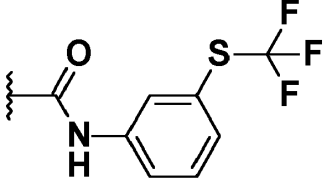
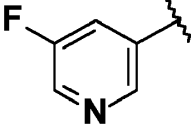
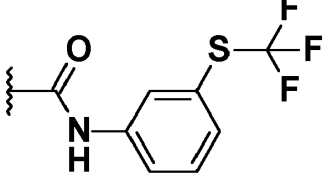
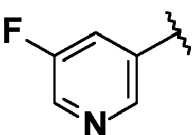
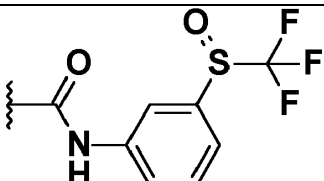
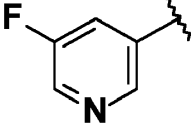
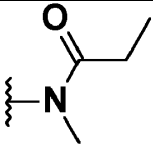
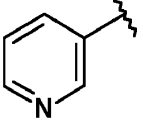
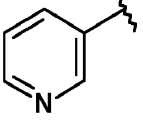
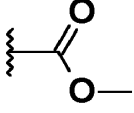
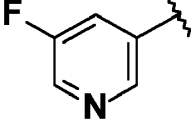
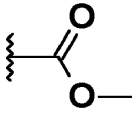
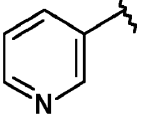
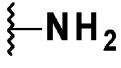
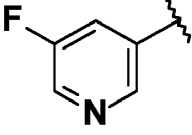

| Procedimiento de preparación | N.º de ejemplo | A   | Q | R <sup>1</sup> | R <sup>2</sup>  |
|------------------------------|----------------|---|---|----------------|---|
| G                            | 56             |    | S | H              |    |
| G                            | 57             |    | S | H              |    |
| I                            | 58             |    | S | H              |    |
| H2                           | 59             |  | S | H              |  |
| A                            | I-a-1          |  | S | H              | Br  |
| G                            | I-j-1          |  | S | H              |  |
| G                            | I-j-2          |  | S | H              |  |
| H2                           | I-s-1          |  | S | H              |  |
| H2                           | I-s-2          |  | S | H              |  |

Tabla 2

| Datos analíticos con respecto a los compuestos indicados |         |         |   |
|--|---------|---------|---|
| N.º de ejemplo   | logP[a] | logP[b] | RMN-1H [ $\sigma$ (ppm)] o bien CL-EM [m/z]   |
| 1  | 2,47    | 2,56    | RMN- <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,366 (4,5); 9,361 (4,6); 9,084 (7,0); 9,079 (8,7); 9,029 (7,7); 9,023 (6,6);<br>8,830 (3,7); 8,826 (4,1); 8,818 (4,0); 8,814 (4,1); 8,574 (2,2); 8,570 (2,9); 8,564<br>(2,3); 8,554 (2,4); 8,549 (3,1); 8,544 (2,4); 8,316 (0,3); 7,875 (5,1); 7,871 (7,3);<br>7,853 (7,7); 7,692 (2,8); 7,690 (2,9); 7,678 (2,9); 7,672 (2,8); 7,670 (2,8); 7,660<br>(2,7); 7,658 (2,8); 7,585 (3,8); 7,567 (8,4); 7,547 (5,3); 7,495 (3,1); 7,492 (2,0);<br>7,481 (1,2); 7,476 (4,3); 7,471 (1,1); 7,458 (1,4); 3,762 (0,6); 3,569 (0,6); 3,351<br>(267,6); 3,349 (243,9); 3,340 (242,3); 3,335 (116,9); 2,682 (0,4); 2,677 (0,9);<br>2,673 (1,2); 2,668 (0,9); 2,526 (2,6); 2,521 (3,9); 2,513 (61,0); 2,508 (126,9);<br>2,504 (172,8); 2,499 (131,6); 2,495 (67,2); 2,335 (0,8); 2,331 (1,2); 2,326 (0,8);<br>2,075 (16,0); 0,146 (0,5); 0,008 (3,7); 0,000 (122,8); -0,008 (5,0); -0,150 (0,5) |
| 2  | 2,76    | 2,8     | RMN- <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,366 (2,3); 9,361 (2,3); 8,833 (1,7); 8,829 (1,9); 8,821 (1,8); 8,817 (1,9);<br>8,753 (2,7); 8,748 (4,7); 8,735 (4,4); 8,730 (2,6); 8,573 (1,0); 8,569 (1,5); 8,564<br>(1,0); 8,553 (1,1); 8,549 (1,5); 8,544 (1,0); 7,693 (1,4); 7,681 (1,4); 7,673 (1,3);<br>7,661 (1,3); 7,404 (0,5); 7,393 (2,4); 7,390 (2,7); 7,383 (3,6); 7,376 (3,2); 7,369<br>(3,3); 7,362 (4,8); 7,355 (1,5); 7,349 (1,1); 7,340 (0,4); 3,329 (15,8); 2,526 (0,8);<br>2,508 (33,3); 2,504 (44,1); 2,500 (33,0); 2,383 (0,4); 2,331 (0,4); 2,315 (16,0);<br>0,008 (1,8); 0,000 (50,9); -0,009 (2,0)   |
| 3  | 2,91    | 2,95    | RMN- <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,362 (2,9); 9,357 (2,9); 9,066 (3,5); 9,060 (4,2); 9,008 (4,0); 9,003 (3,7);<br>8,824 (2,3); 8,815 (2,1); 8,812 (2,2); 8,563 (1,8); 8,559 (1,3); 8,548 (1,3); 8,543<br>(1,9); 8,539 (1,3); 7,688 (5,2); 7,676 (2,1); 7,668 (1,9); 7,656 (3,4); 7,636 (2,1);<br>7,463 (1,6); 7,444 (3,2); 7,425 (1,7); 7,297 (2,2); 7,279 (1,7); 3,346 (101,5);<br>3,339 (98,5); 2,673 (0,5); 2,508 (59,8); 2,504 (75,9); 2,500 (59,5); 2,424 (16,0);<br>2,330 (0,5); 2,076 (0,4); 0,000 (41,3)  |
| 4  | 2,91    | 2,96    | RMN- <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,358 (3,1); 9,353 (3,2); 9,060 (4,6); 9,054 (5,4); 8,992 (5,5); 8,987 (4,9);<br>8,824 (2,4); 8,820 (2,7); 8,812 (2,5); 8,808 (2,7); 8,564 (1,4); 8,559 (2,0); 8,554<br>(1,5); 8,544 (1,5); 8,539 (2,1); 8,534 (1,5); 7,914 (1,2); 7,766 (5,5); 7,746 (6,3);<br>7,685 (2,1); 7,672 (2,0); 7,665 (2,1); 7,652 (1,8); 7,378 (5,1); 7,358 (4,6); 3,328<br>(39,8); 2,677 (0,4); 2,672 (0,6); 2,668 (0,5); 2,544 (0,3); 2,525 (1,8); 2,512<br>(34,6); 2,508 (69,0); 2,503 (91,4); 2,499 (69,9); 2,388 (16,0); 2,330 (0,7); 2,326<br>(0,5); 2,298 (1,2); 0,146 (0,5); 0,008 (3,8); 0,000 (98,0); -0,008 (4,7); -0,150<br>(0,5)   |



ES 2 691 246 T3

(continuación)

| N.º de ejemplo | logP[a] | logP[b] | RMN-1H [ $\sigma$ (ppm)] o bien CL-EM [m/z]   |
|----------------|---------|---------|---|
| 5              | 2,51    | 2,54    | <p>RMN-<sup>1</sup>H (400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):</p> <p><math>\delta</math> = 9,373 (11,3); 9,369 (11,2); 9,367 (10,9); 8,952 (7,9); 8,947 (14,9); 8,943 (13,7); 8,933 (12,1); 8,928 (15,9); 8,923 (7,2); 8,837 (9,0); 8,833 (10,0); 8,825 (9,6); 8,821 (9,8); 8,582 (5,5); 8,578 (7,1); 8,577 (6,9); 8,573 (5,6); 8,562 (5,9); 8,558 (7,1); 8,557 (7,6); 8,553 (5,7); 8,318 (2,6); 8,189 (1,8); 8,091 (0,4); 8,071 (0,5); 7,998 (1,3); 7,758 (3,8); 7,754 (4,3); 7,738 (7,0); 7,734 (8,3); 7,718 (4,2); 7,714 (4,9); 7,697 (7,1); 7,695 (7,1); 7,684 (6,6); 7,683 (6,8); 7,677 (6,6); 7,675 (6,8); 7,664 (6,4); 7,663 (6,6); 7,570 (1,7); 7,566 (2,0); 7,557 (2,0); 7,552 (4,2); 7,548 (4,0); 7,540 (2,9); 7,535 (4,5); 7,532 (5,5); 7,527 (3,4); 7,518 (3,1); 7,514 (2,9); 7,454 (6,4); 7,436 (4,4); 7,433 (4,7); 7,426 (14,0); 7,407 (16,0); 7,389 (4,9); 7,386 (4,5); 7,321 (0,8); 7,318 (0,7); 7,308 (2,2); 7,249 (0,7); 7,229 (0,7); 7,152 (0,4); 7,075 (0,4); 6,600 (0,3); 5,162 (0,6); 4,497 (0,9); 4,482 (0,8); 4,038 (0,6); 4,020 (0,7); 3,397 (0,4); 3,328 (888,9); 3,295 (0,5); 3,005 (0,7); 2,987 (0,7); 2,676 (4,7); 2,671 (6,6); 2,667 (4,9); 2,663 (2,4); 2,525 (16,1); 2,520 (24,4); 2,511 (350,0); 2,507 (724,8); 2,502 (967,1); 2,498 (711,5); 2,493 (349,4); 2,403 (0,6); 2,374 (0,7); 2,338 (2,1); 2,334 (4,6); 2,329 (6,4); 2,325 (4,8); 2,320 (2,3); 1,989 (2,6); 1,355 (0,7); 1,260 (0,9); 1,249 (0,4); 1,242 (1,8); 1,234 (1,4); 1,224 (0,9); 1,212 (0,3); 1,193 (1,0); 1,175 (1,6); 1,157 (0,7); 0,000 (2,4)</p> |
| 6              | 2,77    | 2,78    | <p>RMN-<sup>1</sup>H (400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):</p> <p><math>\delta</math> = 9,373 (8,3); 9,368 (8,3); 8,854 (12,7); 8,848 (16,0); 8,839 (6,8); 8,835 (7,3); 8,827 (7,2); 8,823 (7,4); 8,806 (15,3); 8,800 (12,6); 8,582 (3,8); 8,577 (5,2); 8,572 (4,0); 8,562 (4,2); 8,556 (5,6); 8,552 (4,1); 8,318 (0,5); 7,696 (5,5); 7,687 (8,6); 7,681 (5,0); 7,676 (10,0); 7,672 (4,5); 7,664 (11,9); 7,655 (1,3); 7,651 (0,7); 7,634 (0,7); 7,626 (5,0); 7,618 (3,6); 7,614 (6,6); 7,608 (4,5); 7,602 (8,0); 7,594 (1,3); 7,589 (0,6); 7,567 (0,5); 7,555 (0,6); 7,548 (2,3); 7,543 (1,4); 7,535 (12,8); 7,530 (7,4); 7,524 (10,0); 7,518 (6,5); 7,512 (9,2); 7,500 (1,3); 7,493 (0,5); 6,535 (1,3); 5,758 (0,8); 3,569 (0,4); 3,328 (120,3); 2,681 (0,6); 2,677 (1,2); 2,672 (1,6); 2,668 (1,2); 2,526 (4,2); 2,521 (6,4); 2,512 (87,3); 2,508 (178,1); 2,503 (238,6); 2,499 (179,7); 2,495 (92,4); 2,335 (1,2); 2,330 (1,6); 2,326 (1,2); 2,076 (0,4); 0,146 (1,3); 0,008 (9,3); 0,000 (278,6); -0,008 (12,8); -0,020 (0,7); -0,0256 (0,3); -0,0263 (0,3); -0,150 (1,3)</p>  |
| 7              | 2,98    | 3,01    | <p>RMN-<sup>1</sup>H (400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):</p> <p><math>\delta</math> = 9,374 (8,4); 9,368 (8,3); 9,117 (11,3); 9,111 (15,3); 9,084 (16,0); 9,078 (11,2); 8,834 (6,6); 8,830 (6,7); 8,822 (6,8); 8,818 (6,5); 8,582 (3,8); 8,577 (5,3); 8,572 (3,6); 8,562 (4,1); 8,557 (5,5); 8,552 (3,5); 8,317 (1,9); 7,969 (6,9); 7,964 (12,0); 7,960 (6,7); 7,857 (5,8); 7,838 (6,5); 7,811 (0,4); 7,693 (5,3); 7,681 (5,2); 7,673 (5,1); 7,661 (4,9); 7,611 (4,5); 7,591 (10,7); 7,572 (7,8); 7,547 (7,4); 7,530 (2,8); 7,527 (3,2); 7,289 (0,4); 6,937 (0,5); 6,925 (0,4); 6,914 (0,4); 5,757 (0,7); 3,744 (3,2); 3,327 (467,3); 2,676 (4,1); 2,671 (5,6); 2,667 (4,1); 2,602 (0,5); 2,524 (15,1); 2,507 (606,6); 2,502 (788,2); 2,498</p>  |
|                |         |         | <p>(575,0); 2,333 (3,8); 2,329 (5,2); 2,325 (3,7); 2,170 (0,5); 1,355 (0,5); 1,277 (0,4); 1,259 (0,5); 1,232 (5,8); 1,154 (0,4); 1,136 (0,6); 1,118 (0,4); 0,853 (0,7); 0,836 (0,4); 0,146 (2,7); 0,082 (0,4); 0,073 (6,2); 0,008 (20,0); 0,000 (579,1); -0,009 (21,1); -0,150 (2,8)</p>  |

