

19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 703 950**

51 Int. Cl.:

**C07D 403/04** (2006.01)  
**C07D 405/04** (2006.01)  
**C07D 409/04** (2006.01)  
**C07D 413/04** (2006.01)  
**C07D 417/04** (2006.01)  
**A01N 43/56** (2006.01)  
**A01N 43/653** (2006.01)  
**A01N 43/74** (2006.01)  
**A01P 5/00** (2006.01)  
**A01P 7/00** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- 86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **01.04.2015 PCT/EP2015/057155**
- 87 Fecha y número de publicación internacional: **08.10.2015 WO15150442**
- 96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **01.04.2015 E 15713883 (5)**
- 97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **15.08.2018 EP 3126353**

54 Título: **Nuevos derivados de 3-[(pirazol-5-il)-heteroaril]-benzamida y su uso como agentes plaguicidas**

30 Prioridad:

**02.04.2014 EP 14163157**

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:  
**13.03.2019**

73 Titular/es:

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

72 Inventor/es:

**MAUE, MICHAEL;  
DECOR, ANNE;  
BRETSCHNEIDER, THOMAS;  
HAHN, JULIA JOHANNA;  
HALLENBACH, WERNER;  
FISCHER, REINER;  
SCHWARZ, HANS-GEORG;  
GÖRGENS, ULRICH;  
ILG, KERSTIN;  
RAMING, KLAUS;  
KÖBBERLING, JOHANNES;  
HÜBSCH, WALTER y  
TURBERG, ANDREAS**

74 Agente/Representante:

**CARPINTERO LÓPEZ, Mario**

ES 2 703 950 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

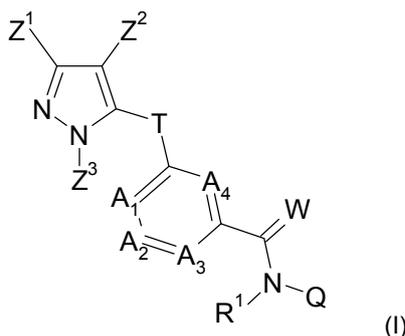
Nuevos derivados de 3-[(pirazol-5-il)-heteroaril]-benzamida y su uso como agentes plaguicidas

La presente solicitud se refiere a compuestos sustituidos con halógeno, a procedimientos para su preparación y a su uso para combatir plagas animales, sobre todo de artrópodos y de forma particular de insectos, arácnidos y nematodos.

Se sabe que compuestos similares como inhibidores de FAAH [WO2009-152025], moduladores de LXR [WO2007-002559] y moduladores del transportador de casetes de unión a ATP [WO2004-080972]. El documento WO2012107434 divulga triazoles sustituidos como insecticidas. Agentes fitosanitarios modernos deben satisfacer muchos requerimientos, por ejemplo, en lo referente a nivel, duración y amplitud de su efecto y posible uso. Cuestiones de toxicidad, de capacidad de combinación con otros principios activos o coadyuvantes de formulación juegan un papel así como la cuestión de consumo, que deben ser gestionados para la síntesis de un principio activo. Además pueden aparecer resistencias. Por todos estos motivos nunca se puede dar por cerrada la búsqueda de nuevos agentes fitosanitarios y se mantiene la necesidad de nuevos compuestos frente a los compuestos conocidos al menos en lo que respecta a aspectos individuales de propiedades mejoradas. Fue objetivo de la presente invención proporcionar compuestos mediante los cuales se amplíe el espectro de agentes plaguicidas en distintos aspectos y/o se mejore su actividad.

Se ha encontrado ahora de forma sorprendente que determinados compuestos sustituidos con halógeno, así como sus *N*-óxidos y sales presentan propiedades biológicas y son adecuados de forma particular para combatir plagas animales y por tanto son especialmente adecuados para uso en el campo de los agroquímicos y en el campo de la salud animal.

Los compuestos sustituidos con halógeno según la invención se definen por medio de la fórmula general (I)



en los que

$R^1$  representa hidrógeno, alquilo, alqueno, alquino, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, alquilcarbonilo, alcoxycarbonilo, arilalquilo, heteroarilalquilo dado el caso sustituidos,

los grupos químicos

$A_1$  representa  $CR^2$  o nitrógeno,  
 $A_2$  representa  $CR^3$  o nitrógeno,  
 $A_3$  representa  $CR^4$  o nitrógeno y  
 $A_4$  representa  $CR^5$  o nitrógeno,

pero en donde no más que tres de los grupos químicos  $A_1$  a  $A_4$  representan al mismo tiempo nitrógeno;

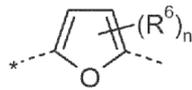
$R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  y  $R^5$  representan, de modo independiente entre sí, hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo, cicloalquilo, alcoxi, *N*-alcoxi-imino-alquilo, alquilsulfanilo, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, *N*-alquilamino o *N,N*-dialquilamino dado el caso sustituidos;

cuando ninguno de los grupos  $A_2$  y  $A_3$  representa nitrógeno,  $R^3$  y  $R^4$  pueden formar junto con el átomo de carbono al que están unidos un anillo de 5 o 6 miembros, que contiene 0, 1 o 2 átomos de nitrógeno y/o 0 o 1 átomo de oxígeno y/o 0 o 1 átomo de azufre o cuando ninguno de los grupos  $A_1$  y  $A_2$  representa nitrógeno,  $R^2$  y  $R^3$  pueden formar junto con el átomo de carbono al que están unidos un anillo de 6 miembros, que contiene 0, 1 o 2 átomos de nitrógeno;

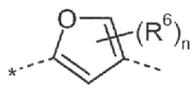
$W$  representa oxígeno o azufre;

$Q$  representa hidrógeno, formilo, hidroxilo, amino o uno de los grupos dado el caso sustituidos alquilo, alquiloxi, alqueno, alquino, cicloalquilo, heterocicloalquilo, cicloalquilalquilo, heterocicloalquilalquilo, arilalquilo, heteroarilalquilo o un grupo *N*-alquilamino, *N*-alquilcarbonilamino, *N,N*-dialquilamino; o

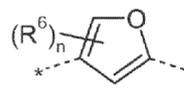
- Q representa un carbociclo de 5 a 6 miembros mono- a poliinsaturado mono- a polisustituido dado el caso con V, que puede estar interrumpido dado el caso por heteroátomos, en donde
- V representa halógeno, ciano, nitro, alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, alcoxi, *N*-alcoxiiminoalquilo, alquilsulfanilo, alquilsulfínilo, alquilsulfonilo, *N,N*-dialquilamino dado el caso sustituidos
- 5 T representa uno de los compuestos heteroaromáticos T1-T35 de 5 miembros enumerados a continuación, en donde la unión con el grupo de cabeza de pirazol está identificada con un asterisco,



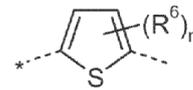
T1



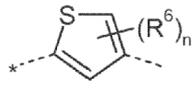
T2



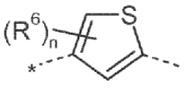
T3



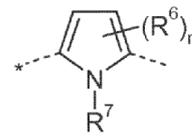
T4



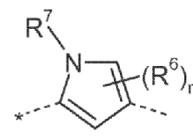
T5



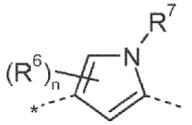
T6



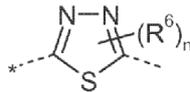
T7



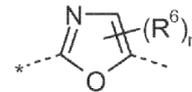
T8



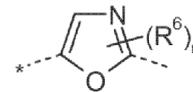
T9



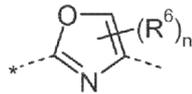
T10



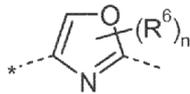
T11



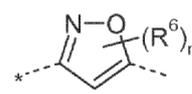
T12



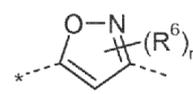
T13



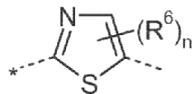
T14



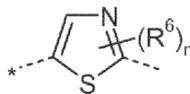
T15



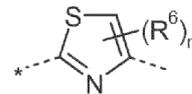
T16



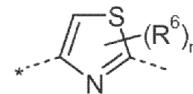
T17



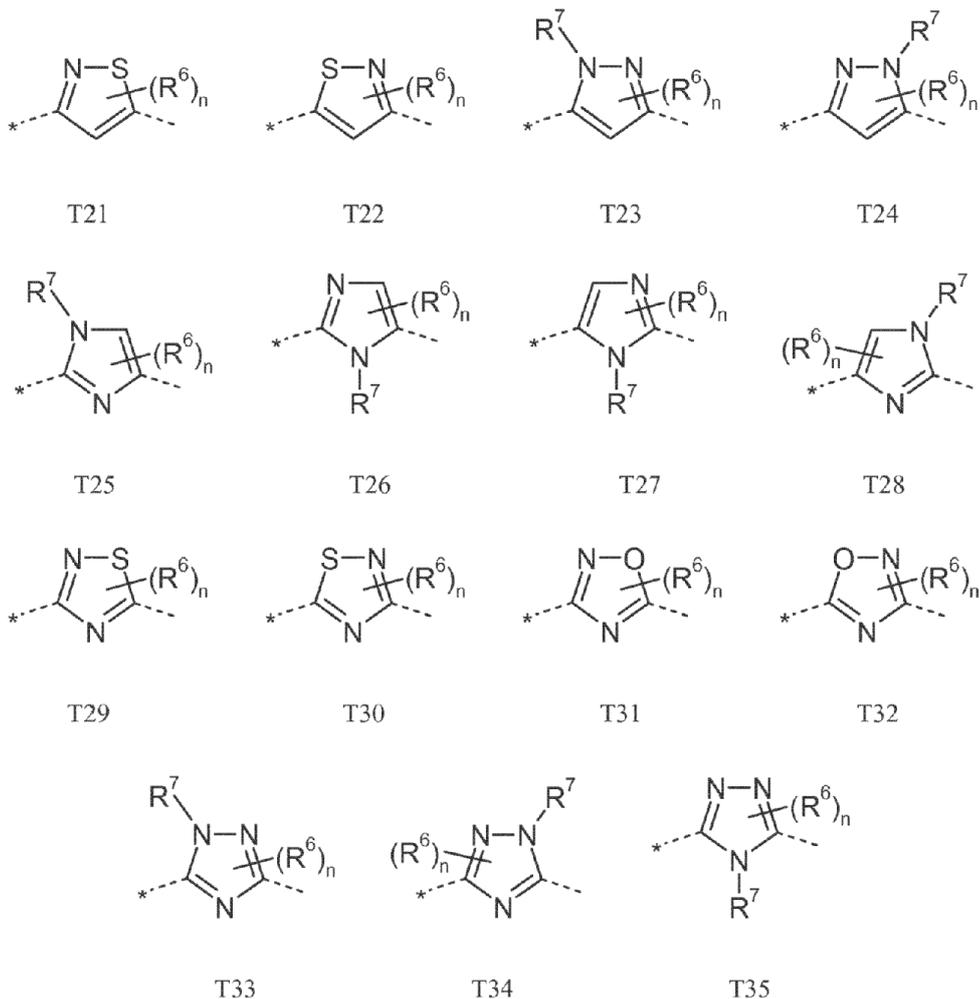
T18



T19



T20

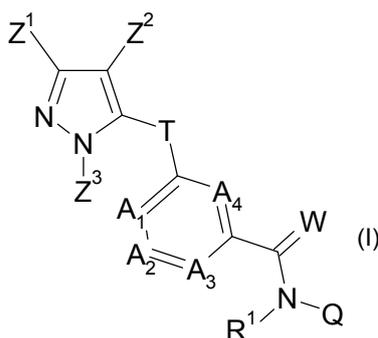


en donde

- $R^6$  representa, de modo independiente entre sí, halógeno, ciano, nitro, amino o un alquilo, alquiloxi, alquilcarbonilo, alquilsulfanilo, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo dado el caso sustituidos y  
 5  $n$  representa los valores 0-2;  
 $R^7$  representa hidrógeno o un alquilo o cicloalquilo dado el caso sustituidos, en donde dado el caso un grupo metileno está sustituido por un heteroátomo;  
 $Z^1$  representa haloalquilo o halocicloalquilo dado el caso sustituidos, y  
 10  $Z^2$  representa hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, amino o un alquilo, alquilcarbonilo, alquilsulfanilo, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo dado el caso sustituidos y  
 $Z^3$  representa hidrógeno o un alquilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, alquenilo, alquinilo dado el caso sustituidos; en donde

para el caso de que T sea igual a T23 o T24, uno de los radicales  $Z^1$ ,  $Z^2$  o  $Z^3$  esté sustituido con al menos 3 átomos de halógeno.

- 15 Se definen preferentemente los compuestos de la fórmula (I)



en los que

5 R<sup>1</sup> representa hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>, cicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-carbonilo, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-carbonilo, arilalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), heteroarilalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>) dado el caso sustituidos,

los grupos químicos

A<sub>1</sub> representa CR<sup>2</sup> o nitrógeno,

A<sub>2</sub> representa CR<sup>3</sup> o nitrógeno,

A<sub>3</sub> representa CR<sup>4</sup> o nitrógeno y

10 A<sub>4</sub> representa CR<sup>5</sup> o nitrógeno,

pero en donde no más que tres de los grupos químicos A<sub>1</sub> a A<sub>4</sub> representan al mismo tiempo nitrógeno;

15 R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> representa, de modo independiente entre sí, hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, N-alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-imino-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-sulfanilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-sulfinilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-sulfonilo, N-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-amino, N,N-di-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-amino dado el caso sustituidos, o cuando ninguno de los grupos A<sub>2</sub> y A<sub>3</sub> representa nitrógeno, R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> pueden formar junto con el átomo de carbono al que están unidos un anillo de 5 o 6 miembros, que contiene 0, 1 o 2 átomos de nitrógeno y/o 0 o 1 átomo de oxígeno y/o 0 o 1 átomo de azufre o cuando ninguno de los grupos A<sub>1</sub> y A<sub>2</sub> representa nitrógeno, R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> pueden formar junto con el átomo de carbono al que están unidos un anillo de 6 miembros, que contiene 0, 1 o 2 átomos de nitrógeno;

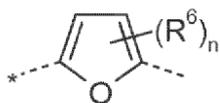
W representa oxígeno o azufre;

25 Q representa hidrógeno, formilo, hidroxilo, amino o uno de los grupos dado el caso sustituidos alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, heterocicloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, aril-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), heteroaril-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>) o un grupo N-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-amino, N-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-carbonilamino, N,N-di-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-amino; o

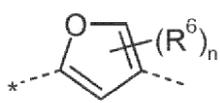
Q representa un carbociclo de 5 a 6 miembros mono- a triinsaturado mono- a polisustituido dado el caso con V o representa un anillo heterocíclico de 5 o 6 miembros mono- a triinsaturado polisustituido dado el caso con V, en donde

30 V representa, de modo independiente entre sí, halógeno, ciano, nitro, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, N-alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-imino-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-sulfanilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-sulfinilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-sulfonilo, N,N-di-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)amino dado el caso sustituidos;

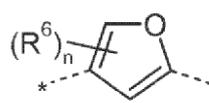
35 T representa uno de los compuestos heteroaromáticos T1-T35 de 5 miembros enumerados a continuación, en donde la unión con el grupo de cabeza de pirazol está identificada con un asterisco,



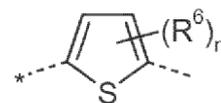
T1



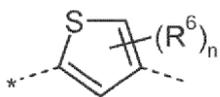
T2



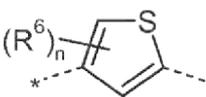
T3



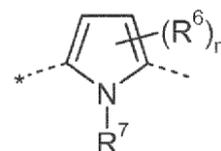
T4



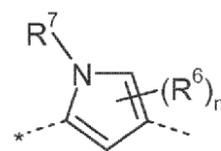
T5



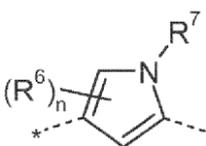
T6



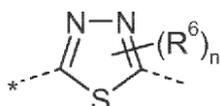
T7



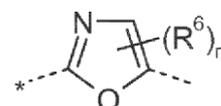
T8



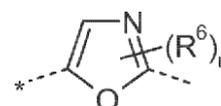
T9



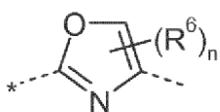
T10



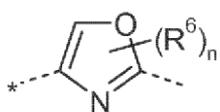
T11



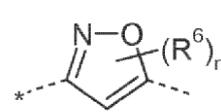
T12



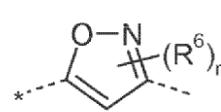
T13



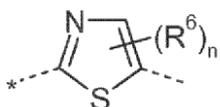
T14



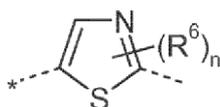
T15



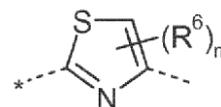
T16



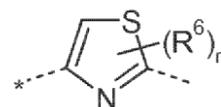
T17



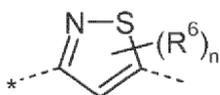
T18



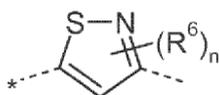
T19



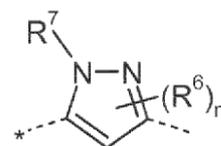
T20



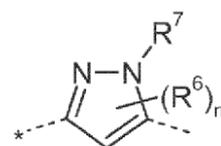
T21



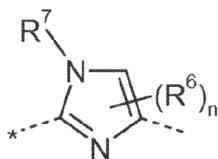
T22



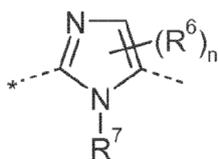
T23



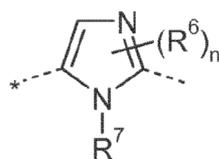
T24



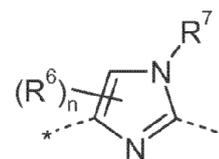
T25



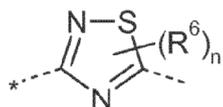
T26



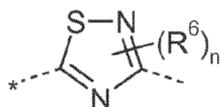
T27



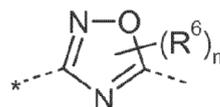
T28



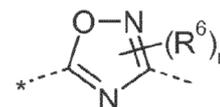
T29



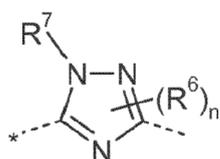
T30



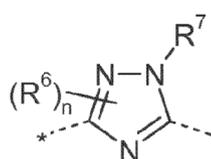
T31



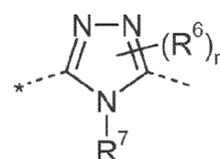
T32



T33



T34



T35

en donde

$R^6$  representa, de modo independiente entre sí, halógeno, ciano, nitro, amino o un alquilo  $C_1-C_6$ , alquil  $C_1-C_6$ -oxi, alquil  $C_1-C_6$ -carbonilo, alquil  $C_1-C_6$ -sulfanilo, alquil  $C_1-C_6$ -sulfinilo, alquil  $C_1-C_6$ -sulfonilo dado en caso sustituidos con halógeno y

$n$  representa los valores 0-1;

$R^7$  representa hidrógeno o un alquilo  $C_1-C_6$  o cicloalquilo  $C_3-C_6$  dado el caso sustituidos, en donde un grupo metileno puede estar sustituido dado el caso por heteroátomos;

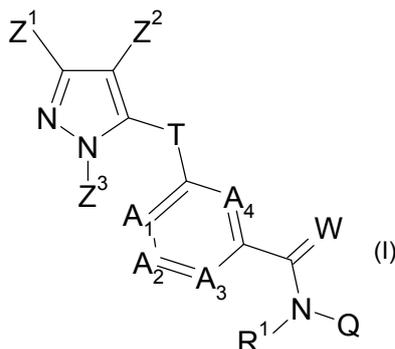
$Z^1$  representa haloalquilo  $C_1-C_6$ , halocicloalquilo  $C_3-C_6$  dado el caso sustituidos, y

$Z^2$  representa hidrógeno halógeno, ciano, nitro, amino o un alquilo  $C_1-C_6$ , alquil  $C_1-C_6$ -carbonilo, alquil  $C_1-C_6$ -sulfanilo, alquil  $C_1-C_6$ -sulfinilo, alquil  $C_1-C_6$ -sulfonilo dado el caso sustituidos y

$Z^3$  representa hidrógeno o un alquilo  $C_1-C_6$ , cicloalquilo  $C_3-C_6$ , heterocicloalquilo  $C_3-C_5$ , alquenilo  $C_3-C_6$ , alquinilo  $C_3-C_6$  dado el caso sustituidos,

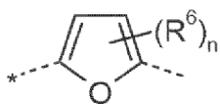
en donde para el caso de que T sea igual a T23 o T24, uno de los radicales  $Z^1$ ,  $Z^2$  o  $Z^3$  esté sustituido con al menos 3 átomos de halógeno.

Con preferencia especial, se definen compuestos de la fórmula (I)

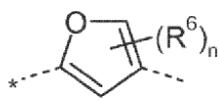


en los que

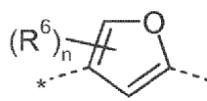
- 5 R<sup>1</sup> representa hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>, cicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-carbonilo, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-carbonilo, arilalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), heteroarilalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>) dado el caso mono- a pentasustituidos, de modo independiente entre sí, con flúor, cloro, ciano, alcoxi y alcoxycarbonilo,
- los grupos químicos
- A<sub>1</sub> representa CR<sup>2</sup> o nitrógeno,
- A<sub>2</sub> representa CR<sup>3</sup> o nitrógeno,
- A<sub>3</sub> representa CR<sup>4</sup> o nitrógeno y
- 10 A<sub>4</sub> representa CR<sup>5</sup> o nitrógeno,
- pero en donde no más que tres de los grupos químicos A<sub>1</sub> a A<sub>4</sub> representan al mismo tiempo nitrógeno;
- R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> representa, de modo independiente entre sí, hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, *N*-alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-imino-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-sulfanilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-sulfinilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-sulfonilo, *N*-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-amino o *N,N*-di-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-amino dado el caso mono- a pentasustituidos con flúor, cloro, ciano o alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;
- 15 W representa oxígeno o azufre;
- Q representa hidrógeno, hidroxilo, formilo, amino o uno de los grupos mono- o polisustituidos dado el caso, de modo independiente entre sí, con hidroxilo, nitro, amino, flúor, cloro, bromo, yodo, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, ciano, hidroxycarbonilo, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-carbonilo, carbamoilo, tiocarbamoilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-carbamoilo, cicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-carbamoilo, fenilo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, heterocicloalquilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, hidroxialquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, arilalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), heteroarilalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), *N*-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-amino, *N*-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-carbonilamino o *N,N*-di-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-amino; o
- 20 Q representa un anillo sustituido con 0, 1, 2 o 3 sustituyentes V o un compuesto heteroaromático de 5 o 6 miembros sustituido con 0, 1, 2 o 3 sustituyentes V, en donde
- 25 V representa, de modo independiente entre sí, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, *N*-alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-imino-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-sulfanilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-sulfinilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-sulfonilo, *N,N*-di-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)amino dado el caso sustituidos;
- 30 T representa uno de los compuestos heteroaromáticos T1-T35 de 5 miembros enumerados a continuación, en donde la unión con el grupo de cabeza de pirazol está identificada con un asterisco,



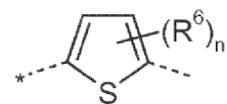
T1



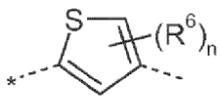
T2



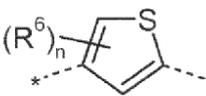
T3



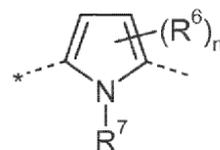
T4



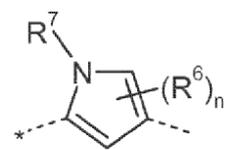
T5



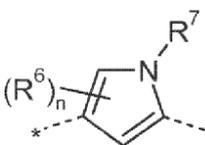
T6



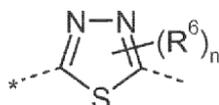
T7



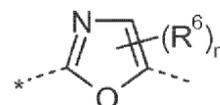
T8



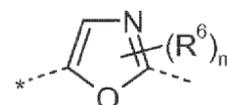
T9



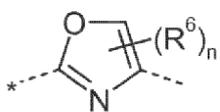
T10



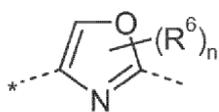
T11



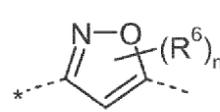
T12



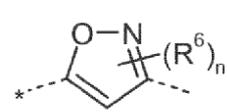
T13



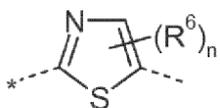
T14



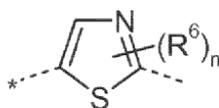
T15



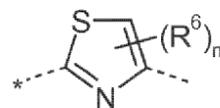
T16



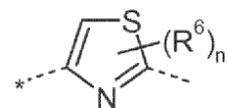
T17



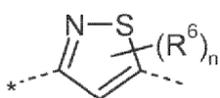
T18



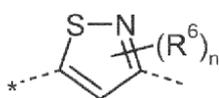
T19



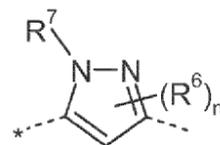
T20



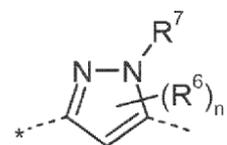
T21



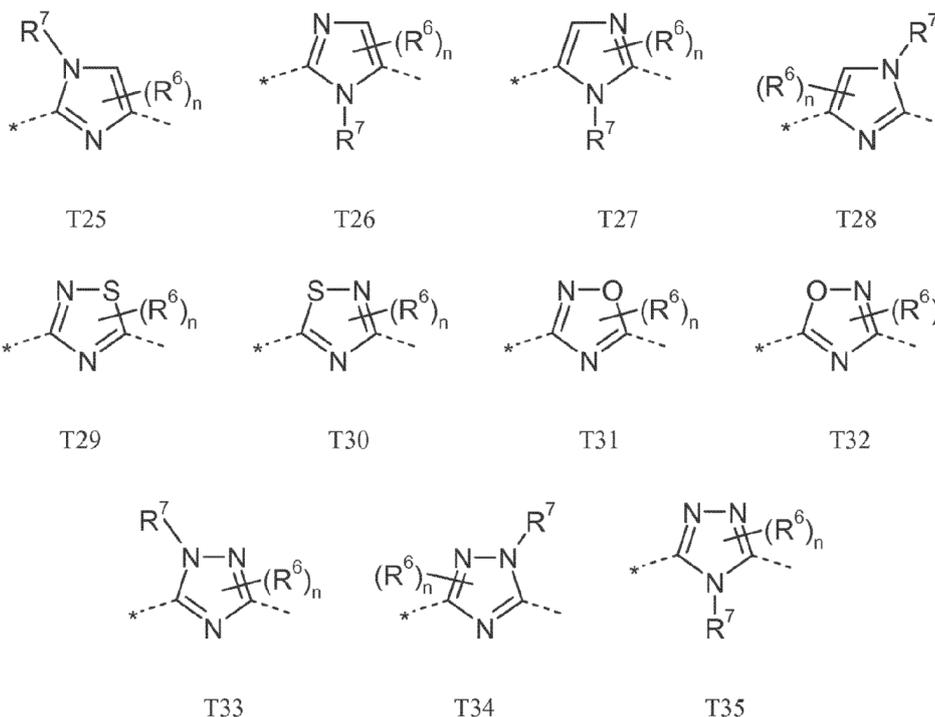
T22



T23



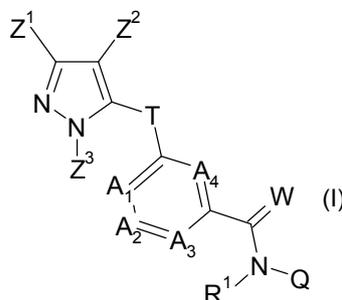
T24



en donde

- R<sup>6</sup> representa, de modo independiente entre sí, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, amino o un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-carbonilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-sulfanilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-sulfinilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-sulfonilo dado el caso mono- a pentasustituidos con flúor o cloro y
- 5 n representa los valores 0-1;
- R<sup>7</sup> representa hidrógeno o un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> o cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> dado el caso mono- a pentasustituidos con flúor, cloro, ciano o alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, en donde un grupo metileno puede estar sustituido dado el caso por heteroátomos; Z<sup>1</sup> representa un haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> dado el caso sustituidos, y
- 10 Z<sup>2</sup> representa hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, amino o un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-carbonilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-sulfanilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-sulfinilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-sulfonilo dado el caso mono- a pentasustituidos y
- Z<sup>3</sup> representa hidrógeno o un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> dado el caso mono- a pentasustituidos con flúor, cloro, ciano o alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;
- 15 en donde para el caso de que T sea igual a T23 o T24, uno de los radicales Z<sup>1</sup>, Z<sup>2</sup> o Z<sup>3</sup> esté sustituido con al menos 3 átomos de halógeno.

Se definen con preferencia muy especial los compuestos de la fórmula (I)

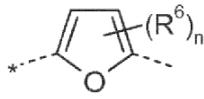


en los que

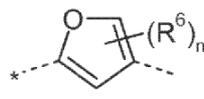
- R<sup>1</sup> representa hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, s-butilo, t-butilo, 2,2,-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, metoximetilo, etoximetilo, propoximetilo, metilcarbonilo, etilcarbonilo, n-propilcarbonilo, isopropilcarbonilo, s-butilcarbonilo, t-butilcarbonilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n-propoxicarbonilo, isopropoxicarbonilo, s-butoxicarbonilo, t-butoxicarbonilo, cianometilo, 2-cianoetilo, bencilo, 4-metoxibencilo, pirid-2-il-metilo, pirid-3-il-metilo, pirid-4-il-metilo, 6-cloro-pirid-3-il-metilo;
- 20

los grupos químicos

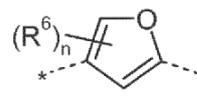
- A<sub>1</sub> representa CR<sup>2</sup> o nitrógeno,  
 A<sub>2</sub> representa CR<sup>3</sup> o nitrógeno,  
 A<sub>3</sub> representa CR<sup>4</sup> o nitrógeno y  
 A<sub>4</sub> representa CR<sup>5</sup> o nitrógeno,
- 5 pero en donde no más que tres de los grupos químicos A<sub>1</sub> a A<sub>4</sub> representan al mismo tiempo nitrógeno;  
 R<sup>2</sup> y R<sup>5</sup> representan, de modo independiente entre sí, hidrógeno, metilo, flúor y cloro y  
 R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> representa, de modo independiente entre sí, hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, metilo, etilo,  
 ciclopropilo, fluorometilo, difluorometilo, clorodifluorometilo, trifluorometilo, 2,2,2-trifluoroetilo, metoxi, etoxi, n-  
 propoxi, 1-metiletoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, cloro-difluorometoxi, dicloro-fluorometoxi, trifluorometoxi, 2,2,2-  
 10 trifluoroetoxi, 2-cloro-2,2-difluoroetoxi, pentafluoroetoxi, *N*-metoxiiminometilo, 1-(*N*-metoxiimino)-etilo, metilsulfanilo,  
 trifluorometilsulfanilo, metilsulfonilo, metilsulfinilo, trifluorometilsulfonilo, trifluorometilsulfinilo
- W representa oxígeno o azufre;
- Q  
 15 representa hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, 1-metiletilo, 1,1-dimetiletilo, 1-metilpropilo, n-butilo, 2-  
 metilpropilo, 2-metilbutilo, hidroxietilo, 2-hidroxiopropilo, cianometilo, 2-cianoetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-  
 difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 1-trifluorometiletilo, 2,2-difluoropropilo, 3,3,3-trifluoropropilo, 2,2-dimetil-3-  
 fluoropropilo, ciclopropilo, 1-ciano-ciclopropilo, 1-metil-ciclopropilo, 1-trifluorometil-ciclopropilo, 1-carbamoil-  
 ciclopropilo, 1-tiocarbamoil-ciclopropilo, 1-metoxycarbonil-ciclopropilo, 1-(*N*-metilcarbamoil)ciclopropilo, 1-(*N*-  
 20 ciclopropilcarbamoil)ciclopropilo, ciclopropil-metilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, 1-ciclopropiletilo,  
 bis(ciclopropil)metilo, 2,2-dimetilciclopropil-metilo, 2-fenilciclopropilo, 2,2-diclorociclopropilo, trans-2-  
 clorociclopropilo, cis-2-clorociclopropilo, 2,2-difluorciclopropilo, trans-2-fluorciclopropilo, cis-2-  
 fluorociclopropilo, trans-4-hidroxiciclohexilo, 4-trifluorometilciclohexilo, prop-2-enilo, 2-metilprop-2-enilo,  
 prop-2-inilo, 1,1-dimetilbut-2-inilo, 3-cloro-prop-2-enilo, 3,3-dicloro-prop-2-enilo, 3,3-dicloro-1,1-dimetilprop-  
 2-enilo, oxetan-3-ilo, tietan-3-ilo, 1-oxido-tietan-3-ilo, 1,1-dioxido-tietan-3-ilo, isoxazol-3-ilmetilo, 1,2,4-triazol-  
 3-ilmetilo, 3-metiloxetan-3-ilmetilo, bencilo, 2,6-difluorofenilmetilo, 3-fluorofenilmetilo, 2-fluorofenilmetilo, 4-  
 25 fluorofenilmetilo, 2,5-difluorofenilmetilo, 1-feniletilo, 4-clorofeniletilo, 2-trifluorometilfeniletilo, 1-piridin-2-iletilo,  
 piridin-2-ilmetilo, 5-fluoropiridin-2-ilmetilo, (6-cloro-piridin-3-il)metilo, pirimidin-2-ilmetilo, metoxi, 2-etoxietilo,  
 2-(metilsulfanil)etilo, 1-metil-2-(etilsulfanil)etilo, 2-metil-1-(metilsulfanil)propan-2-ilo, metoxicarbonilo,  
 metoxicarbonilmetilo, NH<sub>2</sub>, *N*-etilamino, *N*-alilamino, *N,N*-dimetilamino, *N,N*-dietilamino; o
- Q  
 30 representa un fenilo sustituido con 0, 1, 2 o 3 sustituyentes V, naftilo, piridazina, pirazina, pirimidina, triazina,  
 piridina, pirazol, tiazol, isotiazol, oxazol, isoxazol, triazol, Imidazol, furano, tiofeno, pirrol, oxadiazol, tiadiazol,  
 en donde
- V  
 35 representa, de modo independiente entre sí, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, metilo, etilo,  
 difluorometilo, triclorometilo, clorodifluorometilo, diclorofluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo,  
 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 1,2,2,2-tetrafluoroetilo, 1-cloro-1,2,2,2-tetrafluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo,  
 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 1,1-difluoroetilo, pentafluoroetilo, heptafluoro-*n*-propilo, heptafluoro-*isopropilo*,  
 nonafluoro-*n*-butilo, ciclopropilo, ciclobutilo, metoxi, etoxi, n-propoxi, 1-metiletoxi, fluorometoxi,  
 difluorometoxi, cloro-difluorometoxi, dicloro-fluorometoxi, trifluorometoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2,2-  
 difluoroetoxi, pentafluoroetoxi, *N*-metoxiiminometilo, 1-(*N*-metoxiimino)-etilo, metilsulfanilo, metilsulfonilo,  
 metilsulfinilo, trifluorometilsulfonilo, trifluorometilsulfinilo, trifluorometilsulfanilo, *N,N*-dimetilamino;
- 40 T representa uno de los compuestos heteroaromáticos T1-T35 de 5 miembros enumerados a continuación, en  
 donde la unión con el grupo de cabeza de pirazol está identificada con un asterisco,



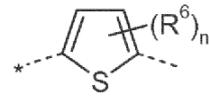
T1



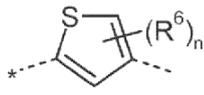
T2



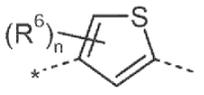
T3



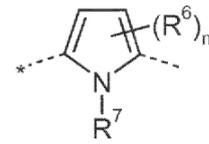
T4



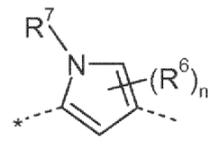
T5



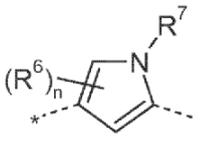
T6



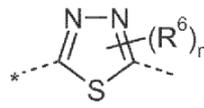
T7



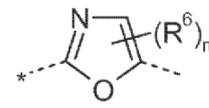
T8



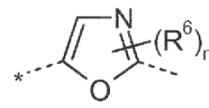
T9



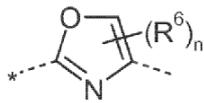
T10



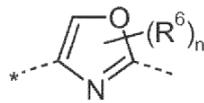
T11



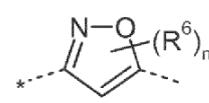
T12



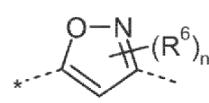
T13



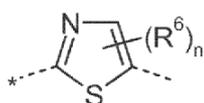
T14



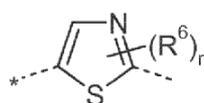
T15



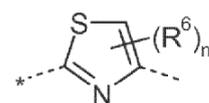
T16



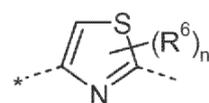
T17



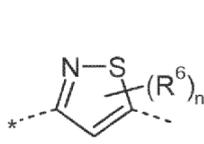
T18



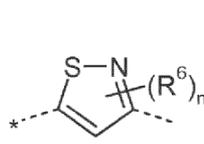
T19



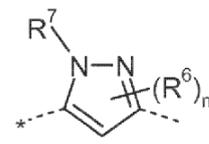
T20



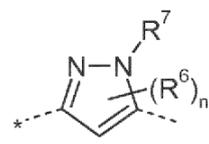
T21



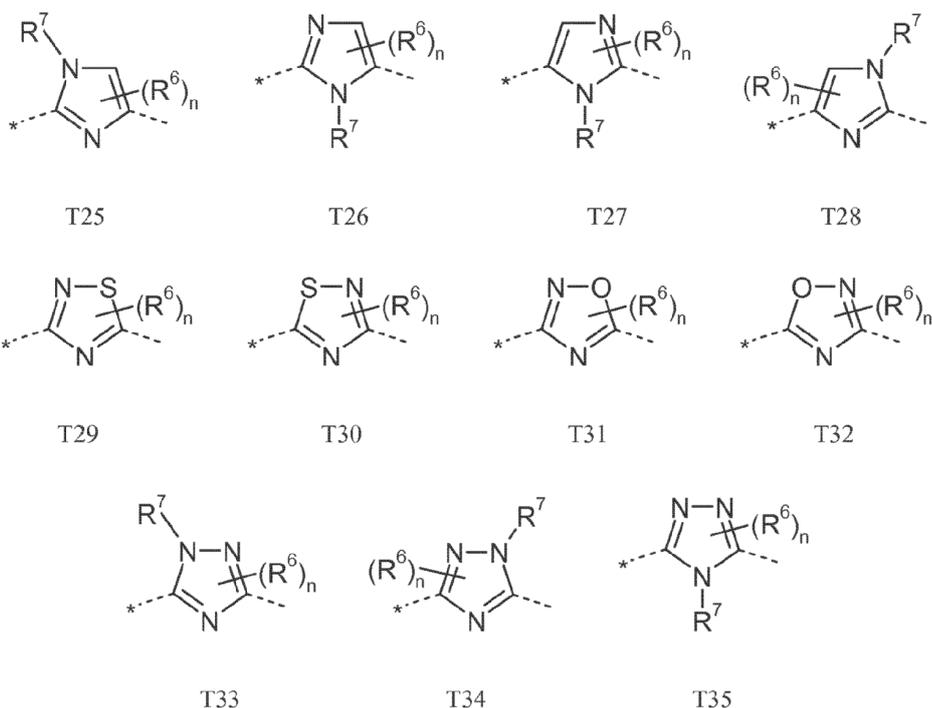
T22



T23



T24



en donde

- 5  $R^6$  representa, de modo independiente entre sí, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, amino, metilo, etilo, n-propilo, 1-metiletilo, terc-butilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, etoxi, trifluorometoxi, 2,2-difluoroetoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, metilcarbonilo, etilcarbonilo, trifluorometilcarbonilo, metilsulfanilo, metilsulfinilo, metilsulfonilo, trifluorometilsulfonilo, trifluorometilsulfanilo, trifluorometilsulfinilo y
- $n$  representa los valores 0-1;
- 10  $R^7$  representa hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, s-butilo, t-butilo, etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-propinilo, 1-butinilo, difluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 1-fluoro-1-metiletilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo;
- 15  $Z^1$  representa difluorometilo, triclorometilo, clorodifluorometilo, diclorofluorometilo, trifluorometilo, bromodiclorometilo, 1-fluoroetilo, 1-fluoro-1-metiletilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 1,2,2,2-tetrafluoroetilo, 1-cloro-1,2,2,2-tetrafluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 1,1-difluoroetilo, pentafluoroetilo, heptafluoro-n-propilo, heptafluoro-isopropilo, nonafluoro-n-butilo, 1-clorociclopropilo, 1-fluorociclopropilo, 1-bromociclopropilo, 1-trifluorometil-ciclopropilo y 2,2-difluoro-1-metil-ciclopropilo, y
- 20  $Z^2$  representa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, amino, metilo, etilo, n-propilo, 1-metiletilo, 1,1-dimetiletilo, difluorometilo, triclorometilo, clorodifluorometilo, diclorofluorometilo, trifluorometilo, bromodiclorometilo, 1-fluoroetilo, 1-fluoro-1-metiletilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 1,2,2,2-tetrafluoroetilo, 1-cloro-1,2,2,2-tetrafluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 1,1-difluoroetilo, pentafluoroetil pentafluoro-t-butilo, heptafluoro-n-propilo, heptafluoro-isopropilo, nonafluoro-n-butilo, metilsulfanilo, metilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfanilo, etilsulfinilo, etilsulfonilo, trifluorometilsulfanilo, trifluorometilsulfinilo, trifluorometilsulfonilo, cloro-difluorometilsulfanilo, cloro-difluorometilsulfinilo, cloro-difluorometilsulfonilo, dicloro-fluorometilsulfanilo, dicloro-fluorometilsulfinilo, dicloro-fluorometilsulfonilo y
- 25  $Z^3$  representa hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, s-butilo, t-butilo, prop-2-enilo, prop-2-inilo, but-3-inilo, difluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 1-fluoro-1-metiletilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo; en donde para el caso de que T sea igual a T23 o T24, uno de los radicales  $Z^1$ ,  $Z^2$  o  $Z^3$  esté sustituido con al menos 3 átomos de halógeno.

Se prefieren en especial los compuestos de la fórmula general (I), en los que

- 30  $Z^1$  representa trifluorometilo, 1-cloro-ciclopropilo, 1-fluoro-ciclopropilo o pentafluoroetilo,
- $Z^2$  representa trifluorometilo, nitro, metilsulfanilo, metilsulfinilo, metilsulfonilo, flúor, cloro, bromo, ciano o yodo,
- $Z^3$  representa metilo, etilo, n-propilo o hidrógeno,

R<sup>1</sup> representa hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, i-butilo, s-butilo, t-butilo, metoximetilo, etoximetilo, propoximetilo, metilcarbonilo, etilcarbonilo, n-propilcarbonilo, isopropilcarbonilo, s-butilcarbonilo, t-butilcarbonilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n-propoxicarbonilo, isopropoxicarbonilo, s-butoxicarbonilo, t-butoxicarbonilo, cianometilo, 2-cianoetilo, bencilo, 4-metoxibencilo, pirid-2-il-metilo, pirid-3-il-metilo, pirid-4-il-metilo, 6-cloro-pirid-3-il-metilo,

5

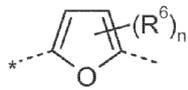
A<sup>1</sup> y A<sup>4</sup> representan CH y A<sup>2</sup> representa CH o N

A<sub>3</sub> representa CR<sup>4</sup> y

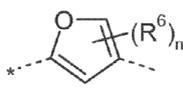
R<sup>4</sup> representa flúor, cloro, bromo, yodo o metilo

T representa uno de los compuestos heteroaromáticos T1-T35 de 5 miembros enumerados a continuación, en donde la unión con el grupo de cabeza de pirazol está identificada con un asterisco,

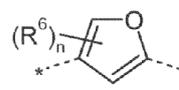
10



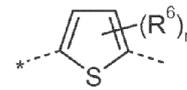
T1



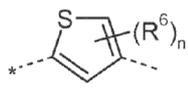
T2



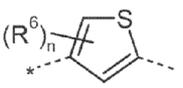
T3



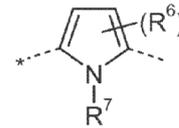
T4



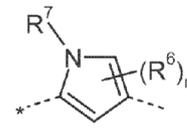
T5



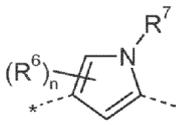
T6



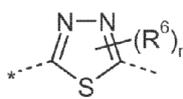
T7



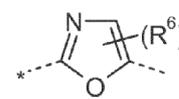
T8



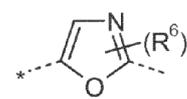
T9



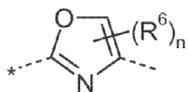
T10



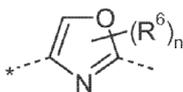
T11



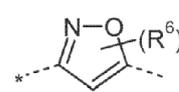
T12



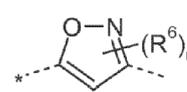
T13



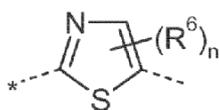
T14



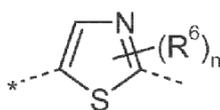
T15



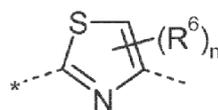
T16



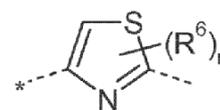
T17



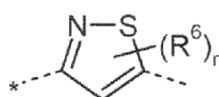
T18



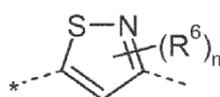
T19



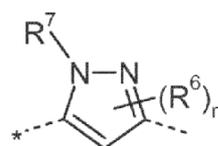
T20



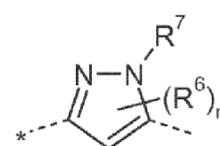
T21



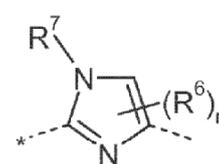
T22



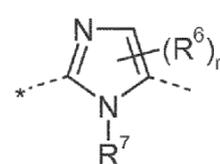
T23



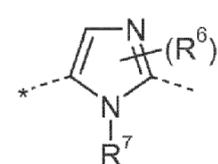
T24



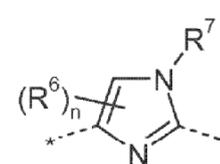
T25



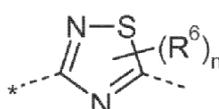
T26



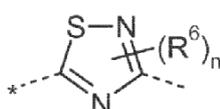
T27



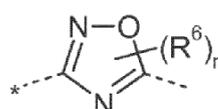
T28



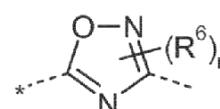
T29



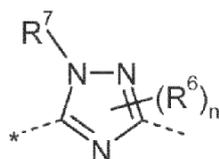
T30



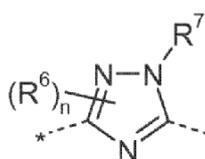
T31



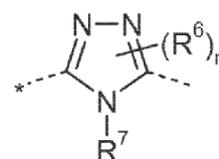
T32



T33



T34



T35

en donde

R<sup>6</sup> representa hidrógeno, metilo, etilo, 2-metiletilo, 2,2-dimetiletilo, flúor, cloro, bromo, yodo, nitro, trifluorometilo, amino, y

5 n representa los valores 0-1;

W representa oxígeno y

10 Q representa hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, 1-metiletilo, 1,1-dimetiletilo, n-butilo, 1-metilpropilo, 2-metilpropilo, 2-metilbutilo, hidroximetilo, 2-hidroxiopropilo, cianometilo, 2-cianoetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 1-trifluorometiletilo, 2,2-difluoropropilo, 3,3,3-trifluoropropilo, 2,2-dimetil-3-fluoropropilo, ciclopropilo, 1-ciano-ciclopropilo, 1-metil-ciclopropilo, 1-trifluorometil-ciclopropilo, 1-carbamoil-ciclopropilo, 1-tiocarbamoil-ciclopropilo, 1-metoxicarbonil-ciclopropilo, 1-(N-metilcarbamoil)ciclopropilo, 1-(N-ciclopropilcarbamoil)ciclopropilo, ciclopropil-metilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, 1-ciclopropiletilo, bis(ciclopropil)metilo, 2,2-dimetilciclopropil-metilo, 2-fenilciclopropilo, 2,2-diclorociclopropilo, trans-2-clorociclopropilo, cis-2-clorociclopropilo, 2,2-difluorociclopropilo, trans-2-fluorociclopropilo, cis-2-

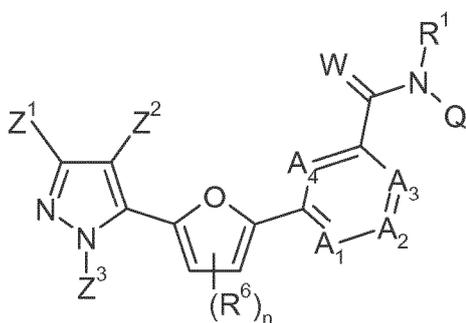
5 fluorociclopropilo, trans-4-hidroxiciclohexilo, 4-trifluorometilciclohexilo, prop-2-enilo, 2-metilprop-2-enilo, prop-2-inilo, 1,1-dimetilbut-2-inilo, 3-cloro-prop-2-enilo, 3,3-dicloro-prop-2-enilo, 3,3-dicloro-1,1-dimetilprop-2-enilo, oxetan-3-ilo, tietan-3-ilo, 1-oxido-tietan-3-ilo, 1,1-dioxido-tietan-3-ilo, isoxazol-3-ilmetilo, 1,2,4-triazol-3-ilmetilo, 3-metiloxetan-3-ilmetilo, bencilo, 2,6-difluorofenilmetilo, 3-fluorofenilmetilo, 2-fluorofenilmetilo, 4-fluorofenilmetilo, 2,5-difluorofenilmetilo, 1-feniletilo, 4-clorofeniletilo, 2-trifluorometilfeniletilo, 1-piridin-2-iletilo, piridin-2-ilmetilo, (6-cloro-piridin-3-il)metilo, 5-fluoropiridin-2-ilmetilo, pirimidin-2-ilmetilo, metoxi, 2-etoxietilo, 2-(metilsulfanil)etilo, 1-metil-2-(etilsulfanil)etilo, 2-metil-1-(metilsulfanil)propan-2-ilo, metoxicarbonilo, metoxicarbonilmetilo, NH<sub>2</sub>, N-etilamino, N-alilamino, N,N-dimetilamino, N,N-dietilamino; o

10 Q representa un fenilo sustituido con 0, 1, 2 o 3 sustituyentes V, naftilo, piridazina, pirazina, pirimidina, triazina, piridina, pirazol, tiazol, isotiazol, oxazol, isoxazol, triazol, Imidazol, furano, tiofeno, pirrol, oxadiazol, tiadiazol, en donde

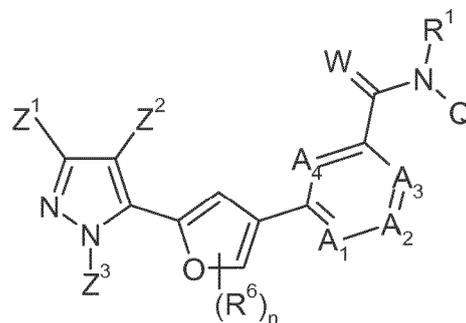
15 V representa, de modo independiente entre sí, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, metilo, etilo, difluorometilo, triclorometilo, clorodifluorometilo, diclorofluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 1,2,2,2-tetrafluoroetilo, 1-cloro-1,2,2,2-tetrafluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 1,1-difluoroetilo, pentafluoroetil pentafluoro-terc-butilo, heptafluoro-n-propilo, heptafluoro-isopropilo, nonafluoro-n-butilo, ciclopropilo, ciclobutilo, metoxi, etoxi, n-propoxi, 1-metiletoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, cloro-difluorometoxi, dicloro-fluorometoxi, trifluorometoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2,2-difluoroetoxi, pentafluoroetoxi, N-metoxiiminometilo, 1-(N-metoxiimino)-etilo, metilsulfanilo, metilsulfonilo, metilsulfinilo, trifluorometilsulfonilo, trifluorometilsulfinilo, trifluorometilsulfanilo, N,N-dimetilamino;

20 en donde para el caso de que T sea igual a T23 o T24, uno de los radicales Z<sup>1</sup>, Z<sup>2</sup> o Z<sup>3</sup> esté sustituido con al menos 3 átomos de halógeno.

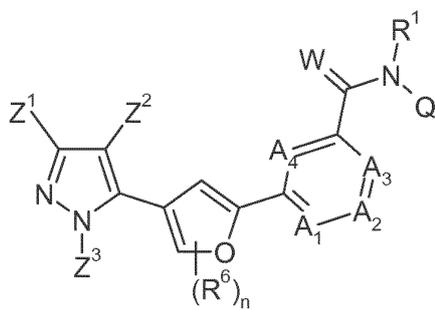
25 En especial también se prefieren los compuestos que se definen cada uno por medio de las fórmulas generales (Iaa) – (Ibi), en los que los radicales A<sub>1</sub>-A<sub>4</sub>, n, W, Q, R<sup>1</sup> y Z<sup>1</sup>-Z<sup>3</sup> tienen los significados generales, preferidos o particularmente preferidos descritos con anterioridad.



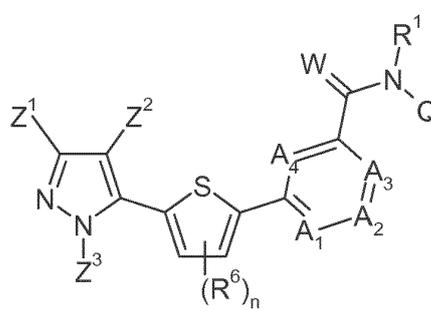
(Iaa)



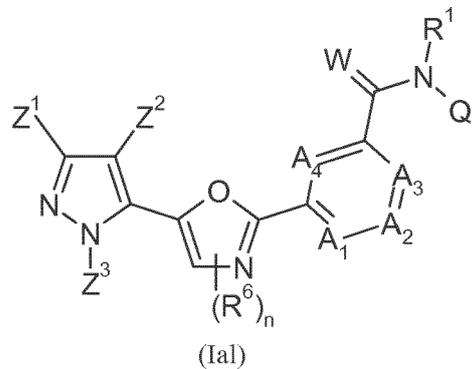
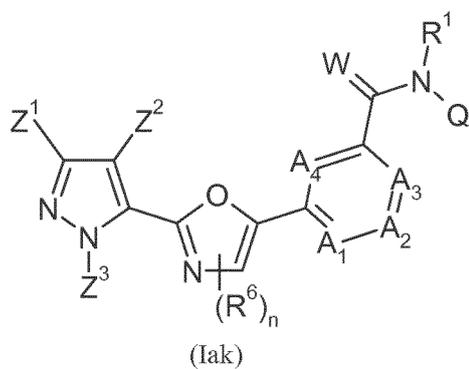
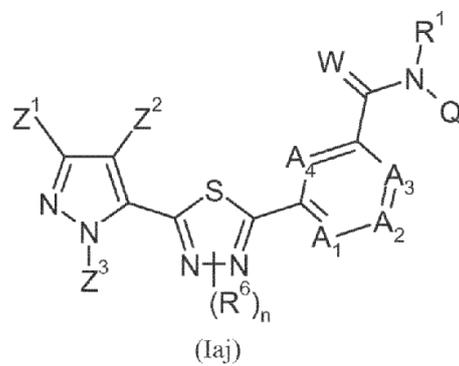
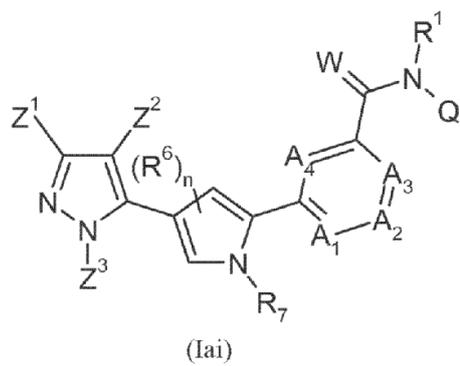
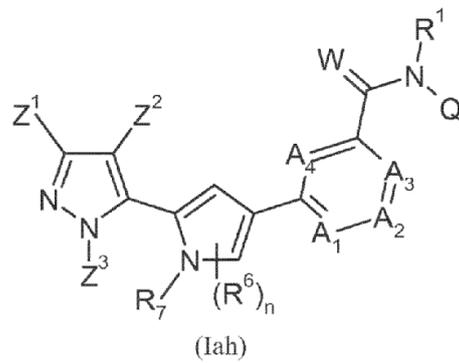
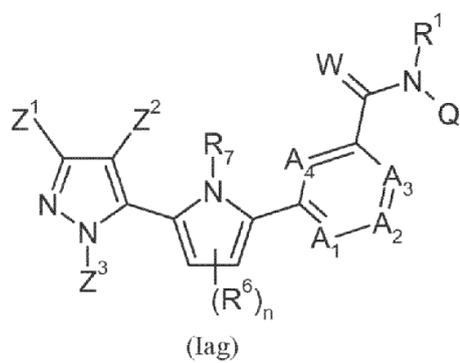
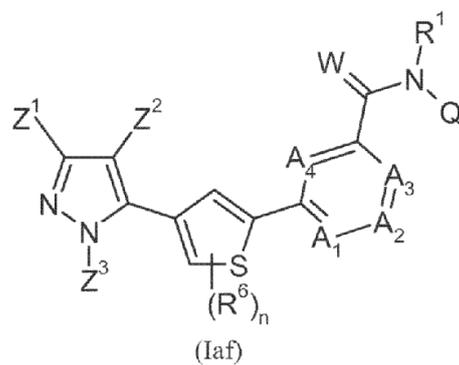
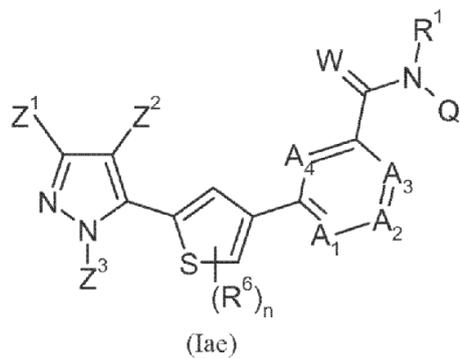
(Iab)

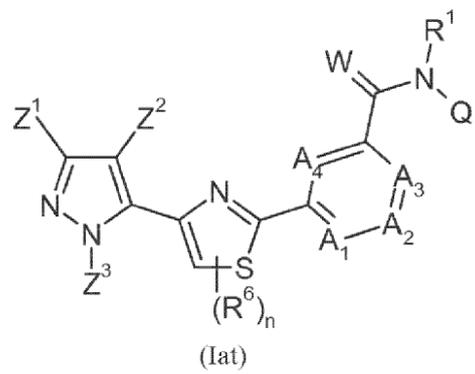
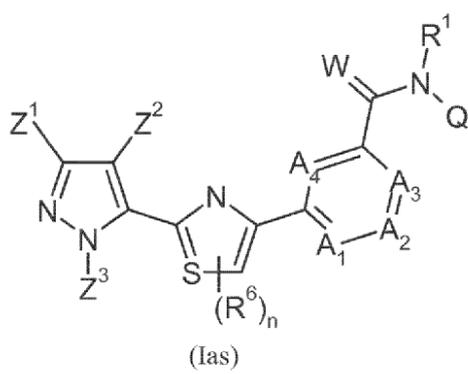
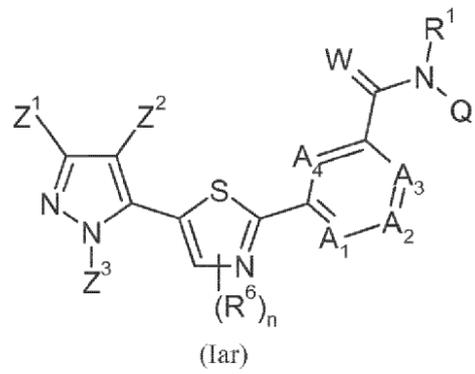
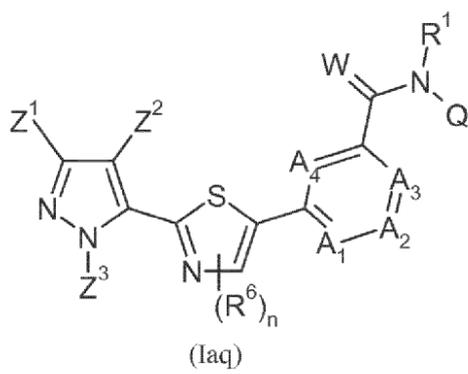
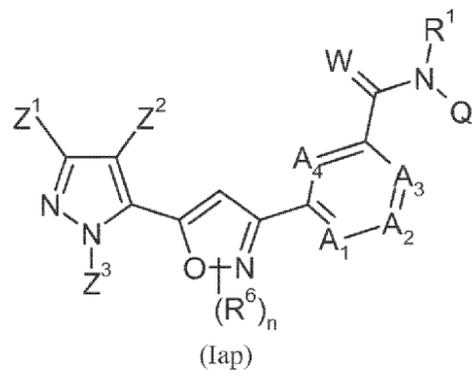
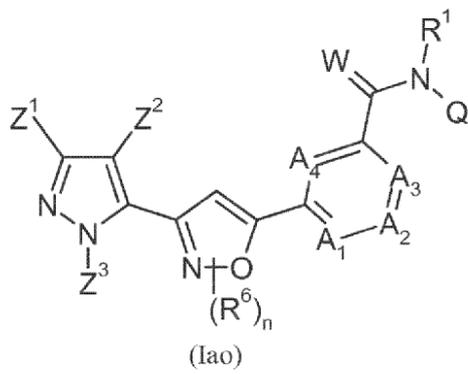
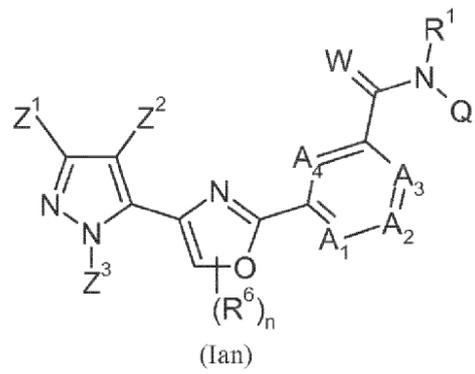
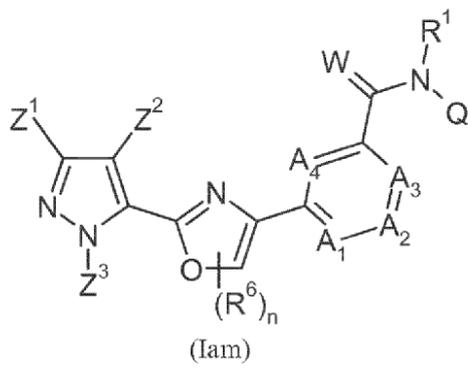


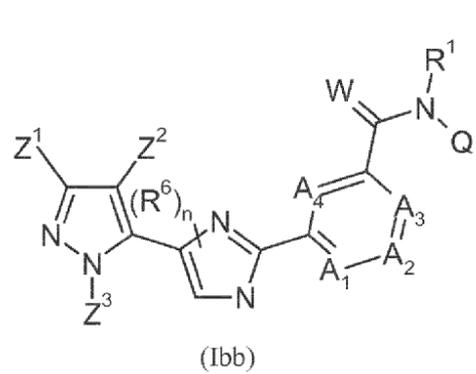
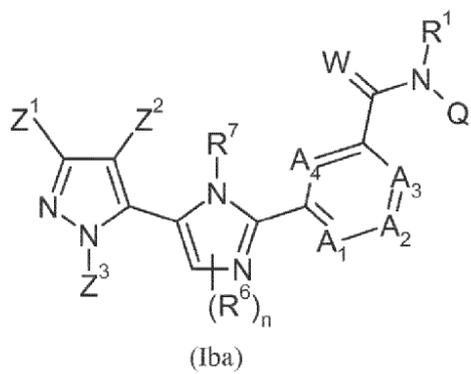
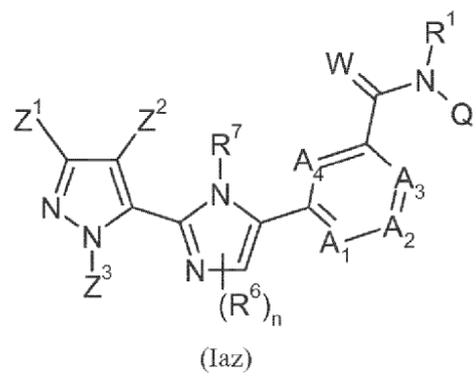
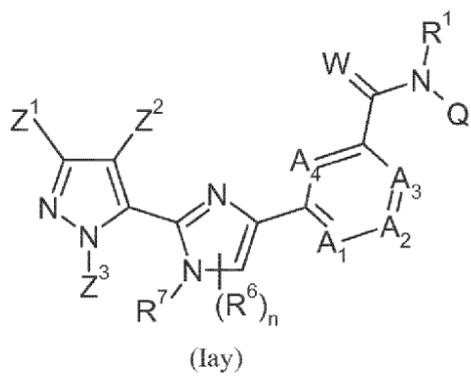
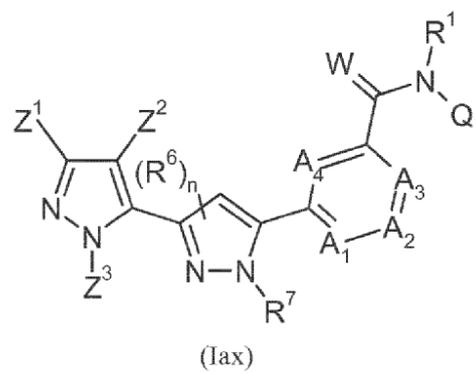
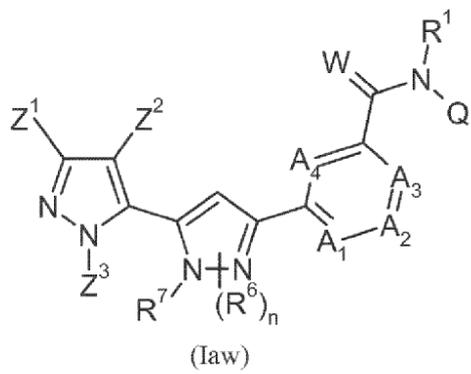
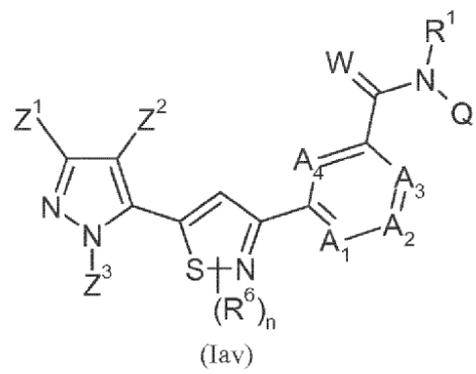
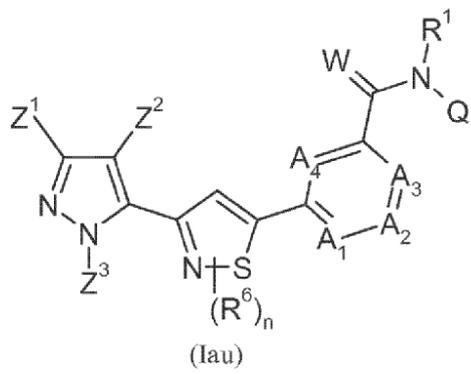
(Iac)

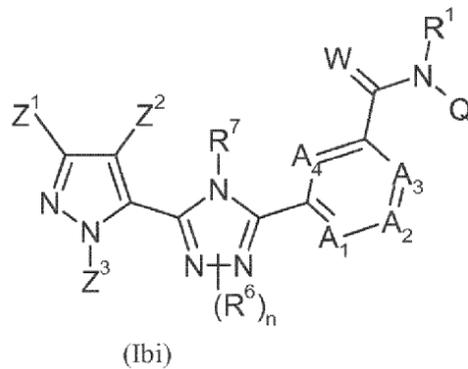
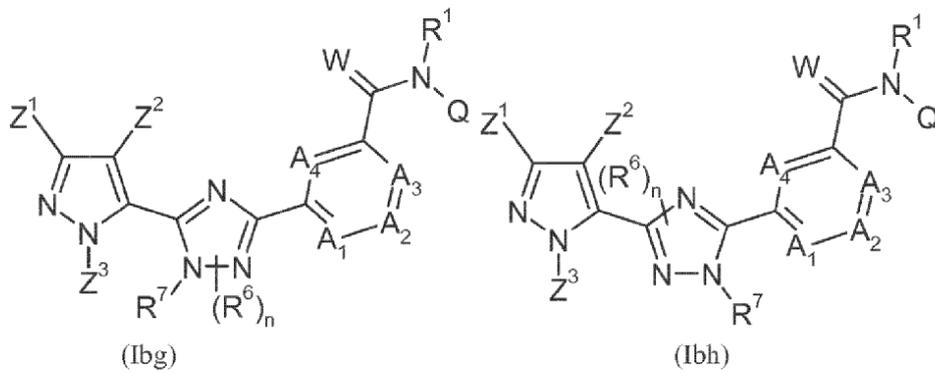
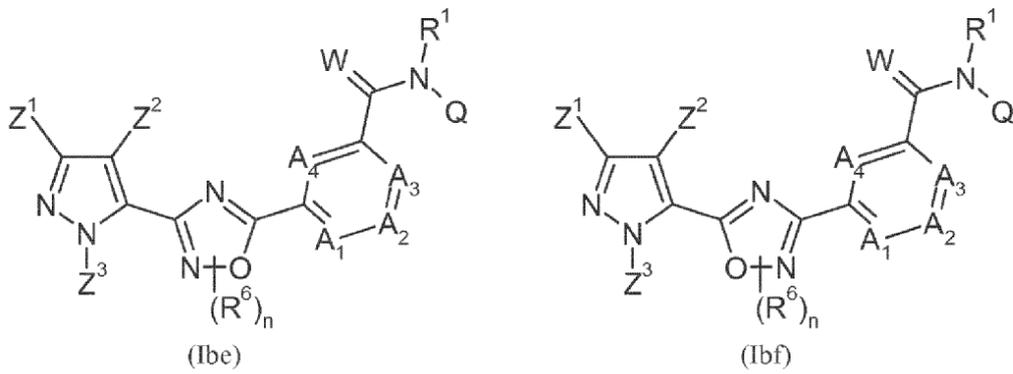
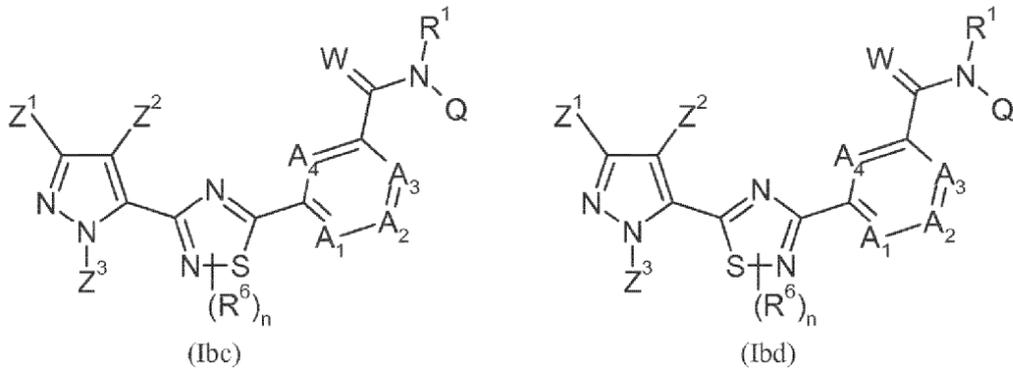


(Iad)









en donde, para el caso de las fórmulas generales (Iaw) y (Iax), rige que uno de los radicales Z<sup>1</sup>, Z<sup>2</sup> o Z<sup>3</sup> esté sustituido con al menos 3 átomos de halógeno.

