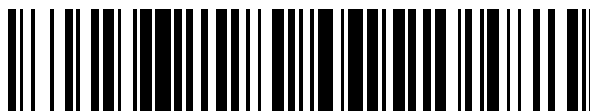


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 747 810**

51 Int. Cl.:

C07D 513/04 (2006.01)
C07D 417/04 (2006.01)
C07D 417/14 (2006.01)
A01N 43/90 (2006.01)
A01P 7/00 (2006.01)
A01P 7/04 (2006.01)
A61P 33/00 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- 86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **02.06.2015 PCT/EP2015/062211**
- 87 Fecha y número de publicación internacional: **10.12.2015 WO15185531**
- 96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **02.06.2015 E 15724728 (9)**
- 97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **24.07.2019 EP 3152216**

54 Título: **Compuestos bicíclicos como agentes para combatir parásitos**

30 Prioridad:

05.06.2014 EP 14171338

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:
11.03.2020

73 Titular/es:

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

72 Inventor/es:

**CEREZO-GALVEZ, SILVIA;
FISCHER, REINER;
FÜSSLEIN, MARTIN;
GREUL, JÖRG;
JESCHKE, PETER;
KLUTH, JOACHIM;
VOERSTE, ARND;
ILG, KERSTIN;
MALSAM, OLGA;
LÖSEL, PETER y
GÖRGENS, ULRICH**

74 Agente/Representante:

CARPINTERO LÓPEZ, Mario

ES 2 747 810 T3

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

DESCRIPCIÓN

Compuestos bicíclicos como agentes para combatir parásitos

La presente solicitud se refiere a nuevos compuestos bicíclicos, a su uso para combatir de manera no terapéutica parásitos animales, en los que se incluyen artrópodos, insectos y nematodos, así como a procedimientos e intermedios para preparar compuestos heterocíclicos.

En el documento WO 2012/102387 A1 se han descrito compuestos heterocíclicos que pueden usarse en particular como insecticidas y acaricidas.

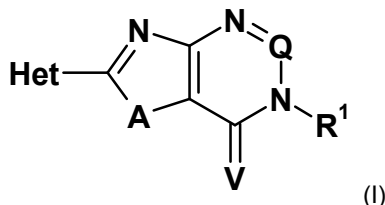
En las publicaciones WO 2009/149858 A1, US 4 260 765 A, WO 2010/100189 A1, US 3 755 581 y WO 98/57969 A1 se revelan compuestos para usar como agentes fitosanitarios, pero que difieren estructuralmente de los compuestos reivindicados en este caso.

En los documentos WO 2003/033476 A1, WO 2004/014916 A1, WO 2008/152390, Med Chem Comm (2013), 4(2), 456-462, Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters (2006), 16(18), 4723-4727, Journal of the American Pharmaceutical Association (1912-1977) (1955), 44, 193-6 and Journal of the Chemical Society (1949), 1064-8 se informa de la síntesis y sobre propiedades farmacológicas de determinadas [1,3]tiazolo[4,5-d]pirimidin-7(6H)-onas o bien [1,3]-oxazolo[4,5-d]pirimidin-7(6H)-onas.

Los agentes fitosanitarios modernos deben cumplir muchas exigencias, por ejemplo en relación a la intensidad, la duración y el espectro de su efecto y uso posible. Son importantes las cuestiones de la toxicidad, de la capacidad de combinación con otros principios activos o adyuvantes de formulación así como el dispendio que debe realizarse para la síntesis de un principio activo. Además pueden presentarse resistencias. Por todas estas razones nunca puede considerarse finalizada la búsqueda de nuevos agentes fitosanitarios y constantemente existe la necesidad de disponer de nuevos compuestos con propiedades mejoradas al menos en relación a algunos aspectos.

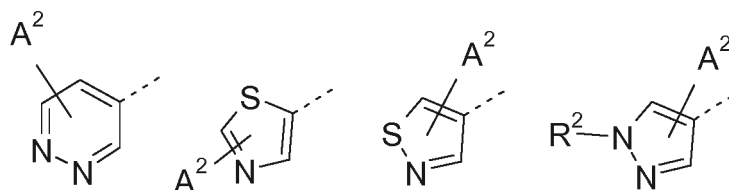
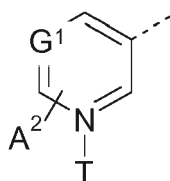
Objetivo de la presente invención fue proveer compuestos mediante los cuales se amplía el espectro de los agentes para combatir parásitos en diferentes aspectos.

Se cumple con el objetivo, así como con otros objetivos no indicados en forma explícita que pueden derivarse o interpretarse de los contextos aquí discutidos, por medio de nuevos compuestos de la fórmula (I)



en la que

Het representa un resto de la serie



en el que la línea discontinua representa la unión con el átomo de oxígeno en el grupo N=C-A unido a Het y

G¹ representa N o C-A¹,

A¹ representa hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi o cicloalquilo o

cicloalqueno cada uno dado el caso sustituidos,

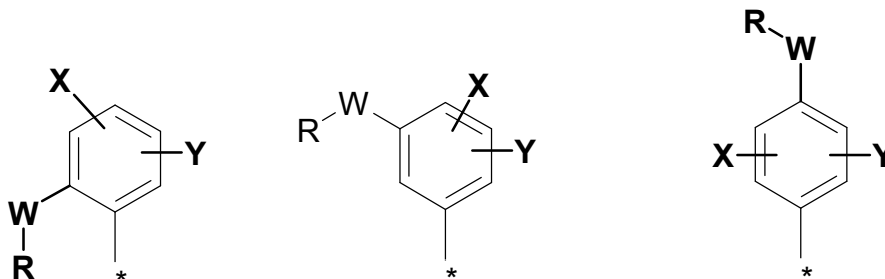
A² representa hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi o cicloalquilo o cicloalqueno cada uno dado el caso sustituidos,

T representa hidrógeno o un par de electrones,

5 R² representa hidrógeno, alquilo, haloalquilo o cicloalquilo dado el caso sustituido,

R¹ representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo, haloalquilo, cianoalquilo, alqueno, haloalqueno, alquino, haloalquino, alcoxi, haloalcoxi, alcoxialquilo dado el caso sustituido con halógeno, bis(alcoxi)alquilo dado el caso sustituido con halógeno, alquilsulfanilalquilo dado el caso sustituido con halógeno, alquilcarbonilalquilo dado el caso sustituido con halógeno, alquilsulfonilalquilo dado el caso sustituido con halógeno, alquilsulfonilalquilo dado el caso sustituido con halógeno, dialquilaminosulfanilalquilo, dialquilaminosulfonilalquilo, dialquilamino-sulfonilalquilo, alcoxycarbonilo dado el caso sustituido con halógeno, alcoxycarbonilalquilo dado el caso sustituido con halógeno, alquinoxilalquilo dado el caso sustituido con halógeno, dialquilaminocarbonilo, N-alquil-N-cicloalquilaminocarbonilo, N-alquil-N-cicloalquilaminocarbonilalquilo, heterociclil-carbonilalquilo, alquilsulfanilo, haloalquilsulfanilo, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, cicloalquilo sustituido dado el caso con halógeno, ciano, nitro, alquilo, cicloalquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alcoxycarbonilo, haloalcoxycarbonilo o hetarilo (que dado el caso también está sustituido con alquilo o halógeno) cicloalquilo, cicloalquilcarbonilo dado el caso sustituido con halógeno, ciano, nitro, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alcoxycarbonilo, haloalcoxycarbonilo o hetarilo (que dado el caso también está sustituido con alquilo o halógeno), cicloalquilalquilo dado el caso sustituido con halógeno, ciano, nitro, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alcoxycarbonilo, haloalcoxycarbonilo o hetarilo (que dado el caso también está sustituido con alquilo o halógeno), heterociclilo dado el caso sustituido, heterociclilalquilo dado el caso sustituido con halógeno, ciano (también en la parte alquilo), nitro, hidroxil, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo (que dado el caso está sustituido), alcoxi, haloalcoxi, alquiltio, haloalquiltio, alquilsulfonilo, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, amino, alquilamino, dialquilamino, alquilcarbonilamino, alcoxycarbonilamino, alcoxialquilo, haloalcoxialquilo, alqueno, alquino, cicloalquilalquilo, alquilcarbonilo, alcoxycarbonilo o aminocarbonilo, arilo dado el caso sustituido con halógeno, ciano, nitro, hidroxil, amino, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo (que dado el caso está sustituido) alcoxi o haloalcoxi, arilalquilo dado el caso sustituido con halógeno, ciano (también en la parte alquilo), nitro, hidroxil, amino, alquilo, cicloalquilo (que dado el caso está sustituido), haloalquilo, alcoxi o haloalcoxi, hetarilo dado el caso sustituido con halógeno, ciano, nitro, hidroxil, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo (que dado el caso está sustituido), alcoxi, haloalcoxi, alquiltio, haloalquiltio, alquilsulfonilo, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, amino, alquilamino, dialquilamino, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, alquilcarbonilamino, alcoxycarbonilamino, alcoxialquilo, haloalcoxialquilo, alqueno, alquino, cicloalquilalquilo, alquilcarbonilo, alcoxycarbonilo o aminocarbonilo, hetarilalquilo dado el caso sustituido con halógeno, ciano (también en la parte alquilo), nitro, hidroxil, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo (que dado el caso está sustituido), alcoxi, haloalcoxi, alquiltio, haloalquiltio, alquilsulfonilo, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, amino, alquilamino, dialquilamino, alquilcarbonilamino, alcoxycarbonilamino, alcoxialquilo, haloalcoxialquilo, alqueno, alquino, cicloalquilalquilo, alquilcarbonilo, alcoxycarbonilo o aminocarbonilo,

40 R¹ también representa un resto de la serie

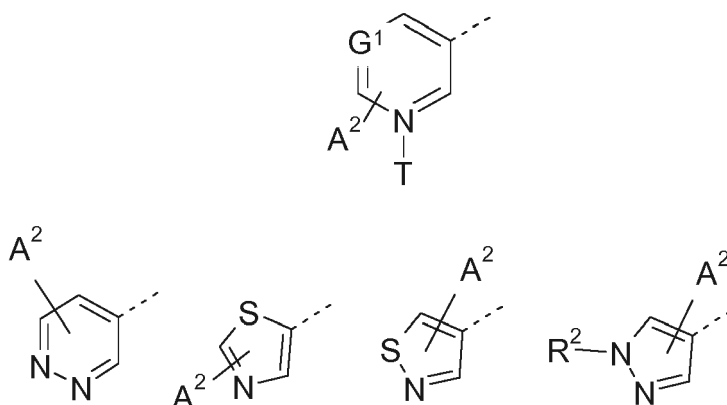


en el que la unión con el átomo de nitrógeno en el grupo C(=V)-N-Q en la fórmula (I) está marcada con el asterisco (*),

45 R representa NR⁷R⁸ o representa en cada caso un resto dado el caso sustituido de la serie alquilo, alqueno, alquino, alcoxialquilo, alquil-S(O)_m-alquilo, R⁷-CO-alquilo, NR⁷R⁸-CO-alquilo, cicloalquilo, cicloalqueno, cicloalquilalquilo, cicloalquenalalquilo, heterociclilo, heterociclilalquilo, fenilo, fenilalquilo, hetarilo y hetarilalquilo,

W representa un resto de la serie O, S, SO y SO₂,

- X representa un resto de la serie hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi y cicloalquilo,
- Y representa un resto de la serie hidrógeno, halógeno, alquilo, cicloalquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, ciano y NR^5R^6 ,
- 5 A representa oxígeno o azufre
- Q representa nitrógeno o $C-R^3$, en el que
- R^3 representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo, cicloalquilo, haloalquilo, OH, alcoxi, haloalcoxi, SH, alquilsulfanilo, alquilsulfino, alquilsulfonilo, NH_2 , alquilamino y dialquilamino,
- V representa un resto de la serie oxígeno, azufre y NR^4 ,
- 10 R^4 representa un resto de la serie hidrógeno, ciano, alquilo, haloalquilo y cicloalquilo,
- R^5 representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo, cicloalquilo y haloalquilo,
- R^6 representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo, cicloalquilo y haloalquilo,
- o
- R^5 y R^6 junto con el nitrógeno al que están unidos, representan un anillo de 3 a 6 miembros saturado o insaturado dado el caso sustituido y que dado el caso contiene uno o varios otros heteroátomos,
- 15 R^7 representa hidrógeno, hidroxilo o en cada caso un resto dado el caso sustituido de la serie alquilo, alcoxi, alcoxialquilo, alquil- $S(O)_m$ -alquilo, alquilcarbonilo, alcoxycarbonilo, cicloalquilo, cicloalqueno, cicloalquilalquilo, cicloalquenilalquilo, heterociclo, heterociclalquilo, fenilo, fenilalquilo, hetarilo y hetarilalquilo,
- 20 R^8 representa hidrógeno, un ión metálico, un ión de amonio dado el caso sustituido o en cada caso un resto dado el caso sustituido de la serie alquilo, alcoxi, alcoxialquilo, alquil- $S(O)_m$ -alquilo y
- m representa un número de la serie 0, 1 y 2.
- Los sustituyentes o bien intervalos preferidos de los restos indicados en los compuestos de la fórmula (I) se explican a continuación. Su combinación conforma el intervalo de preferencia (1).
- 25 Het representa un resto de la serie



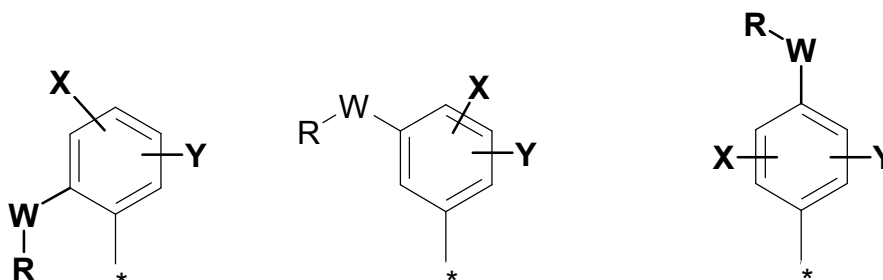
en la que la línea discontinua representa la unión con el átomo de carbono en el grupo $N=C-A$ unido a Het.

- G^1 representa N o $C-A^1$.
- 30 A^1 representa un resto de la serie hidrógeno, halógeno, alquilo C_1-C_6 y haloalquilo C_1-C_4 .
- A^2 representa un resto de la serie hidrógeno, halógeno, alquilo C_1-C_6 y haloalquilo C_1-C_4 .
- T representa oxígeno o un par de electrones.
- R^2 representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 y dado el caso mono- a trisustituido con halógeno, ciano, nitro, alquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 y monosustituido con cicloalquilo C_3-C_6 cicloalquilo C_3-

C₆ sustituido.

R¹ representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₂-C₆, ciano-alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, haloalquinilo C₂-C₄, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ dado el caso sustituido con halógeno, Bis(alcoxi C₁-C₆)-alquilo C₁-C₆ dado el caso sustituido con halógeno, C₁-C₆-alquilsulfanil-alquilo C₁-C₆ dado el caso sustituido con halógeno, alquilcarbonil C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ dado el caso sustituido con halógeno, alquilsulfinil C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ dado el caso sustituido con halógeno, alquilsulfonil C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ dado el caso sustituido con halógeno, di-(alquil C₁-C₆)-aminosulfanil-alquilo C₁-C₆, di-alquilaminosulfinil (C₁-C₆)-alquilo C₁-C₆, di-(alquil C₁-C₆)-aminosulfonil-alquilo C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₆ dado el caso sustituido con halógeno, alcoxycarbonil C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ dado el caso sustituido con halógeno, alquiniloxi C₂-C₄ dado el caso sustituido con halógeno, alquiniloxicarbonilo C₂-C₄ dado el caso sustituido con halógeno, di-(alquil C₁-C₆)-aminocarbonilo, N-alquilo C₁-C₆-N-cicloalquilaminocarbonilo C₃-C₆, di-(alquil C₁-C₆)-aminocarbonil-alquilo C₁-C₆, N-alquil C₁-C₆-N-cicloalquilaminocarbonil C₃-C₆-alquilo C₁-C₆, heterociclicarbonil-alquilo C₁-C₆, alquilsulfanilo C₁-C₆, haloalquilsulfanilo C₁-C₆, alquilsulfinilo C₁-C₆, haloalquilsulfinilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ dado el caso sustituido con halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₆, haloalcoxycarbonilo C₁-C₆ o hetarilo (que dado el caso también esta sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), cicloalquilcarbonilo C₃-C₆ dado el caso sustituido con halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₆, haloalcoxycarbonilo C₁-C₆ o hetarilo (que dado el caso también esta sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), heterociclicil-alquilo C₁-C₆ dado el caso sustituido con halógeno, ciano (también en la parte alquilo C₁-C₆ de heterociclicil-alquilo C₁-C₆), nitro, hidroxil, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ (que dado el caso está sustituido con halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆ y cicloalquilo C₃-C₆), alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, alquilsulfinilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquilsulfinilo C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, amino, alquilamino C₁-C₆, di-(alquil C₁-C₆)-amino, alquilcarbonilamino C₁-C₆, alquilaminocarbonilo C₁-C₆, di-(alquil C₁-C₆)-aminocarbonilo, alcoxycarbonilamino C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₆ o aminocarbonilo, arilo dado el caso sustituido con halógeno, ciano, nitro, hidroxil, amino, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ (que dado el caso está sustituido con halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆ y cicloalquilo C₃-C₆), arilo sustituido con alcoxi C₁-C₆ o haloalcoxi C₁-C₆, aril-alquilo C₁-C₆ dado el caso sustituido con halógeno, ciano (también en la parte alquilo C₁-C₆ de aril-alquilo C₁-C₆), nitro, hidroxil, amino, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ (que dado el caso está sustituido con halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆ y cicloalquilo C₃-C₆), alcoxi C₁-C₆ o haloalcoxi C₁-C₆, hetarilo dado el caso sustituido con halógeno, ciano, nitro, hidroxil, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ (que dado el caso está sustituido con halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆ y cicloalquilo C₃-C₆), alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, alquilsulfinilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquilsulfinilo C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, amino, alquilamino C₁-C₆, di-(alquil C₁-C₆)-amino, alquilcarbonilamino C₁-C₆, alquilaminocarbonilo C₁-C₆, di-(alquil C₁-C₆)-aminocarbonilo, alcoxycarbonilamino C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₆ o aminocarbonilo, hetaril-alquilo C₁-C₆ dado el caso sustituido con halógeno, ciano (también en la parte alquilo C₁-C₆ de hetaril-alquilo C₁-C₆), nitro, hidroxil, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ (que dado el caso está sustituido con halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆ y cicloalquilo C₃-C₆), alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, alquilsulfinilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquilsulfinilo C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, amino, alquilamino C₁-C₆, di-(alquil C₁-C₆)-amino, alquilcarbonilamino C₁-C₆, alcoxycarbonilamino C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₆ o aminocarbonilo.

R¹ también representa un resto de la serie

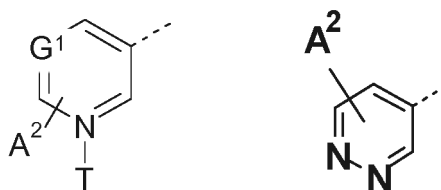


en el que la unión con el átomo de nitrógeno en el grupo C(=V)-N-Q en la fórmula (I) está marcada con el asterisco (*).

- R representa NR⁷R⁸ o representa alquilo C₁-C₆ cada uno dado el caso sustituido con halógeno, oxígeno (produce C=O) o ciano, alqueno C₃-C₆, alqueno C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₆-S(O)_m-alquilo C₁-C₄, representa R⁷-CO-alquilo C₁-C₄, representa NR⁷R⁸-CO-alquilo C₁-C₄, representa cicloalquilo C₃-C₈ mono- o disustituido dado el caso con oxígeno (produce C=O), alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄, representa cicloalqueno C₃₋₈ mono- o disustituido dado el caso con oxígeno (produce C=O), alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄, representa cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄ mono- o disustituido dado el caso con oxígeno (produce C=O), alquilo C₁-C₄, cicloalqueno C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄, representa cicloalqueno C₃-C₆-alquilo C₁-C₄ mono- o disustituido dado el caso con oxígeno (produce C=O), alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄, representa heterociclilo mono- o disustituido dado el caso con oxígeno (produce C=O), alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄, representa heterocicli-alquilo C₁-C₄ mono- o disustituido dado el caso con oxígeno (produce C=O), alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄ o representa fenilo dado el caso mono- a trisustituido con halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄, fenil-alquilo C₁-C₄, hetarilo y hetaril-alquilo C₁-C₄.
- 15 W representa un resto de la serie O, S, SO y SO₂.
- X representa un resto de la serie hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ y haloalcoxi C₁-C₆.
- Y representa un resto de la serie hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, ciano y NR⁵R⁶.
- 20 A representa azufre.
- Q representa nitrógeno o C-R³.
- R³ representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, OH, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, SH, alquilsulfanilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, NH₂, alquilamino C₁-C₆ y di-(alquil C₁-C₆)-amino.
- 25 V representa un resto de la serie oxígeno, azufre y NR⁴.
- R⁴ representa un resto de la serie hidrógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₂-C₆ y cicloalquilo C₃-C₆.
- R⁵ representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ y haloalquilo C₂-C₆.
- R⁶ representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ y haloalquilo C₂-C₆.
- 30 R⁵ y R⁶ también junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, representa un anillo de 3 a 6 miembros saturado o insaturado hasta tres veces dado el caso sustituido con halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, en particular representa aziridinilo, azirenilo, diaziridinilo, diazirenilo, azetidínilo, dihidroazetilo, diazetidínilo, dihidrodiazetilo, oxazetidínilo, oxazetilo, tiazetidínilo, tiazetilo, pirrolidinilo, dihidropirrolilo, pirazolidinilo, dihidropirazolilo, imidazolidinilo, dihidroimidazolilo, oxazolidinilo, dihidrooxazolilo, tiazolidinilo, dihidrotiazolilo, piperidinilo, piperacínilo, hexahidropiridacínilo, hexahidropirimidinilo, morfolinilo, dioxazinanilo, tiomorfolinilo, ditiazinanilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, triazolilo y tetrazolilo.
- 40 R⁷ representa un resto de la serie hidrógeno, hidroxilo, alquilo C₁-C₆ en cada caso mono- o polisustituido dado el caso con halógeno o mono- o disustituido con ciano, alcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₆-S(O)_m-alquilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalqueno C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₃, cicloalqueno C₃-C₆-alquilo C₁-C₃, heterociclilo, heterocicli-alquilo C₁-C₃ y fenilo, fenil-alquilo C₁-C₃, hetarilo y hetaril-alquilo C₁-C₃ en cada caso mono- a tetrasustituido dado el caso con alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halógeno o ciano.
- 45 R⁸ representa hidrógeno, un ión de metal alcalino o alcalinotérreo o representa un ión amonio mono- a tetrasustituido dado el caso con alquilo C₁-C₄ o representa un resto de la serie alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ y alquil C₁-C₄-S(O)_m-alquilo C₁-C₄ en cada caso mono- o polisustituido dado el caso con halógeno o mono o disustituido con ciano.
- m representa un número de la serie 0, 1 y 2.

Los sustituyentes o bien intervalos especialmente preferidos de los restos indicados en los compuestos de la fórmula (I) se explican a continuación. Su combinación conforma el intervalo de preferencia (2).

- 50 Het representa un resto de la serie



en la que la línea discontinua representa la unión con el átomo de carbono en el grupo N=C-A unido a Het.

G¹ representa N o C-A¹.

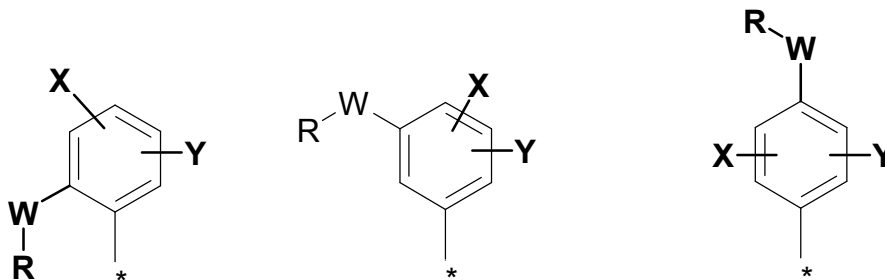
A¹ representa un resto de la serie hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄.

5 A² representa un resto de la serie hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄.

T representa oxígeno o un par de electrones.

R¹ representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo C₁-C₄, C₂-C₄-haloalquilo, ciano-alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, haloalqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, haloalquino C₂-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₂-alquilo C₁-C₄ dado el caso sustituido con halógeno, Bis(alcoxi C₁-C₂)-alquilo C₁-C₄ dado el caso sustituido con halógeno, alquilsulfanil C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ dado el caso sustituido con halógeno, alquilcarbonil C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ dado el caso sustituido con halógeno, alquilsulfonil C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ dado el caso sustituido con halógeno, alquilsulfonil C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ dado el caso sustituido con halógeno, di-(alquil C₁-C₄)-aminosulfanil-alquilo C₁-C₄, di-(alquil C₁-C₄)-aminosulfonil-alquilo C₁-C₄, di-(alquil C₁-C₄)-aminosulfonil-alquilo C₁-C₄, alcoxycarbonilo C₁-C₄ dado el caso sustituido con halógeno, alcoxycarbonil C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ dado el caso sustituido con halógeno, alquinilo C₂-C₄ dado el caso sustituido con halógeno, alquiniloxycarbonilo C₂-C₄ dado el caso sustituido con halógeno, di-(alquil C₁-C₄)-aminocarbonilo, N-alquil C₁-C₄-N-cicloalquilaminocarbonilo C₃-C₆, di-(alquil C₁-C₄)-aminocarbonil-alquilo C₁-C₄, N-alquil C₁-C₄-N-cicloalquilaminocarbonil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, heterociclicarbonil-alquilo C₁-C₄, alquilsulfanilo C₁-C₄, haloalquilsulfanilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ dado el caso sustituido con halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alcoxycarbonilo C₁-C₄, haloalcoxycarbonilo C₁-C₄ o piridilo (que dado el caso también está sustituido con alquilo C₁-C₄ o halógeno), cicloalquilcarbonilo C₃-C₆ dado el caso sustituido con halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alcoxycarbonilo C₁-C₄, haloalcoxycarbonilo C₁-C₄ o piridilo (que dado el caso también está sustituido con alquilo C₁-C₄ o halógeno), cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄ dado el caso sustituido con halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alcoxycarbonilo C₁-C₄, haloalcoxycarbonilo C₁-C₄, piridilo, pirimidilo, pirazano, piridacino, tiazolilo, isotiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, oxadiazolilo, pirazolilo, triacino o triazolilo (estando los heterociclos mencionados también dado el caso sustituidos con alquilo C₁-C₄ o halógeno), heterociclic-alquilo C₁-C₄ dado el caso sustituido con halógeno, ciano (también en la parte alquilo C₁-C₄ de heterociclic-alquil C₁-C₄), nitro, hidroxilo, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ (que dado el caso está sustituido con halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄ y cicloalquilo C₃-C₆), alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, amino, alquilamino C₁-C₄, di-(alquil C₁-C₄)-amino, alquilcarbonilamino C₁-C₄, alcoxycarbonilamino C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₁-C₄, alcoxycarbonilo C₁-C₄ o aminocarbonilo, arilo dado el caso sustituido con halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, amino, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ (que dado el caso está sustituido con halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄ y cicloalquilo C₃-C₆), alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄, aminocarbonilo dado el caso sustituido con halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ (que dado el caso está sustituido con halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄ y cicloalquilo C₃-C₆), alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, amino, alquilamino C₁-C₄, di-(alquil C₁-C₄)-amino, alquilcarbonilamino C₁-C₄, alquilaminocarbonilo C₁-C₄, di-(alquil C₁-C₄)-aminocarbonilo, alcoxycarbonilamino C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₁-C₄, alcoxycarbonilo C₁-C₄ o heterociclo, heterociclo-alquilo C₁-C₄ dado el caso sustituido con halógeno, ciano (también en la parte alquilo C₁-C₄ de heterociclo-alquil C₁-C₄), nitro, hidroxilo, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ (que dado el caso está sustituido con halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄ y cicloalquilo C₃-C₆), alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, amino, alquilamino C₁-C₄, di-(alquil C₁-C₄)-amino, alquilcarbonilamino C₁-C₄, alquilaminocarbonilo C₁-C₄, alcoxycarbonilamino C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₁-C₄, alcoxycarbonilo C₁-C₄ o aminocarbonilo.

R¹ también representa un resto de la serie

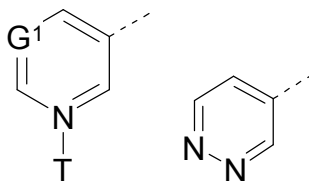


en el que la unión con el átomo de nitrógeno en el grupo C(=V)-N-Q en la fórmula (I) está marcada con el asterisco (*).

- 5 R representa NR⁷R⁸ o representa alquilo C₁-C₆ en cada caso sustituido una a siete veces con halógeno, mono o disustituido con oxígeno (produce C=O) o mono- o disustituido con ciano, alqueno C₃-C₆, alqueno C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₃, alquil C₁-C₄-S(O)_m-alquilo C₁-C₃, representa R⁷-CO-alquilo C₁-C₂, representa NR⁷R⁸-CO-alquilo C₁-C₂, representa cicloalquilo C₃-C₈ mono- o disustituido dado el caso con oxígeno (produce C=O), alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄, representa cicloalqueno C₃-C₈ mono- o disustituido dado el caso con oxígeno (produce C=O), alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄, representa cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄ mono- o disustituido dado el caso con oxígeno (produce C=O), alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄, representa cicloalqueno C₃-C₆-alquilo C₁-C₄ mono- o disustituido dado el caso con oxígeno (produce C=O), alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄, representa heterociclilo mono- o disustituido dado el caso con oxígeno (produce C=O), alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄, representa heterociclil-alquilo C₁-C₄ mono- o disustituido dado el caso con oxígeno (produce C=O), alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄ o representa fenilo, fenil-alquilo C₁-C₄, hetarilo y hetaril-alquilo C₁-C₄ dado el caso mono- a trisustituido con halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄.
- 10
- 15
- 20 W representa un resto de la serie S, SO y SO₂.
- X representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄.
- Y representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄.
- 25 A representa azufre.
- Q representa nitrógeno o C-R³.
- R³ representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, OH, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, SH, alquilsulfanilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, NH₂, alquilamino C₁-C₄ y di-(alquil C₁-C₄)-amino.
- 30 V representa oxígeno.
- R⁷ representa un resto de la serie hidrógeno, hidroxilo, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₄-S(O)_m-alquilo C₁-C₃, alquilcarbonilo C₁-C₄, alcoxycarbonilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₃, heterociclilo, heterociclil-alquilo C₁-C₃ en cada caso mono- o polisustituido dado el caso con halógeno o mono- o disustituido con ciano y fenilo, bencilo, piridilo, pirimidilo, tiazolilo, oxazolilo, pirazolilo, tienilo, furanilo, piridinilmetilo y tiazolilmetilo cada uno dado el caso mono- a trisustituido con alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, ciclopropilo, flúor cloro, bromo o ciano.
- 35
- R⁸ representa hidrógeno, representa unión de metal alcalino o alcalinotérreo o representa un ión de amonio mono- a tetrasustituido dado el caso con alquilo C₁-C₄ o representa un resto de la serie alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₂ y alquil C₁-C₄-S(O)_m-alquilo C₁-C₂ en cada caso mono- o polisustituido dado el caso con halógeno o mono o disustituido con ciano.
- 40
- m representa un número de la serie 0, 1 y 2.

Los sustituyentes o bien intervalos muy especialmente preferidos de los restos indicados en los compuestos de la fórmula (I) se explican a continuación. Su combinación conforma el intervalo de preferencia (3).

Het representa un resto de la serie



en la que la línea discontinua representa la unión con el átomo de carbono en el grupo N=C-A unido a Het.

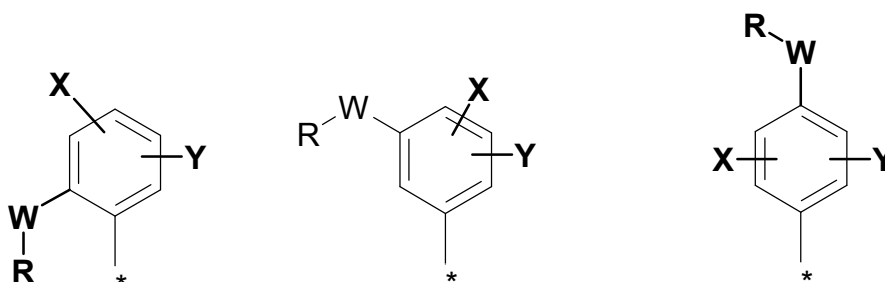
G¹ representa N o C-A¹.

5 A¹ representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro.

T representa oxígeno o un par de electrones.

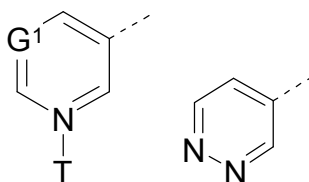
R¹ representa un resto de la serie metilo, etilo, isopropilo, n-propilo, n-butilo, iso-butilo, sec-butilo, *terc*-butilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2-difluoro-n-propilo, metilsulfanil-metilo, metilsulfaniletilo, metilsulfanil-n-propilo, trifluorometilsulfonilmetilo, etilsulfonilmetilo, 2,2,2-trifluoroetilsulfonilmetilo, 2,2-difluoroetilsulfonilmetilo, isopropilsulfanilmetilo, metilsulfonilmetilo, trifluorometilsulfonilmetilo, etilsulfonil-metilo, 2,2,2-trifluoroetilsulfonilmetilo, 2,2-difluoroetilsulfonilmetilo, isopropil-sulfonilmetilo, metilsulfonilmetilo, trifluorometilsulfonilmetilo, etilsulfonilmetilo, 2,2,2-trifluoroetilsulfonilmetilo, 2,2-difluoroetilsulfonilmetilo, isopropilsulfonilmetilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, metoxicarbonilmetilo, etoxicarbonilmetilo, metoxicarboniletilo, etoxicarboniletilo, dimetilaminocarbonilo, dietilaminocarbonilo, *N*-etil-*N*-metilaminocarbonilo, *N*-isopropil-*N*-metilaminocarbonilo, dimetilamino-carbonilmetilo, dietilaminocarbonilmetilo, *N*-etil-*N*-metilaminocarbonilmetilo, *N*-isopropil-*N*-metilaminocarbonilmetilo, dimetilaminocarboniletilo, dietilamino-carboniletilo, *N*-etil-*N*-metilaminocarboniletilo, *N*-isopropil-*N*-metilaminocarboniletilo, *N*-ciclopropil-*N*-metilaminocarbonilmetilo, *N*-ciclopropil-*N*-metilaminocarboniletilo, metilsulfanilo, trifluorometilsulfanilo, etilsulfanilo, 2,2,2-trifluoroetilsulfanilo, 2,2-difluoroetilsulfanilo, isopropilsulfanilo, metilsulfinilo, trifluorometilsulfinilo, etilsulfinilo, 2,2,2-trifluoroetilsulfinilo, 2,2-difluoroetilsulfinilo, isopropilsulfinilo, metilsulfonilo, trifluorometilsulfonilo, etilsulfonilo, 2,2,2-trifluoroetilsulfonilo, 2,2-difluoroetilsulfonilo, isopropilsulfonilo, ciclopropilo, 1-cianociclopropilo, 1-clorociclopropilo, 1-fluorociclopropilo, 2-cianociclopropilo, 2-clorociclopropilo, 2-fluorociclopropilo, 2,2,3,3-tetrafluorociclopropilo, 2-ciclopropilciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, 4-trifluorometilciclohexilo, ciclopropilmetilo, ciclopropiletilo, ciclobutilmetilo, *N*-ciclopropil-*N*-metilaminocarbonilo, morfolin-4-ilcarbonilmetilo, piperazin-1-ilcarbonilmetilo, 4-metil-piperazin-1-ilcarbonilmetilo; o heterocicliometilo y heterocicliletilo cada uno mono-, di- o trisustituídos dado el caso de manera igual o diferente con flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, hidroxilo, amino, metilo, etilo, isopropilo, *terc*-butilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, trifluorometoxi, difluorometoxi, heterocicliometilo y heterocicliletilo sustituidos cada uno con ciclopropilo, estando el resto ciclopropilo mono- o disustituído dado el caso con metilo, flúor, cloro, ciano o monosustituído con ciclopropilo, hetarilo dado el caso mono- o disustituidos de manera igual o diferente con flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, hidroxilo, amino, metilo, etilo, isopropilo, *terc*-butilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, trifluorometoxi, difluorometoxi, difluoroetoxi, arilo sustituido con ciclopropilo, estando el resto ciclopropilo mono- o disustituído dado el caso con metilo, flúor, cloro, ciano o monosustituído con ciclopropilo, arilmetilo y ariletilo cada uno mono-, di- o trisustituídos dado el caso de manera igual o diferente con flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, hidroxilo, amino, metilo, etilo, isopropilo, *terc*-butilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, trifluorometoxi, difluorometoxi, hetarilmetilo y hetariletilo dado el caso mono o disustituído en cada caso de manera igual o diferente con flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, hidroxilo, amino, metilo, etilo, isopropilo, *terc*-butilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, trifluorometoxi, difluorometoxi, hetarilmetilo y hetariletilo sustituidos cada uno con ciclopropilo, estando el resto ciclopropilo mono- o disustituído dado el caso con metilo, flúor, cloro, ciano o monosustituído con ciclopropilo.

R¹ también representa un resto de la serie



en el que la unión con el átomo de nitrógeno en el grupo C(=V)-N-Q en la fórmula (I) está marcada con el asterisco (*).

- 5 R representa NR^7R^8 o representa un resto de la serie cada uno sustituido dado el caso una, dos, tres, cuatro o cinco veces con flúor, cloro o mono o disustituido con ciano de la serie alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, alqueno $\text{C}_3\text{-C}_4$, alquino $\text{C}_3\text{-C}_4$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_2$ -alquilo $\text{C}_1\text{-C}_2$ y alquil $\text{C}_1\text{-C}_2\text{-S}(\text{O})_m$ -alquilo $\text{C}_1\text{-C}_2$, representa $\text{R}^7\text{-CO}$ -alquilo $\text{C}_1\text{-C}_2$, representa $\text{NR}^7\text{R}^8\text{-CO}$ -alquilo $\text{C}_1\text{-C}_2$, representa cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_6$ mono- o disustituido dado el caso con alquilo $\text{C}_1\text{-C}_2$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_2$ o haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_2$ o con un átomo de oxígeno (produce $\text{C}=\text{O}$), representa cicloalqueno $\text{C}_3\text{-C}_6$ mono- o disustituido dado el caso con alquilo $\text{C}_1\text{-C}_2$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_2$ o haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_2$ o con un átomo de oxígeno (produce $\text{C}=\text{O}$), representa cicloalquil $\text{C}_3\text{-C}_6$ -alquilo $\text{C}_1\text{-C}_2$ mono- a disustituido dado el caso con alquilo $\text{C}_1\text{-C}_2$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_2$ o haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_2$, representa cicloalqueno $\text{C}_3\text{-C}_6$ -alquilo $\text{C}_1\text{-C}_2$ mono- o disustituido dado el caso con alquilo $\text{C}_1\text{-C}_2$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_2$ o haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_2$, representa heterociclilo mono- o disustituido dado el caso con alquilo $\text{C}_1\text{-C}_2$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_2$ o haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_2$, representa heterociclil-alquilo $\text{C}_1\text{-C}_2$ mono- o disustituido dado el caso con alquilo $\text{C}_1\text{-C}_2$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_2$ o haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_2$ o fenilo, bencilo, piridilo, pirimidilo, tiazolilo, oxazolilo, pirazolilo, tienilo, furanilo, piridinilmetilo o tiazolilmetilo representa cada uno mono- o disustituido dado el caso con flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi o trifluorometoxi.
- 10 W representa un resto de la serie S, SO y SO_2 .
- 15 X representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi y trifluorometoxi.
- 20 Y representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi y trifluorometoxi.
- A representa azufre.
- Q representa nitrógeno o C-R^3 .
- 25 R^3 representa hidrógeno.
- V representa oxígeno.
- 30 R^7 representa un resto de la serie hidrógeno, hidroxilo, representa fenilo, bencilo, piridilo, pirimidilo, tiazolilo, oxazolilo, pirazolilo, tienilo, furanilo, piridinilmetilo y tiazolilmetilo cada uno sustituido dado el caso una, dos, tres, cuatro o cinco veces con flúor, cloro o mono- o disustituido con ciano alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_4$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, alquil $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-S}(\text{O})_m$ -alquilo $\text{C}_1\text{-C}_2$, alquilcarbonilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, alcocarbonilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_6$, cicloalquil $\text{C}_3\text{-C}_6$ -alquilo $\text{C}_1\text{-C}_3$, heterociclilo y heterociclil-alquilo $\text{C}_1\text{-C}_3$ y cada uno dado el caso mono- a trisustituido con alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_3$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_3$, haloalcoxi $\text{C}_1\text{-C}_3$, ciclopropilo, flúor, cloro, bromo o ciano.
- 35 R^8 representa hidrógeno, un ión alcalino o alcalinotérreo, representa un ión amonio mono- a tetrasustituido dado el caso con alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$ o representa un resto de la serie alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_4$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alquilo $\text{C}_1\text{-C}_2$ y alquil $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-S}(\text{O})_m$ -alquilo $\text{C}_1\text{-C}_2$ cada uno sustituido dado el caso una, dos, tres, cuatro o cinco veces con flúor, cloro o mono o disustituido con ciano.
- m representa un número de la serie 0, 1 y 2.
- 40 Los sustituyentes o bien intervalos preferidos en particular de los restos indicados en los compuestos de la fórmula (I) se explican a continuación. Su combinación conforma el intervalo de preferencia (4).
- Het representa un resto de la serie



en la que la línea discontinua representa la unión con el átomo de carbono en el grupo N=C-A unido a Het.