ES 2 691 246 T3

(continuación)

| N.º de ejemplo | logP[a] | logP[b] | RMN-1H [ $\sigma$ (ppm)] o bien CL-EM [m/z]  |
|----------------|---------|---------|--|
| 8              | 2,98    | 3,03    | RMN- <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,366 (4,0); 9,362 (3,8); 9,087 (5,4); 9,082 (6,9); 9,044 (7,1); 9,039 (5,5); 8,830 (3,1); 8,826 (3,3); 8,818 (3,2); 8,814 (3,2); 8,574 (1,8); 8,569 (2,5); 8,564 (1,8); 8,554 (1,9); 8,549 (2,6); 8,544 (1,8); 8,321 (3,9); 7,920 (1,0); 7,915 (1,3); 7,909 (7,7); 7,904 (3,1); 7,892 (3,1); 7,887 (9,1); 7,688 (2,5); 7,676 (2,4); 7,668 (2,4); 7,656 (2,3); 7,635 (8,9); 7,613 (7,6); 7,194 (0,5); 7,175 (0,6); 5,758 (0,3); 3,339 (24,8); 2,677 (0,7); 2,673 (1,0); 2,668 (0,7); 2,543 (0,8); 2,508 (100,8); 2,503 (131,2); 2,499 (99,0); 2,335 (0,6); 2,330 (0,9); 2,326 (0,6); 2,183 (0,4); 1,571 (16,0); 1,355 (3,1); 1,231 (0,4); 0,146 (0,6); 0,008 (5,1); 0,000 (130,0); -0,008 (6,4); -0,150 (0,6)   |
| 9              |         | 2,96    | RMN- <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,364 (1,9); 9,360 (1,9); 9,094 (2,7); 9,089 (3,3); 9,046 (3,4); 9,040 (2,7); 8,827 (1,5); 8,823 (1,6); 8,815 (1,6); 8,811 (1,5); 8,570 (0,9); 8,565 (1,1); 8,560 (0,9); 8,550 (1,0); 8,545 (1,2); 8,544 (1,2); 8,540 (0,9); 7,696 (1,5); 7,692 (2,6); 7,687 (2,3); 7,674 (1,2); 7,673 (1,2); 7,666 (1,2); 7,665 (1,1); 7,654 (1,1); 7,653 (1,0); 7,626 (1,1); 7,609 (1,2); 7,606 (1,4); 7,505 (1,2); 7,485 (2,3); 7,466 (1,2); 7,364 (1,3); 7,362 (1,3); 7,344 (1,0); 7,342 (1,0); 3,331 (13,1); 2,586 (16,0); 2,573 (0,8); 2,514 (7,5); 2,510 (14,4); 2,506 (18,7); 2,501 (13,5); 2,497 (6,7)   |
| 10             |         | 3,36    | RMN- <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,369 (4,3); 9,364 (4,5); 9,150 (0,3); 9,087 (5,0); 9,082 (6,4); 9,050 (6,4); 9,044 (5,1); 9,029 (0,4); 8,830 (3,4); 8,826 (3,3); 8,818 (3,6); 8,815 (3,2); 8,575 (1,9); 8,571 (2,7); 8,566 (1,9); 8,555 (2,1); 8,551 (2,8); 8,546 (1,9); 7,871 (0,4); 7,852 (0,5); 7,747 (5,6); 7,690 (2,6); 7,678 (2,7); 7,670 (3,2); 7,668 (3,3); 7,659 (3,8); 7,644 (3,2); 7,566 (0,4); 7,515 (2,3); 7,496 (4,8); 7,476 (2,8); 7,409 (3,3); 7,389 (2,2); 3,331 (74,9); 3,140 (2,4); 3,121 (7,6); 3,103 (7,9); 3,085 (2,7); 2,673 (0,7); 2,508 (86,2); 2,504 (107,9); 2,500 (82,1); 2,335 (0,5); 2,331 (0,7); 2,087 (0,8); 1,312 (7,8); 1,294 (16,0); 1,275 (7,6); 1,259 (1,0); 1,230 (2,9); 1,088 (0,5); 0,867 (0,3); 0,852 (0,6); 0,834 (0,4); 0,147 (0,5); 0,008 (4,7); 0,000 (101,5); -0,149 (0,5) |
| 11             | 3,34    | 3,37    | RMN- <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,362 (3,2); 9,357 (3,1); 9,090 (0,4); 9,080 (5,0); 9,075 (5,8); 9,048 (0,4); 9,017 (6,1); 9,011 (5,1); 8,826 (2,5); 8,822 (2,6); 8,814 (2,6); 8,810 (2,5); 8,569 (1,5); 8,565 (2,0); 8,559 (1,5); 8,549 (1,7); 8,544 (2,1); 8,539 (1,5); 8,317 (0,6); 7,911 (0,4); 7,889 (0,4); 7,829 (6,2); 7,812 (2,2); 7,808 (7,2); 7,688 (1,9); 7,686 (1,9); 7,674   |
|                |         |         | (1,9); 7,666 (1,9); 7,656 (1,8); 7,654 (1,8); 7,637 (0,4); 7,616 (0,3); 7,484 (7,1); 7,463 (6,3); 3,327 (229,5); 3,099 (2,3); 3,081 (7,2); 3,063 (7,4); 3,044 (2,4); 2,676 (1,5); 2,671 (2,1); 2,667 (1,5); 2,663 (0,8); 2,525 (5,5); 2,520 (8,3); 2,511 (107,6); 2,507 (217,5); 2,502 (288,2); 2,498 (211,9); 2,493 (104,2); 2,334 (1,3); 2,329 (1,9); 2,325 (1,3); 1,308 (7,7); 1,290 (16,0); 1,272 (7,5); 1,234 (0,6); 0,146 (1,8); 0,008 (13,1); 0,000 (372,2); -0,009 (13,9); -0,150 (1,7)  |

ES 2 691 246 T3

(continuación)