Se prefieren en especial los compuestos de las fórmulas (Iap).

5 Además, se prefieren en especial los compuestos de la fórmula (Ibg).

Además, se prefieren en especial los compuestos de la fórmula (Iac).

Además, se prefieren en especial los compuestos de la fórmula (Iaq).

Además, se prefieren en especial los compuestos de la fórmula (Ibd).

Además, se prefieren en especial los compuestos de la fórmula (Ibe).

5 Además, se prefieren en especial los compuestos de la fórmula (Ibf).

Además, se prefieren en especial los compuestos de la fórmula (Ibh).

Además, se prefieren en especial los compuestos de la fórmula (Ibi).

Además, se prefieren en especial los compuestos de la fórmula (Iaf).

Además, se prefieren en especial los compuestos de la fórmula (Iaa).

10 Además, se prefieren los compuestos de las fórmulas (Iap), (Ibg), (Iac), (Iaq), (Ibd), (Ibe), (Ibf), (Ibh), (Ibi), (Iaf) y (Iaa), en donde W representa oxígeno.

Además, se prefieren los compuestos de las fórmulas (Iap), (Ibg), (Iac), (Iaq), (Ibd), (Ibe), (Ibf), (Ibh), (Ibi), (Iaf) y (Iaa), en donde W representa oxígeno y R<sup>1</sup> representa hidrógeno.

15 Además, se prefieren los compuestos de las fórmulas (Iap), (Ibg), (Iac), (Iaq), (Ibd), (Ibe), (Ibf), (Ibh), (Ibi), (Iaf) y (Iaa), en donde, cuando estén presentes, R<sup>6</sup>, R<sup>6a</sup>, R<sup>6b</sup>, R<sup>7</sup> representen hidrógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, con preferencia, representa hidrógeno.

20 Se prefieren muy especialmente los compuestos de la fórmula general (Iaa) – (Ibi), en los que Z<sup>1</sup> representa CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, Z<sup>2</sup> representa CF<sub>3</sub>, Z<sup>3</sup> representa CH<sub>3</sub>, los radicales R<sup>1</sup> y R<sup>6</sup> representan hidrógeno, A<sup>1</sup> y A<sup>4</sup> representan CH y A<sup>2</sup> representa CH o N, A<sup>3</sup> representa C-Cl, W representa oxígeno y R<sup>1</sup> representa hidrógeno y Q representa hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloado como trifluoroetilo (por ejemplo, CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>), ciclopropilo dado el caso sustituido con ciano o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloado tales como ciclopropilo, 1-(ciano)ciclopropilo, 1-(trifluorometil)ciclopropilo, fenilo dado el caso sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes (con preferencia, con un sustituyente) seleccionados, de modo independiente entre sí, de alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, Cl, F, I como, por ejemplo, fenilo o bencilo o 4-fluorofenilo.

25 Se prefieren muy especialmente los compuestos de la fórmula general (Iap), (Ibg), (Iac), (Iaq), (Ibd), (Ibe), (Ibf), (Ibh), (Ibi), (Iaf) y (Iaa), en los que Z<sup>1</sup> representa CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, Z<sup>2</sup> representa CF<sub>3</sub>, Z<sup>3</sup> representa CH<sub>3</sub>, los radicales R<sup>1</sup> y R<sup>6</sup> representan hidrógeno, A<sup>1</sup> y A<sup>4</sup> representan CH y A<sup>2</sup> representa CH o N, A<sup>3</sup> representa C-Cl o C-H, W representa oxígeno y R<sup>1</sup> representa hidrógeno y Q representa hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloado como trifluoroetilo (por ejemplo, CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>), ciclopropilo dado el caso sustituido con ciano o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloado tales como ciclopropilo, 1-(ciano)ciclopropilo, 1-(trifluorometil)ciclopropilo, fenilo dado el caso sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes (con preferencia con un sustituyente) seleccionados, de modo independiente entre sí, de alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, Cl, F, I tales como, por ejemplo, fenilo o bencilo o 4-fluorofenilo.

30 También se prefieren en especial los compuestos de la fórmula general (Iap), en los que Q está seleccionado de: alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloado como trifluoroetilo (por ejemplo, CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>), ciclopropilo dado el caso sustituido con ciano o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloado como 1-(ciano)ciclopropilo o 1-(trifluorometil)ciclopropilo, tietan-3-ilo, 2-oxo-2-(2,2,2-trifluoroetilamino)etilo.

35 También se prefieren en especial los compuestos de la fórmula general (Iap), en los que Z<sup>1</sup> representa CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, Z<sup>2</sup> representa CF<sub>3</sub>, Z<sup>3</sup> representa CH<sub>3</sub>, los radicales R<sup>1</sup> y R<sup>6</sup> representan hidrógeno, A<sup>1</sup> y A<sup>4</sup> representan CH y A<sup>2</sup> representa CH, A<sup>3</sup> representa C-Cl, W representa oxígeno y R<sup>1</sup> representa hidrógeno y Q se selecciona de: alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloado como trifluoroetilo (por ejemplo, CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>), ciclopropilo dado el caso sustituido con ciano o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloado como 1-(ciano)ciclopropilo o 1-(trifluorometil)ciclopropilo, tietan-3-ilo, 2-oxo-2-(2,2,2-trifluoroetilamino)etilo.

40 En especial también se prefieren los compuestos de la fórmula general (Ibg), en los que Q se selecciona de: alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloado como trifluoroetilo (por ejemplo, CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>), ciclopropilo dado el caso sustituido con ciano o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloado como ciclopropilo, fenilo dado el caso sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes (con preferencia, con un sustituyente) seleccionados, de modo independiente entre sí, de alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, Cl, F, I como, por ejemplo, fenilo o bencilo.

45 En especial también se prefieren los compuestos de la fórmula general (Ibg), en los que Z<sup>1</sup> representa CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, Z<sup>2</sup> representa CF<sub>3</sub>, Z<sup>3</sup> representa CH<sub>3</sub>, los radicales R<sup>1</sup> y R<sup>7</sup> representan hidrógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, A<sup>1</sup> y A<sup>4</sup> representan CH y A<sup>2</sup> representa CH, A<sup>3</sup> representa C-Cl, W representa oxígeno y R<sup>1</sup> representa hidrógeno y Q se selecciona de: alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloado como trifluoroetilo (por ejemplo, CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>), ciclopropilo dado el caso sustituido con ciano o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloado como ciclopropilo, fenilo dado el caso sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes (con preferencia, con un sustituyente) seleccionados, de modo independiente entre sí, de alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, Cl, F, I como por

ejemplo, fenilo o bencilo.

En especial también se prefieren los compuestos de la fórmula general (Ibh), en los que Q se selecciona de: alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloado como trifluoroetilo (por ejemplo, CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>), ciclopropilo dado el caso sustituido con ciano o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloado como ciclopropilo, fenilo dado el caso sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes (con preferencia, con un sustituyente) seleccionados, de modo independiente entre sí, de alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, Cl, F, I como por ejemplo, bencilo.

En especial también se prefieren los compuestos de la fórmula general (Ibh), en los que Z<sup>1</sup> representa CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, Z<sup>2</sup> representa CF<sub>3</sub>, Z<sup>3</sup> representa CH<sub>3</sub>, los radicales R<sup>1</sup> y R<sup>7</sup> representan hidrógeno, A<sup>1</sup> y A<sup>4</sup> representan CH y A<sup>2</sup> representa CH, A<sup>3</sup> representa C-Cl, W representa oxígeno y R<sup>1</sup> representa hidrógeno y Q se selecciona de: alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloado como trifluoroetilo (por ejemplo, CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>), ciclopropilo dado el caso sustituido con ciano o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloado como ciclopropilo, fenilo dado el caso sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes (con preferencia, con un sustituyente) seleccionados, de modo independiente entre sí, de alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, Cl, F, I como, por ejemplo, bencilo.

En una realización particularmente preferida, Q representa en los compuestos de las fórmulas (Iap), (Ibg), (Iac), (Iaq), (Ibd), (Ibe), (Ibf), (Ibh), (Ibi), (Iaf) y (Iaa) 1-ciano-ciclopropilo o ciclopropilo.

De acuerdo con la invención "alquilo" – en solitario o como componente de un grupo químico – representa hidrocarburos de cadena lineal o ramificada, preferentemente con 1 a 6 átomos de carbono como, por ejemplo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, s-butilo, t-butilo, pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 1,2-dimetilpropilo, 1,1-dimetilpropilo, 2,2-dimetilpropilo, 1-etilpropilo, hexilo, 1-metilpentilo, 2-metilpentilo, 3-metilpentilo, 4-metilpentilo, 1,2-dimetilpropilo, 1,3-dimetilbutilo, 1,4-dimetilbutilo, 2,3-dimetilbutilo, 1,1-dimetilbutilo, 2,2-dimetilbutilo, 3,3-dimetilbutilo, 1,1,2-trimetilpropilo, 1,2,2-trimetilpropilo, 1-etilbutilo y 2-etilbutilo. Son más preferidos alquilos con 1 a 4 átomos de carbono, como entre otros metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, s-butilo o t-butilo. Los alquilos de acuerdo con la invención pueden estar sustituidos con uno o varios restos, iguales o diferentes.

De acuerdo con la invención "alqueno" - en solitario o como componente de un grupo químico – representa hidrocarburos de cadena lineal o ramificada, preferentemente con 2 a 6 átomos de carbono y al menos un enlace doble como, por ejemplo, vinilo, 2-propenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-2-propenilo, 2-metil-2-propenilo, 2-pentenilo, 3-pentenilo, 4-pentenilo, 1-metil-2-butenilo, 2-metil-2-butenilo, 3-metil-2-butenilo, 1-metil-3-butenilo, 2-metil-3-butenilo, 3-metil-3-butenilo, 1,1-dimetil-2-propenilo, 1,2-dimetil-2-propenilo, 1-etil-2-propenilo, 2-hexenilo, 3-hexenilo, 4-hexenilo, 5-hexenilo, 1-metil-2-pentenilo, 2-metil-2-pentenilo, 3-metil-2-pentenilo, 4-metil-2-pentenilo, 3-metil-3-pentenilo, 4-metil-3-pentenilo, 1-metil-4-pentenilo, 2-metil-4-pentenilo, 3-metil-4-pentenilo, 4-metil-4-pentenilo, 1,1-dimetil-2-butenilo, 1,1-dimetil-3-butenilo, 1,2-dimetil-2-butenilo, 1,2-dimetil-3-butenilo, 1,3-dimetil-2-butenilo, 2,2-dimetil-3-butenilo, 2,3-dimetil-2-butenilo, 2,3-dimetil-3-butenilo, 1-etil-2-butenilo, 1-etil-3-butenilo, 2-etil-2-butenilo, 2-etil-3-butenilo, 1,1,2-trimetil-2-propenilo, 1-etil-1-metil-2-propenilo y 1-etil-2-metil-2-propenilo. Son más preferidos alquenos con 2 a 4 átomos de carbono, como entre otros 2-propenilo, 2-butenilo o 1-metil-2-propenilo. Los alquenos de acuerdo con la invención pueden estar sustituidos con uno o varios restos, iguales o diferentes.

De acuerdo con la invención "alquino" – en solitario o como componente de un grupo químico – representa hidrocarburos de cadena lineal o ramificada, preferentemente con 2 a 6 átomos de carbono y al menos un enlace triple como por ejemplo 2-propinilo, 2-butinilo, 3-butinilo, 1-metil-2-propinilo, 2-pentinilo, 3-pentinilo, 4-pentinilo, 1-metil-3-butinilo, 2-metil-3-butinilo, 1-metil-2-butinilo, 1,1-dimetil-2-propinilo, 1-etil-2-propinilo, 2-hexinilo, 3-hexinilo, 4-hexinilo, 5-hexinilo, 1-metil-2-pentinilo, 1-metil-3-pentinilo, 1-metil-4-pentinilo, 2-metil-3-pentinilo, 2-metil-4-pentinilo, 3-metil-4-pentinilo, 4-metil-2-pentinilo, 1,1-dimetil-3-butinilo, 1,2-dimetil-3-butinilo, 2,2-dimetil-3-butinilo, 1-etil-3-butinilo, 2-etil-3-butinilo, 1-etil-1-metil-2-propinilo y 2,5-hexadiínilo. Son más preferidos alquinos con 2 a 4 átomos de carbono como entre otros etinilo, 2-propinilo o 2-butilil-2-propenilo. Los alquinos de acuerdo con la invención pueden estar sustituidos con uno o varios restos, iguales o diferentes.

De acuerdo con la invención "cicloalquilo" - en solitario o como componente de un grupo químico – representa hidrocarburos mono-, bi- o tricíclicos, preferentemente con 3 a 10 átomos de carbono como por ejemplo ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo, ciclooctilo, biciclo[2.2.1]heptilo, biciclo[2.2.2]octilo o adamantilo. Son más preferidos cicloalquilos con 3, 4, 5, 6 o 7 átomos de carbono, como entre otros ciclopropilo o ciclobutilo. Los cicloalquilos de acuerdo con la invención pueden estar sustituidos con uno o varios restos, iguales o diferentes.

De acuerdo con la invención "alquilocicloalquilo" representa alquilocicloalquilo mono-, bi- o tricíclico, preferentemente con 4 a 10 o 4 a 7 átomos de carbono como, por ejemplo, etilciclopropilo, isopropilciclobutilo, 3-metilciclopentilo y 4-metil-ciclohexilo. Son más preferidos alquilocicloalquilos con 4, 5 o 7 átomos de carbono, como entre otros etilciclopropilo o 4-metil-ciclohexilo. Los alquilocicloalquilos de acuerdo con la invención pueden estar sustituidos con uno o varios restos, iguales o diferentes.

De acuerdo con la invención "cicloalquilalquilo" representa mono-, bi- o tricíclico cicloalquilalquilo, preferentemente con 4 a 10 o 4 a 7 átomos de carbono como, por ejemplo, ciclopropilometilo, ciclobutilometilo, ciclopentilometilo, ciclohexilometilo y ciclopentiloetilo. Son más preferidos cicloalquilalquilos con 4, 5 o 7 átomos de carbono como

entre otros ciclopropilometilo o ciclobutilometilo. Los cicloalquilalquilos de acuerdo con la invención pueden estar sustituidos con uno o varios restos, iguales o diferentes.

De acuerdo con la invención "halógeno" representa flúor, cloro, bromo o yodo, de forma particular flúor, cloro o bromo.

- 5 Los grupos químicos sustituidos con halógeno de acuerdo con la invención como, por ejemplo, haloalquilo, halocicloalquilo, haloalquiloxi, haloalquilsulfanilo, haloalquilsulfino o haloalquilsulfonilo están sustituidos una o varias veces hasta el número máximo de sustituyentes posible con halógeno. Con sustitución múltiple con halógeno, los átomos de halógeno pueden ser iguales o distintos y pueden todos ellos estar unidos a uno o varios átomos de carbono. A este respecto halógeno representa de forma particular flúor, cloro, bromo o yodo, preferentemente flúor, cloro o bromo y con especial preferencia flúor.

De acuerdo con la invención "halocicloalquilo" representa halocicloalquilo mono-, bi- o tricíclico, preferentemente con 3 a 10 átomos de carbono, como entre otros 1-fluoro-ciclopropilo, 2-fluoro-ciclopropilo o 1-fluoro-ciclobutilo. Adicionalmente se prefiere halocicloalquilo con 3, 5 o 7 átomos de carbono. Los halocicloalquilos de acuerdo con la invención pueden estar sustituidos con uno o varios restos, iguales o diferentes.

- 15 De acuerdo con la invención "haloalquilo", "haloalqueno" o "haloalquino" representan alquilos, alquenos o alquinos sustituidos con halógeno preferentemente con 1 a 9 átomos de halógeno iguales o distintos como, por ejemplo, monohaloalquilo (= monohaloalquilo) como  $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ ,  $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{F}$ ,  $\text{CHClCH}_3$ ,  $\text{CHFCH}_3$ ,  $\text{CH}_2\text{Cl}$ ,  $\text{CH}_2\text{F}$ ; perhaloalquilos como  $\text{CCl}_3$  o  $\text{CF}_3$  o  $\text{CF}_2\text{CF}_3$ ; polihaloalquilo como  $\text{CHF}_2$ ,  $\text{CH}_2\text{F}$ ,  $\text{CH}_2\text{CHFCl}$ ,  $\text{CHCl}_2$ ,  $\text{CF}_2\text{CF}_2\text{H}$ ,  $\text{CH}_2\text{CF}_3$ . Lo correspondiente es válido para haloalqueno y otros restos sustituidos con halógeno. Haloalcoxi es, por ejemplo,  $\text{OCF}_3$ ,  $\text{OCHF}_2$ ,  $\text{OCH}_2\text{F}$ ,  $\text{OCF}_2\text{CF}_3$ ,  $\text{OCH}_2\text{CF}_3$  y  $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ .

- 20 Otros ejemplos de haloalquilos son triclorometilo, clorodifluorometilo, diclorofluorometilo, clorometilo, bromometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, pentafluoroetilo y pentafluoro-t-butilo. Se prefieren haloalquilos con 1 a 4 átomos de carbono y 1 a 9, preferentemente 1 a 5 átomos de halógeno iguales o distintos, que se seleccionan entre flúor, cloro o bromo. Son especialmente preferidos haloalquilos con 1 o 2 átomos de carbono y 1 a 5 átomos de halógeno iguales o distintos, que se seleccionan entre flúor o cloro, como entre otros difluorometilo, trifluorometilo o 2,2-difluoroetilo.

- 25 De acuerdo con la invención "hidroxialquilo" representa alcohol de cadena lineal o ramificada, preferentemente con 1 a 6 átomos de carbono como, por ejemplo, metanol, etanol, n-propanol, isopropanol, n-butanol, isobutanol, s-butanol y t-butanol. Son más preferidos grupos hidroxialquilo con 1 a 4 átomos de carbono. Los grupos hidroxialquilo de acuerdo con la invención pueden estar sustituidos con uno o varios restos, iguales o diferentes.

De acuerdo con la invención "alcoxi" representa O-alquilo de cadena lineal o ramificada, preferentemente con 1 a 6 átomos de carbono como, por ejemplo, metoxi, etoxi, n-propoxi, isopropoxi, n-butoxi, isobutoxi, s-butoxi y t-butoxi. Son más preferidos grupos alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono. Los grupos alcoxi de acuerdo con la invención pueden estar sustituidos con uno o varios restos, iguales o diferentes.

- 35 De acuerdo con la invención "haloalcoxi" representa O-alquilo de cadena lineal o ramificada sustituido con halógeno, preferentemente con 1 a 6 átomos de carbono, como entre otros difluorometoxi, trifluorometoxi, 2,2-difluoroetoxi, 1,1,2,2-tetrafluoroetoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi y 2-cloro-1,1,2-trifluoroetoxi. Son más preferidos grupos haloalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono. Los grupos haloalcoxi de acuerdo con la invención pueden estar sustituidos con uno o varios restos, iguales o diferentes.

- 40 De acuerdo con la invención "alquilsulfanilo" representa S-alquilo de cadena lineal o ramificada, preferentemente con 1 a 6 átomos de carbono como, por ejemplo, metiltio, etiltio, n-propiltio, isopropiltio, n-butiltio, isobutiltio, s-butiltio y t-butiltio. Son más preferidos grupos alquilsulfanilo con 1 a 4 átomos de carbono. Los grupos alquilsulfanilo de acuerdo con la invención pueden estar sustituidos con uno o varios restos, iguales o diferentes.

- Ejemplos de haloalquilsulfanilo, es decir, grupos alquilsulfanilo sustituidos con halógeno, son entre otros difluorometiltio, trifluorometiltio, triclorometiltio, clorodifluorometiltio, 1-fluoroetiltio, 2-fluoroetiltio, 2,2-difluoroetiltio, 1,1,2,2-tetrafluoroetiltio, 2,2,2-trifluoroetiltio o 2-cloro-1,1,2-trifluoroetiltio.

- 45 De acuerdo con la invención "alquilsulfino" representa alquilsulfino de cadena lineal o ramificada, preferentemente con 1 a 6 átomos de carbono como por ejemplo metilsulfino, etilsulfino, n-propilsulfino, isopropilsulfino, n-butilsulfino, isobutilsulfino, s-butilsulfino y t-butilsulfino. Son más preferidos grupos alquilsulfino con 1 a 4 átomos de carbono. Los grupos alquilsulfino de acuerdo con la invención pueden estar sustituidos con uno o varios restos, iguales o diferentes.

- Ejemplos de grupos haloalquilsulfino, es decir, grupos alquilsulfino sustituidos con halógeno, son entre otros difluorometilsulfino, trifluorometilsulfino, triclorometilsulfino, clorodifluorometilsulfino, 1-fluoroetilsulfino, 2-fluoroetilsulfino, 2,2-difluoroetilsulfino, 1,1,2,2-tetrafluoroetilsulfino, 2,2,2-trifluoroetilsulfino y 2-cloro-1,1,2-trifluoroetilsulfino.

De acuerdo con la invención "alquilsulfonilo" representa alquilsulfonilo de cadena lineal o ramificada,

preferentemente con 1 a 6 átomos de carbono como por ejemplo metilsulfonilo, etilsulfonilo, n-propilsulfonilo, isopropilsulfonilo, n-butilsulfonilo, isobutilsulfonilo, s-butilsulfonilo y t-butilsulfonilo. Son más preferidos grupos alquilsulfonilos con 1 a 4 átomos de carbono. Los grupos alquilsulfonilos de acuerdo con la invención pueden estar sustituidos con uno o varios restos, iguales o diferentes.

- 5 Ejemplos de grupos haloalquilsulfonilos, es decir, grupos alquilsulfonilos sustituidos con halógeno son entre otros difluorometilsulfonilo, trifluorometilsulfonilo, sulfonilo, clorodifluorometilsulfonilo, 1-fluoroetilsulfonilo, 2-fluoroetilsulfonilo, 2,2-difluoroetilsulfonilo, 1,1,2,2-tetrafluoroetilsulfonilo, 2,2,2-trifluoroetil-sulfonilo y 2-cloro-1,1,2-trifluoroetilsulfonilo.

- 10 De acuerdo con la invención "alquilcarbonilo" representa alquil-C(=O) de cadena lineal o ramificada, preferentemente con 2 a 7 átomos de carbono, como metilcarbonilo, etilcarbonilo, n-propilcarbonilo, isopropilcarbonilo, s-butilcarbonilo y t-butilcarbonilo. Son más preferidos alquilcarbonilos con 1 a 4 átomos de carbono. Los alquilcarbonilos de acuerdo con la invención pueden estar sustituidos con uno o varios restos, iguales o diferentes.

- 15 De acuerdo con la invención "cicloalquilcarbonilo" representa cicloalquilcarbonilo de cadena lineal o ramificada, preferentemente con 3 a 10 átomos de carbono en la parte cicloalquilo como, por ejemplo, ciclopropilcarbonilo, ciclobutilcarbonilo, ciclopentilcarbonilo, ciclohexil-carbonilo, cicloheptilcarbonilo, ciclooctilcarbonilo, biciclo[2.2.1]heptilo, biciclo[2.2.2]octilcarbonilo y adamantilcarbonilo. Adicionalmente se prefiere cicloalquilcarbonilo con 3, 5 o 7 átomos de carbono en la parte cicloalquilo. Los grupos cicloalquilcarbonilo de acuerdo con la invención pueden estar sustituidos con uno o varios restos, iguales o diferentes.

- 20 De acuerdo con la invención "alcoxicarbonilo" representa – en solitario o como componente de un grupo químico – alcoxicarbonilo de cadena lineal o ramificada, preferentemente con 1 a 6 átomos de carbono o 1 a 4 átomos de carbono en la parte alcoxi como, por ejemplo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n-propoxicarbonilo, isopropoxicarbonilo, s-butoxicarbonilo y t-butoxicarbonilo. Los grupos alcoxicarbonilo de acuerdo con la invención pueden estar sustituidos con uno o varios restos, iguales o diferentes.

- 25 De acuerdo con la invención "alquilaminocarbonilo" representa alquilaminocarbonilo de cadena lineal o ramificada preferentemente con 1 a 6 átomos de carbono o 1 a 4 átomos de carbono en la parte alquilo como, por ejemplo, metilaminocarbonilo, etilaminocarbonilo, n-propilaminocarbonilo, isopropilaminocarbonilo, s-butilaminocarbonilo y t-butilaminocarbonilo. Los grupos alquilaminocarbonilo de acuerdo con la invención pueden estar sustituidos con uno o varios restos, iguales o diferentes.

- 30 De acuerdo con la invención "*N,N*-dialquilamino-carbonilo" representa *N,N*-dialquilaminocarbonilo de cadena lineal o ramificada preferentemente con 1 a 6 átomos de carbono o 1 a 4 átomos de carbono en la parte alquilo como, por ejemplo, *N,N*-dimetilamino-carbonilo, *N,N*-dietilamino-carbonilo, *N,N*-di(n-propilamino)-carbonilo, *N,N*-di(isopropilamino)-carbonilo y *N,N*-di(s-butilamino)-carbonilo. Los grupos *N,N*-dialquilamino-carbonilo de acuerdo con la invención pueden estar sustituidos con uno o varios restos, iguales o diferentes.

- 35 De acuerdo con la invención "arilo", un sistema aromático mono-, bi- o policíclico preferentemente con 6 a 14, de forma particular 6 a 10 átomos de carbono en el anillo como, por ejemplo, fenilo, naftilo, antrilo, fenantrenilo, preferentemente fenilo. Además arilo representa también sistemas policíclicos, como tetrahidronaftilo, indenilo, indanilo, fluorenilo, bifenilo, estando el punto de unión en el sistema aromático. Los grupos arilo de acuerdo con la invención pueden estar sustituidos con uno o varios restos, iguales o diferentes.

- 40 Ejemplos de arilos sustituidos representan los arilalquilos, que pueden estar sustituidos al mismo tiempo con uno o varios restos iguales o diferentes en la parte alquilo y/o arilo. Ejemplos de tales arilalquilos son entre otros bencilo y 1-feniletilo.

- 45 De acuerdo con la invención "heterociclo", "anillo heterocíclico" o "sistema de anillo heterocíclico" representa un sistema de anillo carbocíclico con al menos un anillo, en el que está reemplazado al menos un átomo de carbono con un heteroátomo, preferentemente con un heteroátomo del grupo de N, O, S, P, B, Si, Se y que está saturado, insaturado o heteroaromático y a este respecto puede estar no sustituido o sustituido con un sustituyente Z, estando localizado el punto de unión en un átomo del anillo. Si no se define de otra forma, el anillo heterocíclico contiene preferentemente de 3 a 9 átomos de anillo, de forma particular de 3 a 6 átomos de anillo, y uno o varios, preferentemente de 1 a 4, de forma particular 1, 2 o 3 heteroátomos en el anillo heterocíclico, preferentemente del grupo de N, O, y S, no debiendo ser sin embargo dos átomos de oxígeno directamente adyacentes. Los anillos heterocíclicos contienen de forma habitual no más de 4 átomos de nitrógeno y/o no más de 2 átomos de oxígeno y/o no más de 2 átomos de azufre. Si el resto heterociclilo o el anillo heterocíclico está dado el caso sustituido, puede estar condensado con otros anillos carbocíclicos o heterocíclicos. En el caso de heterociclilo dado el caso sustituido, están comprendidos según la invención también sistemas policíclicos tales como, por ejemplo, 8-aza-biciclo[3.2.1]octanilo o 1-aza-biciclo[2.2.1]heptilo. En el caso de heterociclilo dado el caso sustituido están comprendidos de acuerdo con la invención también sistemas espirocíclicos como por ejemplo 1-oxa-5-aza-espiro[2.3]hexilo.

- 55 Grupos heterociclilo de acuerdo con la invención son por ejemplo piperidinilo, piperazinilo, morfolinilo, tiomorfolinilo, dihidropiranilo, tetrahidropiranilo, dioxanilo, pirrolinilo, pirrolidinilo, imidazolinilo, imidazolidinilo, tiazolidinilo,

oxazolidinilo, dioxolanilo, dioxolilo, pirazolidinilo, tetrahidrofuranilo, dihidrofuranilo, oxetanilo, oxiranilo, azetidino, aziridinilo, oxazetidino, oxaziridinilo, oxazepanilo, oxazinanilo, azepanilo, oxopirrolidinilo, dioxopirrolidinilo, oxomorfolinilo, oxopiperazinilo y oxepanilo.

5 Un significado especial lo presentan heterociclos, por ejemplo sistemas heteroaromáticos. De acuerdo con la invención la expresión heteroarilo representa compuestos heteroaromáticos, que significa compuestos heterocíclicos aromáticos completamente insaturados, que se encuentra bajo la definición previa de heterociclos. Preferiblemente representa anillos de 5 a 7 miembros con 1 a 3, preferentemente 1 o 2 heteroátomos iguales o distintos del grupo anteriormente citado. Heteroarilos de acuerdo con la invención son, por ejemplo, furilo, tienilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3- y 1,2,4-triazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 1,2,3-, 1,3,4-, 1,2,4- y 1,2,5-oxadiazolilo, azepinilo, pirrolilo, 10 piridilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, 1,3,5-, 1,2,4- y 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-, 1,3,2-, 1,3,6- y 1,2,6-oxazinilo, oxepinilo, tiepinilo, 1,2,4-triazolonilo y 1,2,4-diazepinilo. Los grupos heteroarilo de acuerdo con la invención pueden estar sustituidos además con uno o varios restos iguales o distintos.

Grupos sustituidos, como un resto alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, arilo, fenilo, bencilo, heterociclilo y heteroarilo sustituidos, significan por ejemplo un resto sustituido derivado de un cuerpo base no sustituido, en donde 15 los sustituyentes por ejemplo una o varios, preferentemente 1, 2 o 3 restos del grupo de halógeno, alcoxi, alquilsulfanilo, hidroxilo, amino, nitro, carboxi o uno de los grupos equivalentes al grupo carboxilo, ciano, isociano, azido, alcoxicarbonilo, alquilcarbonilo, formilo, carbamoilo, mono y *N,N*-dialquilamino-carbonilo, amino sustituido, como acilamino, mono y *N,N*-dialquilamino, triquilsililo y cicloalquilo dado el caso sustituido, arilo dado el caso sustituido, heterociclilo dado el caso sustituido, en donde cada uno de los grupos cíclicos recién citados también 20 puede estar unido por heteroátomos o grupos funcionales divalentes como en los restos alquilo citados, y alquilsulfino, estando comprendidos ambos enantiómeros del grupo alquilsulfonilo, alquilsulfonilo, alquilsulfonilo, alquilsulfonilo y, en el caso de restos cíclicos (= "cuerpos base cíclicos"), también alquilo, haloalquilo, alquilsulfanalquilo, alcoxi-alquilo, mono- y *N,N*-dialquil-aminoalquilo e hidroxialquilo dado el caso sustituidos.

En la expresión "grupos sustituidos" como alquilo sustituido, etc., están incluidos como sustituyentes además de los 25 radicales hidrocarbonados saturados mencionados los correspondientes radicales alifáticos y aromáticos insaturados tales como, dado el caso sustituidos, alquenilo, alquinilo, alqueniloxi, alquiniloxi, alquenililo, alquinililo, alqueniloxicarbonilo, alquiniloxicarbonilo, alquenilcarbonilo, alquinilcarbonilo, mono- y *N,N*-dialquenilamino-carbonilo, mono- y dialquinilaminocarbonilo, mono- y *N,N*-dialquenilamino, mono- y *N,N*-dialquinilamino, triquenilsililo, triquinilsililo, cicloalquenilo dado el caso sustituido, cicloalquinilo dado el caso sustituido, fenilo, fenoxi, etc. En el caso de radicales cíclicos sustituidos con proporciones alifáticas en el anillo, también están comprendidos sistemas cíclicos con aquellos sustituyentes que están unidos con un enlace doble en el anillo, por ejemplo, con un grupo alquilideno como metilideno o etilideno o un grupo oxo, grupo imino, así como un grupo imino sustituido.

Si dos o varios restos forman uno o varios anillos, entonces estos pueden ser carbocíclicos, heterocíclicos, saturados, parcialmente saturados, insaturados, por ejemplo también aromáticos y estar sustituidos adicionalmente.

35 Los sustituyentes citados a modo de ejemplo ("primeros planos de sustituyentes") pueden, en tanto contengan proporciones que comprendan hidrocarburo, estar sustituidos adicionalmente dado el caso ("segundo plano de sustituyentes"), por ejemplo mediante uno de los sustituyentes como se define para el primer plano de sustituyentes. Son posibles otros planos de sustituyentes correspondientes. Preferiblemente están comprendidos por el término "resto sustituido" solo uno o dos planos de sustituyentes.

40 Sustituyentes preferidos para los planos de sustituyentes son, por ejemplo

amino, hidroxilo, halógeno, nitro, ciano, isociano, mercapto, isotiocianato, carboxi, carboxamida, SF<sub>5</sub>, aminosulfonilo, alquilo, cicloalquilo, alquenilo, cicloalquenilo, alquinilo, *N*-mono-alquil-amino, *N,N*-dialquilamino, *N*-alcanoilamino, alcoxi, alqueniloxi, alquiniloxi, cicloalcoxi, cicloalqueniloxi, alcoxicarbonilo, alqueniloxicarbonilo, alquiniloxicarbonilo, ariloxicarbonilo, alcanoilo, alquenilcarbonilo, alquinilcarbonilo, arilcarbonilo, alquilsulfanilo, cicloalquilsulfanilo, 45 alquenililo, cicloalquenililo, alquinililo, alquilsulfenilo y alquilsulfino, estando comprendidos ambos enantiómeros del grupo de alquilsulfino, alquilsulfonilo, *N*-mono-alquil-aminosulfonilo, *N,N*-dialquil-aminosulfonilo, alquilsulfonilo, alquilsulfonilo, estando comprendidos para alquilsulfonilo o alquilsulfonilo ambos enantiómeros, *N*-alquil-aminocarbonilo, *N,N*-dialquil-amino-carbonilo, *N*-alcanoilamino-carbonilo, *N*-alcanoil-*N*-alquil-aminocarbonilo, arilo, ariloxi, bencilo, benciloxi, bencililo, arililo, arilamino, bencilamino, heterociclilo y triquilsililo.

50 Sustituyentes, que se encuentran en varios planos de sustituyentes, son preferentemente alcoxialquilo, alquilsulfanalquilo, alquilsulfanalcoxi, alcoxialcoxi, fenilo, benciloxi, haloalquilo, halocicloalquilo, haloalcoxi, haloalquilsulfanilo, haloalquilsulfino, haloalquilsulfonilo, haloalcanoilo, haloalquilcarbonilo, haloalcoxicarbonilo, haloalcoxialcoxi, haloalcoxialquilsulfanilo, haloalcoxialcanoilo, haloalcoxialquilo.

En restos con átomos de C se prefieren aquellos con 1 a 6 átomos de C, preferentemente 1 a 4 átomos de C, de 55 forma particular 1 o 2 átomos de C. Se prefieren por lo general sustituyentes del grupo de halógeno, por ejemplo, flúor y cloro, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), preferentemente metilo o etilo, haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), preferentemente trifluorometilo, alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), preferentemente metoxi o etoxi, haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), nitro y ciano. Son especialmente preferidos a este respecto los sustituyentes metilo, metoxi, flúor y cloro.

Amino sustituido como amino mono- o disustituido significa un resto del grupo de restos amino sustituidos, que están *N*-sustituidos por ejemplo con uno o dos restos iguales o distintos del grupo de alquilo, hidroxilo, amino, alcoxi, acilo y arilo; preferentemente *N*-mono- y *N,N*-dialquilamino, (por ejemplo, metilamino, etilamino, *N,N*-dimetilamino, *N,N*-dietilamino, *N,N*-di-*n*-propilamino, *N,N*-disopropilamino o *N,N*-dibutilamino), grupos *N*-mono- o *N,N*-dialcoxilalquilamino (por ejemplo, *N*-metoximetilamino, *N*-metoxietilamino, *N,N*-di-(metoximetil)-amino o *N,N*-di-(metoxietil)-amino), *N*-mono- y *N,N*-diarilamino, como anilina, acilamino, *N,N*-diacilamino, *N*-alquil *N*-arilamino, *N*-alquil-*N*-acilamino así como *N*-heterociclos saturados dado el caso sustituidos; a este respecto se prefieren restos alquilo con 1 a 4 átomos de C; arilo es a este respecto preferentemente fenilo o fenilo sustituido; para acilo es válido a este respecto la definición citada más adelante, preferentemente alcanóilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>). Es válido lo correspondiente para hidroxilamino o hidrazino sustituidos.

De acuerdo con la invención, la expresión "grupos amino cíclicos" comprende sistemas de anillo heteroaromáticos o alifáticos con uno o varios átomos de nitrógeno. Los heterociclos son saturados o insaturados, constituidos por uno o varios sistemas de anillo dado el caso condensados y comprenden dado el caso varios heteroátomos como, por ejemplo, uno o dos átomos de nitrógeno, oxígeno y/o azufre. Además el término comprende también aquellos grupos que presentan un anillo espiro o sistema de anillo puenteado. El número de átomos que forman el grupo amino cíclico es discrecional y pueden comprender, por ejemplo, en el caso de un sistema de un anillo de 3 a 8 átomos de anillo y en el caso de un sistema de dos anillos de 7 a 11 átomos.

A modo de ejemplo para grupos amino cíclicos con grupos monocíclicos saturados e insaturados con un átomo de nitrógeno como heteroátomo son de citar 1-azetidino, pirrolidino, 2-pirrolidin-1-ilo, 1-pirrolilo, piperidino, 1,4-dihidropirazin-1-ilo, 1,2,5,6-tetrahidropirazin-1-ilo, 1,4-dihidropiridin-1-ilo, 1,2,5,6-tetrahidropiridin-1-ilo, homopiperidinilo; por ejemplo para grupos amino cíclicos con grupos monocíclicos saturados e insaturados con dos o varios átomos de nitrógeno como heteroátomos son de citar 1-imidazolidinilo, 1-imidazolilo, 1-pirazolilo, 1-triazolilo, 1-tetrazolilo, 1-piperazinilo, 1-homopiperazinilo, 1,2-dihidro-piperazin-1-ilo, 1,2-dihidro-pirimidin-1-ilo, perhidropirimidin-1-ilo, 1,4-diazacicloheptan-1-ilo; por ejemplo para grupos amino cíclicos con grupos monocíclicos saturados e insaturados con uno o dos átomos de oxígeno y uno a tres átomos de nitrógeno como heteroátomos como, por ejemplo, oxazolidin-3-ilo, 2,3-dihidroisoxazol-2-ilo, isoxazol-2-ilo, 1,2,3-oxadiazin-2-ilo, morfolino, por ejemplo para grupos amino cíclicos con grupos monocíclicos saturados e insaturados con uno a tres átomos de nitrógeno y uno a dos átomos de azufre como heteroátomos son de citar tiazolidin-3-ilo, isotiazolin-2-ilo, tiomorfolino, o dioxotiomorfolino; por ejemplo para grupos amino cíclicos con grupos cíclicos saturados e insaturados condensados son de citar indol-1-ilo, 1,2-dihidrobencimidazol-1-ilo, perhidropirrol[1,2-*a*]pirazin-2-ilo; por ejemplo para grupos amino cíclicos con grupos espirocíclicos es de citar el 2-azaespiro[4,5]decan-2-ilo; por ejemplo para grupos amino cíclicos con grupos heterocíclicos puenteados es de citar el 2-azabicyclo[2,2,1]heptan-7-ilo.

Amino sustituido incluye también compuestos de amonio cuaternario (sales) con cuatro sustituyentes orgánicos en el átomo de nitrógeno.

Fenilo dado el caso sustituido es preferentemente fenilo, que está no sustituido o sustituido una o varias veces, preferentemente hasta tres veces con restos iguales o distintos del grupo de halógeno, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-sulfanilo, haloalquil (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-sulfanilo, ciano, isociano y nitro, por ejemplo *o*-, *m*- y *p*-tolilo, dimetilfenilos, 2-, 3- y 4-clorofenilo, 2-, 3- y 4-fluorofenilo, 2-, 3- y 4-trifluorometilfenilo y -triclorometilfenilo, 2,4-, 3,5-, 2,5- y 2,3-diclorofenilo, *o*-, *m*- y *p*-metoxifenilo.

Cicloalquilo dado el caso sustituido es preferentemente cicloalquilo, que está no sustituido o sustituido una o varias veces, preferentemente hasta tres veces con restos iguales o distintos del grupo de halógeno, ciano, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) y haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), de forma particular con uno o dos restos alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>).

Heterociclilo dado el caso sustituido es preferentemente heterociclilo, que está no sustituido o está sustituido una o varias veces, preferentemente hasta tres veces con restos iguales o distintos del grupo de halógeno, ciano, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), nitro y oxo, de forma particular una o varias veces con restos del grupo de halógeno, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) y oxo, muy especialmente con uno o dos restos alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>).

Ejemplos de heteroarilos sustituidos con alquilo son furilmetilo, tienilmetilo, pirazolilmetilo, imidazolilmetilo, 1,2,3- y 1,2,4-triazolilmetilo, isoxazolilmetilo, tiazolilmetilo, isotiazolilmetilo, 1,2,3-, 1,3,4-, 1,2,4- y 1,2,5-oxadiazolilmetilo, azepinilmetilo, pirrolilmetilo, piridilmetilo, piridazinilmetilo, pirimidinilmetilo, pirazinilmetilo, 1,3,5-, 1,2,4- y 1,2,3-triazinilmetilo, 1,2,4-, 1,3,2-, 1,3,6- y 1,2,6-oxazinilmetilo, oxepinilmetilo, tiepinilmetilo y 1,2,4-diazepinilmetilo.

Sales adecuadas de acuerdo con la invención de compuestos de acuerdo con la invención, por ejemplo sales con bases o sales de adición de ácido, son todas las sales habituales no tóxicas, preferentemente sales agricolamente y/o fisiológicamente aceptables. Por ejemplo sales con bases o sales de adición de ácido. Se prefieren sales con bases inorgánicas como, por ejemplo, sales de metales alcalinos (por ejemplo, sales de sodio, potasio o cesio), sales de metales alcalinotérreos (por ejemplo, sales de calcio o de magnesio), sales de amonio o sales con bases orgánicas, de forma particular con aminas orgánicas como, por ejemplo, sales de trietilamonio, dicitohexilamonio,

*N,N'*-dibenciletilen-diamonio, piridinio, picolinio o etanolamonio, sales con ácidos inorgánicos (por ejemplo, clorhidratos, bromhidratos, dihidrosulfatos, trihidrosulfatos o fosfatos), sales con ácidos carboxílicos orgánicos o ácidos sulfónicos orgánicos (por ejemplo, formiatos, acetatos, trifluoroacetatos, maleatos, tartratos, metanosulfonatos, bencenosulfonatos o 4-toluenosulfonatos). De forma conocida *t*-aminas como, por ejemplo, muchos de los compuestos de acuerdo con la invención, pueden formar *N*-óxidos, que representan igualmente sales de acuerdo con la invención.

Los compuestos de acuerdo con la invención pueden presentarse en función del tipo de sustituyentes como isómeros geométricos y/o como isómeros ópticamente activos o mezclas de isómeros correspondientes en distinta composición. Estos estereoisómeros son, por ejemplo, enantiómeros, diastereómeros, atropisómeros o isómeros geométricos. La invención comprende tanto estereoisómeros puros como también mezclas discrecionales de estos isómeros.

Los compuestos de acuerdo con la invención pueden presentarse dado el caso en distintas formas polimórficas o como mezcla de distintas formas polimórficas. Tanto los polimorfos puros como también las mezclas de polimorfos son objeto de la invención y se pueden usar de acuerdo con la invención.

## 15 **Uso**

La invención se refiere también a procedimientos no terapéuticos para combatir parásitos animales, en el que se dejan actuar compuestos de la fórmula general (I) según la invención sobre parásitos animales y/o su hábitat. Con preferencia, la lucha contra parásitos animales se lleva a cabo en agricultura y silvicultura y en la protección de materiales.

Los compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la invención son adecuados por su buena tolerancia en las plantas, toxicidad favorable en mamíferos y buena tolerancia ambiental para la protección de plantas y órganos de plantas, para aumentar los rendimientos de cosecha, mejorar la calidad de los productos de cosecha y para combatir plagas animales, especialmente insectos, arácnidos, helmintos, nematodos y moluscos, que aparecen en agricultura, en horticultura, en cría de animales, en acuicultura, en bosques, en jardines e instalaciones de tiempo libre, en la protección de existencias y materiales, así como en el sector de la higiene. Se pueden usar preferentemente como agentes plaguicidas. Son eficaces contra los tipos de sensibilidad normal y resistentes, así como contra todos o algunos de los estados de desarrollo. Pertenecen a las plagas anteriormente citadas:

Plagas de la familia de los artrópodos, de forma particular de la clase de los arácnidos, por ejemplo, *Acarus spp.*, *Aceria kuko*, *Aceria sheldoni*, *Aculops spp.*, *Aculus spp.*, *Amblyomma spp.*, *Amphitetranychus viennensis*, *Argas spp.*, *Boophilus spp.*, *Brevipalpus spp.*, *Bryobia graminum*, *Bryobia praetiosa*, *Centruroides spp.*, *Chorioptes spp.*, *Dermanyssus gallinae*, *Dermatophagoides pteronyssinus*, *Dermatophagoides farinae*, *Dermacentor spp.*, *Eotetranychus spp.*, *Eptrimerus pyri*, *Eutetranychus spp.*, *Eriophyes spp.*, *Glycyphagus domesticus*, *Halotydeus destructor*, *Hemitarsonemus spp.*, *Hyalomma spp.*, *Ixodes spp.*, *Latrodectus spp.*, *Loxosceles spp.*, *Metatetranychus spp.*, *Neutrombicula autumnalis*, *Nuphessa spp.*, *Oligonychus spp.*, *Ornithodoros spp.*, *Ornithonyssus spp.*, *Panonychus spp.*, *Phyllocoptura oleivora*, *Platytranychus multidigituli*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Psoroptes spp.*, *Rhipicephalus spp.*, *Rhizoglyphus spp.*, *Sarcoptes spp.*, *Scorpio maurus*, *Steneotarsonemus spp.*, *Steneotarsonemus spinki*, *Tarsonemus spp.*, *Tetranychus spp.*, *Trombicula alfreddugesi*, *Vaejovis spp.*, *Vasates lycopersici*;

de la clase de los quilópodos, por ejemplo, *Geophilus spp.*, *Scutigera spp.*;

del orden o de la clase de los colémbolos, por ejemplo, *Onychiurus armatus*;

de la clase de los diplópodos, por ejemplo, *Blaniulus guttulatus*;

de la clase de los insectos, por ejemplo, del orden de los blatodeos, por ejemplo, *Blattella asahinai*, *Blattella germanica*, *Blatta orientalis*, *Leucophaea maderae*, *Panchlora spp.*, *Parcoblatta spp.*, *Periplaneta spp.*, *Supella longipalpa*;

del orden de los coleópteros, por ejemplo, *Acalymma vittatum*, *Acanthoscelides obtectus*, *Adoretus spp.*, *Agelastica alni*, *Agriotes spp.*, *Alphitobius diaperinus*, *Amphimallon solstitialis*, *Anobium punctatum*, *Anoplophora spp.*, *Anthonomus spp.*, *Anthrenus spp.*, *Apion spp.*, *Apogonia spp.*, *Atomaria spp.*, *Attagenus spp.*, *Baris caerulescens*, *Bruchidius obtectus*, *Bruchus spp.*, *Cassida spp.*, *Cerotoma trifurcata*, *Ceutorrhynchus spp.*, *Chaetocnema spp.*, *Cleonus mendicus*, *Conoderus spp.*, *Cosmopolites spp.*, *Costelytra zealandica*, *Ctenicera spp.*, *Curculio spp.*, *Cryptolestes ferrugineus*, *Cryptorhynchus lapathi*, *Cylindrocopturus spp.*, *Dermestes spp.*, *Diabrotica spp.*, *Dichocrocis spp.*, *Dicladyspa armigera*, *Diloboderus spp.*, *Epilachna spp.*, *Epitrix spp.*, *Faustinus spp.*, *Gibbium psylloides*, *Gnathocerus cornutus*, *Hellula undalis*, *Heteronychus arator*, *Heteronyx spp.*, *Hylamorpha elegans*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera postica*, *Hypomeces squamosus*, *Hypothenemus spp.*, *Lachnosterna consanguinea*, *Lasioderma serricorne*, *Latheticus oryzae*, *Lathridius spp.*, *Lema spp.*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Leucoptera spp.*,

*Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lixus spp.*, *Luperomorpha xanthodera*, *Luperodes spp.*, *Lyctus spp.*, *Megascelis spp.*, *Melanotus spp.*, *Meligethes aeneus*, *Melolontha spp.*, *Migdolus spp.*, *Monochamus spp.*, *Naupactus xanthographus*, *Necrobia spp.*, *Niptus hololeucus*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Oryzaphagus oryzae*, *Otiorrhynchus spp.*, *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllophaga spp.*, *Phyllophaga helleri*, *Phyllotreta spp.*, *Popillia japonica*, *Premnotrypes spp.*, *Prostephanus truncatus*, *Psylliodes spp.*, *Ptinus spp.*, *Rhizobius ventralis*, *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus spp.*, *Sitophilus oryzae*, *Sphenophorus spp.*, *Stegobium paniceum*, *Sternechus spp.*, *Symphyletes spp.*, *Tanymecus spp.*, *Tenebrio molitor*, *Tenebrioides mauretanicus*, *Tribolium spp.*, *Trogoderma spp.*, *Tychius spp.*, *Xylotrechus spp.*, *Zabrus spp.*;

- del orden de los dípteros, por ejemplo, *Aedes spp.*, *Agromyza spp.*, *Anastrepha spp.*, *Anopheles spp.*, *Asphondylia spp.*, *Bactrocera spp.*, *Bibio hortulanus*, *Calliphora erythrocephala*, *Calliphora vicina*, *Ceratitis capitata*, *Chironomus spp.*, *Chrysomyia spp.*, *Chrysops spp.*, *Chrysozona pluvialis*, *Cochliomyia spp.*, *Contarinia spp.*, *Cordylobia anthropophaga*, *Cricotopus sylvestris*, *Culex spp.*, *Culicoides spp.*, *Culiseta spp.*, *Cuterebra spp.*, *Dacus oleae*,  
5 *Dasyneura spp.*, *Delia spp.*, *Dermatobia hominis*, *Drosophila spp.*, por ejemplo *Drosophila suzukii*, *Echinocnemus spp.*, *Fannia spp.*, *Gasterophilus spp.*, *Glossina spp.*, *Haematopota spp.*, *Hydrellia spp.*, *Hydrellia griseola*, *Hylemya spp.*, *Hippobosca spp.*, *Hypoderma spp.*, *Liriomyza spp.*, *Lucilia spp.*, *Lutzomyia spp.*, *Mansonia spp.*, *Musca spp.*, *Oestrus spp.*,  
10 *Oscinella frit*, *Paratanytarsus spp.*, *Paralauterborniella subcincta*, *Pegomyia spp.*, *Phlebotomus spp.*, *Phorbia spp.*, *Phormia spp.*, *Piophilina casei*, *Prodioplosis spp.*, *Psila rosae*, *Rhagoletis spp.*, *Sarcophaga spp.*, *Simulium spp.*, *Stomoxys spp.*, *Tabanus spp.*, *Tetanops spp.*, *Tipula spp.*;
- del orden de los heterópteros, por ejemplo, *Anasa tristis*, *Antestiopsis spp.*, *Boisea spp.*, *Blissus spp.*, *Calocoris spp.*, *Campylomma livida*, *Cavelerius spp.*, *Cimex spp.*, *Collaria spp.*, *Creontiades dilutus*, *Dasyneura piperis*, *Dichelops furcatus*, *Diconocoris hewetti*, *Dysdercus spp.*, *Euschistus spp.*, *Eurygaster spp.*, *Halyomorpha halys*, *Heliopeltis spp.*, *Horcias nobiellus*, *Leptocorisa spp.*, *Leptocorisa varicornis*, *Leptoglossus occidentalis*, *Leptoglossus phyllopus*,  
15 *Lygus spp.*, *Macropes excavatus*, *Miridae*, *Monalonion atratum*, *Nezara spp.*, *Oebalus spp.*, *Pentomidae*, *Piesma quadrata*, *Piezodorus spp.*, *Psallus spp.*, *Pseudacysta perseae*, *Rhodnius spp.*, *Sahlbergella singularis*, *Scaptocoris castanea*, *Scotinophora spp.*, *Stephanitis nashi*, *Tibraca spp.*, *Triatoma spp.*;
- del orden de los homópteros, por ejemplo, *Acizzia acaciaebaileyanae*, *Acizzia dodonaeae*, *Acizzia uncatoides*,  
20 *Acrida turrita*, *Acyrtosipon spp.*, *Acrogonia spp.*, *Aeneolamia spp.*, *Agonoscena spp.*, *Aleyrodes proletera*, *Aleurolobus barodensis*, *Aleurothrix floccosus*, *Allocairida malayensis*, *Amrasca spp.*, *Anuraphis cardui*, *Aonidiella spp.*, *Aphanostigma piri*, *Aphis spp.*, *Arboridia apicalis*, *Arytainilla spp.*, *Aspidiella spp.*, *Aspidiotus spp.*, *Atanus spp.*, *Aulacorthum solani*, *Bemisia tabaci*, *Blastosylla occidentalis*, *Boreioglycaspis melaleucae*, *Brachycaudus helichrysi*, *Brachycolus spp.*, *Brevicoryne brassicae*, *Cacopsylla spp.*, *Calligypona marginata*,  
25 *Carneiocephala fulgida*, *Ceratovacuna lanigera*, *Cercopidae*, *Ceroplastes spp.*, *Chaetosiphon fragaefolii*, *Chionaspis tegalensis*, *Chlorita onukii*, *Chondracris rosea*, *Chromaphis juglandicola*, *Chrysomphalus ficus*, *Cicadulina mbila*, *Coccoomytilus halli*, *Coccus spp.*, *Cryptomyzus ribis*, *Cryptoneossa spp.*, *Ctenarytaina spp.*, *Dalbulus spp.*, *Dialeurodes citri*, *Diaphorina citri*, *Diaspis spp.*, *Drosicha spp.*, *Dysaphis spp.*, *Dysmicoccus spp.*, *Empoasca spp.*, *Eriosoma spp.*, *Erythroneura spp.*, *Eucalyptolyma spp.*, *Euphyllura spp.*, *Euscelis bilobatus*, *Ferrisia spp.*, *Geococcus coffeae*, *Glycaspis spp.*, *Heteropsylla cubana*, *Heteropsylla spinulosa*, *Homalodisca coagulata*, *Hyalopterus arundinis*, *Icerya spp.*, *Idiocerus spp.*, *Idioscopus spp.*, *Laodelphax striatellus*, *Lecanium spp.*, *Lepidosaphes spp.*,  
30 *Lipaphis erysimi*, *Macrosiphum spp.*, *Macrosteles facifrons*, *Mahanarva spp.*, *Melanaphis sacchari*, *Metcalfeella spp.*, *Metopolophium dirhodum*, *Monellia costalis*, *Monelliopsis pecanis*, *Myzus spp.*, *Nasonovia ribisnigri*, *Nephotettix spp.*, *Nettigoniclla spectra*, *Nilaparvata lugens*, *Oncometopia spp.*, *Orthezia praelonga*, *Oxya chinensis*, *Pachypsylla spp.*,  
35 *Parabemisia myricae*, *Paratrioza spp.*, *Parlatoria spp.*, *Pemphigus spp.*, *Peregrinus maidis*, *Phenacoccus spp.*, por ejemplo *Phenacoccus madeirensis*, *Phloeomyzus passerinii*, *Phorodon humuli*, *Phylloxera spp.*, *Pinnaspis aspidistrae*, *Planococcus spp.*, *Prosopidopsylla flava*, *Protospulvinaria pyriformis*, *Pseudaulacaspis pentagona*, *Pseudococcus spp.*, por ejemplo *Pseudococcus viburni*, *Psyllopsis spp.*, *Psylla spp.*, *Pteromalus spp.*, *Pyrilla spp.*, *Quadraspidotus spp.*, *Quesada gigas*, *Rastrococcus spp.*, *Rhopalosiphum spp.*, *Saissetia spp.*, *Scaphoideus titanus*,  
40 *Schizaphis graminum*, *Selenaspis articulatus*, *Sogata spp.*, *Sogatella furcifera*, *Sogatodes spp.*, *Stictocephala festina*, *Siphoninus phillyreae*, *Tenalaphara malayensis*, *Tetragonocephala spp.*, *Tinocallis caryaefoliae*, *Tomaspsis spp.*, *Toxoptera spp.*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Trioza spp.*, *Typhlocyba spp.*, *Unaspis spp.*, *Viteus vitifolii*, *Zygina spp.*;
- del orden de los himenópteros, por ejemplo, *Acromyrmex spp.*, *Athalia spp.*, *Atta spp.*, *Diprion spp.*, *Hoplocampa spp.*,  
45 *Lasius spp.*, *Monomorium pharaonis*, *Sirex spp.*, *Solenopsis invicta*, *Tapinoma spp.*, *Urocera spp.*, *Vespa spp.*, *Xeris spp.*;
- del orden de los isópodos, por ejemplo, *Armadillidium vulgare*, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*;
- del orden de los isópteros, por ejemplo, *Coptotermes spp.*, *Cornitermes cumulans*, *Cryptotermes spp.*, *Incisitermes spp.*, *Microtermes obesi*, *Odontotermes spp.*, *Reticulitermes spp.*;
- 50 del orden de los lepidópteros, por ejemplo, *Achroia grisella*, *Acronicta major*, *Adoxophyes spp.*, *Aedia leucomelas*, *Agrotis spp.*, *Alabama spp.*, *Amyeloides transitella*, *Anarsia spp.*, *Anticarsia spp.*, *Argyroplote 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.*, *Choristoneura spp.*, *Clysia ambiguella*, *Cnaphalocerus spp.*, *Cnaphalocrocis medinalis*, *Cnephasia spp.*, *Conopomorpha spp.*,  
55 *Conotrachelus spp.*, *Copitarsia spp.*, *Cydia spp.*, *Dalaca noctuides*, *Diaphania spp.*, *Diatraea saccharalis*, *Earias spp.*, *Ecdyolophus aurantium*, *Elasmopalpus lignosellus*, *Eldana saccharina*, *Epehestia spp.*, *Epinotia spp.*, *Epiphyas postvittana*, *Etiella spp.*, *Eulia spp.*, *Eupoecilia ambiguella*, *Euproctis spp.*, *Euxoa spp.*, *Feltia spp.*, *Galleria mellonella*, *Gracillaria spp.*, *Grapholitha spp.*, *Hedylepta spp.*, *Helicoverpa spp.*, *Heliiothis spp.*, *Hofmannophila pseudospretella*, *Homoeosoma spp.*, *Homona spp.*, *Hyponomeuta padella*, *Kakivoria flavofasciata*, *Laphygma spp.*,  
60 *Laspeyresia molesta*, *Leucinodes orbonalis*, *Leucoptera spp.*, *Lithocolletis spp.*, *Lithophane antennata*, *Lobesia spp.*, *Loxagrotis albicosta*, *Lymantria spp.*, *Lyonetia spp.*, *Malacosoma neustria*, *Maruca testulalis*, *Mamstra brassicae*, *Melanitis leda*, *Mocis spp.*, *Monopis obviella*, *Mythimna separata*, *Nemapogon cloacellus*, *Nymphula spp.*, *Oiketicus spp.*, *Oria spp.*, *Orthaga spp.*, *Ostrinia spp.*, *Oulema oryzae*, *Panolis flammea*, *Parnara spp.*, *Pectinophora spp.*, *Perileucoptera spp.*, *Phthorimaea spp.*, *Phyllocnistis citrella*, *Phyllonorycter spp.*, *Pieris spp.*, *Platynota stultana*,  
65 *Plodia interpunctella*, *Plusia spp.*, *Plutella xylostella*, *Prays spp.*, *Prodenia spp.*, *Protoparce spp.*, *Pseudaletia spp.*, *Pseudaletia unipuncta*, *Pseudoplusia includens*, *Pyrausta nubilalis*, *Rachiplusia nu*, *Schoenobius spp.*, *Scirpophaga*

- spp., *Scirpophaga innotata*, *Scotia segetum*, *Sesamia* spp., *Sesamia inferens*, *Sparganothis* spp., *Spodoptera* spp., *Spodoptera praefica*, *Stathmopoda* spp., *Stomopteryx subsecivella*, *Synanthedon* spp., *Tecia solanivora*, *Thermesia gemmatalis*, *Tinea cloacella*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*, *Tortrix* spp., *Trichophaga tapetzella*, *Trichoplusia* spp., *Tryporyza incertulas*, *Tuta absoluta*, *Virachola* spp.;
- 5 del orden de los ortópteros o *Saltatoria*, por ejemplo, *Acheta domesticus*, *Dichroplus* spp., *Gryllotalpa* spp., *Hieroglyphus* spp., *Locusta* spp., *Melanoplus* spp., *Schistocerca gregaria*;
- del orden de los fitirópteros, por ejemplo, *Damalinia* spp., *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phylloera vastatrix*, *Phtirus pubis*, *Trichodectes* spp.;
- 10 del orden de los psocópteros, por ejemplo, *Lepinotus* spp., *Liposcelis* spp.;
- del orden de los sifonápteros, por ejemplo, *Ceratophyllus* spp., *Ctenocephalides* spp., *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, *Xenopsylla cheopsis*;
- del orden de los tisanópteros, por ejemplo, *Anaphothrips obscurus*, *Baliothrips biformis*, *Drepanothrips reuteri*, *Enneothrips flavens*, *Frankliniella* spp., *Heliothrips* spp., *Hercinothrips femoralis*, *Rhipiphorothrips cruentatus*, *Scirtothrips* spp., *Taeniothrips cardamomi*, *Thrips* spp.;
- 15 del orden de los cigéntomos (= tisanuros), por ejemplo, *Ctenolepisma* spp., *Lepisma saccharina*, *Lepismodes inquilinus*, *Thermobia domestica*;
- de la clase de los sínfilos, por ejemplo, *Scutigera* spp.;
- Plagas de la familia de los moluscos, de forma particular de la clase de los bivalvos, por ejemplo *Dreissena* spp., así como de la clase de los gasterópodos, por ejemplo, *Arion* spp., *Biomphalaria* spp., *Bulinus* spp., *Deroceas* spp.,
- 20 *Galba* spp., *Lymnaea* spp., *Oncomelania* spp., *Pomacea* spp., *Succinea* spp.;
- parásitos animales de las cepas de los platelmintos y nematodos, por ejemplo, *Ancylostoma duodenale*, *Ancylostoma ceylanicum*, *Ancylostoma braziliensis*, *Ancylostoma* spp., *Ascaris* spp., *Brugia malayi*, *Brugia timori*, *Bunostomum* spp., *Chabertia* spp., *Clonorchis* spp., *Cooperia* spp., *Dicrocoelium* spp., *Dictyocaulus filaria*, *Diphyllobothrium latum*, *Dracunculus medinensis*, *Echinococcus granulosus*, *Echinococcus multilocularis*, *Enterobius vermicularis*, *Faciola* spp., *Haemonchus* spp., *Heterakis* spp., *Hymenolepis nana*, *Hyostrongylus* spp., *Loa Loa*, *Nematodirus* spp., *Oesophagostomum* spp., *Opisthorchis* spp., *Onchocerca volvulus*, *Ostertagia* spp., *Paragonimus* spp., *Schistosomen* spp., *Strongyloides fuelleborni*, *Strongyloides stercoralis*, *Strongyloides* spp., *Taenia saginata*, *Taenia solium*, *Trichinella spiralis*, *Trichinella nativa*, *Trichinella britovi*, *Trichinella nelsoni*, *Trichinella pseudopsiralis*, *Trichostrongylus* spp., *Trichuris trichuria*, *Wuchereria bancrofti*;
- 30 parásitos de plantas de la cepa de los nematodos, es decir, nematodos fitoparasitarios, en especial *Aphelenchoides* spp., *Bursaphelenchus* spp., *Ditylenchus* spp., *Globodera* spp., *Heterodera* spp., *Longidorus* spp., *Meloidogyne* spp., *Pratylenchus* spp., *Radopholus* spp., *Trichodorus* spp., *Tylenchulus* spp., *Xiphinema* spp., *Helicotylenchus* spp., *Tylenchorhynchus* spp., *Scutellonema* spp., *Paratrichodorus* spp., *Meloinema* spp., *Paraphelenchus* spp., *Aglenchus* spp., *Belonolaimus* spp., *Nacobbus* spp., *Rotylenchulus* spp., *Rotylenchus* spp., *Neotylenchus* spp., *Paraphelenchus* spp., *Dolichodorus* spp., *Hoplolaimus* spp., *Punctodera* spp., *Criconemella* spp., *Quinisulcius* spp., *Hemicycliophora* spp., *Anguina* spp., *Subanguina* spp., *Hemicriconemoides* spp., *Psilenchus* spp., *Pseudohalenchus* spp., *Criconemoides* spp., *Cacopaurus* spp.

Además, se pueden combatir del subreino de los protozoos el orden de los coccidios, por ejemplo, *Eimeria* spp.

### Formulaciones

- 40 La presente invención también se refiere a formulaciones y formas de uso preparadas a partir de ellas como agentes fitoprotectores y/o pesticidas, por ejemplo, licores de remojado, inmersión y pulverización, que comprenden al menos uno de los principios activos según la invención. En algunos casos, las formas de uso comprenden otros agentes fitoprotectores y/o pesticidas y/o adyuvantes que mejoran la acción, tales como penetrantes, por ejemplo, aceites vegetales, por ejemplo, aceite de colza, aceite de girasol, aceites minerales, por ejemplo, aceites de parafina,
- 45 ésteres de alquilo de ácidos grasos vegetales, por ejemplo, éster metílico de aceite de colza o éster metílico de aceite de soja o alcoxilatos de alcanol y/o esparcidores, por ejemplo, alquilsiloxanos y/o sales, por ejemplo, sales de amonio o fosfonio orgánicas o inorgánicas, por ejemplo, sulfato de amonio o hidrógeno-fosfato de diamonio y/o promotores de la retención, por ejemplo, sulfosuccinato de dioctilo o polímeros de hidroxipropilguar y/o humectantes, por ejemplo, glicerol y/o fertilizantes, por ejemplo, fertilizantes que contienen amonio, potasio o fósforo.
- 50 Las formulaciones convencionales son, por ejemplo, líquidos solubles en agua (SL), concentrados en emulsión (EC), emulsiones en agua (EW), concentrados en suspensión (SC, SE, FS, OD), gránulos dispersables en agua (WG), gránulos (GR) y concentrados en cápsula (CS); estos y otros tipos de formulación posibles se describen, por ejemplo, por Crop Life International y en Pesticide Specifications, Manual on development and use of FAO and WHO specifications for pesticides, FAO Plant Production and Protection Papers – 173, preparados por FAO/WHO Joint Meeting on Pesticide Specifications, 2004, ISBN: 9251048576. Las formulaciones, además de uno o varios principios
- 55 activos según la invención, opcionalmente comprenden otros principios agroquímicamente activos.

Elas son preferentemente formulaciones o formas de uso que comprenden auxiliares, por ejemplo, extensores, disolventes, promotores de espontaneidad, vehículos, emulsionantes, dispersantes, protectores de heladas, biocidas, espesantes y/u otros auxiliares, por ejemplo, adyuvantes. Un adyuvante en este contexto es un

60 componente que mejora el efecto biológico de la formulación, sin el componente propiamente dicho que tiene cualquier efecto biológico. Los ejemplos de adyuvantes son agentes que promueven la retención, dispersión, unión con la superficie de la hoja o penetración.

Estas formulaciones se preparan de una manera conocida, por ejemplo, mezclando los principios activos con auxiliares tales como, por ejemplo, extensores, disolventes y/o portadores sólidos y/u otros auxiliares tales como, por ejemplo, tensioactivos. Las formulaciones se preparan ya sea en instalaciones apropiadas o incluso antes o durante la aplicación.

5 Los auxiliares usados pueden ser sustancias apropiadas para impartir propiedades especiales, tales como determinadas propiedades físicas, técnicas y/o biológicas a la formulación de los principios activos o las formas de uso preparadas a partir de estas formulaciones (por ejemplo, agentes fitosanitarios listos para usar tales como caldos de pulverización o productos de recubrimiento de semillas).