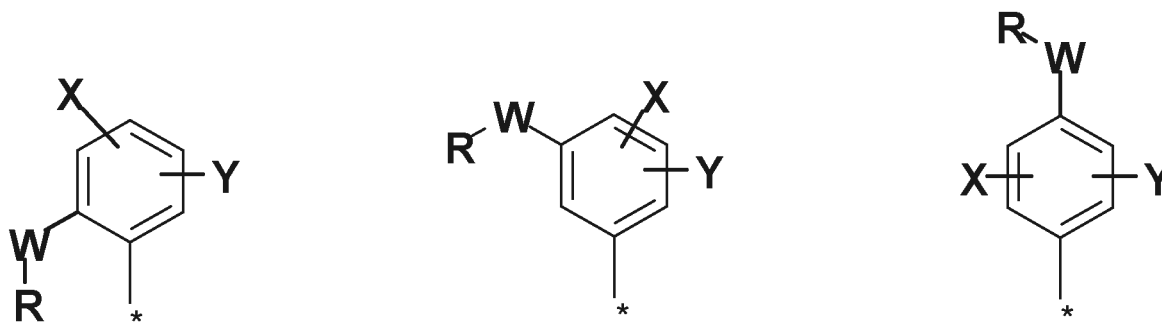
G¹ representa N o C-A¹.

A¹ representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro.

5 T representa oxígeno o un par de electrones.

R¹ representa un resto de la serie metilo, etilo, isopropilo, n-propilo, n-butilo, iso-butilo, sec-butilo, *terc*-butilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2-difluoro-n-propilo, metilsulfanil-metilo, metilsulfaniletilo, metilsulfanil-n-propilo, trifluorometilsulfonilmetilo, etilsulfonilmetilo, 2,2,2-trifluoroetilsulfonilmetilo, 2,2-difluoroetilsulfonilmetilo, isopropilsulfanilmetilo, metilsulfonilmetilo, trifluorometilsulfonilmetilo, etilsulfonil-metilo, 2,2,2-trifluoroetilsulfonilmetilo, 2,2-difluoroetilsulfonilmetilo, isopropilsulfonil-metilo, metilsulfonilmetilo, trifluorometilsulfonilmetilo, etilsulfonilmetilo, 2,2,2-trifluoroetilsulfonilmetilo, 2,2-difluoroetilsulfonilmetilo, isopropilsulfonilmetilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, metoxicarbonilmetilo, etoxicarbonilmetilo, metoxicarboniletilo, etoxicarboniletilo, dimetilaminocarbonilo, dietilaminocarbonilo, *N*-etil-*N*-metilaminocarbonilo, *N*-isopropil-*N*-metilaminocarbonilo, dimetilaminocarbonil-metilo, dietilaminocarbonilmetilo, *N*-etil-*N*-metilaminocarbonilmetilo, *N*-isopropil-*N*-metilaminocarbonilmetilo, dimetilaminocarboniletilo, dietilaminocarboniletilo, *N*-etil-*N*-metilaminocarboniletilo, *N*-isopropil-*N*-metilaminocarboniletilo, *N*-ciclopropil-*N*-metilaminocarbonilmetilo, *N*-ciclopropil-*N*-metilaminocarboniletilo, metilsulfanilo, trifluorometilsulfanilo, etilsulfanilo, 2,2,2-trifluoroetilsulfanilo, 2,2-difluoroetilsulfanilo, isopropilsulfanilo, metilsulfinilo, trifluorometilsulfinilo, etilsulfinilo, 2,2,2-trifluoroetilsulfinilo, 2,2-difluoroetilsulfinilo, isopropilsulfinilo, metilsulfonilo, trifluorometilsulfonilo, etilsulfonilo, 2,2,2-trifluoroetilsulfonilo, 2,2-difluoroetilsulfonilo, 2,2-difluoroetilsulfonilo, 2,2-difluoroetilsulfonilo, isopropilsulfonilo, 1-cianociclopropilo, 1-clorociclopropilo, 1-fluorociclopropilo, 2-cianociclopropilo, 2-clorociclopropilo, 2-fluorociclopropilo, 2,2,3,3-tetrafluorociclopropilo, 2-ciclopropilciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, 4-trifluorometilciclohexilo, ciclopropilmetilo, ciclopropiletilo, ciclobutilmetilo *N*-ciclopropil-*N*-metilaminocarbonilo, morfolin-4-*il*carbonilmetilo, piperazin-1-*il*carbonilmetilo, 4-metil-piperazin-1-*il*carbonilmetilo, heterocicli*il*metilo y heterocicli*il*etilo cada uno mono-, di- o trisustituidos dado el caso de manera igual o diferente con flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, hidroxilo, amino, metilo, etilo, isopropilo, *terc*-butilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, trifluorometoxi, difluorometoxi, heterocicli*il*metilo y heterocicli*il*etilo sustituidos cada uno con ciclopropilo, estando el resto ciclopropilo mono- o disustituido dado el caso con metilo, flúor, cloro, ciano o monosustituido con ciclopropilo, dado el caso mono- o disustituidos de manera igual o diferente con flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, hidroxilo, amino, metilo, etilo, isopropilo, *terc*-butilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, trifluorometoxi, difluorometoxi, dimetilhetarilo sustituido con aminocarbonilo, hetarilo sustituido con ciclopropilo, estando el resto ciclopropilo mono- o disustituido dado el caso con metilo, flúor, cloro, ciano o monosustituido con ciclopropilo, arilo dado el caso mono-, di- o trisustituido, de manera igual o diferente con flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, hidroxilo, amino, metilo, etilo, isopropilo, *terc*-butilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, trifluorometoxi, difluorometoxi, arilmetilo y ariletilo sustituidos cada uno con ciclopropilo, estando el resto ciclopropilo mono- o disustituido dado el caso con metilo, flúor, cloro, ciano o monosustituido con ciclopropilo, arilmetilo y ariletilo cada uno mono-, di- o trisustituidos dado el caso de manera igual o diferente con flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, hidroxilo, amino, metilo, etilo, isopropilo, *terc*-butilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, trifluorometoxi, difluorometoxi, arilmetilo y ariletilo sustituidos cada uno con ciclopropilo, estando el resto ciclopropilo mono- o disustituido dado el caso con metilo, flúor, cloro, ciano o monosustituido con ciclopropilo, hetarilmetilo y hetariletilo dado el caso mono o disustituido en cada caso de manera igual o diferente con flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, hidroxilo, amino, metilo, etilo, isopropilo, *terc*-butilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, trifluorometoxi, difluorometoxi, hetarilmetilo y hetariletilo sustituidos cada uno con ciclopropilo, estando el resto ciclopropilo mono- o disustituido dado el caso con metilo, flúor, cloro, ciano o monosustituido con ciclopropilo.

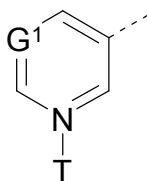
R¹ también representa el resto de la fórmula



en el que la unión con el átomo de nitrógeno en el grupo C(=V)-N-Q en la fórmula (I) está marcada con el asterisco (*).

- 5 R representa metilo, etilo, propilo, iso-propilo, n-butilo, iso-butilo, sec-butilo, terc-butilo, alilo, 2-butenilo, propargilo, 2-butinilo cada uno mono-, di- o trisustituido dado el caso con flúor o monosustituido con ciano, representa cicloalquilo C₃-C₆ dado el caso monosustituido con metilo, etilo, metoxi, etoxi o trifluorometilo, representa cicloalquilmetilo C₃-C₆ dado el caso monosustituido con metilo, etilo, metoxi o trifluorometilo o representa fenilo, bencilo, piridilo, pirimidilo, tiazolilo y piridinilmetilo cada uno mono- o disustituido dado el caso con flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo, iso-propilo, terc-butilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi o trifluorometoxi.
- 10 W representa un resto de la serie S, SO y SO₂.
- X representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi y trifluorometoxi.
- 15 Y representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi y trifluorometoxi.
- A representa azufre.
- Q representa nitrógeno o C-R³.
- R³ representa hidrógeno o metilo.
- V representa oxígeno.
- 20 Otra realización preferida de la invención se refiere a compuestos de la fórmula (I) en la que los sustituyentes tienen los siguientes significados. Su combinación conforma el intervalo de preferencia (5).

Het representa

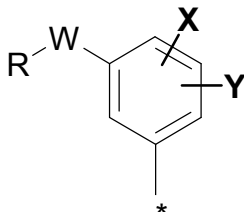


en la que la línea discontinua representa la unión con el átomo de carbono en el grupo N=C-A unido a Het.

- 25 G¹ representa C-A¹.
- A¹ representa hidrógeno.
- T representa oxígeno o un par de electrones.
- R¹ representa metilo, etilo, isopropilo, n-propilo, n-butilo, iso-butilo, sec-butilo, terc-butilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2-difluoro-n-propilo, dimetilaminocarbonilo, dietilaminocarbonilo, N-etil-N-metilaminocarbonilo, N-isopropil-N-metilaminocarbonilo, dimetilaminocarbonilmetilo, dietilaminocarbonilmetilo, N-etil-N-metilaminocarbonilmetilo, N-isopropil-N-metilaminocarbonilmetilo, dimetilaminocarboniletilo, dietilaminocarboniletilo, N-etil-N-metilaminocarboniletilo, N-isopropil-N-metilaminocarboniletilo, N-ciclopropil-N-metilaminocarbonilmetilo, N-ciclopropil-N-metilaminocarboniletilo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo,
- 30

ciclohexilo, hetarilmetilo y hetariletilo dado el caso mono o disustituido en cada caso de manera igual o diferente con flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, hidroxilo, amino, metilo, etilo, isopropilo, terc-butilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, trifluorometoxi, difluorometoxi.

R¹ también representa



5 en el que la unión con el átomo de nitrógeno en el grupo C(=V)-N-Q en la fórmula (I) está marcada con el asterisco (*).

R representa alquilo C₁-C₄ dado el caso mono- a trisustituido con flúor o cloro.

W representa un resto de la serie S y SO.

10 X representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, difluorometilo y trifluorometilo.

Y representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo (en particular representa flúor), metilo y etilo.

A representa azufre.

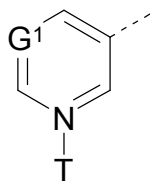
Q representa nitrógeno o C-R³.

15 R³ representa hidrógeno.

V representa oxígeno.

Otra realización preferida de la invención se refiere a compuestos de la fórmula (I), en la que los sustituyentes tienen los siguientes significados. Su combinación conforma el intervalo de preferencia (6).

Het representa



20 en la que la línea discontinua representa la unión con el átomo de carbono en el grupo N=C-A unido a Het.

G¹ representa C-A¹ o N.

A¹ representa hidrógeno o flúor.

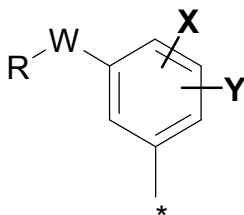
T representa oxígeno o un par de electrones.

25 R¹ representa metilo, etilo, isopropilo, n-propilo, n-butilo, iso-butilo, sec-butilo, terc-butilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2-difluoro-n-propilo, dimetilaminocarbonilo, dietilaminocarbonilo, N-etil-N-metilaminocarbonilo, N-isopropil-N-metilaminocarbonilo, dimetilaminocarbonilmetilo, dietilaminocarbonilmetilo, N-etil-N-metilaminocarbonilmetilo, N-isopropil-N-metilaminocarbonilmetilo, dimetilaminocarboniletilo, dietilaminocarboniletilo, N-etil-N-metilaminocarboniletilo, N-isopropil-N-metilaminocarboniletilo, N-ciclopropil-N-metilaminocarbonilmetilo, N-ciclopropil-N-metilaminocarboniletilo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopropilmetilo, benzotienilo sustituido dado el caso con dimetilaminocarbonilo, fenilo sustituido dado el caso con halógeno, metilo o trifluoroetoxi, fenilmetilo dado el caso sustituido con metilo, metoxi, difluorometoxi o halógeno, hetarilmetilo y hetariletilo dado el caso mono o disustituido en cada caso de manera igual o diferente con flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, hidroxilo, amino, metilo, etilo, isopropilo, terc-butilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, trifluorometoxi, difluorometoxi.

30

35

R¹ también representa



en el que la unión con el átomo de nitrógeno en el grupo C(=V)-N-Q en la fórmula (I) está marcada con el asterisco (*).

- 5 R representa alquilo C₁-C₄ dado el caso mono- a trisustituido con flúor o cloro.
 W representa un resto de la serie S, SO y SO₂.
 X representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, difluorometilo y trifluorometilo.
 Y representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo (en particular representa flúor), metilo y etilo.
- 10 A representa azufre.
 Q representa nitrógeno o C-R³.
 R³ representa hidrógeno o metilo.
 V representa oxígeno.

- 15 En las definiciones preferidas cuya combinación conforman el intervalo de referencia (1), salvo que se haya indicado lo contrario, se realizaron las siguientes elecciones:
 el ión alcalino se seleccionó de la serie litio, sodio, potasio, rubidio, cesio, preferentemente de la serie litio, sodio y potasio,
 el ión alcalinotérreo se seleccionó de la serie berilio, magnesio, calcio, estroncio, bario, preferentemente de la serie magnesio y calcio,
 20 halógeno se seleccionó de la serie flúor, cloro, bromo y yodo, a su vez preferentemente de la serie flúor, cloro y bromo,
 arilo (también como parte de una unidad más grande, como por ejemplo arilalquilo) se seleccionó de la serie fenilo, naftilo, antrilo, fenantrenilo y a su vez representa preferentemente fenilo,
 hetarilo (del mismo significado que heteroarilo, también como parte de una unidad más grande, como por ejemplo hetarilalquilo) se seleccionó de la serie furilo, tienilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo,
 25 oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 1,2,3-oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo, 1,2,3-tiadiazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridacínilo, piracínilo, 1,2,3-triacínilo, 1,2,4-triacínilo, 1,3,5-triacínilo, benzofurilo, benzisofurilo, benzotienilo, benzisotienilo, indolilo, isoindolilo, indazolilo, benzotiazolilo, benzisotiazolilo, benzoxazolilo, benzisoxazolilo, bencimidazolilo, 2,1,3-benzoxadiazol, quinolinilo, isoquinolinilo, cinolinilo, ftalacínilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, naftiridinilo, benzotriacínilo, purinilo, fteridinilo
 30 e indolicínilo,
 heterociclilo un anillo de 4, 5 o 6 miembros saturado, que contiene 1 o 2 átomos de nitrógeno y/o un átomo de oxígeno y/o un átomo de azufre, por ejemplo azetidínilo, azolidínilo, azinanilo, oxetanilo, oxolanilo, oxanilo, dioxanilo, tietanilo, tiolanilo, tianilo, tetrahidrofurilo, piperacínilo, morfolinilo.

- 35 En las definiciones especialmente preferidas cuya combinación conforma el intervalo de referencia (2), salvo que se indique lo contrario, se realizaron las siguientes elecciones:
 el ión alcalino se seleccionó de la serie litio, sodio, potasio, rubidio, cesio, preferentemente de la serie litio, sodio y potasio,
 el ión alcalinotérreo se seleccionó de la serie berilio, magnesio, calcio, estroncio, bario, preferentemente de la serie magnesio y calcio,
 40 halógeno se seleccionó de la serie flúor, cloro, bromo y yodo, a su vez preferentemente de la serie flúor, cloro y bromo,
 arilo (también como parte de una unidad más grande, como por ejemplo arilalquilo) se seleccionó de la serie fenilo, naftilo, antrilo y fenantrenilo y a su vez representa preferentemente fenilo,
 hetarilo (del mismo significado que heteroarilo, también como parte de una unidad más grande, como por ejemplo hetarilalquilo) se seleccionó de la serie pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, oxazolilo, isoxazolilo,
 45 tiazolilo, isotiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridacínilo, piracínilo, 1,2,3-triacínilo, 1,2,4-triacínilo, 1,3,5-triacínilo, benzotienilo,
 heterociclilo se seleccionó de la serie azetidínilo, azolidínilo, azinanilo, oxetanilo, oxolanilo, oxanilo, dioxanilo, tietanilo, tiolanilo, tianilo, tetrahidrofurilo, piperacínilo, morfolinilo.

En las definiciones muy especialmente preferidas o bien las definiciones preferidas en particular, cuyas combinaciones conforman el intervalo de referencia (3) o bien el intervalo de referencia (4), salvo que se haya indicado lo contrario, se realizaron las siguientes elecciones:

5 el ión alcalino representa un ión de la serie litio, sodio, potasio, rubidio, cesio, preferentemente de la serie litio, sodio, potasio,

el ión alcalinotérreo representa un ión de la serie berilio, magnesio, calcio, estroncio y bario, preferentemente de la serie magnesio y calcio,

halógeno representa flúor, cloro, bromo y yodo, a su vez representa preferentemente flúor, cloro y bromo,

10 heterociclilo representa un resto de la serie oxetanilo, tietanilo, tetrahydrofurilo y morfolinilo, arilo representa fenilo y hetarilo (del mismo significado que heteroarilo, también como parte de una unidad más grande, como por ejemplo hetarilalquilo) representa un resto de la serie piridilo, pirimidilo, piracinilo, piridacnilo, tiazolilo, pirazolilo y benzotienilo,.

En las definiciones que conforman el intervalo de referencia (5) o bien el intervalo de referencia (6),

halógeno representa flúor, cloro, bromo y yodo, a su vez representa preferentemente flúor, cloro y bromo y

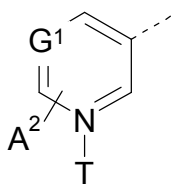
hetarilo representa piridilo, pirimidinilo, tiazolilo, pirazolilo y benzotienilo.

15 Los restos sustituidos con halógeno, p. ej. haloalquilo (= haloalquilo), están mono- o polihaloalquilados hasta el número máximo posible de sustituyentes. En caso de polihaloalquilación, los átomos de halógeno pueden ser iguales o diferentes. Halógeno en ese caso representa flúor, cloro, bromo o yodo, en particular representa flúor, cloro o bromo.

Los restos hidrocarburo saturados o insaturados como alquilo o alqueno pueden, también en combinación con heteroátomos, como p. ej., en alcoxi, pueden cada uno en lo posible ser de cadena lineal o ramificada.

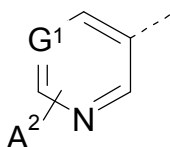
20 Los restos dado el caso sustituidos, salvo que se haya indicado lo contrario, pueden estar mono- o polisustituidos, pudiendo los sustituyentes ser iguales o diferentes en caso de polisustituciones.

Cuando T en el resto Het de la fórmula

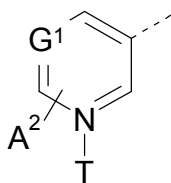


representa un par de electrones, el resto se presenta como derivado de piridina de la fórmula

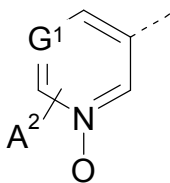
25



Cuando T en el resto Het de la fórmula



representa oxígeno, el resto se presenta como derivado de piridin-N-óxido de la fórmula



30 Aquí se prescindió de la indicación de las cargas formales (+ en el nitrógeno y – en el oxígeno) (cf. el ejemplo 24 en la Tabla 1).

Las definiciones de restos o bien explicaciones generales o preferentes antes indicadas rigen para los productos finales y de manera correspondiente para los productos de partida y los intermedios. Estas definiciones de restos pueden combinarse a discreción entre sí, es decir, también entre los distintos grados de preferencia.

5 Se prefieren según la invención los compuestos de la fórmula (I) en los que existe una combinación de los significados indicados antes como preferidos (intervalo de referencia (1)).

Se prefieren especialmente según la invención los compuestos de la fórmula (I) en los que existe una combinación de los significados indicados antes como especialmente preferidos (intervalo de referencia (2)).

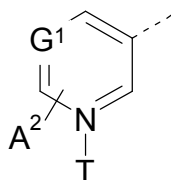
Se prefieren muy especialmente según la invención los compuestos de la fórmula (I) en los que existe una combinación de los significados indicados antes como muy especialmente preferidos (intervalo de referencia (3)).

10 Se prefieren en particular según la invención los compuestos de la fórmula (I) en los que existe una combinación de los significados indicados antes como preferidos en particular (intervalo de referencia (4)).

Otro grupo de compuestos destacados de la fórmula (I) son aquellos que conforman el intervalo de referencia (5).

Otro grupo de compuestos destacados de la fórmula (I) son aquellos que conforman el intervalo de referencia (6).

15 Una realización preferida de la invención se refiere a compuestos de la fórmula (I) en los que Het representa el resto de la fórmula



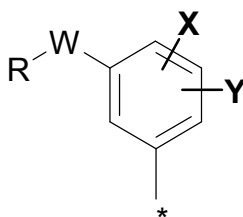
Otra realización preferida de la invención se refiere a compuestos de la fórmula (I) en los que Het representa piridin-3-ilo.

20 Otra realización preferida de la invención se refiere a compuestos de la fórmula (I) en los que Het representa 5-fluoropiridin-3-ilo.

Otra realización preferida de la invención se refiere a compuestos de la fórmula (I) en los que Het representa pirimidin-5-ilo.

Otra realización preferida de la invención se refiere a compuestos de la fórmula (I) en los que Het representa piridazin-4-ilo.

25 Otra realización preferida de la invención se refiere a compuestos de la fórmula (I) en los que R¹ representa el resto



Otra realización preferida de la invención se refiere a compuestos de la fórmula (I) en los que Q representa C-H.

30 Los compuestos de la fórmula (I) pueden eventualmente dependiendo del tipo de sustituyentes presentarse como estereoisómeros, es decir como isómeros geométricos y/o como isómeros ópticamente activos o en forma de correspondientes mezclas isoméricas en diferente composición. Tanto los estereoisómeros puros como también mezclas cualesquiera de estos isómeros son objeto de esta invención, aunque aquí en general solo se mencione a compuestos de la fórmula (I).

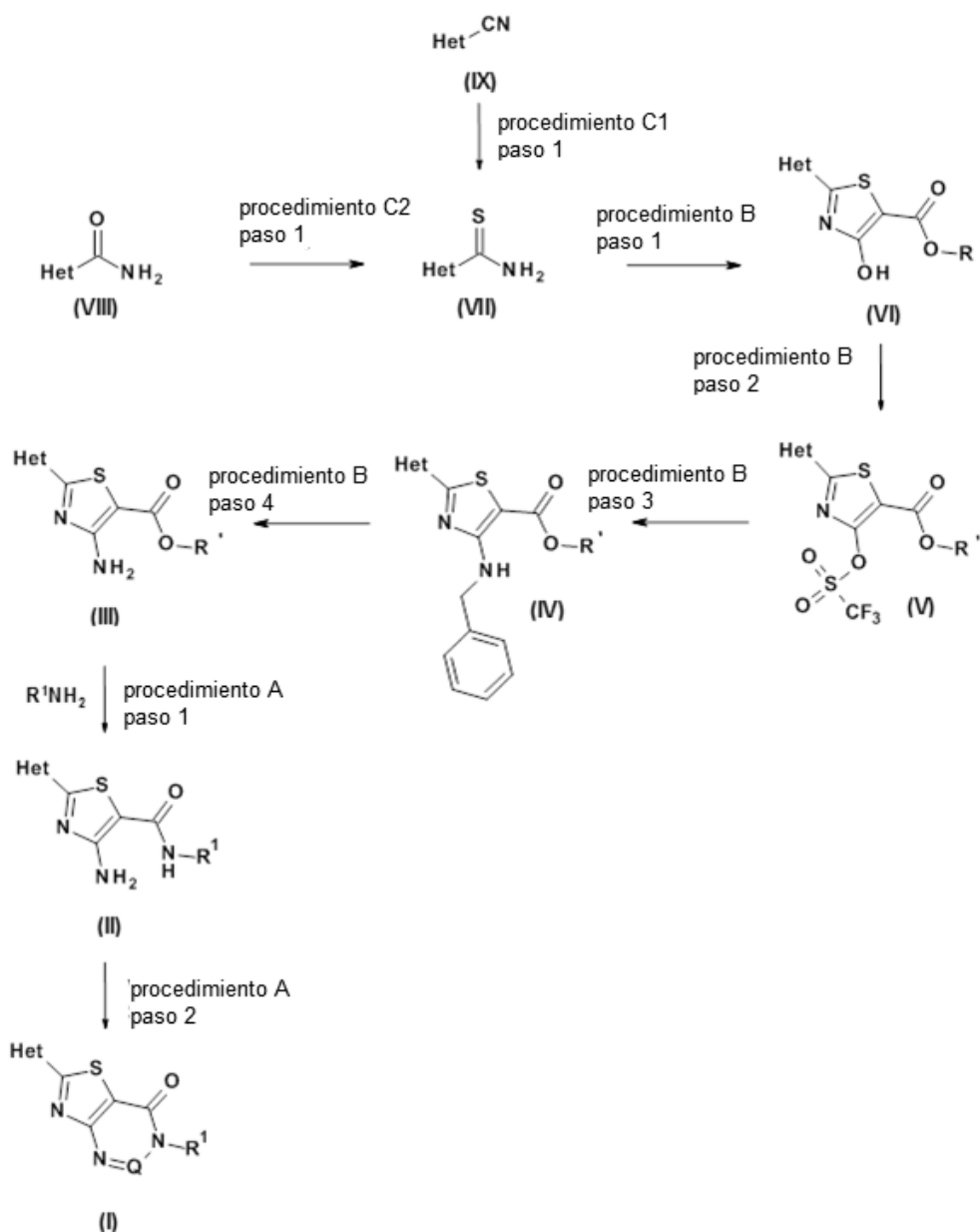
Pero preferentemente se usan de acuerdo con la invención las formas estereoisoméricas, ópticamente activas de los compuestos de la fórmula (I) y sus sales.

35 La invención por lo tanto se refiere tanto a los enantiómeros y diaestereómeros puros como también a sus mezclas para combatir plagas animales en las que se incluyen artrópodos y en particular insectos.

Además se determinó que los nuevos compuestos de la fórmula (I) pueden prepararse de acuerdo con los procedimientos descritos a continuación.

Los compuestos de la fórmula (I) pueden prepararse por ejemplo de acuerdo con el procedimiento A en dos pasos, tal como se represento en el siguiente esquema. Los aminotiazoles de la fórmula (III) necesarios para ello, pueden prepararse por ejemplo de acuerdo con el procedimiento B a partir de heteroaril-tioamidas.

Los compuestos de la fórmula (II) también son objeto de la invención y pueden prepararse tal como se ha descrito en los siguientes procedimientos.



10 presentando Het, Q y R¹ tienen los significados antes indicados y R' representa hidrógeno o alquilo (en particular metilo y etilo).

Procedimiento A

La síntesis de los compuestos de la fórmula (I) puede realizarse por medio de procedimientos conocidos en la literatura en dos pasos.

15 En el primer paso de síntesis, pueden transformarse compuestos de la fórmula (III) según diferentes procedimientos en amidas de ácido carboxílico de las fórmulas (II). Para R' = alquilo, esta reacción puede producirse sin activación, (cf. B. M. Trost y I. Fleming en Comprehensive Organic Synthesis, Ed. Pergamon, 1991, Vol. 6). De modo alternativo,

se conocen de la literatura procedimientos de activación por medio de la formación de una amida de aluminio (véase T. Ooi y K. Marouka en *Science of Synthesis*, Ed. Georg Thieme, 2003, Vol. 7, 225-246). Estas amidas de aluminio pueden prepararse por ejemplo de las aminas o sus sales mediante la transformación con trimetilaluminio o su aducto estable al aire con 1,4-diazobicyclo[2.2.3]octano (DABCO) (cf. S. Woodward en *Tet. Lett.* 2006, 47, 5767-5769).

- 5 En forma alternativa, los aminopirazoles de la fórmula (III), con R' = alquilo, pueden transformarse en dos pasos en las amidas de las fórmulas (II): primero saponificación en los carboxilatos, por ejemplo mediante la reacción con una base inorgánica (preferentemente lejías sódicas y de potasa cáustica), dado el caso en un disolvente orgánico inerte, dado el caso pueden prepararse y aislarse mediante la acidificación con un ácido diluido (p. ej., ácido clorhídrico acuoso) los ácidos carboxílicos de la fórmula (III) con R' = hidrógeno; la posterior reacción de amidación con la posterior
10 reacción de amidación con las aminas deseadas produce los compuestos de la fórmula (II). Para el paso de amidación se han descrito numerosas condiciones de reacción, p. ej., G. Benz en *Comprehensive Organic Synthesis*, 1st Ed., Pergamon Press, Oxford, 1991, Vol. 6, pág. 381-417; P.D. Bailey et al. en *Comprehensive Organic Functional Group Transformation*, 1st Ed., Elsevier Science Ltd., Oxford, 1995, Vol. 5, pág. 257-308 y R.C. Larock en *Comprehensive Organic Transformations*, 2nd Ed., Wiley-VCH, New York, Weinheim, 1999, pág. 1929-1994. Algunas de estas
15 reacciones proceden a través de cloruros de carbonilo intermedios, que se pueden usar en forma aislada o después de haber sido generados in situ.

Las reacciones de amidación se efectúan opcionalmente en presencia de un agente de condensación, opcionalmente en presencia de un aceptor de ácido y opcionalmente en presencia de un disolvente.

- 20 Son agentes de condensación útiles todos los agentes de condensación que pueden usarse comúnmente para tales reacciones de amidación. Los ejemplos incluyen formadores de haluro de ácido tales como fosgeno, tricloruro de fósforo, cloruro de oxalilo o cloruro de tionilo; carbodiimidas tales como *N,N'*-diciclohexilcarbodiimida (DCC) y 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida (EDCI), u otros agentes de condensación usuales, tales como pentóxido de fósforo, ácido polifosfórico, *N,N'*-carbonildiimidazol, 1-metoyoduro de 2-cloropiridina (reactivo de Mukaiyama), 2-etoxi-*N*-etoxicarbonil-1,2-dihidroquinolina (EEDQ), trifenilfosfina / tetracloruro de carbono, hexafluorofosfato de bromotripirrolidinofosfonio (BROP), hexafluorofosfato de *O*-(1*H*-benzotriazol-1-iloxi)tris(dimetilamino)fosfonio (BOP), tetrafluoroborato de *N,N,N',N'*-bis(tetrametilen)cloruronio, hexafluorofosfato de *O*-(1*H*-benzotriazol-1-il)-*N,N,N',N'*-tetrametiluronio (HBTU), hexafluorofosfato de *O*-(1*H*-benzotriazol-1-il)-*N,N,N',N'*-bis(tetrametilen)uronio, tetrafluoroborato de *O*-(1*H*-benzotriazol-1-il)-*N,N,N',N'*-tetrametiluronio (TBTU), tetrafluoroborato *O*-(1*H*-benzotriazol-1-il)-*N,N,N',N'*-bis(tetrametilen)uronio, hexafluorofosfato de *O*-(7-azabenzotriazol-1-il)-*N,N,N',N'*-tetrametiluronio (HATU), 1-hidroxibenzotriazol (HOBt) y sal de 4-(4,6-dimetoxi-1,3,5-triazin-2-il)-4-metilmorfolinio (DMT.MM), usualmente disponible como cloruro. Estos reactivos pueden ser usados por separado o, si es apropiado, en
30 combinación.

- Son aceptores de ácido útiles todas las bases inorgánicas u orgánicas usuales, por ejemplo trietilamina, diisopropiletilamina, *N*-metilmorfolina o *N,N* dimetilaminopiridina. El procedimiento A de acuerdo con la invención se
35 lleva a cabo opcionalmente en presencia de un coadyuvante de la reacción adecuado, por ejemplo *N,N*-dimetilformamida o *N,N*-dimetilaminopiridina. Los disolventes o diluyentes útiles incluyen todos los disolventes orgánicos inertes, por ejemplo hidrocarburos alifáticos o aromáticos (tales como éter de petróleo, tolueno), hidrocarburos halogenados (tales como clorotolueno, diclorometano, cloroformo, 1,2-dicloroetano), éteres (tales como éter dietílico, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano), ésteres (tales como acetato de etilo o de metilo),
40 nitrohidrocarburos (tales como nitrometano, nitroetano, nitrobenceno), nitrilos (tales como acetonitrilo, benzonitrilo), amidas (tales como *N,N*-dimetilformamida, *N,N*-dimetilacetamida, *N*-metilformanilida, *N*-metilpirrolidona, hexametilfosforamida), y también dimetilsulfóxido o agua o mezclas de los disolventes mencionados.

- También es posible usar anhídridos mixtos para la preparación de compuestos de la fórmula (III) (véase *J. Am. Chem. Soc.* 1967, 5012). En este procedimiento, es posible usar diversos ésteres de ácido clorofórmico, por ejemplo
45 cloroformiato de isobutilo y cloroformiato de isopropilo. Es igualmente posible para este propósito usar cloruro de dietilacetilo, cloruro de trimetilacetilo y similares.

En un segundo paso de síntesis, las carboxamidas de la fórmula (II) pueden ser cicladas a los compuestos de las fórmulas (I).

- 50 Para Q = C-R³ en el que R³ es H o alquilo, la ciclación de carboxamidas de la fórmula (II) se puede realizar con un ortoéster, tal como ortoformiato de trietilo u ortoacetato de trietilo, opcionalmente en presencia de un disolvente o diluyente (por ejemplo, en presencia de alcoholes tales como etanol, pero también en presencia de *N,N*-dimetilformamida o *N,N*-dimetilacetamida), opcionalmente en presencia de un ácido orgánico (por ejemplo ácido *p*-toluenosulfónico o ácido acético) o un ácido inorgánico (por ejemplo ácido clorhídrico o ácido sulfúrico) en cantidades catalíticas o estequiométricas o en exceso. Los ácidos mencionados también se pueden usar en lugar del disolvente o diluyente. Para R³ = H, hay ejemplos de tales reacciones con ortoformiato de trietilo en *Archiv der Pharmazie* 2000,
55 333(8), 261-266 (para la preparación de quinazolinonas), *J. het. Chem.* 1990, 27(7), 1953-1956 (idem.), documento WO2010/54398 (para la preparación de pirazinopirimidinonas). Para R³ = metilo, véase, por ejemplo, el documento WO2010/100189 (para la preparación de quinazolinonas).

Para Q = CR³ en el que R³ es alquilo o haloalquilo, las pirazolopirimidinonas de la fórmula (I) se puede preparar

también por reacción de las carboxamidas de la fórmula (II), respectivamente, con haluros de carbonilo o anhídridos de ácidos carboxílicos adecuados mediante procedimientos conocidos en la literatura, como se describe, por ejemplo, en el documento WO2009/143049 en el caso de que R^3 = metilo y en el documento WO 2008/039489 en el caso de que R^3 = trifluorometilo.

- 5 Para Q = N, las pirazolopirimidinonas de la fórmula (I) se pueden preparar por azodiazotización de las carboxamidas de la fórmula (II), respectivamente, mediante procedimientos conocidos de la literatura. Por ejemplo, los compuestos de la fórmula (II) se mezclan a 0 a 5 °C con una fuente de nitrito, tal como nitrito de sodio o nitrito de isobutilo, normalmente en agua, alcohol o un disolvente polar inerte, y en presencia de un ácido orgánico o inorgánico. Ejemplos de condiciones de reacción se pueden encontrar en el documento WO 2004/242572 o en J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 1980, 633-638.

Los compuestos de la fórmula (II) / (III) son nuevos y también son objeto de la invención.

Procedimientos generales para la oxidación de tioéteres en sulfóxidos y sulfonas

- 15 Los compuestos de la fórmula (I) en los que W representa SO (sulfóxidos) o W representa SO₂ (sulfonas) por medio de oxidación según procedimientos conocidos en la literatura pueden prepararse a partir de compuestos de la fórmula (I) en los que W representa S (tioéteres), por ejemplo mediante un agente de oxidación en un disolvente o bien diluyente adecuado. Como agentes de oxidación son adecuados por ejemplo ácido nítrico diluido, peróxido de hidrógeno, Oxone® y ácidos peroxicarboxílicos, como por ejemplo ácido *meta*-cloroperbenzoico. Como disolventes o bien diluyentes son adecuados disolventes orgánicos inertes, normalmente acetonitrilo y disolventes halogenados como ser diclorometano, cloroformo o dicloroetano, así como agua y alcoholes como metanol para la reacción con Oxone®. También es posible la introducción de anilinas adecuadas R¹-NH₂, halogenuros R¹-Hal o ácidos borónicos R¹-B(OH)₂, en los cuales W representa SO o SO₂, de acuerdo con el procedimiento A-1 o A-2. Estos pueden obtenerse mediante oxidación de los correspondientes precursores en los cuales W representa S, según procedimientos conocidos en la literatura, como por ejemplo se ha descrito en el documento WO 2013/092350.

- 25 Para la producción de sulfóxidos enriquecidos enantioméricamente son apropiados una multiplicidad de métodos, como descritos por A.R. Maguire en ARKIVOC, 2011(i), 1-110, : oxidaciones asimétricas catalizadas por metales de tioéteres, por ejemplo con titanio y vanadio como fuentes de catalizadores más usuales, en forma de Ti(OiPr)₄ y VO(acac)₂, junto con un ligando quiral y un agente de oxidación como peróxido de terc-butilhidrógeno (TBHP), 2-fenilpropan-2-ilhidroperóxido (CHP) o peróxido de hidrógeno; oxidaciones asimétricas catalizadas sin metales mediante el uso de agentes de oxidación quirales o catalizadores quirales; oxidaciones asimétricas biológicas o electroquímicas así como resolución cinética de sulfóxidos y sustitución nucleofílica (según el procedimiento de Andersen).

Los enantiómeros también pueden obtenerse de un racemato, a modo de ejemplo mediante separación preparativa mediante una HPLC quiral.

- 35 Los aminotiazoles de las fórmulas (III) requeridos en el procedimiento A pueden prepararse a modo de ejemplo según el procedimiento B. En el caso de heteroaril-tioamidas que no están disponibles en el mercado, como sustancias de partida para el procedimiento B, estas como es sabido pueden sintetizarse según el procedimiento C1 o C2:

Procedimiento C1

- 40 Las heteroaril-tioamidas de la fórmula (VII) pueden prepararse en un paso según procedimientos en sí conocidos a partir de las correspondientes heteroaril-amidas de ácido carboxílico de la fórmula (VIII) que pueden obtenerse comercialmente y donantes adecuados de azufre. Así, en el documento WO 2013/104415 Petterson et al. ha descrito un procedimiento para la transformación de grupos carbonilo en grupos tiocarbonilo en el que se hacen reaccionar los correspondientes compuestos de partida a una temperatura entre 50 °C y 100 °C con un compuesto de azufre adecuado, p. ej., un complejo difosforpentasulfuro-dipiridina, dado el caso en un disolvente orgánico inerte (p. ej., acetonitrilo).