| N.º de ejemplo | logP[a] | logP[b] | RMN-1H [ $\sigma$ (ppm)] o bien CL-EM [m/z]  |
|----------------|---------|---------|--|
| 12             | 1,58    | 1,86    | RMN- <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,375 (4,2); 9,370 (4,2); 9,145 (5,6); 9,140 (7,4); 9,107 (7,5); 9,102 (5,8); 8,835 (3,1); 8,831 (3,4); 8,823 (3,3); 8,819 (3,4); 8,583 (1,8); 8,577 (2,5); 8,573 (1,9); 8,563 (2,0); 8,557 (2,7); 8,553 (1,9); 8,084 (7,3); 8,063 (8,9); 7,824 (8,7); 7,803 (7,7); 7,693 (2,4); 7,681 (2,4); 7,673 (2,4); 7,661 (2,3); 5,759 (0,4); 4,039 (0,3); 4,021 (0,3); 3,331 (69,7); 3,154 (0,5); 3,135 (1,8); 3,117 (2,1); 3,101 (2,4); 3,083 (2,2); 3,065 (0,7); 2,887 (0,6); 2,868 (2,2); 2,850 (2,5); 2,834 (2,0); 2,816 (1,8); 2,798 (0,5); 2,677 (0,6); 2,673 (0,8); 2,668 (0,6); 2,545 (0,5); 2,540 (0,6); 2,526 (2,3); 2,508 (95,9); 2,503 (127,4); 2,499 (95,8); 2,335 (0,6); 2,330 (0,8); 2,326 (0,6); 1,230 (0,4); 1,182 (0,7); 1,166 (1,1); 1,151 (0,6); 1,096 (7,4); 1,078 (16,0); 1,059 (7,2); 0,000 (3,6)  |
| 13             | 1,85    | 1,85    | RMN- <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,385 (4,0); 9,379 (4,3); 9,174 (3,9); 9,168 (7,7); 9,158 (8,0); 9,152 (4,2); 9,142 (0,9); 9,111 (0,8); 9,105 (0,6); 8,853 (0,6); 8,841 (2,9); 8,837 (3,3); 8,829 (3,1); 8,825 (3,3); 8,594 (1,6); 8,589 (2,4); 8,584 (1,9); 8,574 (1,8); 8,568 (2,6); 8,564 (1,9); 8,317 (1,3); 8,167 (5,9); 8,146 (9,0); 8,085 (1,0); 8,060 (9,1); 8,039 (6,1); 7,824 (1,0); 7,804 (0,8); 7,698 (2,4); 7,686 (2,3); 7,678 (2,4); 7,666 (2,3); 5,757 (0,7); 4,037 (0,8); 4,021 (0,8); 3,413 (2,2); 3,395 (6,9); 3,377 (7,2); 3,358 (3,3); 3,329 (568,0); 3,293 (2,4); 2,675 (2,8); 2,671 (3,9); 2,667 (3,0); 2,545 (0,9); 2,540 (1,0); 2,524 (11,0); 2,506 (445,4); 2,502 (589,5); 2,498 (444,2); 2,467 (4,1); 2,430 (1,1); 2,422 (0,5); 2,371 (0,9); 2,333 (2,9); 2,329 (3,9); 2,324 (3,0); 1,232 (1,3); 1,173 (8,4); 1,154 (16,0); 1,136 (7,0); 1,095 (0,9); 1,077 (1,8); 1,059 (0,8); 0,007 (0,5); 0,000 (14,8)   |
| 14             | 3,12    | 3,13    | RMN- <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,364 (3,7); 9,359 (3,7); 8,834 (2,8); 8,831 (3,0); 8,823 (3,0); 8,819 (2,9); 8,742 (4,8); 8,736 (6,6); 8,713 (6,5); 8,707 (4,7); 8,572 (1,6); 8,568 (2,3); 8,563 (1,6); 8,553 (1,8); 8,548 (2,4); 8,543 (1,6); 8,317 (0,4); 8,070 (6,5); 7,695 (2,2); 7,683 (2,2); 7,675 (2,1); 7,663 (2,0); 7,540 (2,1); 7,522 (3,9); 7,520 (3,9); 7,493 (1,8); 7,488 (1,9); 7,475 (2,3); 7,471 (2,7); 7,455 (1,1); 7,451 (1,4); 7,414 (1,8); 7,410 (2,1); 7,395 (4,0); 7,391 (3,4); 7,365 (3,2); 7,362 (3,2); 7,345 (4,2); 7,328 (2,3); 7,325 (2,4); 7,315 (0,8); 7,311 (0,7); 7,297 (0,9); 7,294 (0,9); 7,278 (0,4); 7,274 (0,4); 7,177 (0,6); 7,174 (0,7); 7,159 (1,0);  |
|                |         |         | 7,156 (1,0); 7,141 (0,4); 7,138 (0,4); 4,038 (0,5); 4,020 (0,6); 3,568 (0,4); 3,328 (165,3); 2,936 (2,2); 2,918 (7,2); 2,904 (3,7); 2,900 (7,5); 2,886 (3,1); 2,882 (2,7); 2,868 (0,9); 2,676 (1,1); 2,671 (1,5); 2,667 (1,1); 2,524 (4,1); 2,507 (166,9); 2,502 (217,8); 2,498 (164,7); 2,334 (1,1); 2,329 (1,5); 2,325 (1,1); 1,989 (2,2); 1,242 (0,4); 1,234 (0,3); 1,212 (2,8); 1,194 (6,2); 1,186 (7,9); 1,175 (4,5); 1,167 (16,0); 1,157 (1,3); 1,149 (7,4); 0,000 (0,5)   |
| 15             | 1,58    | 1,59    | RMN- <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,374 (4,2); 9,370 (4,3); 8,866 (6,3); 8,860 (7,5); 8,843 (3,2); 8,839 (3,5); 8,831 (3,4); 8,827 (3,5); 8,805 (7,3); 8,800 (6,2); 8,585 (1,8); 8,580 (2,5); 8,575 (1,9); 8,565 (2,0); 8,559 (2,7); 8,555 (1,9); 8,318 (0,3); 8,006 (2,9); 8,003 (3,1); 7,987 (3,4); 7,984 (3,5); 7,799 (1,4); 7,795 (1,5); 7,780 (3,2); 7,777 (3,2); 7,761 (2,2); 7,757 (2,2); 7,740 (2,0); 7,736 (2,1); 7,721 (3,3); 7,718 (3,4); 7,701 (3,5); 7,699 (3,7); 7,688 (2,4); 7,681 (2,3); 7,669 (2,2); 7,667 (2,2); 7,571 (3,6); 7,569 (3,6); 7,553 (3,0); 7,550 (2,9); 5,758 (1,5); 3,332 (197,0); 2,783 (0,5); 2,764 (1,8); 2,746 (2,1); 2,731 (2,4); 2,712 (2,2); 2,694 (0,7); 2,677 (0,8); 2,672 (1,0); 2,668 (0,8); 2,542 (0,6); 2,525 (2,5); 2,508 (116,7); 2,503 (153,0); 2,499 (113,2); 2,444 (0,7); 2,426 (2,1); 2,408 (2,4); 2,392 (2,1); 2,374 (1,8); 2,355 (0,6); 2,334 (0,7); 2,330 (1,0); 2,325 (0,8); 0,905 (7,4); 0,887 (16,0); 0,869 (7,1); 0,000 (6,3) |

ES 2 691 246 T3

(continuación)

| N.º de ejemplo | logP[a] | logP[b] | RMN-1H [ $\sigma$ (ppm)] o bien CL-EM [m/z]  |
|----------------|---------|---------|--|
| 16             | 1,86    | 1,87    | <p>RMN-<sup>1</sup>H (400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):</p> <p><math>\delta</math> = 9,371 (4,2); 9,365 (4,1); 8,840 (3,2); 8,836 (3,3); 8,828 (3,3); 8,824 (3,3); 8,764 (5,8); 8,759 (7,2); 8,719 (7,0); 8,713 (5,7); 8,580 (1,8); 8,575 (2,5); 8,571 (1,9); 8,561 (1,9); 8,555 (2,6); 8,551 (1,8); 8,318 (1,8); 8,132 (3,1); 8,115 (3,4); 8,112 (3,4); 7,889 (1,6); 7,873 (3,3); 7,870 (3,3); 7,854 (2,3); 7,851 (2,2); 7,815 (2,1); 7,812 (2,5); 7,795 (3,0); 7,792 (3,1); 7,776 (1,3); 7,773 (1,3); 7,699 (2,5); 7,686 (2,5); 7,679 (2,5); 7,666 (2,4); 7,627 (0,5); 7,601 (3,6); 7,598 (3,7); 7,583 (3,2); 7,580 (3,1); 5,757 (1,7); 4,040 (0,5); 4,022 (0,5); 3,376 (0,5); 3,327 (653,5); 3,012 (2,1); 2,993 (7,0); 2,975 (7,2); 2,957 (2,2); 2,675 (4,7); 2,671 (6,3); 2,667 (4,8); 2,623 (0,3); 2,524 (17,2); 2,510 (380,2); 2,506 (748,3); 2,502 (973,4); 2,497 (719,5); 2,372 (0,3); 2,333 (4,7); 2,328 (6,4); 2,324 (4,8); 2,299 (0,4); 2,206 (0,3); 1,355 (0,3); 1,234 (1,4); 1,165 (1,7); 1,026 (7,4); 1,008 (16,0); 0,989 (7,2); 0,146 (17,1); 0,096 (0,3); 0,086 (0,7); 0,070 (0,7); 0,058 (1,2); 0,047 (1,5); 0,007 (153,7); 0,000 (3211,2); -0,009 (157,6); -0,068 (0,9); -0,075 (0,9); -0,095 (0,6); -0,121 (0,4); -0,150 (16,9)</p> |
| 17             | 3,74    | 3,68    | <p>RMN-<sup>1</sup>H (400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):</p> <p><math>\delta</math> = 9,366 (3,2); 9,361 (3,2); 9,360 (3,1); 9,125 (4,6); 9,120 (5,3); 9,042 (5,4); 9,036 (4,8); 8,827 (2,5); 8,823 (2,8); 8,815 (2,7); 8,811 (2,8); 8,570 (1,4); 8,566 (1,9); 8,561 (1,5); 8,550 (1,6); 8,545 (2,1); 8,541 (1,5); 7,975 (3,8); 7,971 (4,0); 7,693 (2,0); 7,687 (3,0); 7,673 (4,1); 7,668 (3,2); 7,654 (1,8); 7,653 (1,8); 7,443 (3,2); 7,423</p>   |
|                |         |         | <p>(2,8); 4,223 (1,3); 4,197 (4,1); 4,171 (4,3); 4,145 (1,5); 3,333 (12,5); 2,528 (0,7); 2,515 (13,7); 2,510 (27,0); 2,506 (35,7); 2,502 (27,0); 2,428 (16,0); 0,008 (1,8); 0,000 (45,7); -0,008 (2,1)</p>   |
| 18             | 2,4     | 2,34    | <p>RMN-<sup>1</sup>H (400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):</p> <p><math>\delta</math> = 9,378 (2,7); 9,373 (2,8); 9,196 (0,3); 9,191 (0,4); 9,168 (3,5); 9,162 (4,8); 9,153 (0,5); 9,133 (4,7); 9,127 (3,6); 8,921 (0,3); 8,834 (2,1); 8,830 (2,3); 8,822 (2,2); 8,818 (2,3); 8,753 (0,3); 8,749 (0,4); 8,584 (1,2); 8,579 (1,7); 8,574 (1,3); 8,564 (1,3); 8,558 (1,8); 8,554 (1,4); 8,317 (0,6); 8,295 (3,7); 8,290 (3,9); 8,150 (1,8); 8,024 (1,8); 8,020 (1,8); 8,004 (2,0); 8,000 (2,0); 7,693 (1,7); 7,681 (1,7); 7,674 (1,8); 7,660 (1,7); 7,562 (2,8); 7,542 (2,5); 4,256 (1,0); 4,229 (3,2); 4,202 (3,3); 4,174 (1,1); 3,328 (135,7); 2,738 (0,4); 2,676 (1,4); 2,671 (2,0); 2,667 (1,5); 2,525 (5,7); 2,507 (215,8); 2,502 (284,3); 2,498 (216,6); 2,470 (16,0); 2,429 (0,3); 2,417 (0,9); 2,333 (1,4); 2,329 (1,9); 2,325 (1,5); 2,275 (0,8); 1,754 (2,0); 1,351 (0,7); 1,230 (1,0); 0,146 (1,1); 0,008 (9,5); 0,000 (247,0); -0,008 (11,8); -0,150 (1,2)</p>  |
| 19             | 3,97    | 3,95    | <p>RMN-<sup>1</sup>H (400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):</p> <p><math>\delta</math> = 9,370 (2,7); 9,366 (2,7); 9,365 (2,7); 8,834 (2,3); 8,830 (2,5); 8,822 (2,4); 8,818 (2,5); 8,759 (2,5); 8,753 (8,0); 8,749 (7,8); 8,744 (2,3); 8,578 (1,3); 8,574 (1,7); 8,568 (1,3); 8,558 (1,4); 8,553 (1,8); 8,548 (1,3); 8,318 (0,3); 7,694 (1,6); 7,693 (1,6); 7,682 (1,6); 7,681 (1,6); 7,674 (1,6); 7,673 (1,6); 7,662 (1,5); 7,661 (1,5); 7,536 (5,9); 7,297 (4,6); 4,035 (1,2); 4,009 (3,8); 3,982 (4,0); 3,956 (1,4); 3,328 (100,9); 2,676 (0,7); 2,672 (0,9); 2,667 (0,7); 2,525 (2,7); 2,520 (3,9); 2,512 (49,4); 2,507 (100,6); 2,503 (133,6); 2,498 (97,4); 2,494 (47,0); 2,418 (14,4); 2,334 (0,6); 2,329 (0,9); 2,325 (0,6); 2,275 (16,0); 1,233 (0,4); 0,146 (0,8); 0,019 (0,4); 0,008 (6,1); 0,000 (176,8); -0,009 (6,0); -0,150 (0,8)</p>  |