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

15 Si el extensor usado es agua, también es posible emplear, por ejemplo, disolventes orgánicos como disolventes auxiliares. Esencialmente, los disolventes líquidos apropiados son: compuestos aromáticos tales como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, compuestos aromáticos clorados o hidrocarburos alifáticos clorados tales como clorobencenos, cloroetilenos o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos tales como ciclohexano o parafinas, por ejemplo, fracciones de aceite mineral, aceites minerales y vegetales, alcoholes tales como butanol o glicol y sus éteres y ésteres, cetonas tales como acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona o ciclohexanona, disolventes fuertemente polares tales como dimetilformamida y dimetilsulfóxido y también agua.

20 En principio, es posible usar todos los disolventes apropiados. Los ejemplos de disolventes apropiados son hidrocarburos aromáticos tales como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, hidrocarburos aromáticos clorados o hidrocarburos alifáticos clorados tales como clorobenceno, cloroetileno o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos tales como ciclohexano, parafinas, fracciones de petróleo, aceites minerales y vegetales, alcoholes, tales como metanol, etanol, isopropanol, butanol o glicol y sus éteres y ésteres, cetonas tales como acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona o ciclohexanona, disolventes fuertemente polares tales como dimetilsulfóxido y agua.

25 En principio, es posible usar todos los vehículos apropiados. Los vehículos útiles incluyen especialmente: por ejemplo, sales de amonio y minerales naturales molidos tales como caolines, arcillas, talco, tiza, cuarzo, attapulgita, montmorillonita o tierra de diatomeas y materiales sintéticos molidos tales como sílice finamente dividida, alúmina y silicatos naturales o sintéticos, resinas, ceras y/o fertilizantes sólidos. Las mezclas de tales vehículos se pueden usar de mismo modo. Los vehículos de utilidad para gránulos incluyen: por ejemplo, piedras naturales picadas y fraccionadas, tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita y gránulos sintéticos de harinas inorgánicas y orgánicas y también gránulos de material orgánico tales como aserrín, papel, cáscaras de coco, mazorcas de maíz y tallos de tabaco.

30 También se pueden usar extensores gaseosos licuados o disolventes. Los extensores o vehículos particularmente apropiados son aquellos que son gaseosos a temperatura ambiente y a presión atmosférica, por ejemplo, gases propelentes en aerosol, tales como halohidrocarburos y también butano, propano, nitrógeno y dióxido de carbono.

40 Los ejemplos de emulsionantes y/o formadores de espuma, dispersantes o agentes humectantes con propiedades iónicas o no iónicas o mezclas de estos tensioactivos, son sales de ácido poliacrílico, sales de ácido lignosulfónico, sales de ácido fenolsulfónico o ácido naftalensulfónico, policondensados de óxido de etileno con alcoholes grasos o con ácidos grasos o con aminas grasas, con fenoles sustituidos (preferentemente, alquifenoles o arilfenoles), sales de ésteres sulfosuccínicos, derivados de taurina (preferentemente, tauratos de alquilo), ésteres fosfóricos de alcoholes polietoxilados o fenoles, ésteres grasos de polioles y derivados de los compuestos que contienen sulfatos, sulfonatos y fosfatos, por ejemplo, éteres de alquilarilpoliglicol, sulfonatos de alquilo, sulfatos de alquilo, sulfonatos de arilo, hidrolizados de proteína, licores de desecho de lignosulfito y metilcelulosa. La presencia de un tensioactivo es ventajosa si uno de los principios activos y/o uno de los portadores inertes es insoluble en agua y cuando la aplicación tiene lugar en agua.

45 Otros auxiliares que pueden estar presentes en las formulaciones y las formas de uso derivadas de ellas incluyen tinturas tales como pigmentos inorgánicos, por ejemplo, óxido de hierro, óxido de titanio y azul de Prusia y tinturas orgánicas tales como tintura de alizarina, tinturas azoicas y tinturas de ftalocianina metálica y nutrientes y nutrientes en trazas tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y zinc.

50 Los componentes adicionales pueden ser estabilizantes, tales como estabilizantes de baja temperatura, conservantes, antioxidantes, fotoestabilizantes u otros agentes que mejoran la estabilidad química y/o física. Los formadores de espuma o antiespumantes también pueden estar presentes.

55 Además, las formulaciones y las formas de uso derivadas de ellas pueden comprender también, como auxiliares adicionales, espesantes tales como carboximetilcelulosa y polímeros naturales y sintéticos en forma de polvos, gránulos o látex tales como goma arábiga, alcohol polivinílico y acetato de polivinilo o incluso fosfolípidos naturales

tales como cefalinas y lecitinas y fosfolípicos sintéticos. Otros posibles auxiliares son aceites minerales y vegetales.

Opcionalmente, otros auxiliares pueden estar presentes en las formulaciones y las formas de uso derivadas de ellas. Los ejemplos de tales aditivos incluyen fragancias, coloides protectores, aglutinantes, adhesivos, espesantes, agentes tixotrópicos, penetrantes, promotores de la retención, estabilizantes, secuestrantes, agentes complejizantes, humectantes, dispersantes. En general, los principios activos se pueden combinar con cualquier aditivo sólido o líquido comúnmente usado para fines de formulación.

Los promotores de retención útiles incluyen todas aquellas sustancias que reducen la tensión superficial dinámica, por ejemplo, sulfosuccinato de dioctilo o incremento de la viscoelasticidad, por ejemplo, polímeros de hidroxipropilguar.

Los penetrantes apropiados en el presente contexto son todas aquellas sustancias que se emplean usualmente para mejorar la penetración de principios activos agroquímicos en plantas. Los penetrantes se definen en este contexto por su capacidad de penetrar desde el licor de aplicación (generalmente acuoso) y/o desde el recubrimiento de pulverización en la cutícula de la planta y aumentar así la movilidad de compuestos activos en la cutícula. El método descrito en la literatura (Baur et al., 1997, Pesticide Science 51, 131-152) se puede usar para determinar su propiedad. Los ejemplos incluyen alcoxilatos de alcohol tales como etoxilato graso de coco (10) o etoxilato de isotridecilo (12), ésteres de ácido graso, por ejemplo, éster metílico de aceite de colza o éster metílico de aceite de soja, alcoxilatos de amina grasos, por ejemplo, etoxilato de tallow amina (15) o sales de amonio y/o de fosfonio, por ejemplo, sulfato de amonio o hidrógeno-fosfato de diamonio.

Las formulaciones comprenden, preferentemente, entre el 0,00000001 y el 98 % en peso del respectivo principio activo o, con mayor preferencia, entre el 0,01 % y el 95 % en peso del principio activo con máxima preferencia, entre el 0,5 % y el 90 % en peso del principio activo, basado en el peso de la formulación.

El contenido de principio activo de las formas de aplicación preparadas a partir de las formulaciones (agentes fitosanitarios) puede variar en amplios intervalos. La concentración de principio activo de las formas de aplicación puede encontrarse entre 0,00000001 y el 95 % en peso de principio activo, preferentemente entre el 0,00001 y el 1 % en peso, referido al peso de la forma de aplicación. La administración se realiza en uno de los modos habituales adaptados a las formas de aplicación.

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

Los principios activos especificados aquí con sus nombres comunes son conocidos y se describen, por ejemplo, en The Pesticide Manual, 16th Ed., British Crop Protection Council 2012 o se pueden buscar en la Internet (por ejemplo, <http://www.alanwood.net/pesticides>).

(1) Inhibidores de acetilcolinesterasa (AChE), por ejemplo, carbamatos, por ejemplo, alanicarb, aldicarb, bendiocarb, benfurcarb, butocarboxima, butoxicarboxima, carbarilo, carbofurano, carbosulfano, etiofencarb, fenobucarb, formetanato, furatiocarb, isoprocarb, metiocarb, metomilo, metolcarb, oxamilo, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, triazamato, trimetacarb, XMC y xililcarb; u organofosfatos, por ejemplo, acefato, azametifos, azinfos-etilo, azinfos-metilo, cadusafos, cloretixifos, clorfenvinfos, clormefos, clorpirifos, clorpirifos-metilo, coumafos, cianofos, demetona-S-metilo, diazinona, diclorvos/DDVP, dicrotofos, dimetoato, dimetilvinfos, disulfotona, EPN, etiona, etoprofos, famfur, fenamifos, fenitrotiona, fentiona, fostiazato, heptenofos, imiciafos, isofenfos, O-(metoxiaminotiofosforil)salicilato de isopropilo, isoxationa, malationa, mecarbam, metamidofos, metidationa, mevinfos, monocrotofos, naled, ometoato, oxidemetona-metilo, parationa, parationa-metilo, fentoato, forato, fosalono, fosmet, fosfamidona, foxima, pirimifos-metilo, profenofos, propetamfos, protiofos, piraclofos, piridafentiona, quinalfos, sulfotep, tebupirimfos, temefos, terbufos, tetraclorvinfos, tiometona, triazofos, triclorfona y vamidotona.

(2) Antagonistas del canal de cloruro regulado por GABA, por ejemplo, ciclodieno-organocloros, por ejemplo, clordano y endosulfano o fenilpirazoles (fiproles), por ejemplo, etiprol y fipronilo.

(3) Moduladores del canal de sodio / bloqueadores del canal de sodio regulado por voltaje, por ejemplo, piretroides, por ejemplo, acrinatrina, aletrina, d-cis-transaletrina, d-transaletrina, bifentrina, bioaletrina, isómero de s-ciclopentenilo de bioaletrina, bioresmetrina, cicloprotrina, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, lambda-cihalotrina, gamma-cihalotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, beta-cipermetrina, teta-cipermetrina, zeta-cipermetrina, cifenotrina [isómero (1R)-trans], deltametrina, empentrina [isómero (EZ)-(1R)], esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flumetrina, tau-fluvalinato, halfenprox, imiprotrina, kadetrina, permetrina, fenotrina [isómero (1R)-trans], praletrina, piretrinas (piretro), resmetrina, silafluofeno, teflutrina, tetrametrina, tetrametrina [isómero (1R)], tralometrina y transflutrina o DDT o metoxicloro.

(4) Agonistas del receptor nicotínico de acetilcolina (nAChR), por ejemplo, neonicotinoides, por ejemplo, acetamiprida, clotianidina, dinotefurano, imidacloprida, nitenpiram, tiacloprida y tiametoxam o nicotina o sulfoxaflor.

(5) Activadores alostéricos del receptor nicotínico de acetilcolina (nAChR), por ejemplo, espinosinas, por ejemplo, espinetoram y espinosad.

(6) Activadores del canal de cloruro, por ejemplo, avermectinas/milbemecinas, por ejemplo, abamectina, benzoato de emamectina, lepimectina y milbemectina.

(7) Imitadores de la hormona juvenil, por ejemplo, análogos de la hormona juvenil, por ejemplo, hidropreno, kinopreno y metopreno o fenoxicarb o piriproxifeno.

(8) Principios activos mecanismos de acción desconocidos o no específicos, por ejemplo, haluros de alquilo, por ejemplo, bromuro de metilo y otros haluros de alquilo; o cloropicrina o fluoruro de sulfurilo o bórax o tártaro emético.

(9) Antialimentantes selectivos, por ejemplo, pimetrozina o flonicamida.

(10) Inhibidores del crecimiento de ácaros, por ejemplo, clofentezina, hexitiazox y diflovidazina o etoxazol.

(11) Disruptores microbianos de la membrana intestinal de insectos, por ejemplo, *Bacillus thuringiensis* subespecie israelensis, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus thuringiensis* subespecie aizawai, *Bacillus thuringiensis* subespecie kurstaki, *Bacillus thuringiensis* subespecie tenebrionis y proteínas de plantas BT: Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry2Ab, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb, Cry34/35Ab1.

(12) Inhibidores de la fosforilación oxidativa, disruptores de ATP, por ejemplo, diafentiurona o compuestos de organoestaño, por ejemplo, azociclotina, cihexatina y óxido de fenbutatina o propargita o tetradifona.

(13) Desacopladores de la fosforilación oxidativa que interrumpen el gradiente de protón H, por ejemplo, clorfenapir, DNOC y sulfluramida.

(14) Antagonistas del receptor nicotínico de acetilcolina, por ejemplo, bensultap, clorhidrato de cartap, tiocilam y tiosultap-sodio.

(15) Inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 0, por ejemplo, bistriflurona, clorfluazurona, diflubenzurona, flucicloxurona, flufenoxurona, hexaflumurona, lufenurona, novalurona, noviflumurona, teflubenzurona y triflumurona.

(16) Inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 1, por ejemplo, buprofezina.

(17) Principios activos inhibidores de la muda, dípteros como, por ejemplo, cromazina.

(18) Agonistas del receptor de ecdisoma, por ejemplo, cromafenozida, halofenozida, metoxifenozida y tebufenozida.

(19) Agonistas octopaminérgicos, por ejemplo, amitraz.

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

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

(22) Bloqueadores del canal de sodio regulado por voltaje, por ejemplo, indoxacarb o metaflumizona.

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

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

(25) Inhibidores del transporte de electrones de complejo II, por ejemplo, cienopirafeno y ciflumentofeno.

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

Otros principios activos con mecanismo de acción desconocido, por ejemplo, afidopiropeno, azadiractina, benclotiaz, benzoximato, bifenazato, bromopropilato, chinometionato, criolita,

dicofol, diflovidazina, fluensulfona, flometoquina, flufenerim, flufenoxistrobina, flufiprol, fluopiram, flupiradifurona, fufenozida, heptaflutrina, imidaclotiz, iprodiona, meperflutrina, paichongding, piflubumida, pirifluquinazona, piriminostrobina, tetrametilflutrina y yodometano; y también preparaciones basadas en *Bacillus firmus* (I-1582, BioNeem, Votivo) y también los siguientes compuestos activos conocidos: 3-bromo-N-{2-bromo-4-cloro-6-[(1-ciclopropiletil)carbamoil]fenil}-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocida del documento WO2005/077934) y 1-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]fenil}-3-(trifluorometil)-1H-1,2,4-triazol-5-amina (conocida del 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 del documento WO2003/106457), 2-cloro-N-[2-{1-[(2E)-3-(4-clorofenil)prop-2-en-1-il]piperidin-4-il}-4-(trifluorometil)fenil]isonicotinamida (conocida del documento WO2006/003494), 3-(2,5-dimetilfenil)-4-hidroxi-8-metoxi-1,8-diazaespiro[4.5]dec-3-en-2-ona (conocida del documento WO2009/049851), 3-(2,5-dimetilfenil)-8-metoxi-2-oxo-1,8-diazaespiro[4.5]dec-3-en-4-il-etilcarbonato (conocido del documento WO2009/049851), 4-(but-2-in-1-iloxi)-6-(3,5-dimetilpiperidin-1-il)-5-fluoropirimidina (conocida del documento WO2004/099160), 4-(but-2-in-1-iloxi)-6-(3-clorofenil)pirimidina (conocida del documento WO2003/076415), PF1364 (CAS Reg. No. 1204776-60-2), 4-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-2-metil-N-{2-oxo-2-[(2,2,2-trifluoroetil)amino]etil}benzamida (conocida del documento WO2005/085216), 4-{5-[3-cloro-5-(trifluorometil)fenil]-5-(trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-N-[2-oxo-2-[(2,2,2-trifluoroetil)amino]etil]-1-naftamida (conocida del documento WO2009/002809), 2-[2-({[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil}amino)-5-cloro-3-metilbenzoil]-2-metilhidrazincarboxilato de metilo (conocido del documento WO2005/085216), 2-[2-({[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil}amino)-5-ciano-3-metilbenzoil]-2-etilhidrazincarboxilato de metilo (conocido del documento WO2005/085216), 2-[2-({[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil}amino)benzoil]-2-etilhidrazincarboxilato de metilo (conocida del 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 (conocida del documento WO2005/085216), 1-(3-cloropiridin-2-il)-N-[4-ciano-2-metil-6-(metilcarbamoil)fenil]-3-[[5-(trifluorometil)-2H-tetrazol-2-il]metil]-1H-pirazol-5-carboxamida (conocida del documento WO2010/069502), 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 del documento CN102057925), 3-cloro-N-(2-cianopropan-2-il)-N-[4-(1,1,1,2,3,3,3-heptafluoropropan-2-il)-2-metilfenil]ftalamida (conocida del documento WO2012/034472), 8-cloro-N-[(2-cloro-5-metoxifenil)sulfonil]-6-(trifluorometil)imidazo[1,2-a]piridin-2-carboxamida (conocida del 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 del documento WO2009/080250), 4-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-2-metil-N-(1-oxidotietan-3-il)benzamida (conocida del documento WO2012/029672), 1-[(2-cloro-1,3-tiazol-5-il)metil]-4-oxo-3-fenil-4H-pirido[1,2-a]pirimidin-1-ilo-2-olato (conocido del documento WO2009/099929), 1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]-4-oxo-3-fenil-4H-pirido[1,2-a]pirimidin-1-ilo-2-olato (conocido del documento WO2009/099929), (5S,8R)-1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]-9-nitro-2,3,5,6,7,8-hexahidro-1H-5,8-epoxiimidazo[1,2-a]azepina (conocida del documento WO2010/069266), (2E)-1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]-N'-nitro-2-pentilidenhidrazincarboximidamida (conocida del documento WO2010/060231), 4-(3-{2,6-dicloro-4-[(3,3-dicloroprop-2-en-1-il)oxi]fenoxi}propoxi)-2-metoxi-6-(trifluorometil)pirimidina (conocida del documento CN101337940), N-[2-(ter-butilcarbamoil)-4-cloro-6-metilfenil]-1-(3-cloropiridin-2-il)-3-(fluorometoxi)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocida del documento WO2008/134969).

### Fungicidas

(1) inhibidores de la biosíntesis de ergosterol tales como, por ejemplo, (1.1) aldimorf (1704-28-5), (1.2) azaconazol (60207-31-0), (1.3) bitertanol (55179-31-2), (1.4) bromuconazol (116255-48-2), (1.5) ciproconazol (113096-99-4), (1.6) diclobutrazol (75736-33-3), (1.7) difenoconazol (119446-68-3), (1.8) diniconazol (83657-24-3), (1.9) diniconazol-M (83657-18-5), (1.10) dodemorf (1593-77-7), (1.11) acetato de dodemorf (31717-87-0), (1.12) epoxiconazol (106325-08-0), (1.13) etaconazol (60207-93-4), (1.14) fenarimol (60168-88-9), (1.15) fenbuconazol (114369-43-6), (1.16) fenhexamida (126833-17-8), (1.17) fenpropidina (67306-00-7), (1.18) fenpropimorf (67306-03-0), (1.19) fluquinconazol (136426-54-5), (1.20) flurprimidol (56425-91-3), (1.21) flusilazol (85509-19-9), (1.22) flutriafol (76674-21-0), (1.23) furconazol (112839-33-5), (1.24) furconazol-Cis (112839-32-4), (1.25) hexaconazol (79983-71-4), (1.26) imazalilo (60534-80-7), (1.27) sulfato de imazalilo (58594-72-2), (1.28) imibutanazol (86598-92-7), (1.29) ipconazol (125225-28-7), (1.30) metconazol (125116-23-6), (1.31) miclobutanilo (88671-89-0), (1.32) naftifina (65472-88-0), (1.33) nuarimol (63284-71-9), (1.34) oxpoconazol (174212-12-5), (1.35) paclobutrazol (76738-62-0), (1.36) pefurazoato (101903-30-4), (1.37) penconazol (66246-88-6), (1.38) piperalina (3478-94-2), (1.39) procloraz (67747-09-5), (1.40) propiconazol (60207-90-1), (1.41) protioconazol (178928-70-6), (1.42) piributicarb (88678-67-5), (1.43) pirifenox (88283-41-4), (1.44) quinconazol (103970-75-8), (1.45) simeconazol (149508-90-7), (1.46) espiroxamina (118134-30-8), (1.47) tebuconazol (107534-96-3), (1.48) terbinafina (91161-71-6), (1.49) tetraconazol (112281-77-3), (1.50) triadimefona (43121-43-3), (1.51) triadimenol (89482-17-7), (1.52) tridemorf (81412-43-3), (1.53) triflumizol (68694-11-1), (1.54) triforina (26644-46-2), (1.55) triticonazol (131983-72-7), (1.56) uniconazol (83657-22-1), (1.57) uniconazol-p (83657-17-4), (1.58) viniconazol (77174-66-4), (1.59) voriconazol (137234-62-9), (1.60) 1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)cicloheptanol (129586-32-9), (1.61) metil-1-(2,2-dimetil-2,3-dihidro-1H-inden-1-il)-1H-imidazol-5-carboxilato (110323-95-0), (1.62) N'-{5-(difluorometil)-2-metil-4-[3-(trimetilsilil)propoxi]fenil]-N-etil-N-metilimidofornamida, (1.63) N-etil-N-metil-N'-{2-metil-5-(trifluorometil)-4-[3-(trimetilsilil)propoxi]fenil}imidofornamida y (1.64) O-[1-(4-metoxifenoxi)-3,3-dimetilbutan-2-il]-1H-imidazol-1-carbotioato (111226-71-2).

(2) inhibidores de la respiración (inhibidores de la cadena respiratoria), tales como, por ejemplo, (2.1) bixafeno (581809-46-3), (2.2) boscalida (188425-85-6), (2.3) carboxina (5234-68-4), (2.4) diflumetorim (130339-07-0), (2.5) fenfuram (24691-80-3), (2.6) fluopiram (658066-35-4), (2.7) flutolanilo (66332-96-5), (2.8) fluxapiroxad (907204-31-3), (2.9) furametpir (123572-88-3), (2.10) furnecicloz (60568-05-0), (2.11) isopirazam mezcla del racemato sin-epimérico 1RS,4SR,9RS y del racemato anti-epimérico 1RS,4SR,9SR (881685-58-1), (2.12) isopirazam (racemato anti-epimérico), (2.13) isopirazam (enantiómero anti-epimérico 1R,4S,9S), (2.14) isopirazam (enantiómero anti-epimérico 1S,4R,9R), (2.15) isopirazam (racemato sin-epimérico 1RS,4SR,9RS), (2.16) isopirazam (enantiómero sin-epimérico 1R,4S,9R), (2.17) isopirazam (enantiómero sin-epimérico 1S,4R,9S), (2.18) mepronilo (55814-41-0), (2.19) oxicarboxina (5259-88-1), (2.20) penflufeno (494793-67-8), (2.21) pentiopirad (183675-82-3), (2.22) sedaxano (874967-67-6), (2.23) tifulzamida (130000-40-7), (2.24) 1-metil-N-[2-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil]-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.25) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[2-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.26) 3-(difluorometil)-N-[4-fluoro-2-(1,1,2,3,3,3-hexafluoropropoxi)fenil]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.27) N-[1-(2,4-diclorofenil)-1-metoxipropan-2-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida (1092400-95-7), (2.28) 5,8-difluoro-N-[2-(2-fluoro-4-[[4-(trifluorometil)piridin-2-il]oxi]fenil]etil]quinazolin-4-amina (1210070-84-0) (conocida del documento WO2010025451), (2.29) N-[9-(diclorometil)-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.30) N-[(1S,4R)-9-(diclorometil)-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida y (2.31) N-[(1R,4S)-9-(diclorometil)-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida.

(3) Inhibidores de la respiración (inhibidores de la cadena respiratoria) en el complejo III de la cadena respiratoria, tales como, por ejemplo, (3.1) ametoctradina (865318-97-4), (3.2) amisulbromo (348635-87-0), (3.3) azoxistrobina (131860-33-8), (3.4) ciazofamida (120116-88-3), (3.5) coumetoxistrobina (850881-30-0), (3.6) coumoxistrobina (850881-70-8), (3.5) dimoxistrobina (141600-52-4), (3.6) enestrobirina (238410-11-2) (conocida del documento WO 2004/058723), (3.9) famoxadona (131807-57-3) (conocida del documento WO 2004/058723), (3.10) fenamidona (161326-34-7) (conocida del documento WO 2004/058723), (3.11) fenoxistrobina (918162-02-4), (3.12) fluoxastrobina (361377-29-9) (conocida del documento WO 2004/058723), (3.13) cresoxim-metilo

(143390-89-0) (conocido del documento WO 2004/058723), (3.14) metominostrobin (133408-50-1) (conocida del documento WO 2004/058723), (3.15) orisastrobin (189892-69-1) (conocida del documento WO 2004/058723), (3.16) picoxistrobin (117428-22-5) (conocida del documento WO 2004/058723), (3.17) piraclostrobin (175013-18-0) (conocida del documento WO 2004/058723), (3.18) pirametostrobin (915410-70-7) (conocida del documento WO 2004/058723), (3.19) piraoxistrobin (862588-11-2) (conocida del documento WO 2004/058723), (3.20) piribencarb (799247-52-2) (conocida del documento WO 2004/058723), (3.21) triclopircarb (902760-40-1), (3.22) trifloxistrobin (141517-21-7) (conocida del documento WO 2004/058723), (3.23) (2E)-2-(2-{{[6-(3-cloro-2-metilfenoxi)-5-fluoropirimidin-4-il]oxi}fenil}-2-(metoxiimino)-N-metiletanamida (conocida del documento WO 2004/058723), (3.24) (2E)-2-(metoxiimino)-N-metil-2-(2-{{(1E)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etiliden}amino)oxi]metil}fenil}etanamida (conocida del documento WO 2004/058723), (3.25) (2E)-2-(metoxiimino)-N-metil-2-{2-[[E]-{{1-[3-(trifluorometil)fenil]etoxi]imino}metil}fenil}etanamida (158169-73-4), (3.26) (2E)-2-{2-[[{(1E)-1-(3-{{[E]-1-fluoro-2-feniletetil}oxi}fenil)etiliden]amino)oxi]metil}fenil}-2-(metoxiimino)-N-metiletanamida (326896-28-0), (3.27) (2E)-2-{2-[[{(2E,3E)-4-(2,6-diclorofenil)but-3-en-2-iliden]amino)oxi]metil}fenil}-2-(metoxiimino)-N-metiletanamida, (3.28) 2-cloro-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)piridin-3-carboxamida (119899-14-8), (3.29) 5-metoxi-2-metil-4-(2-{{(1E)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etiliden}amino)oxi]metil}fenil}-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-ona, (3.30) metil-(2E)-2-{2-[[{ciclopropil}[(4-metoxifenil)imino]metil]sulfanil]metil}fenil}-3-metoxiprop-2-enoato (149601-03-6), (3.31) N-(3-etil-3,5,5-trimetilciclohexil)-3-(formilamino)-2-hidroxibenzamida (226551-21-9), (3.32) 2-{2-[[2,5-dimetilfenoxi]metil}fenil}-2-metoxi-N-metilacetamida (173662-97-0) y (3.33) (2R)-2-{2-[[2,5-dimetilfenoxi]metil}fenil}-2-metoxi-N-metilacetamida (394657-24-0).

(4) inhibidores de la mitosis y la división celular tales como, por ejemplo, (4.1) benomil (17804-35-2), (4.2) carbendazim (10605-21-7), (4.3) clorfenazol (3574-96-7), (4.4) dietofencarb (87130-20-9), (4.5) etaboxam (162650-77-3), (4.6) fluopicolida (239110-15-7), (4.7) fuberidazol (3878-19-1), (4.8) pencicurona (66063-05-6), (4.9) tiabendazol (148-79-8), (4.10) tiofanato-metilo (23564-05-8), (4.11) tiofanato (23564-06-9), (4.12) zoxamida (156052-68-5), (4.13) 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina (214706-53-3) y (4.14) 3-cloro-5-(6-cloropiridin-3-il)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorofenil)piridazina (1002756-87-7).

(5) compuestos con actividad multisitio tales como, por ejemplo, (5.1) mezcla de Bordeaux (8011-63-0), (5.2) captafol (2425-06-1), (5.3) captano (133-06-2) (conocido del documento WO 02/12172), (5.4) clorotalonilo (1897-45-6), (5.5) preparaciones de cobre como hidróxido de cobre (20427-59-2), (5.6) naftenato de cobre (1338-02-9), (5.7) óxido de cobre (1317-39-1), (5.8) oxiclورو de cobre (1332-40-7), (5.9) sulfato de cobre (7758-98-7), (5.10) diclofluanida (1085-98-9), (5.11) ditianona (3347-22-6), (5.12) dodina (2439-10-3), (5.13) base libre de dodina, (5.14) ferbam (14484-64-1), (5.15) fluorofolpet (719-96-0), (5.16) folpet (133-07-3), (5.17) guazatina (108173-90-6), (5.18) acetato de guazatina, (5.19) iminoctadina (13516-27-3), (5.20) albesilato de iminoctadina (169202-06-6), (5.21) triacetato de iminoctadina (57520-17-9), (5.22) mancozeb (53988-93-5), (5.23) mancozeb (8018-01-7), (5.24) maneb (12427-38-2), (5.25) metiram (9006-42-2), (5.26) metiram zinc (9006-42-2), (5.27) oxina de cobre (10380-28-6), (5.28) propamidina (104-32-5), (5.29) propineb (12071-83-9), (5.30) azufre y preparaciones azufradas tales como, por ejemplo, polisulfuro de calcio (7704-34-9), (5.31) tiram (137-26-8), (5.32) toliifluanida (731-27-1), (5.33) zineb (12122-67-7) y (5.34) ziram (137-30-4).

(6) inductores de la resistencia tales como, por ejemplo, (6.1) acibenzolar-S-metilo (135158-54-2), (6.2) isotianilo (224049-04-1), (6.3) probenazol (27605-76-1) y (6.4) tiadinilo (223580-51-6).

(7) inhibidores de la biosíntesis de aminoácidos y proteínas tales como, por ejemplo, (7.1) andoprim (23951-85-1), (7.2) blasticidina-S (2079-00-7), (7.3) ciprodinilo (121552-61-2), (7.4) casugamicina (6980-18-3), (7.5) clorhidrato de casugamicina hidrato (19408-46-9), (7.6) mepanipirim (110235-47-7), (7.7) pirimetanilo (53112-28-0) y (7.8) 3-(5-fluoro-3,3,4,4-tetrametil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina (861647-32-7) (conocida del documento WO2005070917).

(8) inhibidores de la producción de ATP tales como, por ejemplo, (8.1) acetato de fentina (900-95-8), (8.2) cloruro de fentina (639-58-7), (8.3) hidróxido de fentina (76-87-9) y (8.4) siltiofam (175217-20-6).

(9) inhibidores de la síntesis de la pared celular tales como, por ejemplo, (9.1) bentiavalicarb (177406-68-7), (9.2) dimetomorf (110488-70-5), (9.3) flumorf (211867-47-9), (9.4) iprovalicarb (140923-17-7), (9.5) mandipropamida (374726-62-2), (9.6) polioxinas (11113-80-7), (9.7) polioxorim (22976-86-9), (9.8) validamicina A (37248-47-8) y (9.9) valifenalato (283159-94-4; 283159-90-0).

(10) inhibidores de la síntesis de lípidos y la membrana tales como, por ejemplo, (10.1) bifenilo (92-52-4), (10.2) cloroneb (2675-77-6), (10.3) diclorano (99-30-9), (10.4) edifenfos (17109-49-8), (10.5) etridiazol (2593-15-9), (10.6) yodocarb (55406-53-6), (10.7) iprobenfos (26087-47-8), (10.8) isoprotiolano (50512-35-1), (10.9) propamocarb (25606-41-1), (10.10) clorhidrato de propamocarb (25606-41-1), (10.11) protiocarb (19622-08-3), (10.12) pirazofos (13457-18-6), (10.13) quintoceno (82-68-8), (10.14) tecnaceno (117-18-0) y (10.15) tolclofos-metilo (57018-04-9).

(11) inhibidores de la biosíntesis de melanina tales como, por ejemplo, (11.1) carpropamida (104030-54-8), (11.2) diclocimet (139920-32-4), (11.3) fenoxanilo (115852-48-7), (11.4) ftalida (27355-22-2), (11.5) piroquilona (57369-

32-1), (11.6) triciclazol (41814-78-2) y (11.7) {3-metil-1-[(4-metilbenzoil)amino]butan-2-il}carbamato de 2,2,2-trifluoroetilo (851524-22-6) (conocido del documento WO2005042474).

(12) inhibidores de la síntesis de ácidos nucleicos tales como, por ejemplo, (12.1) benalaxilo (71626-11-4), (12.2) benalaxilo-M (quiralaxilo) (98243-83-5), (12.3) bupirimato (41483-43-6), (12.4) clozilacona (67932-85-8), (12.5) dimetirimol (5221-53-4), (12.6) etirimol (23947-60-6), (12.7) furalaxilo (57646-30-7), (12.8) himexazol (10004-44-1), (12.9) metalaxilo (57837-19-1), (12.10) metalaxilo-M (mefenoxam) (70630-17-0), (12.11) ofurace (58810-48-3), (12.12) oxadixilo (77732-09-3) y (12.13) ácido oxolínico (14698-29-4).

(13) inhibidores de la transducción de señales tales como, por ejemplo, (13.1) clozolinato (84332-86-5), (13.2) fenciclonilo (74738-17-3), (13.3) fludioxonilo (131341-86-1), (13.4) iprodiona (36734-19-7), (13.5) procimidona (32809-16-8), (13.6) quinoxifeno (124495-18-7) y (13.7) vinclozolina (50471-44-8).

(14) desacopladores tales como, por ejemplo, (14.1) binapacril (485-31-4), (14.2) dinocap (131-72-6), (14.3) ferimziona (89269-64-7), (14.4) fluazinam (79622-59-6) y (14.5) meptildinocap (131-72-6).

(15) otros compuestos tales como, por ejemplo, (15.1) bentiazol (21564-17-0), (15.2) betoxazina (163269-30-5), (15.3) capsimicina (70694-08-5), (15.4) carvona (99-49-0), (15.5) quinometionato (2439-01-2), (15.6) pirofenona (clazafenona) (688046-61-9), (15.7) cufraneb (11096-18-7), (15.8) ciflufenamida (180409-60-3), (15.9) cimoxanilo (57966-95-7), (15.10) cipro sulfamida (221667-31-8), (15.11) dazomet (533-74-4), (15.12) debacarb (62732-91-6), (15.13) diclorofeno (97-23-4), (15.14) diclomezina (62865-36-5), (15.15) difenzoquat (49866-87-7), (15.16) metilsulfato de difenzoquat (43222-48-6), (15.17) difenilamina (122-39-4), (15.18) ecomat, (15.19) fenpirazamina (473798-59-3), (15.20) flumetover (154025-04-4), (15.21) fluoromida (41205-21-4), (15.22) flusulfamida (106917-52-6), (15.23) flutianilo (304900-25-2), (15.24) fosetil-aluminio (39148-24-8), (15.25) fosetil-calcio, (15.26) fosetil-sodio (39148-16-8), (15.27) hexaclorobenceno (118-74-1), (15.28) irumamicina (81604-73-1), (15.29) metasulfocarb (66952-49-6), (15.30) metilisotiocianato (556-61-6), (15.31) metrafenona (220899-03-6), (15.32) mildiomicina (67527-71-3), (15.33) natamicina (7681-93-8), (15.34) dimetilditiocarbamato de níquel (15521-65-0), (15.35) nitrotal-isopropilo (10552-74-6), (15.36) octilnona (26530-20-1), (15.37) oxamocarb (917242-12-7), (15.38) oxifentiina (34407-87-9), (15.39) pentaclorofenol y sus sales (87-86-5), (15.40) fenotrina, (15.41) ácido fosfórico y sus sales (13598-36-2), (15.42) propamocarb-fosetilato, (15.43) propanosina-sodio (88498-02-6), (15.44) proquinazida (189278-12-4), (15.45) pirimorf (868390-90-3), (15.45e) (2E)-3-(4-ter-butilfenil)-3-(2-cloropiridin-4-il)-1-(morfolin-4-il)prop-2-en-1-ona (1231776-28-5), (15.45z) (2Z)-3-(4-ter-butilfenil)-3-(2-cloropiridin-4-il)-1-(morfolin-4-il)prop-2-en-1-ona (1231776-29-6), (15.46) pirrolnitrina (1018-71-9) (conocida del documento EP-A 1 559 320), (15.47) tebufloquina (376645-78-2), (15.48) tecloftalam (76280-91-6), (15.49) tolnifanida (304911-98-6), (15.50) triazóxido (72459-58-6), (15.51) triclamida (70193-21-4), (15.52) zarilamida (84527-51-5), (15.53) 2-metilpropanoato de (3S,6S,7R,8R)-8-bencil-3-[[3-[(isobutirilo)metoxi]-4-metoxipiridin-2-il]carbonil]amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-ilo (517875-34-2) (conocido del documento WO2003035617), (15.54) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona (1003319-79-6), (15.55) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona (1003319-80-9), (15.56) 1-(4-{4-[(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 (1003318-67-9), (15.57) 1-(4-metoxifenoxi)-3,3-dimetilbutan-2-il-1H-imidazol-1-carboxilato (111227-17-9), (15.58) 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)piridina (13108-52-6), (15.59) 2,3-dibutil-6-clorotieno[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona (221451-58-7), (15.60) 2,6-dimetil-1H,5H-[1,4]ditiino[2,3-c:5,6-c']dipirrol-1,3,5,7(2H,6H)-tetrona, (15.61) 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(5R)-5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona (1003316-53-7), (15.62) 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(5S)-5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona (1003316-54-8), (15.63) 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(5S)-5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona (1003316-51-5), (15.64) 2-butoxi-6-yodo-3-propil-4H-cromen-4-ona, (15.65) 2-cloro-5-[2-cloro-1-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-4-metil-1H-imidazol-5-il]piridina, (15.66) 2-fenilfenol y sus sales (90-43-7), (15.67) 3-(4,4,5-trifluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina (861647-85-0) (conocida del documento WO2005070917), (15.68) 3,4,5-tricloropiridin-2,6-dicarbonitrilo (17824-85-0), (15.69) 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetil-1,2-oxazolidin-3-il]piridina, (15.70) 3-cloro-5-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-6-metilpiridazina, (15.71) 4-(4-clorofenil)-5-(2,6-difluorofenil)-3,6-dimetilpiridazina, (15.72) 5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-tiol, (15.73) 5-cloro-N'-fenil-N'-(prop-2-in-1-il)tiofen-2-sulfonohidrazida (134-31-6), (15.74) 5-fluoro-2-[(4-fluorobencil)oxi]pirimidin-4-amina (1174376-11-4) (conocida del documento WO2009094442), (15.75) 5-fluoro-2-[(4-metilbencil)oxi]pirimidin-4-amina (1174376-25-0) (conocida del documento WO2009094442), (15.76) 5-metil-6-octil[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-amina, (15.77) etil-(2Z)-3-amino-2-cian-3-fenilprop-2-enoato, (15.78) N'-(4-{3-(4-clorobencil)-1,2,4-tiadiazol-5-il}oxi)-2,5-dimetilfenil)-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.79) N-(4-clorobencil)-3-[3-metoxi-4-(prop-2-in-1-il)oxi]fenil]propanamida, (15.80) N-[(4-clorofenil)(cian)metil]-3-[3-metoxi-4-(prop-2-in-1-il)oxi]fenil]propanamida, (15.81) N-[(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)metil]-2,4-dicloropiridin-3-carboxamida, (15.82) N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2,4-dicloropiridin-3-carboxamida, (15.83) N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2-fluoro-4-yodopiridin-3-carboxamida, (15.84) N-[(E)-[(ciclopropilmetoxi)imino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil]-2-fenilacetamida (221201-92-9), (15.85) N-[(Z)-[(ciclopropilmetoxi)imino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil]-2-fenilacetamida (221201-92-9), (15.86) N'-{4-[(3-ter-butyl-4-ciano-1,2-tiazol-5-il)oxi]-2-cloro-5-metilfenil}-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.87) N-metil-2-(1-{[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-N-(1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il)-1,3-tiazol-4-carboxamida (922514-49-6), (15.88) N-metil-2-(1-{[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-

pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il]-1,3-tiazol-4-carboxamida (922514-07-6), (15.89) N-metil-2-(1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-N-[(1S)-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il]-1,3-tiazol-4-carboxamida (922514-48-5), (15.90) pentil-6-[[[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metiliden]amino]oxi]metil]piridin-2-il]carbamato, (15.91) ácido fenazin-1-carboxílico, (15.92) quinolin-8-ol (134-31-6), (15.93) quinolin-8-olsulfato (2:1) (134-31-6) y (15.94) {6-[[[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metiliden]amino]oxi]metil]piridin-2-il]carbamato de terc-butilo.

(16) Otros compuestos tales como, por ejemplo, (16.1) 1-metil-3-(trifluorometil)-N-[2'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.2) N-(4'-clorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.3) N-(2',4'-diclorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.4) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[4'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.5) N-(2',5'-difluorobifenil-2-il)-1-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.6) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[4'-(prop-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.7) 5-fluoro-1,3-dimetil-N-[4'-(prop-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.8) 2-cloro-N-[4'-(prop-1-in-1-il)bifenil-2-il]piridin-3-carboxamida, (16.9) 3-(difluorometil)-N-[4'-(3,3-dimetilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.10) N-[4'-(3,3-dimetilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.11) 3-(difluorometil)-N-(4'-etinilbifenil-2-il)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.12) N-(4'-etinilbifenil-2-il)-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.13) 2-cloro-N-(4'-etinilbifenil-2-il)piridin-3-carboxamida, (16.14) 2-cloro-N-[4'-(3,3-dimetilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]piridin-3-carboxamida (conocida del documento EP-A 1 559 320), (16.15) 4-(difluorometil)-2-metil-N-[4'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1,3-tiazol-5-carboxamida, (16.16) 5-fluoro-N-[4'-(3-hidroxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.17) 2-cloro-N-[4'-(3-hidroxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]piridin-3-carboxamida, (16.18) 3-(difluorometil)-N-[4'-(3-metoxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.19) 5-fluoro-N-[4'-(3-metoxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.20) 2-cloro-N-[4'-(3-metoxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]piridin-3-carboxamida, (16.21) (5-bromo-2-metoxi-4-metilpiridin-3-il)(2,3,4-trimetoxi-6-metilfenil)metanona, (16.22) N-[2-(4-[[3-(4-clorofenil)prop-2-in-1-il]oxi]-3-metoxifenil)etil]-N2-(metilsulfonil)valinamida (220706-93-4), (16.23) ácido 4-oxo-4-[(2-feniletil)amino]butanoico y (16.24) {6-[[[(Z)-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metiliden]amino]oxi]metil]piridin-2-il]carbamato de but-3-in-1-ilo.

Todos los pares de mezcla de las clases (1) a (16) mencionados pueden formar sales, aun si están en condiciones para ello debido a sus grupos funcionales, opcionalmente con bases o ácidos apropiados.

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

### Plantas y partes de plantas

Todas las plantas y partes de plantas se pueden tratar de acuerdo con la invención. Aquí, plantas se han de entender como todas las plantas y poblaciones de plantas tales como plantas salvajes o plantas de cultivos deseadas y no deseadas (que incluyen plantas de cultivos naturales). Las plantas de cultivo que se pueden obtener por métodos de cría y optimización convencionales o por métodos biotecnológicos y de ingeniería genética o combinaciones de estos métodos, que incluyen las plantas transgénicas y que incluyen los cultivares de plantas que se pueden proteger o no por derechos de los criadores de plantas. Las partes de plantas se han de entender como todas las partes y órganos de las plantas por encima y por debajo del suelo, tales como brotes, hojas, flores y raíces, dando como ejemplos hojas, agujas, troncos, tallos, flores, cuerpos de frutas, frutos y semillas y también tubérculos, raíces y rizomas. Las partes de plantas también incluyen material cosechado y material de propagación vegetativo y generativo, por ejemplo, esquejes, tubérculos, rizomas, cortes y semillas.

El tratamiento de acuerdo con la invención de las plantas y partes de plantas con los principios activos se efectuó directamente o dejando que ellos actuaran sobre los alrededores, el hábitat o su espacio de almacenamiento por medio de los métodos de tratamiento habituales, por ejemplo, por inmersión, pulverización, evaporación, nebulización, dispersión, pintura, inyección y, en el caso del material de propagación, en especial en el caso de semillas, también por aplicación de uno o varios recubrimientos.

Como ya se mencionó con anterioridad, es posible de acuerdo con la invención tratar las plantas y sus partes. En una realización preferida, se tratan especies de plantas silvestres y cultivares de plantas o aquellos obtenidos por cruce biológica convencional, tales como cruce o fusión de protoplastos y sus partes. En otra realización preferida, se tratan plantas transgénicas y cultivares de plantas obtenidos por métodos de ingeniería genética, de ser apropiado, en combinación con métodos convencionales (organismos genéticamente modificados) y sus partes. El término "partes" o "partes de plantas" se han explicado con anterioridad. Se da particular preferencia de acuerdo con la invención al tratamiento de plantas de los respectivos cultivares habituales en comercios o aquellos que están en uso. Los cultivares de plantas se han de entender como plantas que tienen nuevas propiedades ("rasgos") y que fueron obtenidos por técnicas de cría convencionales, por mutagénesis o por técnicas de ADN recombinantes. Pueden ser cultivares, variedades, biotipos o genotipos.

### Plantas transgénicas, tratamiento de semillas y eventos de integración

Según el tipo de planta o variedad de planta, su hábitat y condiciones de crecimiento (suelo, clima, periodo

vegetativo, alimentación), pueden aparecer también efectos superaditivos (“sinérgicos”) mediante el tratamiento de acuerdo con la invención. Así, son posibles, por ejemplo, cantidades de aplicación reducidas y/o ampliaciones del espectro de acción y/o un reforzamiento del efecto de las sustancias y agentes de acuerdo con la invención, mejor crecimiento de plantas, mayor tolerancia frente a altas o bajas temperaturas, mayor tolerancia a la sequía o frente al contenido de agua o sales del suelo, mayor rendimiento de floración, recolección facilitada, aceleramiento de la maduración, mayores rendimientos de cosecha, mayor calidad y/o mayor valor nutritivo de los productos de cosecha, mayor capacidad de almacenamiento y/o procesabilidad de los productos de cosecha, que superan los efectos que realmente se esperan.

Pertencen a las plantas o variedades de plantas transgénicas preferidas de acuerdo con la invención para tratar (obtenidas por ingeniería genética) todas las plantas que mediante la modificación por ingeniería genética han obtenido material genético que confiere a estas plantas propiedades valiosas especialmente ventajosas (“rasgos”). Son ejemplos de dichas propiedades mejor crecimiento de planta, tolerancia elevada frente a temperaturas altas o bajas, tolerancia aumentada frente a sequedad o frente al contenido de sal de agua o suelo, rendimiento de floración elevado, recolección facilitada, aceleramiento de la maduración, mayores rendimientos de cosecha, mayor calidad y/o mayor valor nutritivo de los productos de cosecha, mayor capacidad de almacenamiento y/o procesabilidad de los productos de cosecha. Son ejemplos adicionales y especialmente destacados de dichas propiedades una defensa elevada de las plantas frente a parásitos animales y microbianos, como frente a insectos, ácaros, hongos fitopatógenos, bacterias y/o virus, así como una tolerancia elevada de las plantas frente a determinados principios activos herbicidas. Como ejemplos de plantas transgénicas, se citan las plantas de cultivo importantes como cereales (trigo, arroz), maíz, soja, patata, remolacha azucarera, tomates, guisantes y otras variedades de hortalizas, algodón, tabaco, colza así como plantas frutales (con los frutos manzana, peras, cítricos y uvas), siendo especialmente destacadas maíz, soja, patata, algodón y colza. Como propiedades (“rasgos”), se destacan especialmente la defensa elevada de las plantas frente a insectos, arácnidos, nematodos y caracoles por toxinas que se generan en las plantas, especialmente aquellas que son producidas en las plantas por el material genético de *Bacillus thuringiensis* (por ejemplo, mediante los genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb y CryIF, así como sus combinaciones) (en adelante, “plantas Bt”). Como propiedades (“rasgos”), se destacan además especialmente la defensa elevada de las plantas frente a hongos, bacterias y virus mediante resistencia adquirida sistémica (SAR), sistemina, fitoalexina, elicitores así como genes resistentes y proteínas y toxinas expresadas correspondientemente. Como propiedades (“rasgos”) son además especialmente destacables la mayor tolerancia de plantas frente a determinados principios activos herbicidas, por ejemplo, imidazolinonas, sulfonilureas, glifosato o fosfotricina (por ejemplo, gen “PAT”). Los genes que confieren las propiedades respectivamente deseadas (“rasgos”) pueden aparecer también en combinaciones entre sí en las plantas transgénicas. Como ejemplos de “plantas Bt”, se citan variedades de maíz, variedades de algodón, variedades de soja y variedades de patata, que se comercializan con las referencias comerciales YIELD GARD® (por ejemplo, maíz, algodón, soja), KnockOut® (por ejemplo maíz), StarLink® (por ejemplo maíz), Bollgard® (algodón), Nucotn® (algodón) y NewLeaf® (patata). Como ejemplos de plantas tolerantes a herbicida, se citan variedades de maíz, variedades de algodón y variedades de soja que se comercializan con las referencias comerciales Roundup Ready® (tolerancia frente a glifosato, por ejemplo, maíz, algodón, soja), Liberty Link® (tolerancia frente a fosfotricina, por ejemplo, colza), IMI® (tolerancia frente a imidazolinonas) y STS® (tolerancia frente a sulfonilureas, por ejemplo, maíz). Como plantas resistentes a herbicida (criadas convencionalmente con tolerancia a herbicida), se citan también las variedades comercializadas con la referencia Clearfield® (por ejemplo, maíz). Por supuesto, estas indicaciones son válidas también para las variedades de plantas desarrolladas en el futuro o presentes en el mercado futuro con estas u otras propiedades genéticas desarrolladas en el futuro (“rasgos”).

Las plantas citadas se pueden tratar de forma especialmente ventajosa de acuerdo con la invención con los compuestos de fórmula general I o bien las mezclas de principios activos de acuerdo con la invención. Los intervalos preferidos dados anteriormente en los principios activos o mezclas son también válidos para el tratamiento de estas plantas. Se destaca especialmente el tratamiento de plantas con los compuestos o mezclas citadas especialmente en el presente texto.

#### Protección de cultivos – tipos de tratamiento

El tratamiento de las plantas y partes de plantas con los compuestos de la fórmula (I) según la invención se lleva a cabo directamente o por acción sobre sus alrededores, hábitat o espacio de almacenamiento por medio de métodos de tratamiento convencionales, por ejemplo, por inmersión, pulverización, atomización, irrigación, evaporación, espolvoreo, nebulización, difusión, formación de espuma, pintura, propagación, inyección, irrigación, irrigación por goteo y, en el caso del material de propagación, en especial en el caso de semillas, también por tratamiento de semillas seco, tratamiento de semillas líquido, un polvo soluble en agua para tratamiento en suspensión, por incrustación, por recubrimiento con una o varias capas, etc. También es posible aplicar los principios activos por el método de volumen ultrabajo o inyectar la preparación de principio activo o el principio activo propiamente dicho en el suelo.

Un tratamiento directo preferido de las plantas es la aplicación foliar, lo que significa que los compuestos de la fórmula (I) según la invención se aplican al follaje, donde el la frecuencia de tratamiento y la tasa de aplicación se puede ajustar de acuerdo con el nivel de infestación con la plaga en cuestión.

En el caso de compuestos sistémicamente activos, los compuestos de la fórmula (I) según la invención también acceden a las plantas por medio del sistema de raíces. Las plantas se tratan luego por acción de los compuestos de la fórmula (I) según la invención sobre el hábitat de la planta. Esto se puede hacer, por ejemplo, por irrigación o por mezcla en el suelo o la solución nutriente, lo que significa que el locus de la planta (por ejemplo, suelo o sistemas hidropónicos) se impregna con una forma líquida de los compuestos de la fórmula (I) según la invención o por aplicación en el suelo, es decir, los compuestos de la fórmula (I) según la invención se introducen en forma sólida (por ejemplo, en forma de gránulos) en el locus de las plantas. En el caso de cultivos de arrozales, esto se puede hacer dosificando la invención en una fórmula de aplicación sólida (por ejemplo, como gránulos) en un campo de arroz inundado.

## 10 Tratamiento de semillas

El control de plagas animales por tratamiento de semillas de plantas se ha conocido durante un tiempo largo y es el objeto de constantes mejoras. Sin embargo, el tratamiento de semillas conlleva una serie de problemas que no siempre se pueden resolver de una manera satisfactoria. Así, es deseable desarrollar métodos para proteger las semillas y la planta germinante que dispensa o al menos reduce considerablemente la aplicación adicional de agentes fitosanitarios durante el almacenamiento, después de la siembra o después de la emergencia de las plantas. Adicionalmente, es deseable optimizar la cantidad de ingrediente usado de modo de proporcionar una óptima protección para las semillas y la planta germinante del ataque por plagas animales, pero sin dañar la planta propiamente dicha por el principio activo empleado. En particular, los métodos para el tratamiento de semillas también tendrán en cuenta las propiedades insecticidas o nematocidas intrínsecas de plantas transgénicas resistentes a plagas o tolerantes a plagas a fin de lograr una protección óptima de las semillas y la planta germinante con un mínimo gasto de agentes fitosanitarios.

Por ello, la presente invención también se refiere más en particular a un método para la protección de semillas y plantas germinantes, del ataque de plagas, por tratamiento de semillas con uno de los compuestos de la fórmula (I) según la invención. El método de acuerdo con la invención para proteger semillas y plantas germinantes contra el ataque de plagas comprende un método en el que la semilla se trata simultáneamente en una operación o secuencialmente con un principio activo de la fórmula (I) y un componente de mezcla. También un método en el que la semilla se trata en diferentes momentos con un principio activo de la fórmula (I) y un componente de mezcla.

La invención asimismo se refiere al uso de los compuestos de la fórmula (I) según la invención para el tratamiento de semillas para proteger las semillas y la planta resultante de plagas animales.

Por otra parte, la invención también se refiere a semillas que fueron tratadas con un compuesto de la fórmula (I) según la invención para la protección de plagas animales. La invención también se refiere a semillas que fueron tratadas simultáneamente con un principio activo y un componente de mezcla. La invención también se refiere a semillas que fueron tratadas en diferentes momentos con un principio activo y un componente de mezcla. En el caso de semillas que fueron tratados en diferentes momentos con un principio activo y un componente de mezcla, los principios activos individuales del agente según la invención pueden estar presentes en la semilla en diferentes capas. En este caso, las capas que comprenden un principio activo y componentes de mezcla se pueden separar opcionalmente por medio de una capa intermediaria. La invención también se refiere a semillas en las que un principio activo y un componente de mezcla fueron aplicados como parte de un recubrimiento o como otra capa u otras capas además de un recubrimiento.

Por otra parte, la invención se refiere a semillas que, después del tratamiento con un compuesto de la fórmula (I) según la invención, se somete a un proceso de recubrimiento con película para evitar la abrasión de polvo sobre la semilla.

Una de las ventajas de la presente invención consiste en que en virtud de las particulares propiedades sistémicas de los agentes según la invención el tratamiento de la semilla con estos agentes protege no solo la semilla propiamente dicha sino también las plantas resultantes de ella, después de la emergencia, de plagas animales. De esta manera, se puede prescindir del tratamiento inmediato del cultivo al momento de la siembra o poco tiempo después.

Otra ventaja es que el tratamiento de las semillas con un compuesto de la fórmula (I) según la invención puede mejorar la germinación y la emergencia de las semillas tratadas.

Asimismo se considera ventajoso que los compuestos de la fórmula (I) según la invención también se puedan usar en especial para semillas transgénicas.

Se ha de mencionar también que los compuestos de la fórmula (I) según la invención se pueden usar en combinación con composiciones de tecnología de señalización, que dan como resultado, por ejemplo, una mejor colonización por simbiontes, por ejemplo, rhizobia, mycorrhiza y/o bacterias u hongos endofíticos, y/o fijación optimizada de nitrógeno.

Los agentes según la invención son apropiados para la protección de semillas de cualquier variedad de plantas que se usa en agricultura, en el invernadero, en forestas o en horticultura. Más en particular, esto incluye semillas de cereales (por ejemplo, trigo, cebada, centeno, mijo y avena), maíz, algodón, porotos de soja, arroz, patatas,

girasoles, café, tabaco, canola, colza oleaginosa, nabos (por ejemplo, remolachas y remolachas forrajeras), maníes, hortalizas (por ejemplo, tomates, pepinos, guisantes, vegetales crucíferos, cebollas y lechuga), plantas frutales, céspedes y plantas ornamentales. Es de particular importancia el tratamiento de las semillas de cereales (tales como trigo, cebada, centeno y avena), maíz, soja, algodón, canola, colza oleaginosa y arroz.

5 Como ya se mencionó con anterioridad, el tratamiento de semillas transgénicas con un compuesto de la fórmula (I) según la invención también es de particular importancia. Esto implica las semillas de plantas que, en general, contienen al menos un gen heterólogo que controla la expresión de un polipéptido que tiene propiedades en particular insecticidas y/o nematocidas en particular. Los genes heterólogos en semillas transgénicas pueden originarse de microorganismos tales como Bacillus, Rhizobium, Pseudomonas, Serratia, Trichoderma, Clavibacter, Glomus o Glyocladium. La presente invención es apropiada en particular para el tratamiento de semillas transgénicas que contienen al menos un gen heterólogo que se origina de Bacillus sp. Es más preferible un gen heterólogo derivado de Bacillus thuringiensis.

15 En el contexto de la presente invención, el compuesto de la fórmula (I) se aplica a las semillas. Con preferencia, la semilla se trata en un estado en el que es suficientemente estable para evitar que el daño se produzca en el curso del tratamiento. En general, la semilla se puede tratar en cualquier momento entre la siembra y la cosecha. Es habitual usar las semillas que se han separado de la planta y liberado de mazorcas, vainas, tallos, capas, pelos o la pulpa de las frutas. Por ejemplo, es posible usar semillas que fueron cosechadas, limpiadas y secadas hasta un contenido de humedad que permite el almacenamiento. Alternativamente, también es posible usar semillas que, después de secar, se han tratado con, por ejemplo, agua y luego se vuelven a secar, por ejemplo, cebado.

20 En general, en el tratamiento de las semillas, se ha de asegurar que la cantidad del agente según la invención y/u otros aditivos aplicados a la semilla se seleccione de modo tal que la germinación de la semilla no se vea alterada y la planta que surge de ella no esté dañada. Esto se debe asegurar en particular en el caso de principios activos que pueden exhibir efectos fitotóxicos en ciertas tasas de aplicación.

25 Los agentes de acuerdo con la invención se pueden aplicar directamente, también sin contener otros componentes y sin haber sido diluidos. Por lo general se prefiere aplicar los agentes en forma de una formulación adecuada sobre la semilla. Formulaciones y procedimientos adecuados para el tratamiento de semilla son conocidos por el especialista en la técnica y se describen, por ejemplo, en los siguientes documentos: US 4,272,417 A, US 4.245.432 A, US 4.808.430 A, US 5.876.739 A, US 2003/0176428 A1, WO 2002/080675 A1, WO 2002/028186 A2.

30 Los compuestos de la fórmula (I) útiles según la invención se pueden convertir en formulaciones de desinfección de semillas habituales, tales como soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, espumas, suspensiones u otras composiciones de recubrimiento para semillas y también formulaciones ULV.

Estas formulaciones se producen de una manera conocida, mezclando los compuestos de la fórmula (I) con aditivos habituales, por ejemplo, extensores convencionales y disolventes o diluyentes, tinturas, humectantes, dispersantes, emulsionantes, antiespumantes, conservantes, espesantes secundarios, adhesivos, gibberellinas y también agua.

35 Las tinturas que pueden estar presentes en las formulaciones de desinfección de semillas útiles de acuerdo con la invención son todas tinturas que son habituales para tales fines. Es posible usar ya sea pigmentos, que son poco solubles en agua o tinturas, que son solubles en agua. Los ejemplos incluyen las tinturas conocidas por los nombres Rhodamine B, C.I. Pigment Red 112 y C.I. Solvent Red 1.

40 Los humectantes útiles que pueden estar presentes en las formulaciones de desinfección de semillas útiles de acuerdo con la invención son todas sustancias que promueven la humectación y que se usan convencionalmente para la formulación de principios agroquímicamente activos. Se da preferencia al uso de naftalensulfonatos de alquilo, tales como naftalensulfonatos de diisopropilo o diisobutilo.

45 Los dispersantes y/o emulsionantes útiles que pueden estar presentes en las formulaciones de desinfección de semillas útiles de acuerdo con la invención son todos dispersantes no iónicos, aniónicos y catiónicos usados convencionalmente para la formulación de principios agroquímicamente activos. Se da preferencia al uso de dispersantes no iónicos o aniónicos o mezclas de dispersantes no iónicos o aniónicos. Los dispersantes no iónicos apropiados incluyen en particular polímeros de bloque de óxido de etileno / óxido de propileno, alquilfenolpoliglicoléteres y triestirilfenolpoliglicoléteres y sus derivados fosfatados o sulfatados. Los dispersantes aniónicos apropiados son en especial lignosulfonatos, sales de ácido poliacrílico y condensados de sulfonato de arilo / formaldehído.

50 Los antiespumantes que pueden estar presentes en las formulaciones de desinfección de semillas útiles de acuerdo con la invención son todas sustancias inhibidoras de espuma usadas convencionalmente para la formulación de principios agroquímicamente activos. Los antiespumantes siliconados y estearato de magnesio se pueden usar con preferencia.

55 Los conservantes que pueden estar presentes en las formulaciones de desinfección de semillas útiles de acuerdo con la invención son todas sustancias útiles para tales fines en composiciones agroquímicas. Los ejemplos incluyen diclorofeno y alcohol bencílico hemiformal.

Los espesantes secundarios que pueden estar presentes en las formulaciones de desinfección de semillas útiles de acuerdo con la invención son todas las sustancias que se pueden usar para tales fines en composiciones agroquímicas. Los ejemplos preferidos incluyen derivados celulósicos, derivados de ácido acrílico, xantano, arcillas modificadas y sílice finamente dividida.

- 5 Los adhesivos útiles que pueden estar presentes en las formulaciones de desinfección de semillas útiles de acuerdo con la invención son todos los aglutinantes habituales útiles en productos de desinfección de semillas. Los ejemplos preferidos incluyen polivinilpirrolidona, acetato de polivinilo, alcohol polivinílico y tilosa.

- 10 Las gibberellinas que pueden estar presentes en las formulaciones de desinfección de semillas útiles de acuerdo con la invención son preferentemente las gibberellinas A1, A3 (= ácido gibberélico), A4 y A7; se da particular preferencia al uso de ácido gibberélico. Las gibberellinas son conocidas (comp. R. Wegler "Chemie der Pflanzenschutz- und Schädlingsbekämpfungsmittel" [Química de la Composiciones de Protección de Cultivos y Pesticidas], vol. 2, Springer Verlag, 1970, p. 401-412).

- 15 Las formulaciones de desinfección de semillas útiles de acuerdo con la invención se pueden usar para tratar una amplia variedad de diferentes tipos de semillas ya sea directamente o después de dilución previa con agua. Por ejemplo, los concentrados o las preparaciones obtenidas de ellos por dilución con agua se pueden usar para desinfectar las semillas de cereales, tales como trigo, cebada, centeno, avena y triticale y también las semillas de maíz, arroz, colza oleaginosa, guisantes, frijoles, algodón, girasoles, porotos de soja y nabos o incluso una amplia variedad de diferentes semillas vegetales. Las formulaciones de desinfección de semillas útiles de acuerdo con la invención o sus preparaciones diluidas también se pueden usar para desinfectar semillas de plantas transgénicas. A este respecto se pueden producir también efectos sinérgicos adicionales en combinación con las sustancias formadas mediante expresión.

- 20 Para el tratamiento de semillas con las formulaciones de desinfección de semillas útiles de acuerdo con la invención o las preparaciones preparadas por adición de agua son de utilidad todas las unidades de mezcla útiles habitualmente para la desinfección de semillas. Específicamente, el procedimiento en la desinfección de las semillas consiste en colocar las semillas en un mezclador, en operación por lotes o de forma continua, para añadir la cantidad deseada particular de las formulaciones de desinfección de semillas, ya sea como tal o después de dilución previa con agua y mezclar hasta que la formulación se distribuya de forma homogénea en la semilla. De ser apropiado, está seguido por una operación de secado.

- 25 La tasa de aplicación de las formulaciones de desinfección de semillas útiles de acuerdo con la invención se puede variar dentro de un rango relativamente amplio. Está guiada por el contenido particular de los compuestos de la fórmula (I) según la invención en las formulaciones y las semillas. Las tasas de aplicación del compuesto de la fórmula (I) están en general entre 0,001 y 50 g por kilogramo de semilla, preferentemente, entre 0,01 y 15 g por kilogramo de semilla.

### Salud animal

- 35 (El tratamiento quirúrgico, terapéutico y diagnóstico del cuerpo humano o animal no son parte del objeto de acuerdo con la invención). Más allá de ello, se pueden usar los principios activos / combinaciones de principios activos según la invención para combatir un sinnúmero de parásitos, incluyendo, por ejemplo, insectos chupadores dañinos, insectos mordedores y otros parásitos de plantas, parásitos de las existencias, parásitos que destruyen los materiales industriales y parásitos de la higiene incluyendo parásitos en el campo de la salud animal y para su combate como, por ejemplo, su desaparición y erradicación. La presente divulgación incluye así también un procedimiento para combatir parásitos.

- 40 En el campo de la salud animal, es decir, el campo de la medicina veterinaria, los principios activos según la invención son activos contra parásitos animales, en especial ectoparásitos o endoparásitos. El término endoparásitos comprende en especial helmintos y protozoos tales como coccidios. Los ectoparásitos son normalmente y con preferencia artrópodos, en especial insectos y ácaros.

En el campo de la medicina veterinaria, los compuestos según la invención son apropiados, que tienen favorable toxicidad en homeotermos, para controlar parásitos que aparecen en la cría de animales y la ganadería, animales de cría, animales de zoológico, animales de laboratorio, animales experimentales y animales domésticos. Son activos contra todas las etapas o las etapas específicas de desarrollo de parásitos.

- 50 El ganado agrícola incluye, por ejemplo, mamíferos, tales como ovejas, cabras, caballos, burros, camellos, búfalos, conejos, renos, ciervos y en particular vacas y cerdos; o aves tales como pavos, patos, gansos y en particular gallinas; o peces o crustáceos, por ejemplo, en acuacultivo; o eventualmente insectos tales como abejas.

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

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

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

5 El uso de los principios activos según la invención para controlar animal parásitos se pretende reducir o evitar enfermedades, casos de muerte y reducciones de rendimientos (en el caso de carne, leche, lana, cueros, huevos, miel, y similares), de modo que permiten de forma más económica y más simple el cuidado de animales y se puede lograr un mejor bienestar de los animales.

10 En relación con el sector de la salud animal, el término “control” o “controla” significa que los principios activos son efectivos para reducir la incidencia del parásito particular en un animal infectado con tales parásitos en un grado inocuo. Más específicamente, “control”, en el presente contexto, significa que el principio activo puede matar el respectivo parásito, inhibir su crecimiento o inhibir su proliferación.

Entre los ejemplos de artrópodos, se cuentan, sin limitación:

15 del orden Anoplurida, por ejemplo, *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phtirus* spp., *Solenopotes* spp.; del orden Mallophagida y de los subórdenes Amblycerina e 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 de los subórdenes Nematocerina y Brachycerina, por ejemplo, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Simulium* spp., *Eusimulium* spp., *Phlebotomus* spp., *Lutzomyia* spp., *Culicoides* spp., *Chrysops* spp., *Odagmia* spp., *Wilhelmia* spp., *Hybomitra* spp., *Atylotus* spp., *Tabanus* spp., *Haematopota* spp., *Philipomyia* spp., *Braula* spp., *Musca* spp., *Hydrotaea* spp., *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.; del orden Heteroptera,

por ejemplo, *Cimex* spp., *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongylus* spp.; así como parásitos y parásitos de higiene del orden Blattaria.

25 Además, se han de mencionar entre los artrópodos los siguientes ácaros, pero sin limitación: De la subclase ácaros (Acarina) y del orden Metastigmata, por ejemplo, de la familia Argasidae, como *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Otobius* spp., de la familia Ixodidae, como *Ixodes* spp., *Amblyomma* spp., *Rhipicephalus* (*Boophilus*) spp. *Dermacentor* spp., *Haemophysalis* spp., *Hyalomma* spp., *Rhipicephalus* spp. (el género original de las garrapatas polivalentes); del orden Mesostigmata como *Dermanyssus* spp., *Ornithonyssus* spp., *Pneumonyssus* spp., *Raillietia* spp., *Pneumonyssus* spp., *Sternostoma* spp., *Varroa* spp., *Acarapis* spp.; del orden Actinotritida (Prostigmata), por ejemplo, *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp., *Ornithocheyletia* spp., *Myobia* spp., *Psorergates* spp., *Demodex* spp., *Trombicula* spp., *Neotrombicula* spp., *Listrophorus* spp.; und 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.

35 Entre los ejemplos de protozoos parasitarios, se cuentan, pero sin limitación: Mastigophora (Flagellata), tales como, por ejemplo, Trypanosomatidae, por ejemplo, *Trypanosoma* b. *brucei*, T.b. *gambiense*, T.b. *rhodesiense*, T. *congolense*, T. *cruzi*, T. *evansi*, T. *equinum*, T. *lewisi*, T. *percae*, T. *simiae*, T. *vivax*, *Leishmania* *brasiliensis*, L. *donovani*, L. *tropica*, como por ejemplo, Trichomonadidae, por ejemplo, *Giardia* *lamblia*, *G. canis*;

40 Sarcomastigophora (Rhizopoda), tales como Entamoebidae, por ejemplo, *Entamoeba* *histolytica*, Hartmannellidae, por ejemplo, *Acanthamoeba* sp., *Harmanella* sp.;

45 Apicomplexa (Sporozoa), como Eimeridae, por ejemplo, *Eimeria* *acervulina*, E. *adenoides*, E. *alabamensis*, E. *anatis*, E. *anserina*, E. *arloingi*, E. *ashata*, E. *auburnensis*, E. *bovis*, E. *brunetti*, E. *canis*, E. *chinchillae*, E. *clupearum*, E. *columbae*, E. *contorta*, E. *crandalis*, E. *debliecki*, E. *dispersa*, E. *ellipsoidales*, E. *falciformis*, E. *faurei*, E. *flavescens*, E. *gallopavonis*, E. *hagani*, E. *intestinalis*, E. *iroquoiana*, E. *irresidua*, E. *labbeana*, E. *leucarti*, E. *magna*, E. *maxima*, E. *media*, E. *meleagridis*, E. *meleagritidis*, E. *mitis*, E. *necatrix*, E. *ninakhlyakimovae*, 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*,

50 *Globidium* *spec.*, *Isospora* *belli*, I. *canis*, I. *felis*, I. *ohioensis*, I. *rivolta*, I. *spec.*, I. *suis*, *Cystispora* *spec.*, *Cryptosporidium* *spec.*, en especial C. *parvum*; como Toxoplasmodidae, por ejemplo, *Toxoplasma* *gondii*, *Hammondia* *heydornii*, *Neospora* *caninum*, *Besnoitia* *besnoitii*; como Sarcocystidae, por ejemplo, *Sarcocystis* *bovicanis*, S. *bovohominis*, S. *ovicanis*, S. *ovifelis*, S. *neurona*, S. *spec.*, S. *suihominis*, como Leucozooidae, por ejemplo, *Leucozytozoon* *simondi*, como Plasmodiidae, por ejemplo, *Plasmodium* *berghei*, P. *falci-parum*, P. *malariae*, P. *ovale*, P. *vivax*, P. *spec.*, como Piroplasmae, por ejemplo, *Babesia* *argentina*, B. *bovis*, B. *canis*, B. *spec.*, *Theileria* *parva*, *Theileria* *spec.*, como Adeleina, por ejemplo, *Hepatozoon* *canis*, H. *spec.*.