Procedimiento C2

- 45 Las heteroaril-tioamidas de la fórmula (VII) alternativamente al procedimiento B1 también pueden prepararse en un paso según procedimientos en sí conocidos a partir de las correspondientes heteroaril-amidas de ácido carboxílico de la fórmula (IX) que pueden obtenerse comercialmente y donantes adecuados de azufre. Por ejemplo según Mahammed et al. (Journal of Sulfur Chemistry, 28(3), 233-237; 2007) mediante la reacción con ácido tioacético con presencia de hidruro de tioacético con la presencia de hidruro de calcio a una temperatura entre 50 °C y 100°C en un entorno sin disolventes. Alternativamente también se ha descrito p. ej., una síntesis realizada con ayuda de un horno microondas (Synlett, (14), 2615-2617; 2004), cuando se hacen reaccionar los correspondientes nitrilos a una temperatura entre 50 °C y 100 °C con sulfuro de amonio en un disolvente orgánico inerte (p. ej., alcoholes).

Procedimiento B

- 55 Se han descrito ejemplos para la transformación de tioamidas en derivados de tiazol del tipo (VI) en el documento WO

2013/092711 A1 (cf. también *Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters* (2010), 20(9), 2828-2831). Las tioamidas (VII) que pueden obtenerse comercialmente o prepararse según el procedimiento C1 o C2, primero se hacen reaccionar en un disolvente inerte adecuado (p. ej., dioxano o tolueno) bajo temperatura de reflujo, dado el caso en presencia de una base (p. ej., piridina) con 2-cloromalonato de dimetilo o 2-bromomalonato de dimetilo para obtener el compuesto (VI) deseado.

A continuación se logra (p. ej., según *Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters* (2010), 20(9), 2828-2831) mediante la reacción de (VI) con anhídrido de ácido trifluorometansulfónico en presencia de una base adecuada (p. ej., trietilamina, carbonato de sodio, piridina o lutidina) en un disolvente inerte (p. ej., diclorometano) a una temperatura entre -20 °C hasta temperatura ambiente, la preparación del compuesto (V).

Como es sabido los compuestos del tipo (V) pueden transformarse (p. ej., según el documento WO 2003/101985 A1) en compuestos del tipo (IV) mediante el calentamiento con bencilamina en disolventes inertes (p. ej., dioxano) a temperaturas entre 50 a 100 °C.

La escisión de la función bencilamino para obtener el compuesto meta del tipo (III) puede lograrse según procedimientos en sí conocidos (p. ej., el documento WO 2003/066629 A2) mediante el calentamiento en ácidos adecuados (p. ej., ácido trifluoroacético o ácido sulfúrico) a temperaturas entre 20 y 80 °C. Las amidas ácidas que dado el caso pueden formarse, se hidrolizan mediante el calentamiento con carbonato de potasio en una mezcla de agua-metanol para obtener el compuesto meta (III).

Los derivados de tiazol así preparados de las fórmulas (VI) a (III) pueden escindirse, por ejemplo mediante separación cromatográfica sobre gel de sílice o RP(C-18) o mediante la agitación o recristalización usando disolventes adecuados.

Isómeros

Los compuestos de la fórmula (I), dependiendo del tipo de sustituyentes, pueden estar disponibles como isómeros geométricos y/o como isómeros ópticamente activos o correspondientes mezclas de isómeros en diferente composición. Estos estereoisómeros son por ejemplo enantiómeros, diastereómeros, atropisómeros o isómeros geométricos. La invención por lo tanto comprende estereoisómeros puros como también mezclas cualesquiera de estos isómeros.

Procedimientos y usos

La revelación se refiere también a procedimientos para combatir parásitos animales en los que se deja actuar compuestos de la fórmula (I) sobre parásitos animales y/o su hábitat. Preferentemente se combate los parásitos animales en la agricultura y la silvicultura y en la protección de materiales. Aquí se excluyen los procedimientos para el tratamiento quirúrgico o terapéutico del cuerpo humano o animal y procedimientos de diagnóstico que se realizan en el cuerpo humano o animal.

La revelación se refiere además al uso de los compuestos de la fórmula (I) como agentes para combatir parásitos de plantas, en particular agentes fitoprotectores.

En el marco de la presente solicitud, el concepto agentes para combatir parásitos también incluye siempre el concepto agentes fitoprotectores.

Los compuestos de la fórmula (I) resultan apropiados en cuanto a la buena compatibilidad con plantas, adecuada toxicidad en relación a animales de sangre caliente y buena compatibilidad con el medio ambiente para la protección de plantas y órganos de plantas, para el aumento del rendimiento de la cosecha, el mejoramiento de la calidad del fruto de la cosecha y para combatir los parásitos animales, especialmente insectos, arácnidos, helmintos, nematodos y moluscos que existen en la agricultura, la horticultura, la cría de animales, en bosques y elementos de ocio, en la protección de materiales y acopio así como en el sector de la higiene. Preferentemente pueden usarse como agentes para combatir parásitos. Son efectivos contra especies de sensibilidad normal y resistente, así como contra todos o algunos de los estadios de desarrollo. Se incluyen en los parásitos antes mencionados:

Parásitos de la cepa de los artrópodos, en particular de la clase de los arácnidos p. ej., *Acarus* spp., p. ej., *Acarus siro*, *Aceria kuko*, *Aceria sheldoni*, *Aculops* spp., *Aculus* spp., p. ej., *Aculus fockeui*, *Aculus schlechtendali*, *Amblyomma* spp., *Amphitetranychus viennensis*, *Argas* spp., *Boophilus* spp., *Brevipalpus* spp., p. ej., *Brevipalpus phoenicis*, *Bryobia graminum*, *Bryobia praetiosa*, *Centruroides* spp., *Choriotptes* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Dermatophagoides pteronyssinus*, *Dermatophagoides farinae*, *Dermacentor* spp., *Eotetranychus* spp., p. ej., *Eotetranychus hicoriae*, *Epitrimerus piri*, *Eutetranychus* spp., p. ej., *Eutetranychus banksi*, *Eriophyes* spp., p. ej., *Eriophyes piri*, *Glycyphagus domesticus*, *Halotydeus destructor*, *Hemitarsonemus* spp., p. ej., *Hemitarsonemus latus* (=Polyphagotarsonemus latus), *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Latrodectus* spp., *Loxosceles* spp., *Neutrombicula autumnalis*, *Nuphessa* spp., *Oligonychus* spp., p. ej., *Oligonychus coniferarum*, *Oligonychus ilicis*, *Oligonychus indicus*, *Oligonychus mangiferus*, *Oligonychus pratensis*, *Oligonychus punicae*, *Oligonychus yothersi*, *Ornithodoros* spp., *Ornithonyssus* spp., *Panonychus* spp., p. ej., *Panonychus citri* (=Metatetranychus citri), *Panonychus ulmi* (=Metatetranychus ulmi), *Philocoptruta oleivora*, *Platytetranychus multidigituli*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Psoroptes* spp., *Rhipicephalus* spp., *Rhizoglyphus* spp., *Sarcoptes* spp., *Scorpio maurus*, *Steneotarsonemus* spp., *Steneotarsonemus spinki*, *Tarsonemus*

spp., p. ej., *Tarsonemus confusus*, *Tarsonemus pallidus*, *tetranychus* spp., p. ej., *tetranychus canadensis*, *tetranychus cinnabarinus*, *tetranychus turkestanii*, *tetranychus urticae*, *Trombicula alfreddugesi*, *Vaejovis* spp., *Vasates lycopersici*;

de la clase de los quilópodos p. ej., *Geophilus* spp., *Scutigera* spp.;

del orden o de la clase de los colémbolos p. ej., *Onychiurus armatus*; *Sminthurus viridis*;

5 de la clase de los diplópodos p. ej., *Blaniulus guttulatus*;

de la clase de los insectos, p. ej., del orden de los Blattodea p. ej., *Blatta orientalis*, *Blattella asahinai*, *Blattella germanica*, *Leucophaea maderae*, *Pancloroa* spp., *Parcoblatta* spp., *Periplaneta* spp., p. ej., *Periplaneta americana*, *Periplaneta australasiae*, *Supella longipalpa*;

10 del orden de los coleópteros p. ej., *Acalymma vittatum*, *Acanthoscelides obtectus*, *Adoretus* spp., *Agelastica alni*, *Agriotes* spp., p. ej., *Agriotes linneatus*, *Agriotes mancus*, *Alphitobius diaperinus*, *Amphimallon solstitialis*, *Anobium punctatum*, *Anoplophora* spp., *Anthonomus* spp., p. ej., *Anthonomus grandis*, *antrenus* spp., *Apion* spp., *Apogonia* spp., *Atomaria* spp., p. ej., *Atomaria linearis*, *Attagenus* spp., *Baris caerulescens*, *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp., p. ej., *Bruchus pisorum*, *Bruchus rufimanus*, *Cassida* spp., *Cerotoma trifurcata*, *Ceutorrhynchus* spp., p. ej., *Ceutorrhynchus assimilis*, *Ceutorrhynchus quadridens*, *Ceutorrhynchus rapae*, *Chaetocnema* spp., p. ej.,
15 *Chaetocnema confinis*, *Chaetocnema denticulata*, *Chaetocnema ectypa*, *Cleonus mendicus*, *Conoderus* spp., *Cosmopolites* spp., p. ej., *Cosmopolites sordidus*, *Costelytra zealandica*, *Ctenicera* spp., *Curculio* spp., p. ej., *Curculio caryae*, *Curculio caryatipes*, *Curculio obtusus*, *Curculio sayi*, *Cryptolestes ferrugineus*, *Cryptolestes pusillus*, *Cryptorhynchus lapathi*, *Cryptorhynchus mangiferae*, *Cilindrocopturus* spp., *Cilindrocopturus adpersus*, *Cilindrocopturus furnissi*, *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp., p. ej., *Diabrotica balteata*, *Diabrotica barberi*, *Diabrotica*
20 *y Ecypunctata howardi*, *Diabrotica y Ecypunctata y Ecypunctata*, *Diabrotica virgifera virgifera*, *diabrotica virgifera zaeae*, *Dichocrocis* spp., *Dicladispa armigera*, *Diloboderus* spp., *Epilachna* spp., p. ej., *Epilachna borealis*, *Epilachna varivestis*, *Epitrix* spp., p. ej., *Epitrix cucumeris*, *Epitrix fuscula*, *Epitrix hirtipennis*, *Epitrix subcristata*, *Epitrix tuberosa*, *Faustinus* spp., *Gibbium psilloides*, *Gnathocerus cornutus*, *Hellula y alis*, *Heteronychus arator*, *Heteronyx* spp., *Hilamorpha elegans*, *Hilotrupes bajulus*, *Hypera postica*, *Hypomeces squamosus*, *Hypothenemus*
25 spp., p. ej., *Hypothenemus hampei*, *Hypothenemus obscurus*, *Hypothenemus pubescens*, *Lachnosterna consanguinea*, *Lasioderma serricornis*, *Latheticus oryzae*, *Lathridius* spp., *Lema* spp., *Leptinotarsa decemlineata*, *Leucoptera* spp., p. ej., *Leucoptera coffeella*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lixus* spp., *Luperomorpha xanthodera*, *Luperodes* spp., *Lyctus* spp., *Megascelis* spp., *Melanotus* spp., p. ej., *Melanotus longulus oregonensis*, *Meligethes aeneus*, *Melolontha* spp., p. ej., *Melolontha melolontha*, *Migdolus* spp., *Monoctonus* spp., *Naupactus xanthographus*, *Necrobia* spp., *Niptus hololeucus*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Oryzaphagus oryzae*, *Otiorynchus* spp., p. ej., *Otiorynchus cymbicollis*, *Otiorynchus ligustici*, *Otiorynchus ovatus*, *Otiorynchus rugosostriatus*, *Otiorynchus sulcatus*, *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon cochleariae*, *Phillophaga* spp., *Phillophaga helleri*, *Phyllotreta* spp., p. ej., *Phyllotreta armoraciae*, *Phyllotreta pusilla*, *Phyllotreta ramosa*, *Phyllotreta striolata*, *Popillia japonica*, *Premnotypes* spp., *Prostephanus truncatus*, *Psilliodes* spp., p. ej., *Psilliodes affinis*,
35 *Psilliodes chrysocephala*, *Psilliodes punctulata*, *Ptinus* spp., *Rhizobius ventralis*, *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus* spp., p. ej., *Sitophilus granarius*, *Sitophilus linearis*, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Sfenophorus* spp., *Stegobium paniceum*, *Sternechus* spp., p. ej., *Sternechus paludatus*, *Symphyletes* spp., *Tanymecus* spp., p. ej., *Tanymecus dilaticollis*, *Tanymecus indicus*, *Tanymecus palliatus*, *Tenebrio molitor*, *Tenebrioides mauretanicus*, *Tribolium* spp., p. ej., *Tribolium audax*, *Tribolium castaneum*, *Tribolium confusum*, *Trogoderma* spp., *Tychius* spp.,
40 *Xilotrechus* spp., *Zabrus* spp., p. ej., *Zabrus tenebrioides*;

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

60 del orden de los hemípteros p. ej., *Acizzia acaciaebaileyanae*, *Acizzia dodonaeae*, *Acizzia uncatoides*, *Acrida*

turruta, Acyrthosipon spp., p. ej., Acyrthosiphon pisum, Acrogonia spp., Aeneolamia spp., Agonoscena spp., Aleyrodes proletella, Aleurolobus barodensis, Aleurothrixus floccosus, Allocaridara malayensis, Amrasca spp., p. ej., Amrasca bigutulla, Amrasca devastans, Anuraphis cardui, Aonidiella spp., p. ej., Aonidiella aurantii, Aonidiella citrina, Aonidiella inornata, Aphanostigma piri, Aphis spp., p. ej., Aphis citricola, Aphis craccivora, Aphis fabae, 5 Aphis forbesi, Aphis glycines, Aphis gossypii, Aphis hederiae, Aphis illinoisensis, Aphis middletoni, Aphis nasturtii, Aphis nerii, Aphis pomi, Aphis spiraeicola, Aphis viburniphila, Arboridia apicalis, Arytainilla spp., Aspidiella spp., Aspidiotus spp., p. ej., Aspidiotus nerii, Atanus spp., Aulacorthum solani, Bemisia tabaci, Blastopsilla occidentalis, Boreioglycaspis melaleucae, Brachycaudus helichrysi, Brachycolus spp., Brevicoryne brassicae, Cacopsilla spp., p. ej., Cacopsilla piricola, Calligypona marginata, Carneocephala fulgida, Ceratovacuna lanigera, Cercopidae, 10 Ceroplastes spp., Chaetosiphon fragaefolii, Chionaspis tegalensis, cloroita onukii, Chondracris rosea, Chromaphis juglandicola, Chrysomphalus ficus, Cicadulina mbila, Coccomytilus halli, Coccus spp., p. ej., Coccus hesperidum, Coccus longulus, Coccus pseudomagnoliarum, Coccus viridis, Cryptomyzus ribis, Cryptoneossa spp., Ctenarytaina spp., Dalbulus spp., dialeurodes citri, diaphorina citri, diaspis spp., Drosicha spp., Dysaphis spp., p. ej., Dysaphis apiifolia, Dysaphis plantaginea, Dysaphis tulipae, Dymnoscoccus spp., Empoasca spp., p. ej., Empoasca abrupta, 15 Empoasca fabae, Empoasca maligna, Empoasca solana, Empoasca stevensi, Eriosoma spp., p. ej., Eriosoma americanum, Eriosoma lanigerum, Eriosoma piricola, Erythroneura spp., Eucalyptolyma spp., Euphillura spp., Euscelis bilobatus, Ferrisia spp., Geococcus coffeae, Glycaspis spp., heteropsilla cubana, heteropsilla spinulosa, Homalodisca coagulata, Hyalopterus arundinis, Hyalopterus pruni, Icerya spp., p. ej., Icerya purchasi, Idiocerus spp., Idioscopus spp., Laodelphax striatellus, Lecanium spp., p. ej., Lecanium corni (=Parthenolecanium corni), 20 Lepidosaphes spp., p. ej., Lepidosaphes ulmi, Lipaphis erysimi, Lycorma delicatula, Macrosiphum spp., p. ej., Macrosiphum euphorbiae, Macrosiphum lillii, Macrosiphum rosae, Macrosteles facifrons, Mahanarva spp., Melanaphis sacchari, Metcalfiella spp., Metcalfa pruinosa, Metopolophium dirhodum, Monellia costalis, Monelliopsis pecanis, Myzus spp., p. ej., Myzus ascalonicus, Myzus cerasi, Myzus ligustri, Myzus ornatus, Myzus persicae., Myzus nicotianae, Nasonovia ribisnigri, Nephrotettix spp., p. ej., Nephrotettix cincticeps., Nephrotettix nigropictus, 25 Nilaparvata lugens, Oncometopia spp., Orthezia praelonga, Oxya chinensis, Pachypsilla spp., Parabemisia myricae, Paratrioza spp., p. ej., Paratrioza cockerelli, Parlatoria spp., Pemphigus spp., p. ej., Pemphigus bursarius, Pemphigus populivenerae, Peregrinus maidis, fenacoccus spp., p. ej., fenacoccus madeirensis, Phloeomyzus passerinii, Phorodon humuli, Philloxera spp., p. ej., Philloxera devastatrix, Philloxera notabilis, Pinnaspis aspidistrae, Planococcus spp., p. ej., Planococcus citri, Prosopidopsilla flava, Protospulvinaria piriformis, 30 Pseudaulacaspis pentagona, Pseudococcus spp., p. ej., Pseudococcus calceolariae, Pseudococcus comstocki, Pseudococcus longispinus, Pseudococcus maritimus, Pseudococcus viburni, Psilopsis spp., Psilla spp., p. ej., Psilla buxi, Psilla mali, Psilla piri, Pteromalus spp., pirilla spp., Quadraspidiotus spp., p. ej., Quadraspidiotus juglansregiae, Quadraspidiotus ostreaeformis, Quadraspidiotus perniciosus, Quesada gigas, Rastrococcus spp., Rhopalosiphum spp., p. ej., Rhopalosiphum maidis, Rhopalosiphum oxiaacanthae, Rhopalosiphum padi, 35 Rhopalosiphum rufiabdominale, Saissetia spp., p. ej., Saissetia coffeae, Saissetia miranda, Saissetia neglecta, Saissetia oleae, Scaphoideus titanus, Schizaphis graminum, Selenaspis articulatus, Stibion avenae, Sogata spp., Sogatella furcifera, Sogatodes spp., Stictiocephala festina, Siphoninus phillyreae, Tenalaphara malayensis, tetragonocephala spp., Tinocallis caryaefoliae, Tomaspis spp., Toxoptera spp., p. ej., Toxoptera aurantii, Toxoptera citricidus, Trialeurodes vaporariorum, Trioza spp., p. ej., Trioza diospiri, Typhlocyba spp., 40 Unaspis spp., Viteus vitifolii, Zygina spp.;

del suborden de los heterópteros p. ej., Anasa tristis, Antestiopsis spp., Boisea spp., Blissus spp., Calocoris spp., Campilomma livida, Cavelerius spp., Cimex spp., p. ej., Cimex adjunctus, Cimex hemipterus, Cimex lectularius, Cimex pilosellus, Collaria spp., Creontiades dilutus, Dasynus piperis, dichelops furcatus, diconocoris hewetti, 45 Dysdercus spp., Euschistus spp., p. ej., Euschistus heros, Euschistus servus, Euschistus tristigmus, Euschistus variolarius, Eurygaster spp., Halyomorpha halys, Heliopeltis spp., Horcias nobilellus, Leptocoris spp., Leptocoris varicornis, Leptoglossus occidentalis, Leptoglossus phillopus, Lygocoris spp., p. ej., Lygocoris pabulinus, Lygus spp., p. ej., Lygus elisus, Lygus hesperus, Lygus lineolaris, Macropes excavatus, Monalonion atratum, Nezara spp., p. ej., Nezara viridula, Oebalus spp., Piesma quadrata, Piezodorus spp., p. ej., Piezodorus guildinii, Psallus spp., Pseudacysta persea, Rhodnius spp., Sahlbergella singularis, Scaptocoris castanea, Scotinophora spp., Stephanitis 50 nashi, Tibraca spp., Triatoma spp.;

del orden de los himenópteros p. ej., Acromyrmex spp., Athalia spp., p. ej., Athalia rosae, Atta spp., diprion spp., p. ej., Diprion similis, Hoplocampa spp., p. ej., Hoplocampa cookei, Hoplocampa testudinea, Lasius spp., Linepithema humile, Monomorium pharaonis, Sirex spp., Solenopsis invicta, Tapinoma spp., Urocerus spp., Vespa spp., p. ej., Vespa crabro, Xeris spp.;

55 del orden de los isópodos p. ej., Armadillidium vulgare, Oniscus asellus, Porcellio scaber;

del orden de los isópteros p. ej., Coptotermes spp., p. ej., Coptotermes formosanus, Cornitermes cumulans, Cryptotermes spp., Incisitermes spp., Microtermes obesi, Odontotermes spp., Reticulitermes spp., p. ej., Reticulitermes flavipes, Reticulitermes hesperus;

60 del orden de los lepidópteros p. ej., Achroia grisella, Acronicta major, Adoxophyes spp., p. ej., Adoxophyes orana, Aedia leucomelas, Agrotis spp., p. ej., Agrotis segetum, Agrotis ipsilon, Alabama spp., p. ej., Alabama argillacea, Amyelois transitella, Anarsia spp., Anticarsia spp., p. ej., Anticarsia gemmatalis, Argyroplotea 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., p. ej., *Chilo plejadellus*, *Chilo suppressalis*, *Choristoneura* spp., *Clysia ambiguella*, *Cnaphalocerus* spp., *Cnaphalocrocis medinalis*, *Cnephasia* spp., *Conopomorpha* spp., *Conotrachelus* spp., *Copitarsia* spp., *Cydia* spp., p. ej., *Cydia nigricana*, *Cydia pomonella*, *Dalaca noctuides*, *diaphania* spp., *diatraea saccharalis*, *Earias* spp., *Ecdytolopha aurantium*, *Elasmopalpus lignosellus*, *Eldana saccharina*, *Ephestia* spp., p. ej., *Ephestia elutella*, *Ephestia kuehniella*, *Epinotia* spp., *Epiphyas postvittana*, *Etiella* spp., *Eulia* spp., *Eupoecilia ambiguella*, *Euproctis* spp., p. ej., *Euproctis chrysorrhoea*, *Euxoa* spp., *Feltia* spp., *Galleria mellonella*, *Gracillaria* spp., *Grapholita* spp., p. ej., *Grapholita molesta*, *Grapholita prunivora*, *Hedilepta* spp., *Helicoverpa* spp., p. ej., *Helicoverpa armigera*, *Helicoverpa zea*, *Heliothis* spp., p. ej., *Heliothis virescens* *Hofmannophila pseudospretella*, *Homoeosoma* spp., *Homona* spp., *Hyponomeuta padella*, *Kakivoria flavofasciata*, *Laphygma* spp., *Leucinodes orbonalis*, *Leucoptera* spp., p. ej., *Leucoptera coffeella*, *Lithocolletis* spp., p. ej., *Lithocolletis blancardella*, *Lithophane antennata*, *Lobesia* spp., p. ej., *Lobesia botrana*, *Loxagrotis albicosta*, *Lymantria* spp., z.b. *Lymantria dispar*, *Lyonetia* spp., p. ej., *Lyonetia clerkella*, *Malacosoma neustria*, *Maruca testulalis*, *Mamestra brassicae*, *Melanitis leda*, *Mocis* spp., *Monopis obviella*, *Mythimna separata*, *Nemapogon cloacellus*, *Nymphula* spp., *Oiketicus* spp., *Oria* spp., *Orthaga* spp., *Ostrinia* spp., p. ej., *Ostrinia nubilalis*, *Oulema melanopus*, *Oulema oryzae*, *Panolis flammea*, *Parnara* spp., *Pectinophora* spp., p. ej., *Pectinophora gossypiella*, *Perileucoptera* spp., *Phthorimaea* spp., p. ej., *Phthorimaea operculella*, *Philocnistis citrella*, *Philonorycter* spp., p. ej., *Philonorycter blancardella*, *Philonorycter crataegella*, *Pieris* spp., p. ej., *Pieris rapae*, *Platynota stultana*, *Plodia interpunctella*, *Plusia* spp., *Plutella xilostella* (= *Plutella maculipennis*), *Prays* spp., *Prodenia* spp., *Protoparce* spp., *Pseudaletia* spp., p. ej., *Pseudaletia unipuncta*, *Pseudoplusia includens*, *pirauista nubilalis*, *Rachiplusia nu*, *Schoenobius* spp., p. ej., *Schoenobius bipunctifer*, *Scirpophaga* spp., p. ej., *Scirpophaga innotata*, *Scotia segetum*, *Sesamia* spp., p. ej., *Sesamia inferens*, *Sparganothis* spp., *Spodoptera* spp., z.b. *Spodoptera eradiana*, *Spodoptera exigua*, *Spodoptera frugiperda*, *Spodoptera praefica*, *Stathmopoda* spp., *Stomopteryx subsecivella*, *Synanthedon* spp., *Tecia solanivora*, *Thermesia gemmatalis*, *Tinea cloacella*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*, *Tortrix* spp., *Trichophaga tapetzella*, *Trichoplusia* spp., p. ej., *Trichoplusia ni*, *Tryporyza incertulas*, *Tuta absoluta*, *Virachola* spp.;

del orden de los ortópteros o saltatorios p. ej., *Acheta domesticus*, *dichroplus* spp., *Grillotalpa* spp., p. ej., *Grillotalpa grillotalpa*, *Hieroglyphus* spp., *Locusta* spp., p. ej., *Locusta migratoria*, *Melanoplus* spp., p. ej., *Melanoplus devastator*, *Paratlanticus ussuriensis*, *Schistocerca gregaria*;

del orden de los fitópteros p. ej., *Damalinea* spp., *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phylloxera vastatrix*, *Phthirus pubis*, *Trichodectes* spp.;

del orden de los psocópteros p. ej., *Lepinotus* spp., *Liposcelis* spp.;

del orden de los sifonápteros p. ej., *Ceratophyllus* spp., *Ctenocephalides* spp., p. ej., *Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, *Xenopsilla cheopis*;

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

del orden de los cigentomas (= tisanuros), p. ej., *Ctenolepisma* spp., *Lepisma saccharina*, *Lepismodes inquilinus*, *Thermobia domestica*;

de la clase de los símfilos p. ej., *Scutigera* spp., p. ej., *Scutigera immaculata*;

Parásitos de la cepa de los moluscos, en particular de la clase de los bivalvos, p. ej., *Dreissena* spp.;

así de la clase de los gastrópodos p. ej., *Arion* spp., p. ej., *Arion ater rufus*, *Biomphalaria* spp., *Bulinus* spp., *Deroceras* spp., p. ej., *Deroceras laeve*, *Galba* spp., *Lymnaea* spp., *Oncomelania* spp., *Pomacea* spp., *Succinea* spp.;

Parásitos de animales y de humanos de las cepas de los platelmintos y nematodos, p. ej., *Aelurostrongilus* spp., *Amidostomum* spp., *Ancilostoma* spp., *Angiostrongilus* spp., *Anisakis* spp., *Anoplocephala* spp., *Ascaris* spp., *Ascaridia* spp., *Bailliascaris* spp., *Brugia* spp., *Bunostomum* spp., *Capillaria* spp., *Chabertia* spp., *Clonorchis* spp., *Cooperia* spp., *Crenosoma* spp., *Cyathostoma* spp., *dicrocoelium* spp., *dictyocaulus* spp., *diphilobothrium* spp., *dipilidium* spp., *dirofilaria* spp., *Dracunculus* spp., *Echinococcus* spp., *Echinostoma* spp., *Enterobius* spp., *Eucoleus* spp., *Fasciola* spp., *Fascioloides* spp., *Fasciolopsis* spp., *Filaroides* spp., *Gongylonema* spp., *Gyrodactylus* spp., *Habronema* spp., *Haemonchus* spp., *Heligmosomoides* spp., *Heterakis* spp., *Hymenolepis* spp., *Hyostrongilus* spp., *Litomosoides* spp., *Loa* spp., *Metastrongilus* spp., *Metorchis* spp., *Mesocestoides* spp., *Moniezia* spp., *Muellerius* spp., *Necator* spp., *Nematodirus* spp., *Nippostrongilus* spp., *Oesophagostomum* spp., *Ollulanus* spp., *Onchocerca* spp., *Opisthorchis* spp., *Oslerus* spp., *Ostertagia* spp., *Oxyuris* spp., *Paracapillaria* spp., *Parafilaria* spp., *Paragonimus* spp., *Paramphistomum* spp., *Paranoplocephala* spp., *Parascaris* spp., *Passalurus* spp., *Protostrongilus* spp., *Schistosoma* spp., *Setaria* spp., *Spirocerca* spp., *Stephanofilaria* spp., *Stephanurus* spp., *Strongiloides* spp., *Strongilus* spp., *Syngamus* spp., *Taenia* spp., *Teladorsagia* spp., *Thelazia* spp., *Toxascaris* spp., *Toxocara* spp., *Trichinella* spp., *Trichobilharzia* spp., *Trichostrongilus* spp., *Trichuris* spp., *Uncinaria* spp.,

Wuchereria spp.;

Parásitos de las plantas de la cepa de los nematodos, es decir, nematodos parasíticos de plantas, en particular Aglenchus spp., p. ej., Aglenchus agricola, Anguina spp., p. ej., Anguina tritici, Aphelenchoides spp., p. ej., Aphelenchoides arachidis, Aphelenchoides fragariae, Belonolaimus spp., p. ej., Belonolaimus gracilis, 5 Belonolaimus longicaudatus, Belonolaimus nortoni, Bursaphelenchus spp., p. ej., Bursaphelenchus cocophilus, Bursaphelenchus eremus, Bursaphelenchus xilophilus, Cacopaurus spp., p. ej., Cacopaurus pestis, Criconemella spp., p. ej., Criconemella curvata, Criconemella onoensis, Criconemella ornata, Criconemella rusium, Criconemella xenoplax (= Mesocriconema xenoplax), Criconemoides spp., p. ej., Criconemoides ferniae, Criconemoides onoense, Criconemoides ornatum, ditilenchus spp., p. ej., Ditilenchus dipsaci, Dolichodorus spp., Globodera spp., 10 p. ej., Globodera pallida, Globodera rostochiensis, Helicotilenchus spp., p. ej., Helicotilenchus dihystrera, Hemicriconemoides spp., Hemicicliophora spp., heterodera spp., p. ej., heterodera avenae, heterodera glycines, heterodera schachtii, Hoplolaimus spp., Longidorus spp., p. ej., Longidorus africanus, Meloidogyne spp., p. ej., Meloidogyne chitwoodi, Meloidogyne fallax, Meloidogyne hapla, Meloidogyne incognita, Meloinema spp., Nacobbus spp., Neotilenchus spp., Paraphelenchus spp., Paratrichodorus spp., p. ej., Paratrichodorus minor, Pratilenchus spp., p. ej., Pratilenchus penetrans, Pseudohalenchus spp., Psilenchus spp., Punctodera spp., Quinisolchus spp., 15 Radopholus spp., p. ej., Radopholus citrophilus, Radopholus similis, Rotilenchulus spp., Rotilenchus spp., Scutellonema spp., Subanguina spp., Trichodorus spp., p. ej., Trichodorus obtusus, Trichodorus primitivus, Tilenchorhynchus spp., p. ej., Tilenchorhynchus annulatus, Tilenchulus spp., p. ej., Tilenchulus semipenetrans, Xiphinema spp., p. ej., Xiphinema index.

20 Además del subárea de los protozoos puede combatirse el orden de los coccidios, p. ej., Eimeria spp.

Los compuestos de la fórmula (I) dado el caso pueden usarse en concentraciones o dosis determinadas también como herbicidas, protectores, reguladores de crecimiento o agentes químicos para mejorar las características de plantas, o como microbicida o gametocida, por ejemplo como funguicidas, antimicóticos, bactericidas, viricidas (incluyendo 25 agentes contra viroides) o como agentes contra MLO (*Mycoplasma-like-organism*) y RLO (*Rickettsia-like-organism*). Se los puede emplear también como productos intermedios o básicos para la síntesis de otros principios activos.

Formulaciones

La presente invención además se refiere a formulaciones y formas de uso preparadas a partir de las mismas en forma de composiciones para la protección de cultivos y/o plaguicidas, por ejemplo, licores para goteo, rociado y pulverización, que comprenden al menos un compuesto de la fórmula (I). dado el caso las formas de uso comprenden 30 más agentes para la protección de cultivos y/o plaguicidas y/o adyuvantes que mejoran la acción, tales como penetrantes, por ej., aceites vegetales, por ejemplo aceite de colza, aceite de girasol, aceites minerales, por ejemplo aceites de parafina, ésteres de alquilo de ácidos grasos vegetales, por ejemplo metilo éster de aceite de colza, o metilo éster de aceite de soja, o alcoxilatos de alcanol y/o dispersantes, 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 35 y/o promotores de retención, por ejemplo sulfosuccinato de dioctilo o polímeros de hidroxipropilo guar y/o humectantes, por ejemplo glicerol y/o fertilizantes, por ejemplo fertilizantes que contienen amonio, potasio, o fósforo.

Las formulaciones habituales son, por ejemplo, líquidos hidrosolubles (LH), concentrados de emulsión (CE), emulsiones en agua (EA), concentrados de suspensión (SC, SE, FS, ROD), gránulos dispersables en agua (GA), gránulos (GR) y concentrados en cápsulas (CC); estos y otros posibles tipos de formulación se describen, por ejemplo, 40 en Crop Life International y en las Especificaciones de Plaguicidas, Manual sobre el desarrollo y uso de las especificaciones FAO y WHO para plaguicidas, los Documentos sobre Protección y Producción de Plantas FAO – 173, preparados por la Junta FAO/WHO sobre Especificaciones de Plaguicidas, 2004, ISBN: 9251048576. Las formulaciones opcionalmente comprenden, como también uno o más compuestos de la fórmula (I), más ingredientes agroquímicos activos.

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

50 Estas formulaciones se producen de una manera conocida, por ejemplo, mezclando los compuestos de la fórmula (I) con adyuvantes, por ejemplo diluyentes, disolventes y/o vehículos sólidos y/u otros adyuvantes, por ejemplo tensioactivos. Las formulaciones se producen o bien en las plantas adecuadas para la producción o bien antes o durante la aplicación.

55 Como adyuvantes pueden usarse sustancias adecuadas para impartir propiedades especiales, tales como ciertas propiedades físicas, técnicas y/o biológicas, a los compuestos de la fórmula (I) o a las formas de uso preparadas a partir de estas formulaciones (por ejemplo composiciones para la protección de cultivos listos para usar tales como licores para pulverización o productos para el tratamiento de semillas).

Los diluyentes adecuados son, por ejemplo, agua, líquidos químicos orgánicos polares y no polares, por ejemplo de

5 las clases de los hidrocarburos aromáticos y no aromáticos (tales como parafinas, alquilbencenos, alquilnaftalenos, clorobencenos), los alcoholes y polioles (los cuales, de ser apropiado), además pueden ser sustituidos, eterificados y/o esterificados), las cetonas (tales como acetona, ciclohexanona), ésteres (incluyendo grasas y aceites) y (poli)éteres, las aminas sustituidas y no sustituidas, amidas, lactamos (tales como N-alquilpirrolidonas) y lactosas, las sulfonas y los sulfóxidos (tal como dimetilsulfóxido).

10 Si el diluyente usado es el agua, además es posible por ejemplo, usar disolventes orgánicos como disolventes adyuvantes. Los disolventes líquidos adecuados son esencialmente: aromáticos, tales como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, 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, metilo etilo cetona, metilo isobutilo cetona o ciclohexanona, solventes fuertemente polares, tales como dimetilformamida y dimetilsulfóxido, así como agua.

15 En principio, es posible usar todos los disolventes adecuados. Ejemplos de disolventes adecuados son hidrocarburos aromáticos, tales como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, hidrocarburos aromáticos clorados o hidrocarburos alifáticos, tales como clorobencenos, 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, metilo etilo cetona, metilo isobutilo cetona o ciclohexanona, disolventes fuertemente polares, tales como dimetilsulfóxido, y además agua.

20 En principio, es posible usar todos los vehículos adecuados. Los vehículos útiles incluyen especialmente: por ejemplo sales de amonio y minerales de la tierra naturales, tales como caolinas, arcillas, talco, creta, cuarzo, atapulgita, montmorillonita o tierra de diatomea, y minerales sintéticos de la tierra, tales como sílice finamente dividido, alúmina y silicatos naturales o sintéticos, resinas, ceras y/o fertilizantes sólidos. Las mezclas de estos vehículos se pueden usar de igual modo. Los vehículos útiles para gránulos incluyen: por ejemplo rocas molidas y naturales fraccionadas, tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita, y además gránulos sintéticos de metales inorgánicos y orgánicos y además gránulos de material orgánico, tales como el aserrín, papel, las cáscaras de coco, mazorcas de maíz y los tallos de tabaco.

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

30 Ejemplos de emulsionantes y/o espumantes, dispersantes o 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 naftalenosulfónico, policondensados de óxido de etileno con alcoholes grasos o con ácidos grasos o con aminas grasas, con fenoles sustituidos (preferentemente alquilfenoles o arilfenoles), sales de ésteres sulfosuccínico, derivados taurinos (preferentemente alquilo tauratos), ésteres fosfóricos de alcoholes polietoxilados o fenoles, ésteres de ácido graso de polioles, y derivados de los compuestos que contienen sulfatos, sulfonatos y fosfatos, por ejemplo alquilarilo poliglicol éteres, alquilo sulfonatos, alquilsulfatos, arilsulfonatos, hidrolizados de proteínas, licores residuales de lignosulfito y metilcelulosa. La presencia de un tensioactivo es ventajosa cuando uno de los compuestos de la fórmula (I) y/o uno de los vehículos inertes es insoluble en agua y cuando la aplicación se realiza en el agua.

35 Otros adyuvantes que pueden estar presentes en las formulaciones y las formas de uso que derivan de los mismos incluyen tintes tales como los pigmentos inorgánicos, por ejemplo, óxido de hierro, óxido de titanio, y azul de Prusia, y colorantes orgánicos, tales como colorantes de alizarina, colorantes estoicos, y colorantes de ftalocianina metálica, y nutrientes y oligonutrientes, tales como las sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y zinc.

40 Los componentes adicionales pueden ser estabilizantes, tales como estabilizantes fríos, conservantes, antioxidantes, estabilizantes livianos, u otros agentes que mejoran la estabilidad química y/o física. Los espumantes o antiespumantes también pueden estar presentes.

45 Además las formulaciones y las formas de aplicación derivadas de estos pueden contener agentes de pegajosidad adicionales, tales como carboximetilcelulosa y los polímeros naturales y sintéticos en forma de polvos, gránulos o redes cristalinas, tales como la goma arábiga, el alcohol polivinílico y el acetato de polivinilo, u otros fosfolípidos naturales, tales como las cefalinas, y lecitinas y los fosfolípidos sintéticos. Otros adyuvantes pueden ser aceites minerales y vegetales.

50 Dado el caso, las formulaciones y las formas de uso que derivan de las mismas también pueden comprender otros adyuvantes. Ejemplos de estos aditivos incluyen fragancias, coloides protectores, aglutinantes, adhesivos, espesantes, agentes tixotrópicos, penetrantes, promotores de retención, estabilizantes, secuestrantes, agentes formadores de complejos, humectantes, dispersantes. En general, los ingredientes activos se pueden combinar con cualquier aditivo sólido o líquido habitualmente usado para fines de formulación.

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

Los agentes de penetración útiles en el presente contexto son todas aquellas sustancias que se usan normalmente para mejorar la penetración de los ingredientes agroquímicos activos en plantas. Los penetrantes se definen en este contexto por su capacidad para penetrar desde el licor de aplicación (generalmente acuoso) y/o desde el recubrimiento de pulverización dentro de la cutícula de la planta y de este modo incrementar la movilidad de los ingredientes activos en la cutícula. El procedimiento que se describe en la literatura (Baur et al., 1997, Pesticide Science 51, 131-152) se puede usar para determinar esta propiedad. Ejemplos incluyen alcoxilatos de alcohol tal como etoxilato graso de coco (10) o etoxilato de isotridecilo (12), ésteres de ácido graso, por ejemplo metilo éster de aceite de colza o metilo éster de aceite de soja, alcoxilatos de amina grasa, por ejemplo etoxilato de amina de sebo (15) o sales de amonio y/o fosfonio, por ejemplo sulfato de amonio o hidrógeno fosfato de diamonio.