ES 2 691 246 T3

(continuación)

| N.º de ejemplo | logP[a] | logP[b] | RMN-1H [ $\sigma$ (ppm)] o bien CL-EM [m/z]  |
|----------------|---------|---------|--|
| 20             | 2,54    | 2,52    | RMN- <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,379 (3,2); 9,374 (3,0); 8,830 (7,8); 8,825 (9,1); 8,586 (1,4); 8,581 (1,9); 8,577 (1,3); 8,566 (1,5); 8,561 (2,0); 8,557 (1,3); 8,317 (0,5); 8,145 (0,6); 7,820 (6,5); 7,697 (1,8); 7,685 (1,8); 7,676 (1,8); 7,664 (1,7); 7,400 (4,8); 5,758 (2,3); 4,197 (1,1); 4,170 (3,3); 4,142 (3,5); 4,115 (1,2); 3,366 (0,8); 3,329 (136,7); 2,891 (0,7); 2,731 (0,6); 2,695 (0,4); 2,676 (1,3); 2,671 (1,7); 2,667 (1,3); 2,539 (1,9); 2,507 (193,1); 2,502 (244,6); 2,498 (184,8); 2,431 (15,1); 2,398 (0,8); 2,378 (16,0); 2,334 (1,3); 2,329 (1,7); 2,325 (1,3); 1,234 (1,0); 1,165 (1,0); 1,150 (0,6); 0,000 (6,2)   |
| 21             | 1,91    | 1,86    | RMN- <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 8,927 (4,0); 8,861 (2,0); 8,854 (9,9); 8,848 (2,3); 8,841 (0,8); 8,830 (0,4); 8,814 (0,3); 8,690 (0,3); 8,466 (2,0); 8,448 (2,1); 8,317 (1,3); 8,148 (0,5); 8,104 (2,1); 8,084 (2,3); 7,846 (0,5); 7,818 (7,0); 7,680 (2,2); 7,663 (2,3); 7,660 (2,3); 7,643 (1,9); 7,555 (0,4); 7,401 (4,8);   |
|                |         |         | 7,383 (0,3); 5,757 (2,2); 4,194 (1,1); 4,167 (3,4); 4,140 (3,6); 4,113 (1,2); 4,037 (0,4); 4,020 (0,4); 3,428 (0,3); 3,416 (0,4); 3,402 (0,5); 3,368 (1,5); 3,330 (615,1); 3,294 (2,0); 2,891 (1,5); 2,731 (1,3); 2,695 (1,2); 2,676 (2,8); 2,671 (3,9); 2,667 (3,0); 2,545 (2,0); 2,540 (2,2); 2,524 (10,1); 2,507 (425,8); 2,502 (566,6); 2,498 (425,9); 2,430 (14,9); 2,392 (2,1); 2,372 (16,0); 2,333 (2,6); 2,329 (3,6); 2,324 (2,8); 1,234 (2,2); 1,165 (1,4); 1,149 (0,8); 0,853 (0,4); 0,008 (0,5); 0,000 (15,0); - 0,008 (0,7)  |
| 22             | 3,83    | 3,78    | RMN- <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,375 (3,0); 9,370 (3,0); 8,953 (9,2); 8,950 (9,1); 8,836 (2,4); 8,833 (2,6); 8,824 (2,6); 8,821 (2,7); 8,583 (1,3); 8,578 (1,8); 8,573 (1,4); 8,563 (1,5); 8,558 (2,0); 8,553 (1,4); 7,902 (3,1); 7,882 (3,1); 7,693 (1,8); 7,681 (1,8); 7,673 (1,8); 7,663 (1,7); 7,661 (1,8); 7,422 (2,7); 7,393 (2,7); 5,758 (0,6); 4,114 (1,3); 4,088 (4,0); 4,062 (4,2); 4,036 (1,5); 3,328 (42,3); 2,677 (0,5); 2,673 (0,6); 2,668 (0,5); 2,526 (1,6); 2,521 (2,5); 2,512 (35,8); 2,508 (72,9); 2,503 (97,3); 2,499 (72,8); 2,495 (36,8); 2,468 (16,0); 2,403 (0,5); 2,335 (0,5); 2,330 (0,7); 2,326 (0,5); 2,076 (1,5); 0,146 (0,5); 0,008 (3,9); 0,000 (116,1); - 0,009 (4,6); -0,150 (0,5)  |
| 23             | 2,5     | 2,46    | RMN- <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,383 (12,6); 9,378 (12,3); 9,036 (15,7); 9,033 (14,8); 9,022 (12,3); 9,018 (16,0); 9,013 (7,6); 8,841 (9,7); 8,837 (10,6); 8,829 (10,1); 8,825 (10,6); 8,590 (5,6); 8,586 (7,4); 8,581 (5,7); 8,570 (6,1); 8,565 (8,1); 8,560 (5,8); 8,317 (1,4); 8,159 (13,2); 8,139 (13,3); 7,697 (7,3); 7,685 (7,1); 7,679 (6,9); 7,677 (7,0); 7,667 (6,7); 7,665 (6,9); 7,644 (0,6); 7,627 (0,8); 7,624 (0,8); 7,615 (0,7); 7,597 (0,8); 7,575 (0,6); 7,567 (0,7); 7,538 (10,5); 7,509 (10,2); 5,758 (3,5); 4,329 (0,4); 4,302 (1,4); 4,293 (2,2); 4,276 (2,8); 4,266 (7,1); 4,253 (6,9); 4,239 (7,4); 4,225 (7,4); 4,212 (2,8); 4,198 (2,7); 4,189 (1,6); 4,161 (0,5); 4,056 (1,0); 4,038 (2,9); 4,020 (3,0); 4,002 (1,0); 3,827 (0,4); 3,812 (0,5); 3,640 (0,6); 3,407 (0,3); 3,392 (0,7); 3,334 (1093,5); 3,268 (0,5); 3,175 (0,4); 3,162 (0,4); 2,677 (2,9); 2,672 (4,1); 2,668 (2,9); 2,645 (0,3); 2,525 (11,2); 2,512 (231,5); 2,508 (469,6); 2,503 (621,0); 2,499 (458,4); 2,494 (229,3); 2,485 (73,3); 2,434 (0,9); 2,410 (0,6); 2,388 (0,5); 2,372 (0,6); 2,334 (3,1); 2,330 (4,2); 2,325 (3,3); 1,990 (12,4); 1,909 (1,8); 1,298 (1,4); 1,259 (2,1); 1,233 (5,3); 1,193 (3,5); 1,175 (6,8); 1,157 (3,4); 0,853 (0,8); 0,836 (0,4); 0,146 (0,7); 0,008 (6,1); 0,000 (167,9); -0,008 (6,2); -0,150 (0,8) |

ES 2 691 246 T3

(continuación)

| N.º de ejemplo | logP[a] | logP[b] | RMN-1H [ $\sigma$ (ppm)] o bien CL-EM [m/z]  |
|----------------|---------|---------|--|
| 24             | 2,25    | 2,27    | RMN- <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,251 (8,5); 9,247 (8,3); 9,245 (8,3); 8,790 (13,0); 8,758 (6,7); 8,754 (7,6); 8,746 (7,2); 8,742 (7,6); 8,465 (13,4); 8,458 (14,8); 8,445 (4,0); 8,441 (5,3); 8,439 (5,2); 8,435 (4,1); 8,425 (4,3); 8,419 (5,7); 8,415 (4,2); 8,326 (14,2); 8,319 (13,4); 7,637 (4,9); 7,635 (5,3);   |
|                |         |         | 7,623 (5,2); 7,617 (4,8); 7,615 (5,1); 7,605 (4,7); 7,603 (5,0); 7,350 (6,7); 7,329 (13,8); 7,310 (11,1); 7,231 (16,0); 7,212 (10,7); 6,980 (4,4); 6,962 (7,8); 6,943 (3,7); 3,326 (508,1); 2,731 (0,3); 2,676 (4,4); 2,671 (6,2); 2,667 (4,7); 2,524 (15,3); 2,520 (23,1); 2,511 (313,8); 2,507 (651,6); 2,502 (883,9); 2,498 (671,9); 2,494 (345,0); 2,447 (0,7); 2,431 (0,5); 2,338 (2,0); 2,333 (4,3); 2,329 (6,0); 2,324 (4,5); 1,055 (0,4); 0,146 (3,4); 0,032 (0,4); 0,008 (25,2); 0,000 (779,5); -0,009 (30,2); -0,150 (3,4)   |
| 25             | 2,66    | 2,69    | RMN- <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,269 (6,7); 9,264 (6,8); 8,962 (11,3); 8,772 (5,4); 8,768 (5,9); 8,760 (5,8); 8,756 (5,9); 8,483 (9,8); 8,476 (13,1); 8,465 (3,5); 8,461 (4,5); 8,456 (3,4); 8,445 (3,7); 8,440 (5,6); 8,436 (16,0); 8,429 (10,0); 8,317 (1,2); 7,647 (4,3); 7,646 (4,3); 7,635 (4,1); 7,627 (4,1); 7,626 (4,1); 7,615 (4,0); 7,614 (3,9); 7,356 (0,3); 7,339 (4,5); 7,319 (9,7); 7,299 (6,0); 7,189 (4,3); 7,184 (10,1); 7,179 (7,2); 7,170 (5,9); 7,150 (4,0); 7,146 (3,3); 6,967 (4,5); 6,964 (4,4); 6,947 (3,9); 6,944 (4,1); 5,757 (0,5); 3,326 (236,5); 2,891 (1,4); 2,732 (1,2); 2,680 (1,3); 2,676 (2,6); 2,671 (3,6); 2,667 (2,7); 2,662 (1,3); 2,525 (8,9); 2,520 (13,4); 2,511 (186,4); 2,507 (384,3); 2,502 (519,2); 2,498 (389,2); 2,493 (195,6); 2,338 (1,2); 2,333 (2,5); 2,329 (3,5); 2,325 (2,6); 2,086 (4,0); 2,075 (1,1); 0,146 (2,0); 0,008 (14,5); 0,000 (450,0); -0,009 (17,3); -0,150 (2,0)   |
| 26             |         | 1,62    | RMN- <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 11,160 (0,7); 10,721 (0,7); 9,345 (14,2); 9,294 (15,7); 9,162 (14,9); 8,822 (10,6); 8,814 (10,8); 8,761 (0,5); 8,697 (15,8); 8,551 (8,4); 8,531 (8,8); 8,475 (0,5); 8,429 (0,4); 7,894 (16,0); 7,799 (0,4); 7,684 (7,1); 7,667 (8,7); 7,654 (6,8); 7,235 (0,5); 7,220 (0,4); 7,216 (0,4); 6,673 (14,6); 5,935 (0,7); 4,134 (0,5); 3,391 (0,6); 3,326 (63,2); 2,671 (2,1); 2,503 (265,8); 2,329 (2,3); 2,283 (0,7); 2,265 (0,6); 2,244 (0,5); 2,234 (0,5); 2,209 (0,4); 2,205 (0,4); 2,178 (0,4); 2,160 (0,4); 2,155 (0,4); 2,141 (0,4); 2,087 (4,1); 2,058 (0,6); 2,044 (0,4); 1,983 (0,7); 1,926 (0,4); 1,907 (0,5); 1,886 (0,4); 1,870 (0,4); 1,852 (0,4); 1,821 (0,4); 1,743 (1,2); 1,678 (0,5); 1,671 (0,5); 1,625 (1,4); 1,532 (0,7); 1,511 (0,7); 1,463 (0,6); 1,453 (0,6); 1,433 (0,6); 1,416 (0,6); 1,367 (0,9); 1,349 (1,1); 1,297 (3,4); 1,257 (4,8); 1,230 (8,0); 1,171 (2,8); 1,146 (4,1); 1,136 (4,0); 1,088 (1,2); 1,065 (1,0); 1,042 (0,9); 1,036 (0,9); 0,981 (0,6); 0,943 (0,6); 0,928 (0,7); 0,863 (3,1); 0,755 (0,5); 0,724 (0,4); 0,701 (0,4); 0,145 (0,9); 0,123 (0,4); 0,105 (0,5); 0,095 (0,6); -0,001 (131,7); -0,150 (1,2); -0,190 (0,4); -0,201 (0,4) |
| 27             |         | 2,57    | RMN- <sup>1</sup> H (601,6 MHz, CD <sub>3</sub> CN):<br>$\delta$ = 9,373 (4,7); 9,355 (0,8); 9,156 (8,3); 9,151 (8,5); 8,877 (8,9); 8,873 (8,7); 8,789 (3,3); 8,782 (3,4); 8,734 (0,6); 8,729 (0,6); 8,511 (2,6); 8,508 (3,8); 8,505 (2,6); 8,498 (3,3); 8,495 (3,9); 8,492 (3,0); 8,488 (1,3); 8,485  |
|                |         |         | (1,1); 8,476 (0,6); 8,385 (5,8); 8,383 (5,8); 7,585 (3,2); 7,577 (3,3); 7,572 (3,3); 7,564 (3,3); 7,545 (0,5); 7,466 (0,6); 7,452 (1,5); 7,446 (0,9); 7,441 (0,7); 7,433 (0,7); 7,238 (0,5); 7,234 (0,4); 7,224 (0,4); 7,220 (0,4); 6,953 (6,6); 6,949 (6,5); 5,448 (0,7); 2,828 (1,2); 2,748 (0,6); 2,575 (2,2); 2,563 (2,3); 2,501 (0,5); 2,172 (9,1); 2,107 (5,6); 2,087 (3,1); 2,076 (2,7); 2,059 (3,2); 2,055 (4,1); 2,051 (5,1); 2,047 (3,9); 2,043 (2,7); 1,965 (67,2); 1,957 (37,4); 1,952 (51,3); 1,949 (253,4); 1,945 (433,6); 1,940 (624,6); 1,936 (441,3); 1,932 (228,3); 1,916 (4,5); 1,883 (1,7); 1,850 (1,1); 1,842 (1,1); 1,834 (2,0); 1,830 (3,1); 1,826 (4,2); 1,822 (3,0); 1,818 (1,8); 1,567 (0,5); 1,434 (0,5); 1,340 (13,1); 1,319 (2,0); 1,308 (2,5); 1,298 (2,3); 1,285 (16,0); 1,269 (9,4); 1,248 (1,2); 1,227 (1,0); 1,217 (1,0); 1,206 (1,0);   |