Entre los ejemplos de endoparásitos patogénicos en los que se trata de helmintos, se cuentan gusanos planos (por ejemplo, Monogenea, Cestodes y Trematodes), gusanos redondos, Acanthocephala y Pentastoma. Entre los

helminchos se cuentan, pero sin limitación:

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

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

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

- 10 Trematodes: de la clase Digenea por ejemplo: Diplostomum spp., Posthodiplostomum spp., Schistosoma spp., Trichobilharzia spp., Ornithobilharzia spp., Austroilharzia spp., Gigantobilharzia spp., Leucocloroidium spp., Brachylaima spp., Echinostoma spp., Echinoparyphium spp., Echinochasmus spp., Hypoderaeum spp., Fasciola spp., Fasciolides spp., Fasciolopsis spp., Cyclocoelum spp., Typhlocoelum spp., Paramphistomum spp., Calicophoron spp., Cotylophoron spp., Gigantocotyle spp., Fiscoederius spp., Gastrothylacus spp., Notocotylus spp., Catatropis spp., Plagiorchis spp., Prosthogonimus spp., Dicrocoelium spp., Eurytrema spp., Troglotrema spp., Paragonimus spp., Collyriclum spp., Nanophyetus spp., Opisthorchis spp., Clonorchis spp. Metorchis spp., Heterophyes spp., Metagonimus spp.;

gusanos redondos: Trichinellida por ejemplo: Trichuris spp., Capillaria spp., Trichomosoides spp., Trichinella spp.;

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

- 20 del orden Rhabditina por ejemplo: Strongylus spp., Triodontophorus spp., Oesophagodontus spp., Trichonema spp., Gyalocephalus spp., Cylindropharynx spp., Poterostomum spp., Cyclococercus spp., Cylicostephanus spp., Oesophagostomum spp., Chabertia spp., Stephanurus spp., Ancylostoma spp., Uncinaria spp., Bunostomum spp., Globocephalus spp., Syngamus spp., Cyathostoma spp., Metastrongylus spp., Dictyocaulus spp., Muellerius spp., Protostrongylus spp., Neostongylus spp., Cystocaulus spp., Pneumostongylus spp., Spicocaulus spp., Elaphostongylus spp. Parelaphostongylus spp., Crenosoma spp., Paracrenosoma spp., Angiostrongylus spp., Aelurostrongylus spp., Filaroides spp., Parafilaroides spp., Trichostrongylus spp., Haemonchus spp., Ostertagia spp., Marshallagia spp., Cooperia spp., Nematodirus spp., Hyostrongylus spp., Obeliscoides spp., Amidostomum spp., Ollulanus spp.;

- 30 del orden Spirurida por ejemplo: Oxyuris spp., Enterobius spp., Passalurus spp., Syphacia spp., Aspicularis 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.,

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

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

Pentastoma: del orden Porocephalida por ejemplo, Linguatula spp.

En el campo de la medicina veterinaria y la ganadería, la administración de los principios activos según la invención se produce según procedimientos conocidos en general por los expertos, como enteral, parenteral, dérmico o nasal en forma de preparados apropiados. La administración se puede realizar de modo preventivo o terapéutico.

- 40 Así, una realización de la presente invención se refiere al uso de compuestos según la invención para usar como medicamentos.

- 45 Otro aspecto se refiere a compuestos según la invención para el uso como agente antiendoparasítico, en especial un helminticida o un agente contra protozoos. Por ejemplo, los compuestos según la invención son apropiados para usar como agente antiendoparasítico, en especial un helminticida o agente contra protozoos, por ejemplo, en la cría de animales, en la ganadería, en establos y en el sector de higiene.

Otro aspecto, a su vez, se refiere a compuestos según la invención para el uso como agente antiendoparasítico, en especial un artropodicida como un insecticida o un acaricida. Por ejemplo, los compuestos según la invención son apropiados para usar como agente antiendoparasítico, en especial un artropodicida como un insecticida o acaricida, por ejemplo, en la cría de animales, en establos, en el sector de higiene.

## 50 Control de vectores

Los compuestos de la fórmula (I) según la invención también se pueden usar en el control de vectores. En el contexto de la presente invención, un vector es un artrópodo, en especial un insecto o arácnido, capaz de transmitir patógenos, por ejemplo, virus, gusanos, organismos monocelulares y bacterias de un reservorio (planta, animal,

humano, etc.) a un huésped. Los patógenos se pueden transmitir ya sea mecánicamente (por ejemplo, tracoma por moscas no picadoras) a un huésped o después de inyección (por ejemplo, parásitos de paludismo por mosquitos) en un huésped.

Los ejemplos de vectores y las enfermedades o patógenos que transmiten son:

- 5        1) Mosquitos
- Anopheles: paludismo, filariasis;
  - Culex: encefalitis japonesa, filariasis, otras enfermedades virales, transmisión de gusanos;
  - Aedes: fiebre amarilla, fiebre del dengue, filariasis, otras enfermedades virales;
  - Simuliidae: transmisión de gusanos, en particular *Onchocerca volvulus*;
- 10       2) Piojos: infecciones cutáneas, tifus epidémico;
- 3) Pulgas: plaga, tifus endémico;
- 4) Moscas: tripanosomiasis; cólera, otras enfermedades bacterianas;
- 5) Ácaros: acariosis, tifus epidémico, rickettsialpox, tularaemia, encefalitis de Saint Louis, encefalitis transmitida por garrapatas (TBE), fiebre hemorrágica de Crimea–Congo, fiebre tifoidea, borreliosis;
- 15       6) Garrapatas: boreliosis tales como *Borrelia duttoni*, encefalitis transmitida por garrapatas, fiebre Q (*Coxiella burnetii*), babesiosis (*Babesia canis canis*).

Los ejemplos de vectores en el contexto de la presente invención son insectos, por ejemplo, áfidos, moscas, saltamontes o trips, que pueden transmitir virus de plantas a plantas. Otros vectores capaces de transmitir virus de plantas son ácaros de la araña, piojos, escarabajos y nematodos.

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

También es posible el control de vectores si los compuestos de la fórmula (I) rompen la resistencia.

- 25       Los compuestos de la presente invención son apropiados para usar en la prevención de enfermedades y/o patógenas transmitidas por vectores. Así, otro aspecto de la presente invención es el uso de compuestos según la invención para el control de vectores, por ejemplo, en agricultura, en horticultura, en forestas, en jardines y en instalaciones de ocio y también en la protección de materiales y productos almacenados.

#### **Protección de materiales técnicos**

- 30       Los compuestos de la fórmula (I) según la invención son apropiados para proteger materiales industriales contra el ataque o la destrucción por insectos, por ejemplo, de los órdenes Coleoptera, Hymenoptera, Isoptera, Lepidoptera, Psocoptera y Zygentoma.

- 35       Por materiales técnicos se entiende en el presente contexto materiales no vivos como, por ejemplo, plásticos, adhesivos, colas, papeles y cartones, cuero, madera, productos del procesamiento de la madera y agentes de recubrimiento. Se prefiere especialmente el uso de la invención para la protección de madera.

En una forma de realización de acuerdo con la invención las composiciones o agentes de acuerdo con la invención contienen también al menos un insecticida adicional y/o al menos un fungicida.

- 40       En otra realización, esta composición según la invención es una composición lista para usar según la invención, es decir, que se pueden aplicar al material en cuestión sin ulteriores modificaciones. Otros insecticidas o fungicidas apropiados son aquellos mencionados con anterioridad.

- 45       Sorprendentemente, también se halló que los principios activos y composiciones según la invención se pueden emplear para proteger objetos que entran en contacto con agua salina o salobre, en especial cascos, pantallas, redes, edificios, amarres y sistemas de señalización, contra ensuciamiento. Igualmente es posible usar los principios activos y composiciones según la invención, solos o en combinación con otros principios activos como agentes antisuciedad.

#### **Control de plagas animales en el sector de higiene**

Los compuestos de la fórmula (I) según la invención son apropiados para controlar plagas animales en el sector de

5 higiene. Más en particular, la invención se puede usar en el sector doméstico, en el sector de higiene y en la protección de productos almacenados, en particular para controlar insectos, arácnidos y ácaros hallados en espacios cerrados, por ejemplo, viviendas, naves industriales, oficinas, cabinas ed vehículos. Para controlar plagas animales, los principios activos o composiciones se usan solos o en combinación con otros principios activos y/o auxiliares. Se usan preferentemente en productos insecticidas domésticos. Los principios activos según la invención son efectivos contra especies sensibles y resistentes contra cualquier estadio de desarrollo.

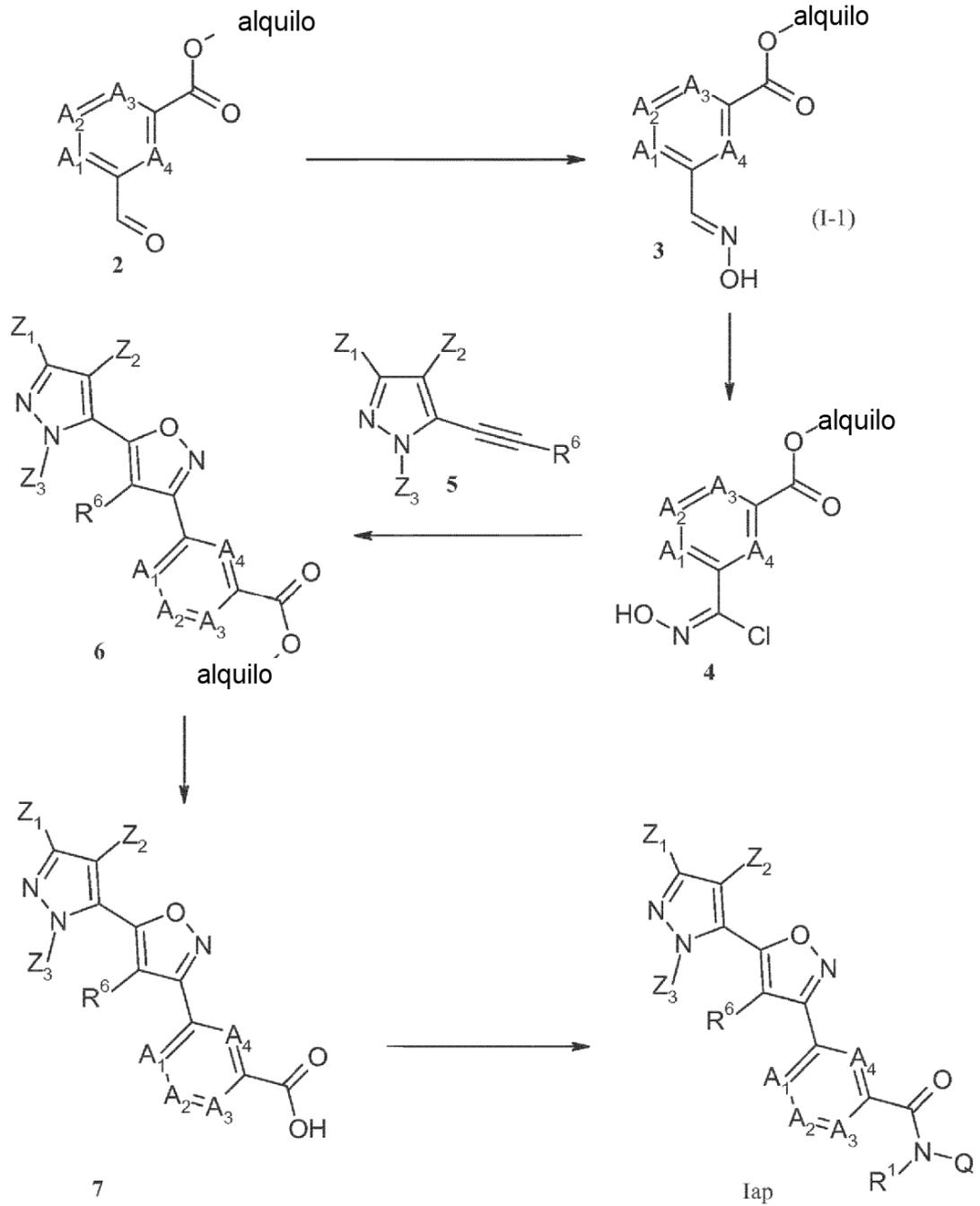
10 Estas plagas incluyen, por ejemplo, plagas de la clase Arachnida, de los órdenes Scorpiones, Araneae y Opiliones, de las clases Chilopoda y Diplopoda, de la clase Insecta, el orden Blattodea, de los órdenes Coleoptera, Dermaptera, Diptera, Heteroptera, Hymenoptera, Isoptera, Lepidoptera, Phthiraptera, Psocoptera, Saltatoria u Orthoptera, Siphonaptera y Zygentoma y de la clase Malacostraca, el orden Isopoda.

15 La aplicación se efectúa, por ejemplo, en aerosoles, productos de pulverización no presurizados, por ejemplo, sprays de bomba y atomización, sistemas automáticos de nebulización, nebulizadores, espumas, geles, productos de evaporación con comprimidos evaporadores hechos de celulosa o plástico, evaporadores líquidos, evaporadores de gel y membrana, evaporadores accionados por hélice, sistemas de evaporación sin energía o pasivos, papeles de polillas, bolsas de polillas y geles de polillas, como gránulos o polvos, en cebos para dispersión o estaciones de cebo.

Los compuestos según la invención se pueden preparar según los métodos usuales conocidos por el especialista.

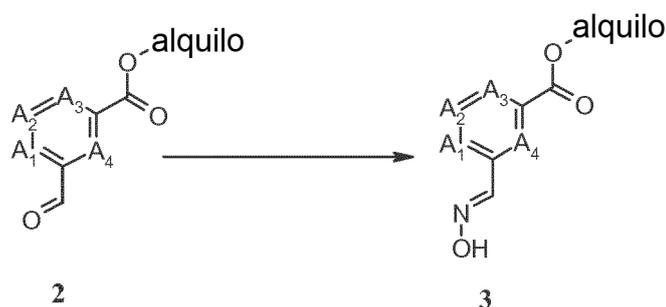
En el Esquema de reacción 1 se muestra el procedimiento de obtención general A para los compuestos según la invención (**Iap**).

20 Esquema de reacción 1



Los radicales  $A_1-A_4$ ,  $Q$ ,  $R^6$ ,  $R^1$  y  $Z^1-Z^3$  tienen los significados mencionados con anterioridad.

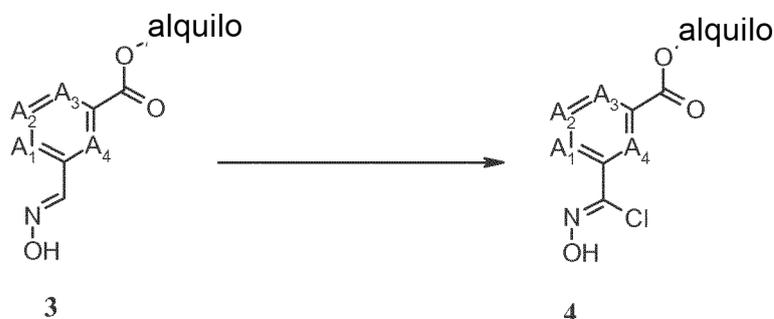
La etapa 1 del procedimiento de obtención de los compuestos según la invención (Iap):



Los compuestos según la invención de la estructura general **3** se pueden preparar análogamente a los métodos conocidos de la literatura a partir de los materiales de partida de la estructura **2**. Los radicales A1-A4 y alquilo tienen los significados mencionados con anterioridad. Los compuestos de partida de la estructura **2** se conocen o se pueden preparar de acuerdo con métodos conocidos. Como ejemplos se han de mencionar 3-carbometoxi-benzaldehído, 3-carbometoxi-4-cloro-benzaldehído, 3-carbometoxi-4-bromo-benzaldehído, 3-carbometoxi-4-fluoro-benzaldehído, 3-carbometoxi-4-cloro-5-fluoro-benzaldehído o bien los correspondientes ésteres etílicos. Se pueden preparar, por ejemplo, de acuerdo con los métodos descritos en los documentos WO2010011584, páginas 19-20; Journal of Organic Chemistry, 76 (2011) 1062 – 1071; WO2012114268, página 137; Journal of the American Chemical Society, 108 (1986) página 452-461.

Los compuestos de la fórmula estructural **3** son parcialmente conocidos, por ejemplo, 3-carbometoxi-benzaldoxima, WO2004072050, página 14, pero en parte aún desconocidos, por ejemplo, 3-carbometoxi-4-cloro-benzaldoxima, 3-carbometoxi-4-fluoro-benzaldoxima, 3-carbometoxi-4-cloro-5-fluoro-benzaldoxima, 3-carbometoxi-4-bromo-benzaldoxima. La preparación de los compuestos aún desconocidos **3** se puede realizar por analogía a los procedimientos conocidos para la preparación de oximas a partir de aldehídos (H. Metzger en Houben-Weyl, volumen X/4, página 55 ff, Georg Thieme Verlag Stuttgart 1968). Los compuestos de la fórmula estructural **3** pueden existir como estereoisómeros puros, pero también como mezclas de los isómeros configuracionales.

Segunda etapa del procedimiento de obtención de los compuestos según la invención (Iap):



Los compuestos según la invención de la estructura general **4** se preparan haciendo reaccionar las oximas de la estructura (X2) con agentes haloantes.

Los radicales A1-A4, alquilo y Z1-Z3 tienen los significados mencionados con anterioridad.

Los compuestos de la estructura **4** típicos son, por ejemplo, cloruro de carbometoxi-4-cloro-N-hidroxibencimidoílo, cloruro de 3-carbometoxi-4-fluoro-N-hidroxibencimidoílo, cloruro de 3-carbometoxi-4-cloro-5-fluoro-N-hidroxibencimidoílo, cloruro de 3-carbometoxi-4-bromo-N-hidroxibencimidoílo.

Los compuestos haloantes apropiados son conocidos por el especialista como, por ejemplo, cloro, bromo, yodo, N-clorosuccinimida, N-bromosuccinimida, N-yodosuccinimida, 1,3-dicloro-5-5-dimetilhidantoína, 1,3-dibromo-5-5-dimetilhidantoína, tetracloroyodato de benciltrimetilamonio e hipoclorito de sodio. Con preferencia, se usan reactivos clorantes.

Para realizar la reacción, se pueden usar disolventes apropiados.

Como diluyentes o bien disolventes para realizar los procedimientos según la invención se tienen en cuenta básicamente todos los disolventes orgánicos inertes en las condiciones específicas de la reacción. Como ejemplos se han de mencionar: hidrocarburos haloados (por ejemplo, clorohidrocarburos tales como tetraetileno, tetracloroetano, dicloropropano, cloruro de metileno, diclorobutano, cloroformo, tetracloruro de carbono,

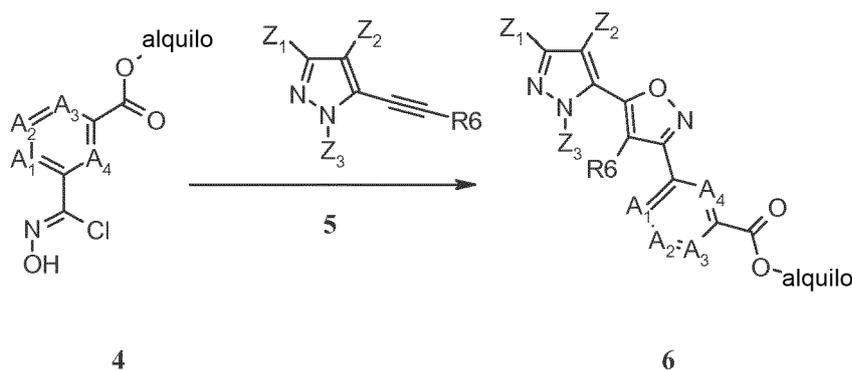
tricloroetano, tricloroetileno, pentacloroetano, difluorobenceno, 1,2-dicloroetano, clorobenceno, bromobenceno, diclorobenceno, clorotolueno, triclorobenceno), alcoholes (por ejemplo, metanol, etanol, isopropanol, butanol), éteres (por ejemplo, éter etilpropílico, éter metil-ter-butílico, éter n-butílico, anisol, fenetol, éter ciclohexilmetílico, éter dimetílico, éter dietílico, éter dipropílico, éter diisopropílico, éter di-n-butílico, éter diisobutílico, éter diisoamílico, 5 etilenglicoldimetiléter, tetrahidrofurano, dioxano, éter diclorodietílico y poliéter de óxido de etileno y/u óxido de propileno), aminas (por ejemplo, trimetil-, trietil-, tripropil-, tributilamina, N-metil morfolina, piridina y tetrametilendiamina), nitrohidrocarburos (por ejemplo, nitrometano, nitroetano, nitropropano, nitrobenceno, cloronitrobenceno, o-nitrotolueno; nitrilos tales como acetonitrilo, propionitrilo, butironitrilo, isobutironitrilo, benzonitrilo, m-clorobenzonitrilo), tetrahidrotiofendioxido, dimetilsulfóxido, tetrametilsulfóxido, dipropilsulfóxido, 10 bencilmetilsulfóxido, diisobutilsulfóxido, dibutilsulfóxido, diisoamilsulfóxido, sulfonas (por ejemplo, dimetil-, dietil-, dipropil-, dibutil-, difenil-, dihexil-, metiletil-, etilpropil-, etilisobutil- y pentametilsulfona), hidrocarburos alifáticos, cicloalifáticos o aromáticos (por ejemplo, pentano, hexano, heptano, octano, nonano e hidrocarburos técnicos), también llamados "White Spirits" con componentes con puntos de ebullición en el rango de por ejemplo 40 °C a 250 °C, cimeno, fracciones de nafta dentro de un intervalo de ebullición de 70 °C a 190 °C, ciclohexano, 15 metilciclohexano, éter de petróleo, ligroína, octano, benceno, tolueno, clorobenceno, bromobenceno, nitrobenceno, xileno, ésteres (por ejemplo, acetato de metilo, etilo, butilo, isobutilo, carbonato de dimetilo, dibutilo, etileno); amidas (por ejemplo, triamida de ácido hexametenfosfórico, formamida, N-metil-formamida, N,N-dimetil-formamida, N,N-dipropil-formamida, N,N-dibutil-formamida, N-metil-pirrolidina, N-metil-caprolactama, 1,3-dimetil-3,4,5,6- tetrahidro-2(IH)-pirimidina, octilpirrolidona, octilcaprolactama, 1,3-dimetil-2-imidazolindiona, N-formil-piperidina, N,N'-1,4-diformil-piperazina) y cetonas (por ejemplo, acetona, acetofenona, metiletilcetona, metilbutilcetona).

Como diluyentes preferidos se puede usar cualquier disolvente, que no perjudique la reacción como, por ejemplo, agua, hidrocarburos aromáticos que se tienen en cuenta tales como benceno, tolueno, xileno o clorobenceno; hidrocarburos haloados tales como diclorometano, cloroformo, 1,2-dicloroetano o tetracloruro de carbono, éteres de 25 cadena abierta o cíclicos tales como éter dietílico, dioxano, tetrahidrofurano o 1,2-dimetoxietano; ésteres tales como acetato de etilo y acetato de butilo; cetonas tales como, por ejemplo, acetona, metil-isobutilcetona y ciclohexanona; amidas tales como dimetilformamida y dimetilacetamida, N-metil-pirrolidinona; nitrilos tales como acetonitrilo o propionitrilo; y otros disolventes inertes tales como 1,3-dimetil-2- imidazolindiona; los disolventes se pueden usar solos o en combinación de dos o más de ellos.

La reacción se puede realizar en un rango de temperatura amplio. Usualmente se puede llevar a cabo en un rango de temperatura de -78 a 200 °C, con preferencia, a temperaturas de entre -10 y 150 °C. La reacción se puede llevar a cabo a presión elevada como también a presión reducida. Pero preferentemente se lleva a cabo a presión normal. Los tiempos de reacción están entre 0,1 a 72 horas, con preferencia 1 a 24 horas.

Para la realización de la reacción, se hacen reaccionar 1 a 3 moles, con preferencia, 1 a 1,5 moles de agente haloante por mol del compuesto de la estructura 3 en un disolvente como, por ejemplo, dimetilformamida (DMF).

35 Tercera etapa del procedimiento de obtención de los compuestos según la invención (Iap):



Los compuestos según la invención de la estructura general 6 se preparan haciendo reaccionar los cloruros de ácido hidroxámico de la estructura 4 con acetilenos de la estructura 5.

Los radicales A1-A4, R6, alquilo y Z1-Z3 tienen los significados mencionados con anterioridad.

40 Los compuestos de la estructura 4 típicos son, por ejemplo, cloruro de carbometoxi-4-cloro-N-hidroxi-bencimidazoilo, cloruro de 3-carbometoxi-4-fluoro-N-hidroxi-bencimidazoilo, cloruro de 3-carbometoxi-4-cloro-5-fluoro-N-hidroxi-bencimidazoilo, cloruro de 3-carbometoxi-4-bromo-N-hidroxi-bencimidazoilo.

Para la realización de la reacción, se pueden usar disolventes apropiados.

Como diluyentes o bien disolventes para la realización de los procedimientos según la invención, se tienen en

cuenta básicamente todos los disolventes orgánicos inertes en las condiciones de reacción específicas. Como ejemplos se han de mencionar: hidrocarburos haloados (por ejemplo, clorohidrocarburos, tales como tetraetileno, tetracloroetano, dicloropropano, cloruro de metileno, diclorobutano, cloroformo, tetracloruro de carbono, tricloroetano, tricloroetileno, pentacloroetano, difluorobenceno, 1,2-dicloroetano, clorobenceno, bromobenceno, diclorobenceno, clorotolueno, triclorobenceno), alcoholes (por ejemplo, metanol, etanol, isopropanol, butanol), éteres (por ejemplo, éter etilpropílico, éter metil-ter-butílico, éter n-butílico, anisol, fenetol, éter ciclohexilmetílico, éter dimetilico, éter dietílico, éter dipropílico, éter diisopropílico, éter di-n-butílico, éter diisobutílico, éter diisoamílico, etilenglicoldimetiléter, tetrahidrofurano, dioxano, éter diclorodietílico y poliéter de óxido de etileno y/u óxido de propileno), aminas (por ejemplo, trimetil-, trietil-, tripropil-, tributilamina, N-metilmofolina, piridina y tetrametilendiamina), nitrohidrocarburos (por ejemplo, nitrometano, nitroetano, nitropropano, nitrobenzoceno, cloronitrobenzoceno, o-nitrotolueno; nitrilos tales como acetonitrilo, propionitrilo, butironitrilo, isobutironitrilo, benzonitrilo, m-clorobenzonitrilo), tetrahidrotiofendióxido, dimetilsulfóxido, tetrametilsulfóxido, dipropilsulfóxido, bencilmetilsulfóxido, diisobutilsulfóxido, dibutilsulfóxido, diisoamilsulfóxido, sulfonas (por ejemplo, dimetil-, dietil-, dipropil-, dibutil-, difenil-, dihexil-, metiletil-, etilpropil-, etilisobutil- y pentametilsulfona), hidrocarburos alifáticos, cicloalifáticos o aromáticos (por ejemplo, pentano, hexano, heptano, octano, nonano e hidrocarburos técnicos), también llamados "White Spirits" con componentes con puntos de ebullición en el rango de por ejemplo 40 °C a 250 °C, cimeno, fracciones de nafta dentro de un intervalo de ebullición de 70 °C a 190 °C, ciclohexano, metilciclohexano, éter de petróleo, ligroína, octano, benceno, tolueno, clorobenceno, bromobenceno, nitrobenzoceno, xileno, ésteres (por ejemplo, acetato de metilo, etilo, butilo, isobutilo, carbonato de dimetilo, dibutilo, etileno); amidas (por ejemplo, triamida de ácido hexametilfosfórico, formamida, N-metil-formamida, N,N-dimetil-formamida, N,N-dipropil-formamida, N,N-dibutil-formamida, N-metil-pirrolidina, N-metil-caprolactama, 1,3-dimetil-3,4,5,6-tetrahidro-2(IH)-pirimidina, octilpirrolidona, octilcaprolactama, 1,3-dimetil-2-imidazolindiona, N-formil-piperidina, N,N'-1,4-diformil-piperazina) y cetonas (por ejemplo, acetona, acetofenona, metiletilcetona, metilbutilcetona).

#### Disolventes preferidos

Como diluyentes preferidos se puede usar cualquier disolvente que no perjudique la reacción, tales como, por ejemplo, agua, los hidrocarburos aromáticos que se tienen en cuenta tales como benceno, tolueno, xileno o clorobenceno; hidrocarburos haloados tales como diclorometano, cloroformo, 1,2-dicloroetano o tetracloruro de carbono, éteres de cadena abierta o cíclicos tales como éter dietílico, dioxano, tetrahidrofurano o 1,2-dimetoxietano; ésteres tales como acetato de etilo y acetato de butilo; cetonas tales como, por ejemplo, acetona, metil-isobutilcetona y ciclohexanona; amidas tales como dimetilformamida y dimetilacetamida, N-metil-pirrolidona; nitrilos tales como acetonitrilo o propionitrilo; y otros disolventes inertes tales como 1,3-dimetil-2-imidazolidinona; los disolventes se pueden usar solos o en combinación de dos o más de ellos.

En las reacciones de los compuestos de la estructura **4** con los acetilenos de la estructura **5** se pueden añadir bases. Como ejemplos se han de mencionar compuestos de metal alcalinotérreo o alcalino (por ejemplo, hidróxidos, hidruros, óxidos y carbonatos de litio, sodio, potasio, magnesio, calcio y bario), bases de amidina o bases de guanidina (por ejemplo, 7-metil-1,5,7-triaza-biciclo(4.4.0)dec-5-eno (MTBD); diazabicyclo(4.3.0)noneno (DBN), diazabicyclo(2.2.2)octano (DABCO), 1,8-diazabicyclo(5.4.0)undeceno (DBU), ciclohexiltetra-butyl-guanidina (CiTBG), ciclohexiltetrametilguanidina (CiTMG), N,N,N,N-tetrametil-1,8-naftalindiamina, pentametilpiperidina) y aminas, en especial aminas terciarias, (por ejemplo, trietilamina, trimetilamina, tribencilamina, triisopropilamina, tributilamina, triciclohexilamina, triamilamina, trihexilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetil-toluidina, N,N-dimetil-p-aminopiridina, N-metil-pirrolidina, N-metil-piperidina, N-metil-imidazol, N-metil-pirazol, N-metil-morfolina, N-metilhexametilendiamina, piridina, 4-pirrolidinopiridina, 4-dimetil-amino-piridina, quinolina,  $\alpha$ -picolina,  $\beta$ -picolina, isoquinolina, pirimidina, acridina, N,N,N',N'-tetra-metilendiamina, N,N,N',N'-tetraetilendiamina, quinoxalina, N-propil-diisopropilamina, N-etil-diisopropilamina, N,N'-dimetilciclohexilamina, 2,6-lutidina, 2,4-lutidina o trietildiamina). Además, se pueden usar cianuro de plata (I) como base y activador [Journal of Organic Chemistry. 1992, 57, 4394-4400; Journal of Medicine Chemistry 1992, 35, 3905-3918; Journal of Organic Chemistry 2003, 68, 1843-1851].

#### Bases preferidas

Como auxiliar básico de reacción preferido se puede usar una base orgánica tales como trietilamina, etil-diisopropilamina, tri-n-butilamina, piridina y 4-dimetilamino-piridina; además, también se pueden usar, por ejemplo, las siguientes bases: hidróxidos de metal alcalino tales como, por ejemplo, hidróxido de sodio e hidróxido de potasio; carbonatos tales como hidrógeno-carbonato de sodio y carbonato de potasio; fosfatos tales como hidrógeno-fosfato dipotásico y fosfato trisódico.

La reacción se puede realizar en un rango de temperatura amplio. Usualmente se puede llevar a cabo en un rango de temperatura de -78 a 200 °C, con preferencia, a temperaturas de entre -10 a 150 °C. La reacción se puede llevar a cabo a presión elevada como también a presión reducida. Pero preferentemente se lleva a cabo a presión normal. Los tiempos de reacción están entre 0,1 a 72 horas, con preferencia 1 a 24 horas.

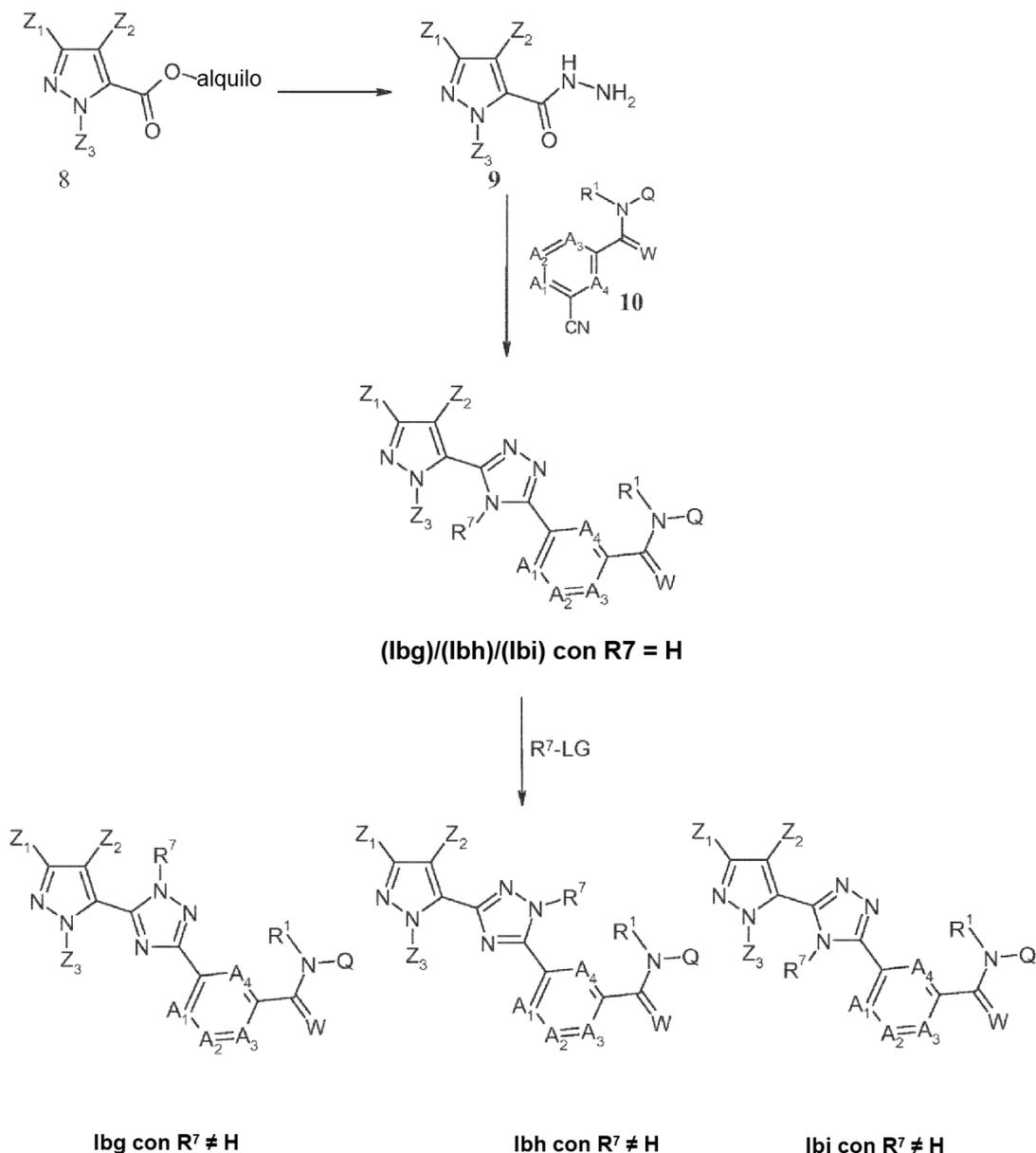
Para la realización de la reacción, se hacen reaccionar, por ejemplo, 1-2 equivalentes molares de los compuestos de la estructura **5** y 1 equivalente molar hasta un leve exceso de base por mol del compuesto de la estructura **4** en un disolvente como, por ejemplo, dimetilformamida (DMF).

Las etapas 2 y 3 para la preparación de los compuestos de la estructura **6** se pueden realizar en pasos individuales o también como reacción en un solo recipiente.

Las últimas etapas para la preparación de los compuestos según la invención (Iap) son la hidrólisis del éster de ácido carboxílico **6** y la amidación del ácido carboxílico **7** [documentos WO2010-051926; WO2010-133312].

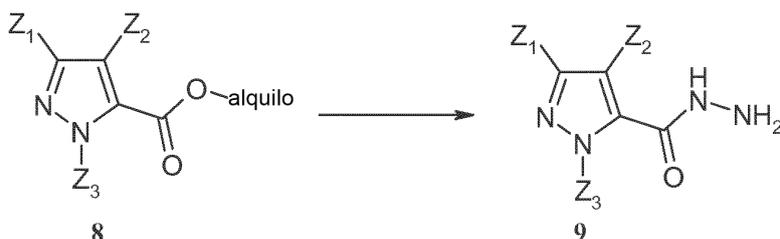
- 5 En el Esquema de reacción 2, se muestra el procedimiento general de obtención B para los compuestos según la invención (**lbj-lbi**).

Esquema de reacción 2



- 10 Los radicales A<sub>1</sub>-A<sub>4</sub>, Q, W, R<sup>7</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>1</sup> y Z<sup>1</sup>-Z<sup>3</sup> tienen los significados mencionados con anterioridad. "Alquilo" representa un radical alquilo como, por ejemplo, metilo o etilo. "LG" representa un grupo saliente, por ejemplo, cloro, bromo o yodo.

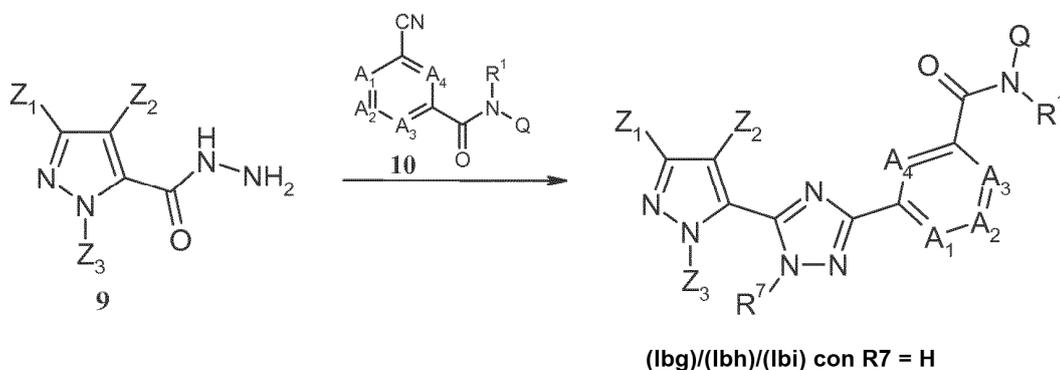
Primera etapa del procedimiento de obtención de los compuestos según la invención (**lbj**)/(**lbh**)/(**lbi**):



Los radicales  $Z^1$ - $Z^3$  tienen los significados mencionados con anterioridad. "Alquilo" representa un radical alquilo como, por ejemplo, metilo o etilo.

- 5 Los compuestos de la estructura general **9** se pueden preparar por analogía a procedimientos de preparación conocidos de la literatura [documentos WO2011-121137; WO2010-0071196] a partir de compuestos de partida de la estructura general **8**.

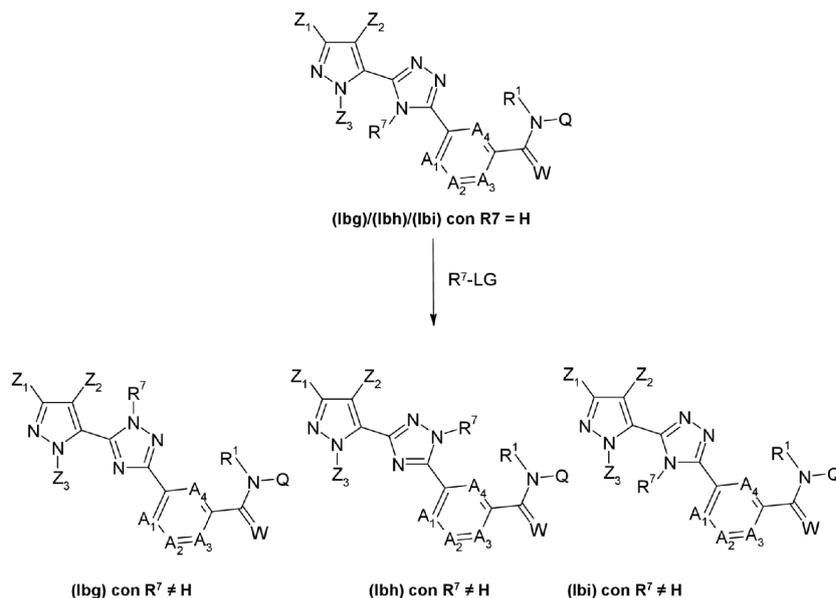
Segunda etapa del procedimiento de obtención de los compuestos según la invención **(lbg)/(lbh)/(lbi)**:



- 10 Los radicales  $A_1$ - $A_4$ ,  $Q$ ,  $W$ ,  $R^1$  y  $Z^1$ - $Z^3$  tienen los significados mencionados con anterioridad.  $R^7$  representa hidrógeno.

Los compuestos de la estructura general **(lbg)/(lbh)/(lbi)** con  $R^7 = H$  se pueden obtener por analogía a procedimientos de preparación conocidos de la literatura [documentos WO2010-025558; WO2004-052280; Tetrahedron Letters 2005, 46, 3429-3432] a partir de los compuestos de las estructuras generales **9** y **10**.

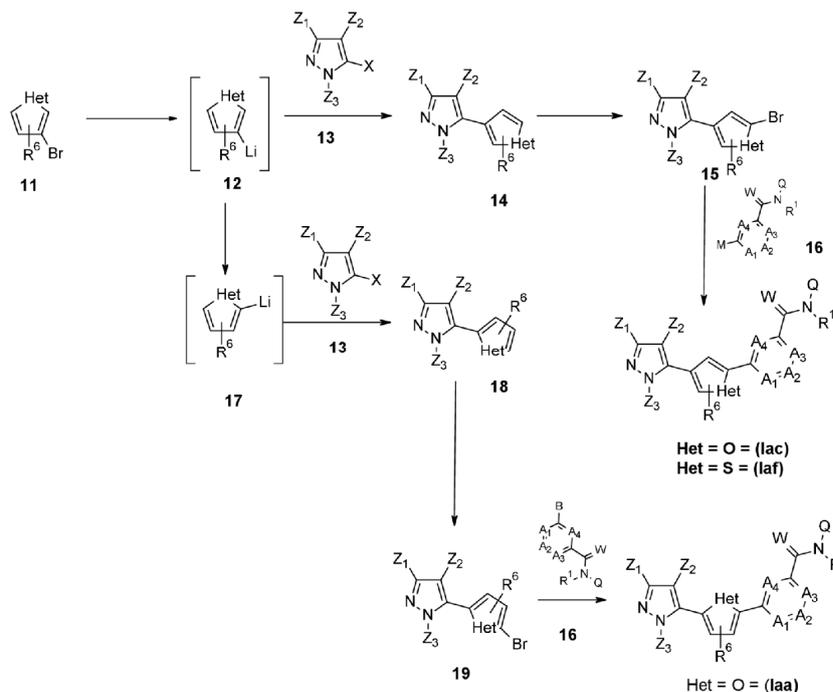
Tercera etapa del procedimiento de obtención de los compuestos según la invención **(lbg)/(lbh)/(lbi)**:



Los compuestos de la estructura general (**ibg/lbh/lbi**) con  $R^7 \neq H$  se pueden obtener por analogía a procedimientos de preparación conocidos de la literatura [documentos WO2007-071900; WO21012137089] a partir de los compuestos de las estructuras generales (**ibg/lbh/lbi**) con  $R^7 = H$ .

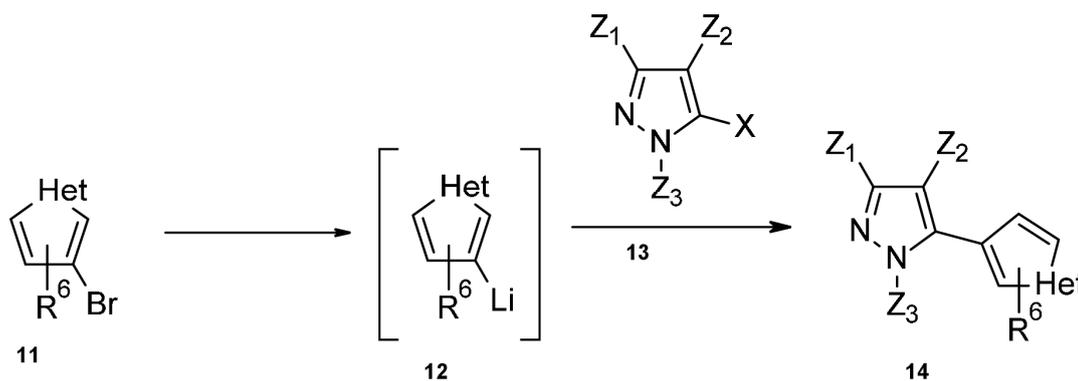
5 En el Esquema de reacción 3, se muestra el procedimiento general de obtención C para los compuestos según la invención (**laa, lac y laf**).

Esquema de reacción 3



10 Los radicales  $A_1$ - $A_4$ , Q, W,  $R^6$ ,  $R^1$  y  $Z^1$ - $Z^3$  tienen los significados mencionados con anterioridad. "Het" representa un átomo de oxígeno o de azufre. "X" representa un grupo saliente, por ejemplo, cloro o flúor. "M" representa un ácido borónico, un éster de ácido borónico o un trifluoroboronato.

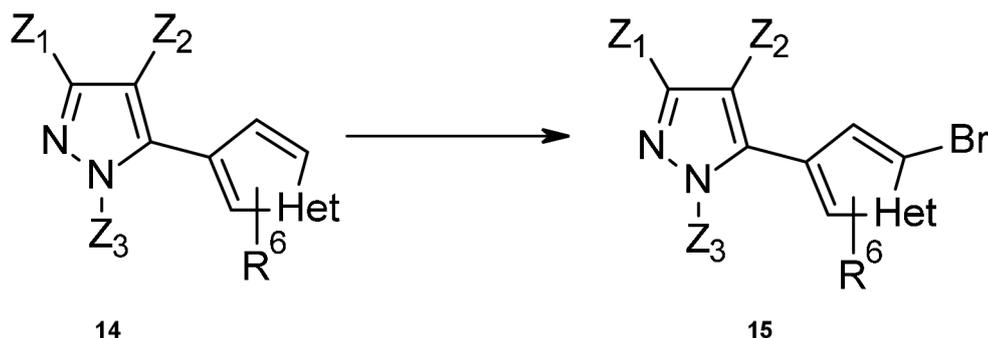
Primera etapa del procedimiento de obtención de (**lac**) & (**laf**)



Los radicales  $R^6$  y  $Z^1$ - $Z^3$  tienen los significados mencionados con anterioridad. "Het" representa un átomo de oxígeno o de azufre. "X" representa un grupo saliente, por ejemplo, cloro o flúor.

15 Los compuestos de la estructura general **14** se pueden obtener por la reacción de los compuestos de la estructura general **13** y compuestos de litio orgánico preparados in situ de la estructura general **12**. La preparación de compuestos de litio orgánico de la estructura general **12** a partir de los correspondientes compuestos de bromo y su reacción en reacciones de sustitución nucleofílicas se conoce de la literatura [Tetrahedron 1988, 44 (1), 81-90].

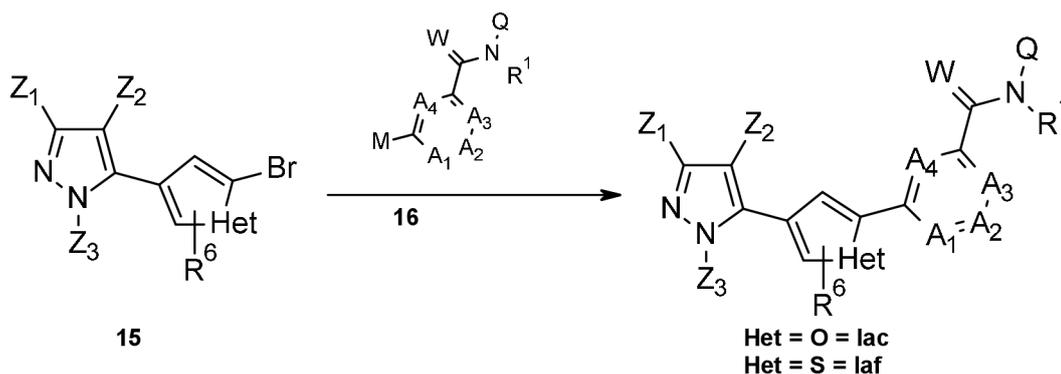
Segunda etapa del procedimiento de obtención de lac & laf



Los radicales R<sup>6</sup> y Z<sup>1</sup>-Z<sup>3</sup> tienen los significados mencionados con anterioridad. "Het" representa un átomo de oxígeno o de azufre.

- 5 Los compuestos de la estructura general **15** se pueden obtener por analogía a procedimientos conocidos de la literatura por bromación de compuestos de la estructura general **14** [por ejemplo, Organic Letters 2001, 13, 2129-2131].

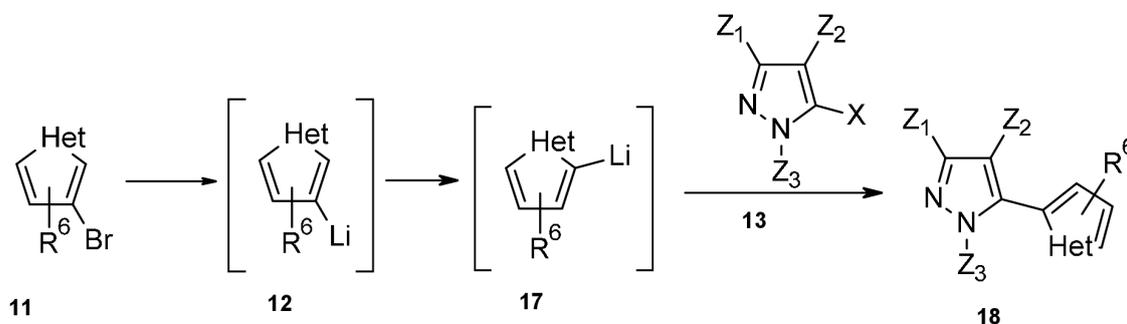
Tercera etapa del procedimiento de obtención de **lac** & **laf**



- 10 Los radicales A<sub>1</sub>-A<sub>4</sub>, Q, W, R<sup>6</sup>, R<sup>1</sup> y Z<sup>1</sup>-Z<sup>3</sup> tienen los significados mencionados con anterioridad. "Het" representa un átomo de oxígeno o de azufre. "M" representa un ácido borónico, un éster de ácido borónico o un trifluoroboronato.

Los compuestos según la invención de la estructura general **lac** y **laf** se pueden preparar por medio de una reacción de Suzuki catalizada con paladio por analogía a procedimientos conocidos de la literatura a partir de los compuestos de la estructura general **15** y **16** [WO2005-040110; WO2009-089508].

- 15 Primera etapa del procedimiento de obtención de los compuestos de la estructura general **laa** según la invención



Los radicales R<sup>6</sup> y Z<sup>1</sup>-Z<sup>3</sup> tienen los significados mencionados con anterioridad. "Het" representa un átomo de oxígeno o de azufre. "X" representa un grupo saliente, por ejemplo, cloro o flúor.

- 20 Los compuestos de la estructura general **18** se pueden obtener por medio de la reacción de los compuestos de la estructura general **13** y los compuestos de litio orgánico preparados in situ de la estructura general **17**. Los compuestos de litio orgánico de la estructura general **17** se producen por isomerización a partir de los compuestos de litio orgánico de la estructura general **12**. Los compuestos de litio orgánico de la estructura general **12** se pueden

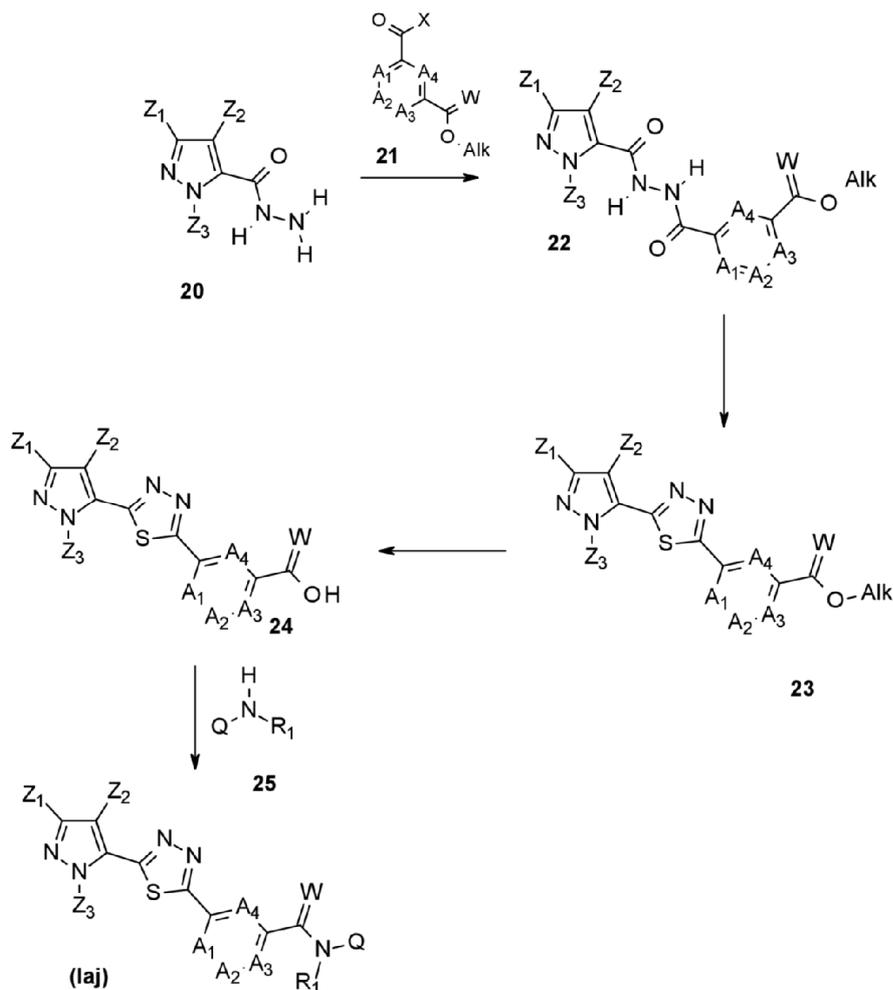
obtener a partir de los correspondientes compuestos de bromo.

La preparación de tales compuestos de litio orgánico y su reacción en reacciones de sustitución nucleofílica es conocida de la literatura [por ejemplo, Tetrahedron 1988, 44 (1), 81-90].

5 Otras reacciones para obtener los compuestos según la invención de la estructura general (Iaj) se producen por analogía a los procedimientos descritos con anterioridad para las preparaciones de (Iac) y (Iaf).

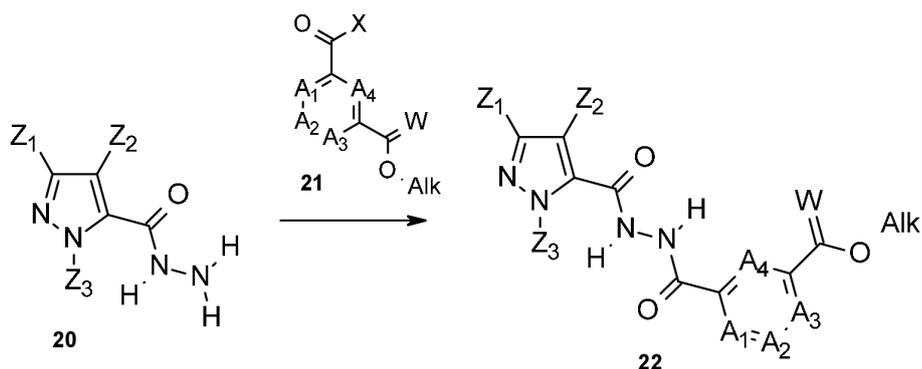
En el Esquema de reacción 4, se muestra el procedimiento general de obtención D para los compuestos según la invención (Iaj).

Esquema de reacción 4



10 Los radicales A<sub>1</sub>-A<sub>4</sub>, Q, W, R<sup>1</sup> y Z<sup>1</sup>-Z<sup>3</sup> tienen los significados mencionados con anterioridad. "X" representa un grupo saliente, por ejemplo, cloro. "Alk" representa un grupo alquilo, por ejemplo, metilo o etilo.

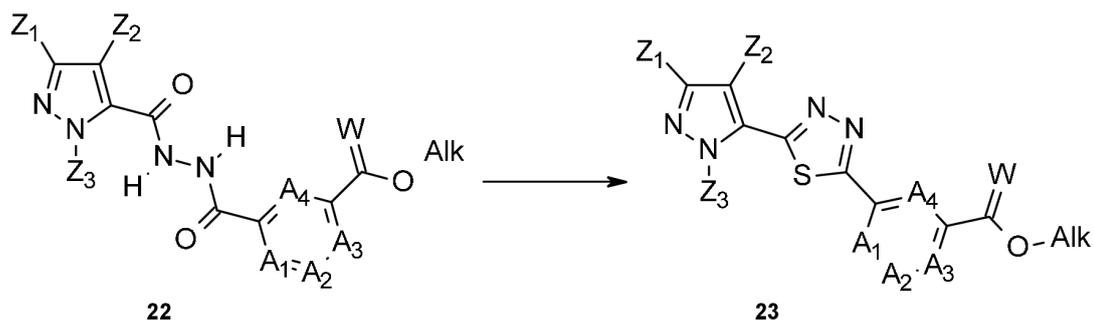
Primera etapa del procedimiento de obtención D para la preparación de los compuestos según la invención de la estructura general (Iaj)



Los radicales  $A_1$ - $A_4$ ,  $W$  y  $Z^1$ - $Z^3$  tienen los significados mencionados con anterioridad. "X" representa un grupo saliente, por ejemplo, cloro. "Alk" representa un grupo alquilo, por ejemplo, metilo o etilo.

- 5 Los compuestos de la estructura general **22** se pueden preparar por analogía a procedimientos conocidos de la literatura por medio de la reacción de compuestos de la estructura general **20** con compuestos de la estructura general **21** [documento US2013-13953965].

Segunda etapa del procedimiento de obtención D para la preparación de los compuestos según la invención de la estructura general (**la**j)



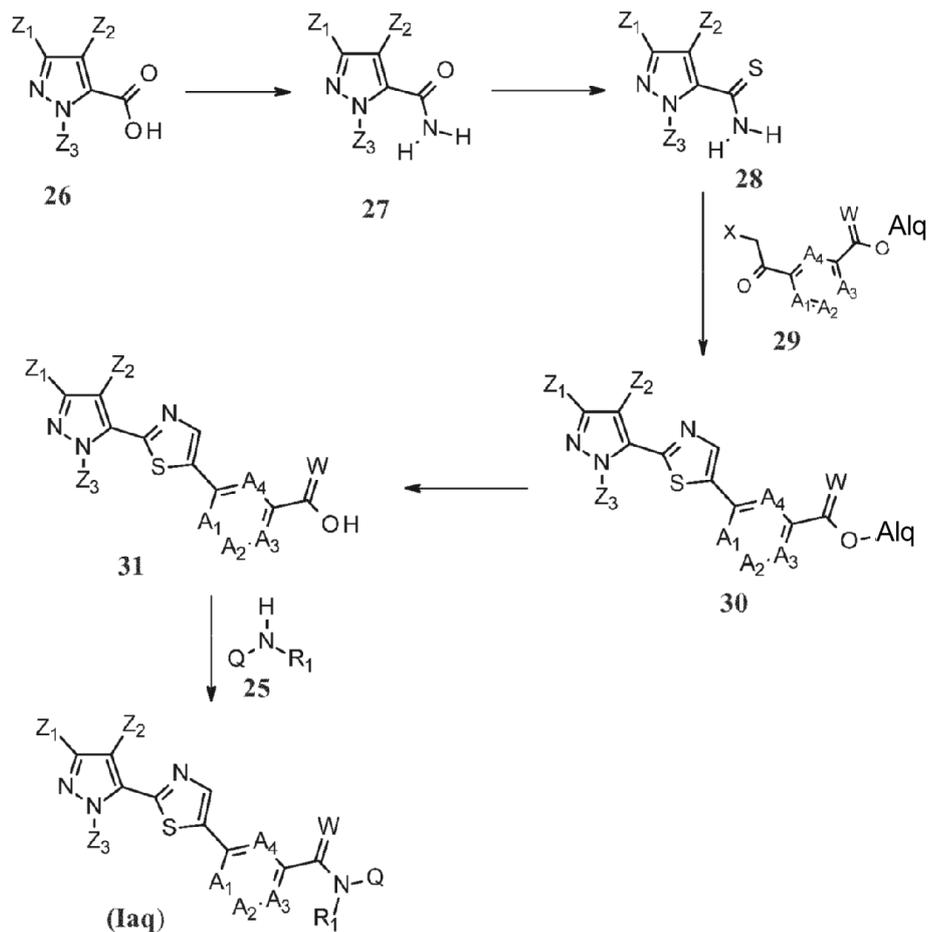
- 10 Los radicales  $A_1$ - $A_4$ ,  $W$  y  $Z^1$ - $Z^3$  tienen los significados mencionados con anterioridad. "Alk" representa un grupo alquilo, por ejemplo, metilo o etilo.

Los compuestos de la estructura general **22** se pueden preparar por analogía a procedimientos conocidos de la literatura por medio de la reacción del compuesto de la estructura general **23** con reactivos de sulfuración como, por ejemplo, reactivo de Lawesson [documento WO2013-149121].

- 15 Las últimas etapas para la preparación de los compuestos según la invención (**la**j), hidrólisis del éster de ácido carboxílico **23** y amidación del ácido carboxílico **24** con aminas de la estructura general **25** se pueden llevar a cabo por analogía a procedimientos conocidos de la literatura [documentos WO2010-051926; WO2010-133312]

En el Esquema de reacción 5, se muestra el procedimiento general de obtención E para los compuestos según la invención (**la**q).

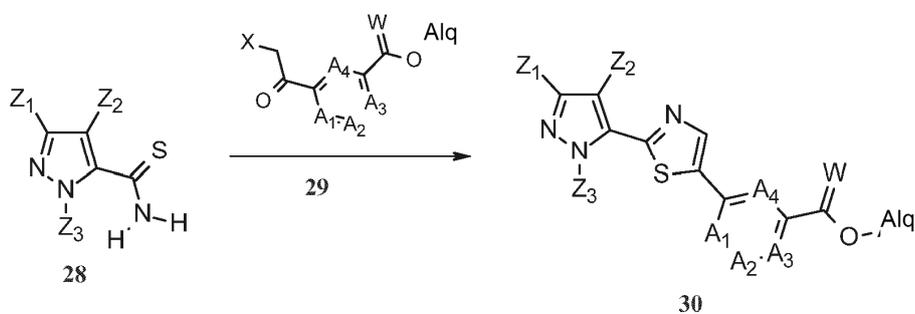
- 20 Esquema de reacción 5



Los radicales  $A_1$ - $A_4$ , Q, W,  $R^1$  y  $Z^1$ - $Z^3$  tienen los significados mencionados con anterioridad. "X" representa un grupo saliente, por ejemplo, cloro o bromo. "Alk" representa un grupo alquilo, por ejemplo, metilo o etilo.

5 La primera y la segunda etapa del procedimiento de obtención E para la preparación de los compuestos según la invención de la estructura general (Iaq) se llevan a cabo según disposiciones conocidas de la literatura [amidación; documento WO2009-071706, tiación de la función carbonilo WO2013-018695]

Tercera etapa del procedimiento de obtención E para la preparación de los compuestos según la invención de la estructura general (Iaq)



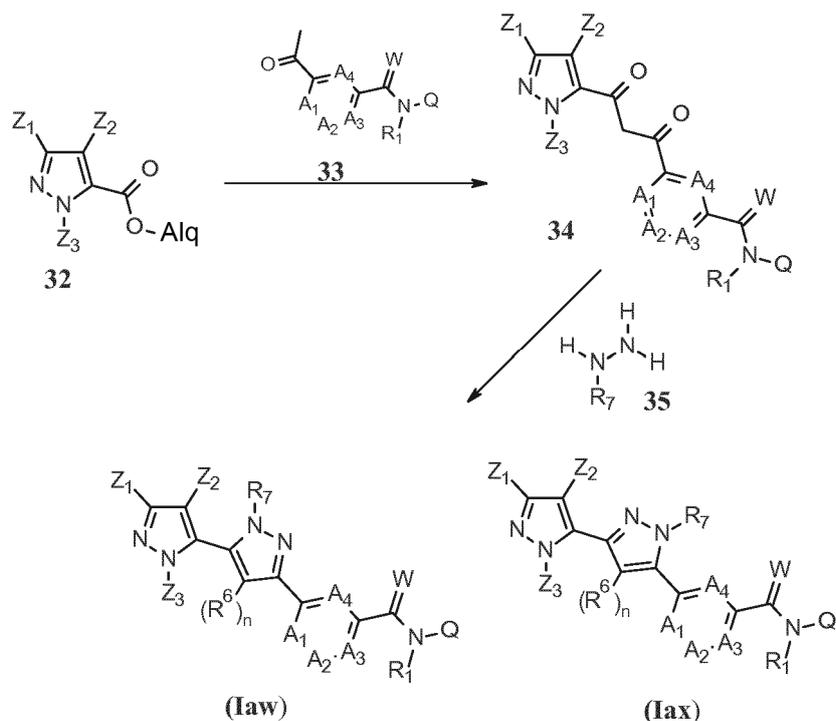
10 Los radicales  $A_1$ - $A_4$ , W y  $Z^1$ - $Z^3$  tienen los significados mencionados con anterioridad. "X" representa un grupo saliente, por ejemplo, cloro o bromo. "Alk" representa un grupo alquilo, por ejemplo, metilo o etilo.

Los compuestos de la estructura general 30 se pueden preparar por analogía a procedimientos conocidos de la literatura por medio de la reacción del compuesto de la estructura general 28 con alfa-halocetonas de la estructura general 29 [documento WO2013-062027].

Las últimas etapas para la preparación de los compuestos según la invención (**laq**), hidrólisis del éster de ácido carboxílico **30** y amidación del ácido carboxílico **31** con aminas de la estructura general **25** se pueden llevar a cabo por analogía a procedimientos conocidos de la literatura [documentos WO2010-051926; WO2010-133312]

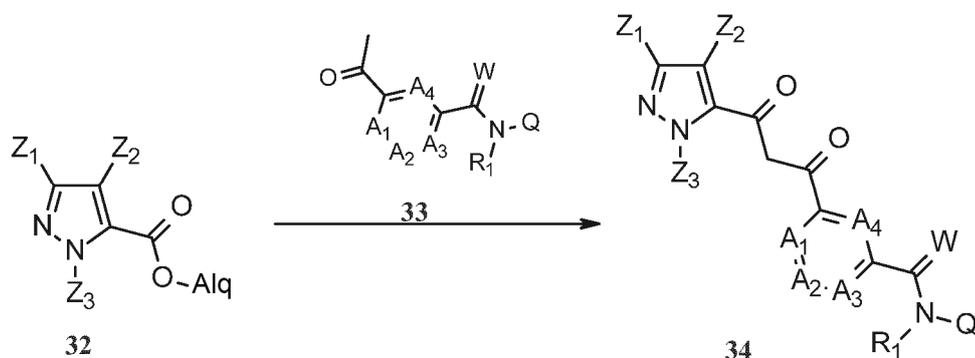
5 En el esquema de reacción 6 se muestra el procedimiento general de obtención F para los compuestos según la invención (**law**) y (**lax**).

Esquema de reacción 6



10 Los radicales  $A_1$ - $A_4$ , Q, W,  $R^6$ ,  $R^7$  y  $Z^1$ - $Z^3$  tienen los significados mencionados con anterioridad, en donde  $n = 0$ .  $R^1$  representa los radicales antes descritos a excepción de hidrógeno. "Alk" representa un grupo alquilo, por ejemplo, metilo o etilo.

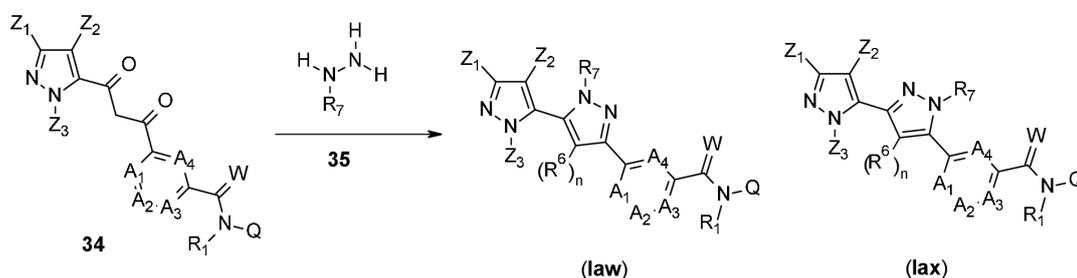
Primera etapa del procedimiento de obtención F para la preparación de los compuestos según la invención de las estructuras generales (**law**) y (**lax**).