Las formulaciones contienen preferentemente entre 0,00000001 y 98 % en peso de principio activo o especialmente preferente entre 0,01 y 95 % en peso de principio activo, especialmente preferente entre 0,5 y 90 % en peso del compuesto de la fórmula (I), respecto del peso de la formulación.

El contenido del compuesto de la fórmula (I) en las formas de uso (composiciones de protección del cultivo) preparadas a partir de las formulaciones puede variar dentro de límites amplios. La concentración del ingrediente activo de las formas de uso puede estar normalmente entre 0,00000001 % y 95 % en peso del ingrediente activo, preferentemente entre 0,00001 % y 1 % en peso, basado en el peso de la forma de uso. Los compuestos se aplican de manera habitual apropiada para las formas de uso.

Mezclas

Los compuestos de la fórmula (I) también pueden usarse mezcladas con otros principios activos como fungicidas, bactericidas, acaricidas, nematocidas, insecticidas, microbicidas, fertilizantes, cebos, agentes esterilizadores, sinergistas, protectores, semiquímicos y/o reguladores de crecimiento, para así por ejemplo ampliar el espectro de acción, prolongar la duración del efecto, aumentar la velocidad de acción, evitar la repelencia o prevenir la evolución de resistencias. Por lo demás tales combinaciones pueden mejorar el crecimiento de las plantas, aumentar la tolerancia de temperaturas elevadas o bajas, a la sequía o al contenido de agua o sal en el suelo, incrementar la floración, facilitar la cosecha y aumentar los rendimientos de cosecha, acelerar la maduración, aumentar la calidad y/o el valor nutritivo de los productos cosechados, prolongar la capacidad de almacenamiento y/o mejorar la procesabilidad de los productos de cosecha.

Los compuestos de la fórmula (I) además pueden estar disponibles en mezcla con otros principios activos o semiquímicos, como cebos y/o repelentes de aves y/o activadores de plantas y/o reguladores de crecimiento y/o fertilizantes. Del mismo modo, los compuestos de la fórmula (I) pueden usarse en mezclas con agentes para mejorar las propiedades de las plantas, como por ejemplo, el crecimiento, el rendimiento y la calidad de los productos de cosecha.

En una realización especial de acuerdo con la invención, los compuestos de la fórmula (I) están disponibles en formulaciones o bien en las formas de uso preparadas a partir de estas formulaciones en mezcla con otros compuestos, preferentemente aquellos como se han descrito a continuación.

Si uno de los compuestos indicados a continuación puede presentarse en diferentes formas tautoméricas, también se incluyen estas formas aunque no se las mencione explícitamente en cada caso.

Insecticidas / Acaricidas / Nematicidas

(1) Inhibidores de acetilcolinesterasa (AChE), por ejemplo, carbamatos, por ejemplo, Alanycarb, Aldicarb, Bendiocarb, Benfuracarb, butocarboxim, butoxicarboxim, Carbarilo, Carbofuran, Carbosulfan, Etiofencarb, Fenobucarb, Formetanato, Furatiocarb, Isoprocarb, Metiocarb, Metomilo, Metolcarb, Oxamilo, Pirimicarb, Propoxur, Tyodoicarb, Tiofanox, Triazamato, Trimetacarb, XMC, y Xililcarb; u organofosfatos, por ejemplo, Acefatos, Azametifos, Azinfos-etílico, Azinfos-metílico, Cadusafos, Cloretixifos, Clorfenvinfos, Clormefos, Clorpirifos, Clorpirifos-metílico, Coumafos, Cianofos, Demeton-S-metílico, Diazinona, Diclorvos/DDVP, Dicrotofos, Dimetoato, Dimetilvinfos, Disulfotona, EPN, Etona, Etoprofos, Fampur, Fenamifos, Fenitrotona, Fentiona, Fostiazato, Heptenofos, Imiciafos, Isofenfos, O-(metoxiaminotio-fosfoil) salicilato de isopropilo, Isoxationa, Malationa, Mecarbam, Metamidofos, Metidationa, Mevinfos, Monocrotofos, Naled, Ometoato, Oxidemeton-metílico, Parationa, Paration-metílico, Fentoato, Forato, Fosadona, Fosmet, Fosfamidona, Foxim, Pirimifos-metílico, Profenofos, Propetamfos, Protiofos, Piraclofos, Piridafentiona, Quinalfos, Sulfotep, Tebupirimfos, Temefos, Terbufos, Tetraclorvinfos, Tiometona, Triazofos, Triclorfon y Vamidotion.

(2) Antagonistas de los canales de cloruro activados por GABA, por ejemplo, organoclorados de ciclodieno, por ejemplo, Clordano y Endosulfan; o fenilpirazoles (fiproles), por ejemplo Etiprol y Fipronilo.

(3) Moduladores del canal de sodio / bloqueadores del canal de sodio dependiente del voltaje, por ejemplo, piretroides, por ejemplo, Acrinatrina, Aletrina, Aletrina d-cis-trans, Aletrina d-trans, Bifentrina, Bioaletrina, isómero S-ciclopentenilo de bioaletrina, Bioresmetrina, cicloprotrina, Ciflutrina, beta-Ciflutrina, Cihalotrina, lambda-Cihalotrina, gamma-Cihalotrina, Cipermetrina, alfa-Cipermetrina, beta-Cipermetrina, teta-Cipermetrina, zeta-Cipermetrina, Cffenotrina [isómeros (1R)-trans], Deltametrina, Empentrina [isómeros (EZ)-(1R)], Esfenvalerato,

- Etofenprox, Fenpropatrina, Fenvalerato, Flucitrinato, Flumetrina, tau-Fluvalinato, Halfenprox, Imiprotrina, Kadealina, Permetrina, Fenotrina [isómero (1R)-trans], Praletrina, Piretrina (piretrum), Resmetrina, Silafluofeno, Teflutrina, Tetrametrina, Tetrametrina [isómeros (1R)], Tralometrina y Transflutrina o DDT; o metoxiclor.
- 5 (4) Agonistas del receptor nicotínico de acetilcolina (nAChR), por ejemplo, neonicotinoides, por ejemplo, Acetamiprid, Clotianidin, Dinotefuran, Imidacloprid, Nitenpiram, Tiacloprid y Tiametoxam; o Nicotina o Sulfoxaflor.
- (5) Activadores alostéricos del receptor nicotínico de acetilcolina (nAChR), por ejemplo, espinosinas, por ejemplo Spinetoram y Spinosad.
- (6) Activadores de los canales de cloruro, por ejemplo avermectinas / milbemicinas, por ejemplo abamectina, benzoato de emamectina, lepimectina y milbemectina.
- 10 (7) Miméticos de hormonas juveniles, por ejemplo, análogos de hormonas juveniles, por ejemplo, Hidropreno, Quinopreno y Metopreno; o Fenoxicab o Piriproxifen.
- (8) Diversos inhibidores no específicos (multisitio), por ejemplo, haluros de alquilo, por ejemplo, bromuro de metilo y otros haluros de alquilo; o Cloropicrina; o fluoruro de azufre; o Borax; o tártaro emético.
- (9) Bloqueantes selectivos de la alimentación de homópteros, por ejemplo Pimetrozina o Flonicamida.
- 15 (10) Inhibidores de crecimiento de ácaros, por ejemplo Clofentezina, Diflovidazina, Hexitiazox o Etoxazol.
- (11) Alteradores microbianos de las membranas del intestino medio de insectos, por ejemplo *Bacillus thuringiensis* subespecie *israelensis*, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus thuringiensis* subespecie *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subespecie *kurstaki*, *Bacillus thuringiensis* subespecie *tenebrionis*, y proteínas del cultivo BT: Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry2Ab, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb, Cry34/35Ab1.
- 20 (12) Inhibidores de ATP sintasa mitocondrial, por ejemplo Diafentiurón; o acaricidas de organoestaño, por ejemplo Azociclotina, Cihexatina y óxido de fenbutatina; o propargita; Tetradiión.
- (13) Desacopladores de fosforilación oxidativa por medio de interrupción del gradiente de protones, por ejemplo clorfenapir, DNOC y Sufluramida.
- 25 (14) Bloqueantes de canales de receptores nicotínicos de acetilcolina, por ejemplo Bensultap, Clorhidrato de cartap, Tiocyclam y Tiosultap-sodio.
- (15) Inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 0, por ejemplo Bistriflurona, Clorfluazurona, Diflubenzurona, Flucicloxurona, Flufenoxurona, Hexaflumurona, Lufenurona, Novalurona, Noviflumurona, Teflubenzuron y Triflumuron.
- (16) Inhibidores de biosíntesis de quitina, de tipo 1, por ejemplo Buprofezina.
- 30 (17) Disruptores de muda, por ejemplo Ciromazina.
- (18) Agonistas del receptor de ecdisona, por ejemplo Clomaenzida, Halofenozida, metoxifenozida y Tebufenozida.
- (19) Agonistas de receptor de octopamina, por ejemplo Amitraz.
- (20) Inhibidores de transporte de electrones del complejo III mitocondrial, por ejemplo Hidrametilnón; Acequinocilo o Fluacropirim.
- 35 (21) Inhibidores de transporte de electrones del complejo I mitocondrial, por ejemplo acaricidas METI, por ejemplo Fenazaquina, Fenpiroximato, Pirimidifeno, Piridabeno, Tebufenpirad, Tolfenpirad o Rotenona (Derris).
- (22) Bloqueantes de canales de sodio dependientes de voltaje, por ejemplo Indoxacarb; Metaflumizona.
- (23) Inhibidores de acetilo CoA carboxilasa, por ejemplo derivados del ácido tetrónico y tetrámico, por ejemplo Eespirodiclofeno, Eespiromesifeno y Eespirotetramato.
- 40 (24) Inhibidores del transporte de electrones del complejo IV, por ejemplo fosfinas, por ejemplo Fosfuro de aluminio, Fosfuro de calcio, Fosfina y Fosfuro de cinc; o Cianuro.
- (25) Inhibidores de transporte de electrones del complejo II mitocondrial, por ejemplo Cienopirafeno y ciflumetofeno.
- (28) Moduladores del receptor de rianodina, por ejemplo, diaminas, por ejemplo, Clorantraniliprol y Flubendimida.
- 45 Otros principios activos como a modo de ejemplo Afidopiropen, Azadirachtina, Benclotiaz, Benzoximato, Bifenazato, Bromopropilato, Chinometionato, Cryolita,

Dicofol, Diflovidazina, Fluensulfona, Flometoquina, Flufenerim, Flufenoxiestrobina, Flufiprole, Fluopiram, Flupiradifurona, Fufenozida, Heptaflutrina, Imidaclothiz, Iprodiona, Meperflutrina, Paichongding, Pyflubumide, Pyrifluquinazona, Piriminoestrobina, Tetrametilflutrina y Yodometano; además preparados sobre la base de *Bacillus firmus* (I-1582, BioNeem, Votivo), así como los siguientes compuestos efectivos conocidos: 3-bromo-N-{2-bromo-4-cloro-6-[(1-ciclopropil)etil]carbamoil}fenil]-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocida del documento WO2005/077934), 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), 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. N° 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-metilhidrazin-carboxilato 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-etilhidrazin-carboxilato de metilo (conocido del documento WO2005/085216), 2-[2-[[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil]amino]-5-cian-3-metilbenzoil]-2-metilhidrazin-carboxilato de metilo (conocido del documento WO2005/085216), 2-[3,5-dibromo-2-[[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil]amino]-benzoil]-2-etilhidrazin-carboxilato de metilo (conocido del documento WO2005/085216), 1-(3-cloropiridin-2-il)-N-[4-cian-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), N-[(2E)-1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]piridin-2(1H)-iliden]-2,2,2-trifluoroacetamida (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-io-2-olato (conocido del documento WO2009/099929), 1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]-4-oxo-3-fenil-4H-pirido[1,2-a]pirimidin-1-io-2-olato (conocido 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]zazepina (conocida del documento WO2010/069266), (2E)-1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]-N'-nitro-2-pentilidenediazin-carboximidamida (conocida del documento WO2010/060231), 4-(3-{2,6-dicloro-4-[(3,3-dicloroprop-2-en-1-il)oxil]fenoxi}-propoxi)-2-metoxi-6-(trifluorometil)pirimidina (conocida del documento CN101337940), N-[2-(terc-butilcarbamoil)-4-cloro-6-metilfenil]-1-(3-cloropiridin-2-il)-3-(fluorometoxi)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocida del documento WO2008/134969).

Fungicidas

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

1) Inhibidores de la biosíntesis de ergosterol, como a modo de ejemplo (1.1) Aldimorph, (1.2) Azaconazol, (1.3) Bitertanol, (1.4) Bromuconazol, (1.5) Cyproconazol, (1.6) Diclobutrazol, (1.7) Difenconazol, (1.8) Diniconazol, (1.9) Diniconazol-M, (1.10) Dodemorph, (1.11) Dodemorph Acetato, (1.12) Epoxiconazol, (1.13) Etaconazol, (1.14) Fenarimol, (1.15) Fenbuconazol, (1.16) Fenhexamida, (1.17) Fenpropidina, (1.18) Fenpropimorph, (1.19) Fluquinconazol, (1.20) Flurprimidol, (1.21) Flusilazol, (1.22) Flutriafol, (1.23) Furconazol, (1.24) Furconazol-Cis, (1.25) Hexaconazol, (1.26) Imazalilo, (1.27) Imazalilo sulfato, (1.28) Imibenconazol, (1.29) Ipconazol, (1.30) Metconazol, (1.31) Myclobutanilo, (1.32) Naftifina, (1.33) Nuarimol, (1.34) Oxpoconazol, (1.35) Paclobutrazol, (1.36) Pefurazoato, (1.37) Penconazol, (1.38) Piperalina, (1.39) Procloroaz, (1.40) Propiconazol, (1.41) Protiocanazol, (1.42) Pyributicarb, (1.43) Pyrifenox, (1.44) Quinconazol, (1.45) Simeconazol, (1.46) Spiroxamina, (1.47) Tebuconazol, (1.48) Terbinafina, (1.49) Tetraconazol, (1.50) Triadimefona, (1.51) Triadimenol, (1.52) Tridemorph, (1.53) Triflumizol, (1.54) Triforina, (1.55) Triticonazol, (1.56) Uniconazol, (1.57) Uniconazol-p, (1.58) Viniconazol, (1.59) Voriconazol, (1.60) 1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)cicloheptanol, (1.61) metil-1-(2,2-dimetil-2,3-dihidro-1H-inden-1-il)-1H-imidazol-5-carboxilato, (1.62) N'-[5-(difluorometil)-2-metil-4-[3-(trimetilsilil)propoxil]fenil]-N-etil-N-metilimidofornamida, (1.63) N-etil-N-metil-N'-[2-metil-5-(trifluorometil)-4-[3-(trimetilsilil)propoxil]fenil]imido-formamida y (1.64) O-[1-(4-metoxifenoxi)-3,3-dimetilbutan-2-il]-1H-imidazol-1-carbotioato, (1.65) Pirisoxazoles.

2) Inhibidores de la respiración (inhibidores de cadenas respiratorias), como a modo de ejemplo (2.1) Bixafen, (2.2) Boscalid, (2.3) carboxina, (2.4) Diflumetorim, (2.5) Fenfuram, (2.6) Fluopiram, (2.7) Flutolanilo, (2.8) Fluxapiraxad, (2.9) Furametpir, (2.10) Furfenciclox, (2.11) Isopirazam (mezcla del racemato syn-epímero 1RS,4SR,9RS) y del racemato anti-epímero 1RS,4SR,9SR, (2.12) Isopirazam (racemato anti-epímero), (2.13) Isopirazam (enantiómero anti-epímero 1R,4S,9S), (2.14) Isopirazam (enantiómero anti-epímero 1S,4R,9R), (2.15) Isopirazam (racemato syn-epímero 1RS,4SR,9RS), (2.16) Isopirazam (enantiómero syn-epímero 1R,4S,9R), (2.17) Isopirazam (enantiómero syn-epímero 1S,4R,9S), (2.18) Mepronilo, (2.19) Oxicarboxina, (2.20) Penflufen, (2.21) Pentipirad,

(2.22) Sedaxano, (2.23) Tifluzamida, (2.24) 1-metil-N-[2-(1,1,2,2-tetrafluoretoxi)fenil]-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.25) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[2-(1,1,2,2-tetrafluoretoxi)fenil]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.26) 3-(difluorometil)-N-[4-fluoro-2-(1,1,2,3,3,3-hexafluoropropoxi)fenil]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.27) N-[1-(2,4-diclorofenil)-1-metoxipropan-2-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.28) 5,8-difluoro-N-[2-(2-fluoro-4-[[4-(trifluorometil)piridin-2-il]oxi]fenil)etil]quinazolin-4-amina, (2.29) benzo-vindiflupir, (2.30) N-[(1S,4R)-9-(Diclorometileno)-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida y (2.31) N-[(1R,4S)-9-(Diclorometileno)-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.32) 3-(difluorometil)-1-metil-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.33) 1,3,5-trimetil-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.34) 1-metil-3-(trifluorometil)-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.35) 1-metil-3-(trifluorometil)-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.36) 1-metil-3-(trifluorometil)-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.37) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.38) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.39) 1,3,5-trimetil-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.40) 1,3,5-trimetil-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.41) Benodanil, (2.42) 2-cloro-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)piridin-3-carboxamida, (2.43) Isofetamida.

3) Inhibidores de la respiración (inhibidores de cadenas respiratorias) en el complejo III de la cadena respiratoria, como a modo de ejemplo (3.1) Ametoctradina, (3.2) Amisulbrom, (3.3) Azoxiestrobina, (3.4) Cyazofamida, (3.5) Coumetoxiestrobina, (3.6) Coumoxiestrobina, (3.5) Dimoxiestrobina, (3.8) Enestroburina, (3.9) Famoxadona, (3.10) Fenamidona, (3.11) Flufenoxiestrobina, (3.12) Fluoxaestrobina, (3.13) Kresoxim-metilo, (3.14) Metominoestrobina, (3.15) Orysaestrobina, (3.16) Picoxiestrobina, (3.17) Piracloestrobina, (3.18) Pirametoestrobina, (3.19) Piraioxiestrobina, (3.20) Pyribencarb, (3.21) Triclopiricarb, (3.22) Trifloxiestrobina, (3.23) (2E)-2-(2-[[6-(3-cloro-2-metilfenoxi)-5-fluoropirimidin-4-il]oxi]fenil)-2-(metoxiimino)-N-metilacetamida, (3.24) (2E)-2-(metoxiimino)-N-metil-2-(2-[[((1E)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etiliden)amino]oxi]metil]fenil)acetamida, (3.25) (2E)-2-(metoxiimino)-N-metil-2-(2-[[E)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etoxi]imino]metil]fenil)acetamida, (3.26) (2E)-2-[[((1E)-1-[3-[[E)-1-fluoro-2-fenilvinil]oxi]-fenil]etiliden]amino]oxi]metil]fenil)-2-(metoxiimino)-N-metilacetamida, (3.27) Fenaminoestrobina, (3.28) 5-metoxi-2-metil-4-(2-[[((1E)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etiliden]amino]oxi]metil]fenil)-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-ona, (3.29) metiléster del ácido (2E)-2-[[[ciclopropil[[4-metoxifenil]imino]metil]sulfanil]metil]fenil]-3-metoxiacrílico, (3.30) N-(3-etil-3,5,5-trimetilciclohexil)-3-formamido-2-hidroxibenzamida, (3.31) 2-[[2,5-dimetilfenoxi]metil]fenil]-2-metoxi-N-metilacetamida, (3.32) 2-[[2,5-dimetilfenoxi]metil]fenil]-2-metoxi-N-metilacetamida.

4) Inhibidores de mitosis y división celular, como a modo de ejemplo (4.1) Benomilo, (4.2) Carbendazima, (4.3) clorofenazol, (4.4) Dietofencarb, (4.5) Etaboxam, (4.6) Fluopicolid, (4.7) Fuberidazol, (4.8) Pencicuron, (4.9) Tiabendazol, (4.10) Tiofanat-metilo, (4.11) Tiofanato, (4.12) Zoxamida, (4.13) 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina y (4.14) 3-cloro-5-(6-cloropiridin-3-il)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorofenil)piridazina.

5) Compuestos con actividad multisitio, como a modo de ejemplo (5.1) mezcla bordalesa, (5.2) Captafol, (5.3) Captan, (5.4) clorotalonilo, (5.5) preparaciones de cobre como hidróxido de cobre, (5.6) naftenato de cobre, (5.7) óxido de cobre, (5.8) oxiclورو de cobre, (5.9) sulfato de cobre, (5.10) Diclofluanida, (5.11) Ditianona, (5.12) Dodina, (5.13) Dodina base libre, (5.14) Ferbam, (5.15) Fluorfolpet, (5.16) Folpet, (5.17) Guazatina, (5.18) acetato de guazatina, (5.19) Iminoctadina, (5.20) besilato de Iminoctadina, (5.21) triacetato de Iminoctadina, (5.22) cobre Man, (5.23) Mancozeb, (5.24) Maneb, (5.25) Metiram, (5.26) metiram de zinc, (5.27) oxina de cobre, (5.28) Propamidina, (5.29) Propineb, (5.30) azufre y preparaciones de azufre como a modo de ejemplo polisulfuro de calcio, (5.31) Tiram, (5.32) Tolilfluanida, (5.33) Zineb, (5.34) Ziram y (5.35) Anilazina.

6) Inductores de resistencia, como a modo de ejemplo (6.1) Acibencenoar-S-metilo, (6.2) Isotianilo, (6.3) Probenazol, (6.4) Tiadinilo y (6.5) Laminarina.

7) Inhibidores de la biosíntesis de aminoácidos y proteínas, como a modo de ejemplo (7.1), (7.2) Blasticidin-S, (7.3) Ciprodinilo, (7.4) Kasugamicina, (7.5) clorhidrato hidrato de Kasugamicina, (7.6) Mepanipirim, (7.7) Pirimetanilo, (7.8) 3-(5-fluoro-3,3,4,4-tetrametil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina y (7.9) Oxitetraciclina y (7.10) estreptomina.

8) Inhibidores de la producción de ATP, como a modo de ejemplo (8.1) acetato de fentino, (8.2) cloruro de fentino, (8.3) hidróxido de fentino y (8.4) Siltiofam.

9) Inhibidores de la síntesis de la pared celular, como a modo de ejemplo (9.1) Bentiavalicarb, (9.2) Dimetomorph, (9.3) Flumorph, (9.4) lprovalicarb, (9.5) Mandipropamida, (9.6) polioxinas, (9.7) polioxorim, (9.8) Validamicina A, (9.9) Valifenalato y (9.10) polioxina B.

10) Inhibidores de la síntesis de lípidos y membranal, como a modo de ejemplo (10.1) Bifenilo, (10.2) cloroneb, (10.3) Dicloran, (10.4) Edifenphos, (10.5) Etridiazol, (10.6) Iodocarb, (10.7) lprobenfos, (10.8) isoprotilan, (10.9) Propamocarb, (10.10) clorhidrato de Propamocarb, (10.11) Protiocarb, (10.12) Pirazophos, (10.13) Quintozen,

(10.14) Tecnazeno y (10.15) Tolclofos-metilo.

11) Inhibidores de la biosíntesis de melanina, como a modo de ejemplo (11.1) Carpropamida, (11.2) Diclocymet, (11.3) Fenoxanilo, (11.4) Ftalida, (11.5) Pyroquilona, (11.6) Tricyclazol, y (11.7) {3-metil-1-[(4-metilbenzoil)amino]butan-2-il}carbamato de 2,2,2-trifluoretilo.

5 12) Inhibidores de la síntesis de ácido nucleico, como a modo de ejemplo (12.1) Benalaxilo, (12.2) Benalaxil-M (Kiralaxil), (12.3) Bupirimato, (12.4) Clozilacon, (12.5) Dimetirimol, (12.6) Etirimol, (12.7) Furalaxilo, (12.8) Hymexazol, (12.9) Metalaxilo, (12.10) Metalaxil-M (Mefenoxam), (12.11) Ofurace, (12.12) Oxadixilo, (12.13) ácido oxolínico y (12.14) Octilina.

10 13) Inhibidores de la transducción de señal, como a modo de ejemplo (13.1) Chlozolinato, (13.2) Fempiclonilo, (13.3) Fludioxonilo, (13.4) Iprodiona, (13.5) Procymidona, (13.6) Quinoxifeno, (13.7) Vinclozolina y (13.8) Proquinazida.

14) Desacopladores, como a modo de ejemplo (14.1) Binapacirilo, (14.2) Dinocap, (14.3) Ferimzon, (14.4) Fluazinam y (14.5) Meptildinocap.

15 15) Otros compuestos, como a modo de ejemplo (15.1) Bentiazol, (15.2) Betoxazina, (15.3) Capsimicina, (15.4) Carvona, (15.5) Chinometionato, (15.6) pirofenona (Chlazafenon), (15.7) Cufraneb, (15.8) Cyflufenamida, (15.9) Cymoxanilo, (15.10) Cyprosulfamida, (15.11) Dazomet, (15.12) Debacarb, (15.13) Diclorofeno, (15.14) Diclomezin, (15.15) Difenzoquat, (15.16) Difenzoquatmetilsulfato, (15.17) Difenilamina, (15.18) Ecomat, (15.19) Fenpirazamina, (15.20) Flumetover, (15.21) Fluoroimida, (15.22) Flusulfamida, (15.23) Flutianilo, (15.24) Fosetil-Aluminio, (15.25) Fosetil-Calcium, (15.26) Fosetil-sodio, (15.27) Hexaclorobenceno, (15.28) Irumamicina, (15.29) Methasulfocarb, (15.30) Metilisotiocianato, (15.31) Metrafenona, (15.32) Mildiomicina, (15.33) Natamicina, (15.34) (15.34) dimetilditiocarbamato de níquel, (15.35) nitrotal-isopropilo, (15.36) Octilina, (15.37) Oxamocarb, (15.38) Oxifentina, (15.39) pentaclorofenol y sus sales, (15.40) Fenotrina, (15.41) ácido fosfórico y sus sales, (15.42) Propamocarb-fosetilato, (15.43) Propanosina sodio, (15.44) Pirimorph, (15.45) (2E)-3-(4-ter-butilfenil)-3-(2-cloropiridin-4-il)-1-(morfolin-4-il)prop-2-en-1-ona, (15.46) (2Z)-3-(4-ter-butilfenil)-3-(2-cloropiridin-4-il)-1-(morfolin-4-il)prop-2-en-1-ona, (15.47) Pirrolnitrina, (15.48) Tebufloquina, (15.49) Tecloftalam, (15.50) Tolnifanida, (15.51) Triazoxido, (15.52) Trichlamida, (15.53) Zarilamida, (15.54) 2-metilpropanoato de (3S,6S,7R,8R)-8-bencil-3-[[[3-[(isobutiriloxi)metoxi]-4-metoxipiridin-2-il] carbonil]amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-ilo, (15.55) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il} piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona, (15.56) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il} piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluoro-metil)-1H-pirazol-1-il]etanona, (15.57) 1-(4-{4-[(5R)-5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il} piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona, (15.58) 1H-imidazol-1-carboxilato de 1-(4-metoxifenoxi)-3,3-dimetilbutan-2-ilo, (15.59) 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)piridina, (15.60) 2,3-dibutil-6-clorotieno[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona, (15.61) 2,6-dimetil-1H,5H-[1,4]ditiino[2,3-c:5,6-c']-dipirrol-1,3,5,7-(2H,6H)-tetrona, (15.62) 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(5R)-5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il} piperidin-1-il)-etanona, (15.63) 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(5S)-5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il} piperidin-1-il)etanona, (15.64) 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(5R)-5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il} piperidin-1-il)etanona, (15.65) 2-butoxi-6-yodo-3-propil-4H-cromen-4-ona, (15.66) 2-cloro-5-[2-cloro-1-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-4-metil-1H-imidazol-5-il]piridina, (15.67) 2-fenilfenol y sales, (15.68) 3-(4,4,5-trifluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina, (15.69) 3,4,5-tricloropiridin-2,6-dicarbonyl, (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, (15.74) 5-fluoro-2-[(4-fluorobencil)oxi]pirimidin-4-amina, (15.75) 5-fluoro-2-[(4-metilbencil)oxi]pirimidin-4-amina, (15.76) 5-metil-6-octil[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-amina, (15.77) (2Z)-3-amino-2-ciano-3-fenilacrilato de etilo, (15.78) N-(4-[[3-(4-clorobencil)-1,2,4-tiadiazol-5-il]oxi]-2,5-dimetilfenil)-N-etil-N-etilimidofornamida, (15.79) N-(4-cloro-bencil)-3-[3-metoxi-4-(prop-2-in-1-il)oxi]fenil]propanamida, (15.80) N-[(4-cloro-fenil)(ciano)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-dicloromicotinamida (15.82) N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2,4-dicloromicotinamida, (15.83) N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2-fluoro-4-yodonicotinamida, (15.84) N-[(E)-[(ciclopropilmetoxi)imino] [6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil]-2-fenilacetamida, (15.85) N-[(Z)-[(ciclopropilmetoxi)imino]-[6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil]-2-fenilacetamida, (15.86) N1-{4-[(3-ter-butil-4-ciano-1,2-tiazol-5-il)oxi]-2-cloro-5-metilfenil}-N-etil-N-metilimido-formamida, (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, (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, (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, (15.90) {6-[[[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)-(fenil)metil]-amino]-oxi]metil]piridin-2-il}carbamato de pentilo, (15.91) ácido fenazin-1-carboxílico, (15.92) quinolin-8-ol, (15.93) quinolin-8-ol sulfato (2:1), (15.94) {6-[[[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)-(fenil)metil]-amino]oxi]metil]piridin-2-il}carbamato de ter-butilo, (15.95) 1-metil-3-(trifluorometil)-N-[2'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.96) N-(4'-clorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.97) N-(2',4'-diclorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.98) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[4'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.99) N-(2',5'-difluorobifenil-2-il)-1-metil-3-(trifluorometil)-

1H-pirazol-4-carboxamida, (15.100) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[4'-(prop-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.101) 5-fluoro-1,3-dimetil-N-[4'-(prop-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.102) 2-cloro-N-[4'-(prop-1-in-1-il)bifenil-2-il]-nicotinamida, (15.103) 3-(difluoroetil)-N-[4'-(3,3-dimetilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.104) N-[4'-(3,3-dimetilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.105) 3-(difluorometil)-N-(4'-etinilbifenil-2-il)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.106) N-(4'-etinilbifenil-2-il)-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.107) 2-cloro-N-(4'-etinilbifenil-2-il)nicotinamida, (15.108) 2-cloro-N-[4'-(3,3-dimetilbut-1-in-1-il)-bifenil-2-il]nicotinamida, (15.109) 4-(difluorometil)-2-metil-N-[4'-(trifluorometil)-bifenil-2-il]-1,3-tiazol-5-carboxamida, (15.110) 5-fluoro-N-[4'-(3-hidroxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.111) 2-cloro-N-[4'-(3-hidroxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]nicotinamida, (15.112) 3-(difluorometil)-N-[4'-(3-metoxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.113) 5-fluoro-N-[4'-(3-metoxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.114) 2-cloro-N-[4'-(3-metoxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]nicotinamida, (15.115) (5-bromo-2-metoxi-4-metilpiridin-3-il)(2,3,4-trimetoxi-6-metilfenil)metanona, (15.116) N-[2-(4-{[3-(4-clorofenil)prop-2-in-1-il]-oxi}-3-metoxifenil)etil]-N2-(metilsulfonil) valinamida, (15.117) ácido 4-oxo-4-[(2-feniletil)amino]butanoico, (15.118) {6-[[[(Z)-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilen]amino]oxi]metil]piridin-2-il}carbamato de but-3-in-1-ilo, (15.119) 4-amino-5-fluoropirimidin-2-ol (forma tautomérica: 4-amino-5-fluoropirimidin-2(1H)-ona), (15.120) 3,4,5-trihidroxibenzoato de propilo, (15.121) 1,3-dimetil-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.122) 1,3-dimetil-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.123) 1,3-dimetil-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.124) [3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (15.125) (S)-[3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (15.126) (R)-[3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (15.127) 2-[[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-2,4-dihidro-3H-triazol-3-tiona, (15.128) 1-[[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-triazol-5-il tiocianato, (15.129) 5-(alilsulfanil)-1-[[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol, (15.130) 2-[1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-yl]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.131) 2-[[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.132) 2-[[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.133) 1-[[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol-5-il tiocianato, (15.134) 1-[[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol-5-il tiocianato, (15.135) 5-(alilsulfanil)-1-[[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol, (15.136) 5-(alilsulfanil)-1-[[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol, (15.137) 2-[(2S,4S,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.138) 2-(2R,4S,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.139) 2-[(2R,4R,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.140) 2-[(2S,4R,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.141) 2-[(2S,4S,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.142) 2-[[2R,4S,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.143) 2-[[2R,4R,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.144) 2-[(2S,4R,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.145) 2-fluoro-6-(trifluonetil)-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)benzamida, (15.146) 2-(6-bencilpiridin-2-il)quinazolina, (15.147) 2-[6-(3-fluoro-4-metoxifenil)-5-metilpiridin-2-il]quinazolina, (15.148) 3-(4)4-difluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il) quinolina, (15.149) ácido abscicínico, (15.150) 3-(difluorometil)-N-metoxi-1-metil-N-[1-(2,4,6-triclorofenil)propan-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.151) N'-[5-bromo-6-(2,3-dihidro-1H-inden-2-iloxi)-2-metilpiridin-il]-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.152) N'-[5-bromo-6-[(1R)-1-(3,5-difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.153) N'-[5-bromo-6-[(1S)-1-(3,5-difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.154) N1-[5-bromo-6-[(cis-4-isopropilciclohexil)oxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.155) N'-[5-bromo-6-[(trans-4-isopropilciclohexil)oxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.156) N'-[5-bromo-6-[(cis-4-isopropilciclohexil)oxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.157) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.158) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropilbencil)-3-(difluorometil)-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.159) N-(2-ter-butilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.160) N-(5-cloro-2-etilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.161) N-(5-cloro-2-isopropilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.162) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-5-fluorobencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.163) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(5-fluoro-2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.164) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropil-5-fluorobencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.165) N-(2-ciclopentil-5-fluorobencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.166) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-fluoro-6-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.167) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-5-metilbencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.168) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropil-5-metilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.169) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropil-5-metilbencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.170) N-(2-ter-butil-5-metilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.171) N-[5-cloro-2-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.172) N-ciclopropil-3'(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-N-[5-metil-2-(trifluorometil)bencil]-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.173) N-[2-cloro-6-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-4-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.174) N-[3-cloro-2-fluoro-6-

(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.175) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-4,5-dimetilbencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.176) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.177) 3-(difluorometil)-N-(7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.178) 3-(difluorometil)-N-[(3R)-7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.179) 3-(difluorometil)-N-[(3S)-7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.180) N'-(2,5-dimetil-(3) fenoxifenil)-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.181) N'-{4-[(4,5-dicloro-1,3-tiazol-2-il)oxi]-2,5-dimetilfenil}-N-etil-N-metilimidofornamida, (15.182) N-(4-cloro-2,6-difluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina. Todos los asociados de mezcla de las clases (1) a (15) mencionados pueden, en caso que sean capaces sobre la base de sus grupos funcionales, dado el caso formar sales con bases o ácidos adecuados.

Agentes biológicos para combatir parásitos de plantas como asociados de mezcla

Los compuestos de la fórmula (I) pueden combinarse con agentes biológicos para combatir parásitos de plantas.

Los agentes biológicos para combatir parásitos de plantas comprenden en particular bacterias, hongos, levaduras, extractos de plantas y aquellos productos que fueron formados por microorganismos, incluyendo proteínas y productos metabólicos secundarios.

Los agentes biológicos para combatir parásitos de plantas comprenden bacterias como bacterias que forman esporas, bacterias que forman poblaciones en las raíces y bacterias que actúan como insecticidas, fungicidas o nematocidas biológicos.

Ejemplos de tales bacterias que se usan o bien pueden usarse como agentes biológicos para combatir parásitos de plantas son los siguientes:

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

Ejemplos de hongos y levaduras que se usan o bien pueden usarse como agentes biológicos para combatir parásitos de plantas, son los siguientes:

Beauveria bassiana, en particular la cepa ATCC 74040, Coniothyrium minitans, en particular la cepa CON/M/91-8 (acceso N° DSM-9660), Lecanicillium spp., en particular la cepa HRO LEC 12, Lecanicillium lecanii, (anteriormente conocido como Verticillium lecanii), en particular la cepa KV01, Metarhizium anisopliae, en particular la cepa F52 (DSM3884/ ATCC 90448), Metschnikowia fructicola, en particular la cepa NRRL Y-30752, Paecilomyces fumosoroseus (nuevo: Isaria fumosorosea), en particular la cepa IFPC 200613, o cepa Apopka 97 (Accesion No. ATCC 20874), Paecilomyces lilacinus, en particular P. lilacinus cepa 251 (AGAL 89/030550), Talaromyces flavus, en particular la cepa V117b, Trichoderma atroviride, en particular la cepa SC1 (acceso N° CBS 122089), Trichoderma harzianum, en particular T. harzianum rifai T39. (acceso N° CNCM I-952).

Ejemplos de virus que se usan o bien pueden usarse como agentes biológicos para combatir parásitos de plantas, son los siguientes:

Adoxophyes orana (oruga de la cáscara de manzana) virus de granulosa (GV), Cydia pomonella (oruga de la manzana) virus de granulosa (GV), Helicoverpa armigera (gusano del algodón) virus de polihedrosis nuclear (NPV), Spodoptera exigua (gardama o rosquilla verde) mNPV, Spodoptera frugiperda (gusano soldado) mNPV, Spodoptera littoralis (gusano africano del algodón) NPV.

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

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

Son ejemplos de extractos de plantas y de aquellos productos que fueron formados por microorganismos incluyendo proteínas y productos metabólicos secundarios, que se usan o bien pueden usarse como agentes para combatir parásitos biológicos:

5 Allium sativum, Artemisia absinthium, Azadirachtin, Biokeeper WP, Cassia nigricans, Celastrus angulatus, Chenopodium anthelminticum, quitina, Armour-Zen, Dryopteris filix-mas, Equisetum arvense, Fortune Aza, Fungastop, Heads Up (Chenopodium quinoa – extracto de saponina), piretro/ piretrinas, Quassia amara, Quercus, Quillaja, Regalia, „Requiem™ Insecticide“, Rotenona, Ryania/Ryanodine, Symphytum officinale, Tanacetum vulgare, Thymol, Triact 70, TriCona, Tropaeolum majus, Urtica dioica, Veratrina, Viscum album, extracto de Brassicaceae, en particular polvo de colza o de mostaza.

Protectores selectivos como asociados de mezcla

10 Los compuestos de la fórmula (I) pueden combinarse con protectores selectivos, como por ejemplo Benoxacor, Cloquintocet (-mexil), Cyometrinilo, Cyprosulfamida, Dicloromida, Fencloroazol (-etilo), Fenclorim, Flurazol, Fluxofenim, Furilazol, isoxadifen (-etilo), Mefenpir (-dietilo), anhídrido naftálico, oxabetrinilo, 2-metoxi-N-((4-[(metilcarbamoil)amino]fenil)sulfonyl)benzamida (CAS 129531-12-0), 4-(dicloroacetil)-1-oxa-4-azaespiro[4.5]decano de (CAS 71526-07-3), 2,2,5-trimetil-3-(dechloroacetil)-1,3-oxazolidina (CAS 52836-31-4).

Plantas y partes de plantas

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

25 El tratamiento de las plantas y las partes de las plantas con los compuestos de la fórmula (I) se efectúa directamente o por la acción en el entorno, hábitat o espacio de almacenamiento mediante los procedimientos de tratamiento habituales, por ejemplo inmersión, pulverización, atomizado, evaporación, espolvoreo, pintura, inyección y, en el caso del material de propagación, especialmente en el caso de semillas, además mediante recubrimiento con uno o más recubridores.

30 Como ya se mencionó antes, todas las plantas y sus partes pueden tratarse de acuerdo con la invención. En una forma preferida de realización se tratan especies y variedades de plantas y sus partes de origen silvestre u obtenidas mediante métodos biológicos de cultivo convencionales, como hibridación o fusión de protoplastos. En otra realización preferida se tratan plantas transgénicas y variedades de plantas y sus partes que fueron obtenidas mediante métodos de ingeniería genética, en su caso en combinación con métodos convencionales (*Genetically Modified Organisms*). Los términos "partes" o bien "partes de plantas" fueron explicados más arriba.