ES 2 691 246 T3

(continuación)

| N.º de ejemplo | logP[a] | logP[b] | RMN-1H [ $\sigma$ (ppm)] o bien CL-EM [m/z]   |
|----------------|---------|---------|---|
|                |         |         | 1,184 (1,3); 1,173 (1,2); 1,153 (0,8); 1,134 (0,8); 1,112 (0,7); 1,083 (0,8); 1,071 (0,7); 1,048 (0,6); 1,038 (0,6); 1,022 (4,4); 1,010 (8,3); 0,999 (4,3); 0,914 (0,7); 0,893 (1,2); 0,882 (2,1); 0,870 (1,5); 0,844 (1,3); 0,000 (2,8)  |
| 28             | 2,48    | 2,53    | RMN- <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,366(16,0); 9,362(16,0); 9,356(13,8); 9,312(12,2); 9,306(15,8); 9,302(7,3); 9,288(2,1); 9,238(13,8); 9,232(14,5); 9,214(1,9); 8,836(6,5); 8,832(8,2); 8,824(8,0); 8,820(8,7); 8,569(4,3); 8,564(6,1); 8,560(6,2); 8,550(5,7); 8,544(7,2); 8,540(6,6); 8,370(14,4); 8,352(2,5); 8,238(1,2); 8,166(1,1); 7,690(4,8); 7,678(5,4); 7,673(6,7); 7,660(5,3); 7,659(5,1); 7,642(1,0); 3,320(121,7); 3,303(20,7); 2,676(1,3); 2,671(1,7); 2,667(1,6); 2,507(200,6); 2,502(274,7); 2,498(253,0); 2,494(174,9); 2,329(1,6); 2,325(1,5); 2,075(1,5); 2,071(0,7); - 0,001(54,0); - 0,005(24,7); -0,019(6,3)                         |
| 29             | 1,00    | 1,07    | RMN- <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,331(1,1); 8,822(1,1); 8,762(4,6); 8,727(6,8); 8,533(1,6); 8,513(1,6); 7,678(1,1); 7,665(1,2); 7,658(1,2); 7,646(1,1); 3,683(16,0); 3,330(24,3); 2,678(0,4); 2,509(58,9); 2,337(0,4); 2,081(0,8)  |
| 30             | 1,23    | 1,42    | RMN- <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,336(0,6); 9,317(2,7); 9,310(3,0); 9,307(3,9); 9,300(3,8); 9,119(3,3); 9,113(3,3); 8,808(2,1); 8,800(2,2); 8,796(2,0); 8,712(0,4); 8,543(0,4); 8,522(1,4); 8,518(1,8); 8,512(1,4); 8,502(1,4); 8,497(1,6); 8,493(1,2); 7,673(1,3); 7,661(1,6); 7,655(1,5); 7,643(1,3); 3,556(0,4); 3,322(46,2); 3,255(17,4); 3,177(1,4); 3,141(0,4); 3,127(0,6); 3,122(0,5); 3,076(0,3); 3,060(2,0); 2,755(0,3); 2,736(0,4); 2,728(0,5); 2,670(2,4); 2,666(2,1); 2,505(269,8); 2,501(349,1); 2,497(274,9); 2,356(0,9); 2,338(16,0); 2,250(1,0); 2,227(0,7); 2,119(1,8); 1,234(0,5); 0,883(0,4); 0,000(50,2)                             |
| 31             | 0,97    | 1,21    | RMN- <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,318(0,6); 8,816(0,4); 8,806(0,4); 8,701(0,7); 8,695(1,0); 8,668(0,9); 8,662(0,8); 8,524(0,4); 8,504(0,4); 7,669(0,4); 7,657(0,4); 7,649(0,4); 3,557(4,4); 3,387(0,7); 3,319(4,7); 2,506(37,0); 2,501(51,1); 2,497(42,5); 2,406(4,4); 2,328(0,3); 2,291(0,5); 1,158(2,3); 1,069(16,0); 0,000(7,1); - 0,002(4,9)   |
| 32             | 1,15    | 1,25    | RMN- <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,347(1,8); 9,341(1,9); 8,830(1,2); 8,826(1,4); 8,815(4,1); 8,809(3,9); 8,757(3,5); 8,750(2,9); 8,559(0,8); 8,554(1,1); 8,549(0,9); 8,539(0,9); 8,533(1,2); 8,529(0,9); 7,690(1,0); 7,678(1,0); 7,671(1,0); 7,658(1,0); 5,747(0,8); 3,882(0,5); 3,601(0,5); 3,415(879,7); 3,409(917,4); 3,297(0,8); 3,274(0,7); 3,238(0,4); 3,221(0,3); 3,213(0,4); 3,123(16,0); 3,099(0,4); 3,038(15,3); 3,018(0,3); 3,007(0,4); 2,977(0,3); 2,969(0,5); 2,683(0,8); 2,679(1,0); 2,674(0,7); 2,532(2,0); 2,527(3,1); 2,519(55,9); 2,514(120,3); 2,510(163,2); 2,505(117,1); 2,501(55,4); 2,345(0,4); 2,341(0,7); 2,336(1,0); 2,332(0,7) |
| 33             | 2,21    | 2,21    | RMN- <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,318(2,6); 9,313(2,6); 9,253(3,4); 9,247(3,7); 9,067(3,8); 9,061(3,5); 8,811(1,7); 8,807(1,9); 8,799(1,8); 8,795(1,9); 8,520(1,0); 8,515(1,4); 8,511(1,0); 8,501(1,0); 8,495(1,5); 8,491(1,0); 7,672(1,4); 7,660(1,3); 7,652(1,3); 7,640(1,3); 5,240(1,2); 5,218(3,7); 5,197(3,9); 5,175(1,3); 3,316(54,1); 3,189(16,0); 2,891(0,8); 2,732(0,7); 2,675(0,4); 2,671(0,6); 2,667(0,5); 2,506(74,0); 2,502(103,4); 2,497(79,9); 2,333(0,5); 2,328(0,6); 2,324(0,5); 0,146(0,3); 0,008(3,0); 0,000(70,0); - 0,008(3,0); -0,150(0,3)   |

ES 2 691 246 T3

(continuación)

| N.º de ejemplo | logP[a] | logP[b] | RMN-1H [ $\sigma$ (ppm)] o bien CL-EM [m/z]  |
|----------------|---------|---------|--|
| 34             | 1,84    | 1,87    | RMN- <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,317(1,4); 9,313(1,4); 9,306(3,1); 9,300(3,1); 9,110(3,2); 9,103(3,0); 8,807(1,0); 8,798(1,0); 8,521(0,8); 8,516(1,0); 8,511(0,8); 8,501(0,8); 8,495(1,1); 8,491(0,8); 7,670(0,9); 7,658(1,0); 7,650(0,9); 7,638(0,9); 3,319(6,7); 3,264(0,5); 3,225(13,6); 3,000(0,4); 2,689(16,0); 2,676(0,4); 2,671(0,5); 2,667(0,3); 2,525(1,0); 2,511(22,4); 2,507(47,2); 2,502(66,0); 2,498(49,3); 2,493(23,7); 2,455(0,5); 2,329(0,4); 0,008(1,0); 0,000(31,8); - 0,008(1,1)  |
| 35             | 2,17    | 2,25    | RMN- <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,322(2,0); 9,318(1,9); 9,301(3,2); 9,294(3,3); 9,113(3,3); 9,106(3,1); 8,822(0,4); 8,810(1,4); 8,801(1,4); 8,798(1,3); 8,526(0,9); 8,522(1,3); 8,517(0,9); 8,506(1,0); 8,501(1,3); 8,497(0,9); 7,674(1,2); 7,662(1,2); 7,654(1,2); 7,642(1,1);   |
|                |         |         | 5,756(3,9); 3,318(65,6); 3,275(1,4); 3,257(4,1); 3,239(4,4); 3,225(16,0); 2,675(0,5); 2,671(0,6); 2,666(0,5); 2,510(41,1); 2,506(81,7); 2,502(107,0); 2,497(77,1); 2,493(37,4); 2,333(0,5); 2,329(0,6); 2,324(0,5); 1,445(4,6); 1,426(9,6); 1,408(4,5); 0,008(2,9); 0,000(67,0); -0,008(2,7)   |
| 36             |         |         | RMN- <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,328(4,1); 9,324(3,8); 9,322(4,0); 9,305(6,7); 9,299(7,1); 9,146(7,1); 9,140(6,6); 8,817(3,0); 8,813(3,3); 8,805(3,2); 8,801(3,3); 8,533(1,7); 8,528(2,2); 8,523(1,7); 8,513(1,9); 8,508(2,4); 8,503(1,7); 8,314(0,3); 7,676(2,2); 7,664(2,1); 7,657(1,9); 7,656(2,1); 7,645(1,9); 7,644(2,1); 4,309(1,5); 4,283(4,7); 4,258(4,9); 4,232(1,7); 3,923(2,2); 3,318(93,5); 3,297(28,7); 2,676(0,6); 2,671(0,8); 2,667(0,6); 2,525(2,0); 2,520(3,0); 2,511(45,6); 2,507(96,4); 2,502(135,1); 2,498(100,4); 2,493(47,8); 2,334(0,6); 2,329(0,8); 2,325(0,6); 1,481(0,4); 1,159(0,4); 1,069(16,0); 0,783(0,4); 0,008(0,8); 0,000(27,0); -0,009(0,8)  |
| 37             | 1,69    | 1,79    | RMN- <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,325(0,9); 9,296(3,0); 9,290(3,1); 9,113(3,7); 9,107(3,5); 8,815(0,8); 8,523(1,3); 8,502(1,3); 7,677(0,9); 7,664(1,0); 7,657(1,0); 7,645(0,9); 3,840(8,3); 3,328(15,5); 3,318(69,4); 2,671(0,6); 2,506(74,1); 2,502(100,0); 2,497(77,7); 2,333(0,5); 2,329(0,6); 2,135(16,0); 2,075(0,7); 0,000(29,6)  |
| 38             | 1,1     | 1,15    | RMN- <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,346(2,1); 9,342(2,2); 8,828(1,5); 8,824(1,8); 8,815(2,0); 8,812(4,5); 8,806(4,1); 8,765(4,1); 8,759(3,2); 8,556(0,9); 8,551(1,1); 8,547(1,0); 8,536(1,1); 8,531(1,3); 8,527(1,0); 7,683(1,1); 7,671(1,2); 7,663(1,1); 7,652(1,1); 7,651(1,1); 5,757(1,5); 3,320(12,5); 3,122(16,0); 3,122(16,0); 3,035(15,1); 2,672(0,3); 2,525(1,0); 2,511(18,4); 2,507(38,7); 2,502(54,2); 2,498(40,4); 2,494(19,4); 1,234(0,6); 0,008(0,9); 0,000(24,3); -0,008(0,9)   |
| 39             | 1,29    | 1,36    | RMN- <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,356(8,6); 8,902(8,8); 8,897(11,6); 8,877(11,6); 8,871(8,2); 8,834(6,1); 8,823(6,3); 8,763(1,1); 8,755(1,0); 8,731(0,9); 8,711(0,9); 8,561(5,1); 8,542(5,7); 8,313(0,5); 8,177(0,4); 7,953(1,0); 7,879(16,0); 7,692(4,3); 7,681(5,2); 7,673(4,7); 7,661(4,5); 7,647(0,9); 7,550(0,8); 7,539(0,7); 7,529(0,7); 7,517(0,6); 5,308(0,4); 3,432(0,6); 3,320(260,1); 3,256(48,0); 3,190(0,5); 3,153(0,4); 3,076(0,3); 2,995(3,2); 2,891(4,8); 2,732(4,6); 2,711(1,2); 2,671(2,4); 2,645(0,4); 2,630(0,5); 2,541(215,4); 2,502(389,5); 2,368(2,0); 2,329(3,0); 2,295(0,8); 2,277(0,7); 2,243(0,6); 2,220(0,7); 2,200(0,6); 2,189(1,2); 2,173(0,6); 2,131(0,6); 2,117(0,9); 2,105(0,7); 2,086(0,6); 2,073(0,6); |
|                |         |         | 2,036(0,6); 2,005(0,5); 1,997(0,5); 1,990(0,5); 1,980(0,5); 1,942(0,5); 1,909(5,1); 1,840(0,9); 1,816(0,4); 1,809(0,4); 1,762(0,4); 1,754(0,4); 1,722(0,3); 1,704(0,4); 1,673(0,3); 1,621(0,3); 1,610(0,4); 1,605(0,4); 1,603(0,4); 1,585(0,4); 1,574(0,4);  |