15 Los radicales  $A_1$ - $A_4$ , W y  $Z^1$ - $Z^3$  tienen los significados mencionados con anterioridad.  $R^1$  representa los radicales antes descritos a excepción de hidrógeno. "Alk" representa un grupo alquilo, por ejemplo, metilo o etilo.

Los compuestos de la estructura general **34** se pueden preparar por analogía a procedimientos conocidos de la literatura por medio de la reacción de compuestos de la estructura general **32** con compuestos de la estructura general **33** [documento US2012-13684606].

Segunda etapa del procedimiento de obtención F para la preparación de los compuestos según la invención de las estructuras generales (**law**) y (**lax**).

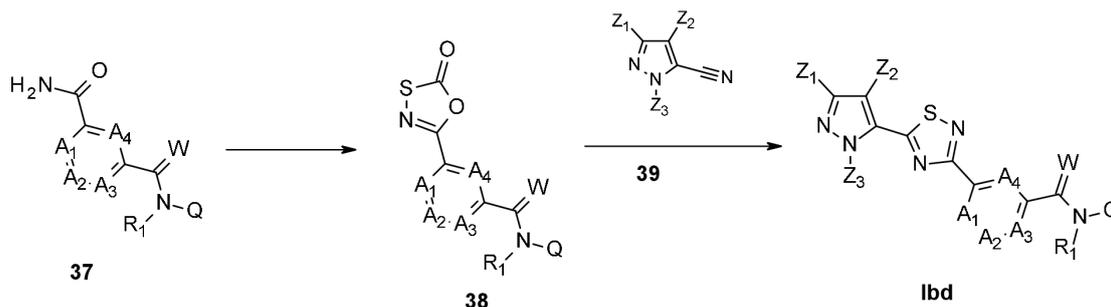


5 Los radicales  $A_1$ - $A_4$ , W,  $R^6$ ,  $R^7$  y  $Z^1$ - $Z^3$  tienen los significados mencionados con anterioridad, en donde  $n = 0$ .  $R^1$  representa los radicales antes descritos a excepción de hidrógeno.

Los compuestos de la estructura general (**law**) y (**lax**) se pueden preparar por analogía a procedimientos conocidos de la literatura por medio de la reacción de compuestos de la estructura general **34** con hidrazinas de la estructura general **35** [WO 2012052412].

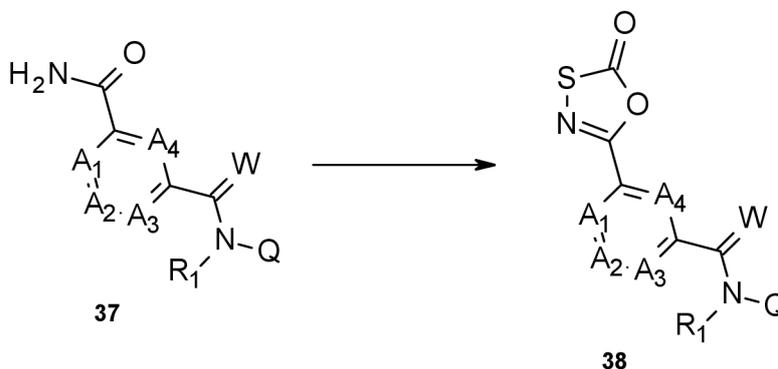
10 En el Esquema de reacción 7 se muestra el procedimiento general de obtención G para los compuestos según la invención (**lbd**).

Esquema de reacción 7



Los radicales  $A_1$ - $A_4$ , Q, W,  $R^1$  y  $Z^1$ - $Z^3$  tienen los significados mencionados con anterioridad.

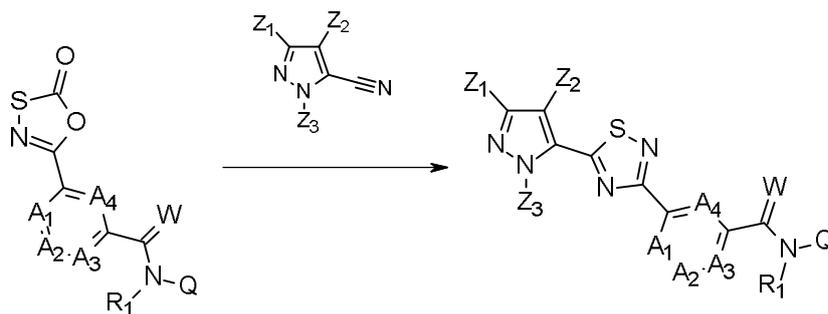
15 Primera etapa del procedimiento de obtención G para la preparación de los compuestos según la invención de la estructura general (**lbd**).



Los radicales  $A_1$ - $A_4$ ,  $R^1$ , Q y W tienen los significados mencionados con anterioridad.

20 Los compuestos de la estructura general **38** pueden prepararse por analogía a procedimientos conocidos de la literatura por medio de la reacción de compuestos de la estructura general **37** con cloruro de clorocarbonilsulfenilo [documento WO2009-023721].

Segunda etapa del procedimiento de obtención G para la preparación de los compuestos según la invención de la estructura general (**lbd**).

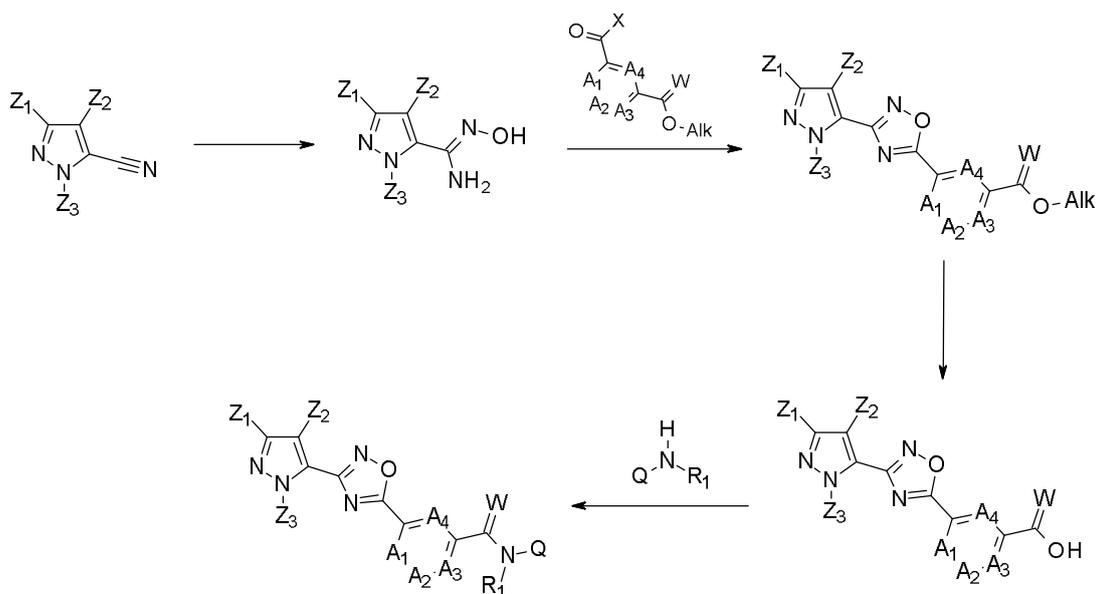


Los radicales A<sub>1</sub>-A<sub>4</sub>, Q, W, R<sup>1</sup> y Z<sup>1</sup>-Z<sup>3</sup> tienen los significados mencionados con anterioridad.

5 Los compuestos de la estructura general (lbd) se pueden preparar por analogía a procedimientos conocidos de la literatura por medio de la reacción de compuestos de la estructura general 38 con compuestos de ciano de la estructura general 39 [documento WO2009-023721].

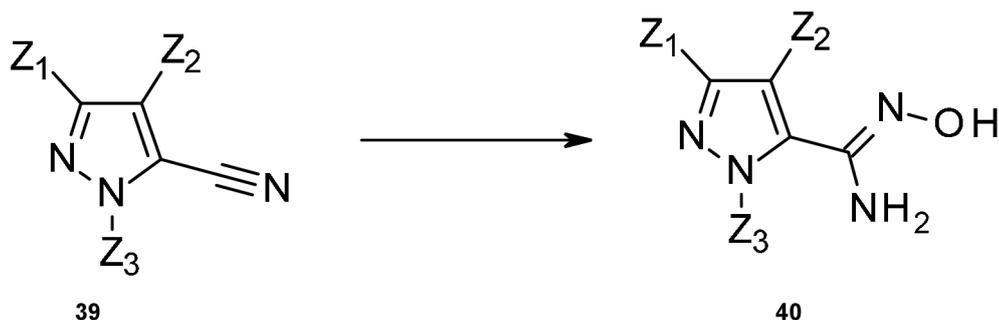
En el Esquema de reacción 8 se muestra el procedimiento general de obtención H para los compuestos según la invención (lbe).

Esquema de reacción 8



10 Los radicales A<sub>1</sub>-A<sub>4</sub>, Q, W, R<sup>1</sup> y Z<sup>1</sup>-Z<sup>3</sup> tienen los significados mencionados con anterioridad. "X" representa un grupo saliente, por ejemplo, cloro o bromo. "Alk" representa un grupo alquilo, por ejemplo, metilo o etilo.

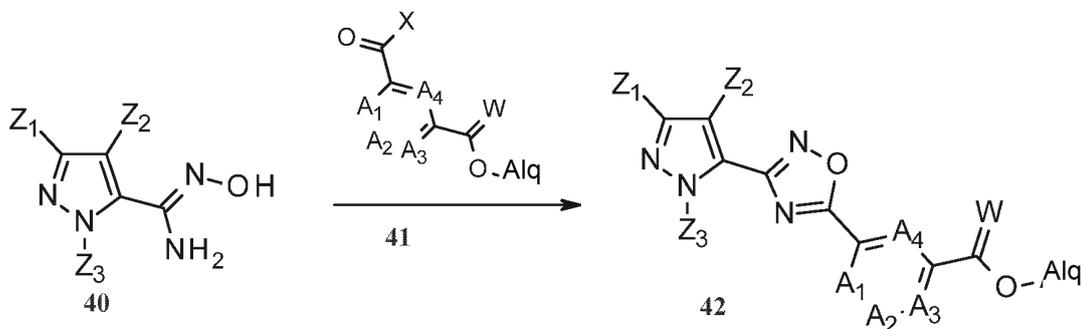
Primera etapa del procedimiento de obtención H para la preparación de los compuestos según la invención de la estructura general (lbe).



15 Los radicales Z<sup>1</sup>-Z<sup>3</sup> tienen los significados mencionados con anterioridad.

Los compuestos de la estructura general **40** se pueden preparar por analogía a procedimientos conocidos de la literatura por medio de la reacción de compuestos de la estructura general **39** con *N*-hidroxilamina, o bien sus sales [documento WO2014-008257].

- 5 Segunda etapa del procedimiento de obtención H para la preparación de los compuestos según la invención de la estructura general (**lbe**).



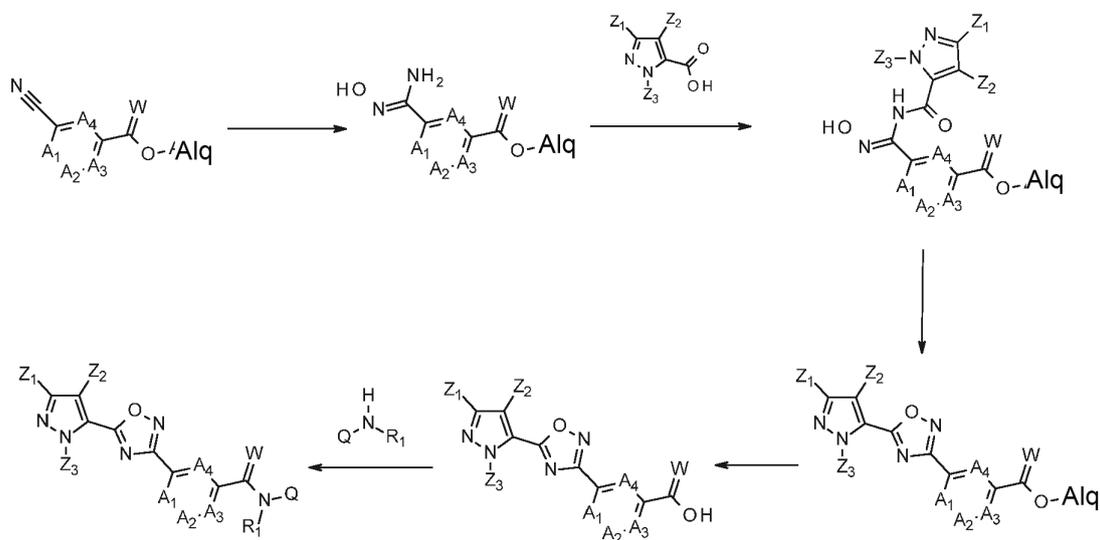
Los radicales A<sub>1</sub>-A<sub>4</sub>, Q, W, R<sup>1</sup> y Z<sup>1</sup>-Z<sup>3</sup> tienen los significados mencionados con anterioridad. "X" representa un grupo saliente, por ejemplo, cloro o bromo. "Alk" representa un grupo alquilo, por ejemplo, metilo o etilo.

- 10 Los compuestos de la estructura general **42** se pueden preparar por analogía a procedimientos conocidos de la literatura por medio de la reacción de compuestos de la estructura general **40** con compuestos de la estructura general **41** [documento WO2012-035023].

Las últimas etapas para la preparación de los compuestos según la invención (**lbe**), hidrólisis del éster de ácido carboxílico **42** y amidación del ácido carboxílico **43** con aminas de la estructura general **25** se pueden llevar a cabo por analogía a procedimientos conocidos de la literatura [documentos WO2010-051926; WO2010-133312]

- 15 En el Esquema de reacción 9 se muestra el procedimiento general de obtención I para los compuestos según la invención (**lbf**).

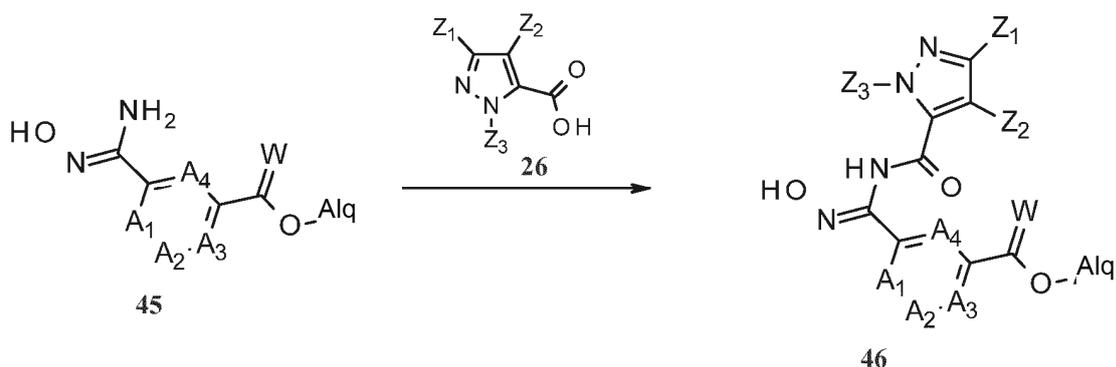
Esquema de reacción 9



- 20 Los radicales A<sub>1</sub>-A<sub>4</sub>, Q, W, R<sup>1</sup> y Z<sup>1</sup>-Z<sup>3</sup> tienen los significados mencionados con anterioridad. "Alk" representa un grupo alquilo, por ejemplo, metilo o etilo.

La primera etapa del procedimiento de obtención I para la preparación de compuestos de la estructura general (**45**) a partir de los compuestos de la estructura general **44** se produce por analogía a disposiciones conocidas de la literatura [documento WO2014-008257].

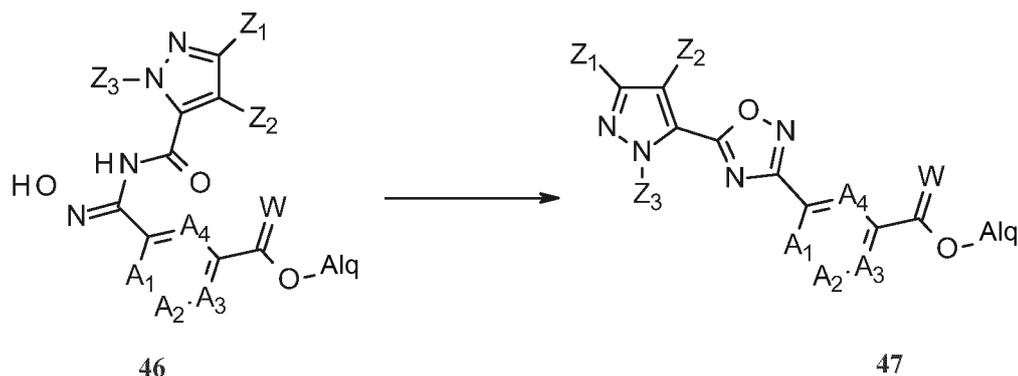
- 25 Segunda etapa del procedimiento de obtención I para la preparación de los compuestos según la invención de la estructura general (**lbf**).



Los radicales  $A_1$ - $A_4$ , Q, W,  $R^1$  y  $Z^1$ - $Z^3$  tienen los significados mencionados con anterioridad. "Alk" representa un grupo alquilo, por ejemplo, metilo o etilo.

- 5 Los compuestos de la estructura general **46** se pueden preparar por analogía a procedimientos conocidos de la literatura por medio de la reacción de compuestos de la estructura general **45** con compuestos de la estructura general **26** [documento WO2008-137816].

Tercera etapa del procedimiento de obtención I para la preparación de los compuestos según la invención de la estructura general (**lbf**).



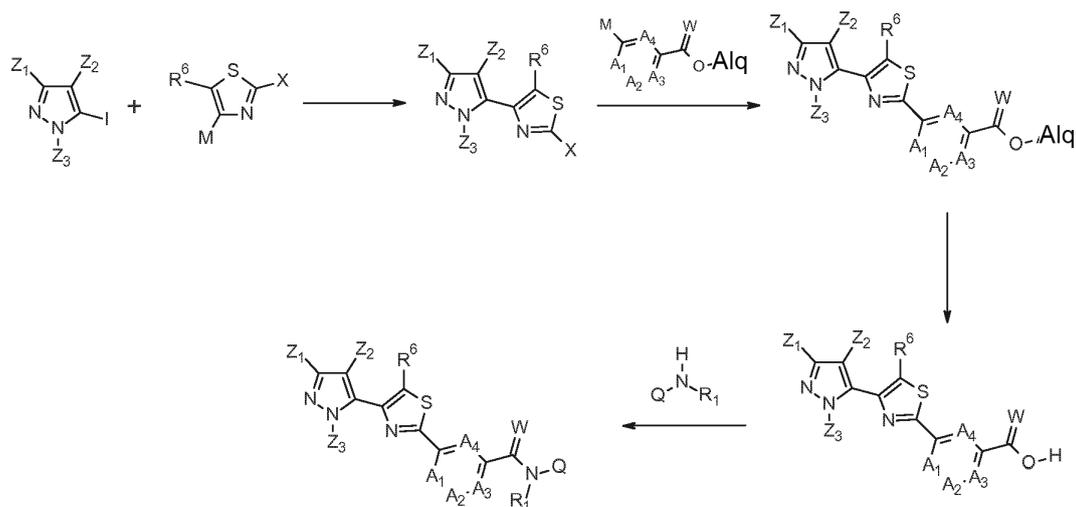
- 10 Los radicales  $A_1$ - $A_4$ , Q, W,  $R^1$  y  $Z^1$ - $Z^3$  tienen los significados mencionados con anterioridad. "Alk" representa un grupo alquilo, por ejemplo, metilo o etilo.

Los compuestos de la estructura general **47** se pueden preparar por analogía a procedimientos conocidos de la literatura a partir de los compuestos de la estructura general **46** [documento WO2008-137816].

- 15 Las últimas etapas para la preparación de los compuestos según la invención (**lbf**), hidrólisis del éster de ácido carboxílico **47** y amidación del ácido carboxílico **48** con aminas de la estructura general **25** se pueden llevar a cabo por analogía a procedimientos conocidos de la literatura [documento WO2010-051926; WO2010-133312].

En el esquema de reacción 10 se muestra el procedimiento general de obtención J para los compuestos según la invención (**lat**).

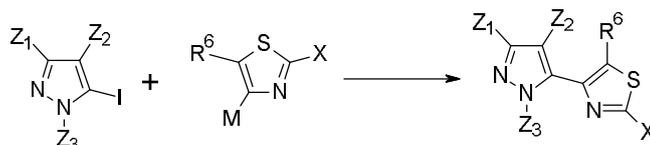
- 20 Esquema de reacción 10



Los radicales  $A_1$ - $A_4$ , Q, W,  $R^1$  y  $Z^1$ - $Z^3$  tienen los significados mencionados con anterioridad.  $R^6$  tiene los significados antes descritos, pero con preferencia representa hidrógeno. "X" representa cloro o bromo, con preferencia cloro. "M" representa un ácido borónico, un éster de ácido borónico o un trifluoroboronato.

5 "Alk" representa un grupo alquilo, por ejemplo, metilo o etilo.

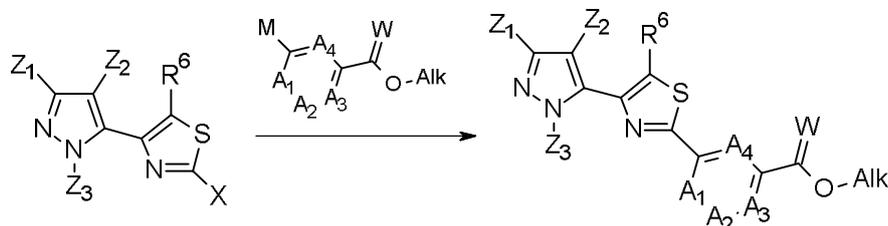
Primera etapa del procedimiento de obtención J para la preparación de los compuestos según la invención de la estructura general (lat).



10 Los radicales  $Z^1$ - $Z^3$  tienen los significados mencionados con anterioridad.  $R^6$  tiene los significados antes descritos, pero preferentemente representa hidrógeno. "X" representa cloro o bromo, con preferencia cloro. "M" representa un ácido borónico, un éster de ácido borónico o un trifluoroboronato.

Los compuestos de la estructura general **51** se pueden preparar por analogía a procedimientos conocidos de la literatura a partir de compuestos de la estructura general **49** y **50** por acoplamiento cruzado catalizado con metal de transición [documento WO2012142504].

15



Los radicales  $A_1$ - $A_4$ , W y  $Z^1$ - $Z^3$  tienen los significados mencionados con anterioridad.  $R^6$  tiene los significados antes descritos, pero preferentemente representa hidrógeno. "X" representa cloro o bromo, con preferencia, cloro. "M" representa un ácido borónico, un éster de ácido borónico o un trifluoroboronato.

20 "Alk" representa un grupo alquilo, por ejemplo, metilo o etilo.

Los compuestos de la estructura general **53** se pueden preparar por analogía a procedimientos conocidos de la literatura a partir de los compuestos de la estructura general **51** y **52** por medio de acoplamiento cruzado catalizado por metal de transición [European Journal of Organic Chemistry 2012, 31, 6248-6259].

Las últimas etapas para la preparación de los compuestos según la invención (lat), hidrólisis del éster de ácido

carboxílico **53** y amidación del ácido carboxílico **54** con aminas de la estructura general **25** se pueden llevar a cabo por analogía a procedimientos conocidos de la literatura [documentos WO2010-051926; WO2010-133312].

Se conocen agentes oxidantes para la oxidación de grupos alcohólicos (véase, por ejemplo, Oxidationsreagenzien in Organic Synthesis by Oxidation with Metal Compounds, Mijs, de Jonge, editorial Plenum, Nueva York, 1986; Manganese Compounds as Oxidizing Agents in Organic Chemistry, Arndt, Open Court Publishing Company, La Salle, IL, 1981; The Oxidation of Organic Compounds by Permanganate Ion and Hexavalent Chromium, Lee, Open Court Publishing Company, La Salle, IL, 1980). Se puede llevar a cabo una oxidación, por ejemplo, en presencia de permanganatos (por ejemplo, permanganato de potasio), óxidos de metal (por ejemplo, dióxido de manganeso, óxidos de cromo como por ejemplo en óxido de dipiridin-cromo (IV) como reactivo de Collins (véase J. C. Collins y col., Tetrahedron Lett. 30, 3363-3366, 1968)). Igualmente en presencia de clorocromato de piridinio (por ejemplo, reactivo de Corey) (véase también R. O. Hutchins y col., Tetrahedron Lett. 48, 4167-4170, 1977; D. Landini y col. Synthesis 134-136, 1979) o tetróxido de rutenio (véase S.-I. Murahashi, N. Komiya Ruthenium-catalyzed Oxidation of Alkenes, Alcohols, Amines, Amides,  $\beta$ -Lactams, Phenols and Hydrocarbons, en: Modern Oxidation Methods, Baekvall, Jan-Erling (Eds.), editorial Wiley-VCH GmbH & Co. KGaA, 2004). Son igualmente adecuadas reacciones de oxidación inducidas por ultrasonidos, así como el uso de permanganato de potasio (véase J. Yamawaki y col., Chem. Lett. 3, 379-380, 1983).

Para el desbloqueo/escisión del grupo protector SG se pueden usar todos los coadyuvantes de reacción ácidos o básicos adecuados conocidos según la forma de proceder descrita en la bibliografía. Con uso de grupos protectores para grupos amino del tipo carbamato se prefieren usar coadyuvantes de reacción ácidos. Con uso de grupo protector de t-butilcarbonato (grupo BOC) se usan, por ejemplo, mezclas de ácidos minerales como ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido nítrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico o ácidos orgánicos como ácido benzoico, ácido fórmico, ácido acético, ácido trifluoroacético, ácido metansulfónico, ácido bencensulfónico o ácido toluensulfónico, y un agente diluyente adecuado como agua y/o un disolvente orgánico como tetrahidrofurano, dioxano, diclorometano, cloroformo, éster acético o metanol. Se prefieren mezclas de ácido clorhídrico o ácido acético con agua y/o un disolvente orgánico como éster acético.

Se sabe que muchas reacciones y procedimientos de preparación se pueden llevar a cabo de forma especialmente adecuada en presencia de diluyentes o disolventes y coadyuvantes de reacción básicos o ácidos. Se pueden usar igualmente mezclas de diluyentes o disolventes. Los diluyentes o disolventes se usan de forma ventajosa en una cantidad tal que la mezcla de reacción se pueda agitar bien durante todo el procedimiento.

Como diluyentes o disolventes para la realización del procedimiento de acuerdo con la invención se tienen en cuenta fundamentalmente todos los disolventes orgánicos inertes en las condiciones de reacción específicas. Como ejemplos son de citar: hidrocarburos haloados, (por ejemplo, hidrocarburos clorados como tetraetileno, tetracloroetano, dicloropropano, cloruro de metileno, diclorobutano, cloroformo, tetracloruro de carbono, tricloroetano, tricloroetileno, pentacloroetano, difluorobenceno, 1,2-dicloroetano, clorobenceno, bromobenceno, diclorobenceno, clorotolueno, triclorobenceno), alcoholes (por ejemplo, metanol, etanol, isopropanol, butanol), éteres (por ejemplo, etilpropiléter, metil-*terc*-butiléter, *n*-butiléter, anisol, fenetol, ciclohexilmetiléter, dimetiléter, dietiléter, dipropiléter, diisopropiléter, di-*n*-butiléter, diisobutiléter, diisoamiléter, etilenglicoldimetiléter, tetrahidrofurano, dioxano, diclorodietiléter y poliéter de óxido de etileno y/o óxidos de propileno), aminas (por ejemplo, trimetil-, trietil-, tripropil-, tributilamina, *n*-metilmorfolina, piridina y tetrametilendiamina), nitrohidrocarburos (por ejemplo, nitrometano, nitroetano, nitropropano, nitrobenceno, cloronitrobenceno, *o*-nitrotolueno; nitrilos como acetonitrilo, propionitrilo, butironitrilo, isobutironitrilo, benzonitrilo, *m*-clorobenzonitrilo), dióxido de tetrahidrotiofeno, dimetilsulfóxido, tetrametilsulfóxido, dipropilsulfóxido, bencilmetilsulfóxido, diisobutilsulfóxido, dibutilsulfóxido, diisoamilsulfóxido; sulfonas (por ejemplo, dimetil-, dietil-, dipropil-, dibutil-, difenil-, dihexil-, metiletil-, etilpropil-, etilisobutil- y pentametilsulfona), hidrocarburos alifáticos, cicloalifáticos o aromáticos (por ejemplo, pentano, hexano, heptano, octano, nonano e hidrocarburos industriales), además de las denominadas bencinas blancas con componentes con puntos de ebullición en el intervalo, por ejemplo, de 40° C a 250° C, cimeno, fracciones de gasolina en un intervalo de punto de ebullición de 70° C a 190° C, ciclohexano, metilciclohexano, éter de petróleo, ligroína, octano, benceno, tolueno, clorobenceno, bromobenceno, nitrobenceno, xileno; ésteres (por ejemplo, acetato de metilo, etilo, butilo, isobutilo, así como carbonato de dimetilo, dibutilo, etileno), amidas (por ejemplo, triamida del ácido hexametilenfosfórico, formamida, *n*-metil-formamida, *N,N*-dimetil-formamida, *N,N*-dipropil-formamida, *N,N*-dibutil-formamida, *N*-metil-pirrolidina, *N*-metil-caprolactama, 1,3-dimetil-3,4,5,6-tetrahidro-2(1H)-pirimidina, octilpirrolidona, octilcaprolactama, 1,3-dimetil-2-imidazolindiona, *N*-formil-piperidina, *N,N'*-1,4-diformil-piperazina) y cetonas (por ejemplo, acetona, acetofenona, metiletilcetona, metilbutilcetona).

Como coadyuvantes de reacción básicos para la realización del procedimiento de acuerdo con la invención se pueden usar todos los aglutinantes de ácido adecuados. Como ejemplos son de citar: compuestos de metales alcalinotérreos o alcalinos (por ejemplo, hidróxidos, hidruros, óxidos y carbonatos de litio, sodio, potasio, magnesio, calcio y bario), bases de amidina o bases de guanidina (por ejemplo, 7-metil-1,5,7-triaza-biciclo[4.4.0]dec-5-eno (MTBD); diazabicyclo[4.3.0]noneno (DBN), diazabicyclo[2.2.2]octano (DABCO), 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undeceno (DBU), ciclohexiltetrabutyl-guanidina (CyTBG), ciclohexiltetrametilguanidina (CiTMG), *N,N,N,N*-tetrametil-1,8-naftalindiamina, pentametilpiperidina) y aminas, de forma particular aminas terciarias (por ejemplo, trietilamina, trimetilamina, tribencilamina, trisopropilamina, tributilamina, triciclohexilamina, triamilamina, trihexilamina, *N,N*-dimetilaminilina, *N,N*-dimetil-toluidina, *N,N*-dimetil-*p*-aminopiridina, *N*-metil-pirrolidina, *N*-metil-piperidina, *N*-metil-

imidazol, N-metil-pirazol, N-metil-morfolina, N-metil-hexametilendiamina, piridina, 4-pirrolidinopiridina, 4-dimetilamino-piridina, quinolina,  $\alpha$ -picolina,  $\beta$ -picolina, isoquinolina, pirimidina, acridina, N,N,N',N'-tetrametilendiamina, N,N,N',N'-tetraetilendiamina, quinoxalina, N-propil-diisopropilamina, N-etil-diisopropilamina, N,N'-dimetil-ciclohexilamina, 2,6-lutidina, 2,4-lutidina o trietildiamina).

- 5 Como coadyuvantes de reacción ácidos para la realización del procedimiento de acuerdo con la invención se pueden usar todos los ácidos minerales (por ejemplo, ácidos halohídricos como ácido fluorhídrico, ácido clorhídrico, ácido bromhídrico o ácido yodhídrico así como ácido sulfúrico, ácido fosfórico, ácido fosforoso, ácido nítrico), ácidos de Lewis (por ejemplo, cloruro de aluminio (III), trifluoruro de boro o su eterato, cloruro de titanio (V), cloruro de estaño (V), y ácidos orgánicos (por ejemplo, ácido fórmico, ácido acético, ácido propiónico, ácido malónico, ácido láctico, ácido oxálico, ácido fumárico, ácido adípico, ácido esteárico, ácido tartárico, ácido oleico, ácido metansulfónico, ácido benzoico, ácido bencensulfónico o ácido para-toluensulfónico).

10 En tanto en los esquemas de reacción se prevean grupos protectores, se pueden usar todos los grupos protectores conocidos en general. De forma particular aquellos que se describen por parte de T. W., Wuts P. G. W. en Protective Groups in Organic Synthesis; John Wiley & Sons, Inc. 1999, "Protection for the hydroxyl group including 1,2- and 1,3-diols".

15 Adicionalmente son grupos protectores adecuados también

20 del tipo de un metiléter sustituido (por ejemplo, metoximetiléter (MOM), metiltimetiléter (MTM), (fenil-dimetilsilil)metoximetiléter (SNOM-OR), benciloximetiléter (BOM-OR) para-metoxibenciloximetiléter (PMBM-OR), para-nitrobenciloximetil-éter, orto-nitrobenciloximetiléter (NBOM-OR), (4-metoxifenoxi)-metiléter (p-AOM-OR), guaiacolmetiléter (GUM-OR), t-butoximetiléter, 4-pentiloxi-metiléter (POM-OR), sililoximetiléter, 2-metoxi-etoximetiléter (MEM-OR), 2,2,2-tricloroetoximetiléter, bis(2-cloroetoxi)-metiléter, 2-(trimetil-silil)etoximetiléter (SEM-OR), metoximetiléter (MM-OR));

25 del tipo de un etiléter sustituido (por ejemplo, 1-etoxietiléter (EE-OR), 1-(2-cloroetoxi)etiléter (CEE-OR), 1-[2-(trimetilsilil)etoxi]etiléter (SEE-OR), 1-metil-1-metoxietiléter (MIP-OR), 1-metil-1-benciloxietiléter (MBE-OR), 1-metil-1-benciloxi-2-fluoro-etiléter (MIP-OR), 1-metil-1-fenoxietiléter, 2,2,-tricloroetiléter, 1,1-dianisil-2,2,2-tricloroetiléter (DATE-OR), 1,1,1,3,3,3-hexafluoro-2-fenilisopropiléter (HIP-OR), 2-trimetilsililetiléter, 2-(benciltio)etiléter, 2-(fenilselenil)etiléter), un éter (por ejemplo, tetrahidropiraniléter (THP-OR), 3-bromo-tetrahidropiraniléter (3-BrTHP-OR), tetrahidrotiopiraniléter, 1-metoxi-ciclohexiléter, 2- y 4-picoliléter, 3-metil-2-picolil-N-oxido-éter, 2-quinolinilmetiléter (Qm-OR), 1-pirenilmetiléter, dipenilmetiléter (DPM-OR), para, para'-dinitrobenzohidriléter (DNB-OR), 5-dibenzosuberiléter, trifenilmetiléter (Tr-OR), alfa-naftildifenilmetiléter, para-metoxi-fenildifenilmetiléter (MMTrOR), di(para-metoxi-fenil)fenilmetiléter (DMTr-OR), tri(para-metoxi-fenil)fenilmetiléter (TMTr-OR), 4-(4'-bromo-fenaciloxi)fenildifenilmetiléter, 4,4',4''-tris(4,5-dicloroformilido-fenil)metiléter (CPTTr-OR), 4,4',4''-tris(benzoiloxifenil)-metiléter (TBTr-OR), 4,4'-dimetoxi-3''-[N-(imidazolilmetil)]-trilitéter (IDTr-OR), 4,4'-dimetoxi-3''-[N-(imidazolil-etil)carbamoil]trilitéter (IETr-OR), 1,1-bis(4-metoxi-fenil)-1'-pirenil-metiléter (Bmpm-OR), 9-antriléter, 9-(9-fenil)xanteniléter (pixil-OR), 9-(9-fenil-10-oxo)antril(tritilon-éter), 4-metoxi-tetrahidropiraniléter (MTHP-OR), 4-metoxi-tetrahidrotiopiraniléter, S,S-dióxido de 4-metoxi-tetrahidrotiopirano, 1-[(2-cloro-4-metil)fenil]-4-metoxipiperidin-4-il-éter (CTMP-OR), 1-(2-fluorofenil)-4-metoxipiperidin-4-il-éter (Fpmp-OR), 1,4-dioxan-2-il-éter, tetrahidrofuraniléter, tetrahidrotiofuraniléter, 2,3,3a,4,5,6,7,7a-octahidro-7,8,8-trimetil-4,7-metanbenzofuran-2-il-éter (MBF-OR), t-butiléter, aliléter, propargiléter, para-cloro-feniléter, para-metoxi-feniléter, para-nitro-feniléter, para-2,4-dinitro-feniléter (DNP-OR), 2,3,5,6-tetrafluoro-4-(trifluorometil)feniléter, benciléter (Bn-OR));

40 del tipo de un benciléter sustituido (por ejemplo, para-metoxi-benciléter (MPM-OR), 3,4-dimetoxi-benciléter (DMPM-OR), orto-nitro-benciléter, para-nitro-benciléter, para-halo-benciléter, 2,6-dicloro-benciléter, para-aminoacil-benciléter (PAB-OR), para-azido-benciléter (Azb-OR), 4-azido-3-cloro-benciléter, 2-trifluorometil-benciléter, para-(metilsulfonil)benciléter (Msib-OR));

45 del tipo de un sililéter (por ejemplo, trimetilsililéter (TMS-OR), trietilsililéter (TES-OR), trisopropilsililéter (TIPS-OR), dimetilisopropilsililéter (IPDMS-OR), dietilisopropilsililéter (DEIPS-OR), dimetilhexilsililéter (TDS-OR), t-butildimetilsililéter (TBDMS-OR), t-butildifenilsililéter (TBDPS-OR), tribencilsililéter, tri-para-xililsililéter, trifenilsililéter (TPS-OR), difenilmetilsililéter (DPMS-OR), di-t-butilmetilsililéter (DTBMS-OR), tris(trimetilsilil)sililéter (sisiléter), di-t-butilmetilsililéter (DTBMS-OR), tris(trimetilsilil)sililéter (sisiléter), (2-hidroxiestiril)-dimetilsililéter (HSDMS-OR), (2-hidroxiestiril)diisopropilsililéter (HSDIS-OR), t-butilmetoxifenil-sililéter (TBMPS-OR), t-butoxidifenilsililéter (DPTBOS-OR));

50 del tipo de un éster (por ejemplo, éster de formiato, éster de benzoilformiato, éster de acetato (Ac-OR), éster de cloroacetato, éster de dicloroacetato, éster de tricloroacetato, éster de trifluoroacetato, (TFA-OR), metoxiacetato, éster de trifenilmetoxiacetato, éster de fenoxiacetato, éster de para-cloro-fenoxiacetato, éster de fenilacetato, éster de difenilacetato (DPA-OR), nicotinato, éster de 3-fenil-propionato, éster de 4-pentoato, éster de 4-oxo-pentoato (levulinato) (Lev-OR) éster de 4,4-(etilenditio)-pentanoato (LevS-OR), éster de 5-[3-bis(4-metoxifenil)hidroxi-metoxifenoxi]-levulinato, éster de pivaloato (Pv-OR), éster de 1-adamantanoato, éster de crotonato, éster de 4-metoxi-crotonato, éster de benzoato (Bz-OR), éster de para-fenil-benzoato, éster de 2,4,6-

trimetil-benzoato (mesitoato), éster de 4-(metiltiometoxi)-butirato (MTMB-OR), éster de 2-(metiltiometoximetil)-benzoato (MTMT-OR),

del tipo de un carbonato (por ejemplo, carbonato de metilo, carbonato de metoximetilo, metilcarbonato de 9-fluorenilo (Fmoc-OR), carbonato de etilo, carbonato de 2,2,2-tricloroetilo (Troc-OR), carbonato de 1,1-dimetil-2,2,2-tricloro-etilo (TCBOC-OR), carbonato de 2-(trimetilsilil)etilo (TMS-OR), carbonato de 2-(fenilsulfonil)-etilo (Ps-OR), carbonato de 2-(trifenilfosfonio)-etilo (Peoc-OR), carbonato de t-butilo (Boc-OR), carbonato de isobutilo, carbonato de vinilo, carbonato de alilo (Alloc-OR), carbonato de para-nitro-fenil, carbonato de bencilo (Z-OR), carbonato de para-metoxi-bencilo, carbonato de 3,4-dimetoxi-bencilo, carbonato de orto-nitro-bencilo, carbonato de para-nitro-bencilo, carbonato de 2-dansiletilo (Dnseoc-OR), carbonato de 2-(4-nitrofenil)etilo (Npeoc-OR), carbonato de 2-(2,4-dinitrofenil)etilo (Dnpeoc)), y

del tipo de un éster (por ejemplo, alilsulfonato (Als-OR), metanosulfonato (Ms-OR), bencilsulfonato, tosilato (Ts-OR), 2-[(4-nitrofenil)etil]sulfonato (Npes-OR)).

Como catalizadores para la realización de una hidrogenación catalítica en el procedimiento de acuerdo con la invención son adecuados todos los catalizadores de hidrogenación habituales como, por ejemplo, catalizadores de platino (por ejemplo, placa de platino, esponja de platino, negro de platino, platino coloidal, óxido de platino, alambre de platino), catalizadores de paladio (por ejemplo, esponja de paladio, negro de paladio, óxido de paladio, carbón de paladio, paladio coloidal, paladio-sulfato de bario, paladio-carbonato de bario, hidróxido de paladio, catalizadores de níquel (por ejemplo, níquel reducido, óxido de níquel, níquel Raney), catalizadores de rutenio, catalizadores de cobalto (por ejemplo, cobalto reducido, cobalto Raney), catalizadores de cobre (por ejemplo, cobre reducido, cobre Raney, cobre Ullmann). Se prefiere usar catalizadores de metales preciosos (por ejemplo, catalizadores de platino y paladio o rutenio), que se usa dado el caso sobre un vehículo adecuado (por ejemplo, carbono o silicio), catalizadores de rodio (por ejemplo, cloruro de tris(trifenilfosfin)rodio (I) en presencia de trifenilfosfina). Además se pueden usar "catalizadores de hidrogenación quirales" (por ejemplo, aquellos que contienen ligandos de difosfina quiral como (2S,3S)-(-)-2,3-bis(difenilfosfino)-butano [(S,S)-quirafós] o (R)-(+)-2,2'- o bien (S)-(-)-2,2'-bis(difenilfosfino)-1,1'-binaftalina [R(+)-BINAP o bien S(-)-BINAP]), con lo que aumenta la proporción de un isómero en la mezcla de isómeros o bien la generación de otro isómero se elimina casi por completo.

La preparación de sales de compuestos de acuerdo con la invención se realiza según procedimientos convencionales. Sales de adición de ácido representativas son, por ejemplo, aquellas que se forman mediante reacción con ácidos inorgánicos como, por ejemplo, ácido sulfúrico, ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido fosfórico o ácidos carboxílicos orgánicos como ácido acético, ácido trifluoroacético, ácido cítrico, ácido succínico, ácido butírico, ácido láctico, ácido fórmico, ácido fumárico, ácido maleico, ácido malónico, ácido canfórico, ácido oxálico, ácido ftálico, ácido propiónico, ácido glicólico, ácido glutárico, ácido esteárico, ácido salicílico, ácido sorbínico, ácido tartárico, ácido cinámico, ácido valeriánico, ácido picrínico, ácido benzoico o ácidos sulfónicos orgánicos como ácido metansulfónico y ácido 4-toluensulfónico.

Son representativas también sales de compuestos de acuerdo con la invención, que se forman a partir de bases orgánicas como, por ejemplo, piridina o trietilaminas o aquellas que se forman a partir de bases inorgánicas como, por ejemplo, hidruros, hidróxidos, o carbonatos de sodio, litio, calcio, magnesio o bario, si los compuestos de fórmula general (I) presentan un elemento de estructura adecuado para esta formación de sal.

Se conocen procedimientos de síntesis para la síntesis de N-óxidos y t-aminas. Estas pueden obtenerse con peroxiácidos (por ejemplo, ácido peracético y ácido meta-cloro-perbenzoico (MCPBA), peróxido de hidrógeno), hidroperóxidos de alquilo (por ejemplo, hidroperóxido de t-butilo), perborato de sodio y dioxirano (por ejemplo, dimetildioxirano). Estos procedimientos se describen, por ejemplo, por parte de T. L. Gilchrist, en *Comprehensive Organic Synthesis*, vol. 7, páginas 748-750, 1992, S. V. Ley, (Ed.), Pergamon Press; M. Tisler, B. Stanovnik, en *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, vol. 3, páginas 18-20, 1984, A. J. Boulton, A. McKillop, (Eds.), Pergamon Press; M. R. Grimmett, B. R. T. Keene en *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 43, páginas 149-163, 1988, A. R. Katritzky, (Ed.), Academic Press; M. Tisler, B. Stanovnik, en *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 9, páginas 285-291, 1968, A. R. Katritzky, A. J. Boulton (Eds.), Academic Press; G. W. H. Cheeseman, E. S. G. Werstiuk en *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 22, páginas 390-392, 1978, A. R. Katritzky, A. J. Boulton, (Eds.), Academic Press.

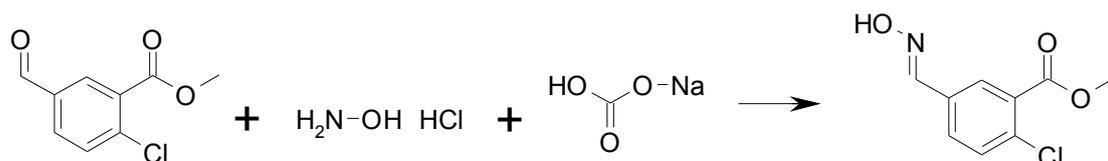
## Parte experimental

### Procedimiento de preparación A

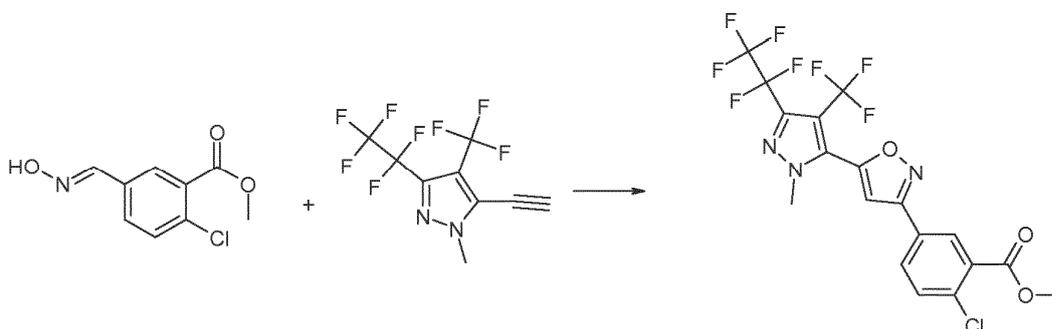
#### Descripciones de los ensayos:

Ejemplo lap-1:

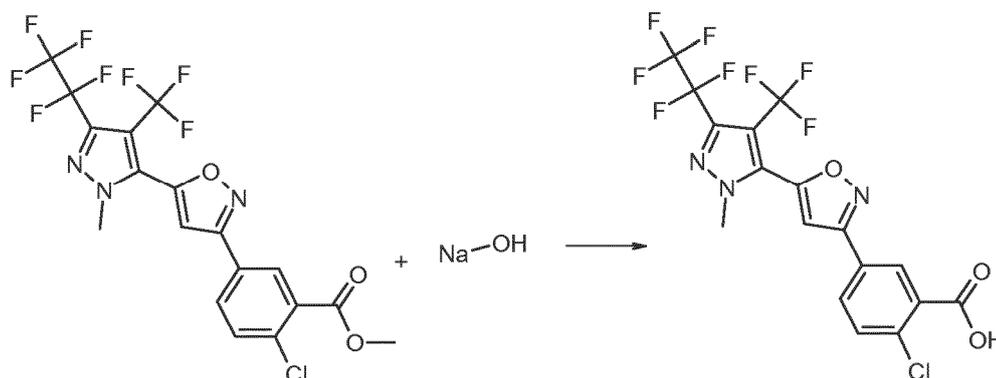
La preparación de 4-cloro-3-carbometoxi-benzaldehído ya se describe en la literatura (documento WO2010011584, páginas 19-20; Molinaro, Carmela; Roy, Amelie; Lau, Stefen; Trinh, Tao; Angelaud, Remy; O'Shea, Paul D.; Shultz, Scott; Cameron, Mark; Corley, Ed; Steinhuebel, Dietrich; Weisel, Mark; Krska, Shane; Abele, Stefan; Funel, Jacques-Alexis *Journal of Organic Chemistry*, **76** (2011) 1062 – 1071; WO2012114268, página 137).



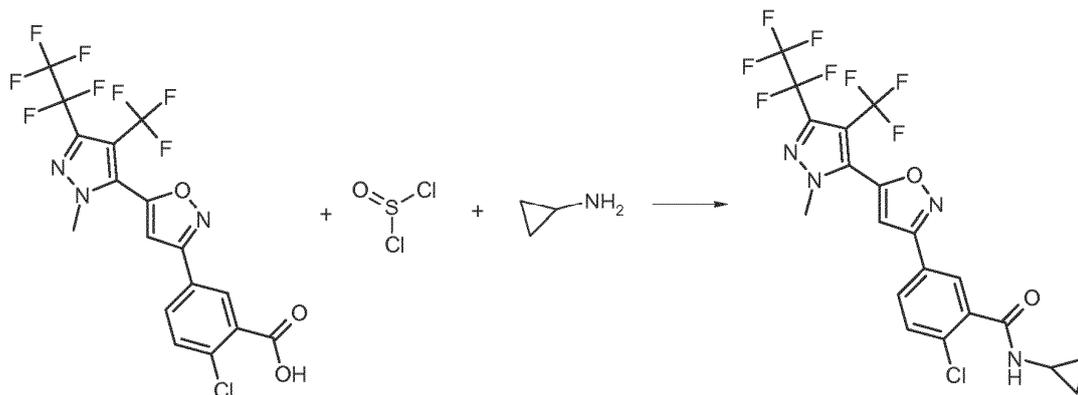
5 4,1 g (20,6 mmol) de 4-cloro-3-carbometoxi-benzaldehído se disolvieron en 82 ml de metanol, se añadieron 1,734 g (20,6 mmol) de hidrógeno-carbonato de sodio y se enfriaron hasta 0 °C. Luego se añadieron 5,738 g (82,5 mmol) de clorhidrato de hidroxilamina y se agitó durante 2,5 horas a temperatura ambiente. Para la elaboración, se evaporó luego al vacío en el evaporador rotativo y se extrajo en 100 ml de acetato de etilo. El sólido se filtró y el filtrado se evaporó al vacío en el evaporador rotativo. El residuo se cromatografió luego para purificar sobre un cartucho con 120 g de gel de sílice por medio de un gradiente en ciclohexano/acetato de etilo 9:1 a 7:3 (v/v) y dio como resultado 2,68 g de 2-cloro-5-[(hidroxiimino)metil]benzoato de metilo.



10 1,1 g (5,14 mmol) de 2-cloro-5-[(hidroxiimino)metil]benzoato de metilo se dispusieron en 15 ml de dimetilformamida y se añadieron 756 mg (5,66 mmol) de N-cloro-succinimida. Se agitaron durante 3,5 horas a temperatura ambiente, luego se añadieron otros 190 mg (1,42 mmol) de N-cloro-succinimida y se agitaron durante otras 2 horas a temperatura ambiente. La mezcla luego se enfrió hasta 0 °C y se añadió gota a gota una solución de 1,5 g (5,14 mmol) de 5-etinil-1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol en 5 ml de dimetilformamida y luego se  
 15 añadieron 1,15 g (11,39 mmol) de trietilamina. La preparación se agitó durante la noche a temperatura ambiente. Para la elaboración, se añadió agua y se extrajo dos veces con diclorometano. Los extractos combinados se lavaron cuatro veces con agua, se secaron con sulfato de sodio y se evaporaron al vacío en el evaporador rotativo. El residuo se cromatografió sobre un cartucho con 40 g de gel de sílice y un gradiente de ciclohexano puro según ciclohexano/acetato de etilo 8:2 (v/v). Se obtuvieron 0,57 g de 2-cloro-5-{5-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]-1,2-oxazol-3-il}benzoato de metilo.  
 20



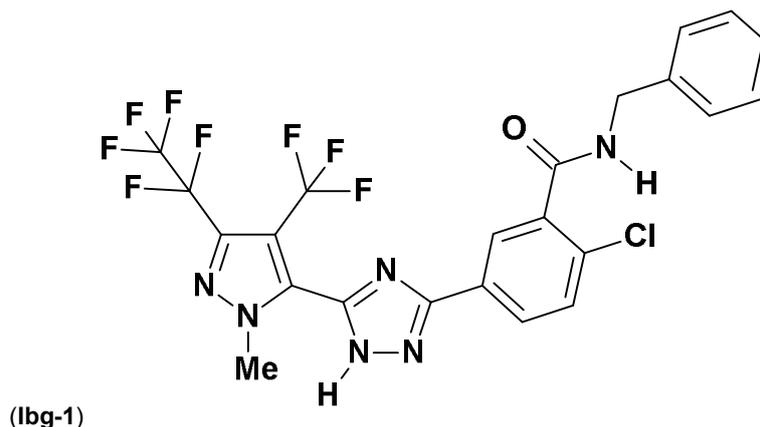
25 0,5 g (1,11 mmol) de 2-cloro-5-{5-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]-1,2-oxazol-3-il}benzoato de metilo se dispusieron en 28 ml de metanol y se añadieron 1,11 ml (1,11 mmol) de lejía de sosa 1 M. Se calentó luego durante 6 horas a reflujo. Luego se evaporó en el evaporador rotativo al vacío. El residuo se acidificó con ácido clorhídrico acuoso diluido y se extrajo tres veces con acetato de etilo, los extractos combinados se lavaron luego una vez con solución saturada de cloruro de sodio, se secaron con sulfato de sodio y se evaporaron en el evaporador rotativo al vacío. Como residuo se obtuvieron 0,54 g de ácido 2-cloro-5-{5-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]-1,2-oxazol-3-il}benzoico.

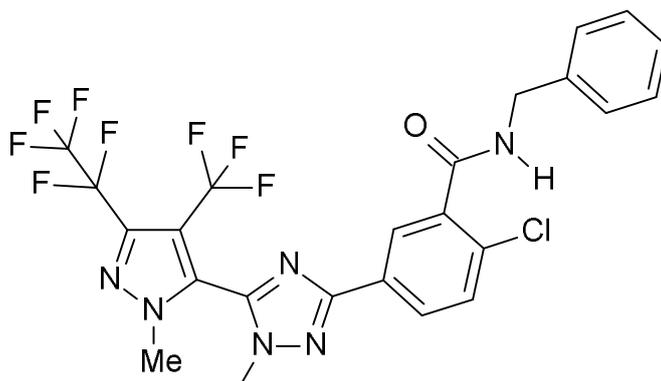


0,1 g (0,2 mmol) de ácido 2-cloro-5-{5-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]-1,2-oxazol-3-il}benzoico se disolvieron en 1 ml de tolueno y se añadieron 122 mg (1,02 mmol) de cloruro de tionilo. La preparación se calentó durante 2 horas a 80 °C y luego se evaporó al vacío en el evaporador rotativo. Para separar los restos de cloruro de tionilo, se añadió luego 1 ml de tolueno seco y se volvió a evaporar. Se diluyó luego el residuo en 0,5 ml de diclorometano y la solución se vertió gota a gota a una solución de 29 mg (51 mmol) de cicloproilamina en 0,5 ml de diclorometano a 0 °C. Luego se agitó durante una hora sin enfriamiento. Para la elaboración, se lavó la mezcla con solución acuosa al 5 % de NaH<sub>2</sub>PO<sub>4</sub>, se secó con sulfato de sodio y se evaporó al vacío en el evaporador rotativo. El residuo se purificó a través de un cartucho de 40 g con gel de sílice y un gradiente de ciclohexano/acetato de etilo 9:1 a ciclohexano/acetato de etilo 7:3 (v/v). Se obtuvieron 63 mg de 2-cloro-N-ciclopropil-5-{5-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]-1,2-oxazol-3-il}benzamida. HPLC-MS<sup>a</sup>): logP = 4,06, masa (m/z) = 529 [M+H]<sup>+</sup>. <sup>1</sup>H-RMN (400 MHz, d<sub>3</sub>-acetronitrilo): δ = 7,97 (s, 1 H), 7,95-7,96 (dd, J<sub>1</sub>=7,4 Hz, J<sub>2</sub>=1,5 Hz, 1 H), 7,6-7,62 (dd, J<sub>1</sub>=7,4 Hz, J<sub>2</sub>=1,5 Hz, 1H), 7,31 (s, 1 H), 7,02 (s (breit), 1 H (N-H)), 3,97 (s, 3 H), 2,83-2,88 (m, 1H), 0,76-0,8 (m, 2 H), 0,586-0,625 (m, 2 H).

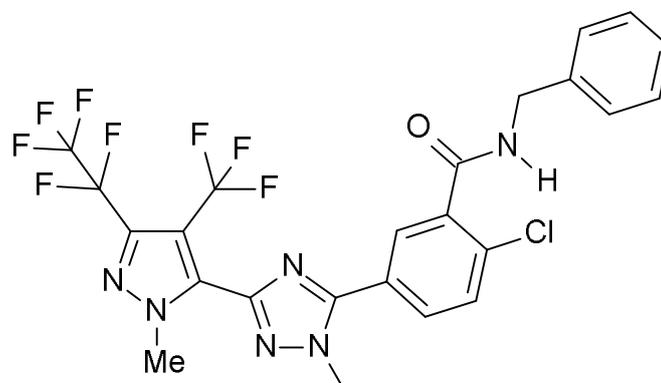
#### Procedimiento de preparación B

Síntesis de N-bencil-3-{5-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]-1H-1,2,4-triazol-3-il}benzamida (**lb-g-1**), N-bencil-3-{1-metil-5-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]-1H-1,2,4-triazol-3-il}benzamida (**lb-g-15**) y N-bencil-3-{1-metil-3-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]-1H-1,2,4-triazol-5-il}benzamida (**lb-h-2**).





(lbg-15)



(lbh-2)

## 5 Etapa 1

8,4 g de 1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carboxilato de metilo (25,7 mmol) se disolvieron en 50,0 mL de etanol p.a. y luego se mezclaron gota a gota con 12,5 mL de hidrato de hidrazina (257 mmol). La mezcla de reacción se calentó durante 16 h a reflujo. La mezcla de reacción enfriada se diluyó con 50,0 mL de agua. El etanol se eliminó en el evaporador rotativo a presión reducida. La fase acuosa se extrajo luego tres veces con 50,0 mL de acetato de etilo por vez. Las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtraron y luego se concentraron en el evaporador rotativo hasta sequedad.

Se aislaron 7,80 g de 1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carbohidrazida como sólido incoloro. El producto crudo se siguió haciendo reaccionar sin purificación.

HPLC-MS<sup>2</sup>: logP = 2,12, masa (m/z) = 327 [M+H]<sup>+</sup>.

<sup>1</sup>H-RMN (400 MHz, d<sub>3</sub>-acetónitrilo): δ = 10,15 (s, 1H), 4,81 (s, 2H), 3,92 (s, 3H).

## Etapa 2

200 mg de 1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carbohidrazida (0,61 mmol), 290 mg de N-bencil-3-cianbenzamida (1,22 mmol) y 42 mg de carbonato de potasio (0,3 mmol) se suspendieron en 4,00 ml de n-butan-1-ol y luego se calentaron durante 2 h a 150 °C en el microondas. La solución de reacción se evaporó en el evaporador rotativo hasta sequedad. El residuo se mezcló dos veces con tolueno y se concentró otra vez hasta sequedad. El producto crudo se purificó por medio de MPLC en sílice.

Se aislaron 130 mg de N-bencil-3-{5-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]-1H-1,2,4-triazol-3-il}benzamida (lbg-1) como sólido incoloro.

HPLC-MS<sup>2</sup>: logP = 3,80, masa (m/z) = 545 [M+H]<sup>+</sup>.

<sup>1</sup>H-RMN (400 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ = 15,37 (s, 1H), 9,24 (t, 1H), 8,58 (s, 1H), 8,20 (d, 1H), 8,07 (d, 1H), 7,71 (t, 1H), 7,22-7,36 (m, 5H), 4,52 (d, 2H), 4,08 (s, 3H).

## Etapa 3

Se disolvieron 102 mg (0,18 mmol) de N-bencil-3-{5-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]-1H-

5 1,2,4-triazol-3-il}benzamida (**ibg-1**) en 4 mL de THF p.a. y luego se mezclaron bajo enfriamiento con baño de hielo de forma sucesiva con 52 mg (0,36 mmol) de carbonato de potasio y 26,6 mg (0,18 mmol) de yoduro de metilo. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 14 h y luego se diluyó con agua. La fase acuosa se extrajo varias veces con acetato de metilo. Las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio, se filtraron y se concentraron en el evaporador rotativo a presión reducida. El producto crudo se purificó por medio de MPLC en gel de sílice.

Se aislaron 35 mg de N-bencil-3-{1-metil-5-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]-1H-1,2,4-triazol-3-il}benzamida (**ibg-15**).

HPLC-MS<sup>9</sup>: logP = 4,24, masa (m/z) = 559 [M+H]<sup>+</sup>.

10 <sup>1</sup>H-RMN (400 MHz, d3-acetonitrilo): δ = 8,53 (d, 1H), 8,23 (d, 1H), 7,80 (d, 1H), 7,67 (s, 1H), 7,59 (t, 1H), 7,39-7,32 (m, 3H) 7,29-7,24 (m, 1H), 4,57 (d, 2H), 3,87 (s, 3H), 3,85 (s, 3H).

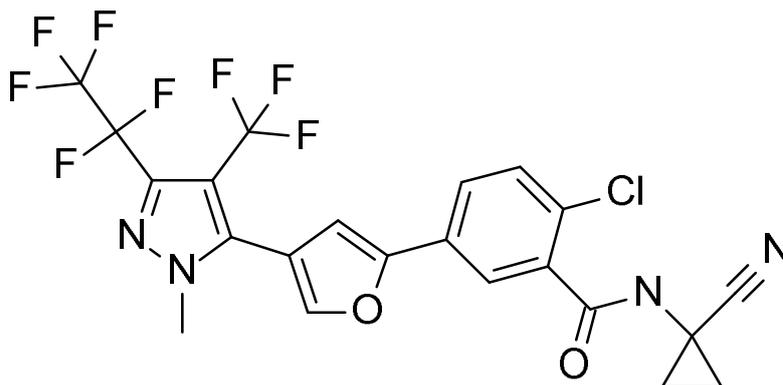
Se aislaron 11 mg de N-bencil-3-{1-metil-3-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]-1H-1,2,4-triazol-5-il}benzamida (**ibh-2**).

HPLC-MS<sup>9</sup>: logP = 4,16, masa (m/z) = 559 [M+H]<sup>+</sup>.

15 <sup>1</sup>H-RMN (400 MHz, d3-acetonitrilo): δ = 8,23-8,22 (m, 1H), 8,02-8,00 (m, 1H), 7,96-7,93 (m, 1H), 7,70-7,66 (m, 2H), 7,40-7,34 (m, 3H), 7,29-7,25 (m, 1H), 4,58 (d, 2H), 4,06 (s, 3H), 4,03 (s, 3H).

### Procedimiento de preparación C

Síntesis de 2-cloro-N-(1-cianiciclopropil)-5-{4-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]-2-furil}benzamida (Iac-1)



20 Etapa 1

6,50 g (44,2 mmol) de 3-bromofurano se dispusieron a -78 °C en 65,0 mL de tetrahidrofurano absoluto y luego se mezclaron con 27,6 mL (44,2 mmol) de solución 1,6 M de n-butil-litio. La mezcla de reacción se agitó durante 15 minutos a -65 °C y luego se mezcló a -65 °C con una solución de 12,7 g (44,2 mmol) de 5-fluoro-1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol en 20,0 mL de tetrahidrofurano absoluto. La mezcla de reacción se calentó hasta temperatura ambiente. Después de 2 horas a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se neutralizó cuidadosamente con agua. El tetrahidrofurano se eliminó a presión reducida en el evaporador rotativo. La fase acuosa se extrajo luego varias veces con cloroformo. Las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio, se filtraron y se concentraron en el evaporador rotativo a presión reducida. El producto crudo se purificó por medio de MPLC en sílice.

25 30

Se aislaron 4,00 g de 5-(3-furil)-1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol.

GC-MS: índice = 1276, masa (m/z) = 334 [M]<sup>+</sup>.

<sup>1</sup>H-RMN (400 MHz, d6-DMSO): δ = 8,15 (s, 1H), 7,93-7,95 (m, 1H), 6,81 (s, 1H), 3,85 (s, 3H).

### Etapa 2

35 2,00 g (5,99 mmol) de 5-(3-furil)-1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol disueltos en 20,0 mL de THF pa se mezclaron con 1,28 g (7,19 mmol) de N-bromosuccinimida. La mezcla de reacción se calentó durante 2 h a uf 50 °C. Después de enfriar hasta temperatura ambiente, la mezcla de reacción se mezcló con una solución acuosa de hidrógeno-sulfito de sodio. La mezcla se extrajo varias veces con cloroformo. Las fases orgánicas combinadas se concentraron en el evaporador rotativo y el producto crudo obtenido por medio de MPLC en sílice.

40 Se aisló 1,00 g de 5-(5-bromo-3-furil)-1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol con una pureza del 55 % según LCMS.

HPLC-MS<sup>9</sup>: logP = 4,49, masa (m/z) = 415 [M+H]<sup>+</sup>.

## Etapa 3

1,04 g (2,52 mmol) de 5-(5-bromo-3-furil)-1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1*H*-pirazol, 747 mg (2,52 mmol) de 2-cloro-5-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)benzoato de metilo y 145 mg (0,13 mmol) de tetrakis(trifenilfosfina)paladio (0) se mezclaron bajo atmósfera de gas de protección con 31,2 mL de 2-propanol y 7,68 mL de hidrógeno-carbonato de sodio acuoso 1 M. Ambos disolventes se saturaron con argón antes de su uso, introduciendo argón al menos durante 15 minutos a través de los disolventes. La mezcla de reacción se agitó durante 7 h a 90 °C y luego durante 14 h a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se concentró por medio de evaporador rotativo a presión reducida hasta sequedad. El residuo se extrajo en una mezcla de cloroformo y agua. La fase acuosa se extrajo tres veces con cloroformo. Las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio, se filtraron y se concentraron en el evaporador rotativo a presión reducida. El producto crudo se purificó por medio de MPLC en sílice.

Se aislaron 350 mg de 2-cloro-5-{4-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-5-il]-2-furil}benzoato de metilo.

HPLC-MS<sup>a</sup>): logP = 5,20, masa (m/z) = 503 [M+H]<sup>+</sup>.

## Etapa 4

Se disolvieron 200 mg (0,40 mmol) de 2-cloro-5-{4-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-5-il]-2-furil}benzoato de metilo en una mezcla de 1,43 mL de agua y 11,4 mL de metanol. La solución se mezcló con 19 mg (0,79 mmol) de hidróxido de litio y se calentó durante 30 minutos a 50 °C. La mezcla de reacción se agitó luego durante 14 h a temperatura ambiente. El metanol se eliminó en el evaporador rotativo a presión reducida. El valor pH de la mezcla de reacción se reguló luego con ácido clorhídrico al 10 % a 1-2. El precipitado producido se envejeció durante 1 h a temperatura ambiente y luego se filtró. El sólido se lavó tres veces con agua y luego se secó.

Se aislaron 170 mg de ácido 2-cloro-5-{4-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-5-il]-2-furil}benzoico como sólido incoloro.

HPLC-MS<sup>a</sup>): logP = 4,13, masa (m/z) = 489 [M+H]<sup>+</sup>.

<sup>1</sup>H-RMN (400 MHz, d6-DMSO): δ = 8,29 (s, 1H), 8,15 (d, 1H), 7,91 (dd, 1H), 7,66 (d, 1H), 7,46 (s, 1H), 3,92 (s, 3H).

## Etapa 5

85 mg (0,17 mmol) de ácido 2-cloro-5-{4-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-5-il]-2-furil}benzoico se disolvieron en 2 mL de N,N-dimetilformamida pa y se mezclaron con 61,4 mg (0,19 mmol) de TBTU. Después de 5 minutos, se añadieron 91 µL (0,52 mmol) de N,N-diisopropil-etilamina y 22,7 mg (0,19 mmol) de clorhidrato de 1-aminociclopropancarbonitrilo (1:1). La mezcla de reacción se agitó durante 1 h a temperatura ambiente y 5 minutos a 50 °C. La mezcla de reacción se purificó sin ulterior elaboración por medio de MPLC en RP18 gel de sílice.

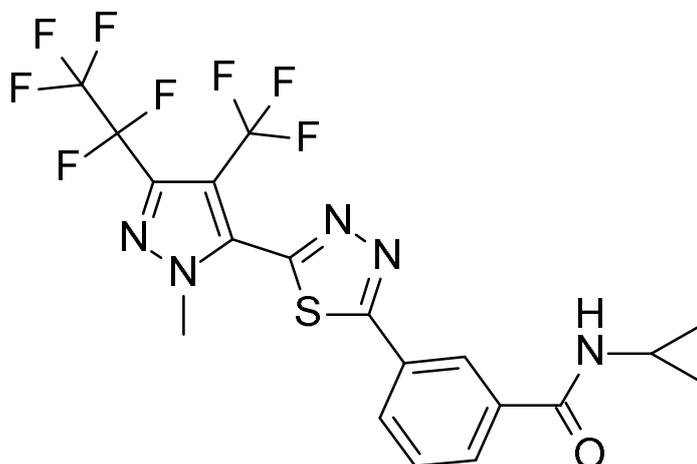
Se aislaron 40 mg de 2-cloro-N-(1-cianciclopropil)-5-{4-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-5-il]-2-furil}benzamida (Iaj-1).

HPLC-MS<sup>a</sup>): logP = 4,02, masa (m/z) = 553 [M+H]<sup>+</sup>.