Plantas transgénicas, tratamiento de semillas y eventos de integración

35 Las plantas transgénicas o bien las especies de plantas (las que se obtienen por ingeniería genética) que se tratarán preferentemente de acuerdo con la presente invención, incluyen todas las plantas que obtuvieron material genético por medio de la ingeniería genética, que les confiere propiedades ("rasgos") ventajosas particularmente útiles a estas plantas. Son ejemplos de estas propiedades un mejor desarrollo de la planta, tolerancia aumentada a temperaturas altas o bajas, tolerancia aumentada a la sequía o al agua o al contenido salobre del suelo, rendimiento aumentado de la floración, cosechas más fáciles, maduración acelerada, rendimientos más altos, mejor calidad y/o un valor nutricional más alto de los productos cosechados, mayor duración en el almacenamiento y/o procesamientos de los productos cosechados. Otros ejemplos que pueden destacar estas propiedades en particular son una defensa mejorada de las plantas contra las plagas animales y microbianas, como ser contra insectos, arácnidos, nematodos, ácaros, caracoles, causada p. ej., por toxinas formadas en las plantas, en particular las que se forman en las plantas por el material genético de *Bacillus thuringiensis* (por ejemplo por los genes CryIA (a), CryIA (b), CryIA (c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb y CryIF así como sus combinaciones), además una defensa mejorada de las plantas contra los hongos, bacterias y virus fitopatógenos causada por ejemplo, por resistencia adquirida sistémica (RAS), sistemina, fitoalexinas, desencadenantes y además genes de resistencia y proteínas y toxinas, así como también una mayor tolerancia de las plantas a ciertos principios activos herbicidas, por ejemplo, imidazolinonas, sulfonilureas, glifosato o fosfotricina (por ej., el gen "PAT"). Los genes que proveen en cada caso las propiedades ("rasgos") deseados, también pueden encontrarse combinados entre sí en las plantas transgénicas. Como ejemplos de plantas transgénicas han de mencionarse las plantas de cultivo más importantes, como ser cereales (trigo, arroz, triticale, cebada, centeno, avena), maíz, soja, patatas, remolacha azucarera, caña de azúcar, tomates, arvejas y otros tipos hortalizas, algodón, tabaco, colza y además plantas con frutos (con los frutos de manzanas, peras, frutas cítricas y uvas), siendo de especial importancia maíz, soja, trigo, arroz, patata, algodón, caña de azúcar, tabaco y colza. Las propiedades

("rasgos") que se resaltan en particular son la mayor capacidad de defensa de las plantas contra insectos, arácnidos, nematodos y caracoles.

Protección de plantas – Tipos de tratamiento

5 El tratamiento de plantas y partes de plantas con los compuestos de la fórmula (I) se puede llevar a cabo directamente o actuando sobre su entorno, su hábitat o lugar de almacenamiento mediante el uso de procedimientos convencionales, tales como impregnación, pulverizado, evaporación, formación de partículas, dispersión, revestimiento e inyección, o para un material de propagación, especialmente para una semilla, recubriéndola con uno o más de los compuestos etc. También es posible, aplicar los compuestos de la fórmula (I) según el procedimiento de volumen-ultra-bajo o inyectar la forma de uso o el mismo compuesto de la fórmula (I) en el suelo.

10 Un tratamiento directo preferido de las plantas es la aplicación foliar, es decir, los compuestos de la fórmula (I) se aplican sobre el follaje donde la frecuencia del tratamiento y la cantidad de aplicación debería adecuarse a la intensidad de infestación del parásito respectivo.

15 En el caso de compuestos sistémicamente activos, los compuestos de la fórmula (I) también ingresan a las plantas a través del sistema radicular. El tratamiento de las plantas en ese caso se realiza mediante la acción de los compuestos de la fórmula (I) en el hábitat de la planta. Esto puede realizarse, por ejemplo, por empapado o mezclado en el suelo o el fertilizante líquido, es decir, el sitio de la planta (por ej., en el suelo o sistemas hidropónicos) se embebe con una forma líquida de los compuestos de la fórmula (I), o mediante la aplicación al suelo, es decir compuestos de la fórmula (I) se introducen en forma sólida (por ejemplo en forma de gránulos) en el sitio de las plantas. En el caso de cultivos de arroz con cáscara, esto además puede realizarse midiendo compuestos de la fórmula (I) en una forma de aplicación sólida (p. ej., como gránulos) dentro de un arrozal inundado.

Tratamiento de semillas

Desde hace tiempo se conoce la lucha contra los parásitos animales mediante el tratamiento de las semillas de plantas y es objeto de continuas mejoras. Pero a pesar de ello, se producen una serie de dificultades durante el tratamiento de semillas que no siempre pueden ser solucionadas de manera satisfactoria. Así, se pretende de desarrollar procedimientos para la protección de las semillas y de la planta en etapa de germinación que eviten la aplicación adicional de agentes fitoprotectores durante el almacenamiento, después de la siembra o después de la emergencia de las plantas o al menos la reduzcan notoriamente. Además se debe tratar de optimizar la cantidad del principio activo usado de manera tal que las semillas y la planta en etapa de germinación reciban la mejor protección posible de la infestación con parásitos animales, pero sin dañar la planta misma por el principio activo usado. En particular, se debería considerar en los procedimientos para el tratamiento de semillas las propiedades insecticidas o bien nematocidas intrínsecas de plantas resistentes a parásitos o bien plantas transgénicas tolerantes, a fin de lograr una protección óptima de las semillas y de la planta en etapa de germinación con un dispendio mínimo de agentes fitoprotectores.

35 La presente invención por lo tanto también es apropiada para un procedimiento para la protección de semillas y de plantas en etapa de germinación antes de la infestación con parásitos, en el que las semillas se tratan con compuestos de la fórmula (I). El procedimiento para la protección de semillas y plantas en proceso de germinación ante la infestación de parásitos también incluye un procedimiento en el que las semillas se tratan en forma simultánea o secuencial con un compuesto de la fórmula (I) y los asociados de mezcla. Además comprende un procedimiento en el que las semillas se tratan en momentos diferentes con un compuesto de la fórmula (I) y los asociados de mezcla

40 La invención se refiere además al uso de los compuestos de la fórmula (I) para el tratamiento de semillas para la protección de las semillas y de la planta que se forma de ellas, ante parásitos animales.

En semillas que se trataron en diferentes momentos con un compuesto de la fórmula (I) y asociados de mezcla, las distintas sustancias pueden estar contenidas en diferentes capas sobre las semillas. En ese caso, las capas que contienen un compuesto de la fórmula (I) y asociados de mezcla, dado el caso pueden estar separadas por una capa intermedia. Una de las ventajas cuando uno de los compuestos de la fórmula (I) tiene efecto sistémico es que con el tratamiento de las semillas no solamente se protegen las semillas mismas, sino también las plantas que surjan de estas después de la emergencia ante hongos fitopatógenos. De este modo se puede prescindir del tratamiento inmediato del cultivo al momento de la siembra o poco después.

50 Otra de las ventajas radica en que mediante el tratamiento de las semillas con un compuesto de la fórmula (I) pueden fomentarse la germinación y la emergencia de las semillas tratadas.

Asimismo debe considerarse ventajoso que los compuestos de la fórmula (I) pueden usarse en particular también en semillas transgénicas.

55 Los compuestos de la fórmula (I) además pueden usarse en combinación con medios de la tecnología de señales, por lo que se produce una mejor colonización con simbiontes, como por ejemplo Rhizobios, Mycorrhiza y/o bacterias endofíticas u hongos y/o se logra una fijación óptima de nitrógeno.

Los compuestos de la fórmula (I) son apropiados para la protección de semillas de cualquier tipo de plantas que se usan en la agricultura, en el invernadero, en bosques o en horticultura o de vides. Especialmente se trata aquí de semillas de cereales (como trigo, cebada, centeno, triticale, mijo y avena), maíz, algodón, soja, arroz, patatas, girasol, judías, café, rábano (p. ej., remolacha azucarera y remolacha forrajera), cacahuete, colza, amapola, olivo, coco, cacao, caña de azúcar, tabaco, hortalizas (como tomate, pepino, cebollas y lechuga), frutales, césped y plantas ornamentales. Especial importancia tiene el tratamiento de las semillas de cereales (como trigo, cebada, centeno y avena), maíz, soja, algodón, canola, colza y arroz.

Como ya se mencionó previamente, el tratamiento de semillas transgénicas con un compuesto de la fórmula (I) es de especial importancia. Esto se refiere a semillas de plantas que contienen al menos un gen heterólogo que permite la expresión de un polipéptido o una proteína con propiedades insecticidas. El gen heterólogo en semillas transgénicas puede provenir p. ej., de microorganismos de las especies *Bacillus*, *Rhizobium*, *Pseudomonas*, *Serratia*, *Trichoderma*, *Clavibacter*, *Glomus* o *Gliocladium*. La presente invención es especialmente adecuada para el tratamiento de semillas transgénicas que contiene al menos un gen heterólogo que proviene de *Bacillus* sp. De preferencia especial, gen heterólogo proviene de *Bacillus thuringiensis*.

En el marco de la presente invención el compuesto de la fórmula (I) se aplica solo en una formulación adecuada sobre las semillas. Preferentemente se trata la semilla en un estado en el cual sea tan estable que no se produzcan daños durante el tratamiento. En general, el tratamiento de la semilla puede realizarse en cualquier momento entre la cosecha y la siembra. Usualmente se usa la semilla que se separa de la planta y que se ha limpiado de mazorca, cáscara, tallo, vaina, lana o pulpa. Así, por ejemplo, puede usarse la semilla cosechada, limpiada y secada hasta un contenido de humedad apto para el almacenamiento. En forma alternativa, también puede usarse la semilla que tras el secado se trató, por ejemplo, con agua y que luego nuevamente se secó. En el caso de semillas de arroz también es posible usar semillas que se ha hinchado previamente por ejemplo en agua hasta un estadio determinado (estadio pigeon breast), lo que produce una mejor germinación y una emergencia uniforme.

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

Los compuestos de la fórmula (I) por lo general se aplican en forma de una formulación adecuada sobre las semillas. Las formulaciones y procedimientos adecuados para el tratamiento de las semillas son conocidos por el especialista.

Los compuestos de la fórmula (I) pueden trasladarse a las formulaciones habituales de desinfectantes, como soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, espumas, dispersiones u otros gránulos para semillas, así como formulaciones de tipo ULV.

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

Como colorantes que pueden estar contenidos en las formulaciones aplicables de desinfectantes de acuerdo con la invención, se indican todos los colorantes habituales para el dicho fin. En este sentido son aplicables tanto los pigmentos poco solubles en agua, como así también los colorantes solubles en agua. Como ejemplo se mencionan los colorantes conocidos bajo las denominaciones rodamina B, C.I. pigmento rojo 112 y C.I. disolvente rojo 1.

Como agentes tensioactivos que pueden estar contenidos en las formulaciones de agentes tensioactivos aplicables de acuerdo con la invención vienen al caso todas las formulaciones de principios activos agroquímicos usuales que favorecen la humectación. Preferentemente son aplicables los alquilnaftaleno sulfonatos, como diisopropilnaftaleno sulfonato o diisobutilnaftaleno sulfonato.

Como dispersantes y/o emulsionantes que pueden estar contenidos en las formulaciones de desinfectantes aplicables de acuerdo con la invención, se indican todos los dispersantes para la formulación de principios activos agroquímicos no iónicos, aniónicos y catiónicos habituales. Son preferentemente aplicables los dispersantes no iónicos o aniónicos o mezclas de dispersantes no iónicos o aniónicos. Como dispersantes no iónicos adecuados pueden mencionarse especialmente los polímeros de bloque óxido de etileno-óxido de propileno, éteres alquifenolpoliglicólico así como éteres tristrifenolpoliglicólicos y sus derivados fosfatados o sulfatados. Son dispersantes aniónicos adecuados especialmente los sulfonatos de lignina, las sales ácidas poliacrílicas y los productos de condensación de arilsulfonato y formaldehído.

Como antiespumantes las formulaciones de desinfectantes que pueden usarse de acuerdo con la invención pueden contener todas las sustancias inhibidoras de espuma habituales para la formulación de principios activos agroquímicos. Preferentemente son aplicables los antiespumantes de silicona y el estearato de magnesio.

Como conservantes pueden estar presentes en las formulaciones de desinfectantes que pueden usarse de acuerdo con la invención todas las sustancias aplicables en los agentes agroquímicos para tal fin. Como ejemplo se tienen el

diclorofeno y el bencilalcohol hemiformal.

5 Como espesantes secundarios que pueden estar contenidos en las formulaciones de desinfectantes que pueden usarse de acuerdo con la invención, se indican todas las sustancias químicas empleables en agentes agroquímicos para tal fin. Preferentemente entran en consideración los derivados de la celulosa, los derivados del ácido acrílico, xantano, arcillas modificadas y ácidos silícicos altamente dispersos.

Como aglutinantes que pueden estar contenidos en los desinfectantes que pueden usarse de acuerdo con la invención, se indican todas las sustancias aglutinantes usuales empleables en desinfectantes. Preferentemente pueden nombrarse polivinilpirrolidona, acetato de polivinilo, alcohol de polivinilo y tilosa.

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

15 Se pueden emplear las formulaciones de desinfectantes que pueden usarse de acuerdo con la invención ya sea en forma directa o luego de la previa dilución con agua para el tratamiento de las semillas de los más variados modos. Así los concentrados o las preparaciones que se obtienen de ellos mediante la dilución con agua pueden usarse para la desinfección de semillas de cereales, como trigo, cebada, centeno, avena y triticale, así como de semillas de maíz, arroz, colza, arvejas, judías, algodón, girasol, soja y rábanos o también de semillas de hortalizas de tipos muy diferentes. Las formulaciones de desinfectantes que pueden usarse de acuerdo con la invención o sus formas de uso diluidas también puede usarse para la desinfección de semillas de plantas transgénicas.

20 Para el tratamiento de semillas con las formulaciones de desinfectantes que pueden usarse de acuerdo con la invención o con los preparados resultantes producidos con adición de agua, entran en consideración todos los dispositivos usuales de mezcla que pueden usarse para la desinfección. En particular, para la desinfección se procede colocando la semilla en un mezclador con las correspondientes cantidades de formulaciones de desinfectante o como tal o luego de la previa dilución con agua y hasta la distribución uniforme de la formulación sobre la semilla. Eventualmente se añade un proceso de secado.

25 La cantidad de aplicación en las formulaciones de decapado que se usan de acuerdo con la invención puede variarse dentro de un intervalo más amplio. Se rige según el contenido respectivo de los compuestos de la fórmula (I) en las formulaciones y por las semillas. Las cantidades de aplicación en el compuesto de la fórmula (I) por lo general se encuentran entre 0,001 y 50 g por kilogramo de semillas, preferentemente entre 0,01 y 15 g por kilogramo de semillas.

30 Uso en sanidad animal

En el ámbito de la sanidad animal, esto es en el ámbito de la medicina veterinaria, los compuestos de la fórmula (I) producen efectos contra parásitos animales, especialmente ectoparásitos y endoparásitos. El término endoparásitos incluye especialmente helmintos como cestodos, nematodos o trematodos, y protozoos como coccidios. Los ectoparásitos son en forma típica y preferentemente artrópodos, especialmente insectos y ácaros.

35 Los compuestos de la fórmula (I) resultan apropiados en el caso de una toxicidad favorable para animales de sangre caliente, para combatir endoparásitos patógenos que se encuentran en los lugares de manutención y cría de animales, en los animales domesticados, de cría, de zoológico, de laboratorio, de ensayo y en mascotas. Son efectivos en todos o en algunos de los estadios de desarrollo de los parásitos.

40 Se incluyen en los animales útiles en la ganadería especialmente los mamíferos, como ovejas, cabras, caballos, asnos, camellos, búfalos, conejos, gamos, renos, y en particular vacas y cerdos; aves como pavos, patos, gansos y en particular gallinas; peces y crustáceos, p. ej. en el cultivo acuático y también insectos como las abejas.

En los animales domésticos se incluyen por ejemplo mamíferos como hámster, cobayos, ratas, ratones, chinchillas, hurones y en particular perros, gatos, aves domésticas, reptiles, anfibios y peces de acuario.

45 Mediante el uso de los compuestos de la fórmula (I) para combatir los parásitos animales se desea reducir o evitar las enfermedades, los casos de muerte y las mermas de rendimientos (en la producción de carne, leche, lana, pieles, huevos, miel, etc.) de modo que mediante el uso de los principios activos es posible una tenencia de animales más económica y sencilla y un mejor bienestar de los animales.

50 Con respecto al área de la sanidad animal, el concepto "lucha" o "combatir" significa que mediante los compuestos de la fórmula (I) puede reducirse de manera efectiva la presentación de los parásitos respectivos en un animal que está infestado con tales parásitos en una medida no riesgosa. Más exactamente "combatir" significa en el presente contexto que el compuesto de la fórmula (I) elimina al parásito respectivo, impiden su crecimiento o puede impedir su multiplicación.

Forman parte de los artrópodos:

del orden Anoplurida, por ejemplo *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phtirus* spp., *Solenopotes*

spp.; del orden Mallophagida y 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 los subórdenes Nematocera y Brachycera, por ejemplo Aedes spp., Anopheles spp., Culex spp., Simulium spp., Eusimulium spp., Phlebotomus spp., Lutzomyia spp., Culicoides spp., Chrysops spp., Odagmia spp., Wilhelmsia spp., Hybomitra spp., Atilotus spp., Tabanus spp., Haematopota spp., Philipomyia spp., Braula spp., Musca spp., hidrotæa 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., Xenopsilla spp., Ceratophyllus spp.;

del orden Heteroptera, por ejemplo Cimex spp., triatoma spp., Rhodnius spp., Panstrongylus spp.; así como insectos molestos y nocivos para la sanidad del orden de los Blattaria.

Además se incluyen en los artrópodos:

De la subclase de los 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. (la especie originaria de las garrapatas de múltiples hospedantes); del orden Mesostigmata, como Dermanyssus spp., Ornithonyssus spp., Pneumonyssus spp., Raillietia spp., Pneumonyssus spp., Sternostoma spp., Varroa spp., Acarapis spp.; del orden Actinieda (Prostigmata), por ejemplo Acarapis spp., Cheiletiella spp., Ornithocheiletia spp., Myobia spp., Psorergates spp., Demodex spp., Trombicula spp., Neotrombicula spp., Listrophorus spp.; y del orden Acaridida (Astigmata), por ejemplo Acarus spp., Tyrophagus spp., Caloglyphus spp., Hypodectes spp., Pterolichus spp., Psoroptes spp., Chorioptes spp., Otodectes spp., Sarcoptes spp., Notoedres spp., Knemidocoptes spp., Cytodites spp., Laminosioptes spp..

Forman parte de los protozoarios parasitarios:

Mastigophora (Flagellata), 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;

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

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. crandallii, E. deblickei, E. dispersa, E. ellipsoides, E. falciformis, E. faurei, E. flavescens, E. gallopavonis, E. hagani, E. intestinalis, E. iroquoiana, E. irrisidua, E. labbeana, E. leucarti, E. magna, E. maxima, E. media, E. meleagridis, E. meleagritidis, E. mitis, E. necatrix, E. ninakohlyakimovae, E. ovis, E. parva, E. pavonis, E. perforans, E. phasani, E. piriformis, E. praecox, E. residua, E. scabra, E. spec., E. stiedai, E. suis, E. tenella, E. truncata, E. truttae, E. zuernii, Globidium spec., isospora belli, I. canis, I. felis, I. ohioensis, I. rivolta, I. spec., I. suis, Cystisporospora spec., Cryptosporidium spec., en particular C. parvum; como Toxoplasmatidae, por ejemplo Toxoplasma gondii, Hammondia heydornii, Neospora caninum, Besnoitia besnoitii; como Sarcocystidae, por ejemplo Sarcocystis bovicanis, S. bovis, S. ovicanis, S. ovifelis, S. neurona, S. spec., S. suihominis, como Leucosporidia, por ejemplo Leucosporidium simondi, como Plasmodiidae, por ejemplo Plasmodium berghei, P. falciparum, 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..

Forman parte de los endoparásitos patógenos, que son helmintos, las tenias (p. ej., Monogenea, Cestodes y Trematodes), los gusanos, Acanthocephala y Pentastoma. Se incluyen en estos:

Monogenea: p. ej.: Gyrodactylus spp., Dactylogyrus spp., Polystoma spp.;

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

del orden Cyclophyllida por ejemplo: Mesocestoides spp., Anoplocephala spp., Paranoplocephala spp., Moniezia spp., Thysanosoma spp., Thysanotria spp., Avitellina spp., Stilesia spp., Cittotaenia spp., Andrya spp., Bertiella spp., Taenia spp., Equinococcus spp., Hydatigera spp., Davainea spp., Raillietina spp., Hymenolepis spp., Equinolepis spp., Equinocotyle spp., Diorchis spp., Dipylidium spp., Joyeuxiella spp., Diplopylidium spp.;

Trematodos: de la clase Digenea por ejemplo: Diplostomum spp., Posthodiplostomum spp., Schistosoma spp., Trichobilharzia spp., Ornithobilharzia spp., Austrobilharzia spp., Gigantobilharzia spp., Leucocloridium spp., Brachylaima spp., Equinostoma spp., Equinoparyphium spp., Equinochasmus spp., Hypoderaeum spp., Fasciola spp., Fascioloides spp., Fasciolopsis spp., ciclocoelum spp., Typhlocoelum spp., Paramphistomum spp.,

Calicophoron spp., Cotilophoron spp., Gigantocotile spp., Fiscoeiderius spp., Gastrothilacus spp., Notocotilus 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.;

5 gusanos: Trichinellida por ejemplo: Trichuris spp., Capillaria spp., Paracapillaria spp., Eucoleus spp., Trichomosoides spp., Trichinella spp.;

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

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

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

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

25 del orden Equinorhynchida por ejemplo Acanthocephalus spp., Equinorhynchus spp., Leptorhynchoides spp.;

Pentastoma: del orden Porocephalida por ejemplo Linguatula spp..

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

30 Control de vectores

Los compuestos de la fórmula (I) pueden también usarse para controlar los vectores. Un vector en el sentido de la presente invención es un artrópodo, en particular un insecto o arácnido que es capaz de transmitir agentes patógenos como por ejemplo virus, gusanos, organismos unicelulares y bacterias de un reservorio (una planta, un animal, un ser humano, etc.) a un hospedante. Los agentes patógenos pueden transmitirse en forma mecánica (por ejemplo, Trachoma mediante moscas no picadoras) a un hospedante, o mediante picadura (por ejemplo, parásitos de malaria mediante mosquitos) a un hospedante.

Son ejemplos de vectores y enfermedades transmitidas por ellos o de agentes patógenos:

1) Moscas

- Anopheles: malaria, filarirose;

40 - Culex: encefalitis japonesa, filariasis, otras enfermedades virales, transmisión de gusanos;

- Aedes: fiebre amarilla, fiebre de dengue, filariasis, otras enfermedades virales;

- Simulium: transmisión de gusanos, especialmente onchocerca volvulus

2) Piojos: infecciones de piel, tifus exantemático (tifus epidémica);

3) Pulgas: peste, tifus exantemático endémico;

45 4) Moscas: enfermedad del sueño (trpanosomiasis); cólera, otras enfermedades bacterianas.

5) Ácaros: acariosis, tifus exantemático, tifus pustuloso, turalemia, encefalitis de Saint-Louis, meningitis viral (FSME), fiebre de Krim-Kongo, tifus exantemático, borreliosis;

6) Garrapatas: borreliosis tales como borrelia duttoni, meningoencefalitis de principios de verano, fiebre "Q" (coxiella burnetii), babesias (babesia canis canis).

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

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

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

10 Los compuestos de la fórmula (I) son adecuados para el uso en la prevención de enfermedades o bien de agentes patógenos que pueden ser transmitidos por vectores.

Protección de materiales técnicos

Los compuestos de la fórmula (I) son adecuados para la protección de materiales técnicos ante la infestación con o la destrucción mediante insectos, p. ej., del orden Coleoptera, Hymenoptera, Isoptera, Lepidoptera, Psocoptera y Zygentoma.

15 Por materiales técnicos debe entenderse en este contexto los materiales inertes en este conjunto como preferentemente plásticos, adhesivos, pegamentos, papeles y cartones, cuero, madera, productos para el tratamiento de madera y barnices. El uso de la invención para la protección de madera es de preferencia particular.

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

20 En otra realización, los compuestos de la fórmula (I) están disponibles como un agente plaguicida listo para usar (ready-to-use), es decir, puede aplicarse sin otra modificación sobre el material correspondiente. Como otros insecticidas o como fungicidas entran en consideración en particular los antes mencionados.

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

Lucha contra parásitos animales en el área sanitaria

30 Los compuestos de la fórmula (I) son adecuados para combatir parásitos animales en el área sanitaria. En particular, la invención puede usarse para la protección del hogar, la higiene y los acopios, ante todo para combatir insectos, arácnidos y ácaros que existen en espacios cerrados, como por ejemplo, viviendas, naves industriales, oficinas y cabinas de vehículos entre otros. Para combatir las plagas animales, los compuestos de la fórmula (I) pueden usarse solos o en combinación con otros principios activos y coadyuvantes. Preferentemente se usan en insecticidas domésticos. Los compuestos de la fórmula (I) son efectivos contra formas sensibles y resistentes, así como contra
35 todos los estadios de desarrollo.

Se incluyen en estas plagas a modo de ejemplo plagas de la clase de los arácnidos de los órdenes Scorpiones, Araneae y Opiliones, de las clases Chilopoda y Diplopoda, de la clase de los insectos del orden de los Blattodea, de los órdenes Coleoptera, Dermaptera, Diptera, Heteroptera, Hymenoptera, Isoptera, Lepidoptera, Phthiraptera, Psocoptera, Saltatoria o Orthoptera, Siphonaptera y Zygentoma y de la clase Malacostraca, del orden Isopoda.

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

45 **Explicación de los procedimientos e intermedios**

Los siguientes ejemplos de preparación y uso ilustran la invención. Los productos se caracterizaron mediante espectroscopía de RMN de ¹H y/o CL-EM (Liquid Chromatography Mass Spectrometry) y/o CG-EM (Gas Chromatography-Mass Spectrometry).

50 La determinación de los valores logP se efectuó análogamente a la Directiva OECD 117 (directiva CE 92/69/EEC) mediante HPLC (High Performance Liquid Chromatography) en columnas de fase reversa (C 18), de acuerdo con los procedimientos siguientes:

[a] la determinación con la CL-EM en el intervalo ácido se realiza a un valor de pH 2,7 con 0,1 % ácido fórmico

acuoso y acetonitrilo (contiene 0,1 % de ácido fórmico) como eluyente; gradiente lineal de 10 % de acetonitrilo a 95 % de acetonitrilo.

[b] la determinación con la CL-EM en el intervalo neutral a un valor de pH 7.8 con una solución acuosa 0,001 molar de solución hidrogenocarbonato de amonio y acetonitrilo como eluyente; gradiente lineal de 10 % de acetonitrilo a 95 % de acetonitrilo.

La calibración se realiza con soluciones de una serie homóloga de alcan-2-onas no ramificadas (con 3 a 16 átomos de carbono) cuyos valores logP son conocidos (determinación de los valores logP con los tiempos de retención por medio de interpolación lineal entre dos alcanonas sucesivas).

Los espectros de RMN se midieron con un dispositivo Bruker II Avance 400, equipado con un cabezal de muestra de 1,7 mm TCI. En casos aislados se determinaron los espectros de RMN con un dispositivo Bruker Avance II 600.

Los datos de RMN de ^1H de ejemplos seleccionados se registran en forma de listas de picos de RMN de ^1H . Para cada pico de señal se indicó el valor δ en ppm y la intensidad de señal en paréntesis. El valor δ - pares de números de intensidad de señal para diferentes picos de señal se indican con la separación uno de otro por punto y coma.

La lista de picos de un ejemplo por lo tanto tiene la forma:

δ_1 (intensidad1); δ_2 (intensidad2);.....; δ_i (intensidad i);.....; δ_n (intensidad n)

La intensidad de las señales fuertes es correlativa con la altura de las señales en un ejemplo impreso de un espectro de RMN en cm y muestra las relaciones reales de las intensidades de señal. Puede mostrarse las señales anchas de varios picos o el centro de la señal y su intensidad relativa en comparación con la señal más intensiva en el espectro.

Para calibrar el desplazamiento químico para de espectros RMN de ^1H usamos tetrametilsilano y/o el desplazamiento químico del disolvente usado, especialmente en el caso de espectros medidos en DMSO. Por lo tanto, en listas de picos de RMN puede presentarse un pico de tetrametilsilano, pero no se produce en todos los casos.

Las listas de picos de RMN de ^1H son similares a las impresiones clásicas de RMN de ^1H y por lo tanto, incluyen en general todos los picos que están enumerados en la interpretación clásica de RMN.

Por lo demás, pueden mostrar al igual que las impresiones clásicas de RMN de ^1H señales de disolventes, estereoisómeros de los compuestos blanco que también son objeto de la invención y/o picos de impurezas.

Para mostrar señales de compuestos en el intervalo delta de disolventes y/o agua, los picos usuales de disolventes, por ejemplo, los picos de DMSO en DMSO- D_6 y el pico de agua se muestran en nuestras listas de picos de RMN de ^1H y por lo general presentan en promedio una intensidad elevada.

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

Tales estereoisómeros y/o impurezas pueden ser típicas para el proceso de preparación específico. Por lo tanto, sus picos pueden ayudar a reconocer la reproducción de nuestro proceso de preparación mediante las impresiones de productos secundarios "side-products-fingerprints".

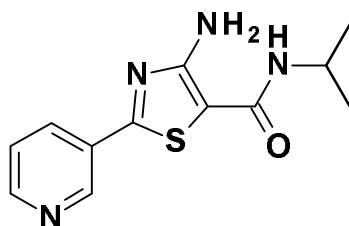
Un especialista que calcula los picos de los compuesto blanco por medio de procedimientos conocidos (MestreC, simulación ACD, pero también con valores esperados evaluados de manera empírica) puede aislar los picos de los compuestos blanco según necesidad usando filtros de intensidad adicionales. Esta aislación sería similar a la elección de picos relevantes en la interpretación clásica de RMN de ^1H .

Otros detalles de listas de picos de RMN de ^1H pueden encontrarse en la base de datos Research Disclosure Database Number 564025.

Síntesis de compuestos de la fórmula (I) según el procedimiento A

Ejemplo de preparación 1: 6-isopropil-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-d]-pirimidin-7(6H)-ona (1)

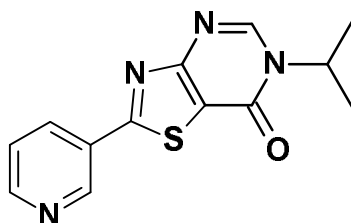
Paso 1: 4-Amino-N-isopropil-2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxamida (II-1)



Bajo argón se adicionó lentamente gota a gota a 356 mg (6,02 mmol) de isopropilamina en 1,2-dicloroetano 3 ml una solución 2 M de trietilaluminio (6,02 mmol) en tolueno y se agitó 30 min a temperatura ambiente. A continuación se adicionaron 500 mg (2,00 mmol) de 4-amino-2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxilato de etilo (III-1) y la mezcla de reacción después se calentó durante la noche bajo reflujo. Después del enfriado, la mezcla de reacción se adicionó cuidadosamente a una solución al 10 % de tartrato de potasio-sodio (aprox. 100 ml). La mezcla se extrajo tres veces con diclorometano, las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio, se filtraron y se concentraron. El residuo se mezcló con poca cantidad de acetonitrilo y se formó una suspensión. El residuo se separó mediante filtración por succión y se secó al vacío. Se obtuvieron 340 mg (99 % de pureza, 63,9 % del teórico) del compuesto del título (II-1).

RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9,046(2,3); 9,042(2,4); 8,704(1,8); 8,700(2,0); 8,692(2,0); 8,688(1,9); 8,218(1,0); 8,214(1,4); 8,208(1,0); 8,198(1,2); 8,194(1,5); 8,193(1,5); 8,188(1,1); 7,639(1,3); 7,620(1,3); 7,581(1,4); 7,579(1,4); 7,569(1,4); 7,567(1,4); 7,561(1,4); 7,559(1,3); 7,549(1,3); 7,547(1,3); 6,982(4,0); 4,077(0,7); 4,061(1,0); 4,042(1,0); 4,025(0,7); 3,904(0,9); 3,338(73,4); 2,526(0,6); 2,513(11,6); 2,509(23,1); 2,504(30,0); 2,500(21,6); 2,495(10,5); 1,143(16,0); 1,126(15,8); 0,000(7,2); -0,008(0,3)

Paso 2: 6-isopropil-2-(piridin-3-il) [1,3]tiazolo[4,5-d]pirimidin-7(6H)-ona (1)

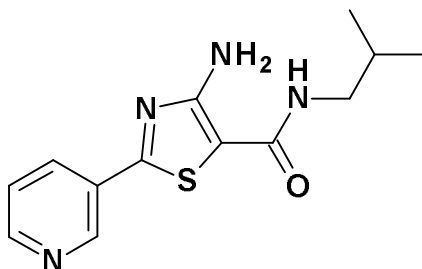


Se dispusieron 300 mg (1,14 mmol) de 4-amino-N-isopropil-2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxamida (II-1) en *N,N*-dimetilacetamida. Se adicionaron 98 mg (0,57 mmol) de ácido *p*-toluensulfónico y 339 mg (2,29 mmol) de trietiléster del ácido ortofórmico y la mezcla de reacción se calentó durante 1 h en un microondas CEM Discover a 200 Vatios a 130 °C. La mezcla de reacción enfriada se concentró al vacío, el residuo se mezcló con acetonitrilo mediante agitación y el sólido se eliminó por filtración. El filtrado a continuación se concentró y se purificó mediante MPLC en una columna RP(C-18) por cromatografía. Se obtuvieron 25 mg (96 % de pureza, 7,6 % del teórico) del compuesto del título (1).

RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9,307(2,2); 9,302(2,2); 8,814(1,6); 8,811(1,7); 8,802(1,7); 8,799(1,7); 8,734(6,2); 8,516(1,0); 8,512(1,3); 8,506(1,0); 8,496(1,1); 8,491(1,4); 8,486(1,0); 8,144(3,9); 7,659(1,3); 7,647(1,3); 7,641(1,3); 7,639(1,3); 7,628(1,2); 7,627(1,2); 5,054(0,4); 5,037(1,1); 5,019(1,5); 5,002(1,1); 4,985(0,4); 3,337(1,4); 2,526(0,8); 2,513(17,3); 2,508(34,7); 2,504(45,2); 2,499(32,4); 2,495(15,5); 1,483(16,0); 1,466(15,8); 1,142(0,4); 1,126(0,4); 0,000(8,5)

Ejemplo de preparación 2: 6-isobutil-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-d]pirimidin-7(6H)-ona (3)

Paso 1: 4-Amino-N-isobutil-2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxamida (II-3)



Se dispusieron 1,75 g (7,02 mmol) de 4-amino-2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxilato de etilo (III-1) en etanol y se mezclaron con 1,97 g de hidróxido de potasio (35,10 mmol) disuelto en etanol. La mezcla de reacción se agitó durante la noche a 50 °C y a continuación se concentró a sequedad. El residuo se diluyó en poca cantidad de agua y se hizo precipitar el producto con solución acuosa al 10 % de ácido cítrico. La proporción insoluble se separó mediante filtración por succión y se secó bien al vacío. El ácido 4-amino-2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxílico así obtenido (1,32 g, 100 % de pureza, 85,0 % del teórico) se continuó transformando directamente.

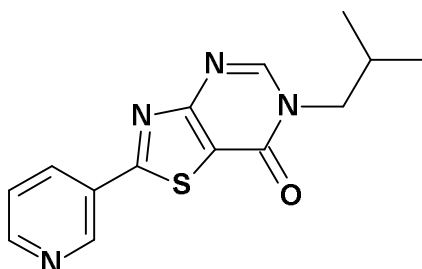
RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9,112(1,2); 9,108(1,4); 9,099(0,7); 9,086(15,3); 9,085(15,4); 9,080(16,0); 9,018(0,3); 9,012(0,4); 8,730(1,2); 8,727(1,2); 8,719(1,4); 8,715(1,4); 8,701(13,6); 8,697(14,4); 8,689(14,5); 8,685(14,2); 8,607(0,4); 8,603(0,4); 8,595(0,4); 8,297(0,7); 8,292(0,9); 8,287(0,8); 8,277(0,9); 8,271(1,2); 8,262(8,1); 8,258(10,9); 8,253(8,0); 8,242(8,7); 8,238(11,2); 8,233(8,1); 7,580(1,0); 7,566(1,5); 7,560(11,6); 7,558(11,0); 7,548(11,5); 7,546(10,9); 7,540(10,5); 7,538(9,8); 7,528(10,0); 7,526(9,3); 7,506(0,4); 7,494(0,4); 7,486(0,4); 7,473(0,4); 7,133(1,1); 6,917(1,6); 6,028(1,3); 4,271(0,9); 4,253(2,8); 4,235(2,8); 4,218(0,9); 3,578(0,4); 3,545(0,5);

3,466(1,1); 3,448(1,5); 3,431(1,8); 3,324(25,6); 3,120(0,5); 3,092(0,4); 2,951(0,3); 2,675(2,3); 2,671(3,1); 2,667(2,3); 2,555(5,6); 2,541(2,3); 2,524(9,2); 2,517(30,9); 2,511(156,3); 2,506(313,9); 2,502(413,1); 2,497(295,7); 2,493(141,3); 2,481(18,0); 2,443(5,2); 2,338(1,1); 2,333(2,2); 2,329(3,0); 2,324(2,2); 2,290(0,4); 1,909(0,8); 1,295(3,0); 1,277(6,4); 1,260(3,0); 1,073(0,8); 1,055(1,5); 1,038(0,7); 0,146(1,3); 0,008(11,0); 0,000(302,5); -0,009(11,0); -0,150(1,3)

5 A continuación se dispusieron 100 mg (0,45 mmol) de este ácido 4-amino-2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxílico en tolueno. Se adicionaron 376 mg (3,16 mmol) de cloruro de tionilo y la mezcla de reacción se calentaron 3 horas bajo reflujo. Después del enfriado se concentró el preparado al vacío y se secó al alto vacío. El cloruro ácido así obtenido se recogió en acetonitrilo y se adicionó a una solución de 88 mg (0,68 mmol) de N,N-diisopropiletilamina y 36,36 mg (0,50 mmol) de isobutilamina en acetonitrilo. La mezcla de reacción se agitó a continuación durante la noche a temperatura ambiente. Después de eliminar el disolvente por evaporación se recoge el residuo en acetato de etilo y solución saturada de cloruro de sodio. Se separó la fase orgánica, se secó con sulfato de sodio y se concentró por evaporación. Se obtuvieron así 71 mg (84 % de pureza, 47,7 % del teórico) del compuesto del título (II-3), que se usó directamente en el Paso 2, para obtener (3).

CL-EM: masa resultante [m/z] = 276,10

15 **Paso 2: 6-isobutil-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-d]pirimidin-7(6H)-ona (3)**

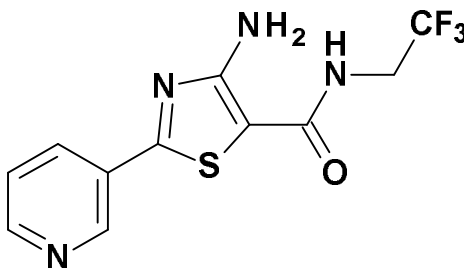


20 Se dispusieron 71 mg (0,22 mmol; al 84 %) de 4-amino-N-isobutil-2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxamida (II-3) en 266 mg (3,05 mmol) de N,N-dimetilacetamida. Se adicionaron 2 mg (0,013 mmol) de ácido p-toluensulfónico y 57 mg (0,39 mmol) de trietiléster del ácido ortofórmico y la mezcla de reacción se calentó 10 min en un microondas CEM Discover a 200 Vatios a 120 °C. Se concentró la mezcla de reacción enfriada y se purificó por cromatografía. Se obtuvieron 24 mg (90 % de pureza, 34,3 % del teórico) del compuesto del título (3).