ES 2 691 246 T3

(continuación)

| N.º de ejemplo | logP[a] | logP[b] | RMN-1H [ $\sigma$ (ppm)] o bien CL-EM [m/z]  |
|----------------|---------|---------|--|
|                |         |         | 1,536(0,5); 1,514(0,6); 1,507(0,6); 1,500(0,6); 1,490(0,6); 1,466(0,7); 1,458(0,6); 1,386(1,4); 1,380(1,4); 1,347(1,8); 1,335(1,8); 1,298(1,7); 1,259(1,7); 1,234(2,6); 1,201(1,3); 1,141(1,4); 1,085(0,5); 1,070(0,6); 1,054(0,5); 1,045(0,5); 1,035(0,5); 0,988(0,5); 0,968(0,4); 0,922(0,3); 0,892(0,4); 0,864(0,6); 0,852(0,9); 0,830(1,3); 0,756(0,5); 0,726(0,3); 0,000(43,1)  |
| 40             | 0,83    |         | RMN- <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,369(2,9); 9,323(0,4); 9,317(0,4); 9,230(0,4); 9,225(0,4); 9,152(5,1); 9,147(6,5); 9,110(5,6); 9,104(4,8); 8,847(3,7); 8,837(3,5); 8,571(1,7); 8,567(2,4); 8,562(1,8); 8,551(1,8); 8,546(2,4); 8,542(1,6); 7,696(2,1); 7,684(2,1); 7,677(2,0); 7,664(1,9); 3,955(1,5); 3,903(16,0); 3,511(0,4); 3,339(354,7); 3,337(355,7); 3,175(1,4); 3,162(1,4); 2,866(13,6); 2,854(13,6); 2,678(1,1); 2,673(1,5); 2,669(1,1); 2,526(3,9); 2,513(87,9); 2,508(186,6); 2,504(262,5); 2,499(195,4); 2,495(93,0); 2,340(0,5); 2,335(1,1); 2,331(1,4); 2,326(1,1); 1,234(0,4); 0,008(0,4); 0,000(11,9); -0,008(0,4) |
| 41             | 1,19    |         | RMN- <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,244(6,1); 9,157(6,1); 9,151(8,2); 9,116(7,1); 9,110(6,5); 8,873(5,3); 8,866(5,6); 8,806(2,3); 8,795(2,3); 8,519(1,8); 8,513(2,7); 8,508(2,0); 8,496(1,8); 8,490(2,7); 8,485(1,9); 3,992(0,4); 3,902(10,4); 3,509(0,5); 3,345(426,7); 3,170(1,1); 2,869(15,8); 2,857(16,0); 2,802(0,3); 2,677(1,0); 2,672(1,4); 2,668(1,1); 2,512(81,1); 2,508(169,0); 2,503(238,2); 2,499(183,7); 2,335(0,9); 2,330(1,3); 2,326(1,0); 1,351(0,4); 1,258(0,4); 1,232(1,4); 0,000(7,1)  |
| 42             | 1,29    |         | RMN- <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,245(7,9); 8,870(6,8); 8,863(7,3); 8,850(9,3); 8,845(12,2); 8,810(12,7); 8,805(10,3); 8,521(2,6); 8,514(3,5); 8,509(2,7); 8,497(2,7); 8,493(3,3); 8,491(3,5); 8,486(2,7); 8,309(0,3); 3,902(16,0); 3,509(0,8); 3,360(944,6); 3,176(0,7); 3,165(0,6); 3,062(12,0); 3,013(12,6); 2,868(0,9); 2,679(1,2); 2,674(1,7); 2,670(1,3); 2,528(4,3); 2,514(95,1); 2,510(201,4); 2,505(282,5); 2,501(211,4); 2,496(101,5); 2,337(1,1); 2,332(1,6); 2,327(1,1); 1,275(0,4); 1,259(0,8); 1,245(0,7); 1,234(0,4); 0,000(7,8)   |
| 43             | 0,96    |         | RMN- <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,363(3,6); 9,267(0,7); 9,262(0,9); 9,212(0,8); 9,207(0,8); 8,841(2,6); 8,830(2,6); 8,823(7,2); 8,818(9,1); 8,790(9,2); 8,784(7,3); 8,576(1,9);   |
|                |         |         | 8,571(3,1); 8,566(2,4); 8,556(2,2); 8,551(3,2); 8,546(2,2); 7,699(2,4); 7,687(2,6); 7,679(2,5); 7,667(2,3); 3,902(16,0); 3,509(0,7); 3,364(596,5); 3,171(1,6); 3,060(9,1); 3,014(9,4); 2,678(1,0); 2,674(1,3); 2,669(1,0); 2,513(72,9); 2,509(152,8); 2,505(214,9); 2,500(163,4); 2,496(80,5); 2,336(0,8); 2,331(1,2); 2,327(0,9); 1,233(0,8); 0,000(5,6)  |
| 44             | 1,23    |         | RMN- <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,361(5,8); 8,840(4,3); 8,829(4,9); 8,791(2,9); 8,746(2,1); 8,571(3,4); 8,566(4,8); 8,561(3,4); 8,551(3,7); 8,546(5,0); 8,541(3,5); 8,313(0,4); 7,696(4,0); 7,684(4,1); 7,676(4,0); 7,664(3,7); 3,902(16,0); 3,539(1,9); 3,523(2,0); 3,509(1,8); 3,346(693,4); 3,170(1,1); 3,020(6,3); 2,989(6,0); 2,677(1,8); 2,673(2,4); 2,668(1,8); 2,579(0,4); 2,526(6,4); 2,512(144,2); 2,508(304,1); 2,503(426,5); 2,499(317,6); 2,495(151,3); 2,339(0,9); 2,335(1,7); 2,330(2,4); 2,326(1,7); 1,352(0,4); 1,259(0,5); 1,233(1,7); 1,188(3,4); 1,122(3,5); 0,853(0,4); 0,000(7,2)                             |

ES 2 691 246 T3

(continuación)

| N.º de ejemplo | logP[a] | logP[b] | RMN-1H [ $\sigma$ (ppm)] o bien CL-EM [m/z]  |
|----------------|---------|---------|--|
| 45             | 1,55    |         | RMN- <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,242(6,8); 8,869(6,0); 8,862(6,5); 8,843(1,6); 8,817(1,8); 8,798(1,6); 8,766(1,5); 8,518(2,1); 8,512(3,0); 8,507(2,2); 8,495(2,2); 8,488(3,0); 8,483(2,2); 3,902(16,0); 3,525(1,8); 3,510(1,6); 3,365(833,6); 3,171(2,1); 3,023(4,5); 2,986(4,4); 2,804(0,4); 2,679(1,2); 2,674(1,6); 2,670(1,2); 2,544(1,0); 2,527(4,2); 2,514(90,1); 2,510(189,9); 2,505(266,6); 2,501(199,8); 2,496(95,7); 2,336(1,1); 2,332(1,5); 2,327(1,1); 1,351(0,3); 1,233(1,3); 1,189(2,4); 1,119(2,5); 0,000(6,6)   |
| 46             | 1,54    |         | RMN- <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,478(2,0); 9,463(4,1); 9,447(2,0); 9,374(4,9); 9,189(6,7); 9,184(12,4); 9,172(11,8); 9,167(6,7); 8,847(3,4); 8,837(3,3); 8,583(2,7); 8,578(3,7); 8,573(2,7); 8,563(3,0); 8,558(4,0); 8,553(2,7); 8,311(0,3); 7,699(3,2); 7,687(3,2); 7,680(3,1); 7,667(2,9); 4,233(1,3); 4,216(1,5); 4,208(4,0); 4,192(4,1); 4,184(4,3); 4,168(4,1); 4,160(1,7); 4,144(1,5); 4,107(0,3); 4,094(0,4); 3,955(1,3); 3,902(16,0); 3,547(0,5); 3,508(0,7); 3,346(618,3); 3,170(5,7); 2,682(0,7); 2,678(1,3); 2,673(1,8); 2,669(1,3); 2,526(4,9); 2,513(102,4); 2,509(214,9); 2,504(300,2); 2,500(221,5); 2,495(103,8); 2,340(0,5); 2,335(1,1); 2,331(1,6); 2,326(1,1); 1,249(0,4); 1,232(0,8); 0,000(8,1) |
| 47             | 1,90    |         | RMN- <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,488(1,0); 9,473(1,9); 9,457(0,9); 9,257(3,9); 9,201(16,0); 8,880(3,5); 8,873(3,6); 8,536(1,2); 8,530(1,6); 8,525(1,1); 8,513(1,2); 8,506(1,5); 8,501(1,1); 4,234(0,6); 4,218(0,7); 4,210(1,8); 4,194(1,9); 4,186(2,0); 4,170(1,8); 4,162(0,7);<br>4,146(0,6); 3,902(7,6); 3,341(184,8); 3,334(195,9); 3,169(0,5); 2,677(0,6); 2,672(0,9); 2,668(0,6); 2,525(2,7); 2,512(52,7); 2,508(107,6); 2,503(148,5); 2,499(111,1); 2,494(54,0); 2,334(0,6); 2,330(0,8); 2,326(0,6); 1,234(0,4); 0,000(5,8)  |
| 48             | 1,20    |         | RMN- <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,362(1,8); 8,997(3,0); 8,992(3,7); 8,945(3,8); 8,940(3,2); 8,844(1,2); 8,833(1,2); 8,573(0,9); 8,567(1,3); 8,563(1,0); 8,553(1,0); 8,547(1,4); 8,543(1,0); 7,697(1,1); 7,685(1,2); 7,677(1,1); 7,665(1,1); 3,902(4,2); 3,608(16,0); 3,424(0,6); 3,353(185,0); 3,347(193,9); 3,170(0,8); 2,673(0,6); 2,669(0,4); 2,526(1,4); 2,509(66,8); 2,504(94,1); 2,500(71,7); 2,335(0,4); 2,331(0,5); 2,326(0,4); 1,233(0,4); 0,000(2,7)  |
| 49             | 1,54    |         | RMN- <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,245(3,0); 9,026(3,2); 9,021(3,9); 8,962(3,9); 8,957(3,5); 8,875(2,6); 8,868(2,8); 8,523(0,9); 8,517(1,2); 8,512(1,0); 8,499(1,0); 8,493(1,2); 8,488(0,9); 3,902(5,6); 3,607(16,0); 3,354(200,7); 3,346(249,7); 3,170(0,4); 2,678(0,5); 2,673(0,7); 2,669(0,5); 2,526(2,1); 2,513(38,5); 2,508(80,5); 2,504(112,9); 2,499(86,6); 2,495(43,4); 2,335(0,5); 2,331(0,6); 2,326(0,5); 1,234(0,8); 0,000(3,4)   |
| 50             | 1,45    |         | RMN- <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,382(2,0); 9,209(1,1); 9,193(2,3); 9,185(4,9); 9,180(7,3); 9,159(6,3); 9,154(4,4); 8,854(1,4); 8,845(1,4); 8,582(1,3); 8,577(1,9); 8,573(1,4); 8,562(1,5); 8,557(2,0); 8,553(1,4); 7,701(1,6); 7,689(1,6); 7,682(1,6); 7,669(1,5); 3,902(16,0); 3,853(1,3); 3,837(1,3); 3,818(2,6); 3,802(2,6); 3,783(1,4); 3,767(1,3); 3,509(0,4); 3,349(364,2); 3,344(447,4); 3,341(452,3); 3,176(0,8); 3,163(0,8); 2,677(1,0); 2,673(1,4); 2,668(1,1); 2,664(0,5); 2,526(3,6); 2,521(5,4); 2,513(80,5); 2,508(172,3); 2,504(243,6); 2,499(179,6); 2,495(84,0); 2,340(0,4); 2,335(0,9); 2,330(1,3); 2,326(1,0); 1,727(4,3); 1,679(9,7); 1,632(4,8); 0,000(5,0)                                     |