<sup>1</sup>H-RMN (600 MHz, d3-acetonitrilo): δ = 7,86 (s, 1H), 7,83 (d, 1H), 7,80 (dd, 1H), 7,58 (s, 1H), 7,55 (d, 1H), 7,05 (s, 1H), 3,83 (s, 3H), 1,56-1,59 (m, 2H), 1,34-1,36 (m, 2H).

## Procedimiento de preparación D

Síntesis de N-ciclopropil-3-{5-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-5-il]-1,3,4-tiadiazol-2-il}benzamida (Iaj-1)



## Etapa 1

300 mg (0,92 mmol) de 1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-5-carbohidrazida y 166 mg (0,92 mmol) de ácido 3-(metoxicarbonil)benzoico se disolvieron en 10,5 mL de diclorometano y se enfriaron hasta 0 °C. Se añadieron 135 mg (1,10 mmol) de DMAP y 194 mg (1,01 mmol) de EDCI y luego se agitaron durante 2 h bajo enfriamiento con hielo y durante 14 h a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se diluyó con diclorometano y de forma sucesiva con solución acuosa de hidrógeno-carbonato de sodio, se lavó con solución acuosa al 10 % de ácido cítrico. El producto generado se filtró y se secó.

Se aislaron 230 mg de 3-[(2-[[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-5-il]carbonil]hidrazino)carbonil]benzoato de metilo como sólido incoloro.  
 HPLC-MS<sup>9</sup>: logP = 2,06, masa (m/z) = 489 [M+H]<sup>+</sup>.  
<sup>1</sup>H-RMN (400 MHz, d6-DMSO): δ = 8,55 (s, 1H), 8,19-8,21 (m, 2H), 7,72 (t, 1H), 4,17 (s, 3H), 3,92 (s, 3H).

## Etapa 2

200 mg (0,41 mmol) de 3-[(2-[[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-5-il]carbonil]hidrazino)carbonil]benzoato de metilo y 190 mg (0,47 mmol) de 2,4-bis(4-metoxifenil)-1,3,2,4-ditiadifosfetan-2,4-disulfuro (reactivo de Lawesson) se disolvieron en un recipiente de microondas en 2,6 mL de tolueno y se calentaron durante 12 h a 120 °C de temperatura del baño de aceite. La mezcla de reacción se filtró y el filtrado se diluyó con 5 mL de diclorometano. La fase orgánica se lavó una vez con solución acuosa saturada de hidrógeno-carbonato de sodio. La mezcla de reacción se concentró en el evaporador rotativo hasta sequedad. El producto crudo se purificó por medio de MPLC en gel de sílice.

Se obtuvieron 140 mg de 3-{5-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-5-il]-1,3,4-tiadiazol-2-il}benzoato de metilo como sólido casi incoloro.  
 HPLC-MS<sup>9</sup>: logP = 3,93, masa (m/z) = 487 [M+H]<sup>+</sup>.  
<sup>1</sup>H-RMN (400 MHz, d6-DMSO): δ = 8,61 (s, 1H), 8,38 (d, 1H), 8,21 (d, 1H), 7,80 (t, 1H), 3,98 (s, 3H), 3,94 (s, 3H).

## Etapa 3

120 mg (0,25 mmol) de 3-{5-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-5-il]-1,3,4-tiadiazol-2-il}benzoato de metilo se disolvieron en una mezcla 1:1 de THF y agua y se mezclaron con una solución de 21 mg (0,49 mmol) de hidróxido de litio monohidrato en 1 mL de agua. La mezcla de reacción se agitó durante 14 h a temperatura ambiente y luego se concentró en el evaporador rotativo. El residuo se extrajo varias veces con éter terc-butil-metílico. Las fases orgánicas combinadas se concentraron en el evaporador rotativo hasta sequedad.

Se aislaron 114 mg de ácido 3-{5-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-5-il]-1,3,4-tiadiazol-2-il}benzoico.  
 HPLC-MS<sup>9</sup>: logP = 3,58, masa (m/z) = 473 [M+H]<sup>+</sup>.  
<sup>1</sup>H-RMN (400 MHz, d6-DMSO): δ = 8,49 (s, 1H), 8,10 (d, 1H), 8,06 (d, 1H), 7,53 (t, 1H), 3,98 (s, 3H).

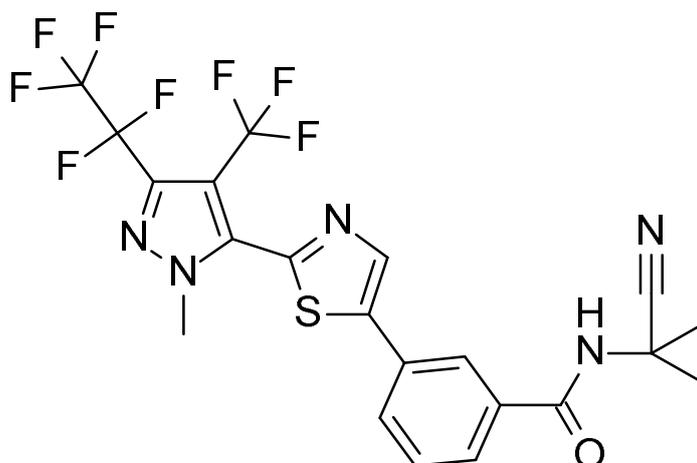
## Etapa 4

90 mg (0,19 mmol) de ácido 3-{5-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-5-il]-1,3,4-tiadiazol-2-il}benzoico y 11 mg (0,19 mmol) de ciclopropilamina se disolvieron en 1,5 mL de diclorometano y se enfriaron hasta 0 °C. Se añadieron 28 mg (0,23 mmol) de DMAP y 40 mg (0,21 mmol) de EDCI y luego se agitaron durante 2 h bajo enfriamiento con hielo y durante 14 h a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se diluyó con diclorometano y se lavaron de forma sucesiva con solución acuosa de hidrógeno-carbonato de sodio, solución acuosa al 10 % de ácido cítrico. El producto crudo se purificó por medio de MPLC en gel de sílice.

Se aislaron 42 mg de *N*-ciclopropil-3-{5-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-5-il]-1,3,4-tiadiazol-2-il}benzamida (**1aj-1**).  
 HPLC-MS<sup>9</sup>: logP = 3,72, masa (m/z) = 512 [M+H]<sup>+</sup>.  
<sup>1</sup>H-RMN (400 MHz, d6-DMSO): δ = 8,74 (d, 1H), 8,49 (s, 1H), 8,25 (d, 1H), 8,08 (d, 1H), 7,71 (t, 1H), 3,97 (s, 3H), 2,87-2,92 (m, 1H), 0,71-0,76 (m, 2H), 0,58-0,63 (m, 2H).

## Procedimiento de preparación E

Síntesis de *N*-(1-Cianciclopropil)-3-{2-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-5-il]-1,3-tiazol-5-il}benzamida (**1aq-1**)



## Etapa 1

Se suspendieron 5,00 g (16,0 mmol) de ácido 1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-5-carboxílico en 50 mL de diclorometano y se mezclaron con 2 gotas de dimetilformamida. Se vertió gota a gota una solución de 2,10 mL (24,0 mmol) de cloruro de oxalilo y 10 mL de diclorometano a la mezcla de reacción. La mezcla de reacción se calentó primero durante 3 h a temperatura ambiente y luego durante otros 5 minutos a 40 °C. Los disolventes se eliminaron con el evaporador rotativo. El residuo se disolvió en 5 mL de diclorometano y se vertió gota a gota con una solución al 33 % de amoníaco en agua enfriada con baño de hielo. La mezcla de reacción se agitó durante una hora a temperatura ambiente y luego se concentró hasta la mitad del volumen en el evaporador rotativo. El sólido producido se filtró y se secó.

Se aislaron 3,80 g de 1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-5-carboxamida como sólido incoloro. HPLC-MS<sup>a</sup>): logP = 2,33, masa (m/z) = 312 [M+H]<sup>+</sup>.

<sup>1</sup>H-RMN (400 MHz, d6-DMSO): δ = 8,55 (s, 1H), 8,43 (s, 1H), 3,95 (s, 3H).

## Segunda etapa

Se dispusieron 500 mg (1,61 mmol) de 1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-5-carboxamida en 12 mL de tolueno y se calentaron a 80 °C. A la mezcla de reacción se añadieron 390 mg (0,96 mmol) de 2,4-bis(4-metoxifenil)-1,3,2,4-ditiadifosfetan-2,4-disulfuro (reactivo de Lawesson). Después de 3 h, se calentó la mezcla de reacción de 80 °C a 95 °C y se agitó durante 14 h a esta temperatura. Después de enfriar, la mezcla de reacción se diluyó con acetato de etilo y se lavó una vez con solución acuosa saturada de hidrógeno-carbonato de sodio. La fase orgánica se evaporó en el evaporador rotativo hasta sequedad. El producto crudo se purificó por medio de MPLC en gel de sílice.

Se aislaron 300 mg de 1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-5-carbotioamida.

HPLC-MS<sup>a</sup>): logP = 2,92, masa (m/z) = 328 [M+H]<sup>+</sup>.

<sup>1</sup>H-RMN (400 MHz, d1-cloroforno): δ = 7,97 (s, 1H), 7,34 (s, 1H), 4,03 (s, 3H).

## Etapa 3

Se calentaron 100 mg (0,30 mmol) de 1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-5-carbotioamida, 119 mg (0,30 mmol) de 3-(bromacetil)benzoato de metilo y 24 mg (0,30 μmol) de piridina p.a. bajo atmósfera de gas de protección en etanol p.a. durante 6 h a reflujo. La mezcla de reacción se evaporó en el evaporador rotativo hasta sequedad y el producto crudo obtenido se purificó por medio de MPLC en gel de sílice.

Se aislaron 95 mg de 3-{2-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-5-il]-1,3-tiazol-5-il}benzoato de metilo.

HPLC-MS<sup>a</sup>): logP = 4,96, masa (m/z) = 486 [M+H]<sup>+</sup>.

<sup>1</sup>H-RMN (400 MHz, d1-cloroforno): δ = 8,59 (s, 1H), 8,17 (d, 1H), 8,08 (d, 1H), 7,93 (s, 1H), 7,56 (t, 1H), 4,04 (s, 3H), 3,97 (s, 3H).

## Etapa 4

Se disolvieron 85 mg (0,18 mmol) de 3-{2-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-5-il]-1,3-tiazol-5-il}benzoato de metilo en una mezcla de 4 mL de THF p.a. y 2 mL de agua destilada y se mezclaron con una solución de 15 mg (0,35 mmol) de hidróxido de litio monohidrato en 1,0 mL de agua destilada. La mezcla de reacción se agitó durante 14 h a temperatura ambiente. El THF se eliminó en el evaporador rotativo a presión reducida. La mezcla de reacción acuosa se acidificó bajo enfriamiento con hielo con ácido clorhídrico 1 N. El precipitado obtenido se filtró y

luego se secó.

Se aislaron 60 mg de ácido 3-{2-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]-1,3-tiazol-5-il}benzoico.

HPLC-MS<sup>a</sup>): logP = 4,04, masa (m/z) = 472 [M+H]<sup>+</sup>.

<sup>1</sup>H-RMN (400 MHz, d6-DMSO): δ = 8,76 (s, 1H), 8,58 (s, 1H), 8,27 (d, 1H), 7,98 (d, 1H), 7,64 (t, 1H), 3,99 (s, 3H).

#### 5 Etapa 5

Se suspendieron / disolvieron 40 mg (0,09 mmol) de ácido 3-{2-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]-1,3-tiazol-5-il}benzoico y 12 mg (0,10 mmol) de clorhidrato de 1-aminociclopropanocarbonitril (1:1) en 10,0 mL de diclorometano y se enfriaron hasta 0 °C. Se añadieron 25 mg (0,20 mmol) de DMAP y 18 mg (0,09 mmol) de EDCI y luego se agitaron durante 2 h bajo enfriamiento con hielo y durante 14 h a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se lavó de forma sucesiva con ácido clorhídrico 1 N y lejía de sosa 1 N. La fase orgánica se secó sobre sulfato de sodio, se filtró y se concentró en el evaporador rotativo a presión reducida hasta sequedad. El producto crudo se purificó por medio de MPLC en gel de sílice.

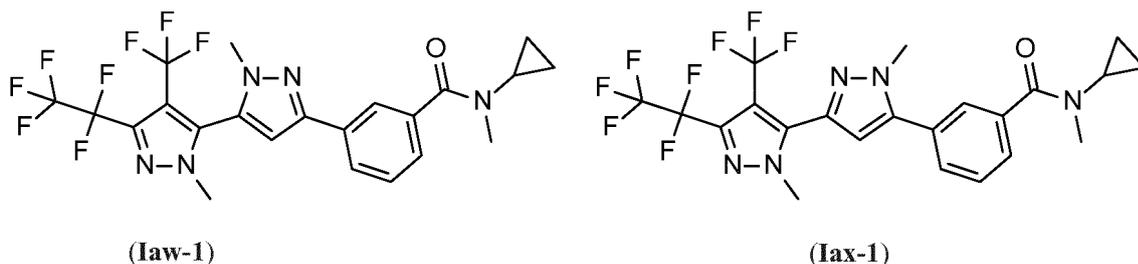
Se aislaron 23 mg de *N*-(1-Cianciclopropil)-3-{2-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]-1,3-tiazol-5-il}benzamida (**laq-1**).

15 HPLC-MS<sup>a</sup>): logP = 3,93, masa (m/z) = 536 [M+H]<sup>+</sup>.

<sup>1</sup>H-RMN (400 MHz, d6-DMSO): δ = 9,46 (s, 1H), 8,69 (s, 1H), 8,47 (s, 1H), 8,22 (d, 1H), 7,87 (d, 1H), 7,62 (t, 1H), 3,99 (s, 3H), 1,56-1,61 (m, 2H), 1,29-1,33 (m, 2H).

#### Procedimiento de preparación F

20 Síntesis de *N*-ciclopropil-3-[2,2'-dimetil-5'-(pentafluoroetil)-4'-(trifluorometil)-2*H*,2'*H*-3,3'-bipirazol-5-il]-*N*-metilbenzamida (**law-1**) y *N*-ciclopropil-3-[1,2'-dimetil-5'-(pentafluoroetil)-4'-(trifluorometil)-1*H*,2'*H*-3,3'-bipirazol-5-il]-*N*-metilbenzamida (**lax-1**)



#### Etapa 1

25 250 mg (1,15 mmol) de 3-acetil-*N*-ciclopropil-*N*-metilbenzamida se disolvieron en 5 mL de THF p.a. bajo atmósfera de gas de protección y se enfriaron hasta -78 °C. La solución de reacción se mezcló en un lapso de 20 minutos con 1,44 mL de una solución 2 M de diisopropilamida de litio en THF/heptano/etilbenceno. La mezcla de reacción se agitó durante 30 minutos a -78 °C y luego se mezcló con una solución de 418 mg de cloruro de 1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carbonilo recién preparado y codestilado varias veces con tolueno en THF p.a. La mezcla de reacción se agitó durante 1 h y a -78 °C y luego se calentó hasta temperatura ambiente.

30 Después de 30 minutos a temperatura ambiente, se neutralizó la reacción por adición de solución saturada de cloruro de amonio. La mezcla de reacción se extrajo varias veces con diclorometano. Las fases orgánicas combinadas se lavaron con solución saturada de cloruro de sodio, se secaron sobre sulfato de sodio y se filtraron. El disolvente se concentró en el evaporador rotativo. El producto crudo se purificó por medio de MPLC en gel de sílice.

35 Se aislaron 160 mg de *N*-ciclopropil-*N*-metil-3-{3-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]-3-oxopropanoil}benzamida con una pureza del 86 % (según LCMS).

HPLC-MS<sup>a</sup>): logP = 4,39, masa (m/z) = 512 [M+H]<sup>+</sup>.

#### Etapa 2

40 Se calentaron 100 mg (0,20 mmol) de *N*-ciclopropil-*N*-metil-3-{3-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]-3-oxopropanoil}benzamida y 9,01 mg (0,20 mmol) de *N*-metilhidrazina en 10 mL de etanol a reflujo. El disolvente se eliminó en el evaporador rotativo a presión reducida. El producto crudo se purificó por medio de MPLC en gel de sílice.

Se aislaron 16,0 mg de *N*-ciclopropil-3-[2,2'-dimetil-5'-(pentafluoroetil)-4'-(trifluorometil)-2*H*,2'*H*-3,3'-bipirazol-5-il]-*N*-metilbenzamida (**law-1**).

HPLC-MS<sup>a</sup>): logP = 3,94, masa (m/z) = 522 [M+H]<sup>+</sup>.

45 <sup>1</sup>H-RMN (400 MHz, d6-DMSO): δ = 7,85-7,92 (m, 2H), 7,47-7,51 (m, 2H), 7,27 (s, 1H), 3,86 (s, 3H), 3,76 (s, 3H), 2,99 (s, 3H), 0,33-0,63 (m, 4H).

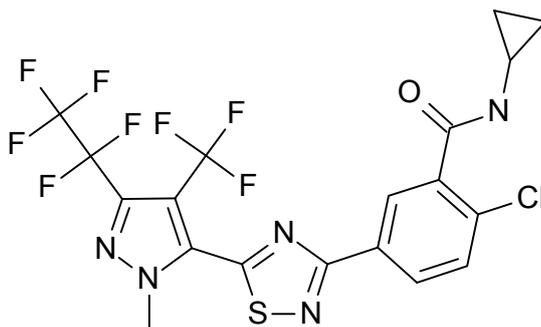
Además, se aislaron 11,0 mg de *N*-ciclopropil-3-[1,2'-dimetil-5'-(pentafluoroetil)-4'-(trifluorometil)-1*H*,2'*H*-3,3'-bipirazol-5-il]-*N*-metilbenzamida (**lax-1**).

HPLC-MS<sup>9</sup>): logP = 4,13, masa (m/z) = 522 [M+H]<sup>+</sup>.

<sup>1</sup>H-RMN (400 MHz, d6-DMSO): δ = 7,65-7,74 (m, 2H), 7,55-7,60 (m, 2H), 6,89 (s, 1H), 4,00 (s, 3H), 3,97 (s, 3H), 3,04 (s, 3H), 0,33-0,63 (m, 4H).

### Procedimiento de preparación G

Síntesis de 2-cloro-*N*-ciclopropil-5-{5-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-5-il]-1,2,4-tiadiazol-3-il}benzamida (**lbd-3**)



#### 10 Etapa 1

Se dispusieron de forma sucesiva 5,00 g (21,0 mmol) de 4-cloro-*N*-ciclopropilisoftalamida, 120 mL de una mezcla de 3:1 tolueno/1,4-dioxano, 2,50 g (18,09 mmol) de carbonato de potasio y 5,50 g (42,0 mmol) de cloro(clorosulfanil)oxometano en un matraz de tres bocas de 250 mL. La mezcla de reacción se agitó durante 2 h a 100 °C. Después de enfriar hasta temperatura ambiente, la reacción se neutralizó por adición de 200 mL de agua y el precipitado producido se filtró y se secó.

Se obtuvieron 2,99 g de 2-cloro-*N*-ciclopropil-5-(2-oxo-1,3,4-oxatiazol-5-il)benzamida.

<sup>1</sup>H-RMN (300 MHz, d6-DMSO): δ = 8.67-8.68 (m, 1H), 7.92-7.96 (m, 1H), 7.84-7.85 (m, 1H), 7.69-7.72 (m, 1H), 2.79-2.86 (m, 1H), 0.68-0.75 (m, 2H), 0.53-0.57 (m, 2H).

#### Etapa 2

20 Se dispusieron 593 mg (2 mmol) de 2-cloro-*N*-ciclopropil-5-(2-oxo-1,3,4-oxatiazol-5-il)benzamida en 20 mL de decano y se mezclaron con 2,93 g (10 mmol) de 1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-5-carbonitril. La mezcla de reacción se calentó durante 1 h a 200 °C en el microondas. La mezcla de reacción se vertieron en agua helada y la fase acuosa se extrajo tres veces con 20 mL de acetato de etilo por vez. Las fases orgánicas combinadas se lavaron tres veces con 10 mL de solución saturada de cloruro de sodio por vez, se secaron sobre sulfato de sodio, se filtraron y se concentraron en el evaporador rotativo a presión reducida. El producto crudo se purificó por medio de HPLC preparativa (C18).

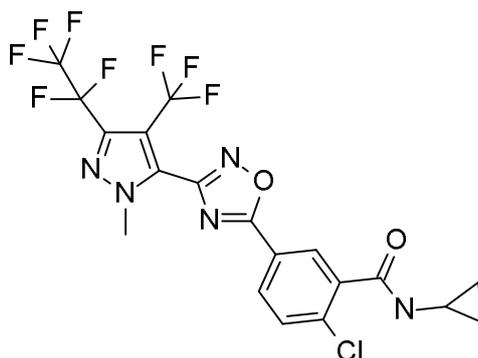
Se aislaron 35 mg de 2-cloro-*N*-ciclopropil-5-{5-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-5-il]-1,2,4-tiadiazol-3-il}benzamida (**lbd-3**) como sólido incoloro.

HPLC-MS<sup>9</sup>): tiempo de retención = 2,31 min., masa (m/z) = 546 [M+H]<sup>+</sup>.

30 <sup>1</sup>H-RMN (300 MHz, d6-DMSO): δ = 8.64-8.66 (m, 1H), 8.26-8.29 (m, 1H), 8.18-8.19 (m, 1H), 7.71-7.73 (m, 1H), 3.97 (s, 3H), 2.80-2.87 (m, 1H), 0.70-0.73 (m, 2H), 0.54-0.56 (m, 2H).

### Procedimiento de preparación H

Síntesis de 2-cloro-*N*-ciclopropil-5-{3-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-5-il]-1,2,4-oxadiazol-5-il}benzamida (**lbe-1**).



#### Etapa 1

5 Se disolvieron 6,0 g (20,5 mmol) de 1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carbonitrilo en 150 mL de etanol y se mezclaron con solución al 50 % de N-hidroxilamina en agua. La solución de reacción se agitó durante 3 h a temperatura ambiente y luego se concentró al vacío en el evaporador rotativo hasta sequedad.

Se aislaron 2,8 g de N'-hidroxi-1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carboximidamida como sólido amarillo.

HPLC-MS<sup>d</sup>): tiempo de retención = 0,93 min., masa (m/z) = 237 [M+H]<sup>+</sup>.

#### Etapa 2

10 Se dispusieron de forma sucesiva 2,8 g (8,59 mmol) de N'-hidroxi-1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carboximidamida, 100 mL de diclorometano, 2,6 g (25,7 mmol) de trietilamina y por último 4,7 g (17,1 mmol) de 2-cloro-5-(clorocarbonil)benzoato de terc-butilo en un matraz redondo. Después de 1 h a temperatura ambiente, se eliminó el disolvente en el evaporador rotativo. El residuo se disolvió en 20 mL de DMSO y se mezcló con 2,6 g (25,7 mmol) de trietilamina. La mezcla de reacción se calentó durante 1 h a 140 °C en el microondas. La mezcla de reacción se enfrió hasta temperatura ambiente y se diluyó con 50 mL de agua. La solución resultante se extrajo tres veces con 50 mL de acetato de etilo por vez. Las fases orgánicas combinadas se lavaron con solución saturada de cloruro de sodio, se secaron sobre sulfato de sodio y se filtraron. El producto crudo se purificó por cromatografía en columna en gel de sílice.

20 Se aislaron 960 mg de 2-cloro-5-{3-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]-1,2,4-oxadiazol-5-il}benzoato de terc-butilo como sólido amarillo.

HPLC-MS<sup>d</sup>): tiempo de retención = 1,77 min., masa (m/z) = 547 [M+H]<sup>+</sup>.

#### Etapa 3

25 Se disolvieron 960 mg (1,76 mmol) de 2-cloro-5-{3-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]-1,2,4-oxadiazol-5-il}benzoato de terc-butilo en 30 mL de ácido trifluoroacético y se agitaron durante 12 h a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se concentró en el evaporador rotativo a presión reducida. El sólido precipitado se filtró y se secó.

Se aislaron 800 mg de ácido 2-cloro-5-{3-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]-1,2,4-oxadiazol-5-il}benzoico en forma de sólido amarillo.

HPLC-MS<sup>e</sup>): tiempo de retención = 1,88 min., masa (m/z) = 489 [M-H]<sup>-</sup>.

#### Etapa 4

35 Sucesivamente se dispusieron 200 mg (0,41 mmol) de ácido 2-cloro-5-{3-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]-1,2,4-oxadiazol-5-il}benzoico, 20 mL de dimetilformamida, 158 mg (1,23 mmol) de N,N-diisopropiletilamina, 188 mg (0,5 mmol) de HATU y 46 mg (0,82 mmol) de ciclopropilamina en un matraz redondo. La mezcla de reacción se agitó durante 2 h a 50 °C. La mezcla de reacción se diluyó con 5 mL de agua y la solución resultante se extrajo tres veces con 5 mL de acetato de etilo por vez. Las fases orgánicas combinadas se lavaron con 10 mL de solución saturada de cloruro de sodio, se secaron sobre sulfato de sodio, se filtraron y se concentraron en el evaporador rotativo a presión reducida. El producto crudo se purificó por medio de HPLC preparativa.

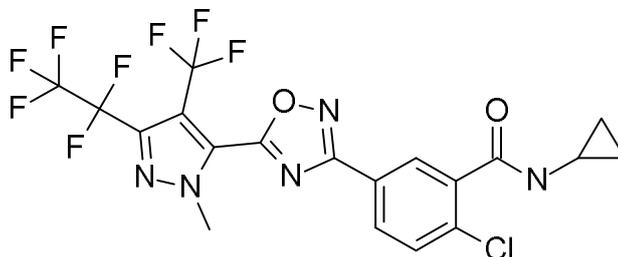
40 Se aislaron 26 mg de 2-cloro-N-ciclopropil-5-{3-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]-1,2,4-oxadiazol-5-il}benzamida (**Ibe-1**) como sólido incoloro.

HPLC-MS<sup>a</sup>): logP = 4,16, masa (m/z) = 530 [M+H]<sup>+</sup>.

<sup>1</sup>H-RMN (300 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ = 8.71-8.73 (m, 1H), 8.22-8.26 (m, 1H), 8.16-8.17 (m, 1H), 7.83-7.86 (m, 1H), 4.15 (s, 3H), 2.83-2.89 (m, 1H), 0.73-0.74 (m, 2H), 0.56-0.59 (m, 2H).

#### Procedimiento de preparación I

Síntesis de 2-cloro-*N*-ciclopropil-5-{5-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-5-il]-1,2,4-oxadiazol-3-il}benzamida (**lbf-1**).



#### Etapa 1

- 5 Se disolvieron 10,0 g (51,1 mmol) de 2-cloro-5-cianbenzoato de metilo en 150 mL de etanol y se mezclaron con 2,6 g (255 mmol) de una solución al 50 % de *N*-hidroxilamina en agua. La mezcla de reacción se agitó durante la noche a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se concentró en el evaporador rotativo a presión reducida. El residuo se extrajo en 100 mL de agua y la fase acuosa se extrajo luego tres veces con 100 mL de acetato de etilo por vez. Las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y luego se filtraron. El filtrado se concentró en el evaporador rotativo a presión reducida hasta sequedad.

Se aislaron 6,0 g de 2-cloro-5-(*N*'-hidroxicarbamimidoil)benzoato de metilo como sólido incoloro.

<sup>1</sup>H-RMN (300 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ 9.86 (s, 1H), 8.1 (d, 1H), 7.85,(dd, 1H), 7.60 (d, 3H), 5.98 (brs, 2H), 3.90 (s, 3H).

#### Etapa 2

- 15 Se extrajeron 3,12 g (10,0 mmol) de ácido 1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-5-carboxílico, 4,41 g (15,0 mmol) de EDCI, 2,03 g (10,0 mmol) de HOBt y 2,97 g (15,0 mmol) de *N,N*-diisopropiletilamina en 80 mL de THF y se agitó durante 1 h a temperatura ambiente. Se añadieron 3,43 g (15,0 mmol) de 2-cloro-5-(*N*'-hidroxicarbamimidoil)benzoato de metilo a una solución de reacción y se agitaron durante 14 h a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se concentró hasta sequedad en el evaporador rotativo. El residuo se extrajo tres veces con 50 mL de acetato de etilo por vez, las fases orgánicas combinadas se lavaron tres veces con 50 mL de agua por vez y una vez con 50 mL de solución saturada de cloruro de sodio. La fase orgánica se secó sobre sulfato de sodio, se filtró y se concentró en el evaporador rotativo hasta sequedad. El producto crudo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice.

Se aislaron 5,26 g de 2-cloro-5-(*N*'-hidroxi-*N*'-{1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-5-il}carbonil}carbamimidoil)benzoato de metilo.

- 25 HPLC-MS<sup>d</sup>: tiempo de retención = 1,64 min., masa (m/z) = 523 [M+H]<sup>+</sup>.

#### Etapa 3

- 30 Se calentaron 5,23 g (10,0 mmol) de 2-cloro-5-(*N*'-hidroxi-*N*'-{1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-5-il}carbonil}carbamimidoil)benzoato de metilo en 60 mL de tolueno durante 14 h a reflujo. La mezcla de reacción se concentró en el evaporador rotativo a presión reducida. El producto crudo se purificó por cromatografía en columna en gel de sílice.

Se aislaron 2,02 g de 2-cloro-5-{5-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-5-il]-1,2,4-oxadiazol-3-il}benzoato de metilo.

HPLC-MS<sup>d</sup>: tiempo de retención = 1,80 min., masa (m/z) = no detectable.

#### Etapa 4

- 35 Se disolvieron 228 mg (0,45 mmol) de 2-cloro-5-{5-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-5-il]-1,2,4-oxadiazol-3-il}benzoato de metilo en 70 mL de metanol y luego se mezclaron con 15 mL (15 mmol) de lejía de sosa 1 M. La mezcla de reacción se agitó durante 14 h a temperatura ambiente. El valor pH de la solución se reguló con ácido clorhídrico 1 N a pH 3. La solución de reacción se concentró en el evaporador rotativo a presión reducida. El residuo se extrajo tres veces con 25 mL de acetato de etilo por vez. Las fases orgánicas combinadas se lavaron con solución saturada de cloruro de sodio, se secaron sobre sulfato de sodio y se filtraron. El disolvente se eliminó en el evaporador rotativo a presión reducida.

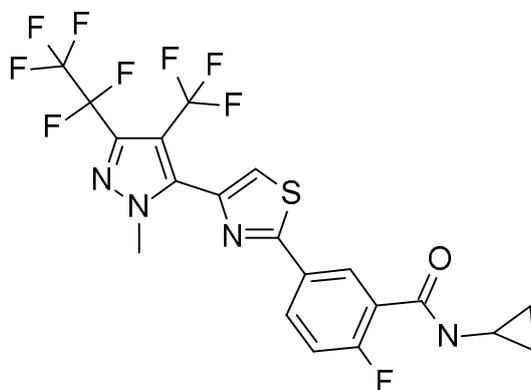
Se aislaron 198 mg de ácido 2-cloro-5-{5-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-5-il]-1,2,4-oxadiazol-3-il}benzoico.

HPLC-MS<sup>g</sup>: tiempo de retención = 1,70 min., masa (m/z) = 489 [M+H]<sup>+</sup>.

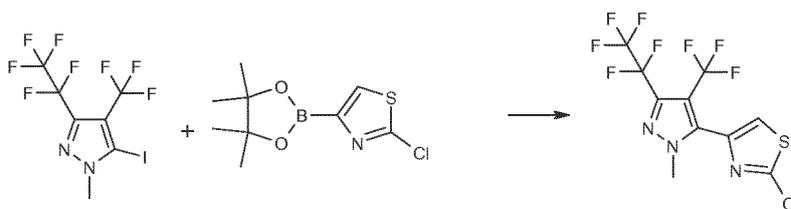
- 45 Etapa 5

- 5 Se dispusieron de forma sucesiva 196 mg (0,4 mmol) de ácido 2-cloro-5-{5-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]-1,2,4-oxadiazol-3-il}benzoico, 10 mL de diclorometano, 10 mL de THF, 115 mg (0,6 mmol) de EDCI, 54 mg (0,4 mmol) de HOBT, 77 mg (0,6 mmol) de N,N-diisopropiletilamina en un matraz redondo y se agitaron durante 1 h a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se enfrió con un baño de hielo/agua y luego se mezcló con 48 mg (0,48 mmol) de ciclopropilamina. La solución de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 14 h y luego se concentró en el evaporador rotativo a presión reducida. El residuo se extrajo tres veces con 25 mL de acetato de etilo por vez. Las fases orgánicas combinadas se lavaron tres veces con solución saturada de cloruro de sodio, se secaron sobre sulfato de sodio y se filtraron. El disolvente se eliminó en el evaporador rotativo a presión reducida y el producto crudo se purificó luego por cromatografía en columna en gel de sílice.
- 10 Se aislaron 62,9 mg de 2-cloro-N-ciclopropil-5-{5-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]-1,2,4-oxadiazol-3-il}benzamida (Ibf-2) como sólido incoloro.  
HPLC-MSb): tiempo de retención = 5,04 min., masa (m/z) = 530 [M+H]<sup>+</sup>.  
1H-RMN (300 MHz, d6-DMSO): δ 8.69 (s, 1H), 8.15 (dd, 1H), 8.06 (d, 1H), 7.78 (d, 1H), 4.33 (s, 3H), 2.90-2.81(m, 1H), 0.76-0.50 (m, 4H).
- 15 Procedimiento de preparación J

Síntesis de N-ciclopropil-2-fluoro-5-{4-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]-1,3-tiazol-2-il}benzamida (**lat-1**).

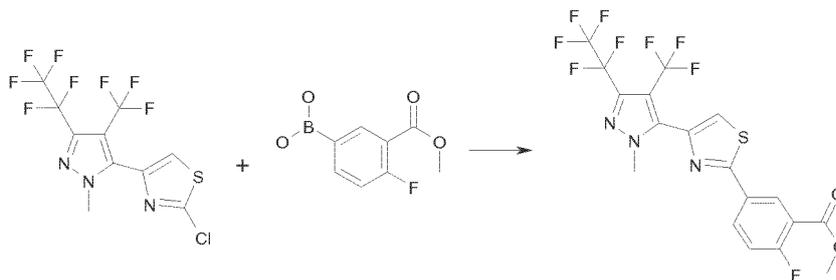


### Etapa 1



- 20 0,5 g (1,27 mmol) de 5-yodo-1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol se disolvieron con 0,375 g (1,53 mmol) de 2-cloro-4-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)-1,3-tiazol, 0,31 g (2,04 mmol) de fluoruro de cesio y 0,071 g (0,061 mmol) de tetrakis(trifenilfosfina)paladio (0) en 10 ml de dimetoxietano en un vial de microondas. Se introdujo argón con una cánula durante 3 min a través de la solución. Luego se cerró el recipiente de reacción con una tapa con cierre Krimpdeckel y se hizo reaccionar en el microondas a 100 °C durante 4 h. La mezcla de reacción se filtró sobre Celite y se concentró. El producto crudo se disolvió en acetonitrilo y se purificó por medio de una HPLC preparativa con columna de RP18 con un gradiente de agua / acetonitrilo de 9/1 a 1/9.
- 25 Las fracciones de producto diana se identificaron por LC-MS, se purificaron y se concentraron. Esto dio como resultado 0,031 g de 2-cloro-4-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]-1,3-tiazol.

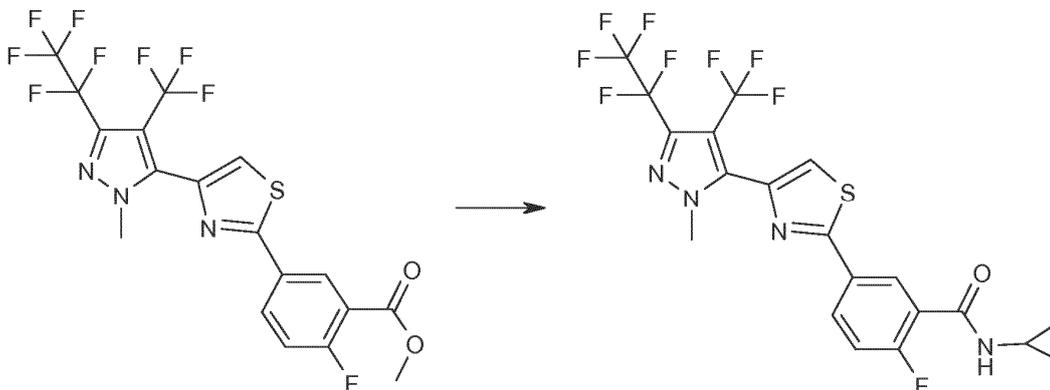
### 30 Etapa 2



- 5 Se disolvieron 35,0 mg (0,087 mmol) de 2-cloro-4-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]-1,3-tiazol con 17,2 mg (0,087 mmol) de ácido 4-fluoro-3-(metoxicarbonil)fenilborónico, 8,1 mg (0,017 mmol) de 2-diciclohexilfosfino-2',6'-diisopropoxibifenilo y 14,22 mg (0,017 mmol) de cloro(2-diciclohexilfosfino-2',6'-diisopropil-1,1'-bifenil)(2-(2-aminoetil)fenil)paladio (II) y 27,7 mg (0,13 mmol) de fosfato de potasio en 2 ml de dioxano en un vial de microondas. Con una cánula se introdujo durante 3 min Ar a través de la solución. Luego se cerró el recipiente de reacción con una tapa con cierre y se hizo reaccionar en el microondas a 120 °C durante 3 h. La mezcla de reacción se filtró por medio de Celite y se concentró y se mezcló con 2 ml de agua. La mezcla de reacción se extrajo 3 veces con 5 ml de acetato de etilo. La fase orgánica se extrajo con solución saturada de NaCl y se secó sobre Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>. Se concentró hasta sequedad. El producto crudo se disolvió en acetonitrilo y se purificó por medio de una HPLC preparativa con columna RP18 con un gradiente de agua / acetonitrilo de 9/1 a 1/9.

Las fracciones de producto diana se identificaron por LC-MS, se combinaron y se concentraron. Esto dio como resultado 10,4 mg de 2-fluoro-5-{4-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]-1,3-tiazol-2-il}benzoato de metilo.

### 15 Etapa 3



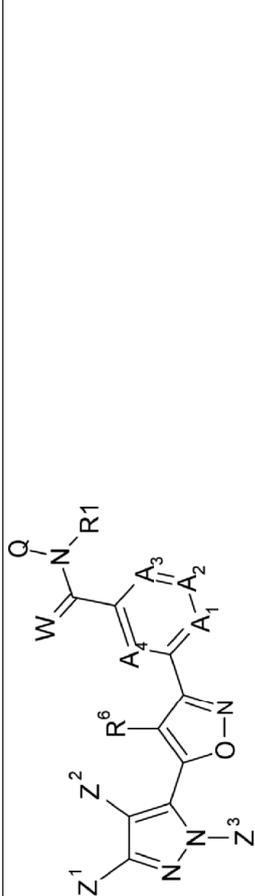
- 20 10,4 mg (0,13 mmol) de 2-fluoro-5-{4-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]-1,3-tiazol-2-il}benzoato de metilo se disolvieron en 3 ml de dioxano y se añadieron 5 mg de LiOH disueltos en aproximadamente 0,2 ml de agua y la mezcla de reacción se agitaron durante 12 h. Esta solución se llevó a neutralidad con solución 1 N de HCl. La mezcla de reacción se extrajo con 5 ml de acetato de etilo tres veces. La fase orgánica se extrajo con solución saturada de NaCl y se secó sobre Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>. Se concentró hasta sequedad. El residuo se extrajo en 1 ml de diclorometano y se mezcló con 1 µl de ciclopropilamina, 6 mg de HATU y 3 µl de DIEPA. Después de reaccionar a 60 °C en el microondas durante 30 min, la mezcla de reacción se concentró y se disolvió en 7 ml de acetonitrilo y se purificó por medio de una HPLC preparativa con columna RP18 con un gradiente de agua / acetonitrilo de 9/1 a 1/9.

- 25 Las fracciones de producto diana se identificaron por LC-MS, se combinaron y se concentraron. Esto dio como resultado 2,5 mg de 2-cloro-4-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]-1,3-tiazol.

N-ciclopropil-2-fluoro-5-{4-[1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]-1,3-tiazol-2-il}benzamida (lat-1)  
HPLC-MS<sup>Q</sup>: rt = 1,24 min, masa (m/z) = 529 [M+H]<sup>+</sup>.  
<sup>1</sup>H-RMN ver en lista de picos

- 30 Con ayuda del procedimiento de preparación A a I descrito con anterioridad se obtuvieron, además de los compuestos ya descritos, los compuestos enumerados en las Tablas 1 – 11.

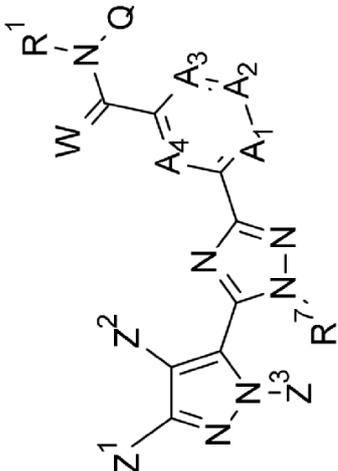
Tabla 1



(lap)

Ej. N.º	Z <sup>1</sup>	Z <sup>2</sup>	Z <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>6</sup>	A <sub>4</sub>	A <sub>3</sub>	A <sub>2</sub>	A <sub>1</sub>	W	Q	logpa <sup>1</sup>	Masa [m/z] <sup>a(1)</sup>	Proced. de obtención
lap-2	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	CH	CCI	CH	CH	O	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	4,42	571	A
lap-3	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	CH	CCI	CH	CH	O	1-(ciano)ciclopropilo	3,96	554	A
lap-4	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	CH	CCI	CH	CH	O	tetran-3-ilo	4,37	561	A
lap-5	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	CH	CCI	CH	CH	O	1-(trifluorometil)ciclopropilo	4,55	597	A
lap-6	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	CH	CCI	CH	CH	O	2-oxo-2-(2,2,2-trifluoroetilamino)etilo	3,87	628	A

Tabla 2



(ibg)

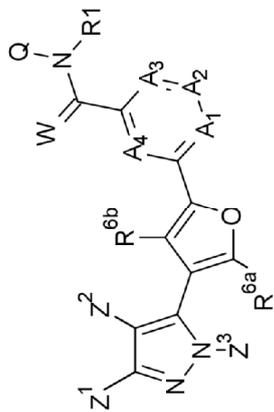
Ej. N.º	Z <sup>1</sup>	Z <sup>2</sup>	Z <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>7</sup>	A <sub>4</sub>	A <sub>3</sub>	A <sub>2</sub>	A <sub>1</sub>	W	Q	logpa <sup>1</sup>	Masa [m/z] <sup>a1)</sup>	Proced. de obtención
ibg-2	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	CH	CH	CH	CH	O	ciclopropilo	3,24	495	B
ibg-3	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	CH	CH	CH	CH	O	2,2,2-trifluoroetilo	3,54	537	B
ibg-4	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH	CCl	CH	CH	O	2,2,2-trifluoroetilo	4,14	565	B
ibg-5	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	Et	CH	CCl	CH	CH	O	ciclopropilo	4,09	557	B
ibg-6	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	Et	CH	CCl	CH	CH	O	2,2,2-trifluoroetilo	4,41	599	B

(continuación)

Ej. N.º	Z <sup>1</sup>	Z <sup>2</sup>	Z <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>7</sup>	A <sub>4</sub>	A <sub>3</sub>	A <sub>2</sub>	A <sub>1</sub>	W	Q	logpa)	Masa [m/z] <sup>a1)</sup>	Proced. de obtención
lbg-7	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH	CCl	CH	CH	O	ciclopropilo	3,80	543	B
lbg-8	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	iPr	CH	CCl	CH	CH	O	bencilo	4,93	621	B
lbg-9	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	Et	CH	CCl	CH	CH	O	bencilo	4,71	607	B
lbg-10	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	Me	CH	CCl	CH	CH	O	bencilo	4,43	593	B
lbg-11	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	iPr	CH	CCl	CH	CH	O	fenilo	5,13	607	B
lbg-12	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	Et	CH	CCl	CH	CH	O	fenilo	4,85	593	B
lbg-13	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	iPr	CH	CCl	CH	CH	O	ciclopropilo	4,35	571	B
lbg-14	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	Me	CH	CCl	CH	CH	O	fenilo	4,56	579	B

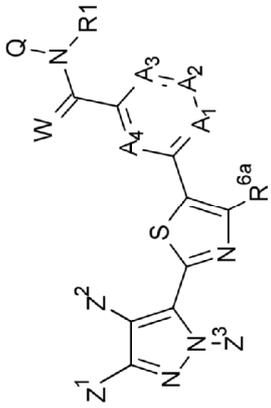
Tabla 3

Ej. N.º	Z <sup>1</sup>	Z <sup>2</sup>	Z <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>6a</sup>	R <sup>6b</sup>	A <sub>4</sub>	A <sub>3</sub>	A <sub>2</sub>	A <sub>1</sub>	W	Q	logpa'	Masa [m/z] <sup>(a)</sup>	Proced. de obtención
lac-3	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	CH	CCl	CH	CH	O	ciclopropilo	4,08	528	C



**Tabla 4**

Ej. N.º	Z <sup>1</sup>	Z <sup>2</sup>	Z <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>6a</sup>	A <sub>4</sub>	A <sub>3</sub>	A <sub>2</sub>	A <sub>1</sub>	W	Q	logpa <sup>1</sup>	Masa [m/z] <sup>a)1</sup>	Proced. de obtención
1aq-2	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	CH	CH	CH	CH	O	H	3,38	471	E



(1aq)

Tabla 5

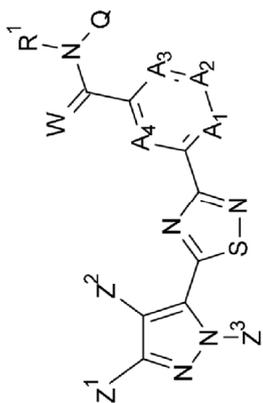
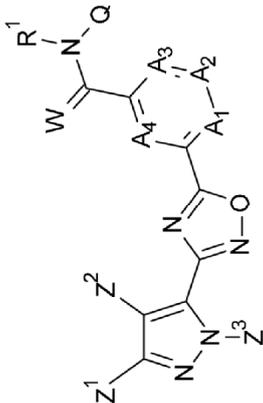
													
(Ibd)													
Ej. N.º	Z <sup>1</sup>	Z <sup>2</sup>	Z <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	A <sub>4</sub>	A <sub>3</sub>	A <sub>2</sub>	A <sub>1</sub>	W	Q	logpa <sup>1</sup>	Masa [m/z] <sup>a)1)</sup>	Proced. de obtención
Ibd-1	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH	CCI	CH	CH	O	benzilo	5,00	596	G
Ibd-2	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH	CCI	CH	CH	O	4-fluorofenilo	5,17	600	G

Tabla 6



(lbe)

Ej. N.º	Z <sup>1</sup>	Z <sup>2</sup>	Z <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	A <sub>4</sub>	A <sub>3</sub>	A <sub>2</sub>	A <sub>1</sub>	W	Q	logpa)	Masa [m/z] <sup>a)1)</sup>	Proced. de obtención
lbe-2	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH	CCl	CH	CH	O	bencilo	4,76	580	H
lbe-3	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH	CCl	CH	CH	O	4-fluorofenilo	4,91	584	H
lbe-4	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH	CCl	CH	CH	O	1-(ciano)ciclopropilo	4,01	555	H

Tabla 7

Ej. N.º	Z <sup>1</sup>	Z <sup>2</sup>	Z <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	A <sub>4</sub>	A <sub>3</sub>	A <sub>2</sub>	A <sub>1</sub>	W	Q	logpa	Masa [m/z] <sup>a1)</sup>	Proced. de obtención
lbf-2	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH	CCl	CH	CH	O	1-(ciano)ciclopropilo	4,14	555	I
lbf-3	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH	CCl	CH	CH	O	ciclopropilo	4,26	530	I

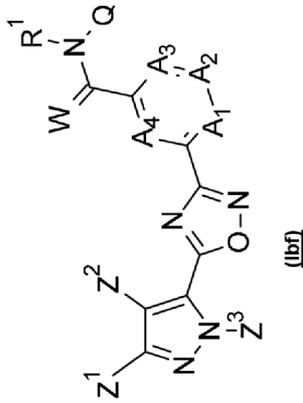
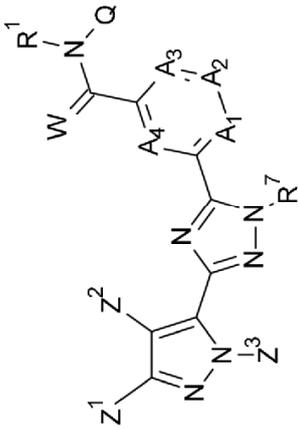


Tabla 8



(lbh)

Ej. N.º	Z <sup>1</sup>	Z <sup>2</sup>	Z <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>7</sup>	A <sub>4</sub>	A <sub>3</sub>	A <sub>2</sub>	A <sub>1</sub>	W	Q	logpa)	Masa [m/z] <sup>a1)</sup>	Proced. de obtención
lbh-3	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	Me	CH	CCl	CH	CH	O	2,2,2-trifluoroetilo	3,99	585	B
lbh-4	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	Et	CH	CCl	CH	CH	O	ciclopropilo	3,99	557	B
lbh-5	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	Et	CH	CCl	CH	CH	O	2,2,2-trifluoroetilo	4,32	599	B
lbh-6	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	iPr	CH	CCl	CH	CH	O	ciclopropilo	4,39	571	B
lbh-7	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	iPr	CH	CCl	CH	CH	O	2,2,2-trifluoroetilo	4,68	613	B
lbh-8	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	Me	CH	CCl	CH	CH	O	ciclopropilo	3,67	543	B

(continuación)

Ej. N.º	Z <sup>1</sup>	Z <sup>2</sup>	Z <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>7</sup>	A <sub>4</sub>	A <sub>3</sub>	A <sub>2</sub>	A <sub>1</sub>	W	Q	logpa)	Masa [m/z] <sup>a1)</sup>	Proced. de obtención
lbh-9	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	iPr	CH	CCl	CH	CH	O	bencilo	4,98	621	B
lbh-10	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	Et	CH	CCl	CH	CH	O	bencilo	4,59	607	B
lbh-11	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	Me	CH	CCl	CH	CH	O	bencilo	4,29	593	B
lbh-12	C <sub>3</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	iPr	CH	CCl	CH	CH	O	fenilo	5,23	607	B
lbh-13	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	Et	CH	CCl	CH	CH	O	fenilo	4,73	593	B
lbh-14	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	Me	CH	CCl	CH	CH	O	fenilo	4,42	579	B

Tabla 9

Ej. N.º	Z <sup>1</sup>	Z <sup>2</sup>	Z <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>7</sup>	A <sub>4</sub>	A <sub>3</sub>	A <sub>2</sub>	A <sub>1</sub>	W	Q	logpa'	Masa [m/z] <sup>a)</sup>	Proced. de obtención
Ibi-1	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	CH	CCI	CH	CH	O	bencilo	4,00	579	B
Ibi-2	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	CH	CCI	CH	CH	O	2,2,2-trifluoroetilo	3,73	571	B
Ibi-3	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	CH	CCI	CH	CH	O	ciclopropilo	3,40	529	B
Ibi-4	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	CH	CCI	CH	CH	O	fenilo	4,13	565	B

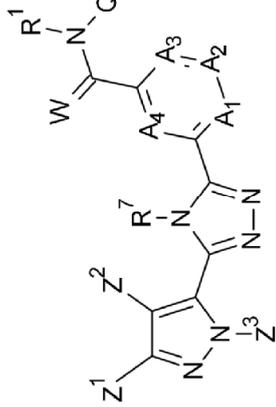


Tabla 10

Ej. N.º	Z <sup>1</sup>	Z <sup>2</sup>	Z <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>6a</sup>	R <sup>6b</sup>	A <sub>4</sub>	A <sub>3</sub>	A <sub>2</sub>	A <sub>1</sub>	W	Q	logpa)	Masa [m/z] <sup>a)</sup>	Proced. de obtención
laf-1	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	CH	CCI	CH	CH	O	ciclopropilo	4,31	544	C

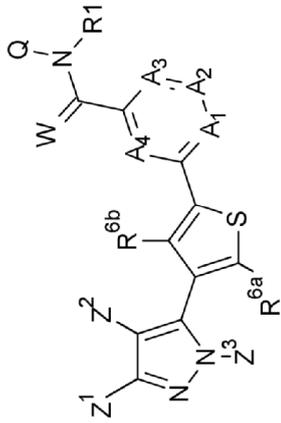
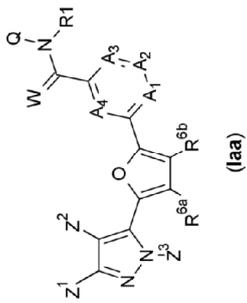


Tabla 11

Ej. N.º	Z <sup>1</sup>	Z <sup>2</sup>	Z <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>6a</sup>	R <sup>6b</sup>	A <sub>4</sub>	A <sub>3</sub>	A <sub>2</sub>	A <sub>1</sub>	W	Q	logp <sub>a</sub> '	Masa [m/z] <sub>a(1)</sub>	Proced. de obtención
laa-1	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	CH	CCl	CH	CH	O	1-(ciano)ciclopropilo	4,08	553	C



(continuación)

Ej. N.º	Z <sup>1</sup>	Z <sup>2</sup>	Z <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>6a</sup>	R <sup>6b</sup>	A <sub>4</sub>	A <sub>3</sub>	A <sub>2</sub>	A <sub>1</sub>	W	Q	logpa <sup>1</sup>	Masa [m/z] <sup>a)1)</sup>	Proced. de obtención <sup>n</sup>
<p><sup>1</sup> En el caso de la masa indicada, se trata del pico de la muestra isotópica del ion [M+H]<sup>+</sup> con la máxima intensidad; en caso de detectar el ion [M-H]<sup>-</sup>, se caracteriza la indicación de masa con <sup>2</sup>.</p>															
<p><sup>2</sup> En el caso de la masa indicada, se trata del pico de la muestra isotópica del ion [M-H]<sup>-</sup> con la máxima intensidad.</p>															
<p>a) Observación para la determinación de los valores logP y detección de masa: la determinación de los valores indicados logP se realizó según la directiva EEC 79/831 Anexo V.A8 por HPLC (cromatografía líquida de alto rendimiento) en una columna de fase inversa (C18). Sistema de LC Agilent 1100; 50*4,6 Zorbax Eclipse Plus C18 1,8 micrones; eluyente A: acetonitrilo (0,1 % de ácido fórmico); eluyente B: agua (0,09 % de ácido fórmico); gradiente lineal del 10 % de acetonitrilo a 95 % de acetonitrilo en 4-25 min, luego 95 % de acetonitrilo durante otros 1,25 min; temperatura del horno 55 °C; flujo: 2,0 mL/min. La detección de masa se produce a través de un sistema Agilent MSD.</p>															
<p>b) Observación para determinar el tiempo de retención y la detección de masa: la determinación de los tiempos de retención indicados se produjo en una columna de inversión de fases (C18). Shimadzu LCMS 2020; 50*3,0 Shimadzu shim-pack XR-ODS 2,2 micrones; eluyente A: agua (0,05 % de TFA); eluyente B: acetonitrilo; gradiente lineal del 5 % de acetonitrilo a 95 % de acetonitrilo en 6,00 min, luego 95 % de acetonitrilo durante otros 1,1 min; temperatura del horno 40 °C; flujo: 1,0 mL/min.</p>															
<p>c) Observación para la determinación del tiempo de retención y la detección de masa: sistema UPLC Waters ACQUITY SQD; columna: Waters Acquity UPLC HSS T3 1,8 µ 50 x 1 mm; eluyente A: 1 l de agua + 0,25 ml de ácido fórmico al 99 %, eluyente B: 1 l de acetonitrilo + 0,25 ml de ácido fórmico al 99 %; gradiente: 0,0 min 90 % de A → 1,2 min 5 % de A → 2,0 min 5 % de A horno: 50 °C; flujo: 0,40 ml/min; detección UV: 208 – 400 nm.</p>															
<p>d) Observación para la determinación del tiempo de retención y detección de masa: la determinación de los tiempos de retención indicados se produjo en una columna de inversión de fases (C18). Shimadzu LCMS 2020; 50*3,0 Shimadzu shim-pack XR-ODS 2,2 micrones; eluyente A: agua (0,05 % de TFA); eluyente B: acetonitrilo; gradiente lineal del 5 % de acetonitrilo al 100 % de acetonitrilo en 1,2 min, luego 100 % de acetonitrilo durante otros 1,1 min; temperatura del horno 40 °C; flujo: 1,0 mL/min.</p>															
<p>e) Observación para la determinación del tiempo de retención y detección de masa: la determinación de los tiempos de retención indicados se produjo en una columna de inversión de fases (C18). Shimadzu LCMS 2020; 50*3,0 Shimadzu shim-pack XR-ODS 2,2 micrones; eluyente A: agua (0,1 % de ácido fórmico); eluyente B: acetonitrilo (0,1 % de ácido fórmico); gradiente lineal del 5 % de acetonitrilo a 100 % de acetonitrilo en 1,2 min, luego 100 % de acetonitrilo durante otros 1,1 min; temperatura del horno 40 °C; flujo: 1,0 mL/min.</p>															

(continuación)

Ej. N.º	Z <sup>1</sup>	Z <sup>2</sup>	Z <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>6a</sup>	R <sup>6b</sup>	A <sub>4</sub>	A <sub>3</sub>	A <sub>2</sub>	A <sub>1</sub>	W	Q	logpa)	Masa [m/z] <sup>a1)</sup>	Proced. de obtención
<p><sup>f)</sup> Observación para la determinación de los valores logP y detección de masa: la determinación de los valores logP indicados se produjo de acuerdo con la directiva EEC 79/831 Anexo V.A8 por HPLC (cromatografía líquida de alto rendimiento) en una columna de inversión de fases (C18). Sistema LC Agilent 1100; 50*4,6 Zorbax Eclipse Plus C18 1,8 micrones; eluyente A: acetonitrilo; eluyente B: agua (-79 mg de hidrógeno-carbonato de amonio/l); gradiente lineal del 10 % de acetonitrilo al 95 % de acetonitrilo en 4,25 min, luego 95 % de acetonitrilo durante otros 1,55 min; temperatura del horno 55 °C; flujo: 2,0 mL/min. La detección de masa se produce por medio de un sistema Agilent MSD.</p>															

**Datos de RMN de ejemplos seleccionados**

Procedimiento de listas de picos de RMN

Los datos de RMN de  $^1\text{H}$  de ejemplos seleccionados están escritos en forma de listas de picos de RMN de  $^1\text{H}$ . El valor de  $\delta$  en ppm y la intensidad de las señales se enumeran para cada pico de señal entre paréntesis. Los pares de valor de  $\delta$  –intensidad de señal para diferentes picos de señales se enumeran con separación entre sí por punto y coma.

La lista de picos de un ejemplo tiene, por ende, la forma:

$\delta_1$  (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 agudas se correlaciona con la altura de las señales en un ejemplo impreso de un espectro de RMN en cm y muestra las relaciones actuales de intensidades de señales. De señales amplias, se pueden mostrar varios picos o el medio de la señal y su intensidad relativa en comparación con la señal más intensa en el espectro.

Para calibración del desplazamiento químico de los espectros de RMN de  $^1\text{H}$ , se han usado tetrametilsilano y/o el desplazamiento químico del disolvente, en particular en el caso de espectros medidos en DMSO. En consecuencia, el pico de tetrametilsilano se puede producir, pero no necesariamente, en listas de picos de RMN.

Las listas de picos de RMN de  $^1\text{H}$  son similares a impresiones convencionales de RMN de  $^1\text{H}$  y, por ende, contienen usualmente todos los picos que se enumeran en la interpretación clásica de RMN.

Adicionalmente, pueden mostrar como señales de disolventes de impresiones clásicas de RMN de  $^1\text{H}$ , estereoisómeros de los compuestos objeto que también son objeto de la invención, y/o picos de impurezas.

Para mostrar las señales de compuestos en el intervalo delta de disolventes y/o agua, los picos usuales de disolventes, por ejemplo, nuestras listas de picos de RMN de  $^1\text{H}$  muestran los picos de disolventes usuales, por ejemplo, picos de DMSO en DMSO-D<sub>6</sub> y el pico de agua que usualmente tienen en promedio una elevada intensidad.

Los picos de estereoisómeros de los compuestos objeto y/o picos de impurezas tienen usualmente en promedio una menor intensidad que los picos de compuestos objeto (por ejemplo, con una pureza > 90 %).

Tales estereoisómeros y/o impurezas pueden ser típicos del proceso de preparación específico. Por ende, sus picos pueden ayudar a reconocer la reproducción de nuestro proceso de preparación por medio de "huellas de subproductos".

Un experto, quien calcula los picos de los compuestos objeto con métodos conocidos (MestreC, ACD-simulation, pero también con valores esperados evaluados empíricamente) puede aislar los picos de los compuestos objeto de ser necesario opcionalmente usando filtros adicionales de intensidad. Este aislamiento será similar a la recolección relevante de picos en la interpretación convencional de RMN de  $^1\text{H}$ .

Otros detalles de las listas de picos de RMN de  $^1\text{H}$  pueden hallarse en la Base de Datos de la Descripción de Búsqueda Número 564025.