25 **RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO):** δ = 9,302(2,1); 9,297(2,1); 9,049(0,4); 9,044(0,4); 8,815(1,8); 8,811(1,9); 8,803(1,8); 8,799(1,8); 8,703(0,3); 8,699(0,4); 8,691(0,4); 8,687(0,4); 8,634(6,2); 8,510(1,1); 8,506(1,4); 8,500(1,1); 8,490(1,1); 8,486(1,4); 8,484(1,4); 8,480(1,1); 7,662(1,3); 7,660(1,4); 7,650(1,3); 7,648(1,3); 7,642(1,3); 7,640(1,3); 7,630(1,2); 7,628(1,3); 6,974(0,7); 3,895(4,7); 3,876(4,7); 3,323(24,1); 3,022(0,4); 3,005(0,6); 2,990(0,4); 2,512(10,6); 2,508(21,2); 2,503(27,9); 2,499(20,3); 2,495(10,0); 2,162(0,4); 2,145(0,8); 2,128(1,0); 2,111(0,9); 2,093(0,4); 0,916(16,0); 0,899(15,5); 0,873(3,2); 0,856(3,1); 0,008(0,3); 0,000(8,4); -0,008(0,3)

Ejemplo de preparación 3: 2-(Piridin-3-il)-6-(2,2,2-trifluoroetil)[1,3]-tiazolo-[4,5-d]pirimidin-7(6H)-ona (5)

Paso 1: 4-Amino-2-(piridin-3-il)-N-(2,2,2-trifluoroetil)-1,3-tiazol-5-carboxamida (II-5)

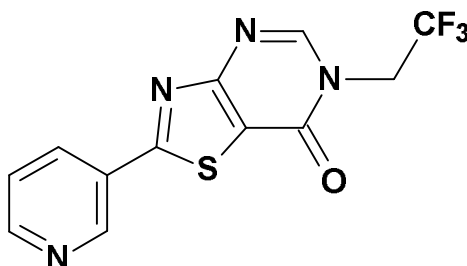


30 Bajo argón se adicionó lentamente gota a gota a 596 mg (6,02 mmol) 2,2,2-trifluoroetilamina en 1,2-dicloroetano 3 ml una solución 2 M de trietilaluminio (6,02 mmol) en tolueno y se agitó 30 min a temperatura ambiente. A continuación se adicionaron 500 mg (2,0 mmol) de 4-amino-2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxilato de etilo (III-1) y la mezcla de reacción después se calentó durante la noche bajo reflujo. Después del enfriado, la mezcla de reacción se adicionó cuidadosamente a una solución al 10 % de tartrato de potasio-sodio (aprox. 100 ml). La mezcla se hizo precipitar tres veces con cloruro de metileno, se separó la fase orgánica, se secó sobre sulfato de sodio, se filtró y se concentró. El residuo se mezcló con poca cantidad de acetonitrilo y se formó una suspensión. El residuo se separó mediante filtración por succión y se secó al vacío. Se obtuvieron 299 mg (91 % de pureza, 44,8 % del teórico) del compuesto del título (II-5).

35

RMN de ^1H (400,0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9,114(0,8); 9,110(0,8); 9,074(9,3); 9,070(9,3); 8,728(7,9); 8,724(7,8); 8,716(8,3); 8,712(7,5); 8,476(3,0); 8,461(6,3); 8,446(3,0); 8,318(0,4); 8,298(0,4); 8,293(0,5); 8,288(0,4); 8,277(0,4); 8,272(0,5); 8,268(0,5); 8,249(4,1); 8,245(5,6); 8,240(4,0); 8,229(4,5); 8,225(5,8); 8,224(5,8); 8,220(4,1); 7,594(5,4); 7,593(5,3); 7,582(5,6); 7,580(5,7); 7,574(5,3); 7,573(5,1); 7,562(5,2); 7,560(5,2); 7,548(0,5); 7,164(16,0); 5,759(1,8); 4,272(0,5); 4,254(1,5); 4,236(1,5); 4,218(0,5); 4,040(1,7); 4,016(5,6); 4,000(5,7); 3,992(6,1); 3,976(5,5); 3,968(2,4); 3,952(1,9); 3,905(2,0); 3,332(49,0); 2,678(0,5); 2,673(0,6); 2,669(0,4); 2,509(72,6); 2,504(92,8); 2,500(67,2); 2,335(0,5); 2,331(0,6); 2,327(0,4); 1,296(1,6); 1,279(3,2); 1,261(1,5); 0,008(2,8); 0,000(58,8); -0,008(2,6)

Paso 2: 2-(Piridin-3-il)-6-(2,2,2-trifluoroetil)[1,3]tiazolo[4,5-d]pirimidin-7(6H)-ona (5)

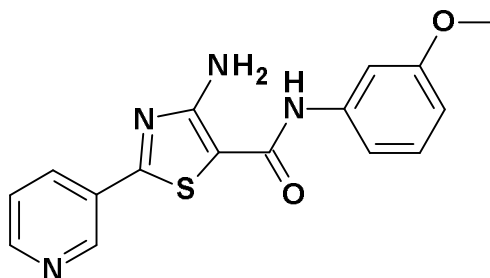


Se dispusieron 240 mg (0,79 mmol) de 4-amino-2-(piridin-3-il)-N-(2,2,2-trifluoroetil)-1,3-tiazol-5-carboxamida (II-5) en 3 ml de *N,N*-dimetilacetamida. Se adicionaron 68 mg (0,40 mmol) de ácido *p*-toluensulfónico y 235 mg (1,59 mmol) de trietiléster del ácido ortofórmico y la mezcla de reacción se calentó durante 1 h en un microondas CEM Discover a 200 Vatios a 130 °C. La mezcla de reacción enfriada se concentró al vacío, el residuo se mezcló con acetonitrilo y se separó el sólido por filtración. Este a continuación se purificó mediante MPLC en una columna RP(C-18). Se obtuvieron 69 mg (92 % de pureza, 25,6 % del teórico) del compuesto del título (5).

RMN de ^1H (400,0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9,320(8,2); 9,315(8,2); 9,302(0,4); 8,829(6,4); 8,825(6,8); 8,817(6,9); 8,813(6,6); 8,698(16,0); 8,530(4,0); 8,526(5,1); 8,520(3,9); 8,510(4,3); 8,506(5,3); 8,505(5,3); 8,500(4,0); 8,318(0,4); 7,672(4,8); 7,671(4,8); 7,660(4,8); 7,659(4,7); 7,652(4,8); 7,651(4,6); 7,640(4,5); 7,639(4,4); 5,143(0,3); 5,121(0,4); 5,089(3,5); 5,067(11,4); 5,044(11,9); 5,021(4,0); 3,363(0,6); 3,336(289,1); 2,720(1,5); 2,678(0,6); 2,674(0,8); 2,669(0,6); 2,527(2,1); 2,513(48,7); 2,509(96,7); 2,505(125,4); 2,500(89,6); 2,496(42,7); 2,336(0,6); 2,331(0,8); 2,327(0,6); 2,077(0,4); 0,008(1,2); 0,000(30,0); -0,008(1,1)

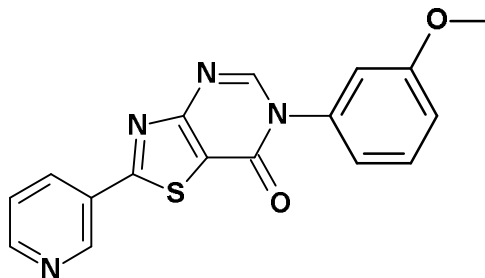
Ejemplo de preparación 4: 6-(3-metoxifenil)-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-d]pirimidin-7(6H)-ona (10)

Paso 1: 4-Amino-N-(3-metoxifenil)-2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxamida (II-10)



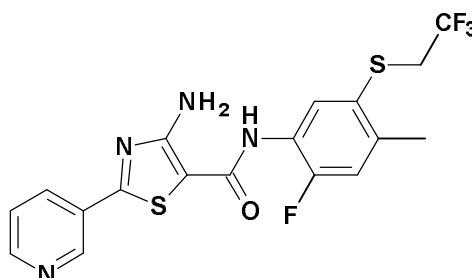
Bajo argón se adicionó lentamente gota a gota a 445 mg (3,61 mmol) de 3-metoxi-anilina en 1,2-dicloroetano 1,8 ml de una solución 2 M de trietilaluminio (3,61 mmol) en tolueno y se agitó 1 h a temperatura ambiente. A continuación se adicionaron 300 mg (1,2 mmol) de 4-amino-2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxilato de etilo (III-1) y la mezcla de reacción después se calentó durante la noche bajo reflujo. Después del enfriado, la mezcla de reacción se adicionó cuidadosamente a una solución al 10 % de tartrato de potasio-sodio (aprox. 120 ml). La mezcla se extrajo tres veces con cloruro de metileno, las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio, se filtraron y se concentraron. El residuo se mezcló con poca cantidad de acetonitrilo y se formó una suspensión. El residuo se separó mediante filtración por succión y se secó al vacío. Se obtuvieron 120 mg (96 % de pureza, 29,3 % del teórico) del compuesto del título (II-10).

RMN de ^1H (400,0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9,618(2,9); 9,113(0,4); 9,107(0,5); 9,099(2,3); 9,093(2,3); 8,736(1,5); 8,732(1,7); 8,724(1,7); 8,720(1,7); 8,271(1,0); 8,266(1,5); 8,261(0,9); 8,251(0,8); 8,246(1,4); 8,241(0,9); 7,607(1,3); 7,595(1,3); 7,587(1,3); 7,575(1,4); 7,361(1,4); 7,355(2,5); 7,350(1,7); 7,303(1,0); 7,282(1,7); 7,238(3,5); 7,232(3,1); 7,211(2,7); 7,191(1,2); 6,658(1,2); 6,652(1,2); 6,638(1,1); 6,631(1,1); 4,253(0,7); 4,235(0,7); 3,747(16,0); 3,330(15,3); 2,525(0,6); 2,507(25,7); 2,503(34,3); 2,499(26,3); 2,076(0,7); 1,295(0,8); 1,278(1,5); 1,260(0,7); 0,008(1,5); 0,007(1,5); 0,000(44,0); -0,008(1,9)

Paso 2: 6-(3-metoxifenil)-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-d]pirimidin-7(6H)-ona (10)

Se dispusieron 100 mg (0,29 mmol) de 4-amino-N-(3-metoxifenil)-2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxamida (II-10) en *N,N*-dimetilacetamida. Se adicionaron 25 mg (0,15 mmol) de ácido p-toluensulfónico y 87 mg (0,59 mmol) de trietiléster del ácido ortofórmico y la mezcla de reacción se calentó durante 1 h en un microondas CEM Discover a 200 Vatios a 130 °C. La mezcla de reacción enfriada se diluyó con agua y se extrajo varias veces con diclorometano. Las fases orgánicas combinadas se secaron con sulfato de sodio, se filtraron y se concentraron por evaporación. El residuo a continuación se purificó cromatográficamente por MPLC en columna. Se obtuvieron 20 mg (100 % de pureza, 20,2 % del teórico) del compuesto del título (10).

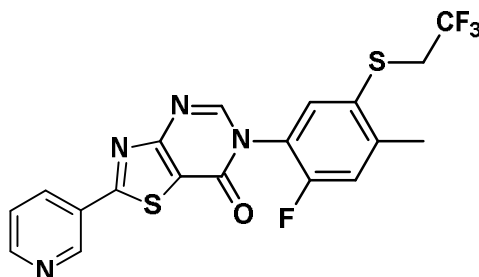
RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9,345(0,5); 9,340(0,5); 8,833(0,4); 8,829(0,4); 8,821(0,4); 8,817(0,4); 8,620(1,4); 7,495(0,6); 7,475(0,4); 7,217(0,3); 7,211(0,6); 7,206(0,4); 7,155(0,4); 7,134(0,5); 3,818(3,8); 3,328(15,7); 2,944(16,0); 2,784(13,5); 2,507(16,3); 2,502(21,3); 2,498(16,0); 1,957(14,1); 0,008(1,0); 0,000(24,1); -0,008(1,1)

Ejemplo de preparación 5: 6-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)-sulfinil]fenil}-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-d]pirimidin-7(6H)-ona (22)**Paso 1: 4-Amino-N-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]fenil}-2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxamida (II-21)**

Bajo argón se adicionó lentamente gota a gota a 720 mg (3,01 mmol) 2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]anilina en 1,2-dicloroetano, 1,5 ml de una solución 2 M de trietilaluminio (3,01 mmol) en tolueno y se agitó 30 min a temperatura ambiente. A continuación se adicionaron 250 mg (1,00 mmol) de 4-amino-2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxilato de etilo (III-1) y la mezcla de reacción después se calentó durante la noche bajo reflujo. Después del enfriado, la mezcla de reacción se adicionó cuidadosamente a una solución al 10 % de tartrato de potasio-sodio (aprox. 200 ml). La mezcla se extrajo tres veces con cloruro de metileno, las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio, se filtraron y se concentraron. El residuo se mezcló con poca cantidad de acetonitrilo y se formó una suspensión. El residuo se separó mediante filtración por succión y se secó al vacío. Se obtuvieron 144 mg (92 % de pureza, 29,9 % del teórico) del compuesto del título (II-21).

RMN de ¹H (601,6 MHz, d₆-DMSO): δ = 9,566(4,6); 9,110(0,4); 9,100(3,4); 9,096(3,4); 8,737(2,4); 8,734(2,6); 8,729(2,8); 8,726(2,8); 8,270(1,3); 8,267(1,9); 8,264(1,3); 8,257(1,3); 8,254(2,0); 8,251(1,3); 7,696(2,8); 7,683(2,8); 7,601(1,7); 7,594(1,7); 7,588(1,7); 7,580(1,6); 7,268(2,5); 7,250(2,5); 7,209(5,5); 4,250(0,6); 4,238(0,6); 3,891(1,1); 3,874(3,4); 3,857(3,5); 3,840(1,2); 3,343(61,4); 2,616(0,4); 2,507(51,6); 2,504(70,6); 2,501(53,2); 2,406(16,0); 1,290(0,6); 1,278(1,2); 1,266(0,6); 0,005(1,5); 0,000(41,7)

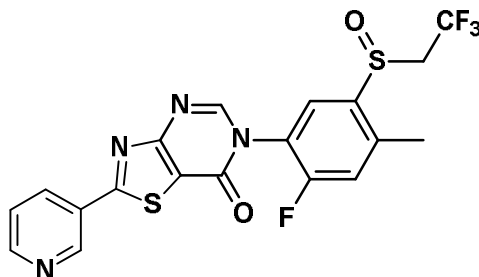
Paso 2: 6-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]fenil}-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-d]pirimidin-7(6H)-ona (21)



Se dispusieron 120 mg (0,27 mmol) de 4-amino-N-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]fenil}-2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxamida (II-21) en *N,N*-dimetilacetamida. Se adicionaron 23 mg (0,14 mmol) de ácido *p*-toluensulfónico y 80 mg (0,54 mmol) de trietiléster del ácido ortofórmico y la mezcla de reacción se calentó durante 1 h en un microondas CEM Discover a 200 Vatios a 130 °C. La mezcla de reacción enfriada se concentró al vacío, el residuo se mezcló con acetonitrilo y el producto se separó por filtración en forma sólida. El filtrado a continuación se concentró y se purificó cromatográficamente mediante MPLC en una columna RP(C-18). Se obtuvieron en total 43 mg (98 % de pureza, 34,3 % del teórico) del compuesto del título (21).

RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9,350(3,0); 9,346(3,1); 9,344(3,0); 8,839(2,4); 8,836(2,6); 8,827(2,6); 8,824(2,6); 8,679(8,7); 8,561(1,4); 8,557(1,8); 8,551(1,4); 8,541(1,5); 8,537(1,9); 8,535(1,9); 8,531(1,5); 7,939(3,1); 7,921(3,1); 7,684(1,8); 7,683(1,7); 7,672(1,7); 7,671(1,7); 7,664(1,8); 7,663(1,7); 7,652(1,7); 7,651(1,7); 7,518(2,7); 7,491(2,6); 4,062(1,2); 4,037(3,9); 4,011(4,0); 3,985(1,4); 3,330(57,6); 2,945(1,0); 2,785(0,7); 2,672(0,4); 2,526(1,0); 2,512(19,8); 2,508(40,6); 2,503(53,8); 2,499(39,4); 2,494(19,5); 2,471(16,0); 2,330(0,3); 2,076(10,9); 1,958(0,8); 0,008(1,0); 0,000(30,1); -0,009(1,2)

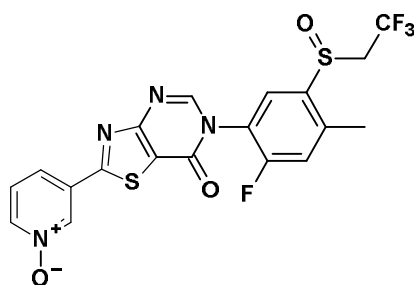
Paso 3 - Producto principal: 6-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)-sulfinil]fenil}-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-d]pirimidin-7(6H)-ona (22)



A una solución de 32,0 mg (0,07 mmol) de 6-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoro-etil)sulfinil]fenil}-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-d]pirimidin-7(6H)-ona (21) en 3 ml de diclorometano se adicionaron a 0 °C 19,18 mg (al 70 %, 0,08 mmol) de ácido meta-cloroperbenzoico. La mezcla de reacción se agitó 2 horas a temperatura ambiente y después se diluyó con solución saturada de carbonato de sodio. Al cabo de 20 minutos se separaron las fases, la fase acuosa se extrajo dos veces más con diclorometano y las fases orgánicas combinadas se secaron con sulfato de sodio. Tras la evaporación del disolvente, el residuo a continuación se purificó cromatográficamente mediante MPLC en una columna RP(C-18). Se obtuvieron 10 mg (95 % de pureza, 28,1 % del teórico) del compuesto del título (22).

RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9,761(0,5); 9,353(6,6); 9,347(6,9); 9,102(0,4); 8,836(5,2); 8,828(4,9); 8,824(5,2); 8,738(0,5); 8,723(15,6); 8,557(4,0); 8,553(2,9); 8,543(2,8); 8,537(4,3); 8,533(3,1); 8,315(2,5); 8,195(6,5); 8,176(6,5); 8,039(0,4); 7,951(2,4); 7,685(3,8); 7,673(3,8); 7,665(4,0); 7,653(3,8); 7,635(5,0); 7,608(5,1); 7,366(0,4); 7,238(0,6); 5,755(1,0); 4,293(0,9); 4,271(1,2); 4,263(1,3); 4,233(1,1); 4,182(0,4); 4,124(1,0); 4,100(1,2); 3,505(1,6); 3,322(748,9); 2,944(1,9); 2,891(16,0); 2,784(1,6); 2,731(14,3); 2,716(0,5); 2,670(6,0); 2,666(4,8); 2,505(695,9); 2,501(960,0); 2,497(767,5); 2,395(0,8); 2,373(2,4); 2,328(6,2); 2,324(5,1); 2,283(0,4); 1,957(1,9); 1,303(0,3); 1,284(0,6); 1,233(2,0); 0,854(0,4); 0,146(3,0); 0,008(21,8); 0,000(638,0); -0,078(0,4); -0,150(3,2)

Paso 3 - producto secundario: 6-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)-sulfinil]fenil}-2-(1-oxidopiridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-d]pirimidin-7(6H)-ona (23)

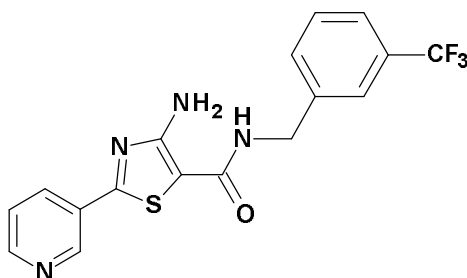


Durante la preparación del compuesto (23) según el “Paso 3 – Producto principal” se aisló en forma simultánea el compuesto (23) como producto secundario. Se obtuvieron 11 mg (94 % de pureza, 30,5 % del teórico) del compuesto del título (23).

- 5 **RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO):** δ = 8,928(9,2); 8,734(16,0); 8,463(5,2); 8,446(5,3); 8,315(0,9); 8,196(7,0); 8,177(7,1); 8,082(5,1); 8,061(5,7); 7,668(4,5); 7,649(5,9); 7,633(8,7); 7,608(5,6); 7,573(0,4); 7,251(0,4); 4,265(1,6); 4,236(1,3); 4,117(1,2); 4,106(1,2); 4,092(1,4); 3,322(182,5); 2,671(2,1); 2,502(339,3); 2,498(298,4); 2,402(0,7); 2,373(1,6); 2,329(2,4); 0,146(1,6); 0,000(312,8); -0,083(0,4); -0,150(1,7)

Ejemplo de preparación 6: 2-(Piridin-3-il)-6-[3-(trifluorometil)encil]-[1,3]-tiazolo[4,5-d]pirimidin-7(6H)-ona (28)

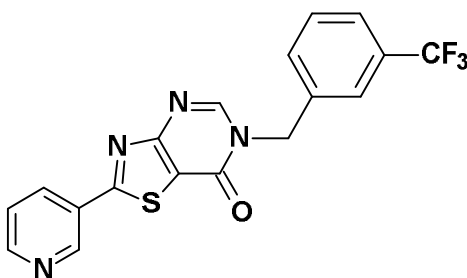
- 10 **Paso 1: 4-Amino-2-(piridin-3-il)-N-[3-(trifluorometil)encil]-1,3-tiazol-5-carboxamida (II-28)**



Bajo argón se adicionó lentamente gota a gota a 843 mg (4,81 mmol) de 3-(trifluorometil)-encilamina en 20 ml 1,2-dicloroetano, 2,4 ml una solución 2 M de trietilaluminio (4,81 mmol) en tolueno y se agitó 30 min a temperatura ambiente. A continuación se adicionaron 400 mg (1,61 mmol) de 4-amino-2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxilato de etilo (III-1) y la mezcla de reacción después se calentó durante la noche bajo reflujo. Después del enfriado, la mezcla de reacción se adicionó cuidadosamente a una solución al 10 % de tartrato de potasio-sodio (aprox. 120 ml). La mezcla se extrajo tres veces con diclorometano, las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio, se filtraron y se concentraron. El residuo se agitó con poca cantidad de n-pentano hasta formar una suspensión. El residuo se separó mediante filtración por succión y se secó al vacío. Se obtuvieron 425 mg (100 % de pureza, 70,0 % del teórico) del compuesto del título (II-28).

- 15 **RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO):** δ = 9,063(9,1); 9,058(9,1); 8,714(6,6); 8,710(7,3); 8,702(7,1); 8,698(7,3); 8,543(2,9); 8,528(6,3); 8,514(3,0); 8,317(0,6); 8,237(3,6); 8,232(5,3); 8,227(3,9); 8,217(4,0); 8,212(5,8); 8,207(4,1); 7,656(9,5); 7,633(3,5); 7,615(8,3); 7,609(10,3); 7,591(9,1); 7,583(6,9); 7,572(9,3); 7,563(5,7); 7,552(5,8); 7,161(0,4); 7,099(0,5); 7,050(16,0); 6,941(0,4); 5,757(3,2); 4,483(12,6); 4,469(12,6); 3,903(1,3); 3,800(0,5); 3,327(183,9); 2,676(1,2); 2,672(1,8); 2,667(1,3); 2,525(4,0); 2,511(99,6); 2,507(202,4); 2,503(270,1); 2,498(201,5); 2,333(1,3); 2,329(1,8); 2,325(1,4); 1,989(0,6); 0,146(1,4); 0,008(9,9); 0,000(288,4); -0,008(11,9); -0,150(1,4)

Paso 2: 2-(Piridin-3-il)-6-[3-(trifluorometil)encil][1,3]tiazolo[4,5-d]pirimidin-7(6H)-ona (28)



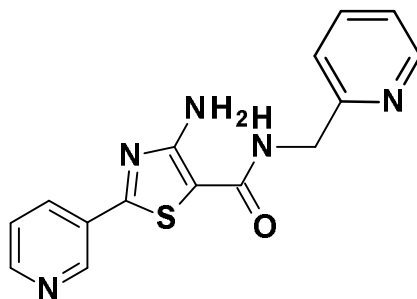
Se dispusieron 110 mg (0,29 mmol) de 4-amino-2-(piridin-3-il)-N-[3-(trifluorometil)encil]-1,3-tiazol-5-carboxamida (II-

28) en *N,N*-dimetilacetamida. Se adicionaron 25 mg (0,14 mmol) de ácido *p*-toluensulfónico y 129 mg (0,87 mmol) de trietiléster del ácido ortofórmico y la mezcla de reacción se calentó durante 1 h en un microondas CEM Discover a 200 Vatios a 130 °C. La mezcla de reacción enfriada se diluyó con solución saturada de hidrocbonato de sodio y se extrajo varias veces con diclorometano. Las fases orgánicas combinadas se secaron con sulfato de magnesio, se filtraron y se concentraron por evaporación. El residuo a continuación se purificó mediante MPLC con eluyente ciclohexano/acetato de etilo. Después de evaporar el disolvente, el producto se trituró con pentano/acetato de etilo y se sonificó. Los cristales así obtenidos se separaron mediante filtración por succión. Se obtuvieron 38 mg (98,3 % de pureza, 33,1 % del teórico) del compuesto del título (28).

RMN de ¹H (600,1 MHz, CD₃CN): δ = 9,2734(3,7); 9,2728(3,7); 9,270(3,8); 8,751(2,8); 8,748(2,9); 8,743(2,9); 8,740(2,8); 8,469(9,8); 8,403(1,8); 8,400(2,4); 8,399(2,3); 8,396(1,7); 8,389(1,9); 8,387(2,4); 8,386(2,3); 8,383(1,7); 7,744(3,9); 7,662(2,1); 7,650(3,1); 7,641(2,5); 7,576(2,2); 7,563(3,2); 7,550(1,3); 7,534(2,3); 7,533(2,2); 7,526(2,3); 7,525(2,2); 7,521(2,3); 7,520(2,1); 7,513(2,2); 7,512(2,0); 5,293(16,0); 2,957(13,9); 2,827(11,1); 2,154(11,6); 1,972(12,0); 1,967(0,5); 1,959(0,6); 1,955(0,8); 1,951(5,6); 1,947(10,0); 1,943(14,5); 1,938(9,7); 1,934(4,8); 0,000(6,8)

Ejemplo de preparación 7: 2-(Piridin-3-il)-6-(piridin-2-ilmetil)[1,3]-tiazolo-[4,5-d]pirimidin-7(6H)-ona (34)

Paso 1: 4-Amino-2-(piridin-3-il)-N-(piridin-2-ilmetil)-1,3-tiazol-5-carboxamida (II-34)



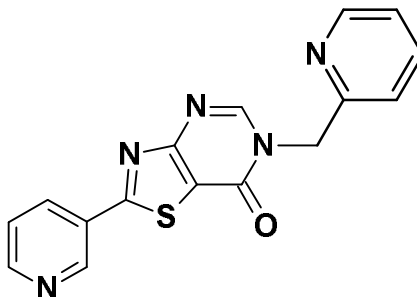
Se dispusieron 1 g (4,0 mmol) de 4-amino-2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxilato de etilo (III-1) en etanol y se mezclaron con 2,25 g hidróxido de potasio (40 mmol) disuelto en etanol. La mezcla de reacción se agitó 4 h a 50 °C y a continuación se concentró a sequedad. El residuo se diluyó en poca cantidad de agua y el producto se hizo precipitar con solución acuosa al 10 % de ácido cítrico. La proporción insoluble se separó mediante filtración por succión y se secó bien al vacío. El así obtenido ácido 4-amino-2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxílico (583 mg, 100 % de pureza, 65,7 % del teórico) se continuó transformando directamente.

CL-EM: masa resultante [m/z] = 221,03

Se dispusieron 148 mg (0,67 mmol) de ácido 4-amino-2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxílico y 237 mg (0,74 mmol) de tetrafluoroborato de O-(1*H*-benzotriazol-1-il)-*N,N,N',N'*-tetrametiluronio (TBTU) en DMF y se agitaron 10 minutos. A continuación se adicionaron 73 mg (0,67 mmol) de 1-(piridin-2-il)-metanamina así como 130 mg (1 mmol) de *N,N*-diisopropiletilamina disuelta en dimetilformamida. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante la noche y posteriormente se concentró por evaporación al vacío. La posterior purificación del residuo se realizó después por cromatografía en columna mediante MPLC. Se obtuvieron 192 mg (43,0 % de pureza, 39,5 % del teórico) del compuesto del título (II-34).

CL-EM: masa resultante [m/z] = 311,08

Paso 2: 2-(Piridin-3-il)-6-(piridin-2-ilmetil)[1,3]tiazolo[4,5-d]pirimidin-7(6H)-ona (34)



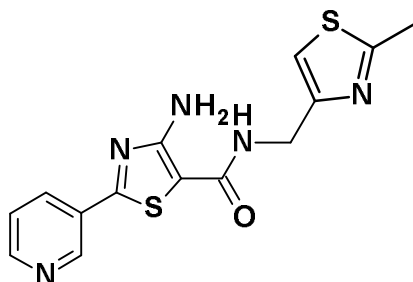
Se dispusieron 96 mg (0,31 mmol) de 4-amino-2-(piridin-3-il)-N-(piridin-2-ilmetil)-1,3-tiazol-5-carboxamida (II-34) en 1,1 g de *N,N*-dimetilacetamida. Se adicionaron 2,4 mg (0,015 mmol) de ácido *p*-toluensulfónico y 69 mg (0,46 mmol) de trietiléster del ácido ortofórmico y la mezcla de reacción se calentó 10 min en un microondas CEM Discover a 200 Vatios a 120 °C. La mezcla de reacción enfriada se diluyó con agua y se extrajo varias veces con acetato de etilo. Las

fases orgánicas combinadas se secaron con sulfato de sodio, se filtraron y se concentraron por evaporación. La purificación posterior del residuo se efectuó después mediante MPLC con eluyente diclorometano / metanol (10:1) en el gradiente. Se obtuvieron 9,5 mg (100,0 % de pureza, 9,6 % del teórico) del compuesto del título (34).

5 **RMN de ^1H (400,0 MHz, d_6 -DMSO):** δ = 9,324 (8,2); 9,320 (8,0); 8,828 (5,9); 8,819 (5,7); 8,652 (16,0); 8,533 (4,1); 8,528 (5,4); 8,523 (3,9); 8,513 (4,3); 8,508 (5,6); 8,503 (3,8); 7,673 (4,7); 7,661 (4,8); 7,653 (4,6); 7,641 (4,2); 6,830 (1,0); 6,818 (1,8); 6,805 (0,9); 6,700 (2,0); 6,688 (3,9); 6,676 (2,0); 6,570 (1,0); 6,558 (2,0); 6,546 (1,0); 4,914 (5,2); 4,875 (10,9); 4,837 (5,5); 3,905 (7,6); 3,506 (0,4); 3,338 (626,8); 3,225 (1,1); 3,062 (0,9); 2,677 (2,1); 2,672 (2,7); 2,668 (2,1); 2,508 (339,6); 2,503 (425,1); 2,499 (319,3); 2,334 (1,9); 2,330 (2,5); 2,325 (1,9); 1,298 (0,4); 1,258 (0,5); 1,233 (0,7); 1,145 (0,7); 0,000 (37,7)

10 **Ejemplo de preparación 8: 6-[(2-metil-1,3-tiazol-4-il)metil]-2-(piridin-3-il)-[1,3]tiazolo[4,5-d]pirimidin-7(6H)-ona (38)**

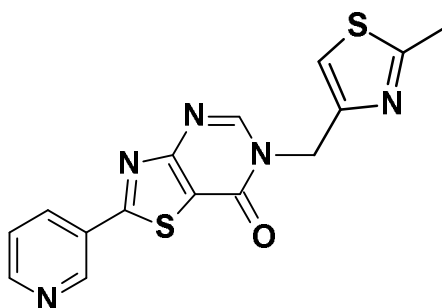
Paso 1: 4-Amino-N-[(2-metil-1,3-tiazol-4-il)metil]-2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxamida (II-38)



15 Bajo argón se adicionó lentamente gota a gota a 193 mg (1,5 mmol) de 1-(2-metil-1,3-tiazol-4-il)metanamina en 12 ml de 1,2-dicloroetano, 0,75 ml de una solución 2 M de trietilaluminio (1,5 mmol) en tolueno y se agitó 30 min a temperatura ambiente. A continuación se adicionaron 250 mg (1,0 mmol) de 4-amino-2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxilato de etilo (III-1) en porciones y la mezcla de reacción después se calentó durante la noche bajo reflujo. Después del enfriado la mezcla de reacción con argón se cargó a una solución al 10 % de tartrato de potasio-sodio (aprox. 120 ml). La mezcla se hizo precipitar tres veces con diclorometano, se separó la fase orgánica, se secó sobre sulfato de sodio, se filtró y se concentró. El residuo se agitó con poca cantidad de n-pentano / acetato de etilo hasta formar una suspensión. El residuo se separó mediante filtración por succión y a continuación se agitó con acetonitrilo. El sólido separado mediante filtración por succión después se secó al vacío. Se obtuvieron 71 mg (96,1 % de pureza, 20,5 % del teórico) del compuesto del título.

25 **RMN de ^1H (400,0 MHz, d_6 -DMSO):** δ = 9,059 (2,1); 9,054 (2,0); 8,711 (1,5); 8,708 (1,6); 8,699 (1,6); 8,695 (1,6); 8,426 (0,7); 8,412 (1,4); 8,398 (0,7); 8,231 (0,8); 8,226 (1,2); 8,221 (0,9); 8,211 (0,9); 8,206 (1,3); 8,201 (0,9); 7,581 (1,2); 7,569 (1,2); 7,561 (1,1); 7,549 (1,1); 7,166 (3,7); 7,035 (3,4); 4,433 (2,9); 4,419 (2,9); 3,904 (1,0); 3,330 (28,0); 2,629 (16,0); 2,507 (25,7); 2,503 (33,6); 2,499 (25,3); 1,278 (0,5); 0,008 (1,1); 0,000 (26,2); -0,008 (1,2)

Paso 2: 6-[(2-metil-1,3-tiazol-4-il)metil]-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-d]pirimidin-7(6H)-ona (38)



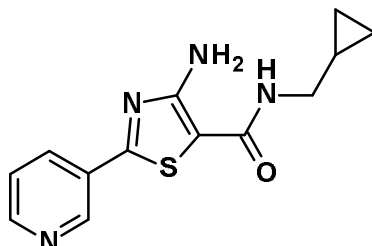
30 Se dispusieron 55 mg (0,17 mmol) de 4-amino-N-[(2-metil-1,3-tiazol-4-il)metil]-2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxamida (II-38) en 0,5 ml de *N,N*-dimetilacetamida. Se adicionaron 14 mg (0,08 mmol) de ácido p-toluensulfónico y 49 mg (0,33 mmol) de trietiléster del ácido ortofórmico y la mezcla de reacción se calentó durante 1 h en un microondas CEM Discover a 200 Vatios a 130 °C. La mezcla de reacción enfriada se diluyó con agua y se extrajo varias veces con diclorometano. Las fases orgánicas combinadas se lavaron con solución saturada de cloruro de sodio, se secaron con sulfato de magnesio, se filtraron y se concentraron por evaporación. Después de evaporar el disolvente, el residuo se trituró con acetonitrilo / acetato de etilo y los cristales así obtenidos se separaron mediante filtración por succión. Se obtuvieron 11 mg (80,0 % de pureza, 15,5 % del teórico) del compuesto del título (38).

35 **RMN de ^1H (400,0 MHz, d_6 -DMSO):** δ = 9,305(2,2); 9,301(2,3); 8,815(1,6); 8,812(1,9); 8,798(6,3); 8,511(1,3); 8,506(1,0); 8,495(1,0); 8,490(1,4); 8,486(1,1); 7,661(1,3); 7,648(1,3); 7,641(1,3); 7,628(1,2); 7,454(4,1); 7,277(0,5);

5,759(0,4); 5,308(7,1); 4,489(0,4); 4,476(0,4); 3,332(61,6); 2,945(0,9); 2,784(0,8); 2,672(0,9); 2,655(1,3); 2,637(2,1); 2,611(16,0); 2,507(95,2); 2,503(124,7); 2,499(102,9); 2,446(0,4); 2,330(0,8); 2,288(0,7); 1,958(0,8); 1,313(0,5); 0,146(0,4); 0,000(71,2); -0,150(0,4)

Ejemplo de preparación 13: 6-(ciclopropilmetil)-2-(piridin-3-il)[1,3]-tiazolo-[4,5-d]pirimidin-7(6H)-ona (39)

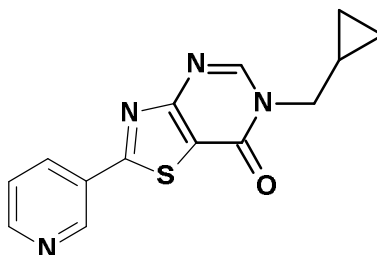
5 Paso 1: 4-Amino-N-(ciclopropilmetil)-2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxamida (II-39)



A 213 mg (3,00 mmol) de 1-ciclopropilmethanamina en 15 ml de 1,2-dicloroetano se adicionaron lentamente gota a gota bajo argón 1,5 ml de una solución 2 M de trietilaluminio (3,01 mmol) en tolueno bajo enfriamiento con hielo y se agitó 60 min a temperatura ambiente. A continuación se adicionaron 373 mg (1,50 mmol) de 4-amino-2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxilato de etilo (III-1) y la mezcla de reacción después se calentó durante la noche bajo reflujo. Después del enfriado, la mezcla de reacción se adicionó cuidadosamente a una solución al 10 % de tartrato de potasio-sodio (aprox. 100 ml). La mezcla se extrajo tres veces con cloruro de metileno, las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio, se filtraron y se concentraron. El residuo se mezcló con poca cantidad de acetonitrilo y se formó una suspensión. El residuo se separó mediante filtración por succión y se secó al vacío. Se obtuvieron 300 mg (100 % de pureza, 73,0 % del teórico) del compuesto del título (II-39).

RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9,056(9,2); 9,052(9,7); 8,710(6,7); 8,707(7,1); 8,699(7,2); 8,695(7,1); 8,229(3,8); 8,226(5,4); 8,220(3,9); 8,210(4,1); 8,205(5,7); 8,200(4,0); 8,025(3,0); 8,012(5,9); 7,998(3,1); 7,579(4,9); 7,567(5,0); 7,559(5,0); 7,547(4,6); 7,027(16,0); 3,454(4,0); 3,437(9,3); 3,422(9,5); 3,404(4,3); 3,312(106,1); 2,671(1,1); 2,573(1,2); 2,556(2,1); 2,545(3,8); 2,527(7,5); 2,506(132,9); 2,502(168,0); 2,498(133,8); 2,470(2,8); 2,452(1,3); 2,329(1,1); 0,000(11,5)

Paso 2: 6-(ciclopropilmetil)-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-d]pirimidin-7(6H)-ona (39)

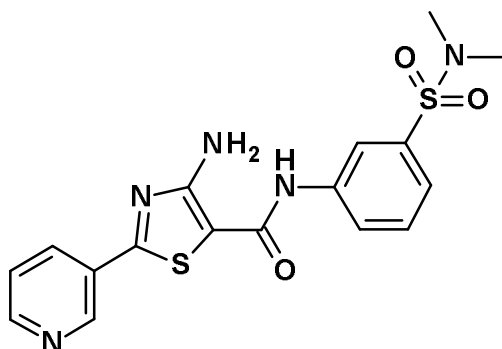


Se dispusieron 100 mg (0,37 mmol) de 4-amino-N-(ciclopropilmetil)-2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxamida (II-39) en 1 ml de *N,N*-dimetilacetamida. Se adicionaron 31 mg (0,18 mmol) de ácido *p*-toluensulfónico y 162 mg (1,09 mmol) de trietiléster del ácido ortofórmico y la mezcla de reacción se calentó durante 1 h en un microondas CEM Discover a 200 Vatios a 130 °C. La mezcla de reacción enfriada se concentró al vacío y el residuo se purificó por cromatografía mediante MPLC. Se obtuvieron en total 2 mg (100 % de pureza, 2,2 % del teórico) del compuesto del título (39).