ES 2 691 246 T3

(continuación)

| N.º de ejemplo | logP[a] | logP[b] | RMN-1H [ $\sigma$ (ppm)] o bien CL-EM [m/z]   |
|----------------|---------|---------|---|
| 51             | 1,80    |         | <p>RMN-<sup>1</sup>H (400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):</p> <p><math>\delta</math> = 9,348(0,4); 9,343(0,4); 9,256(8,0); 9,242(0,9); 9,222(2,2); 9,206(4,4); 9,201(6,9); 9,196(12,5); 9,188(11,9); 9,183(5,9); 8,878(7,2); 8,872(7,3); 8,534(2,4); 8,528(3,3); 8,523(2,4); 8,511(2,5); 8,504(3,2); 8,499(2,3); 8,316(0,3); 4,428(0,5); 4,410(0,5); 4,110(0,4); 4,098(0,4); 3,958(0,4); 3,902(14,3); 3,854(2,2); 3,839(2,2); 3,819(4,5); 3,803(4,4); 3,784(2,4); 3,768(2,3); 3,598(0,4); 3,559(0,4); 3,528(0,5); 3,508(0,7); 3,490(0,6); 3,341(647,7); 3,176(2,2); 3,163(2,1); 2,677(1,6); 2,672(2,3); 2,668(1,6); 2,594(0,4); 2,588(0,4); 2,525(6,1); 2,512(127,9); 2,508(267,9); 2,503(375,8); 2,499(283,5); 2,494(138,3); 2,335(1,5); 2,330(2,0);</p> |
|                |         |         | <p>2,326(1,5); 1,728(7,3); 1,680(16,0); 1,633(8,0); 1,405(0,4); 1,388(0,9); 1,370(0,4); 1,244(0,3); 1,233(0,5); 0,008(0,4); 0,000(11,4)</p>   |
| 52             | 1,39    |         | <p>RMN-<sup>1</sup>H (400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):</p> <p><math>\delta</math> = 9,365(1,2); 9,153(2,3); 9,148(2,8); 9,101(2,7); 9,096(2,4); 8,981(0,5); 8,967(1,0); 8,953(0,5); 8,843(0,9); 8,831(0,8); 8,574(0,7); 8,568(1,0); 8,564(0,7); 8,554(0,7); 8,548(1,0); 8,544(0,8); 7,695(0,8); 7,683(0,8); 7,676(0,8); 7,664(0,8); 3,902(4,0); 3,556(0,8); 3,540(1,6); 3,522(1,6); 3,507(0,9); 3,356(130,8); 3,349(200,4); 2,724(1,7); 2,706(2,5); 2,689(1,6); 2,678(0,4); 2,673(0,5); 2,669(0,3); 2,526(1,2); 2,513(24,8); 2,509(53,4); 2,504(76,2); 2,500(58,4); 2,495(28,7); 2,331(0,4); 2,326(0,3); 2,128(16,0); 0,000(2,5)</p>   |
| 53             | 1,72    |         | <p>RMN-<sup>1</sup>H (400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):</p> <p><math>\delta</math> = 9,248(2,1); 9,169(2,2); 9,164(2,8); 9,130(2,5); 9,124(2,1); 8,991(0,5); 8,977(1,0); 8,962(0,5); 8,875(1,9); 8,868(2,0); 8,524(0,6); 8,518(0,9); 8,513(0,7); 8,501(0,7); 8,495(0,9); 8,490(0,6); 3,902(4,2); 3,558(0,8); 3,542(1,6); 3,524(1,6); 3,508(0,9); 3,348(170,0); 2,725(1,8); 2,706(2,6); 2,689(1,7); 2,678(0,4); 2,673(0,5); 2,669(0,4); 2,526(1,2); 2,513(27,8); 2,509(58,7); 2,504(82,4); 2,500(61,3); 2,495(29,3); 2,335(0,3); 2,331(0,5); 2,326(0,3); 2,128(16,0); 0,000(1,9)</p>   |
| 54             | 0,84    |         | <p>RMN-<sup>1</sup>H (400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):</p> <p><math>\delta</math> = 9,372(1,9); 9,152(3,4); 9,147(4,5); 9,125(1,7); 9,115(4,8); 9,109(4,2); 8,849(1,3); 8,838(1,3); 8,576(1,0); 8,571(1,4); 8,567(1,1); 8,556(1,1); 8,551(1,5); 8,547(1,1); 7,698(1,2); 7,686(1,2); 7,678(1,2); 7,666(1,1); 3,955(0,6); 3,902(8,0); 3,777(0,9); 3,760(2,4); 3,745(2,5); 3,729(1,2); 3,455(2,2); 3,438(4,0); 3,421(1,9); 3,344(186,2); 3,336(242,0); 3,176(0,6); 3,162(0,6); 3,075(16,0); 2,677(0,6); 2,672(0,8); 2,668(0,6); 2,543(0,6); 2,526(2,1); 2,512(47,9); 2,508(101,9); 2,503(144,1); 2,499(111,8); 2,334(0,6); 2,330(0,8); 2,325(0,6); 0,000(3,8)</p>   |
| 55             | 1,12    |         | <p>RMN-<sup>1</sup>H (601,6 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):</p> <p><math>\delta</math> = 9,254(1,8); 9,252(2,8); 9,194(0,8); 9,185(1,7); 9,177(4,0); 9,173(5,2); 9,161(5,1); 9,158(3,3); 8,876(3,0); 8,872(3,0); 8,527(1,0); 8,524(1,2); 8,523(1,2); 8,520(1,0); 8,512(1,0); 8,508(1,3); 8,507(1,2); 8,504(1,0); 7,953(0,5); 3,769(1,0); 3,758(2,5); 3,748(2,5); 3,737(1,2); 3,454(2,1); 3,442(3,9); 3,431(1,9); 3,324(361,5); 3,281(0,4); 3,076(16,0); 2,986(0,5); 2,891(4,0); 2,7313(3,2); 2,7307(3,1); 2,689(0,5); 2,617(1,3); 2,614(1,8); 2,611(1,3); 2,523(3,2); 2,520(4,2); 2,517(4,3); 2,508(97,1); 2,505(201,1); 2,502(270,3); 2,499(198,0); 2,496(95,1); 2,389(1,3); 2,386(1,7); 2,383(1,3);</p>   |
|                |         |         | <p>0,937(0,4); 0,000(7,3)</p>   |

ES 2 691 246 T3

(continuación)