<p>Ejemplo Iaa-1: <math>^1\text{H}</math>-RMN(600,1 MHz, CD<sub>3</sub>CN): <math>\delta</math>= 7,832(3,2);7,828(4,1);7,811(2,4);7,807(1,7);7,797(2,5);7,793(2,1);7,603(1,5);7,545(3,8);7,531(3,4);7,089(4,0);7,083(4,6);7,011(3,7);7,005(3,2);5,447(1,2);3,995(16,0);2,142(7,2);1,957(0,6);1,953(0,7);1,949(3,8);1,945(6,7);1,941(9,8);1,937(6,6);1,933(3,3);1,594(1,7);1,585(4,1);1,580(4,1);1,571(2,0);1,360(2,1);1,350(4,1);1,346(4,3);1,336(1,7);0,000(1,3)</p>
<p>Ejemplo Iac-1: <math>^1\text{H}</math>-RMN(600,1 MHz, CD<sub>3</sub>CN): <math>\delta</math>= 7,863(5,5);7,827(3,2);7,823(4,0);7,805(2,1);7,801(1,6);7,790(2,2);7,787(1,9);7,782(0,3);7,582(1,6);7,552(3,7);7,538(3,3);7,424(0,4);7,048(5,0);3,835(16,0);3,810(4,4);3,638(0,9);3,412(0,3);3,282(1,7);3,273(1,7);2,142(1,6);1,964(0,8);1,956(2,3);1,952(2,8);1,948(15,4);1,944(26,8);1,939(39,4);1,935(26,8);1,931(13,6);1,591(1,6);1,581(4,2);1,577(4,2);1,568(2,0);1,364(2,0);1,354(4,1);1,350(4,3);1,340(1,7);1,272(0,3);0,000(5,2)</p>
<p>Ejemplo Iac-3: <math>^1\text{H}</math>-RMN(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): <math>\delta</math>= 8,582(2,5);8,571(2,4);8,315(1,2);8,270(6,0);8,078(0,4);8,074(0,4);7,813(1,8);7,807(2,4);7,792(2,1);7,784(6,0);7,602(3,8);7,592(0,5);7,582(3,1);7,551(0,4);7,529(0,4);7,421(5,8);7,178(0,4);6,924(0,4);6,919(0,4);5,755(2,7);3,907(16,0);3,710(1,4);3,324(129,5);3,301(1,6);2,861(0,8);2,852(1,1);2,843(1,6);2,833(1,5);2,824(1,1);2,815(0,7);2,676(0,6);2,671(0,7);2,667(0,5);2,506(84,3);2,502(105,1);2,498(79,3);2,333(0,6);2,329(0,7);0,735(1,0);0,723(2,9);0,718(3,7);0,705(3,6);0,700(3,0);0,688(1,4);0,672(0,4);0,667(0,4);0,565(1,4);0,555(3,8);0,548(3,7);0,539(3,1);0,527(0,9);0,464(0,5);0,457(0,4);0,146(0,5);0,009(10,9);0,000(109,4);-0,149(0,6)</p>

(continuación)

<p>Ejemplo Iaf-1: <sup>1</sup>H-RMN(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ= 8,578(2,3);8,567(2,4);8,051(4,9);7,842(4,8);7,752(1,5);7,746(2,1);7,725(7,0);7,572(3,6);7,552(2,9);3,862(0,7);3,846(16,0);3,565(0,5);3,327(38,2);2,854(0,6);2,844(1,0);2,836(1,4);2,826(1,4);2,817(1,0);2,808(0,7);2,671(0,5);2,502(71,9);2,329(0,5);2,086(0,4);1,398(4,4);0,731(0,8);0,713(3,6);0,701(3,4);0,695(3,0);0,684(1,2);0,563(1,1);0,552(3,6);0,545(3,7);0,537(3,2);0,524(0,9);0,000(41,8)</p>
<p>Ejemplo Iaj-1: <sup>1</sup>H-RMN(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ= 8,749(1,8);8,739(1,8);8,486(3,8);8,316(0,4);8,263(1,8);8,243(1,9);8,086(1,9);8,066(2,1);7,727(1,9);7,708(3,5);7,688(1,6);5,756(0,8);4,288(1,0);3,973(16,0);3,324(145,3);2,917(0,6);2,908(0,9);2,899(1,4);2,889(1,4);2,881(0,9);2,871(0,7);2,675(0,6);2,671(0,9);2,667(0,6);2,524(1,9);2,506(96,8);2,502(127,5);2,498(94,2);2,333(0,6);2,329(0,9);2,324(0,6);0,760(0,8);0,746(2,3);0,742(3,4);0,730(3,0);0,723(2,7);0,713(1,2);0,674(0,4);0,634(1,2);0,623(3,7);0,616(3,3);0,608(2,6);0,595(0,8);0,008(1,8);0,000(56,9);-0,008(2,4)</p>
<p>Ejemplo Iap-1: <sup>1</sup>H-RMN(400,0 MHz, CD<sub>3</sub>CN): δ= 7,969(8,9);7,965(3,7);7,950(2,8);7,945(1,6);7,621(2,7);7,617(1,5);7,602(1,6);7,598(2,4);7,312(7,0);7,019(1,0);5,448(0,9);3,967(16,0);2,879(0,7);2,870(1,0);2,861(1,6);2,851(1,6);2,843(1,1);2,833(0,8);2,473(0,4);2,468(0,8);2,464(1,0);2,459(0,7);2,454(0,4);2,167(275,2);2,120(0,7);2,114(1,0);2,108(1,2);2,101(0,9);2,095(0,5);1,964(7,0);1,958(20,9);1,952(84,6);1,946(148,5);1,940(190,5);1,934(131,6);1,928(67,1);1,781(0,5);1,775(0,9);1,769(1,1);1,763(0,8);1,756(0,4);1,270(1,2);0,804(0,8);0,791(2,8);0,786(3,4);0,773(3,7);0,768(2,6);0,756(1,1);0,625(1,1);0,615(3,0);0,613(3,1);0,608(3,3);0,604(3,0);0,599(2,7);0,586(0,8);0,146(2,4);0,027(0,3);0,000(539,7);-0,009(31,0);-0,037(0,4);-0,039(0,4);-0,041(0,4);-0,042(0,4);-0,045(0,4);-0,150(2,4)</p>
<p>Ejemplo Iap-2: <sup>1</sup>H-RMN(400,0 MHz, CD<sub>3</sub>CN): δ= 8,020(7,6);8,001(2,4);7,996(1,5);7,671(2,3);7,649(2,1);7,485(0,8);7,328(7,0);4,153(0,8);4,137(0,9);4,130(2,4);4,113(2,4);4,106(2,5);4,090(2,4);4,083(1,0);4,066(0,9);3,969(16,0);2,467(0,3);2,463(0,4);2,458(0,3);2,165(115,1);2,113(0,4);2,107(0,4);1,971(1,0);1,964(2,6);1,958(6,5);1,952(29,7);1,946(52,8);1,940(69,5);1,934(47,9);1,928(24,4);1,768(0,4);1,437(0,9);1,270(0,8);1,203(0,3);0,146(1,5);0,007(17,8);-0,001(270,7);-0,150(1,5)</p>
<p>Ejemplo Iap-3: <sup>1</sup>H-RMN(601,6 MHz, CD<sub>3</sub>CN): δ= 8,020(9,9);8,018(3,7);8,008(3,1);8,004(1,9);7,654(2,7);7,652(1,8);7,641(1,9);7,639(3,0);7,634(1,5);7,324(8,4);3,970(16,0);2,146(107,9);2,060(0,3);2,056(0,6);2,052(0,9);2,048(0,6);1,973(1,5);1,966(3,5);1,958(9,3);1,954(11,2);1,950(58,9);1,946(104,1);1,942(152,2);1,937(102,4);1,933(51,4);1,917(0,4);1,831(0,6);1,827(0,9);1,823(0,6);1,601(1,8);1,591(4,2);1,587(4,3);1,578(2,1);1,437(0,4);1,375(2,2);1,366(4,1);1,362(4,4);1,352(1,8);1,216(0,4);1,204(0,7);1,192(0,4);0,005(2,1);0,000(64,8);-0,006(2,3)</p>
<p>Ejemplo Iap-4: <sup>1</sup>H-RMN(601,6 MHz, CD<sub>3</sub>CN): δ= 8,008(3,1);8,005(4,1);7,991(2,6);7,987(1,7);7,977(2,6);7,973(2,1);7,640(3,7);7,626(3,4);7,489(0,6);7,477(0,6);7,321(8,1);5,330(0,8);5,316(1,6);5,303(1,6);5,288(0,9);3,970(16,0);3,542(2,3);3,540(1,3);3,526(3,8);3,514(1,5);3,512(2,8);3,374(2,8);3,371(1,6);3,360(4,0);3,357(3,8);3,346(1,3);3,344(2,3);3,279(0,8);3,270(0,8);2,141(321,1);2,110(0,3);2,059(0,9);2,055(1,5);2,051(2,2);2,047(1,5);2,043(0,8);1,965(9,0);1,957(23,2);1,952(26,0);1,949(154,0);1,945(264,8);1,940(384,0);1,936(266,4);1,932(137,2);1,924(2,4);1,834(0,8);1,830(1,5);1,826(2,2);1,822(1,4);1,817(0,7);1,270(0,4);0,005(1,6);0,000(57,9);-0,006(1,9)</p>
<p>Ejemplo Iap-5: <sup>1</sup>H-RMN(601,6 MHz, CD<sub>3</sub>CN): δ= 7,999(2,0);7,996(2,6);7,985(1,9);7,982(3,1);7,971(4,2);7,968(3,0);7,643(3,7);7,629(3,4);7,535(1,3);7,317(8,5);3,968(16,0);2,141(240,0);2,059(0,8);2,055(1,3);2,051(1,9);2,047(1,2);2,043(0,6);1,965(7,2);1,957(19,0);1,953(21,7);1,949(124,7);1,945(218,2);1,940(315,9);1,936(211,0);1,932(109,2);1,924(1,6);1,834(0,6);1,830(1,2);1,826(1,8);1,822(1,2);1,818(0,6);1,399(1,5);1,389(3,5);1,386(3,8);1,376(2,1);1,269(1,6);1,259(2,9);1,248(0,7);1,217(0,5);0,005(1,4);0,000(48,0);-0,006(1,4)</p>
<p>Ejemplo Iap-6: <sup>1</sup>H-RMN(601,6 MHz, CD<sub>3</sub>CN): δ= 8,111(3,3);8,108(3,3);8,002(2,1);7,999(2,0);7,988(2,4);7,985(2,2);7,663(3,7);7,650(3,5);7,362(0,7);7,324(6,5);7,095(0,5);5,448(0,3);4,058(6,7);4,048(6,7);3,977(0,8);3,969(16,0);3,961(2,3);3,950(2,3);3,946(2,4);3,935(2,3);3,930(0,9);3,919(0,8);3,891(0,9);3,270(0,3);2,141(353,9);2,108(0,3);2,059(0,9);2,055(1,5);2,051(2,2);2,047(1,5);2,043(0,7);1,972(1,1);1,965(9,1);1,957(23,6);1,953(27,2);1,949(155,9);1,945(269,4);1,940(394,3);1,936(268,2);1,932(136,9);1,834(0,9);1,830(1,5);1,826(2,2);1,822(1,5);1,817(0,8);1,285(0,6);1,271(1,2);1,204(0,5);0,005(1,7);0,000(57,4);-0,006(1,8)</p>

(continuación)

<p>Ejemplo Iaq-1: <sup>1</sup>H-RMN(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ= 9,455(4,1);8,692(7,3);8,466(4,0);8,316(0,4);8,231(2,1);8,211(2,2);7,876(2,0);7,856(2,3);7,642(1,8);7,622(3,1);7,603(1,5);7,250(0,8);7,232(0,7);7,182(0,9);7,164(0,8);7,144(0,4);3,989(16,0);3,323(50,6);2,671(0,8);2,502(114,6);2,329(0,7);2,300(3,4);1,605(1,5);1,591(4,2);1,584(4,7);1,571(2,0);1,329(1,9);1,316(4,3);1,309(4,6);1,295(1,6);1,234(0,4);1,056(0,5);0,146(0,4);0,000(78,0);-0,150(0,4)</p>
<p>Ejemplo Iaq-2: <sup>1</sup>H-RMN(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ= 8,670(8,8);8,509(3,7);8,316(0,8);8,181(1,9);8,162(2,0);8,094(1,6);7,910(1,8);7,890(2,0);7,599(1,9);7,579(3,4);7,560(1,6);7,479(1,6);5,756(0,6);3,995(16,0);3,322(87,9);2,676(0,9);2,671(1,2);2,667(0,9);2,564(0,3);2,524(3,4);2,511(65,5);2,506(132,2);2,502(176,6);2,498(132,7);2,333(0,7);2,329(1,1);2,324(0,8);1,235(0,9);0,146(0,8);0,008(6,3);0,000(164,7);-0,008(8,4);-0,150(0,8)</p>
<p>Ejemplo lat-1: <sup>1</sup>H-RMN (400 MHz, CLOROFORMO-d) δ [ppm]: 0.000 (1.72), 0.645 (0.48), 0.658 (1.74), 0.662 (1.89), 0.668 (1.94), 0.672 (1.77), 0.675 (1.43), 0.685 (0.59), 0.897 (0.61), 0.910 (1.68), 0.915 (1.96), 0.929 (2.03), 0.933 (1.46), 0.946 (0.46), 1.255 (0.42), 1.570 (16.00), 2.968 (0.54), 2.977 (0.69), 2.979 (0.64), 2.986 (0.68), 2.995 (0.50), 3.998 (9.61), 6.808 (0.46), 6.840 (0.46), 7.216 (0.90), 7.237 (1.12), 7.244 (1.18), 7.639 (2.98), 8.138 (0.57), 8.144 (0.65), 8.150 (0.66), 8.156 (0.74), 8.159 (0.72), 8.165 (0.64), 8.171 (0.61), 8.177 (0.51), 8.641 (1.00), 8.647 (0.96), 8.658 (1.02), 8.665 (0.90).</p>
<p>Ejemplo Iaw-1: <sup>1</sup>H-RMN(601,6 MHz, CDCl<sub>3</sub>): δ= 7,946(0,7);7,886(1,0);7,884(1,3);7,872(1,4);7,869(1,0);7,476(0,6);7,464(1,5);7,452(1,9);7,439(0,7);7,265(6,2);6,770(6,3);5,671(1,1);5,300(2,4);4,266(1,3);4,005(0,7);3,979(1,2);3,846(0,7);3,821(11,9);3,780(0,9);3,767(16,0);3,123(1,2);3,114(1,3);2,890(0,6);2,875(0,6);2,869(0,8);2,863(1,2);2,857(0,9);2,851(0,7);2,845(0,4);2,371(0,4);1,966(0,5);1,644(1,1);1,428(0,4);1,334(0,4);1,318(0,4);1,285(0,6);1,255(1,5);0,621(0,4);0,505(0,5);0,000(2,6)</p>
<p>Ejemplo Iax-1: <sup>1</sup>H-RMN(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ= 8,318(0,3);7,733(1,4);7,703(0,8);7,698(0,9);7,688(1,2);7,681(1,4);7,676(1,3);7,599(3,3);7,586(2,2);7,567(0,4);7,472(0,3);7,461(0,4);7,267(0,5);6,891(4,9);5,757(0,4);4,038(0,6);4,020(0,5);3,995(16,0);3,974(12,2);3,934(0,6);3,887(0,3);3,879(0,8);3,858(1,1);3,754(1,3);3,330(99,3);3,036(0,4);2,996(4,1);2,931(0,6);2,919(0,5);2,811(1,0);2,676(0,6);2,672(0,9);2,667(0,7);2,507(96,6);2,503(128,0);2,498(97,5);2,333(0,6);2,329(0,8);2,325(0,6);1,989(1,6);1,706(0,6);1,398(5,4);1,351(0,4);1,336(0,4);1,287(0,5);1,271(0,6);1,259(0,5);1,249(0,7);1,233(1,8);1,216(0,5);1,193(0,5);1,175(0,9);1,157(0,5);0,539(1,1);0,451(1,0);0,000(1,3)</p>
<p>Ejemplo Ibd-1: <sup>1</sup>H-RMN(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ= 9,171(1,0);9,156(2,1);9,141(1,0);8,315(2,0);8,310(2,3);8,294(1,9);8,289(2,7);8,266(4,6);8,261(3,6);7,757(3,9);7,736(3,7);7,392(1,3);7,376(11,0);7,359(5,0);7,339(1,4);7,291(0,8);7,286(1,3);7,270(1,5);7,254(0,7);4,501(4,7);4,486(4,7);3,977(16,0);3,901(0,6);3,368(0,3);3,323(127,1);2,671(0,7);2,667(0,5);2,506(86,7);2,502(110,7);2,498(83,2);2,333(0,5);2,329(0,7);2,324(0,5);1,236(0,4);0,000(3,3)</p>
<p>Ejemplo Ibd-2: <sup>1</sup>H-RMN(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ= 10,716(4,1);8,391(3,3);8,386(4,4);8,373(2,4);8,368(1,5);8,352(2,3);8,347(1,9);7,825(3,4);7,804(3,2);7,764(2,4);7,752(2,8);7,742(2,9);7,729(2,6);7,238(2,6);7,216(4,8);7,194(2,4);3,975(16,0);3,902(0,5);3,366(0,4);3,325(92,4);2,672(0,6);2,503(91,0);2,329(0,5);1,235(0,4);0,000(2,2)</p>
<p>Ejemplo Ibd-3: <sup>1</sup>H-RMN(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ= 8,656(2,1);8,646(2,1);8,314(0,3);8,291(2,0);8,286(2,3);8,270(2,1);8,265(2,5);8,197(4,3);8,191(3,9);7,728(4,0);7,707(3,7);4,000(0,5);3,967(16,0);3,902(1,4);3,323(130,7);2,868(0,6);2,858(0,9);2,849(1,4);2,839(1,4);2,831(0,9);2,821(0,7);2,676(0,5);2,671(0,7);2,667(0,5);2,541(0,5);2,507(88,6);2,502(115,2);2,498(86,8);2,333(0,5);2,329(0,7);2,325(0,5);1,260(0,4);1,235(1,1);0,740(0,8);0,727(2,4);0,722(3,4);0,710(3,2);0,704(2,7);0,693(1,1);0,567(1,1);0,557(3,3);0,550(3,1);0,547(3,0);0,541(2,8);0,529(0,8);0,000(3,6)</p>
<p>Ejemplo Ibe-1: <sup>1</sup>H-RMN(601,6 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ= 8,741(2,0);8,734(2,0);8,243(2,1);8,240(2,3);8,229(2,2);8,226(2,5);8,166(4,1);8,162(3,7);7,887(0,5);7,883(0,4);7,845(3,9);7,831(3,6);7,665(0,4);7,651(0,4);4,163(0,6);4,150(16,0);3,872(2,3);3,330(624,0);3,051(0,5);2,869(0,6);2,862(0,9);2,857(1,3);2,850(1,3);2,844(0,9);2,838(0,7);2,831(0,4);2,828(0,7);2,617(1,7);2,614(2,3);2,611(1,7);2,523(4,2);2,520(5,4);2,517(5,6);2,508(133,3);2,505(273,9);2,502(372,9);2,499(282,1);2,474(1,3);2,390(1,7);2,387(2,3);2,384(1,7);1,639(0,8);1,235(1,6);0,854(0,4);0,744(0,8);0,735(2,4);0,732(3,3);0,724(3,1);0,720(2,7);0,712(1,4);0,699(0,6);0,582(1,0);0,574(2,9);0,570(2,9);0,567(2,7);0,564(2,8);0,556(0,8);0,544(0,5);0,540(0,5);0,537(0,5);0,534(0,4);0,000(4,9)</p>

(continuación)

<p>Ejemplo lbe-2: <sup>1</sup>H-RMN(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ= 9,232(0,9);9,217(1,9);9,202(1,0);8,313(0,5);8,272(1,7);8,266(2,2);8,251(1,8);8,245(2,6);8,216(4,2);8,211(3,6);7,875(3,7);7,854(3,4);7,403(1,3);7,383(9,7);7,367(4,6);7,355(0,6);7,347(1,6);7,298(0,8);7,293(1,2);7,288(0,7);7,277(1,5);7,265(0,5);7,260(0,7);7,255(0,4);4,516(4,5);4,501(4,5);4,151(16,0);4,134(0,4);3,901(1,7);3,390(0,3);3,325(329,8);3,279(0,6);2,675(0,8);2,671(1,1);2,667(0,9);2,506(139,0);2,502(186,0);2,498(145,3);2,333(0,8);2,329(1,1);2,324(0,9);1,258(0,4);1,235(1,3);0,913(0,3);0,000(4,9)</p>
<p>Ejemplo lbe-3: <sup>1</sup>H-RMN(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ= 10,764(3,7);8,396(3,4);8,390(3,9);8,328(1,9);8,323(1,7);8,314(0,6);8,307(2,1);8,301(1,9);7,938(3,5);7,917(3,2);7,765(2,4);7,752(2,6);7,747(1,9);7,742(2,8);7,730(2,6);7,251(2,5);7,229(4,7);7,207(2,4);4,162(16,0);3,902(1,0);3,325(256,2);2,671(1,0);2,668(0,8);2,507(135,0);2,503(174,0);2,498(133,6);2,329(1,1);2,325(0,9);1,336(0,3);1,277(0,5);1,261(1,0);1,245(0,9);1,235(0,9);0,000(4,3)</p>
<p>Ejemplo lbe-4: <sup>1</sup>H-RMN(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ= 9,628(4,2);8,297(1,6);8,292(2,4);8,273(9,0);7,892(2,6);7,870(2,4);4,143(16,0);3,377(0,4);3,325(314,7);3,280(0,5);2,671(1,2);2,666(1,0);2,541(23,4);2,506(148,1);2,502(190,5);2,498(147,5);2,328(1,2);2,324(0,9);1,618(1,4);1,604(3,9);1,597(4,2);1,584(1,8);1,357(1,8);1,344(4,0);1,337(4,2);1,323(1,5);1,297(0,3);1,286(0,3);1,258(0,6);1,235(2,2);0,854(0,4);0,000(1,5)</p>
<p>Ejemplo lbf-1: <sup>1</sup>H-RMN(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ= 10,753(3,7);8,314(0,4);8,275(3,5);8,270(4,5);8,246(2,5);8,240(1,8);8,225(2,6);8,219(2,2);7,883(4,0);7,862(3,6);7,771(2,5);7,758(2,8);7,753(1,7);7,748(2,9);7,735(2,7);7,248(2,7);7,242(1,0);7,226(4,9);7,209(0,9);7,203(2,5);4,340(16,0);3,902(1,7);3,323(249,1);3,286(0,4);2,675(0,9);2,671(1,2);2,666(0,9);2,524(4,4);2,511(79,5);2,506(155,9);2,502(201,8);2,497(147,7);2,493(72,7);2,333(0,9);2,329(1,2);2,324(0,9);1,234(1,2);0,000(6,4)</p>
<p>Ejemplo lbf-2: <sup>1</sup>H-RMN(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ= 9,595(4,1);8,313(0,4);8,215(1,8);8,211(1,9);8,195(1,9);8,190(2,2);8,146(4,0);8,141(3,4);7,838(3,4);7,817(3,1);4,329(16,0);3,901(1,5);3,382(0,4);3,322(189,7);2,671(1,2);2,502(195,8);2,328(1,2);1,619(1,4);1,605(3,9);1,598(4,1);1,585(1,7);1,344(1,7);1,330(4,0);1,324(4,1);1,309(1,4);1,235(0,5);0,000(4,5)</p>
<p>Ejemplo lbf-3: <sup>1</sup>H-RMN(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ= 8,694(2,3);8,684(2,2);8,164(2,0);8,159(2,1);8,143(2,3);8,138(2,3);8,063(4,3);8,058(3,7);7,790(3,5);7,769(3,2);4,332(16,0);3,901(0,4);3,327(145,2);2,882(0,8);2,872(1,1);2,864(1,5);2,854(1,5);2,846(1,1);2,836(0,7);2,826(0,3);2,672(0,8);2,506(103,4);2,502(120,8);2,329(0,7);0,751(1,0);0,734(3,6);0,721(3,6);0,716(3,0);0,704(1,2);0,577(1,4);0,566(3,9);0,560(3,9);0,551(3,2);0,539(0,9);0,000(2,6)</p>
<p>Ejemplo lbg-1: <sup>1</sup>H-RMN(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ= 15,366(3,2);9,256(1,1);9,241(2,2);9,226(1,0);8,584(3,7);8,316(0,7);8,209(1,9);8,189(1,9);8,078(1,8);8,059(1,9);7,734(1,7);7,714(3,1);7,695(1,5);7,352(16,0);7,344(8,1);7,339(9,2);7,327(1,4);7,318(0,9);7,275(1,0);7,267(1,3);7,262(1,3);7,260(1,3);7,253(1,6);7,247(1,1);7,241(0,8);7,232(0,4);4,530(4,9);4,515(5,0);4,494(0,3);4,076(15,4);3,996(0,3);3,903(3,9);3,892(0,3);3,331(332,8);2,681(0,4);2,676(0,9);2,672(1,3);2,667(0,9);2,663(0,4);2,542(0,7);2,525(3,9);2,512(78,5);2,507(156,8);2,503(204,8);2,498(146,8);2,494(70,0);2,339(0,4);2,334(0,9);2,329(1,2);2,325(0,9);1,259(0,3);1,245(0,3);1,234(0,6);0,941(0,5);0,876(0,4);0,000(0,8)</p>
<p>Ejemplo lbg-2: <sup>1</sup>H-RMN(400,0 MHz, CD<sub>3</sub>CN): δ= 13,369(0,4);8,515(5,2);8,172(1,6);8,153(1,7);7,910(2,1);7,890(2,4);7,655(1,6);7,636(2,8);7,617(1,4);7,588(0,4);7,288(1,2);4,031(16,0);2,919(0,3);2,910(1,0);2,900(1,5);2,892(2,1);2,882(2,1);2,873(1,5);2,864(1,0);2,855(0,4);2,473(0,5);2,469(0,7);2,464(0,6);2,460(0,3);2,159(219,6);2,126(1,7);2,120(1,5);2,114(1,7);2,108(2,2);2,102(1,5);2,095(0,9);2,087(0,6);2,024(0,4);2,010(0,4);1,996(0,4);1,965(7,4);1,959(18,5);1,953(96,5);1,947(173,4);1,940(233,2);1,934(161,4);1,928(83,8);1,884(0,3);1,781(0,7);1,775(1,1);1,769(1,5);1,763(1,1);1,756(0,6);1,546(0,4);1,527(0,4);1,508(0,4);1,487(0,4);1,429(0,4);1,419(0,4);1,410(0,3);1,400(0,4);1,380(0,4);1,340(0,8);1,270(13,3);1,217(1,0);1,177(0,5);1,161(0,4);1,151(0,4);1,126(0,4);1,116(0,4);1,104(0,4);0,974(0,4);0,932(0,4);0,913(0,5);0,881(2,6);0,864(1,7);0,857(1,6);0,836(1,2);0,817(0,6);0,798(1,4);0,786(3,7);0,781(5,1);0,768(4,9);0,763(4,0);0,751(1,9);0,730(0,5);0,712(0,4);0,696(0,4);0,686(0,4);0,657(1,8);0,646(4,8);0,639(4,8);0,636(4,4);0,630(3,9);0,617(1,3);0,146(1,9);0,079(3,5);0,008(15,8);0,000(413,3);-0,009(19,0);-0,150(2,0)</p>
<p>Ejemplo lbg-3: <sup>1</sup>H-RMN(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ= 15,396(3,1);9,328(1,6);9,313(3,1);9,297(1,5);8,582(5,4);8,316(0,7);8,249(2,5);8,230(2,6);8,070(2,1);8,051(2,4);7,763(1,7);7,744(2,9);7,724(1,4);4,184(0,8);4,160(2,6);4,144(2,8);4,136(2,9);4,120(2,7);4,095(1,4);4,077(16,0);3,903(2,5);3,332(329,6);2,677(1,0);2,672(1,3);2,668(1,0);2,542(0,8);2,525(4,1);2,512(84,7);2,508(167,9);2,503(218,4);2,499(158,5);2,494(77,6);2,335(1,0);2,330(1,3);2,325(1,0);1,235(0,4);0,000(0,8)</p>

(continuación)

<p>Ejemplo lbg-4: <sup>1</sup>H-RMN(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ= 9,321(1,0);9,305(1,9);9,289(0,9);8,122(1,7);8,117(1,8);8,101(1,8);8,096(2,0);8,051(0,4);8,046(0,4);8,027(3,8);8,022(3,4);7,703(3,2);7,682(2,9);4,286(1,4);4,153(0,6);4,130(1,7);4,114(1,8);4,106(1,9);4,089(1,7);4,066(0,6);3,930(14,7);3,911(16,0);3,323(100,6);2,672(0,6);2,506(82,4);2,502(100,9);2,329(0,6);0,000(2,4)</p>
<p>Ejemplo lbg-5: <sup>1</sup>H-RMN(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ= 8,617(2,4);8,606(2,3);8,074(1,9);8,070(2,0);8,053(2,1);8,049(2,2);7,982(4,1);7,977(3,7);7,646(3,5);7,625(3,2);4,212(0,7);4,194(1,4);4,176(1,6);4,167(1,6);4,149(1,4);4,132(0,7);3,899(16,0);3,323(124,1);2,857(0,7);2,847(1,0);2,838(1,4);2,829(1,4);2,820(1,0);2,811(0,6);2,671(0,7);2,502(125,5);2,329(0,7);1,429(4,5);1,411(9,2);1,393(4,4);0,732(0,8);0,714(3,5);0,701(3,4);0,697(3,0);0,685(1,1);0,562(1,2);0,551(3,7);0,545(3,8);0,537(3,2);0,524(0,9);0,000(2,5)</p>
<p>Ejemplo lbg-6: <sup>1</sup>H-RMN(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ= 9,319(1,0);9,303(2,1);9,287(1,0);8,313(0,4);8,132(2,0);8,127(2,1);8,111(2,2);8,106(2,4);8,034(4,2);8,029(3,8);7,701(3,9);7,680(3,6);4,219(0,5);4,201(1,2);4,183(1,3);4,175(1,3);4,156(1,5);4,138(1,2);4,130(1,9);4,114(1,8);4,106(1,9);4,090(1,8);4,065(0,6);3,902(16,0);3,365(0,4);3,322(232,0);3,282(0,4);2,675(0,8);2,671(1,0);2,667(0,8);2,506(135,5);2,502(173,4);2,497(129,5);2,333(0,8);2,329(1,1);2,324(0,8);1,429(4,6);1,411(9,7);1,393(4,5);0,000(5,1)</p>
<p>Ejemplo lbg-7: <sup>1</sup>H-RMN(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ= 8,615(1,9);8,604(1,9);8,065(1,7);8,059(1,9);8,044(1,8);8,038(2,1);7,974(3,7);7,969(3,3);7,648(3,4);7,627(3,1);4,282(0,6);3,942(0,6);3,928(13,6);3,904(16,0);3,324(76,1);2,856(0,6);2,846(0,8);2,838(1,2);2,828(1,2);2,819(0,8);2,810(0,6);2,676(0,3);2,672(0,4);2,667(0,4);2,507(57,9);2,502(73,9);2,498(55,8);2,329(0,5);0,731(0,7);0,718(2,2);0,713(2,9);0,701(2,8);0,696(2,3);0,684(0,9);0,560(1,0);0,549(3,0);0,543(2,8);0,534(2,5);0,521(0,7);0,000(2,1)</p>
<p>Ejemplo lbg-8: <sup>1</sup>H-RMN(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ= 9,181(0,9);9,166(1,9);9,151(0,9);7,836(1,2);7,830(1,4);7,815(2,2);7,810(3,3);7,791(4,5);7,787(3,5);7,780(4,9);7,760(2,2);7,398(1,1);7,393(1,6);7,377(5,9);7,370(6,4);7,352(4,7);7,332(1,7);7,286(0,9);7,282(1,4);7,278(0,8);7,271(0,8);7,265(1,7);7,252(0,5);7,248(0,7);4,875(0,4);4,858(1,1);4,842(1,6);4,826(1,1);4,810(0,4);4,501(4,3);4,487(4,4);4,096(15,6);3,902(3,1);3,365(0,3);3,325(137,0);2,676(0,5);2,671(0,6);2,667(0,5);2,542(0,6);2,525(1,8);2,511(40,8);2,507(79,3);2,502(102,4);2,498(75,9);2,494(38,4);2,334(0,4);2,329(0,6);2,325(0,4);1,501(16,0);1,485(15,9);1,236(0,6);0,000(3,5)</p>
<p>Ejemplo lbg-9: <sup>1</sup>H-RMN(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ= 9,128(0,9);9,114(2,0);9,099(1,0);8,100(1,9);8,095(2,3);8,079(2,0);8,074(2,7);8,047(4,6);8,042(3,7);7,676(3,9);7,655(3,6);7,388(0,9);7,374(13,6);7,368(6,0);7,358(5,3);7,338(1,1);7,287(0,8);7,282(1,2);7,273(1,1);7,266(1,4);7,251(0,7);7,245(0,4);4,487(4,6);4,472(4,6);4,213(0,5);4,196(1,1);4,177(1,3);4,169(1,3);4,151(1,2);4,133(0,5);3,900(16,0);3,324(140,1);3,290(0,4);2,675(0,4);2,671(0,6);2,667(0,4);2,524(1,9);2,506(79,5);2,502(102,9);2,497(77,7);2,333(0,5);2,329(0,6);2,324(0,5);1,427(4,7);1,409(9,9);1,391(4,6);0,000(2,9)</p>
<p>Ejemplo lbg-10: <sup>1</sup>H-RMN(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ= 9,130(0,8);9,115(1,7);9,100(0,8);8,090(1,7);8,084(2,0);8,069(1,8);8,064(2,5);8,039(4,1);8,034(3,3);7,677(3,4);7,656(3,1);7,373(12,2);7,366(5,4);7,358(5,0);7,343(0,5);7,337(0,9);7,288(0,7);7,281(1,0);7,274(1,0);7,266(1,2);7,258(0,8);7,252(0,6);4,486(4,0);4,471(4,0);3,928(13,2);3,904(16,0);3,397(0,6);3,390(0,4);3,384(0,6);3,323(87,8);2,690(0,4);2,675(0,3);2,671(0,5);2,667(0,4);2,511(30,1);2,506(59,5);2,502(77,9);2,497(59,2);2,333(0,3);2,329(0,5);2,324(0,4);0,000(2,5)</p>
<p>Ejemplo lbg-11: <sup>1</sup>H-RMN(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ= 10,684(0,9);10,628(3,9);8,325(0,4);8,169(3,3);8,164(4,8);8,153(2,7);8,148(1,7);8,133(2,5);8,127(2,1);7,947(1,0);7,942(1,1);7,886(0,3);7,865(0,8);7,860(0,8);7,838(1,3);7,817(0,5);7,736(7,8);7,716(7,6);7,388(3,1);7,369(5,5);7,349(3,5);7,148(1,8);7,130(3,0);7,111(1,3);4,868(0,4);4,554(0,4);4,538(1,2);4,521(1,7);4,505(1,3);4,489(0,5);4,100(4,3);3,902(6,6);3,883(16,0);3,330(291,3);3,174(0,3);2,677(0,8);2,672(1,2);2,668(0,9);2,542(0,6);2,508(153,1);2,503(199,2);2,499(155,8);2,334(0,9);2,330(1,2);2,325(1,0);1,512(4,2);1,496(4,4);1,480(6,4);1,464(6,5);1,443(6,5);1,427(6,2);1,258(0,4);1,235(0,8);0,000(5,4)</p>
<p>Ejemplo lbg-12: <sup>1</sup>H-RMN(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ= 10,615(4,0);8,169(3,3);8,164(4,9);8,154(2,8);8,149(1,7);8,134(2,5);8,128(2,1);7,740(4,6);7,733(4,5);7,719(5,0);7,714(5,1);7,387(2,5);7,368(4,4);7,348(2,7);7,147(1,4);7,129(2,4);7,110(1,1);4,223(0,6);4,207(1,3);4,189(1,5);4,178(1,5);4,160(1,3);4,143(0,6);3,908(16,0);3,326(121,7);3,282(0,4);2,676(0,5);2,672(0,6);2,668(0,5);2,507(78,8);2,503(102,2);2,498(80,4);2,334(0,5);2,330(0,6);2,325(0,5);1,439(4,8);1,421(10,0);1,403(4,7);1,245(0,3);1,235(0,4);0,000(2,6)</p>

# ES 2 703 950 T3

(continuación)

<p><b>Ejemplo</b>  <b>lbg-13:</b> <sup>1</sup>H-RMN(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ= 8,657(2,0);8,646(2,0);7,805(1,2);7,800(1,4);7,784(2,6);7,779(3,1);7,750(4,7);7,728(5,4);7,722(3,8);4,834(0,4);4,818(1,1);4,802(1,6);4,786(1,2);4,770(0,4);4,111(0,5);4,090(15,3);3,902(0,4);3,325(105,2);2,862(0,6);2,852(0,9);2,844(1,3);2,834(1,3);2,825(0,9);2,816(0,6);2,676(0,4);2,672(0,5);2,667(0,4);2,507(62,6);2,503(82,0);2,498(62,5);2,334(0,4);2,330(0,5);2,325(0,4);1,495(16,0);1,479(16,0);1,235(0,7);0,738(0,8);0,725(2,4);0,720(3,3);0,708(3,0);0,702(2,7);0,691(1,0);0,560(1,1);0,550(3,1);0,544(3,1);0,540(3,0);0,534(2,8);0,522(0,8);0,000(2,4)</p>
<p><b>Ejemplo</b>  <b>lbg-14:</b> <sup>1</sup>H-RMN(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ= 10,614(3,2);8,161(2,7);8,156(4,0);8,145(2,2);8,140(1,3);8,125(2,1);8,119(1,7);7,742(3,3);7,731(3,5);7,721(3,5);7,712(3,8);7,386(2,1);7,367(3,6);7,346(2,3);7,146(1,2);7,128(2,0);7,109(0,9);4,146(0,9);4,085(0,8);4,067(0,3);3,937(13,7);3,917(16,0);3,902(2,0);3,872(0,4);3,427(0,4);3,410(0,4);3,324(62,1);2,676(0,4);2,672(0,5);2,667(0,4);2,542(0,5);2,538(0,5);2,507(59,0);2,503(75,2);2,498(56,3);2,329(0,4);2,325(0,3);1,236(0,7);1,161(0,5);0,000(2,5)</p>
<p><b>Ejemplo</b>  <b>lbg-15:</b> <sup>1</sup>H-RMN(600,1 MHz, CD3CN): δ= 8,532(1,4);8,530(2,5);8,527(1,4);8,240(1,0);8,238(1,3);8,235(0,9);8,227(1,0);8,225(1,4);8,222(0,9);7,909(0,9);7,907(1,2);7,906(1,1);7,904(0,9);7,896(1,0);7,894(1,3);7,893(1,3);7,891(0,9);7,659(0,5);7,601(1,3);7,588(2,4);7,576(1,2);7,384(1,0);7,382(1,4);7,370(3,1);7,359(2,6);7,355(0,6);7,346(3,0);7,336(0,7);7,333(1,3);7,281(0,5);7,278(0,8);7,276(0,5);7,266(1,2);7,254(0,5);4,579(3,6);4,569(3,6);3,873(11,8);3,853(16,0);2,139(4,6);1,971(1,2);1,964(0,6);1,955(1,6);1,951(2,0);1,947(10,6);1,943(18,4);1,939(26,8);1,935(18,3);1,931(9,1);1,216(0,3);1,204(0,7);1,192(0,3);0,000(7,4)</p>
<p><b>Ejemplo</b>  <b>lbg-2:</b> <sup>1</sup>H-RMN(600,1 MHz, CD3CN): δ= 8,225(1,3);8,223(2,2);8,220(1,3);8,020(0,8);8,018(1,1);8,016(0,8);8,007(0,9);8,0054(1,1);8,0045(1,1);8,003(0,8);7,953(0,9);7,951(1,1);7,950(1,0);7,948(0,8);7,940(1,0);7,938(1,1);7,937(1,1);7,935(0,8);7,693(1,2);7,680(2,3);7,667(1,3);7,388(1,3);7,376(2,7);7,375(2,6);7,360(2,0);7,356(0,5);7,348(2,6);7,335(1,1);7,280(0,7);7,268(1,1);7,256(0,4);4,588(3,1);4,578(3,1);4,062(16,0);4,033(10,1);3,935(0,6);2,137(45,4);1,971(0,6);1,963(0,6);1,955(1,6);1,951(2,0);1,947(10,6);1,943(18,5);1,939(26,9);1,935(18,2);1,931(9,2);1,285(0,4);1,277(0,3);1,272(0,4);0,000(6,0)</p>
<p><b>Ejemplo</b>  <b>lbg-3:</b> <sup>1</sup>H-RMN(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ= 9,355(0,7);9,339(1,5);9,324(0,7);7,990(1,3);7,984(1,5);7,969(1,6);7,963(1,9);7,902(3,1);7,896(2,7);7,802(3,0);7,782(2,5);4,164(0,4);4,140(1,4);4,121(16,0);4,100(1,4);4,091(0,8);4,076(12,0);3,902(0,5);3,323(102,8);2,676(0,4);2,671(0,6);2,667(0,4);2,511(36,8);2,507(70,9);2,502(91,4);2,498(68,1);2,494(34,9);2,333(0,4);2,329(0,5);2,324(0,4);0,000(2,8)</p>
<p><b>Ejemplo</b>  <b>lbg-4:</b> <sup>1</sup>H-RMN(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ= 8,646(2,0);8,635(2,0);8,313(0,6);7,859(1,8);7,853(2,0);7,838(2,4);7,833(2,9);7,784(4,4);7,779(3,8);7,747(4,5);7,726(3,2);4,421(1,4);4,403(4,4);4,384(4,4);4,366(1,4);4,104(0,6);4,084(16,0);3,901(1,9);3,322(227,3);2,862(0,6);2,852(0,9);2,844(1,3);2,834(1,3);2,825(0,9);2,816(0,6);2,680(0,5);2,676(0,9);2,671(1,2);2,667(0,9);2,524(3,8);2,511(76,7);2,507(151,3);2,502(197,3);2,498(147,9);2,493(75,9);2,333(0,9);2,329(1,2);2,324(0,9);1,461(5,0);1,443(11,1);1,425(5,0);1,411(0,4);1,236(0,4);0,738(0,8);0,725(2,4);0,720(3,4);0,708(3,2);0,702(2,8);0,691(1,1);0,559(1,1);0,549(3,2);0,542(3,2);0,539(3,0);0,533(2,8);0,521(0,9);0,000(6,0)</p>
<p><b>Ejemplo</b>  <b>lbg-5:</b> <sup>1</sup>H-RMN(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ= 9,359(0,9);9,344(2,0);9,328(1,0);8,035(0,4);8,030(0,4);7,923(1,6);7,918(1,8);7,902(2,2);7,897(2,6);7,823(4,1);7,818(3,8);7,802(4,3);7,781(3,2);7,701(0,4);7,680(0,4);4,437(1,3);4,419(4,1);4,401(4,2);4,383(1,3);4,165(0,6);4,141(1,8);4,125(1,8);4,116(2,1);4,100(2,0);4,088(16,0);3,902(2,1);3,350(0,6);3,323(88,4);2,676(0,4);2,672(0,5);2,667(0,4);2,542(0,4);2,511(33,9);2,507(66,6);2,503(87,4);2,498(66,3);2,494(34,9);2,333(0,4);2,329(0,5);2,325(0,4);1,472(4,7);1,454(10,3);1,436(4,7);1,412(1,1);1,394(0,5);0,000(2,5)</p>
<p><b>Ejemplo</b>  <b>lbg-6:</b> <sup>1</sup>H-RMN(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ= 8,643(0,3);8,618(2,4);8,608(2,4);8,076(1,9);8,071(2,1);8,055(2,1);8,050(2,3);7,984(4,2);7,979(3,9);7,779(0,4);7,749(0,5);7,728(0,7);7,642(3,7);7,621(3,4);4,542(0,5);4,526(1,3);4,510(1,7);4,493(1,3);4,478(0,5);4,090(1,9);3,902(3,2);3,874(16,0);3,323(125,9);3,268(0,3);3,170(0,5);2,859(0,7);2,850(1,1);2,841(1,6);2,831(1,6);2,823(1,1);2,813(0,8);2,671(0,8);2,502(130,6);2,445(0,4);2,329(0,8);1,495(2,2);1,475(7,5);1,459(7,0);1,436(6,9);1,420(6,6);1,265(0,4);1,259(0,4);1,247(0,5);1,236(0,7);0,734(0,9);0,716(3,7);0,703(3,6);0,699(3,1);0,687(1,1);0,565(1,2);0,554(3,7);0,548(4,1);0,540(3,5);0,527(1,0);0,000(2,9)</p>

(continuación)

<p>Ejemplo            lbh-7: <sup>1</sup>H-RMN(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ= 9,316(1,0);9,301(2,1);9,285(1,0);8,135(2,3);8,130(2,5);8,114(2,5);8,109(2,9);8,035(4,8);8,030(4,3);7,843(0,3);7,804(0,5);7,765(0,4);7,760(0,4);7,697(4,4);7,676(4,1);4,548(0,5);4,531(1,3);4,515(1,8);4,499(1,3);4,483(0,5);4,156(0,6);4,140(0,8);4,132(1,8);4,116(1,9);4,107(1,9);4,092(3,3);4,067(0,6);3,902(2,1);3,878(16,0);3,323(129,0);3,294(0,4);2,676(0,5);2,671(0,7);2,667(0,5);2,542(0,4);2,525(2,2);2,511(45,3);2,507(90,1);2,502(117,6);2,498(87,5);2,493(44,1);2,334(0,5);2,329(0,7);2,324(0,5);1,503(1,9);1,487(2,4);1,478(6,3);1,462(6,4);1,437(6,3);1,421(6,1);0,000(4,2)</p>
<p>Ejemplo            lbh-8: <sup>1</sup>H-RMN(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ= 8,643(1,5);8,632(1,5);7,926(1,4);7,920(1,6);7,905(1,7);7,899(2,1);7,859(3,4);7,854(2,8);7,748(3,2);7,727(2,6);4,128(0,6);4,109(16,0);4,092(0,6);4,074(12,1);3,902(0,5);3,349(0,6);3,323(77,8);2,866(0,5);2,857(0,7);2,848(1,0);2,838(1,0);2,829(0,6);2,820(0,5);2,676(0,4);2,671(0,5);2,667(0,4);2,511(31,8);2,507(60,0);2,502(76,6);2,498(56,9);2,494(29,1);2,333(0,3);2,329(0,5);2,325(0,3);0,739(0,6);0,727(1,9);0,722(2,5);0,709(2,4);0,704(2,0);0,692(0,8);0,562(0,8);0,552(2,4);0,546(2,4);0,542(2,2);0,536(2,1);0,524(0,6);0,000(2,5)</p>
<p>Ejemplo            lbh-10: <sup>1</sup>H-RMN(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ= 9,172(0,9);9,157(1,9);9,142(0,9);8,312(0,5);7,887(1,5);7,882(2,0);7,867(1,9);7,861(3,4);7,851(4,7);7,846(3,1);7,791(0,7);7,777(4,3);7,756(2,9);7,397(1,0);7,393(1,6);7,376(6,1);7,371(8,3);7,353(4,7);7,333(1,7);7,287(0,9);7,283(1,4);7,278(0,8);7,266(1,6);7,253(0,5);7,249(0,7);7,245(0,4);7,197(0,6);7,168(0,6);6,793(0,3);6,765(0,4);6,749(0,4);6,721(0,4);5,979(0,5);5,935(0,5);5,441(0,6);5,411(0,5);4,500(4,5);4,485(4,5);4,440(1,3);4,422(4,3);4,403(4,3);4,385(1,4);4,090(16,0);3,985(0,4);3,959(1,1);3,933(1,1);3,907(0,5);3,901(1,2);3,373(0,9);3,329(435,0);3,280(0,6);3,270(0,5);3,254(0,3);2,676(0,9);2,671(1,2);2,667(0,9);2,541(0,7);2,525(3,6);2,511(77,3);2,507(153,6);2,502(200,6);2,498(149,2);2,493(75,5);2,457(0,5);2,383(4,1);2,334(1,0);2,329(1,3);2,325(1,0);1,470(5,0);1,452(11,0);1,434(4,9);0,000(8,9);-0,008(0,3)</p>
<p>Ejemplo            lbh-11: <sup>1</sup>H-RMN(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ= 9,165(0,8);9,150(1,6);9,135(0,8);7,953(1,1);7,948(1,9);7,936(2,8);7,931(7,1);7,778(2,7);7,772(0,9);7,761(0,7);7,755(2,2);7,395(1,3);7,378(4,7);7,373(6,1);7,354(3,7);7,335(1,4);7,283(1,1);7,266(1,3);7,249(0,5);4,502(3,6);4,487(3,6);4,125(16,0);4,080(12,7);3,901(0,8);3,365(0,4);3,325(252,8);3,295(0,8);2,675(0,6);2,671(0,8);2,667(0,6);2,524(2,6);2,506(110,0);2,502(141,9);2,498(106,6);2,333(0,6);2,329(0,9);2,324(0,6);0,000(3,9)</p>
<p>Ejemplo            lbh-12: <sup>1</sup>H-RMN(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ= 10,618(4,0);8,168(3,2);8,163(4,7);8,154(2,8);8,149(1,6);8,133(2,5);8,128(2,1);7,737(6,0);7,734(4,8);7,717(6,4);7,391(2,6);7,371(4,4);7,351(2,7);7,151(1,4);7,132(2,4);7,114(1,1);4,554(0,5);4,538(1,2);4,522(1,7);4,505(1,3);4,489(0,5);3,882(16,0);3,440(0,7);3,427(0,6);3,420(0,5);3,398(1,5);3,343(1284,7);3,292(1,6);3,282(1,1);3,269(1,2);3,252(0,6);3,237(0,4);3,225(0,4);3,192(0,4);3,184(0,3);2,676(1,1);2,672(1,5);2,667(1,2);2,542(50,5);2,525(3,9);2,507(188,0);2,503(247,6);2,498(187,6);2,433(0,4);2,368(0,3);2,334(1,2);2,329(1,6);2,325(1,2);1,650(0,3);1,479(6,3);1,463(6,5);1,441(6,5);1,425(6,2);1,298(0,6);1,279(0,6);1,261(1,2);1,259(1,1);1,236(1,8);0,853(0,4);0,000(1,9)</p>
<p>Ejemplo            lbh-13: <sup>1</sup>H-RMN(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ= 10,652(3,7);8,313(0,4);8,005(3,7);8,000(4,1);7,941(1,9);7,935(1,6);7,920(2,6);7,914(2,4);7,838(4,3);7,817(3,0);7,732(4,0);7,713(4,2);7,389(2,6);7,370(4,3);7,350(2,7);7,149(1,5);7,131(2,4);7,112(1,1);4,461(1,4);4,443(4,2);4,425(4,2);4,407(1,4);4,094(16,0);3,921(0,5);3,901(1,0);3,323(218,2);2,676(0,8);2,671(1,1);2,667(0,8);2,511(73,2);2,507(138,4);2,502(179,0);2,497(133,8);2,493(69,0);2,333(0,8);2,329(1,1);2,324(0,8);1,483(4,9);1,465(10,4);1,447(4,7);1,437(0,5);1,234(0,3);0,000(5,9)</p>
<p>Ejemplo            lbh-14: <sup>1</sup>H-RMN(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ= 10,656(3,1);8,314(0,4);8,075(3,0);8,070(3,4);8,006(1,6);8,001(1,4);7,985(1,9);7,980(1,8);7,839(3,3);7,818(2,6);7,736(3,3);7,717(3,6);7,390(2,1);7,371(3,6);7,351(2,2);7,150(1,2);7,131(2,0);7,113(0,9);4,145(16,0);4,084(13,5);3,901(0,9);3,323(240,5);2,676(0,8);2,671(1,0);2,667(0,8);2,506(126,1);2,502(164,7);2,498(125,8);2,333(0,7);2,329(1,0);2,324(0,7);0,000(4,5)</p>
<p>Ejemplo            lbh-9: <sup>1</sup>H-RMN(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ= 9,127(1,1);9,112(2,3);9,097(1,1);8,102(1,8);8,097(2,2);8,081(2,0);8,076(2,6);8,049(4,5);8,044(3,7);7,672(4,0);7,651(3,7);7,391(1,2);7,375(12,0);7,358(5,3);7,338(1,4);7,287(0,8);7,282(1,3);7,272(1,0);7,266(1,6);7,250(0,7);4,541(0,5);4,525(1,3);4,509(1,8);4,490(5,6);4,475(5,2);4,095(0,6);3,901(1,5);3,876(1,6,0);3,389(0,4);3,359(0,4);3,322(132,8);2,671(0,7);2,666(0,5);2,540(0,5);2,506(86,3);2,502(112,9);2,498(87,2);2,333(0,5);2,329(0,7);2,325(0,5);1,501(0,7);1,475(6,2);1,459(6,3);1,435(6,3);1,419(6,1);1,235(0,7);0,000(3,1)</p>

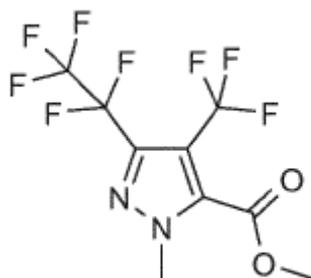
(continuación)

<p>Ejemplo Ibi-1: <sup>1</sup>H-RMN(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ= 15,389(2,6);9,171(1,2);9,157(2,4);9,142(1,3);8,313(0,6);8,118(7,0);8,097(3,8);8,092(2,9);7,783(2,5);7,763(2,3);7,403(2,1);7,384(16,0);7,367(7,9);7,347(2,5);7,298(1,3);7,293(2,0);7,287(1,2);7,276(2,5);7,265(0,9);7,260(1,1);4,506(6,9);4,491(6,9);4,107(1,0);4,075(13,0);3,901(1,1);3,325(266,4);3,262(0,4);3,169(0,4);2,676(1,1);2,671(1,4);2,667(1,1);2,542(1,0);2,511(97,3);2,507(184,9);2,502(236,9);2,498(176,5);2,494(90,6);2,435(0,4);2,334(1,1);2,329(1,4);2,325(1,1);0,008(0,3);0,000(7,8)</p>
<p>Ejemplo Ibi-2: <sup>1</sup>H-RMN(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ= 15,412(3,0);9,356(1,9);9,341(3,5);9,326(1,8);8,313(1,1);8,148(3,9);8,143(4,5);8,127(4,1);8,122(5,5);8,099(6,3);7,809(3,0);7,788(2,7);4,176(1,2);4,152(3,8);4,136(4,0);4,128(4,2);4,112(4,1);4,070(16,0);3,902(2,8);3,509(0,4);3,406(0,5);3,323(628,3);3,260(0,3);3,175(0,6);3,164(0,6);2,676(2,3);2,671(3,1);2,667(2,3);2,541(3,4);2,511(208,3);2,507(394,7);2,502(503,7);2,498(374,4);2,493(190,0);2,333(2,2);2,329(2,9);2,324(2,2);1,235(0,5);0,008(0,7);0,000(15,5);-0,008(0,6)</p>
<p>Ejemplo Ibi-3: <sup>1</sup>H-RMN(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ= 15,339(0,8);8,654(3,1);8,644(3,0);8,314(0,3);8,094(2,6);8,089(3,5);8,073(2,6);8,068(4,4);8,056(5,9);8,051(4,2);7,747(2,8);7,726(2,5);4,281(0,6);4,085(0,9);4,063(16,0);3,902(1,1);3,391(0,4);3,328(198,2);3,278(0,4);3,176(0,4);3,163(0,4);2,891(0,3);2,881(0,9);2,872(1,4);2,863(2,0);2,853(2,0);2,844(1,3);2,835(1,0);2,825(0,4);2,676(0,7);2,672(0,9);2,668(0,7);2,542(0,7);2,511(61,3);2,507(117,2);2,503(151,2);2,498(113,6);2,334(0,7);2,330(0,9);2,325(0,7);0,753(1,2);0,740(3,8);0,736(5,1);0,723(4,8);0,718(4,1);0,706(1,6);0,565(1,7);0,554(5,0);0,548(4,8);0,544(4,6);0,539(4,3);0,526(1,3);0,000(4,5)</p>
<p>Ejemplo Ibi-4: <sup>1</sup>H-RMN(400,0 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO): δ= 15,391(3,5);10,670(4,2);8,247(4,2);8,242(4,0);8,225(0,4);8,177(3,0);8,171(2,4);8,156(3,1);8,150(2,5);7,852(3,4);7,831(3,0);7,744(5,7);7,741(6,4);7,722(6,8);7,402(3,7);7,383(6,0);7,362(3,4);7,161(2,0);7,143(3,1);7,125(1,4);4,291(0,6);4,084(16,0);4,000(0,5);3,902(2,3);3,330(89,2);3,171(1,0);2,677(0,6);2,673(0,7);2,668(0,5);2,512(68,5);2,508(104,9);2,503(119,4);2,499(82,4);2,495(38,3);2,335(0,6);2,330(0,7);2,326(0,5);1,259(0,4);1,235(0,7);0,000(4,1)</p>

### Preparación de los compuestos de partida

Todos los compuestos de partida usados se pueden preparar según o por analogía a procedimientos conocidos de la literatura o se pueden obtener en comercios.

#### 5 Síntesis de 1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carboxilato de metilo



- 10,0 g de ácido 1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carboxílico (32 mmol) se dispusieron en 250 mL de diclorometano p.a. y luego se mezclaron con 8,39 mL de cloruro de oxalilo (96,1 mmol). La mezcla de reacción se agitó durante 30 minutos a temperatura ambiente y luego durante 30 minutos a reflujo. La mezcla de reacción se concentró en el evaporador rotativo hasta sequedad y se extrajo en 100 mL de cloroformo. La solución así obtenida se vertió gota a gota luego a una suspensión de 6,43 g de cianuro de plata (I), 65 mL de metanol p.a. y 150 mL de cloroformo. La mezcla de reacción se calentó luego durante 16 h a reflujo y se enfrió hasta temperatura ambiente. La suspensión se filtró luego sobre sílice y se enjuagó con diclorometano. El disolvente se concentró en el evaporador rotativo hasta sequedad.
- 15 Se aislaron 8,40 g de 1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carboxilato de metilo como líquido incoloro.  
HPLC-MS<sup>a</sup>): logP = 3,42, masa (m/z) = 327 [M+H]<sup>+</sup>.  
<sup>1</sup>H-RMN (400 MHz, d<sub>3</sub>-acetonitrilo): δ = 4,08 (s, 3H), 3,97 (s, 3H).

**Ejemplos de realización biológicos para usar en el área de la fitoprotección y la salud animal****Ctenocephalides felis – ensayo de contacto in vitro con pulgas de gatos**

5 Para el recubrimiento de los tubos de ensayo, se disuelven primero 9 mg de principio activo en 1 ml de acetona p.a. y luego se diluyen a la concentración deseada con acetona p.a. 250 µl de la solución se distribuyen en forma homogénea sobre las paredes interiores y la base de un tubo de ensayo de 25 ml dando vuelta y agitando en un agitador orbital (rotación de agitación a 30 rpm durante 2 h). Con una solución de principio activo de 900 ppm y superficie interna de 44,7 cm<sup>2</sup>, dada una distribución homogénea, se logra una dosis basada en el área de 5 µg/cm<sup>2</sup>.

10 Después de evaporar el disolvente, se ocupan los tubitos con 5-10 pulgas adultas de gato (*Ctenocephalides felis*), se cubre con una tapa perforada de plástico y se incuba a temperatura ambiente y humedad ambiente. Después de 48 h, se determina la eficacia. Para ello, los tubitos se colocan verticales y las pulgas se golpean en el fondo del tubito. Las pulgas que quedan inmóviles en el fondo o que se mueven descoordinadamente rigen como muertas o derribadas.

15 Una sustancia muestra buena eficacia contra *Ctenocephalides felis* si se logró al menos 80 % de eficacia en este ensayo a una tasa de aplicación de 5 µg/cm<sup>2</sup>. 100 % de eficacia significa que todas las pulgas estaban muertas o moribundas. 0 % de eficacia significa que ninguna pulga había sido dañada.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 5 µg/cm<sup>2</sup>: lac-1, laf-1, lap-1, lap-3

**Rhipicephalus sanguineus – ensayo de contacto in vitro con garrapatas adultas pardas de perro**

20 Para el recubrimiento de los tubos de ensayo se disolvieron en primer lugar 9 mg de principio activo en 1 ml de acetona p.a. y a continuación se diluyó con acetona p.a. hasta la concentración deseada. Se distribuyeron 250 µl de la solución mediante agitación y volteo en un agitador de rotación (2 h de rotación por vaivén a 30 rpm) homogéneamente sobre las paredes interiores y el fondo de un tubo de vidrio de 25 ml. Con 900 ppm de solución de principio activo y 44,7 cm<sup>2</sup> de superficie interior se consigue con distribución homogénea una dosis superficial de 5 µg/cm<sup>2</sup>.

25 Tras evaporación del disolvente se infestan los vasos con 5 a 10 garrapatas de perro adultas (*Rhipicephalus sanguineus*), se cierra con una cubierta de plástico agujereada y se incuba en oscuridad a temperatura ambiente y humedad ambiental. Después de 48 h se determina la actividad. A tal efecto se disponen las garrapatas sobre el fondo del vaso y se incuba sobre una placa caliente a 45-50° C durante 5 minutos. Las garrapatas que permanecían inmóviles sobre el fondo o se movían de forma tan descoordinada que no podía de forma intencionada apartarse del calor trepando hacia arriba, se valoran como muertas o afectadas.

30 Una sustancia muestra buen efecto contra *Rhipicephalus sanguineus*, si en este ensayo se consigue con una cantidad de aplicación de 5 µg/cm<sup>2</sup> al menos 80 % de efecto. A este respecto 100 % de efecto significa que todas las garrapatas estaban afectadas o muertas. 0 % de efecto significa que ninguna garrapata sufrió daño.

35 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de ejemplos de preparación muestran un efecto de 100 % con una cantidad de aplicación de 5 µg/cm<sup>2</sup> (500 g/ha): laf-1, lap-1, lap-3, lap-4.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de ejemplos de preparación muestran un efecto de 80 % con una cantidad de aplicación de 5 µg/cm<sup>2</sup> (500 g/ha): lbf-2.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de ejemplos de preparación muestran un efecto de 80 % con una cantidad de aplicación de 1 µg/cm<sup>2</sup> (100 g/ha): lap-2.

**40 Ensayo de *Amblyomma hebraeum* (AMBYHE)**

Disolvente: dimetilsulfóxido

Para la preparación de un preparado de principio activo conveniente se mezcla 10 mg de principio activo con 0,5 ml de dimetilsulfóxido y se diluye el concentrado con agua hasta la concentración deseada.

45 Se disponen ninfas de garrapata (*Amblyomma hebraeum*) en recipientes de plástico perforados y se sumergen a la concentración deseada un minuto. Las garrapatas se transfieren sobre papel de filtro a una columna Petri y se conservan en un armario climatizado.

Después de 42 días se determina la mortalidad en %. A este respecto 100 % significa que todas las garrapatas habían muerto; 0 % significa que ninguna de las garrapatas había muerto.

50 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de ejemplos de preparación muestran un efecto de 100 % con una cantidad de aplicación de 100 ppm: lac-1, lac-3, laf-1, lap-1.

**Boophilus microplus – ensayo de inmersión**

Animales de ensayo: garrapata de caballo (*Boophilus microplus*) cepa: Parkhurst, SP-resistente

Disolvente: dimetilsulfóxido

5 Se disuelven 10 mg de principio activo en 0,5 ml de dimetilsulfóxido. A efectos de preparación de una formulación adecuada se diluye la solución de principio activo con agua hasta la concentración deseada.

10 Este preparado de principio activo se pipetea en tubo. Se transfieren 8-10 garrapatas de caballo sanas, adultas, hembra (*Boophilus microplus*) a un tubo adicional con orificios. El tubo se sumerge en el preparado de principio activo humedeciendo todas las garrapatas por completo. Tras eliminación del líquido se transfieren las garrapatas a placas de filtro en columnas de plásticos y se reservan en una sala climatizada.

El control del efecto se realiza después de 7 días en el estadio de huevos fértiles. Huevos, cuya fertilidad no es visible externamente, se conservan hasta el estado larvario después de aproximadamente 42 días en armario climatizado. Un efecto de 100 % significa que no había huevos fértiles de garrapatas, 0 % significa que todos los huevos son fértiles.

15 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de ejemplos de preparación muestran un efecto de 100 % con una cantidad de aplicación de 100 ppm: lac-1, lac-3, laf-1, lap-1.

**Boophilus microplus – ensayo de inyección**

Solvente: dimetilsulfóxido

20 Para producir una formulación de principio activo apropiada, 10 mg de principio activo se mezclan con 0,5 ml de solvente y el concentrado es diluido con solvente a la concentración deseada.

1 µl de la solución de principio activo es inyectada en el abdomen de 5 garrapatas hembras adultas de ganado vacuno llenas de sangre (*Boophilus microplus*). Los animales son transferidos a discos y mantenidos en un ambiente de clima controlado.

25 La eficacia es evaluada después de 7 días por la postura de huevos fértiles. Los huevos que no son visiblemente fértiles son almacenados en un gabinete de clima controlado hasta que las larvas eclosionan después de aproximadamente 42 días. Una eficacia de 100 % significa que ninguna de las garrapatas ha puesto huevos fértiles; 0 % significa que todos los huevos son fértiles.

30 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 20 µg/animal: laa-1, lac-1, lac-3, laf-1, lap-1, lap-2, lap-3, lap-4, lap-5, lbe-4, lbf-2, lbf-3, lbf-4.

**Ctenocephalides felis - ensayo oral**

Solvente: dimetilsulfóxido

Para el propósito de producir una formulación de principio activo apropiada, 10 mg de principio activo se mezclan con 0,5 ml de dimetilsulfóxido. La dilución con sangre citrada de ganado vacuno da la concentración deseada.

35 Aproximadamente 20 pulgas adultas no alimentadas de gatos (*Ctenocephalides felis*) son colocadas en una cámara que es cerrada en la parte superior y la parte inferior con gasa. Un cilindro de metal cuyo extremo inferior está cerrado con parafilm es colocado sobre la cámara. El cilindro contiene la preparación de sangre/principio activo, que puede ser embebida por las pulgas a través de la membrana de parafilm.

40 Después de 2 días, se determina la mortalidad en %. 100 % significa que todas las pulgas murieron; 0 % significa que ninguna pulga murió.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 90 % a una tasa de aplicación de 100 ppm: laa-1, lac-1, lac-3, laf-1, lap-1, lap-2, lap-3, lap-4, lap-5, lbe-4, lbf-2, lbf-3.

45 En este ensayo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran, por ejemplo, una acción del 90 % con una cantidad de aplicación de 100 ppm: lbf-4.

**Ensayo de *Lucilia cuprina***

Solvente: dimetilsulfóxido

Para producir una formulación de principio activo apropiada, 10 mg de principio activo se mezclan con 0,5 ml de dimetilsulfóxido y el concentrado es diluido con agua a la concentración deseada.

5 Aproximadamente 20 larvas L11 de la mosca miásica de la oveja australiana (*Lucilia cuprina*) son transferidas a un recipiente de ensayo que contiene carne de caballo picada y la preparación de principio activo de la concentración deseada.

Después de 2 días, se determina la mortalidad en %. 100 % significa que todas las larvas murieron; 0 % significa que ninguna de las larvas murió.

10 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 100 ppm: laa-1, lac-1, lac-3, laf-1, lap-1, lap-2, lap-3, lap-4, lap-5, lbe-4, lbf-2, lbf-3, lbh-4.

**Ensayo de la *Musca domestica***

Solvente: dimetilsulfóxido

Para producir una formulación de principio activo apropiada, 10 mg de principio activo se mezclan con 0,5 ml de dimetilsulfóxido y el concentrado es diluido con agua a la concentración deseada.

15 Los recipientes que contienen una esponja tratada con una solución de azúcar y la formulación de principio activo de la concentración deseada son pobladas con 10 moscas comunes adultas (*Musca domestica*).

Después de 2 días, se determinó la mortalidad en %. 100 % significa que todas las moscas murieron; 0 % significa que ninguna mosca murió.

20 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 100 ppm: laa-1, lac-1, lac-3, lap-1, lap-2, lap-3, lap-5, lbe-4, lbf-2.

En este ensayo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran, por ejemplo, una acción del 90 % con una cantidad de aplicación de 100 ppm: lbh-4.

En este ensayo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran, por ejemplo, una acción del 80 % con una cantidad de aplicación de 100 ppm: lbf-3.

25 ***Myzus persicae* – ensayo de rociado**

Solvente: 78 partes en peso de acetona  
1,5 partes en peso de dimetilformamida  
Emulsionante: alquilarilpoliglicoléter

30 Para producir una formulación de principio activo apropiada, 1 parte en peso de principio activo se disuelve usando las partes en peso de solvente especificadas y se completa con agua que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm hasta que se alcanza la concentración deseada. Para producir otras concentraciones de prueba, la preparación se diluye con agua que contiene emulsionante.

Discos de hojas de col china (*Brassica pekinensis*) infestadas con todas las etapas del áfido verde del durazno (*Myzus persicae*) son rociadas con una formulación de principio activo de la concentración deseada.

35 Después de 6 días, se determinó la eficacia en %. 100 % significa que todos los áfidos murieron; 0 % significa que ninguno de los áfidos murió.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 100 g/ha: laf-1.

***Phaedon cochleariae* – ensayo de rociado**

40 Solvente: 78,0 partes en peso de acetona  
1,5 partes en peso de dimetilformamida  
Emulsionante: alquilarilpoliglicoléter

45 Para producir una formulación de principio activo apropiada, 1 parte en peso de principio activo se disuelve usando las partes en peso de solvente especificadas y se completa con agua que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm hasta que se alcanza la concentración deseada. Para producir otras concentraciones de ensayo, la preparación se diluye con agua que contiene emulsionante.

Discos de col china (*Brassica pekinensis*) son rociados con una formulación de principio activo de la concentración deseada y, después de secar, son poblados con larvas de escarabajo de la mostaza (*Phaedon cochleariae*).

Después de 7 días, se determinó la eficacia en %. 100 % significa que todas las larvas de escarabajo murieron; 0 % significa que ninguna larva de escarabajo murió.

- 5 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 500 g/ha: laj-1, lap-4, lbd-3, lbe-1, lbe-3, lbe-4, lbf-2, lbf-3, lbg-13, lbg-5, lbg-7, lbg-8, lbg-9, lbh-3, lbh-4, lbh-5, lbh-6, lbh-8.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 100 g/ha: laa-1, lac-1, lac-3, laf-1, lap-1, lap-2, lap-3, lap-5, lap-6, laq-1, lax-1.

10 **Spodoptera frugiperda – ensayo de rociado**

Solvente:	78,0 partes en peso de acetona
	1,5 partes en peso de dimetilformamida
Emulsionante:	alquilarilpoliglicoléter

- 15 Para producir una formulación de principio activo apropiada, 1 parte en peso de principio activo se disuelve usando las partes en peso de solvente especificadas y se completa con agua que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm hasta que se alcanza la concentración deseada. Para producir otras concentraciones de prueba, la preparación se diluye con agua que contiene emulsionante.

Discos de hojas de maíz (*Zea mays*) son rociadas con una formulación de principio activo de la concentración deseada y, después de secar, son poblados con oruga militar tardía (*Spodoptera frugiperda*).

- 20 Después de 7 días, se determina la eficacia en %. 100 % significa que todas las orugas murieron; 0 % significa que ninguna oruga murió.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 500 g/ha: lbe-1, lbe-4, lbf-2, lbf-3, lbh-3.

- 25 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 83 % a una tasa de aplicación de 500 g/ha: lbh-8.

En este ensayo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran, por ejemplo, una acción del 80 % con una cantidad de aplicación de 500 g/ha: lap-4.

En este ensayo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran, por ejemplo, una acción del 100 % con una cantidad de aplicación de 100 g/ha: laa-1, lac-1, lac-3, laf-1, lap-1, lap-2, lap-3.

30 **Tetranychus urticae – ensayo de rociado, resistente a OP**

Solvente:	78,0 partes en peso de acetona
	1,5 partes en peso de dimetilformamida
Emulsionante:	alquilarilpoliglicoléter

- 35 Para producir una formulación de principio activo apropiada, 1 parte en peso de principio activo se disuelve usando las partes en peso de solvente especificadas y se completa con agua que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm hasta que se alcanza la concentración deseada. Para producir otras concentraciones de prueba, la preparación se diluye con agua que contiene emulsionante.

Discos de hojas de poroto (*Phaseolus vulgaris*) infestados con todas las etapas de la araña roja de los invernaderos (*Tetranychus urticae*) son rociados con una formulación de principio activo de la concentración deseada.

- 40 Después de 6 días, se determina la eficacia en %. 100 % significa que todas las arañas rojas murieron; 0 % significa que ninguna de las arañas rojas murió.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 500 g/ha: lbh-4.

- 45 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 90 % a una tasa de aplicación de 500 g/ha: lap-4, lbe-4, lbg-5, lbh-3.

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

100 % a una tasa de aplicación de 100 g/ha: lac-1, lac-3, laf-1, lap-3.

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

Disolvente: 7 partes en peso de dimetilformamida

5 Emulsionante: alquilarilpoliglicoléter

10 Para producir una preparación de principio activo apropiada, 1 parte en peso de principio activo se disuelve con las partes en peso de disolvente indicadas y se llena con agua, que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm, hasta lograr la concentración deseada. Para preparar otras concentraciones de ensayo, se diluye con agua con contenido de emulsionante. Con una adición necesaria de sales de amonio y/o estimulantes de la penetración, se añaden en cada caso en una concentración de 1000 ppm de la solución del preparado.

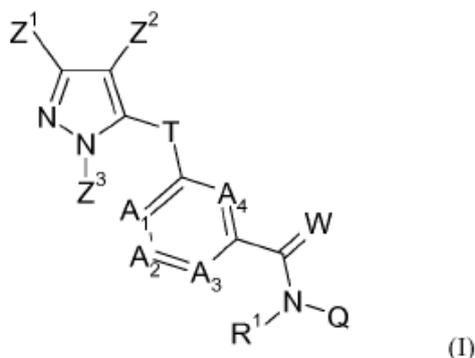
Plantas de porotos (*Phaseolus vulgaris*), que están muy infestadas por todos los estadios de *Tetranychus urticae*, se tratan por pulverización de la preparación de principio activo en la concentración deseada.

Después de 7 días, se determina la acción en %. En este caso, 100 % significa que se mataron todos los ácaros; 0 % significa que no se mató a ningún ácaro.

15 En este ensayo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran, por ejemplo, una acción del 100 % con una cantidad de aplicación de 20 ppm: lap-1.

REIVINDICACIONES

1. Compuestos de la fórmula general (I)



en los que

5 R<sup>1</sup> representa hidrógeno, representa alquilo, alquenoilo, alquinilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, alquilcarbonilo, alcocarbonilo, arilalquilo, heteroarilalquilo dado el caso sustituidos,

los grupos químicos

10 A<sub>1</sub> representa CR<sup>2</sup> o nitrógeno,  
 A<sub>2</sub> representa CR<sup>3</sup> o nitrógeno,  
 A<sub>3</sub> representa CR<sup>4</sup> o nitrógeno y  
 A<sub>4</sub> representa CR<sup>5</sup> o nitrógeno,

pero en donde no más que tres de los grupos químicos A<sub>1</sub> a A<sub>4</sub> representan al mismo tiempo nitrógeno;

15 R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> representan, de modo independiente entre sí, hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, representan alquilo, cicloalquilo, alcoxi, *N*-alcoxi-imino-alquilo, alquilsulfanilo, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, *N*-alquilamino o *N,N*-dialquilamino dado el caso sustituidos;

cuando ninguno de los grupos A<sub>2</sub> y A<sub>3</sub> representa nitrógeno, R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> pueden formar junto con el átomo de carbono al que están unidos un anillo de 5 o 6 miembros, que contiene 0, 1 o 2 átomos de nitrógeno y/o 0 o 1 átomo de oxígeno y/o 0 o 1 átomo de azufre o

20 cuando ninguno de los grupos A<sub>1</sub> y A<sub>2</sub> representa nitrógeno, R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> pueden formar junto con el átomo de carbono al que están unidos un anillo de 6 miembros, que contiene 0, 1 o 2 átomos de nitrógeno;

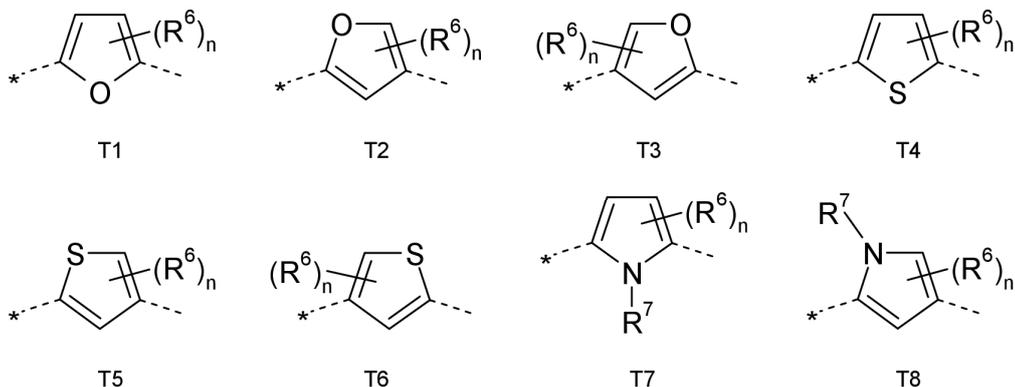
W representa oxígeno o azufre;

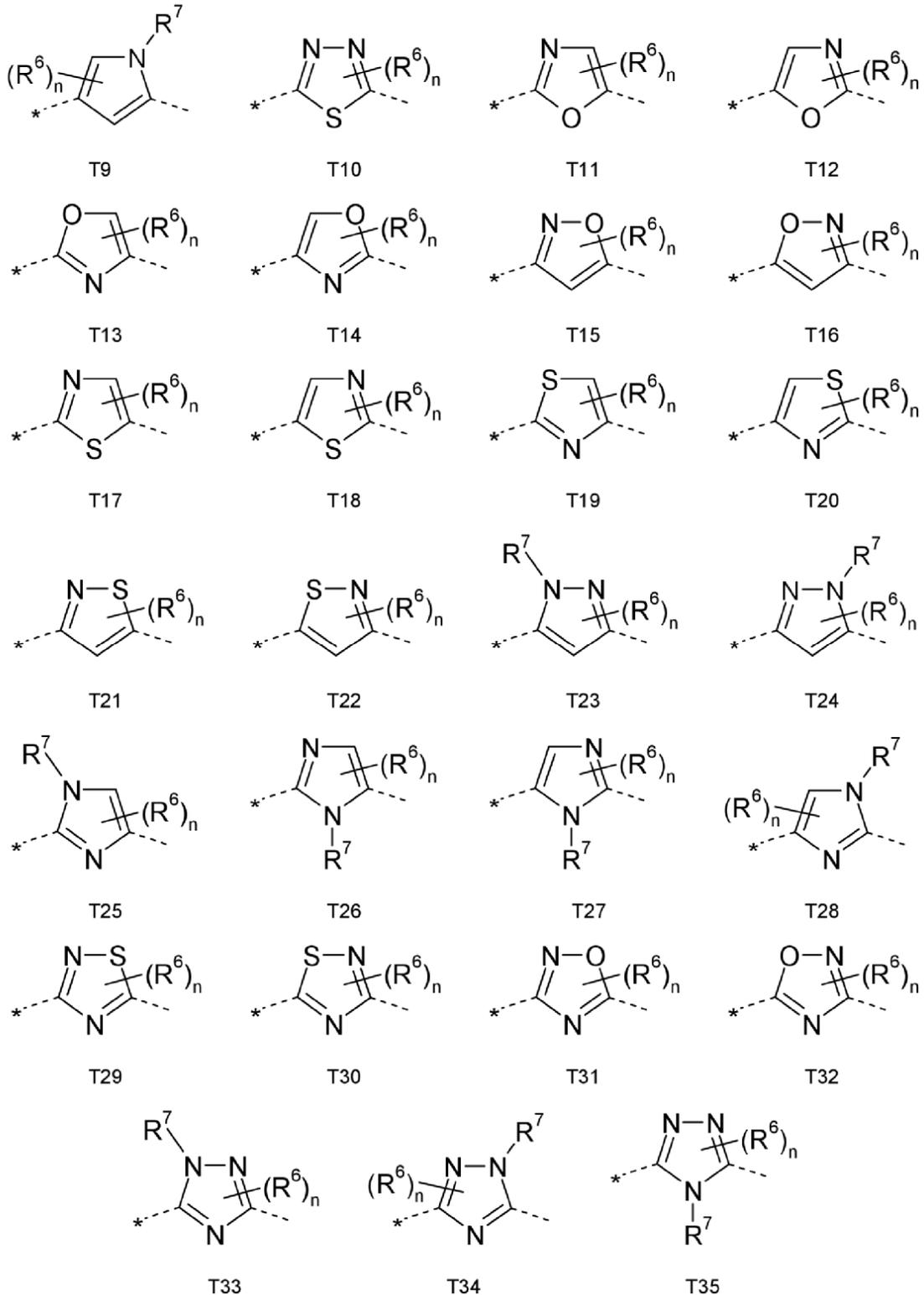
Q representa hidrógeno, formilo, hidroxi, amino o uno de los grupos dado el caso sustituidos alquilo, alquiloxi, alquenoilo, alquinilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, cicloalquilalquilo, heterocicloalquilalquilo, arilalquilo, heteroarilalquilo o representa un grupo *N*-alquilamino, *N*-alquilcarbonilamino, *N,N*-dialquilamino; o

25 Q representa un carbociclo de 5 a 6 miembros mono- a poliinsaturado mono- a polisustituido dado el caso con V, que puede estar interrumpido dado el caso por heteroátomos, en donde

V representa halógeno, ciano, nitro, alquilo, alquenoilo, alquinilo, cicloalquilo, alcoxi, *N*-alcoxiiminoalquilo, alquilsulfanilo, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, *N,N*-dialquilamino dado el caso sustituidos

30 T representa uno de los compuestos heteroaromáticos T1-T35 de 5 miembros enumerados a continuación, en donde la unión con el grupo de cabeza de pirazol está identificada con un asterisco,





en donde

R<sup>6</sup> representa, de modo independiente entre sí, halógeno, ciano, nitro, amino o un alquilo, alquiloxi, alquilcarbonilo, alquilsulfanilo, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo dado el caso sustituidos y n representa los valores 0-2;

5 R<sup>7</sup> representa hidrógeno o un alquilo o cicloalquilo dado el caso sustituidos, en donde llegado el caso un grupo metileno está sustituido con un heteroátomo;

Z<sup>1</sup> representa haloalquilo o halocicloalquilo dado el caso sustituidos y

Z<sup>2</sup> representa hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, amino o un alquilo, alquilcarbonilo, alquilsulfanilo, alquilsulfonilo, alquilsulfonilo dado el caso sustituidos y

Z<sup>3</sup> representa hidrógeno o un alquilo, cicloalquilo, heterocicloalquilo, alquenilo, alquinilo dado el caso sustituidos; en donde para el caso de que T sea igual a T23 o T24, uno de los radicales Z<sup>1</sup>, Z<sup>2</sup> o Z<sup>3</sup> esté sustituido con al menos 3 átomos de halógeno.

2. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, en los que

R<sup>1</sup> representa hidrógeno, representa alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>, cicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-carbonilo, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-carbonilo, arilalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), heteroarilalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>) dado el caso sustituidos,

los grupos químicos

A<sub>1</sub> representa CR<sup>2</sup> o nitrógeno,  
 A<sub>2</sub> representa CR<sup>3</sup> o nitrógeno,  
 A<sub>3</sub> representa CR<sup>4</sup> o nitrógeno y  
 A<sub>4</sub> representa CR<sup>5</sup> o nitrógeno,

pero en donde no más que tres de los grupos químicos A<sub>1</sub> a A<sub>4</sub> representan al mismo tiempo nitrógeno;

R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> representa, de modo independiente entre sí, hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, representan alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, N-alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-imino-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-sulfanilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-sulfonilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-sulfonilo, N-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-amino, N,N-di-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-amino dado el caso sustituidos, o cuando ninguno de los grupos A<sub>2</sub> y A<sub>3</sub> representa nitrógeno, R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> pueden formar junto con el átomo de carbono al que están unidos un anillo de 5 o 6 miembros, que contiene 0, 1 o 2 átomos de nitrógeno y/o 0 o 1 átomo de oxígeno y/o 0 o 1 átomo de azufre o

cuando ninguno de los grupos A<sub>1</sub> y A<sub>2</sub> representa nitrógeno, R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> pueden formar junto con el átomo de carbono al que están unidos un anillo de 6 miembros, que contiene 0, 1 o 2 átomos de nitrógeno;

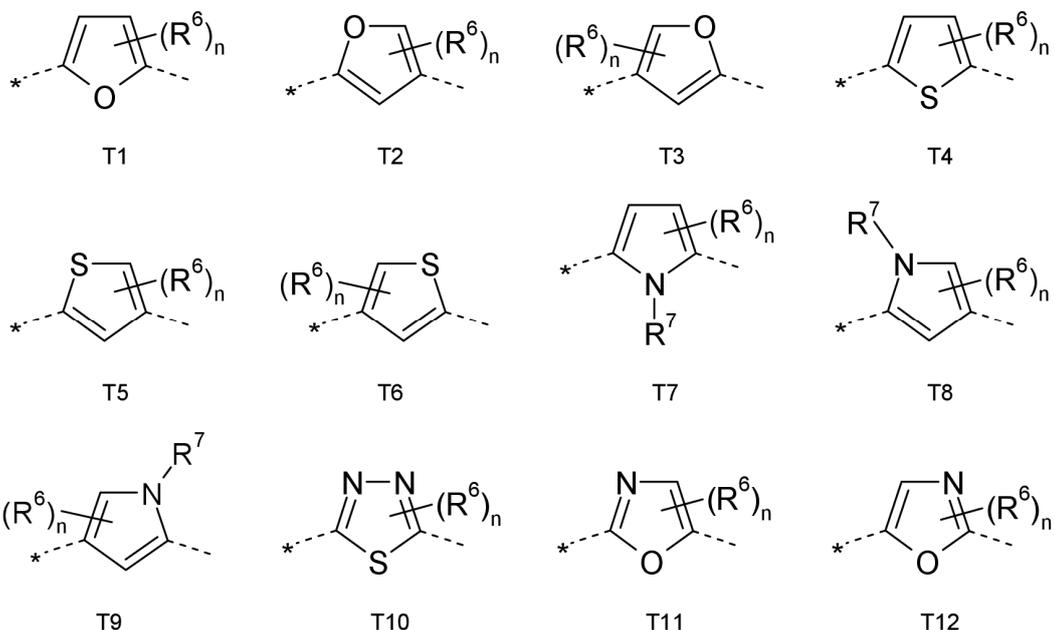
W representa oxígeno o azufre;

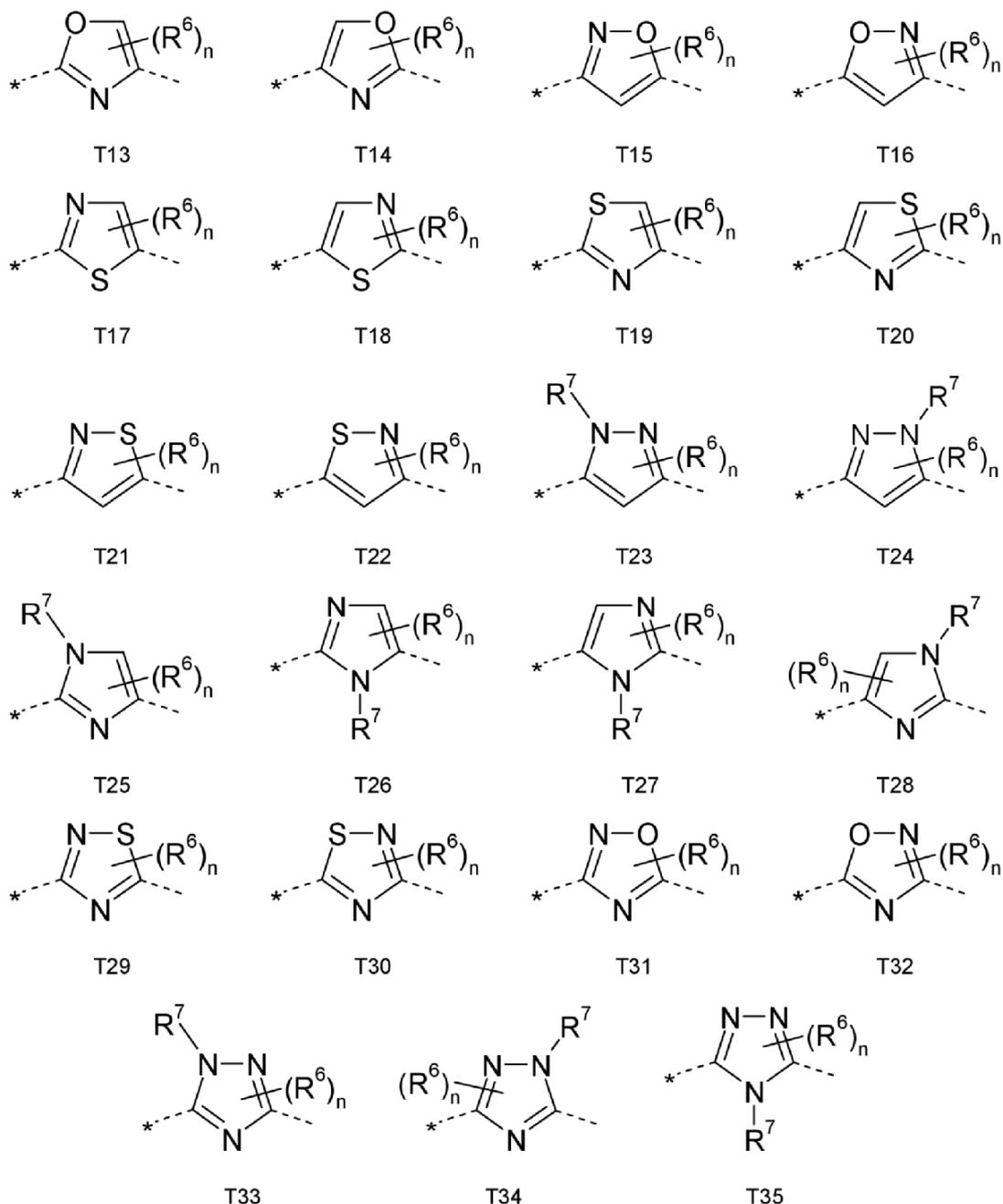
Q representa hidrógeno, formilo, hidroxilo, amino o uno de los grupos dado el caso sustituidos alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, heterocicloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, aril-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), heteroaril-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>) o representa un grupo N-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-amino, N-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-carbonilamino, N,N-di-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-amino dado el caso sustituidos; o

Q representa un carbociclo de 5 a 6 miembros mono- a triinsaturado mono- a polisustituido dado el caso con V o representa un anillo heterocíclico de 5 a 6 miembros mono- a triinsaturado polisustituido dado el caso con V, en donde

V representa, de modo independiente entre sí, halógeno, ciano, nitro, representa alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, N-alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-imino-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-sulfanilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-sulfonilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-sulfonilo, N,N-di-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)amino dado el caso sustituidos;

T representa uno de los compuestos heteroaromáticos T1-T35 de 5 miembros enumerados a continuación, en donde la unión con el grupo de cabeza de pirazol está identificada con un asterisco,





en donde

$R^6$  representa, de modo independiente entre sí, halógeno, ciano, nitro, amino o un alquilo  $C_1-C_6$ , alquil  $C_1-C_6$ -oxi, alquil  $C_1-C_6$ -carbonilo, alquil  $C_1-C_6$ -sulfanilo, alquil  $C_1-C_6$ -sulfinilo, alquil  $C_1-C_6$ -sulfonilo dado el caso sustituidos con halógeno y

5  $n$  representa los valores 0-1;  
 $R^7$  representa hidrógeno o un alquilo  $C_1-C_6$  o cicloalquilo  $C_3-C_6$  dado el caso sustituidos, en donde un grupo metileno puede estar sustituido dado el caso con heteroátomos;

10  $Z^1$  representa haloalquilo  $C_1-C_6$ , halocicloalquilo  $C_3-C_6$  dado el caso sustituidos, y  
 $Z^2$  representa hidrógeno halógeno, ciano, nitro, amino o un alquilo  $C_1-C_6$ , alquil  $C_1-C_6$ -carbonilo, alquil  $C_1-C_6$ -sulfanilo, alquil  $C_1-C_6$ -sulfinilo, alquil  $C_1-C_6$ -sulfonilo dado el caso sustituidos y

$Z^3$  representa hidrógeno o un alquilo  $C_1-C_6$ , cicloalquilo  $C_3-C_6$ , heterocicloalquilo  $C_3-C_5$ , alquenilo  $C_3-C_6$ , alquinilo  $C_3-C_6$  dado el caso sustituidos

15 en donde para el caso de que T sea igual a T23 o T24, uno de los radicales  $Z^1$ ,  $Z^2$  o  $Z^3$  esté sustituido con al menos 3 átomos de halógeno.

3. Compuestos de acuerdo con las reivindicación 1 o 2, en los que

R<sup>1</sup> representa hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>, cicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-carbonilo, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-carbonilo, arilalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), heteroarilalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>) dado el caso mono- a pentasustituido, de modo independiente entre sí, con flúor, cloro, ciano, alcoxi y alcoxicarbonilo.

5 los grupos químicos

A<sub>1</sub> representa CR<sup>2</sup> o nitrógeno,  
 A<sub>2</sub> representa CR<sup>3</sup> o nitrógeno,  
 A<sub>3</sub> representa CR<sup>4</sup> o nitrógeno y  
 A<sub>4</sub> representa CR<sup>5</sup> o nitrógeno,

10 pero en donde no más que tres de los grupos químicos A<sub>1</sub> a A<sub>4</sub> representan al mismo tiempo nitrógeno;

R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> representan, de modo independiente entre sí, hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, representan alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, N-alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-imino-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-sulfanilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-sulfinilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-sulfonilo, N-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-amino o N,N-di-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-amino dado el caso mono- a pentasustituido con flúor, cloro, ciano o alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;

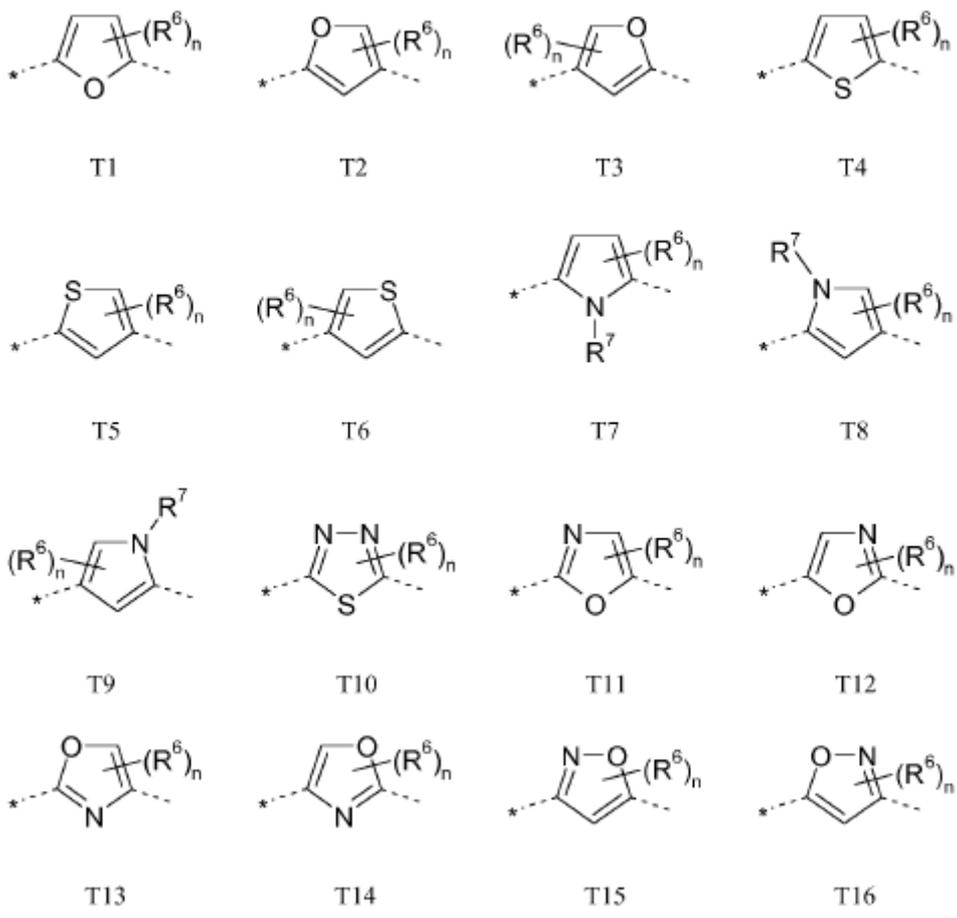
15 W representa oxígeno o azufre;

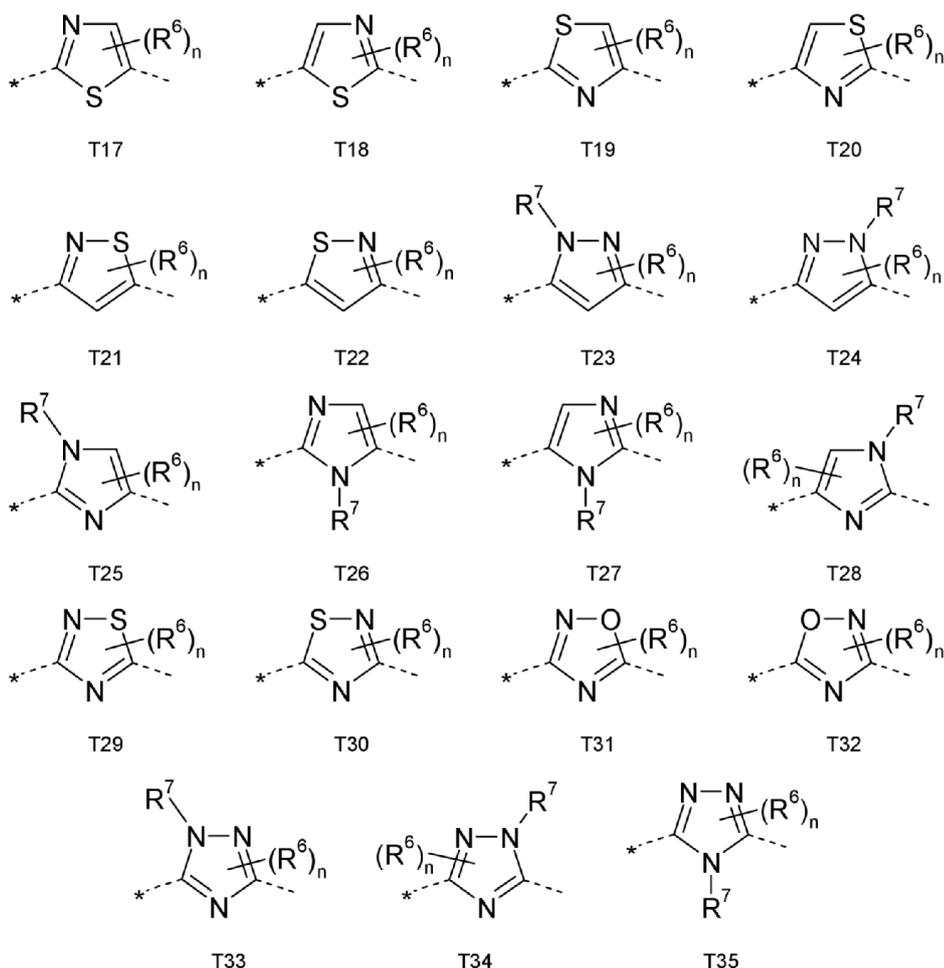
Q representa hidrógeno, hidroxilo, formilo, amino o uno de los grupos alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, heterocicloalquilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, hidroxialquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, arilalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), heteroarilalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), N-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-amino, N-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-carbonilamino o N,N-di-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-amino mono- o polisustituidos dado el caso, de modo independiente entre sí, con hidroxilo, nitro, amino, flúor, cloro, bromo, yodo, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, ciano, hidroxicarbonilo, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-carbonilo, carbamoilo, tiocarbamoilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-carbamoilo, cicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-carbamoilo, fenilo; o

20 Q representa un arilo sustituido con 0, 1, 2 o 3 sustituyentes V o un compuesto heteroaromático de 5 o 6 miembros sustituido con 0, 1, 2 o 3 sustituyentes V, en donde

V representa, de modo independiente entre sí, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, representa alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, N-alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-imino-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-sulfanilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-sulfinilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-sulfonilo, N,N-di-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)amino dado el caso sustituidos;

T representa uno de los compuestos heteroaromáticos T1-T35 de 5 miembros enumerados a continuación, en donde la unión con el grupo de cabeza de pirazol está identificada con un asterisco,





en donde

$R^6$  representa, de modo independiente entre sí, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, amino o un alquilo  $C_1-C_6$ , alcoxi  $C_1-C_6$ , alquil  $C_1-C_6$ -carbonilo, alquil  $C_1-C_6$ -sulfanilo, alquil  $C_1-C_6$ -sulfinilo, alquil  $C_1-C_6$ -sulfonilo dado el caso mono- a pentasustituidos con flúor o cloro y  $n$  representa los valores 0-1;

$R^7$  representa hidrógeno o un alquilo  $C_1-C_6$  o cicloalquilo  $C_3-C_6$  dado el caso mono- a pentasustituidos con flúor, cloro, ciano o alcoxi  $C_1-C_4$ , en donde un grupo metileno puede estar sustituido dado el caso por heteroátomos;

$Z^1$  representa un haloalquilo  $C_1-C_6$ , halocicloalquilo  $C_3-C_6$  dado el caso sustituidos, y

$Z^2$  representa hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, amino o un alquilo  $C_1-C_6$ , alquil  $C_1-C_6$ -carbonilo, alquil  $C_1-C_6$ -sulfanilo, alquil  $C_1-C_6$ -sulfinilo, alquil  $C_1-C_6$ -sulfonilo dado el caso mono- a pentasustituidos y

$Z^3$  representa hidrógeno o un alquilo  $C_1-C_6$ , cicloalquilo  $C_3-C_6$ , alquenilo  $C_1-C_4$ , alquinilo  $C_1-C_4$  dado el caso mono- a pentasustituidos con flúor, cloro, ciano o alcoxi  $C_1-C_4$ ;

en donde para el caso de que T sea igual a T23 o T24, uno de los radicales  $Z^1$ ,  $Z^2$  o  $Z^3$  esté sustituido con al menos 3 átomos de halógeno.

4. Compuestos de acuerdo con una de las reivindicaciones 1, 2 o 3, en los que

$R^1$  representa hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, s-butilo, t-butilo, 2,2,-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, metoximetilo, etoximetilo, propoximetilo, metilcarbonilo, etilcarbonilo, n-propilcarbonilo, isopropilcarbonilo, s-butilcarbonilo, t-butilcarbonilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n-propoxicarbonilo, isopropoxicarbonilo, s-butoxicarbonilo, t-butoxicarbonilo, cianometilo, 2-cianoetilo, bencilo, 4-metoxibencilo, pirid-2-il-metilo, pirid-3-il-metilo, pirid-4-il-metilo, 6-cloro-pirid-3-il-metilo;

los grupos químicos

$A_1$  representa  $CR^2$  o nitrógeno,

$A_2$  representa  $CR^3$  o nitrógeno,

$A_3$  representa  $CR^4$  o nitrógeno y

$A_4$  representa  $CR^5$  o nitrógeno,

pero en donde no más que tres de los grupos químicos A<sub>1</sub> a A<sub>4</sub> representan al mismo tiempo nitrógeno;

R<sup>2</sup> y R<sup>5</sup> representan, de modo independiente entre sí, hidrógeno, metilo, flúor y cloro y

R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> representan, de modo independiente entre sí, hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, metilo, etilo, ciclopropilo, fluorometilo, difluorometilo, clorodifluorometilo, trifluorometilo, 2,2,2-trifluoroetilo, metoxi, etoxi, n-propoxi, 1-metiletoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, cloro-difluorometoxi, dicloro-fluorometoxi, trifluorometoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2,2-difluoroetoxi, pentafluoroetoxi, N-metoxiiminometilo, 1-(N-metoxiimino)-etilo, metilsulfanilo, trifluorometilsulfanilo, metilsulfonilo, metilsulfinilo, trifluorometilsulfonilo, trifluorometilsulfinilo;

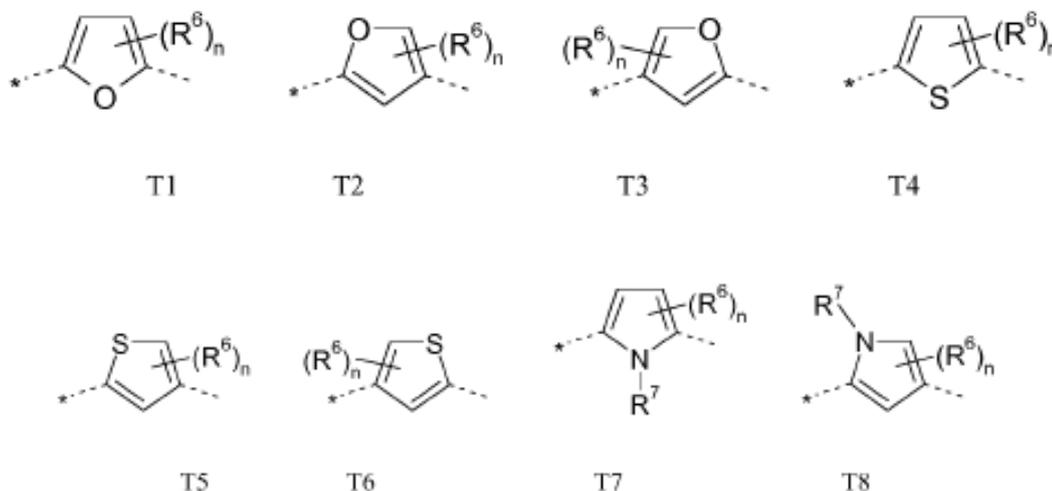
W representa oxígeno o azufre;

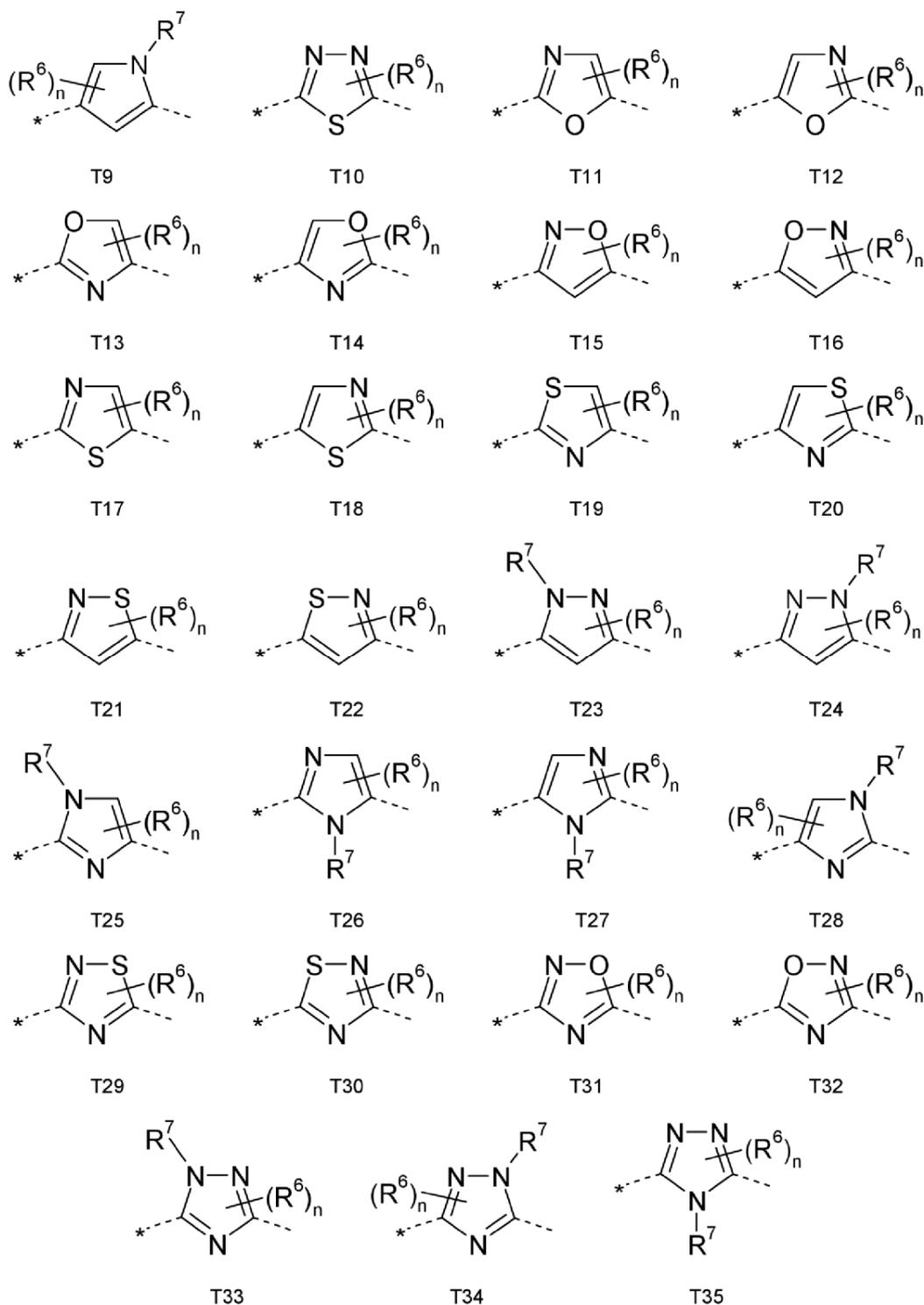
Q representa hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, 1-metiletilo, 1,1-dimetiletilo, 1-metilpropilo, n-butilo, 2-metilpropilo, 2-metilbutilo, hidroxietilo, 2-hidroxipropilo, cianometilo, 2-cianoetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 1-trifluorometiletilo, 2,2-difluoropropilo, 3,3,3-trifluoropropilo, 2,2-dimetil-3-fluoropropilo, ciclopropilo, 1-ciano-ciclopropilo, 1-metil-ciclopropilo, 1-trifluorometil-ciclopropilo, 1-carbamoil-ciclopropilo, 1-tiocarbamoil-ciclopropilo, 1-metoxicarbonil-ciclopropilo, 1-(N-metilcarbamoil)ciclopropilo, 1-(N-ciclopropilcarbamoil)ciclopropilo, ciclopropil-metilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, 1-ciclopropiletilo, bis(ciclopropil)metilo, 2,2-dimetilciclopropil-metilo, 2-fenilciclopropilo, 2,2-diclorociclopropilo, trans-2-clorociclopropilo, cis-2-clorociclopropilo, 2,2-difluorciclopropilo, trans-2-fluorciclopropilo, cis-2-fluorciclopropilo, trans-4-hidroxiciclohexilo, 4-trifluorometilciclohexilo, prop-2-enilo, 2-metilprop-2-enilo, prop-2-inilo, 1,1-dimetilbut-2-inilo, 3-cloro-prop-2-enilo, 3,3-dicloro-prop-2-enilo, 3,3-dicloro-1,1-dimetilprop-2-enilo, oxetan-3-ilo, tietan-3-ilo, 1-oxido-tietan-3-ilo, 1,1-dioxido-tietan-3-ilo, isoxazol-3-ilmetilo, 1,2,4-triazol-3-ilmetilo, 3-metiloxetan-3-ilmetilo, bencilo, 2,6-difluorofenilmetilo, 3-fluorofenilmetilo, 2-fluorofenilmetilo, 4-fluorofenilmetilo, 2,5-difluorofenilmetilo, 1-feniletilo, 4-clorofeniletilo, 2-trifluorometilfeniletilo, 1-piridin-2-iletilo, piridin-2-ilmetilo, 5-fluoropiridin-2-ilmetilo, (6-cloro-piridin-3-il)metilo, pirimidin-2-ilmetilo, metoxi, 2-etoxietilo, 2-(metilsulfanil)etilo, 1-metil-2-(etilsulfanil)etilo, 2-metil-1-(metilsulfanil)propan-2-ilo, metoxicarbonilo, metoxicarbonilmetilo, NH<sub>2</sub>, N-etilamino, N-alilamino, N,N-dimetilamino, N,N-diethylamino; o

Q representa un fenilo, naftilo, piridazina, pirazina, pirimidina, triazina, piridina, pirazol, tiazol, isotiazol, oxazol, isoxazol, triazol, Imidazol, furano, tiofeno, pirrol, oxadiazol, tiadiazol sustituidos con 0, 1, 2 o 3 sustituyentes V, en donde

V representa, de modo independiente entre sí, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, metilo, etilo, difluorometilo, triclorometilo, clorodifluorometilo, diclorofluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 1,2,2,2-tetrafluoroetilo, 1-cloro-1,2,2,2-tetrafluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 1,1-difluoroetilo, pentafluoroetilo, heptafluoro-n-propilo, heptafluoro-isopropilo, nonafluoro-n-butilo, ciclopropilo, ciclobutilo, metoxi, etoxi, n-propoxi, 1-metiletoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, cloro-difluorometoxi, dicloro-fluorometoxi, trifluorometoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2,2-difluoroetoxi, pentafluoroetoxi, N-metoxiiminometilo, 1-(N-metoxiimino)-etilo, metilsulfanilo, metilsulfonilo, metilsulfinilo, trifluorometilsulfonilo, trifluorometilsulfinilo, trifluorometilsulfanilo, N,N-dimetilamino;

T representa uno de los compuestos heteroaromáticos T1-T35 de 5 miembros enumerados a continuación, en donde la unión con el grupo de cabeza de pirazol está identificada con un asterisco,





en donde

$R^6$  representa, de modo independiente entre sí, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, amino, metilo, etilo, n-propilo, 1-metiletilo, terc-butilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, etoxi, trifluorometoxi, 2,2-difluoroetoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, metilcarbonilo, etilcarbonilo, trifluorometilcarbonilo, metilsulfanilo, metilsulfinilo, metilsulfonilo, trifluorometilsulfonilo, trifluorometilsulfanilo, trifluorometilsulfinilo y

5

$n$  representa los valores 0-1;  
 $R^7$  representa hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, s-butilo, t-butilo, etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-propinilo, 1-butinilo, difluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 1-fluoro-1-metiletilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo;

10

$Z^1$  representa difluorometilo, triclorometilo, clorodifluorometilo, diclorofluorometilo, trifluorometilo,

bromodiclorometilo, 1-fluoroetilo, 1-fluoro-1-metiletilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 1,2,2,2-tetrafluoroetilo, 1-cloro-1,2,2,2-tetrafluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 1,1-difluoroetilo, pentafluoroetilo, heptafluoro-n-propilo, heptafluoro-isopropilo, nonafluoro-n-butilo, 1-clorociclopropilo, 1-fluorociclopropilo, 1-bromociclopropilo, 1-trifluorometil-ciclopropilo y 2,2-difluoro-1-metil-ciclopropilo, y

5  $Z^2$  representa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, amino, metilo, etilo, n-propilo, 1-metiletilo, 1,1-dimetiletilo, difluorometilo, triclorometilo, clorodifluorometilo, diclorofluorometilo, trifluorometilo, bromodiclorometilo, 1-fluoroetilo, 1-fluoro-1-metiletilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 1,2,2,2-tetrafluoroetilo, 1-cloro-1,2,2,2-tetrafluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 1,1-difluoroetilo, pentafluoroetilo, heptafluoro-t-butilo, heptafluoro-n-propilo, heptafluoro-isopropilo, nonafluoro-n-butilo, metilsulfanilo, metilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfanilo, etilsulfinilo, etilsulfonilo, trifluorometilsulfanilo, trifluorometilsulfinilo, trifluorometilsulfonilo, cloro-difluorometilsulfanilo, cloro-difluorometilsulfinilo, cloro-difluorometilsulfonilo, dicloro-fluorometilsulfanilo, dicloro-fluorometilsulfinilo, dicloro-fluorometilsulfonilo y

10  $Z^3$  representa hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, s-butilo, t-butilo, prop-2-enilo, prop-2-inilo, but-3-inilo, difluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 1-fluoro-1-metiletilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo;

15

en donde para el caso de que T sea igual a T23 o T24, uno de los radicales  $Z^1$ ,  $Z^2$  o  $Z^3$  esté sustituido con al menos 3 átomos de halógeno.

5. Compuestos de acuerdo con una de las reivindicaciones 1, 2, 3 o 4, en los que

$Z^1$  representa trifluorometilo, 1-cloro-ciclopropilo, 1-fluoro-ciclopropilo o pentafluoroetilo,

20  $Z^2$  representa trifluorometilo, nitro, metilsulfanilo, metilsulfinilo, metilsulfonilo, flúor, cloro, bromo, ciano o yodo,

$Z^3$  representa metilo, etilo, n-propilo o hidrógeno,

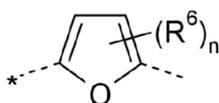
$R^1$  representa hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, i-butilo, s-butilo, t-butilo, metoximetilo, etoximetilo, propoximetilo, metilcarbonilo, etilcarbonilo, n-propilcarbonilo, isopropilcarbonilo, s-butilcarbonilo, t-butilcarbonilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n-propoxicarbonilo, isopropoxicarbonilo, s-butoxicarbonilo, t-butoxicarbonilo, cianometilo, 2-cianoetilo, bencilo, 4-metoxibencilo, pirid-2-il-metilo, pirid-3-il-metilo, pirid-4-il-metilo, 6-cloro-pirid-3-il-metilo,

25  $A^1$  y  $A^4$  representan CH y  $A^2$  representa CH o N

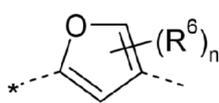
$A_3$  representa  $CR^4$  y

$R^4$  representa flúor, cloro, bromo, yodo o metilo

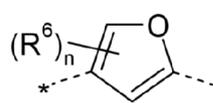
30 T representa uno de los compuestos heteroarómicos T1-T35 de 5 miembros enumerados a continuación, en donde la unión con el grupo de cabeza de pirazol está identificada con un asterisco,



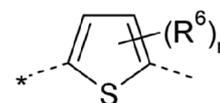
T1



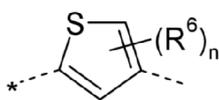
T2



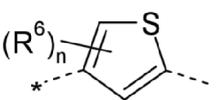
T3



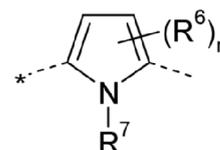
T4



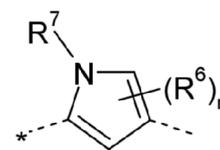
T5



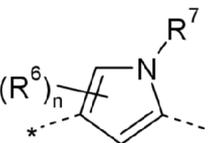
T6



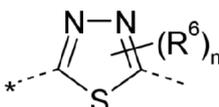
T7



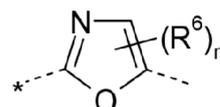
T8



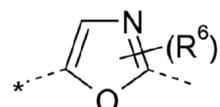
T9



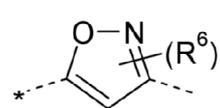
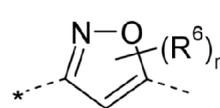
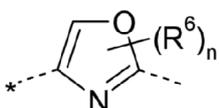
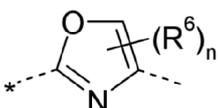
T10

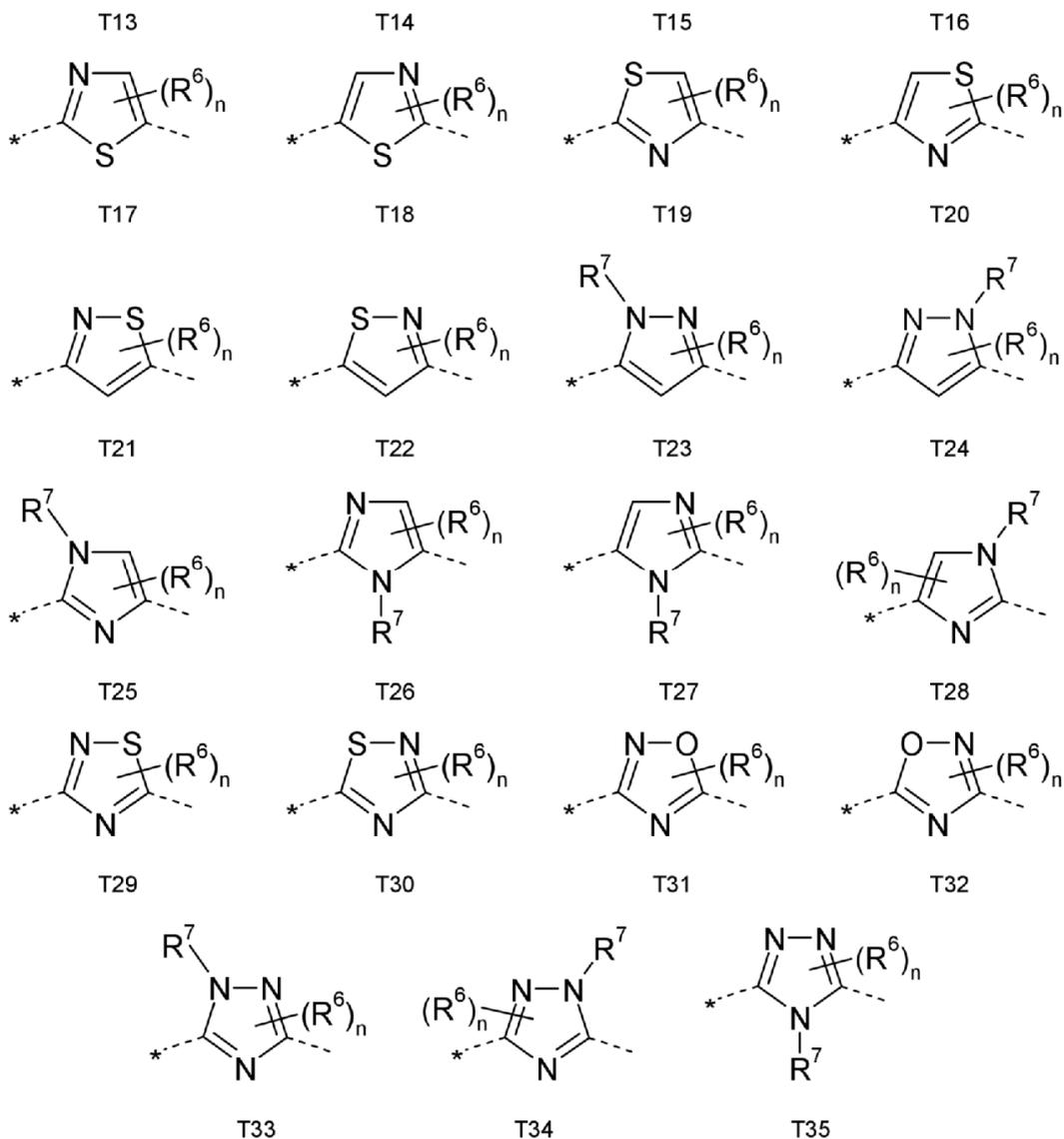


T11



T12





en donde

$R^6$  representa hidrógeno, metilo, etilo, 2-metiletilo, 2,2-dimetiletilo, flúor, cloro, bromo, yodo, nitro, trifluorometilo, amino, y

5 n representa los valores 0-1;

W representa oxígeno y

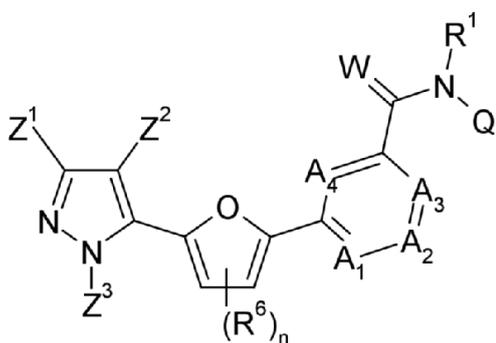
Q representa hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, 1-metiletilo, 1,1-dimetiletilo, n-butilo, 1-metilpropilo, 2-metilpropilo, 2-metilbutilo, hidroximetilo, 2-hidroxiopropilo, cianometilo, 2-cianoetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 1-trifluorometiletilo, 2,2-difluoropropilo, 3,3,3-trifluoropropilo, 2,2-dimetil-3-fluoropropilo, ciclopropilo, 1-ciano-ciclopropilo, 1-metil-ciclopropilo, 1-trifluorometil-ciclopropilo, 1-carbamoil-ciclopropilo, 1-tiocarbamoil-ciclopropilo, 1-metoxicarbonil-ciclopropilo, 1-(N-metilcarbamoil)ciclopropilo, 1-(N-ciclopropilcarbamoil)ciclopropilo, ciclopropil-metilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, 1-ciclopropiletilo, bis(ciclopropil)metilo, 2,2-dimetilciclopropil-metilo, 2-fenilciclopropilo, 2,2-diclorociclopropilo, trans-2-clorociclopropilo, cis-2-clorociclopropilo, 2,2-difluorociclopropilo, trans-2-fluorociclopropilo, cis-2-fluorociclopropilo, trans-4-hidroxiciclohexilo, 4-trifluorometilciclohexilo, prop-2-enilo, 2-metilprop-2-enilo, prop-2-inilo, 1,1-dimetilbut-2-enilo, 3-cloro-prop-2-enilo, 3,3-dicloro-prop-2-enilo, 3,3-dicloro-1,1-dimetilprop-2-enilo, oxetan-3-ilo, tietan-3-ilo, 1-oxido-tietan-3-ilo, 1,1-dioxido-tietan-3-ilo, isoxazol-3-ilmetilo, 1,2,4-triazol-3-ilmetilo, 3-metiloxetan-3-ilmetilo, bencilo, 2,6-difluorofenilmetilo, 3-fluorofenilmetilo, 2-fluorofenilmetilo, 4-fluorofenilmetilo, 2,5-difluorofenilmetilo, 1-feniletilo, 4-clorofeniletilo, 2-trifluorometilfeniletilo, 1-piridin-2-iletilo, piridin-2-ilmetilo, (6-cloro-piridin-3-il)metilo, 5-fluoropiridin-2-ilmetilo, pirimidin-2-ilmetilo, metoxi, 2-etoxietilo, 2-(metilsulfanil)etilo, 1-metil-2-(etilsulfanil)etilo, 2-metil-1-(metilsulfanil)propan-2-ilo, metoxicarbonilo, metoxicarbonilmetilo,  $NH_2$ , N-etilamino, N-alilamino, N,N-dimetilamino, N,N-diethylamino; o

Q representa un fenilo, naftilo, piridazina, pirazina, pirimidina, triazina, piridina, pirazol, tiazol, isotiazol, oxazol,

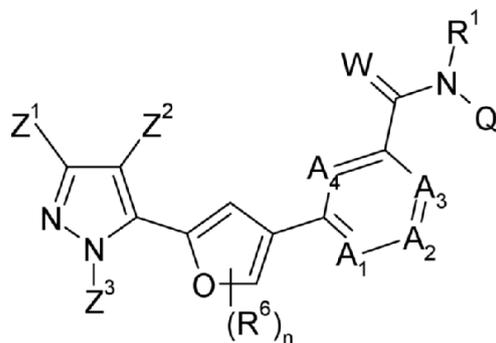
isoxazol, triazol, imidazol, furano, tiofeno, pirrol, oxadiazol, tiadiazol sustituidos con 0, 1, 2 o 3 sustituyentes V, en donde

V representa, de modo independiente entre sí, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, metilo, etilo, difluorometilo, triclorometilo, clorodifluorometilo, diclorofluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 1,2,2,2-tetrafluoroetilo, 1-cloro-1,2,2,2-tetrafluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 1,1-difluoroetilo, pentafluoroetil pentafluoro-terc-butilo, heptafluoro-n-propilo, heptafluoro-isopropilo, nonafluoro-n-butilo, ciclopropilo, ciclobutilo, metoxi, etoxi, n-propoxi, 1-metiletoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, cloro-difluorometoxi, dicloro-fluorometoxi, trifluorometoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2,2-difluoroetoxi, pentafluoroetoxi, *N*-metoxiiminometilo, 1-(*N*-metoxiimino)-etilo, metilsulfanilo, metilsulfonilo, metilsulfinilo, trifluorometilsulfonilo, trifluorometilsulfinilo, trifluorometilsulfanilo, *N,N*-dimetilamino; en donde para el caso de que T sea igual a T23 o T24, uno de los radicales Z<sup>1</sup>, Z<sup>2</sup> o Z<sup>3</sup> esté sustituido con al menos 3 átomos de halógeno.

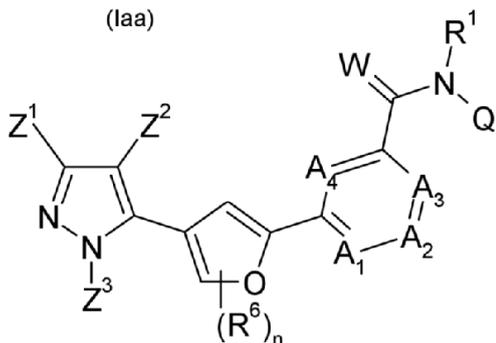
6. Compuestos de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 5 y de acuerdo con una de las siguientes fórmulas generales (Iaa) – (Ibi)



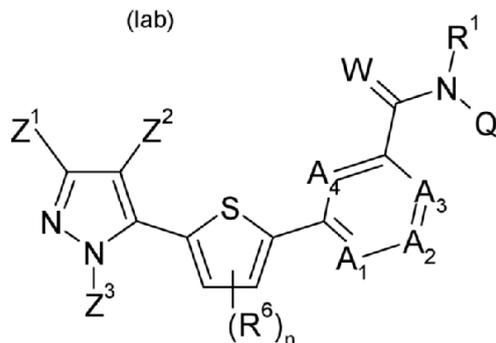
(Iaa)



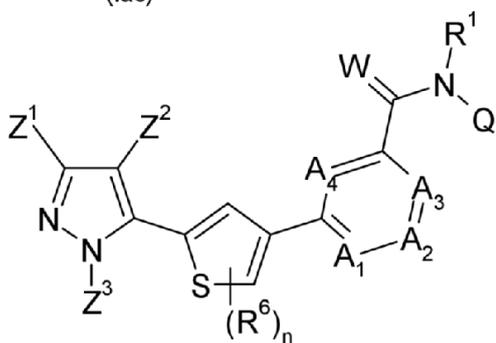
(Iab)



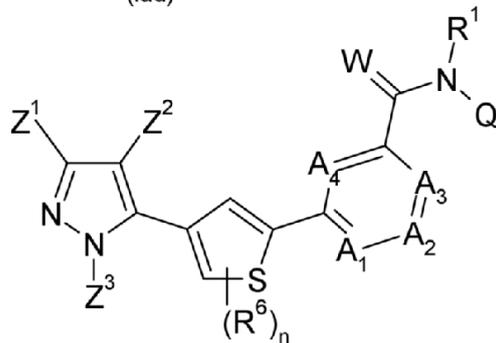
(Iac)



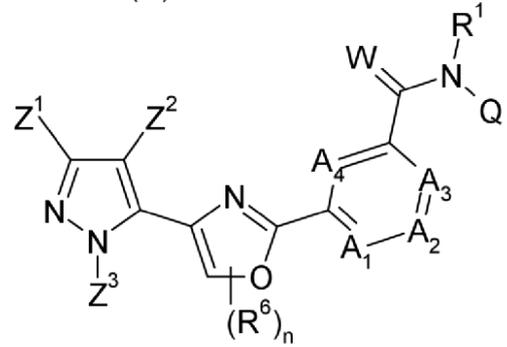
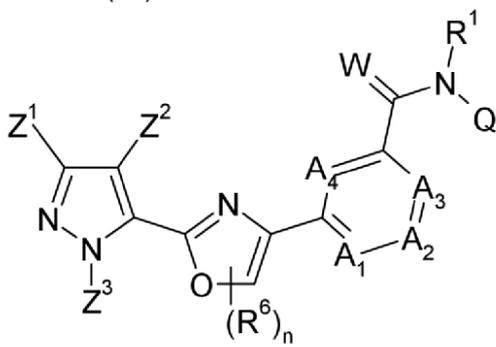
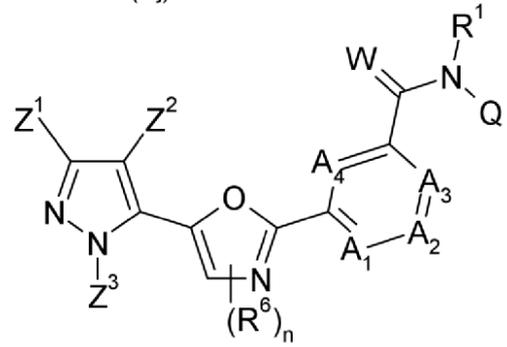
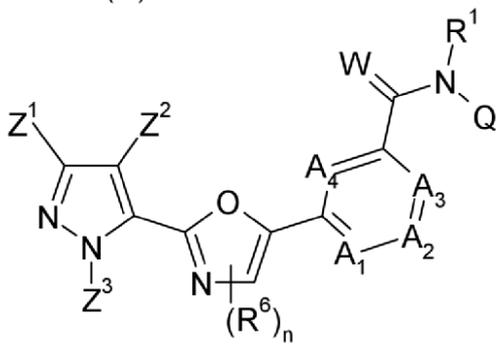
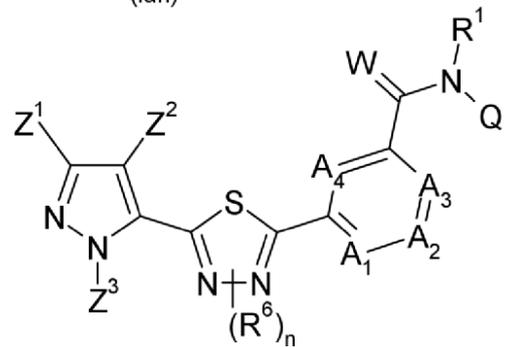
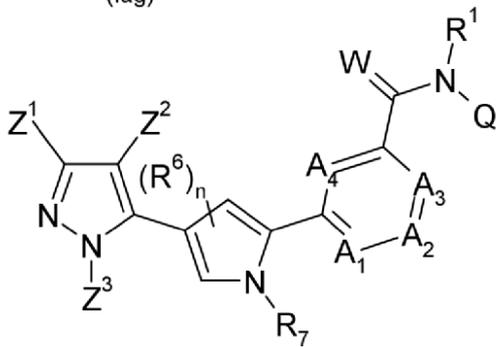
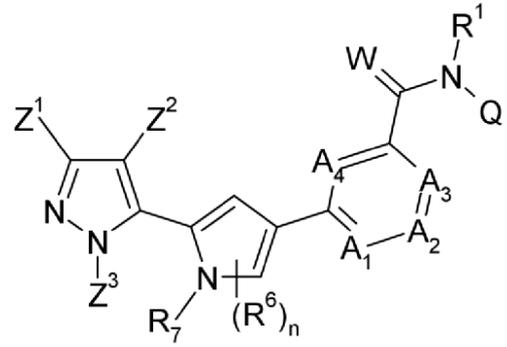
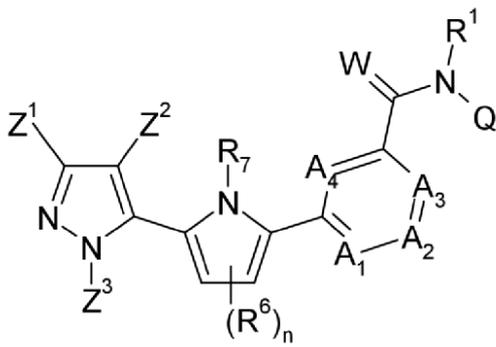
(Iad)

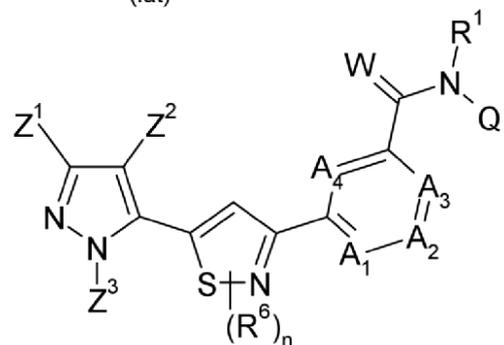
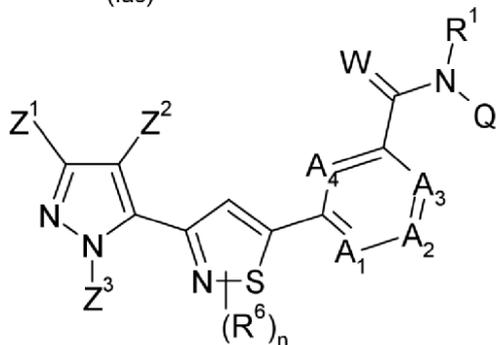
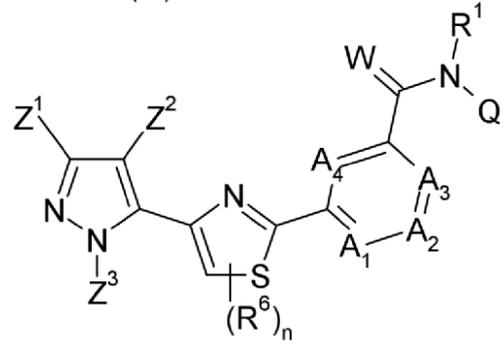
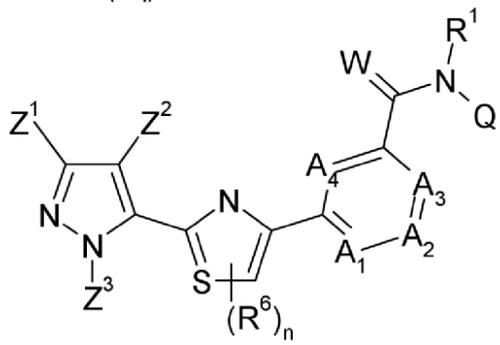
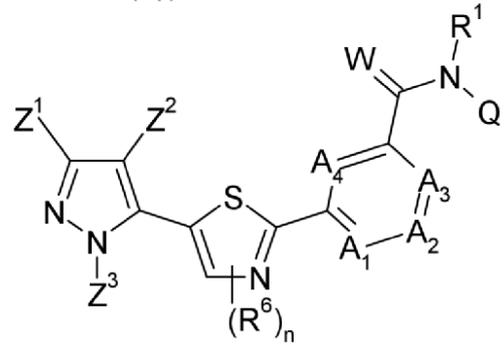
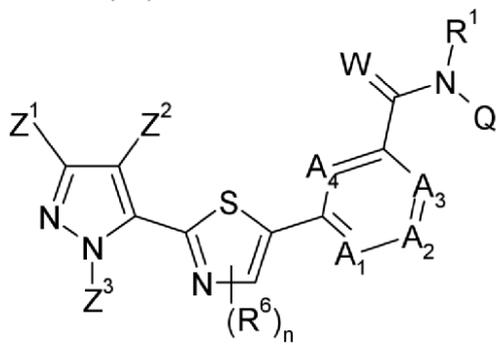
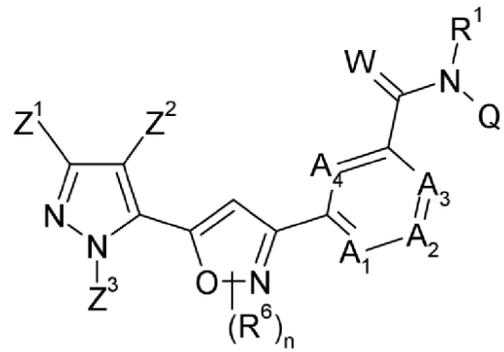
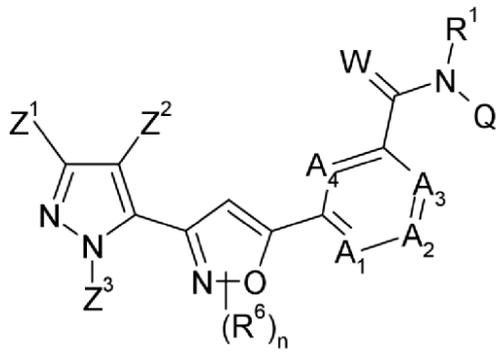


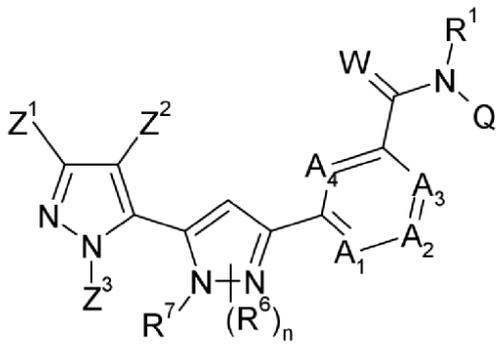
(Iae)



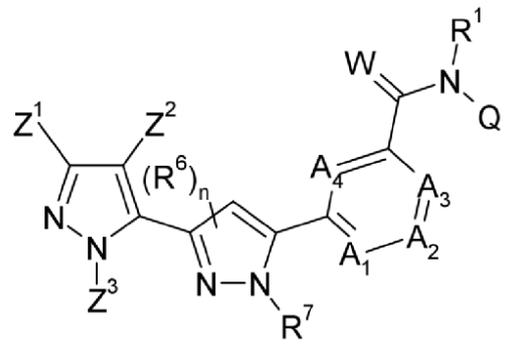
(Iaf)



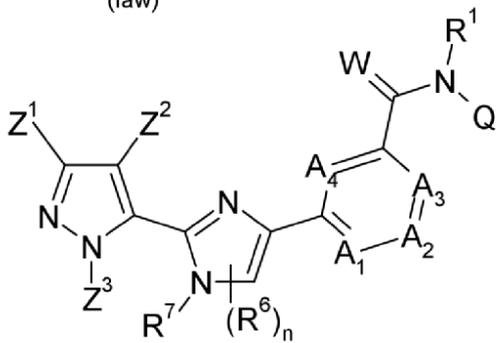




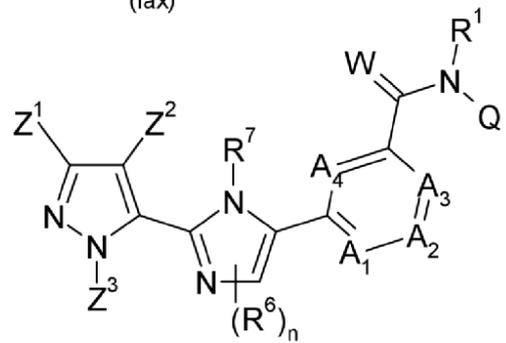
(law)



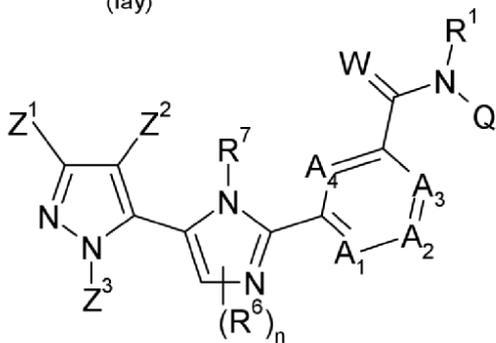
(lax)



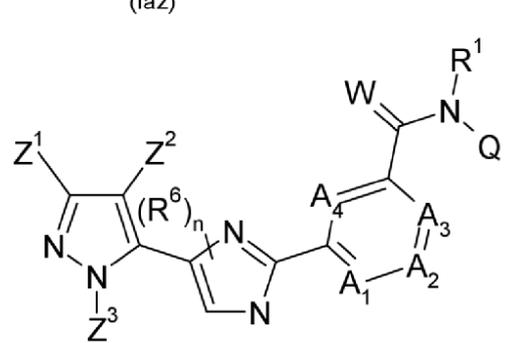
(lay)



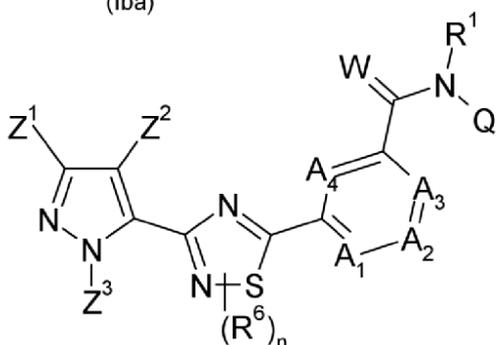
(laz)



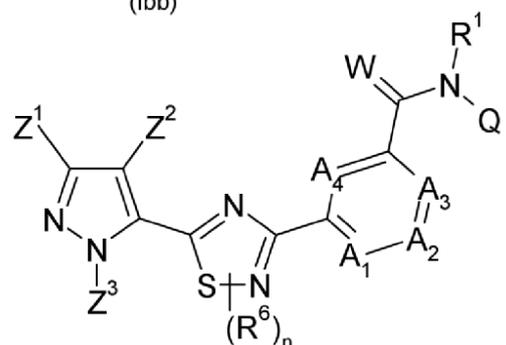
(lba)



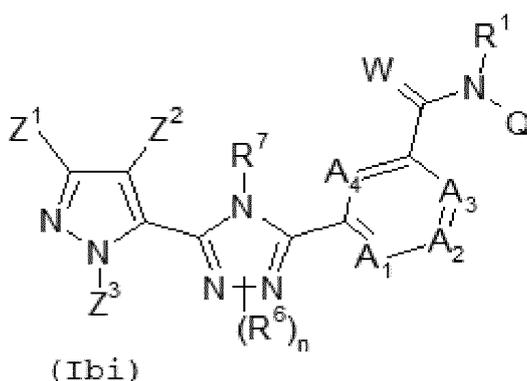
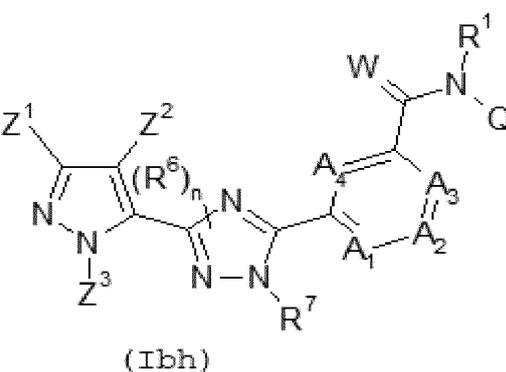
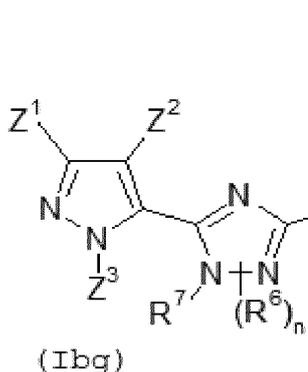
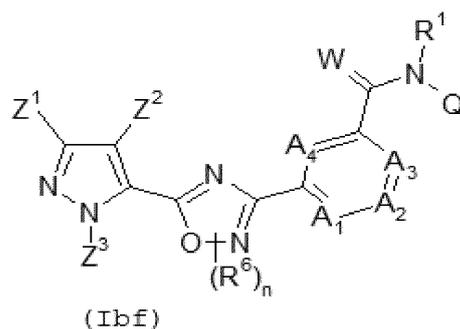
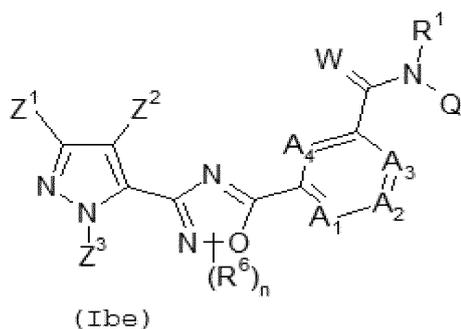
(lbb)



(lbc)



(lbd)



7. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 6, en los que Z<sup>1</sup> representa CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, Z<sup>2</sup> representa CF<sub>3</sub>, Z<sup>3</sup> representa CH<sub>3</sub>, los radicales R<sup>1</sup> y R<sup>6</sup> representan hidrógeno, A<sup>1</sup> y A<sup>4</sup> representan CH y A<sup>2</sup> representa CH o N, A<sup>3</sup> representa C-Cl, W representa oxígeno y Q representa 1-ciano-ciclopilo o ciclopilo.

8. Uso de compuestos de la fórmula general (I) de acuerdo con una de las reivindicaciones 0 a 0, así como de los compuestos de acuerdo con la reivindicación 6 o 7 para combatir insectos, arácnidos y nematodos, en el que está excluido el tratamiento quirúrgico, terapéutico y diagnóstico del cuerpo humano o animal.

9. Composiciones farmacéuticas, que contienen al menos un compuesto según una de las reivindicaciones 1 a 7.

10. Compuestos según una de las reivindicaciones 1 a 7 para el uso como medicamento.

11. Uso de compuestos según una de las reivindicaciones 1 a 7 para la preparación de composiciones farmacéuticas para combatir parásitos en animales.

12. Procedimiento para la preparación de agentes fitosanitarios que contienen compuestos según una de las reivindicaciones 1 a 7, así como diluyentes y/o sustancias tensioactivas habituales.

13. Procedimiento para combatir plagas, **caracterizado porque** se deja actuar un compuesto según una de las reivindicaciones 1 a 7 sobre la plaga y/o su hábitat, en el que está excluido el tratamiento quirúrgico, terapéutico y diagnóstico del cuerpo humano o animal.

14. Uso de compuestos según una de las reivindicaciones 1 a 7 para la protección de material reproductivo en plantas.