| N.º de ejemplo | logP[a] | logP[b] | RMN-1H [ $\sigma$ (ppm)] o bien CL-EM [m/z]   |
|----------------|---------|---------|---|
| 56             | 3,14    |         | RMN- <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 10,867(7,7); 9,395(4,2); 9,284(6,7); 9,278(9,8); 9,257(9,3); 9,252(6,8); 8,855(3,0); 8,846(3,0); 8,602(2,2); 8,597(3,1); 8,593(2,3); 8,582(2,4); 8,577(3,4); 8,573(2,3); 8,313(0,4); 8,277(6,2); 8,032(2,9); 8,030(2,8); 8,009(3,2); 7,708(2,8); 7,696(2,8); 7,688(2,7); 7,676(2,6); 7,603(3,1); 7,583(6,6); 7,563(4,4); 7,507(4,3); 7,487(2,7); 4,108(0,8); 4,095(0,8); 4,083(0,3); 3,902(16,0); 3,508(0,5); 3,495(0,4); 3,346(476,4); 3,340(619,0); 3,176(6,2); 3,163(6,1); 2,677(1,3); 2,672(1,7); 2,668(1,3); 2,664(0,7); 2,526(4,7); 2,512(103,2); 2,508(217,0); 2,503(304,9); 2,499(228,7); 2,494(110,1); 2,335(1,2); 2,330(1,7); 2,326(1,2); 1,249(0,3); 0,008(0,4); 0,000(12,2); -0,009(0,4) |
| 57             | 3,53    |         | RMN- <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 10,872(8,7); 9,298(6,5); 9,293(10,8); 9,277(16,0); 8,887(6,9); 8,880(7,1); 8,555(2,2); 8,549(3,3); 8,544(2,4); 8,532(2,3); 8,525(3,3); 8,521(2,3); 8,308(0,3); 8,273(7,1); 8,025(3,4); 8,004(3,7); 7,605(3,2); 7,585(7,0); 7,565(4,6); 7,509(5,1); 7,490(3,2); 3,902(15,3); 3,705(0,4); 3,657(0,4); 3,603(0,6); 3,508(1,4); 3,361(1440,1); 3,174(0,6); 2,678(1,6); 2,674(2,2); 2,670(1,6); 2,582(0,4); 2,544(1,6); 2,509(266,9); 2,505(367,0); 2,500(281,7); 2,336(1,5); 2,331(2,0); 1,233(0,6); 0,000(7,6)  |
| 58             | 2,54    |         | RMN- <sup>1</sup> H (601,6 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 11,037(1,3); 9,317(7,8); 9,313(14,4); 9,306(16,0); 9,302(8,6); 9,278(8,6); 8,887(8,8); 8,883(10,4); 8,833(0,9); 8,829(0,8); 8,825(0,9); 8,554(2,8); 8,551(3,7); 8,547(2,8); 8,539(3,0); 8,536(3,8); 8,532(2,6); 8,452(8,0); 8,270(1,6); 8,189(0,8); 8,176(0,9); 8,160(4,1); 8,147(4,3); 8,145(4,3); 8,022(0,8); 8,007(0,8); 7,760(4,0); 7,746(8,2); 7,733(4,8); 7,646(5,2); 7,634(4,1); 7,596(0,7); 7,583(1,5); 7,569(0,9); 7,505(1,0); 7,493(0,8); 3,322(411,9); 2,614(2,3); 2,611(1,7); 2,541(1,0); 2,523(4,5); 2,520(5,8); 2,517(6,8); 2,505(256,7); 2,502(334,0); 2,499(250,5); 2,386(2,0); 1,231(0,6); 0,000(7,3)   |
| 59             | 1,65    |         | RMN- <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,231(6,6); 8,861(5,8); 8,854(6,1); 8,761(8,3); 8,508(1,9); 8,503(2,6); 8,485(1,9); 8,480(2,6); 8,475(1,8); 3,902(16,0); 3,508(0,4); 3,342(396,2); 3,338(410,6); 3,176(0,7); 3,164(0,7); 2,677(1,1); 2,672(1,5); 2,668(1,2); 2,548(0,6); 2,525(4,3); 2,512(90,4); 2,508(185,6); 2,503(257,8); 2,499(197,1); 2,335(1,2); 2,330(1,5); 2,325(1,2); 2,199(0,5); 2,143(0,6); 2,130(0,6); 2,112(0,6); 2,074(0,4); 1,249(0,3); 1,235(0,3); 0,969(4,6); 0,008(0,4);  |
|                |         |         | 0,000(10,5)   |
| I-a-1          |         | 1,95    | RMN- <sup>1</sup> H (400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):<br>$\delta$ = 9,339 (8,2); 9,337 (8,7); 9,333 (8,6); 9,332 (8,2); 9,046 (15,3); 9,040 (16,0); 8,842 (15,8); 8,836 (15,1); 8,830 (7,6); 8,827 (7,8); 8,818 (7,7); 8,814 (7,5); 8,548 (4,4); 8,544 (5,4); 8,543 (5,3); 8,538 (4,3); 8,528 (4,7); 8,524 (5,4); 8,523 (5,8); 8,518 (4,4); 8,318 (0,4); 7,679 (5,3); 7,677 (5,4); 7,667 (5,2); 7,665 (5,3); 7,659 (5,2); 7,657 (5,1); 7,647 (5,0); 7,645 (5,0); 3,757 (1,1); 3,329 (112,8); 2,678 (0,5); 2,674 (0,7); 2,669 (0,5); 2,527 (1,9); 2,514 (39,9); 2,509 (80,5); 2,505 (105,7); 2,500 (75,9); 2,496 (35,9); 2,336 (0,5); 2,331 (0,7); 2,327 (0,5); 0,146 (0,7); 0,008 (5,9); 0,000 (157,7); -0,009 (5,5); -0,150 (0,7)                                       |
| I-j-1          |         |         | CL-EM: m/z 272 [M+H <sup>+</sup> ]  |
| I-j-2          |         |         | CL-EM: m/z 290 [M+H <sup>+</sup> ]  |
| I-s-1          |         |         | CL-EM: m/z 229 [M+H <sup>+</sup> ]  |
| I-s-2          |         |         | CL-EM: m/z 247 [M+H <sup>+</sup> ]  |

**Ejemplos biológicos****Myzus persicae – ensayo de pulverización**

Disolvente: 78 partes en peso de acetona  
1,5 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: alquilarilpoliglicoléter

5 Para preparar una preparación de principios activos conveniente se disuelve 1 parte en peso de principio activo con las partes en peso indicadas de disolvente y se llena con agua, que contiene una concentración en emulsión de 1000 ppm, hasta obtener la concentración deseada. Para preparar otras concentraciones de ensayo se diluye con agua que contiene emulsionante.

Los discos de hojas de col de China (*Brassica pekinensis*) que están infestadas con pulgones verde del duraznero (*Myzus persicae*) en todos los estadios, se pulverizan con una preparación de principio activo de la concentración deseada.

10 Tras 6 días se determina la acción en %. A este respecto significa el 100 % que murieron todos los pulgones; el 0 % significa que no murió ningún pulgón.

En este ensayo, por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una acción del 100 % con una cantidad de aplicación de 500 g/ha: 2, 4, 6, 7, 9, 19, 22, 30, 41, 42, 43, 44

15 En este ensayo, por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una acción del 90 % con una cantidad de aplicación de 500 g/ha: 13, 16, 17, 18, 20, 23, 25, 26, 31, 32, 39, 45, 48, 49

**Tetranychus urticae – ensayo de pulverización, resistente a OP**

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

Emulsionante: alquilarilpoliglicoléter

20 Para preparar una preparación de principios activos conveniente se disuelve 1 parte en peso de principio activo con las partes en peso indicadas de disolvente y se llena con agua, que contiene una concentración en emulsión de 1000 ppm, hasta obtener la concentración deseada. Para preparar otras concentraciones de ensayo se diluye con agua que contiene emulsionante.

Los discos de hojas de judías (*Phaseolus vulgaris*), que están infestadas con ácaros de araña roja (*Tetranychus urticae*) en todos los estadios, se pulverizan con una preparación de principio activo de la concentración deseada.

Tras 6 días se determina la acción en %. A este respecto significa el 100 % que se murieron todos los ácaros; el 0 % significa que no se murió ningún ácaro.

25 En este ensayo, por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una acción del 90 % con una cantidad de aplicación de 500 g/ha: 22

**Phaedon cochleariae – ensayo de pulverización**

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

Emulsionante: alquilarilpoliglicoléter

30 Para preparar una preparación de principios activos conveniente se disuelve 1 parte en peso de principio activo con las partes en peso indicadas de disolvente y se llena con agua, que contiene una concentración en emulsión de 1000 ppm, hasta obtener la concentración deseada. Para preparar otras concentraciones de ensayo se diluye con agua que contiene emulsionante.

Se pulverizan discos de hojas de col de China (*Brassica pekinensis*) con una preparación de principio activo de la concentración deseada y después de haberse secado se colocan larvas del escarabajo de la mostaza (*Phaedon cochleariae*).

35 Tras 7 días se determina la acción en %. A este respecto significa el 100 % que murieron todas las larvas de escarabajo; el 0 % significa que no murió ninguna larva de escarabajo.

En este ensayo, por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una acción del 83 % con una cantidad de aplicación de 500 g/ha: 39

**Myzus persicae – ensayo de pulverización**

Disolvente: 7 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: alquilarilpoliglicoléter

5 Para preparar una preparación de principios activos conveniente se disuelve 1 parte en peso de principio activo con las partes en peso indicadas de disolvente y se llena con agua, que contiene una concentración en emulsión de 1000 ppm, hasta obtener la concentración deseada. Para preparar otras concentraciones de ensayo se diluye con agua que contiene emulsionante. En caso de adición necesaria de sales de amonio o/y agentes que favorecen la penetración se añaden éstos en cada caso en una concentración de 1000 ppm a la solución de preparado.

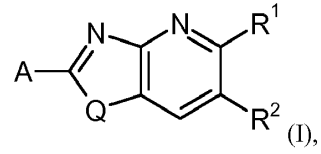
10 Las plantas de pimiento (*Capsicum annuum*), que están fuertemente infestadas con pulgones verde del duraznero (*Myzus persicae*), se tratan mediante pulverización con la preparación de principio activo en la concentración deseada.

Tras 6 días se determina la destrucción en %. A este respecto significa el 100 % que se destruyeron todos los pulgones; el 0 % significa que no destruyó ningún pulgón.

15 En este ensayo, por ejemplo los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una acción del 100 % con una cantidad de aplicación de 4 ppm: 21

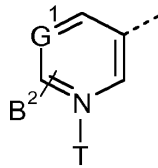
REIVINDICACIONES

1. Compuestos de fórmula (I)



en la que

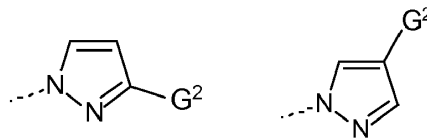
5 A representa el resto (A-a)



(A-a)

en el que la línea discontinua significa la unión al átomo de carbono del biciclo de fórmula (I),

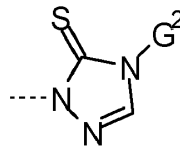
10 G<sup>1</sup> representa C-B<sup>1</sup>,  
 B<sup>1</sup> representa hidrógeno o flúor,  
 B<sup>2</sup> representa hidrógeno,  
 T representa un par de electrones o representa oxígeno,  
 Q representa azufre,  
 R<sup>1</sup> representa hidrógeno,  
 R<sup>2</sup> a) representa uno de los restos B siguientes



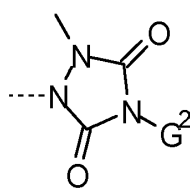
(B-1)

(B-2)

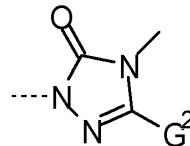
15



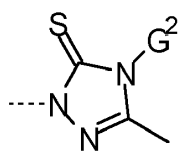
(B-41)



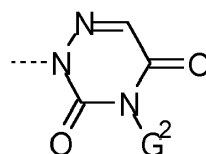
(B-42)



(B-43)



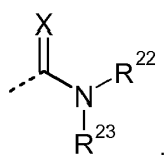
(B-46)



(B-47)

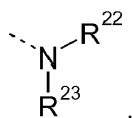
en los que la línea discontinua significa la unión al átomo de carbono del biciclo de fórmula (I) o

R<sup>2</sup> c) representa un resto de fórmula



5 en la que X representa oxígeno o azufre y la línea discontinua significa la unión al átomo de carbono del biciclo de fórmula (I) o

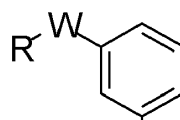
R<sup>2</sup> f) representa un resto de fórmula



10 en la que la línea discontinua significa la unión al átomo de carbono del biciclo de fórmula (I), en la que

G<sup>2</sup> representa un resto de la serie de hidrógeno, 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>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> y haloalquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> y en el caso de que R<sup>2</sup> represente c)

R<sup>22</sup> representa el resto D



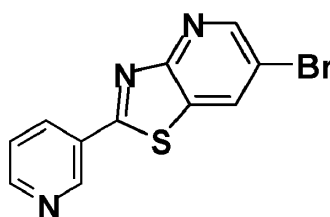
(D-2)

15 en la que  
R representa alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> eventualmente mono-, di-, tri-, tetra- o pentasustituido con flúor, cloro,  
W representa un resto de la serie de S, SO y SO<sub>2</sub> y en el caso de que R<sup>2</sup> represente f),  
R<sup>22</sup> representa fenilo eventualmente sustituido con flúor, cloro o bromo y  
R<sup>23</sup> representa hidrógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>.

20 2. Agente, **caracterizado por** un contenido de al menos un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1 y diluyentes habituales y/o sustancias tensioactivas.

3. Uso no terapéutico de compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1 o de agentes de acuerdo con la reivindicación 2 para la lucha contra plagas.

4. Compuesto de fórmula



25