RMN de ¹H (601,6 MHz, CDCl₃): δ = 9,341(5,1); 9,338(5,0); 8,781(3,5); 8,775(3,6); 8,426(2,9); 8,423(3,9); 8,420(2,8); 8,413(3,1); 8,410(4,0); 8,407(2,8); 8,299(16,0); 7,484(3,2); 7,476(3,3); 7,471(3,3); 7,463(3,1); 7,432(0,6); 7,261(86,9); 7,084(0,5); 5,299(2,5); 3,958(15,5); 3,946(15,6); 3,278(0,4); 3,269(0,5); 3,266(0,4); 3,257(0,4); 2,232(0,4); 2,220(0,6); 2,207(0,4); 1,637(0,4); 1,558(13,5); 1,445(0,4); 1,368(0,5); 1,360(0,9); 1,355(1,3); 1,352(0,9); 1,347(2,2); 1,342(2,1); 1,339(1,8); 1,334(3,5); 1,329(2,0); 1,326(2,4); 1,321(2,7); 1,313(2,0); 1,309(1,8); 1,301(1,4); 1,255(7,8); 0,892(1,0); 0,881(1,8); 0,869(1,1); 0,856(0,4); 0,841(0,4); 0,715(2,2); 0,707(6,7); 0,705(7,1); 0,697(3,5); 0,694(7,0); 0,692(6,7); 0,684(2,5); 0,577(0,4); 0,575(0,4); 0,564(0,4); 0,562(0,4); 0,491(2,4); 0,483(8,8); 0,473(8,4); 0,465(2,0); 0,276(0,4); 0,267(0,5); 0,097(0,4); 0,005(2,9); 0,000(86,6); -0,006(3,2); -0,100(0,4)

Ejemplo de preparación 14: N,N-dimetil-3-[7-oxo-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo-[4,5-d]pirimidin-6(7H)-il]bencensulfonamida (42)

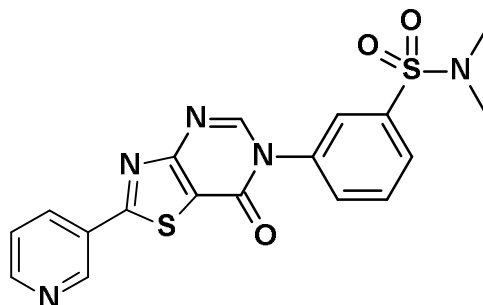
Paso 1: 4-Amino-N-[3-(dimetilsulfamoil)fenil]-2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxamida (II-42)



A 3,6 g (18,1 mmol) de 3-amino-N,N-dimetilbencensulfonamida en 200 ml de 1,2-dicloroetano se adicionaron lentamente gota a gota bajo argón 9,0 ml de una solución 2 M de trietilaluminio (18,1 mmol) en tolueno bajo enfriamiento con hielo y se agitó durante 60 min a temperatura ambiente. A continuación se adicionaron 1,5 g (6,02 mmol) de 4-amino-2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxilato de etilo (III-1) y la mezcla de reacción después se calentó durante la noche bajo reflujo. Después del enfriado, la mezcla de reacción se adicionó cuidadosamente a una solución al 10 % de tartrato de potasio-sodio (aprox. 250 ml). La mezcla se extrajo tres veces con cloruro de metileno, las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio, se filtraron y se concentraron. El residuo se mezcló con poca cantidad de acetonitrilo y se formó una suspensión. La parte insoluble se lavó con n-pentano, se aspiró y se secó al vacío. El sólido a continuación se purificó mediante MPLC con eluyente ciclohexano / acetato de etilo. Se obtuvieron 340 mg (100 % de pureza, 14,0 % del teórico) del compuesto del título (II-42).

RMN de ^1H (400,0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9,997(1,7); 9,107(1,2); 9,102(1,3); 8,745(0,8); 8,742(0,9); 8,734(0,9); 8,731(0,9); 8,279(0,4); 8,275(0,7); 8,271(0,5); 8,259(0,5); 8,255(0,8); 8,251(0,5); 8,169(1,5); 8,062(0,6); 8,040(0,7); 7,614(1,2); 7,603(0,7); 7,594(1,8); 7,583(0,7); 7,574(0,8); 7,424(0,9); 7,404(0,7); 7,322(1,9); 3,320(8,0); 2,638(16,0); 2,507(14,9); 2,503(19,6); 2,499(15,3); 1,989(0,9); 1,176(0,5); 0,000(0,4)

Paso 2: N,N-dimetil-3-[7-oxo-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-d]pirimidin-6(7H)-il]bencensulfonamida (42)

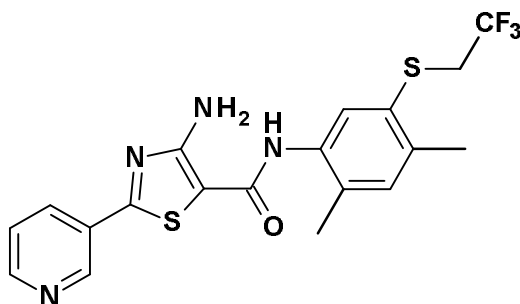


Se dispusieron 320 mg (0,79 mmol) de 4-amino-N-[3-(dimetilsulfamoil)fenil]-2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxamida (II-42) en N,N-dimetilacetamida. Se adicionaron 68 mg (0,40 mmol) de ácido p-toluensulfónico y 260 mg (1,75 mmol) de trietiléster del ácido ortofórmico y la mezcla de reacción se calentó durante 1 h en un microondas CEM Discover a 200 Vatios a 130 °C. La mezcla de reacción enfriada se concentró al vacío, el residuo se mezcló con acetonitrilo y el producto se separó por filtración en forma sólida. El sólido a continuación se presionó sobre una placa de arcilla y se purificó mediante MPLC con eluyente n-hexano/acetato de etilo. Se obtuvieron 320 mg (100 % de pureza, 97,6 % del teórico) del compuesto del título (42).

RMN de ^1H (400,0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9,350(1,3); 9,345(1,3); 8,835(0,9); 8,831(1,0); 8,823(1,0); 8,819(1,0); 8,714(3,3); 8,560(0,5); 8,556(0,7); 8,551(0,5); 8,540(0,6); 8,535(0,8); 8,531(0,5); 8,055(1,6); 7,967(0,6); 7,962(0,4); 7,948(1,0); 7,944(0,7); 7,929(0,5); 7,925(0,4); 7,909(1,4); 7,894(1,3); 7,875(1,1); 7,856(0,4); 7,680(0,7); 7,668(0,7); 7,660(0,7); 7,648(0,7); 3,320(7,9); 2,681(16,0); 2,507(13,0); 2,502(16,4); 2,498(12,5); 0,000(16,1)

Ejemplo de preparación 15: 6-{2,4-dimetil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)-sulfinil]-fenil}-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-d]pirimidin-7(6H)-ona (50)

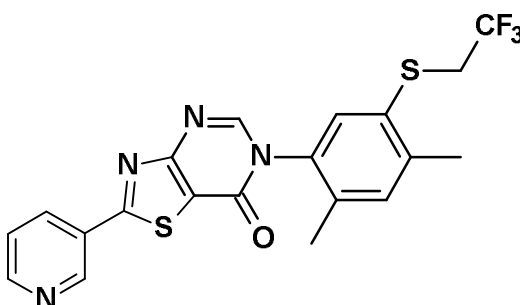
Paso 1: 4-Amino-N-{2,4-dimetil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]fenil}-2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxamida (II-49)



5 A 708 mg (3,01 mmol) de 2,4-dimetil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]anilina en 1,2-dicloroetano se adicionaron lentamente gota a gota bajo argón 1,5 ml de una solución 2 M de trietilaluminio (3,01 mmol) en tolueno bajo enfriamiento con hielo y se agitó 30 min a temperatura ambiente. A continuación se adicionaron 250 mg (1,00 mmol) de 4-amino-2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxilato de etilo (III-1) y la mezcla de reacción después se calentó durante la noche bajo reflujo. Después del enfriado, la mezcla de reacción se adicionó cuidadosamente a una solución al 10 % de tartrato de potasio-sodio (aprox. 120 ml). La mezcla se extrajo tres veces con cloruro de metileno, las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio, se filtraron y se concentraron. El residuo se mezcló con poca cantidad de acetonitrilo y se formó una suspensión. El residuo se separó mediante filtración por succión y se secó al vacío. Se obtuvieron 158 mg (100 % de pureza, 35,9 % del teórico) del compuesto del título (II-49).

10 **RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO):** δ = 9,328(4,1); 9,086(3,2); 9,081(3,1); 8,729(2,3); 8,726(2,4); 8,717(2,4); 8,714(2,4); 8,259(1,3); 8,254(1,8); 8,249(1,3); 8,239(1,4); 8,234(1,9); 8,229(1,3); 7,598(1,7); 7,586(1,7); 7,579(1,7); 7,566(1,6); 7,468(5,9); 7,174(5,0); 7,133(5,2); 3,878(1,2); 3,852(3,8); 3,826(4,0); 3,800(1,4); 3,330(19,9); 2,507(38,9); 2,503(48,8); 2,499(36,6); 2,365(14,9); 2,330(0,4); 2,325(0,3); 2,163(16,0); 0,000(40,2)

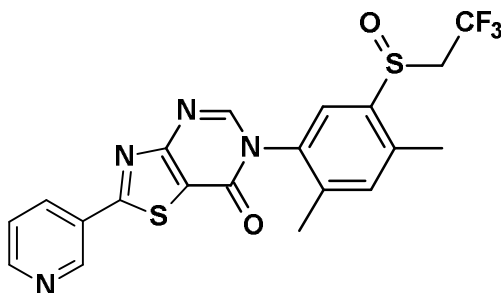
15 **Paso 2: 6-{2,4-dimetil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-2-(piridin-3-il)-[1,3]tiazolo[4,5-d]pirimidin-7(6H)-ona (49)**



20 Se dispusieron 600 mg (1,37 mmol) de 4-amino-N-{2,4-dimetil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxamida (II-49) en 15 ml (90,2 mmol) de trietiléster del ácido ortofórmico. Se adicionaron 118 mg (0,68 mmol) de ácido p-toluensulfónico y la mezcla de reacción se calentó durante 2 h en un microondas CEM Discover a 170 °C. La mezcla de reacción enfriada se concentró al vacío y se purificó por cromatografía mediante MPLC con eluyente ciclohexano/acetato de etilo. Se obtuvieron en total 200 mg (95,3 % de pureza, 31,1 % del teórico) del compuesto del título (49).

25 **RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO):** δ = 9,347(2,9); 9,342(3,0); 8,838(2,3); 8,834(2,4); 8,826(2,4); 8,822(2,5); 8,558(1,3); 8,554(1,9); 8,548(1,4); ,536(10,2); 8,528(1,5); 8,317(0,8); 7,924(0,4); 7,683(1,9); 7,675(6,4); 7,665(2,0); 7,651(1,5); 7,360(4,7); 6,025(1,0); 4,055(0,6); 4,038(2,6); 4,020(2,4); 4,014(3,6); 4,002(0,9); 3,988(3,6); 3,962(1,3); 3,855(0,8); 3,837(0,8); 3,392(0,3); 3,374(0,5); 3,332(421,8); 2,676(1,7); 2,671(2,3); 2,667(1,7); 2,525(5,6); 2,511(131,6); 2,507(269,9); 2,502(357,0); 2,498(264,5); 2,494(133,5); 2,407(15,0); 2,365(0,4); 2,334(1,8); 2,329(2,4); 2,325(1,8); 2,078(16,0); 1,989(7,6); 1,890(0,3); 1,398(1,9); 1,235(0,6); 1,193(2,1); 1,175(4,1); 1,157(2,1); 1,100(0,8); 1,083(1,5); 1,065(0,8); 0,146(0,5); 0,008(3,7); 0,000(116,2); -0,008(4,9); -0,150(0,5)

30 **Paso 3: 6-{2,4-dimetil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-2-(piridin-3-il)-[1,3]tiazolo[4,5-d]pirimidin-7(6H)-ona (50)**

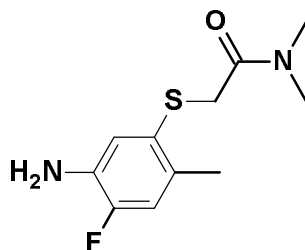


A una solución de 250,0 mg (0,56 mmol) de 6-(2,4-dimetil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil)-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-d]pirimidin-7(6H)-ona (49) en 10 ml de diclorometano se adicionaron a 0 °C 127 mg (al 77 %, 0,57 mmol) de ácido meta-cloroperbenzoico. La mezcla de reacción se agitó durante 1 hora a temperatura ambiente y después se mezcló con solución acuosa de hidrosulfito de sodio. La fase orgánica separada a continuación se lavó con solución saturada de carbonato de sodio y se secó con sulfato de sodio. Tras la evaporación del disolvente, se purificó por cromatografía el residuo mediante MPLC con eluyente ciclohexano/acetato de etilo. Se obtuvieron 154 mg (99,0 % de pureza, 58,88 % del teórico) del compuesto del título (50).

RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9,351(4,6); 9,346(4,6); 8,839(3,4); 8,835(3,7); 8,827(3,6); 8,823(3,7); 8,591(14,3); 8,561(1,9); 8,556(2,7); 8,551(1,9); 8,541(2,0); 8,536(2,8); 8,531(1,9); 8,317(1,3); 7,937(6,3); 7,928(4,2); 7,685(2,6); 7,673(2,6); 7,667(2,5); 7,653(2,4); 7,496(3,0); 7,470(4,4); 4,323(0,5); 4,295(0,6); 4,286(0,7); 4,259(0,7); 4,178(0,6); 4,171(0,6); 4,151(1,8); 4,144(1,8); 4,124(1,8); 4,117(1,8); 4,097(0,7); 4,090(0,6); 4,055(0,4); 4,037(1,0); 4,020(1,0); 4,002(0,4); 3,977(0,7); 3,951(0,8); 3,940(0,7); 3,924(0,3); 3,914(0,7); 3,372(0,9); 3,332(833,0); 2,676(2,9); 2,671(3,9); 2,667(2,9); 2,525(9,7); 2,507(449,3); 2,502(587,2); 2,498(437,0); 2,451(12,1); 2,446(16,0); 2,408(0,8); 2,353(0,6); 2,334(3,2); 2,329(4,0); 2,325(3,0); 2,279(0,4); 2,258(0,5); 2,188(15,9); 2,182(12,0); 1,989(4,2); 1,193(1,1); 1,175(2,3); 1,157(1,1); 0,146(0,8); 0,008(6,5); 0,000(190,8); -0,008(8,2); -0,150(0,9)

Ejemplo de preparación 16: 2-([4-fluoro-2-metil-5-[7-oxo-2-(piridin-3-il)-[1,3]tiazolo[4,5-d]pirimidin-6(7H)-il]fenil]sulfanil)-N,N-dimetilacetamida (55)

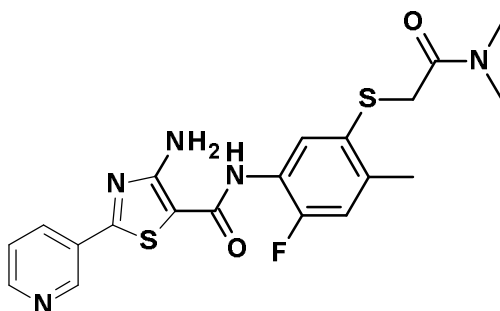
Paso 1: 2-[(5-Amino-4-fluoro-2-metilfenil)sulfanil]-N,N-dimetilacetamida



Se mezclaron 1,50 g (9,54 mmol) de 5-amino-4-fluoro-2-metilbencentiol, 1,28 g (10,50 mmol) de 2-cloro-N,N-dimetilacetamida y 6,22 g (19,08 mmol) de carbonato de cesio junto con 100 ml de acetona seca y durante la noche se agitaron bajo reflujo. El preparado de reacción enfriado se adicionó a una mezcla de acetato de etilo y carbonato de sodio y se separó la fase orgánica. La fase acuosa se extrajo varias veces con acetato de etilo, las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de magnesio, se filtraron y se concentraron por evaporación. Se obtuvieron 2,10 g (90,0 % de pureza, 81,75 % del teórico) del compuesto del título 2-[(5-amino-4-fluoro-2-metilfenil)sulfanil]-N,N-dimetilacetamida.

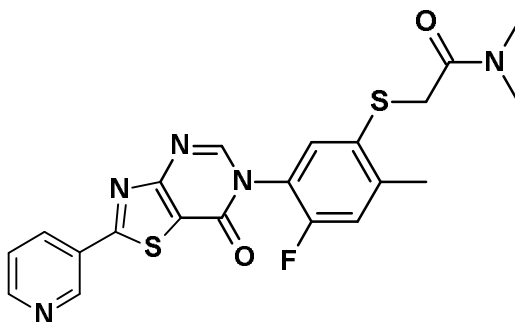
RMN de ¹H (601,6 MHz, CDCl₃): δ = 7,264(2,5); 6,995(2,3); 6,980(2,3); 6,836(1,7); 6,816(1,7); 4,079(0,4); 3,605(10,1); 3,098(0,6); 3,034(0,4); 3,025(16,0); 2,991(0,6); 2,968(0,4); 2,951(14,4); 2,313(13,0); 2,170(1,4); 0,000(2,4)

Paso 2: 4-Amino-N-(5-[[2-(dimetilamino)-2-oxoetil]sulfanil]-2-fluoro-4-metilfenil)-2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxamida (II-54)



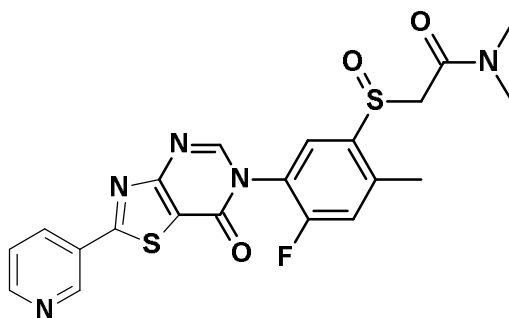
5 A 2,10 g (7,88 mmol) de 2-[(5-amino-4-fluoro-2-metilfenil)sulfanil]-N,N-dimetilacetamida (véase Ejemplo de preparación 16, Paso 1) en 150 ml de 1,2-dicloroetano se adicionaron lentamente gota a gota bajo argón 3,94 ml de una solución 2 M de trietilaluminio (7,88 mmol) en tolueno bajo enfriamiento con hielo y se agitó 60 min a temperatura ambiente. A continuación se adicionaron 655 mg (2,63 mmol) de 4-amino-2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxilato de etilo (III-1) y la mezcla de reacción después se calentó durante la noche bajo reflujo. Después del enfriado, la mezcla de reacción se adicionó cuidadosamente a una solución al 10 % de tartrato de potasio-sodio (aprox. 200 ml). La mezcla se extrajo tres veces con cloruro de metileno, las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de magnesio, se filtraron y se concentraron. El residuo a continuación se purificó por cromatografía mediante MPLC con eluyente ciclohexano /acetato de etilo. Se obtuvieron 370 mg (47,0 % de pureza, 14,86 % del teórico) del compuesto del título (II-54), que se hizo reaccionar sin purificación adicional directamente en el Paso 3. HPCL-EM (ESI positivo, m/z): [M+H] = 446.0

Paso 3: 2-((4-fluoro-2-metil-5-[7-oxo-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-d]pirimidin-6(7H)-il]fenil)sulfanil)-N,N-dimetilacetamida (54)



15 Se dispusieron 370 mg (al 47 %, 0,39 mmol) de 4-amino-N-(5-[[2-(dimetilamino)-2-oxoetil]sulfanil]-2-fluoro-4-metilfenil)-2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxamida (II-54) en 1 ml de N,N-dimetilacetamida. Se adicionaron 34 mg (0,20 mmol) de ácido p-toluensulfónico y 174 mg (1,17 mmol) de trietiléster del ácido ortofórmico y la mezcla de reacción se calentó durante 1 h en un microondas CEM Discover a 200 Vatios a 130 °C. La mezcla de reacción enfriada se concentró al vacío, el residuo se mezcló con acetonitrilo y el producto se separó por filtración en forma sólida. El sólido a continuación se compactó sobre una placa de arcilla y se purificó mediante MPLC con eluyente acetonitrilo / agua. Se obtuvieron 170 mg (100 % de pureza, 95,61 % del teórico) del compuesto del título (54).
 20 **RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO):** δ = 9,347(2,8); 9,342(2,6); 8,837(2,0); 8,825(2,0); 8,668(5,5); 8,552(1,6); 8,532(1,6); 8,141(0,9); 7,718(2,4); 7,700(2,4); 7,682(1,5); 7,669(1,5); 7,662(1,4); 7,649(1,3); 7,448(2,1); 7,422(2,1); 5,754(0,6); 4,011(8,8); 3,320(45,4); 3,027(16,0); 2,891(0,5); 2,832(14,9); 2,731(0,5); 2,670(0,6); 2,502(95,0); 2,406(12,3); 2,328(0,6); 0,000(4,0)

Paso 4: 2-((4-fluoro-2-metil-5-[7-oxo-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-d]pirimidin-6(7H)-il]fenil)sulfanil)-N,N-dimetilacetamida (55)

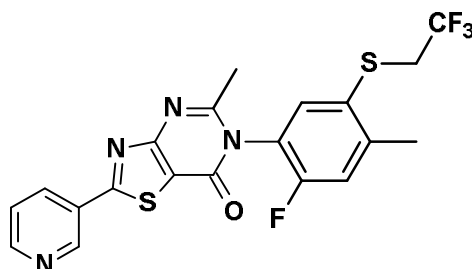


A una solución de 170 mg (0,36 mmol) de 2-({4-fluoro-2-metil-5-[7-oxo-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-d]pirimidin-6(7H)-il]fenil}sulfanil)-N,N-dimetilacetamida (54) en 1 ml de diclorometano se adicionaron a 0 °C 81 mg (al 77 %, 0,36 mmol) de ácido meta-cloroperbenzoico. La mezcla de reacción se agitó durante 1 hora a temperatura ambiente y después se añadió una solución acuosa de carbonato de sodio. La fase acuosa separada se extrajo varias veces más con diclorometano y las fases orgánicas combinadas se secaron, se filtraron y se concentraron por evaporación. El residuo a continuación se purificó por cromatografía mediante MPLC con eluyente ciclohexano/acetato de etilo. Se obtuvieron 119 mg (100 % de pureza, 71,2 % del teórico) del compuesto del título (55).

RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9,350(3,2); 9,345(3,1); 8,838(2,2); 8,835(2,3); 8,826(2,3); 8,823(2,3); 8,722(6,2); 8,556(1,8); 8,540(1,4); 8,535(1,9); 8,531(1,3); 8,139(4,6); 8,119(2,9); 7,685(1,7); 7,672(1,7); 7,665(1,7); 7,653(1,5); 7,568(2,4); 7,541(2,4); 4,185(1,3); 4,148(2,5); 4,086(1,2); 4,047(0,6); 3,340(160,4); 2,955(16,0); 2,863(15,8); 2,672(0,6); 2,507(78,3); 2,503(97,2); 2,473(15,1); 2,330(0,6); 0,000(3,2)

Ejemplo de preparación 17: 6-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)-sulfanil]fenil}-5-metil-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-d]pirimidin-7(6H)-ona (57)

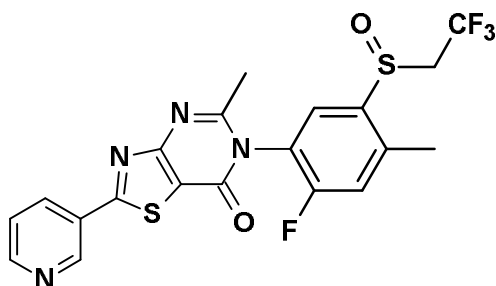
Paso 1: 6-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-5-metil-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-d]pirimidin-7(6H)-ona (56)



Se dispusieron 200 mg (0,45 mmol) de 4-amino-N-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxamida (II-21) en 1 ml de *N,N*-dimetilacetamida. Se adicionaron 39 mg (0,23 mmol) de ácido p-toluensulfónico y 220 mg (1,36 mmol) de trietiléster de ácido ortoacético y la mezcla de reacción se calentó durante 30 min en un microondas CEM Discover a 200 Vatios a 130 °C. La mezcla de reacción enfriada se concentró por evaporación en el alto vacío. El residuo a continuación se purificó mediante MPLC con eluyente acetonitrilo/ agua. Se obtuvieron 30 mg (100 % de pureza, 14,2 % del teórico) del compuesto del título (56).

RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9,333(2,4); 9,328(2,4); 8,834(1,8); 8,830(2,0); 8,822(1,9); 8,818(2,0); 8,535(1,1); 8,531(1,4); 8,526(1,1); 8,515(1,2); 8,510(1,5); 8,506(1,1); 7,939(2,4); 7,920(2,4); 7,680(1,4); 7,668(1,4); 7,661(1,4); 7,648(1,3); 7,541(2,1); 7,515(2,1); 4,085(0,5); 4,071(0,5); 4,060(0,6); 4,046(1,3); 4,037(0,6); 4,021(1,3); 4,012(1,3); 3,995(0,7); 3,986(1,3); 3,972(0,5); 3,960(0,5); 3,946(0,5); 3,329(49,4); 2,676(0,4); 2,672(0,5); 2,668(0,4); 2,525(1,3); 2,512(29,6); 2,507(59,8); 2,503(79,0); 2,498(58,4); 2,494(29,1); 2,469(13,3); 2,443(0,6); 2,417(0,6); 2,339(0,3); 2,334(0,5); 2,329(0,6); 2,325(0,5); 2,302(0,4); 2,281(16,0); 2,076(1,0); 0,008(1,9); 0,000(57,6); -0,009(2,3)

Paso 2: 6-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-5-metil-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-d]pirimidin-7(6H)-ona (57)

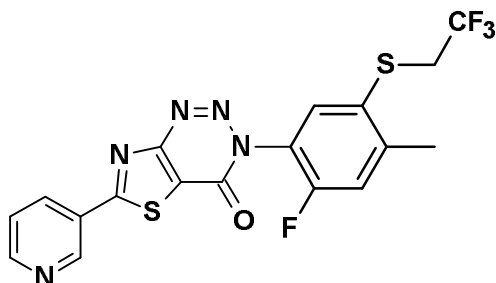


A una solución de 25 mg (0,06 mmol) de 6-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-5-metil-2-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-d]pirimidin-7(6H)-ona (56) en 1 ml de diclorometano se adicionaron a 0 °C 12 mg (al 77 %, 0,06 mmol) de ácido meta-cloroperbenzoico. La mezcla de reacción se agitó durante 1 hora a temperatura ambiente y después se añadió una solución acuosa de carbonato de sodio. La fase acuosa separada se extrajo varias veces más con diclorometano y las fases orgánicas combinadas se secaron, se filtraron y se concentraron por evaporación. Se obtuvieron 14 mg (88,0 % de pureza, 47,7 % del teórico) del compuesto del título (57).

RMN de ¹H (601,6 MHz, CDCl₃): δ = 9,363(2,0); 8,807(1,5); 8,469(0,8); 8,466(1,1); 8,463(0,8); 8,452(1,9); 8,441(0,9); 8,438(1,1); 8,435(0,8); 8,065(1,7); 8,029(1,8); 8,017(1,8); 8,003(1,8); 7,991(1,8); 7,979(1,0); 7,966(1,1); 7,556(0,7); 7,554(0,7); 7,542(0,9); 7,541(0,9); 7,526(0,9); 7,519(1,3); 7,513(1,7); 7,507(1,3); 7,500(0,9); 7,415(1,0); 7,402(1,7); 7,389(0,8); 7,304(1,8); 7,302(1,9); 7,288(1,9); 7,286(1,8); 7,272(7,2); 5,302(6,3); 3,617(0,5); 3,609(0,4); 3,601(0,6); 3,593(1,0); 3,576(1,1); 3,563(1,1); 3,555(0,3); 3,547(3,0); 3,539(0,6); 3,530(3,1); 3,523(0,8); 3,514(1,2); 3,506(0,7); 2,590(0,5); 2,517(16,0); 2,501(0,6); 2,493(0,4); 2,484(0,3); 2,418(0,7); 2,408(12,8); 2,395(0,6); 2,386(12,7); 2,378(1,1); 2,369(0,4); 2,356(0,5); 2,352(0,4); 2,344(0,4); 2,332(0,4); 1,335(0,5); 1,329(0,3); 1,306(0,6); 1,295(0,9); 1,286(1,3); 1,283(1,3); 1,271(1,3); 1,255(6,2); 1,232(0,7); 1,221(0,5); 1,212(0,5); 0,891(0,8); 0,880(1,4); 0,868(1,0); 0,856(0,5); 0,843(0,9); 0,841(0,9); 0,834(0,9); 0,005(0,5); 0,000(14,7); -0,006(0,7)

Ejemplo de preparación 18: 3-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)-sulfanil]fenil}-6-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-d][1,2,3]triazin-4(3H)-ona (59)

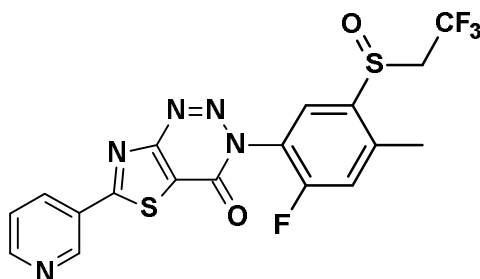
Paso 2: 3-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-6-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-d][1,2,3]triazin-4(3H)-ona (58)



Se dispusieron 160 mg (0,36 mmol) de 4-amino-N-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxamida (II-21) en 4 ml de ácido clorhídrico concentrado. A esta mezcla se adicionó después gota a gota 212 mg (3,07 mmol) de nitrito de sodio disuelto en 4 ml de agua y se agitó el preparado durante 4 h a 70 °C. A continuación, el preparado enfriado se añadió a la solución saturada de carbonato de sodio y se extrajo varias veces con diclorometano. Las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de magnesio, se filtraron y se concentraron por evaporación. Se obtuvieron 112 mg (90,0 % de pureza, 61,5 % del teórico) del compuesto del título (58).

RMN de ¹H (400,0 MHz, DMSO): δ = 9,430(10,3); 9,425(10,4); 8,891(8,1); 8,887(8,8); 8,879(8,5); 8,875(8,7); 8,651(4,7); 8,646(6,4); 8,641(4,7); 8,631(5,1); 8,625(6,5); 8,621(4,7); 8,317(0,4); 8,260(1,0); 8,242(1,1); 7,992(9,9); 7,973(9,9); 7,729(6,1); 7,717(6,0); 7,709(6,0); 7,697(6,2); 7,673(0,9); 7,583(8,6); 7,556(8,5); 5,758(16,0); 4,361(0,7); 4,351(0,4); 4,344(0,4); 4,324(0,4); 4,086(0,4); 4,059(0,4); 4,049(0,4); 4,018(4,1); 3,993(12,7); 3,967(13,1); 3,941(4,5); 3,331(218,6); 2,677(1,1); 2,672(1,5); 2,668(1,1); 2,512(92,5); 2,508(154,3); 2,503(197,3); 2,499(145,6); 2,495(73,3); 2,374(0,4); 2,353(0,4); 2,334(1,0); 2,330(1,3); 2,326(1,0); 1,343(0,4); 1,326(0,8); 1,308(0,4); 0,146(0,4); 0,008(3,0); 0,000(84,9); -0,008(3,4); -0,150(0,4)

Paso 2: 3-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-6-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo [4,5-d][1,2,3]triazin-4(3H)-ona (59)

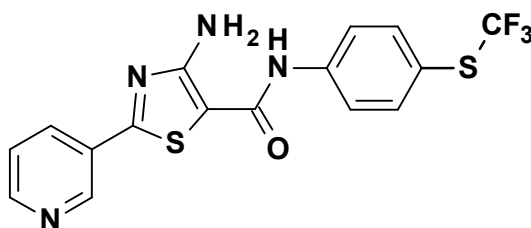


A una solución de 96 mg (al 90 %, 0,19 mmol) de 3-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-6-(piridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-d][1,2,3]triazin-4(3H)-ona (58) en 1 ml de diclorometano se adicionaron a 0 °C 44 mg (al 77 %, 0,19 mmol) de ácido meta-cloroperbenzoico. La mezcla de reacción se agitó durante 40 minutos a temperatura ambiente y después se añadió una solución acuosa de carbonato de sodio. La fase acuosa separada se extrajo varias veces más con diclorometano y las fases orgánicas combinadas se secaron, se filtraron y se concentraron por evaporación. El residuo a continuación se purificó mediante MPLC con eluyente acetonitrilo /agua. Se obtuvieron 30 mg (100 % de pureza, 33,5 % del teórico) del compuesto del título (59).

RMN de ¹H (400,0 MHz, DMSO): δ = 9,432(5,9); 9,428(6,0); 8,891(4,5); 8,887(4,8); 8,879(4,8); 8,875(4,8); 8,652(2,6); 8,648(3,5); 8,642(2,6); 8,632(2,8); 8,626(3,7); 8,622(2,7); 8,260(5,9); 8,241(6,0); 7,729(3,3); 7,717(3,3); 7,709(3,5); 7,699(7,6); 7,673(4,8); 5,758(16,0); 4,415(0,5); 4,388(1,7); 4,378(0,8); 4,360(2,0); 4,351(2,3); 4,333(0,8); 4,323(2,3); 4,296(0,7); 4,112(0,6); 4,085(2,0); 4,075(0,7); 4,058(2,3); 4,048(1,9); 4,031(0,9); 4,021(1,8); 3,994(0,6); 3,331(101,6); 2,676(0,7); 2,672(1,0); 2,668(0,8); 2,507(117,2); 2,503(134,4); 2,498(99,6); 2,334(0,6); 2,330(0,9); 2,325(0,7); 1,233(0,7); 0,008(1,1); 0,000(27,5)

Ejemplo de preparación 19: 2-(Piridin-3-il)-6-{4-[(trifluorometil)-sulfanil]fenil}[1,3]tiazolo[4,5-d]pirimidin-7(6H)-ona (63)

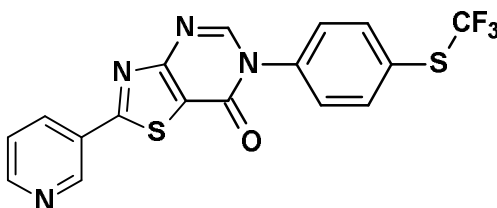
Paso 1: 4-Amino-2-(piridin-3-il)-N-{4-[(trifluorometil)sulfanil]fenil}-1,3-tiazol-5-carboxamida (II-62)



A 1,16 g (6,0 mmol) de 4-[(trifluorometil)sulfanil]anilina en 50 ml de 1,2-dicloroetano se adicionaron lentamente gota a gota bajo argón 3,0 ml de una solución 2 M de trietilaluminio (6,0 mmol) en tolueno bajo enfriamiento con hielo y se agitó durante 1 hora a temperatura ambiente. A continuación se adicionaron 500 mg (2,0 mmol) de 4-amino-2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxilato de metilo (III-1) y la mezcla de reacción después se calentó durante la noche bajo reflujo. Después del enfriado, la mezcla de reacción se adicionó cuidadosamente a una solución al 10 % de tartrato de potasio-sodio (aprox. 120 ml). La mezcla se extrajo tres veces con cloruro de metileno, las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de magnesio, se filtraron y se concentraron. El residuo se mezcló con poca cantidad de acetonitrilo y se formó una suspensión. El residuo se separó mediante filtración por succión y a continuación se purificó mediante MPLC con eluyente acetonitrilo /agua. Se obtuvieron 130 mg (99,0 % de pureza, 16,2 % del teórico) del compuesto del título (II-62).

RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9,958(9,7); 9,780(0,6); 9,109(7,3); 9,104(7,2); 9,103(7,2); 9,096(0,8); 8,746(5,4); 8,742(6,0); 8,734(6,2); 8,730(6,1); 8,283(3,0); 8,278(4,1); 8,273(3,4); 8,263(3,6); 8,257(4,6); 8,253(3,5); 7,889(1,4); 7,883(12,5); 7,878(4,6); 7,866(4,6); 7,861(16,0); 7,854(2,0); 7,730(0,9); 7,725(0,3); 7,713(0,3); 7,707(1,1); 7,679(12,9); 7,657(10,8); 7,615(3,8); 7,613(4,1); 7,601(4,0); 7,595(3,9); 7,593(4,0); 7,583(3,6); 7,581(3,9); 7,384(1,2); 7,379(0,5); 7,361(1,4); 7,337(10,7); 7,267(0,8); 3,329(92,9); 2,677(0,8); 2,672(1,1); 2,668(0,8); 2,525(2,6); 2,512(58,6); 2,508(119,3); 2,503(158,4); 2,499(116,9); 2,494(58,1); 2,334(0,7); 2,330(1,0); 2,325(0,8); 2,321(0,4); 2,076(1,4); 0,146(0,6); 0,008(4,8); 0,000(137,9); -0,009(5,2); -0,150(0,6)

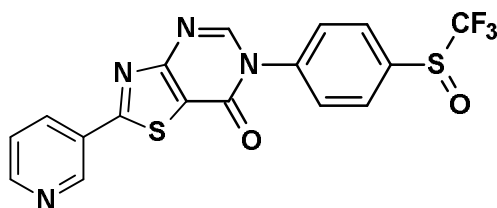
Paso 2: 2-(Piridin-3-il)-6-{4-[(trifluorometil)sulfanil]fenil}[1,3]tiazolo[4,5-d]-pirimidin-7(6H)-ona (62)



Se dispusieron 65 mg (0,16 mmol) de 4-amino-2-(piridin-3-il)-N-{4-[(trifluorometil)sulfanil]fenil}-1,3-tiazol-5-carboxamida (II-62) en 5 ml de etanol absoluto. Se adicionaron 14 mg (0,08 mmol) de ácido p-toluensulfónico así como 72 mg (0,49 mmol) de trietiléster del ácido ortofórmico y la mezcla de reacción se calentó durante 15 min en un microondas CEM Discover a 80 °C. La mezcla de reacción enfriada se concentró al vacío en 3 ml de diclorometano. La solución se lavó con 2 ml de solución saturada de carbonato de sodio y la fase orgánica separada se secó, se filtró y se concentró por evaporación. El residuo a continuación se purificó por cromatografía mediante MPLC. Se obtuvieron en total 20 mg (86,0 % de pureza, 26,1 % del teórico) del compuesto del título (62).

RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9,954(1,2); 9,347(5,1); 9,343(5,1); 9,341(5,2); 9,106(0,9); 9,100(0,9); 8,835(3,9); 8,831(4,4); 8,823(4,0); 8,819(4,4); 8,744(0,7); 8,740(0,8); 8,732(0,8); 8,728(0,8); 8,701(16,0); 8,636(1,4); 8,558(2,1); 8,552(3,1); 8,548(2,5); 8,538(2,3); 8,532(3,3); 8,528(2,5); 8,280(0,4); 8,275(0,5); 8,271(0,4); 8,260(0,4); 8,255(0,6); 8,251(0,4); 7,969(7,3); 7,948(9,3); 7,881(1,5); 7,859(2,0); 7,806(1,5); 7,799(11,4); 7,795(3,7); 7,783(3,0); 7,778(9,2); 7,772(1,0); 7,688(0,6); 7,679(4,0); 7,667(4,3); 7,660(3,6); 7,647(4,4); 7,625(0,4); 7,612(0,5); 7,600(0,5); 7,592(0,5); 7,579(0,5); 7,333(1,3); 3,324(74,8); 2,676(0,7); 2,671(0,9); 2,667(0,7); 2,524(2,5); 2,511(45,7); 2,507(92,5); 2,502(124,5); 2,498(94,2); 2,493(47,7); 2,333(0,5); 2,329(0,8); 2,325(0,6); 1,298(0,5); 1,259(0,7); 1,233(1,0); 0,000(1,1)

Paso 3: 2-(Piridin-3-il)-6-{4-[(trifluorometil)sulfinil]fenil}[1,3]tiazolo[4,5-d]-pirimidin-7(6H)-ona (63)

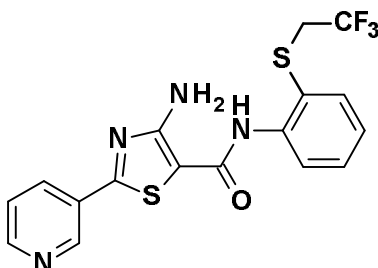


A una solución de 35,0 mg (0,09 mmol) de 2-(piridin-3-il)-6-{4-[(trifluorometil)sulfanil]fenil}[1,3]tiazolo[4,5-d]pirimidin-7(6H)-ona (62) en 1 ml de diclorometano se adicionaron a 0 °C 20 mg (al 77 %, 0,09 mmol) de ácido metacloroperbenzoico. La mezcla de reacción se agitó durante 90 minutos a temperatura ambiente y después se añadió solución saturada de carbonato de sodio. La fase acuosa se extrajo tres veces más con diclorometano y las fases orgánicas combinadas se secaron y se filtraron. Tras la evaporación del disolvente, el residuo a continuación se purificó por cromatografía con eluyente diclorometano/metanol (30:1). Se obtuvieron 10 mg (95,0 % de pureza, 26,1 % del teórico) del compuesto del título (63).

RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9,344(0,4); 8,925(9,0); 8,748(0,7); 8,714(16,0); 8,649(1,1); 8,542(0,3); 8,462(5,6); 8,446(5,9); 8,317(1,5); 8,137(0,4); 8,117(0,7); 8,081(5,4); 8,061(5,8); 7,970(10,5); 7,950(13,1); 7,793(14,1); 7,772(11,5); 7,689(0,8); 7,666(5,7); 7,647(6,7); 7,629(4,4); 5,757(7,6); 3,507(0,3); 3,487(0,3); 3,447(0,4); 3,439(0,4); 3,409(0,5); 3,326(536,7); 3,245(0,3); 2,840(0,4); 2,820(0,4); 2,805(0,4); 2,765(0,4); 2,671(8,5); 2,622(1,1); 2,618(1,1); 2,502(1215,9); 2,329(7,9); 2,184(0,3); 1,355(0,6); 1,299(1,8); 1,259(2,9); 1,235(7,6); 1,166(0,5); 1,149(1,1); 1,066(0,4); 0,854(1,6); 0,843(1,0); 0,834(1,1); 0,814(0,7); 0,784(0,5); 0,146(5,7); 0,083(0,5); 0,000(1101,9); -0,150(5,9)

Ejemplo de preparación 20: 2-(Piridin-3-il)-6-{2-[(2,2,2-trifluoroetil)-sulfinil]fenil}[1,3]tiazolo[4,5-d]pirimidin-7(6H)-ona (69)

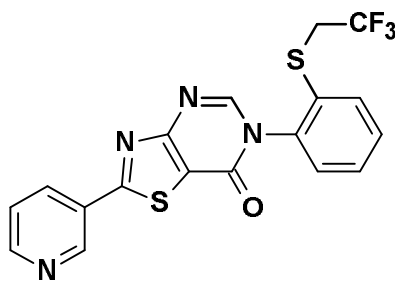
Paso 1: 4-Amino-2-(piridin-3-il)-N-{2-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-1,3-tiazol-5-carboxamida (II-68)



A 1,50 g (7,22 mmol) de 2-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfonil]anilina en 50 ml de 1,2-dicloroetano se adicionaron lentamente gota a gota bajo argón 3,6 ml de una solución 2 M de trietilaluminio (7,22 mmol) en tolueno bajo enfriamiento con hielo y se agitó durante 1 hora a temperatura ambiente. A continuación se adicionaron 600 mg (2,41 mmol) de 4-amino-2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxilato de etilo (III-1) y la mezcla de reacción después se calentó durante la noche bajo reflujo. Después del enfriado, la mezcla de reacción se adicionó cuidadosamente a una solución al 10 % de tartrato de potasio-sodio (aprox. 120 ml). La mezcla se extrajo tres veces con cloruro de metileno, las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de magnesio, se filtraron y se concentraron. El residuo se mezcló con poca cantidad de acetonitrilo y se formó una suspensión. El residuo se separó mediante filtración por succión y a continuación se purificó mediante MPLC con eluyente acetonitrilo /agua. Se obtuvieron 240 mg (96,0 % de pureza, 23,3 % del teórico) del compuesto del título (II-68).

RMN de ^1H (400,0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9,458(10,4); 9,104(6,7); 9,099(6,7); 8,738(5,3); 8,734(5,7); 8,726(5,8); 8,722(5,6); 8,316(0,4); 8,279(3,0); 8,275(4,2); 8,269(3,1); 8,259(3,3); 8,254(4,3); 8,249(3,1); 7,661(4,8); 7,644(5,2); 7,641(5,2); 7,605(3,9); 7,603(3,9); 7,593(3,9); 7,591(3,9); 7,585(3,9); 7,583(3,8); 7,573(3,7); 7,571(3,6); 7,536(4,8); 7,519(5,5); 7,517(5,7); 7,365(2,4); 7,362(2,5); 7,346(5,0); 7,343(5,0); 7,327(3,3); 7,324(3,1); 7,287(3,6); 7,283(3,6); 7,267(4,9); 7,264(4,9); 7,249(2,2); 7,245(2,1); 7,176(12,1); 4,253(0,6); 4,235(0,6); 3,944(2,8); 3,918(8,8); 3,892(9,1); 3,866(3,1); 3,330(242,9); 2,676(0,9); 2,672(1,2); 2,667(0,9); 2,525(2,8); 2,507(127,7); 2,503(166,7); 2,498(124,1); 2,334(0,9); 2,329(1,2); 2,325(0,9); 2,075(16,0); 1,295(0,6); 1,278(1,3); 1,260(0,6); 1,233(0,7); 0,008(0,4); 0,000(10,3); -0,008(0,4)

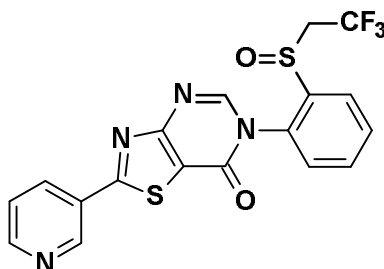
Paso 2: 2-(Piridin-3-il)-6-{2-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfonil]fenil}[1,3]tiazolo[4,5-d]pirimidin-7(6H)-ona (68)



Se mezclaron 225 mg (0,53 mmol) de 4-amino-2-(piridin-3-il)-N-{2-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfonil]fenil}-1,3-tiazol-5-carboxamida (II-68) y 45 mg (0,26 mmol) de ácido p-toluensulfónico junto con 5 ml (30,1 mmol) de trietiléster del ácido ortofórmico y la mezcla de reacción se calentó durante 60 min en un microondas CEM Discover a 170 °C. La mezcla de reacción enfriada se concentró al vacío y a continuación se purificó por cromatografía mediante MPLC con eluyente ciclohexano/acetato de etilo. Se obtuvieron en total 95 mg (99,0 % de pureza, 42,5 % del teórico) del compuesto del título (68).

RMN de ^1H (400,0 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9,348(4,6); 9,344(4,6); 8,841(3,7); 8,837(4,0); 8,829(4,0); 8,825(4,0); 8,558(2,5); 8,551(16,0); 8,539(2,6); 8,533(3,3); 8,529(2,4); 7,918(3,2); 7,915(3,1); 7,899(4,0); 7,688(2,9); 7,686(2,8); 7,676(2,9); 7,674(2,9); 7,667(5,2); 7,663(4,0); 7,654(4,6); 7,648(3,9); 7,645(5,9); 7,639(5,5); 7,635(3,0); 7,620(3,2); 7,616(2,2); 7,598(3,4); 7,595(3,5); 7,579(3,1); 7,576(3,5); 7,561(1,3); 7,557(1,2); 5,757(3,6); 4,056(0,6); 4,038(1,0); 4,031(1,1); 4,020(1,3); 4,017(1,0); 4,006(1,3); 3,992(2,6); 3,980(0,7); 3,967(3,0); 3,944(2,9); 3,930(0,6); 3,918(2,8); 3,905(1,2); 3,892(1,0); 3,878(1,2); 3,852(0,4); 3,329(31,2); 2,677(0,4); 2,672(0,5); 2,668(0,4); 2,526(1,3); 2,512(26,5); 2,508(53,3); 2,503(70,5); 2,499(52,7); 2,495(27,0); 2,335(0,3); 2,330(0,5); 2,325(0,4); 1,990(3,7); 1,397(1,3); 1,299(0,8); 1,259(1,1); 1,250(0,4); 1,234(1,6); 1,193(1,2); 1,176(2,1); 1,158(1,1); 0,146(0,6); 0,008(4,9); 0,000(120,6); -0,008(6,0); -0,150(0,6)

Paso 3: 2-(Piridin-3-il)-6-{2-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfonil]fenil}[1,3]tiazolo[4,5-d]pirimidin-7(6H)-ona (69)



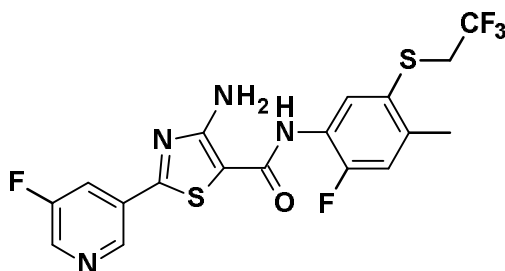
A una solución de 80,0 mg (0,18 mmol) de 2-(piridin-3-il)-6-{2-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfonil]fenil}[1,3]tiazolo[4,5-d]pirimidin-7(6H)-ona (68) en 1 ml de diclorometano se adicionaron a 0 °C 42 mg (al 77 %, 0,19 mmol) de ácido metacloroperbenzoico. La mezcla de reacción se agitó 30 minutos a temperatura ambiente y después se añadió solución saturada de carbonato de sodio. La fase acuosa se extrajo tres veces más con diclorometano y las fases orgánicas

combinadas se secaron y se filtraron. Tras la evaporación del disolvente, el residuo a continuación se purificó por cromatografía mediante MPLC con eluyente ciclohexano/acetato de etilo. Se obtuvieron 10 mg (90,0 % de pureza, 11,3 % del teórico) del compuesto del título (69).

5 **RMN de ^1H (601,6 MHz, CDCl_3):** δ = 9,372(12,3); 8,822(9,3); 8,817(9,2); 8,465(7,5); 8,453(8,0); 8,307(16,0); 8,291(8,4); 8,278(8,2); 8,192(1,6); 8,154(0,9); 7,937(0,8); 7,910(4,3); 7,898(8,3); 7,885(5,1); 7,837(5,4); 7,825(9,3); 7,813(6,0); 7,583(0,8); 7,525(6,1); 7,516(7,8); 7,513(7,9); 7,505(6,3); 7,451(9,5); 7,439(8,9); 7,263(66,7); 7,086(0,4); 5,301(4,1); 4,129(1,1); 4,112(3,4); 4,094(4,4); 4,072(3,5); 4,055(1,2); 3,882(0,3); 3,859(0,5); 3,841(0,4); 3,642(0,4); 3,625(0,5); 3,597(1,4); 3,580(3,6); 3,564(4,4); 3,558(4,0); 3,541(3,2); 3,525(1,1); 3,490(0,5); 1,577(178,8); 1,426(0,4); 1,371(1,1); 1,333(2,4); 1,285(4,4); 1,256(10,6); 1,104(0,5); 0,881(1,6); 0,842(1,6); 0,070(0,6); 0,000(47,7)

10 **Ejemplo de preparación 21: 6-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)-sulfanil]fenil}-2-(5-fluoropiridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-d]pirimidin-7(6H)-ona (74)**

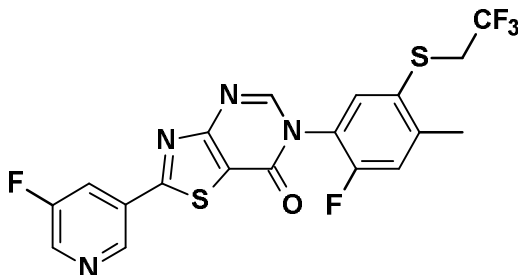
Paso 1: 4-Amino-N-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-2-(5-fluoropiridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxamida (II-73)



15 A 1,34 g (5,61 mmol) de 2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]anilina en 50 ml de 1,2-dicloroetano se adicionaron lentamente gota a gota bajo argón, 2,8 ml de una solución 2 M de trietilaluminio (5,61 mmol) en tolueno bajo enfriamiento con hielo y se agitó durante 1 hora a temperatura ambiente. A continuación se adicionaron 500 mg (1,87 mmol) de 4-amino-2-(5-fluoropiridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxilato de etilo (III-2) y la mezcla de reacción después se calentó durante la noche bajo reflujo. Después del enfriado, la mezcla de reacción se adicionó cuidadosamente a una solución al 10 % de tartrato de potasio-sodio (aprox. 120 ml). La mezcla se extrajo tres veces con cloruro de metileno, las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de magnesio, se filtraron y se concentraron. El residuo se mezcló con poca cantidad de acetonitrilo y se formó una suspensión. El residuo se retiró por succión, se lavó con n-pentano y se secó. Se obtuvieron 330 mg (98,0 % de pureza, 37,6 % del teórico) del compuesto del título (II-73).

25 **RMN de ^1H (400,0 MHz, d_6 -DMSO):** δ = 9,613(4,5); 8,971(2,3); 8,968(4,0); 8,770(3,9); 8,763(4,1); 8,155(1,2); 8,150(1,6); 8,144(1,2); 8,132(1,3); 8,127(1,7); 8,120(1,2); 7,705(3,1); 7,686(3,1); 7,273(2,8); 7,245(2,8); 7,208(5,1); 4,259(0,3); 4,241(0,3); 3,903(2,7); 3,875(4,0); 3,849(4,2); 3,823(1,4); 3,329(26,3); 2,672(0,4); 2,668(0,3); 2,525(1,0); 2,512(24,8); 2,507(49,6); 2,503(65,4); 2,499(49,2); 2,407(16,0); 2,334(0,3); 2,330(0,4); 2,325(0,3); 1,297(0,4); 1,279(0,7); 1,262(0,3); 0,008(1,0); 0,000(27,4); -0,008(1,2)

30 **Paso 2: 6-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-2-(5-fluoropiridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-d]pirimidin-7(6H)-ona (73)**

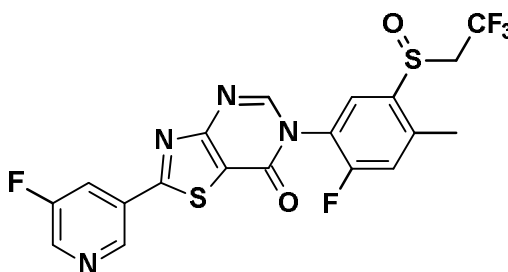


35 Se dispusieron 200 mg (pureza al 98 %, 0,43 mmol) de 4-amino-N-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-2-(5-fluoropiridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxamida (II-73) en 1 ml de *N,N*-dimetilacetamida. Se adicionaron 37 mg (0,21 mmol) de ácido p-toluensulfónico y 189 mg (1,28 mmol) de trietiléster del ácido ortofórmico y la mezcla de reacción se calentó durante 30 minutos en un microondas CEM Discover a 200 Vatios a 130 °C. La mezcla de reacción enfriada se concentró al alto vacío y se purificó mediante MPLC con eluyente acetonitrilo /agua. Se obtuvieron 50 mg (97,0 % de pureza, 24,2 % del teórico) del compuesto del título (73).

40 **RMN de ^1H (400,0 MHz, d_6 -DMSO):** δ = 9,243(3,5); 8,875(3,5); 8,868(3,6); 8,693(7,7); 8,535(1,2); 8,530(1,7); 8,524(1,2); 8,512(1,2); 8,507(1,7); 8,501(1,1); 7,940(3,1); 7,922(3,1); 7,521(2,7); 7,494(2,7); 4,061(1,2); 4,035(3,8)

4,009(3,9); 3,984(1,4); 3,329(53,8); 2,676(0,3); 2,672(0,5); 2,668(0,3); 2,507(49,1); 2,503(64,3); 2,499(49,1); 2,471(16,0); 2,414(0,5); 2,334(0,3); 2,330(0,4); 2,325(0,3); 2,076(14,3); 1,233(0,9); 0,000(0,4)

Paso 3: 6-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-2-(5-fluoropiridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-d]pirimidin-7(6H)-ona (74)



5

A una solución de 96,0 mg (0,19 mmol) de 6-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-2-(5-fluoropiridin-3-il)[1,3]tiazolo[4,5-d]pirimidin-7(6H)-ona (73) en 1 ml de diclorometano se adicionaron a 0 °C 42 mg (al 77 %, 0,19 mmol) de ácido meta-cloroperbenzoico. La mezcla de reacción se agitó durante 1 hora a temperatura ambiente y después se añadió solución saturada de carbonato de sodio. La fase acuosa se extrajo tres veces más con diclorometano y las fases orgánicas combinadas se secaron y se filtraron. Tras la evaporación del disolvente el residuo a continuación se purificó por cromatografía mediante MPLC con eluyente ciclohexano/acetato de etilo. Se obtuvieron 65 mg (94,0 % de pureza, 68,4 % del teórico) del compuesto del título (74).

10

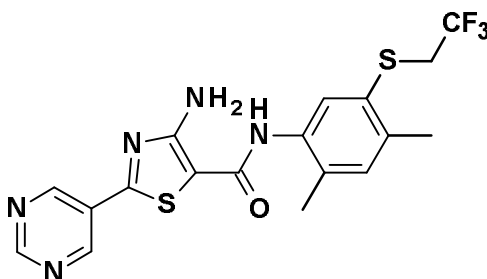
15

RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9,249(4,3); 9,246(7,4); 9,242(4,4); 8,876(7,8); 8,870(8,1); 8,738(16,0); 8,538(2,5); 8,533(3,1); 8,531(3,1); 8,527(2,4); 8,515(2,6); 8,510(3,3); 8,503(2,4); 8,447(0,5); 8,317(0,7); 8,200(6,2); 8,182(6,2); 7,639(4,3); 7,613(4,3); 5,758(2,5); 4,299(0,6); 4,266(1,0); 4,241(0,8); 4,147(0,4); 4,126(0,7); 4,099(0,8); 4,038(0,5); 4,020(0,4); 3,568(3,3); 3,329(336,9); 2,676(1,4); 2,671(2,0); 2,667(1,5); 2,525(5,0); 2,520(7,9); 2,511(110,1); 2,507(225,1); 2,502(308,8); 2,498(233,4); 2,494(111,7); 2,377(1,3); 2,334(1,5); 2,329(2,0); 2,325(1,5); 1,989(1,2); 1,234(0,4); 1,207(0,4); 1,193(0,6); 1,189(0,7); 1,175(0,8); 1,157(0,3); 0,000(0,9)

20

Ejemplo de preparación 22: 6-{2,4-dimetil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-2-(pirimidin-5-il)[1,3]tiazolo[4,5-d]pirimidin-7(6H)-ona (77)

Paso 1: 4-Amino-N-{2,4-dimetil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-2-(pirimidin-5-il)-1,3-tiazol-5-carboxamida (II-76)



25

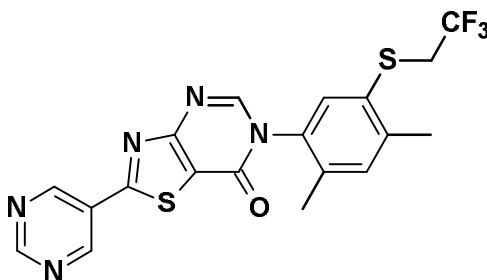
A 987 mg (4,20 mmol) de 2,4-dimetil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]anilina en 70 ml de 1,2-dicloroetano se adicionaron lentamente gota a gota bajo argón 2,1 ml de una solución 2 M de trietilaluminio (4,20 mmol) en tolueno bajo enfriamiento con hielo y se agitó durante 1 hora a temperatura ambiente. A continuación se adicionaron 350 mg (1,40 mmol) de 4-amino-2-(pirimidin-5-il)-1,3-tiazol-5-carboxilato de etilo (III-3) y la mezcla de reacción después se calentó durante la noche bajo reflujo. Después del enfriado, la mezcla de reacción se adicionó cuidadosamente a una solución al 10 % de tartrato de potasio-sodio (aprox. 120 ml). La mezcla se extrajo tres veces con cloruro de metileno, las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de magnesio, se filtraron y se concentraron. El residuo se mezcló con poca cantidad de acetonitrilo y se formó una suspensión. El residuo se retiró por succión, se lavó con n-pentano y se secó. Se obtuvieron 215 mg (90,0 % de pureza, 31,5 % del teórico) del compuesto del título (II-76).

30

35

RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9,410(4,5); 9,327(6,4); 9,285(1,2); 9,247(11,7); 7,465(5,7); 7,176(7,8); 7,170(7,4); 6,814(0,5); 6,793(0,6); 5,754(0,7); 4,743(0,5); 4,264(0,5); 4,246(0,5); 3,875(1,3); 3,849(4,0); 3,823(4,1); 3,798(1,5); 3,691(0,5); 3,666(0,5); 3,320(121,1); 2,671(1,0); 2,502(151,6); 2,418(0,3); 2,367(15,3); 2,329(1,4); 2,205(1,9); 2,162(16,0); 2,074(0,8); 2,000(1,8); 1,300(0,5); 1,282(1,1); 1,265(0,6); 0,147(0,4); 0,000(72,2); -0,149(0,4)

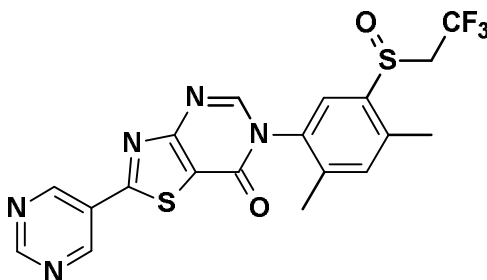
Paso 2: 6-{2,4-dimetil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-2-(pirimidin-5-il)-[1,3]tiazolo[4,5-d]pirimidin-7(6H)-ona (76)



Se mezclaron 100 mg (0,23 mmol) de 4-amino-N-{2,4-dimetil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-2-(pirimidin-5-il)-1,3-tiazol-5-carboxamida (II-76) y 20 mg (0,11 mmol) de ácido p-toluensulfónico junto con 5 ml (30,1 mmol) de trietiléster del ácido ortofórmico y la mezcla de reacción se calentó 40 min en un microondas CEM Discover a 150 °C. La mezcla de reacción enfriada se concentró al vacío y a continuación se purificó por cromatografía mediante MPLC. Se obtuvieron 36 mg (94,0 % de pureza, 33,1 % del teórico) del compuesto del título (76).

RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9,538(16,0); 9,429(7,5); 8,559(8,5); 7,680(4,9); 7,362(3,9); 5,754(1,8); 4,034(1,0); 4,008(2,9); 3,982(3,1); 3,956(1,1); 3,318(38,5); 2,671(0,4); 2,524(1,0); 2,511(23,9); 2,506(47,7); 2,502(62,3); 2,497(45,4); 2,493(22,1); 2,411(12,3); 2,368(0,6); 2,329(0,4); 2,170(0,5); 2,080(13,3); 1,352(1,1); 1,336(0,4); 1,259(0,4); 1,250(0,6); 1,229(1,2); 0,000(3,8)

Paso 3: 6-{2,4-dimetil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-2-(pirimidin-5-il)-[1,3]tiazolo[4,5-d]pirimidin-7(6H)-ona (77)



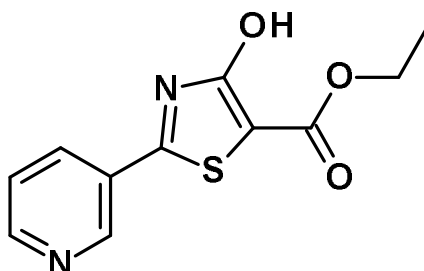
A una solución de 70,0 mg (0,15 mmol) de 6-{2,4-dimetil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenil}-2-(pirimidin-5-il)-[1,3]tiazolo[4,5-d]pirimidin-7(6H)-ona (76) en 3 ml de diclorometano se adicionaron a 0 °C 33 mg (al 77 %, 0,15 mmol) de ácido meta-cloroperbenzoico. La mezcla de reacción se agitó una hora más al frío y a continuación durante la noche a temperatura ambiente. El preparado luego se lavó sucesivamente con solución saturada de hidrosulfito de sodio, solución de hidrocarbonato de sodio y solución de cloruro de sodio, se secó y se concentró. El residuo a continuación se purificó por cromatografía mediante MPLC. Se obtuvieron 20 mg (97,0 % de pureza, 28,7 % del teórico) del compuesto del título (77).

RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9,542(16,0); 9,429(7,8); 8,612(8,8); 7,949(4,1); 7,939(2,8); 7,497(2,0); 7,471(3,0); 5,754(0,9); 4,321(0,4); 4,293(0,5); 4,284(0,5); 4,257(0,5); 4,175(0,4); 4,166(0,4); 4,148(1,1); 4,139(1,1); 4,121(1,1); 4,112(1,2); 4,094(0,4); 4,085(0,4); 3,969(0,5); 3,942(0,5); 3,932(0,4); 3,905(0,5); 3,317(54,5); 2,675(0,5); 2,671(0,7); 2,666(0,5); 2,506(79,6); 2,502(106,3); 2,497(82,4); 2,452(8,0); 2,447(10,7); 2,338(0,5); 2,333(0,6); 2,328(0,7); 2,324(0,6); 2,258(0,4); 2,188(10,5); 2,182(8,0); 1,234(0,7); 0,008(0,5); 0,000(13,1)

Síntesis de aminotiazoles de la fórmula (III) según el procedimiento B

Ejemplo de preparación 9: 4-amino-2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxilato de etilo (III-1)

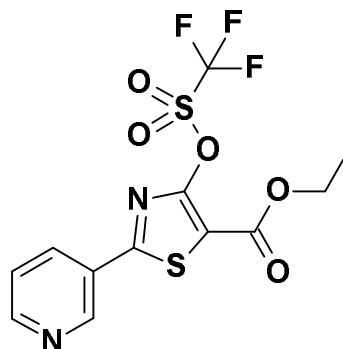
Paso 1: 4-hidroxi-2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxilato de etilo (VI-1)



Se dispusieron 32,5 g (235,2 mmol) de piridin-3-carbotioamida en 200 ml etanol y se adicionaron 58,5 g (244,6 mmol) de bromomalonato de dietilo. La mezcla se calentó durante la noche bajo reflujo, a continuación se enfrió y se filtró. El residuo del filtro se lavó bien con etanol y se secó al vacío. Se obtuvieron 26,0 g (83,0 % de pureza, 36,7 % del teórico) del compuesto del título (VI-1).

5 **RMN de ¹H (399,9 MHz, d₆-DMSO):** δ = 9,150 (2,8); 9,145 (2,8); 8,771 (1,9); 8,768 (2,0); 8,759 (2,0); 8,756 (2,0); 8,399 (1,1); 8,395 (1,7); 8,390 (1,3); 8,379 (1,3); 8,375 (1,8); 7,670 (1,6); 7,657 (1,7); 7,649 (1,7); 7,637 (1,5); 7,249 (13,6); 7,121 (14,1); 6,993 (13,7); 4,695 (0,3); 4,673 (0,4); 4,609 (0,4); 4,597 (0,5); 4,584 (0,5); 4,578 (0,5); 4,559 (0,5); 4,507 (0,6); 4,498 (0,6); 4,488 (0,6); 4,475 (0,6); 4,459 (0,6); 4,441 (0,7); 4,435 (0,7); 4,404 (0,7); 4,397 (0,7); 4,387 (0,8); 4,369 (0,8); 4,351 (0,7); 4,335 (0,7); 4,294 (3,1); 4,276 (8,4); 4,259 (8,5); 4,241 (3,1); 4,111 (0,4); 4,089 (0,3); 4,071 (0,3); 2,533 (0,5); 2,504 (7,3); 2,500 (14,4); 2,495 (20,1); 2,490 (14,7); 2,486 (7,6); 1,306 (7,9); 1,288 (16,0); 1,270 (7,7); 1,064 (0,5); 0,000 (2,3)

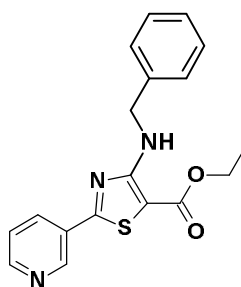
Paso 2: 2-(piridin-3-il)-4-[(trifluorometil)sulfonyl]oxi-1,3-tiazol-5-carboxilato de etilo (V-1)



15 Se dispusieron 500 mg (2 mmol) de 4-hidroxi-2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxilato de etilo seco (VI-1) junto con 414 g (3 mmol) carbonato de potasio en diclorometano bajo argón a temperatura ambiente. Se adicionaron gota a gota 620 mg (2,2 mmol) de anhídrido de ácido trifluorometansulfónico en el plazo de 10 minutos y la mezcla se agitó durante la noche a temperatura ambiente. El preparado a continuación se lavó con solución saturada de hidrocbonato de sodio, se filtró la fase orgánica sobre poca cantidad de celite, se lavó posteriormente con diclorometano y el filtrado se secó sobre sulfato de sodio. La purificación del residuo obtenido después de la concentración por evaporación, se produjo después mediante MPLC en el eluyente ciclohexano /acetato de etilo en el gradiente. Se obtuvieron 220 mg (100,0 % de pureza, 28,7 % del teórico) del compuesto del título (V-1).

20 **RMN de ¹H (399,9 MHz, d₆-DMSO):** δ = 3,115 (16,0); 2,498 (0,9); 2,493 (1,8); 2,489 (2,5); 2,484 (1,8); 2,479 (0,9); 1,341 (0,5)

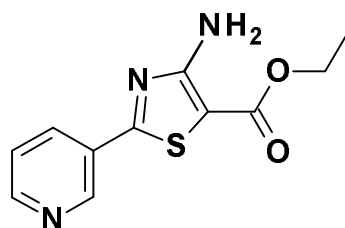
Paso 3: 4-(bencilamino)-2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxilato de etilo (IV-1)



25 Se agitaron 20,0 g (52,0 mmol) de 2-(piridin-3-il)-4-[(trifluorometil)sulfonyl]oxi-1,3-tiazol-5-carboxilato de etilo (V-1) y 11,2 g (104,1 mmol) de bencilamina en 100 ml de dioxano durante la noche bajo reflujo. Después del enfriamiento y concentrado por evaporación de la mezcla de reacción, se añadió metanol al residuo oleoso, se separó por succión el sólido precipitado de color amarillo y se lavó con pentano. A continuación se eliminó la bencilamina excedente en el producto en bruto mediante el lavado con ácido clorhídrico 1 N. El producto en bruto después se lavó con agua, se agitó con pentano, se aspiró y se secó al vacío. Se obtuvieron 13,5 g (100 % de pureza, 76,4 % del teórico) del compuesto del título (IV-1).

30 **RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO):** δ = 9,153(4,6); 9,148(4,9); 8,745(3,2); 8,742(3,3); 8,733(3,3); 8,730(3,1); 8,374(1,6); 8,370(2,5); 8,366(1,7); 8,354(1,9); 8,350(2,7); 7,618(3,8); 7,605(3,4); 7,597(2,9); 7,585(2,4); 7,413(4,4); 7,394(7,2); 7,347(4,0); 7,329(7,1); 7,309(3,6); 7,251(2,2); 7,233(3,1); 7,215(1,1); 4,780(4,8); 4,767(4,8); 4,285(2,3); 4,267(7,3); 4,249(7,4); 4,232(2,5); 4,039(0,4); 4,021(0,4); 3,913(2,0); 3,775(0,7); 3,760(0,7); 3,744(0,7); 2,509(41,8); 2,505(53,2); 2,501(40,7); 2,332(0,4); 1,990(1,1); 1,297(7,8); 1,280(16,0); 1,262(7,6); 1,176(0,6); 0,000(6,0)

Paso 4: 4-amino-2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxilato de etilo (III-1)

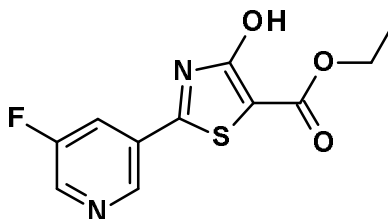


Se dispusieron 40 ml de ácido sulfúrico concentrado y se adicionaron lentamente 8,5 g (25,0 mmol) de 4-(bencilamino)-2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxilato de etilo (IV-1) a 20 °C. La mezcla de reacción se agitó 3 h a temperatura ambiente, después se vertió sobre 500 ml de agua helada y se ajustó cuidadosamente con una solución al 30 % de hidróxido de potasio a un valor de pH 10t. La mezcla se extrajo a continuación con acetato de etilo, se secaron las fases orgánicas y se concentraron por evaporación. Se obtuvieron 6,0 g (100 % de pureza, 96,1 % del teórico) del compuesto del título (III-1).

RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9,113(4,3); 9,109(4,3); 9,107(4,3); 8,730(3,0); 8,727(3,4); 8,718(3,3); 8,715(3,4); 8,296(1,7); 8,291(2,6); 8,286(1,9); 8,276(1,8); 8,271(2,7); 8,266(2,0); 7,578(2,4); 7,566(2,5); 7,558(2,4); 7,546(2,3); 7,139(3,5); 4,271(2,4); 4,253(7,5); 4,236(7,6); 4,218(2,5); 3,333(25,6); 2,504(43,0); 2,500(34,6); 1,990(0,5); 1,296(7,8); 1,278(16,0); 1,261(7,7); 0,000(0,6)

Ejemplo de preparación 23: -4-amino-2-(5-fluoropiridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxilato de etilo (III-2)

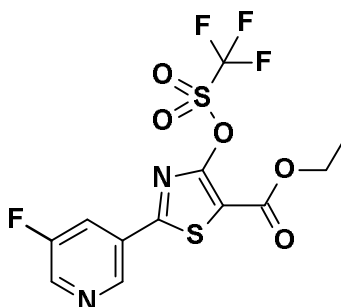
Paso 1: 2-(5-fluoropiridin-3-il)-4-hidroxi-1,3-tiazol-5-carboxilato de etilo (VI-2)



Se dispusieron 38,6 g (247 mmol) de 5-fluoropiridin-3-carbotioamida en 250 ml de etanol y a continuación se adicionaron 60 ml de piridina y 177,3 g (741 mmol) de bromomalonato de dietilo. La mezcla después se calentó durante la noche bajo reflujo, a continuación se enfrió y se filtró. El residuo del filtro se lavó bien con etanol y se secó al vacío. Se obtuvieron 37,0 g (94,9 % de pureza, 53,0 % del teórico) del compuesto del título (VI-2).

RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9,013(4,9); 8,765(4,9); 8,758(5,0); 8,227(1,6); 8,221(2,1); 8,216(1,6); 8,204(1,6); 8,198(2,1); 8,193(1,5); 4,275(2,3); 4,258(7,3); 4,240(7,4); 4,222(2,4); 3,324(2,6); 2,508(32,1); 2,504(41,6); 2,500(31,7); 1,294(7,8); 1,276(16,0); 1,259(7,6); 0,000(3,7)

Paso 2: 2-(5-fluoropiridin-3-il)-4-[[trifluorometil]sulfonyloxi]-1,3-tiazol-5-carboxilato de etilo (V-2)

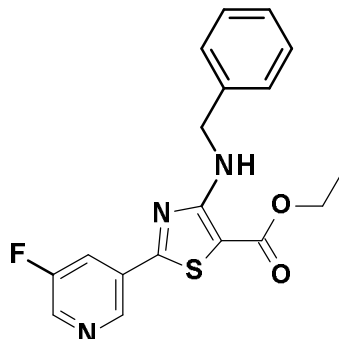


Se dispusieron 37,0 g (138 mmol) de 2-(5-fluoropiridin-3-il)-4-hidroxi-1,3-tiazol-5-carboxilato de etilo (VI-2) bajo argón en 300 ml de diclorometano, 45 ml de piridina y el preparado se enfrió a 0 °C. A continuación se adicionaron lentamente 54,5 g (193 mmol) de anhídrido de ácido trifluorometansulfónico y la mezcla se agitó durante la noche a temperatura ambiente. El preparado se filtró, se lavó el residuo del filtro con diclorometano y el filtrado se concentró por evaporación. El residuo obtenido se calentó con 400 ml de terc-butil-éter de butilo (MTBE) durante 30 min a 55 °C y se decantó tibio. Este proceso se repitió en cada caso con otros 300 ml de MTBE. Las fracciones de MTBE combinadas se concentraron por evaporación y el residuo obtenido se secó al vacío. Se obtuvieron 55,8 g (98,6 % de pureza, 99,6 % del teórico) del compuesto del título (V-2).

RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9,083(2,7); 9,079(4,5); 9,076(2,7); 8,849(4,5); 8,842(4,5); 8,364(1,5); 8,359(1,9); 8,357(1,9); 8,353(1,5); 8,341(1,6); 8,336(2,0); 8,334(1,8); 8,329(1,4); 4,427(2,2); 4,409(7,2); 4,392(7,3);

4,374(2,3); 3,569(13,3); 3,344(8,3); 2,672(0,3); 2,526(0,8); 2,512(19,0); 2,508(38,3); 2,503(50,2); 2,499(37,2); 2,494(18,6); 2,330(0,3); 1,355(7,6); 1,337(16,0); 1,319(7,4); 0,000(3,2)

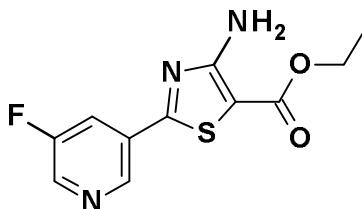
Paso 3: 4-(bencilamino)-2-(5-fluoropiridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxilato de etilo (IV-2)



5 Se agitaron 55,8 g (139 mmol) de 2-(5-fluoropiridin-3-il)-4-[[trifluorometil]sulfonyloxi]-1,3-tiazol-5-carboxilato de etilo (V-2) y 29,7 g (277 mmol) de bencilamina en 300 ml de dioxano durante la noche bajo reflujo. Después del enfriado y concentrado por evaporación de la mezcla de reacción, se añadió metanol al residuo oleoso, se separó mediante filtración con succión el sólido amarillo que precipitaba y se lavó con pentano. A continuación, el exceso de bencilamina en el producto en bruto se eliminó mediante lavado con ácido clorhídrico 1 N. El producto en bruto posteriormente se lavó con agua, se agitó con pentano, se aspiró y se secó al vacío. Se obtuvieron 42,6 g (100 % de pureza, 85,9 % del teórico) del compuesto del título (IV-2).

10 **RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO):** δ = 9,015(2,9); 9,011(4,9); 8,746(4,6); 8,740(4,7); 8,249(1,5); 8,244(1,9); 8,242(1,9); 8,238(1,5); 8,225(1,6); 8,220(2,0); 8,214(1,5); 7,628(1,1); 7,612(2,3); 7,596(1,2); 7,444(0,4); 7,411(4,0); 7,393(6,2); 7,344(3,6); 7,340(1,3); 7,326(6,6); 7,307(3,3); 7,249(2,0); 7,231(2,8); 7,213(1,0); 4,782(5,7); 4,766(5,7); 4,289(2,2); 4,271(7,1); 4,253(7,3); 4,236(2,3); 4,029(0,5); 3,568(0,4); 3,318(32,2); 2,676(0,4); 2,671(0,6); 2,667(0,4); 2,524(1,1); 2,511(33,4); 2,507(65,6); 2,502(85,2); 2,498(63,3); 2,494(31,8); 2,333(0,4); 2,329(0,6); 2,324(0,4); 1,298(7,6); 1,280(16,0); 1,262(7,5); 0,146(0,4); 0,008(3,4); 0,000(85,6); -0,008(3,8); -0,019(0,4); -0,150(0,4)

Paso 4: 4-amino-2-(5-fluoropiridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxilato de etilo (III-2)



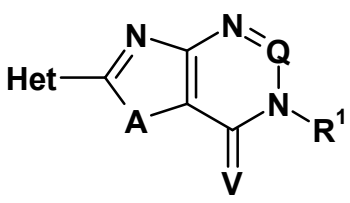
20 Se dispusieron 3 ml de ácido sulfúrico concentrado y se adicionaron lentamente 500 mg (1,39 mmol) de 4-(bencilamino)-2-(5-fluoropiridin-3-il)-1,3-tiazol-5-carboxilato de etilo (IV-2) a 20 °C. La mezcla de reacción se agitó durante la noche a temperatura ambiente, después se vertió sobre 10 ml de agua helada y cuidadosamente se ajustó con solución al 30 % de hidróxido de potasio a un valor de pH 10. A continuación la mezcla se extrajo con acetato de etilo, las fases orgánicas se secaron sobre sulfato de magnesio y se concentraron por evaporación. El residuo se agitó con n-pentano, se filtró y se secó. Se obtuvieron 200 mg (100 % de pureza, 53,5 % del teórico) del compuesto del título (III-2).

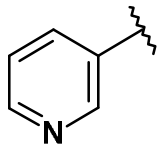
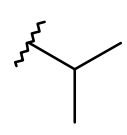
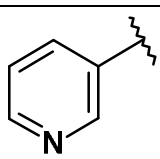
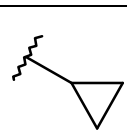
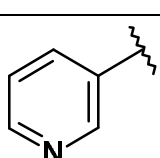
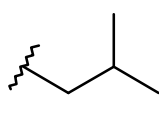
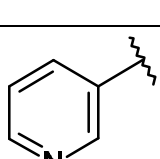
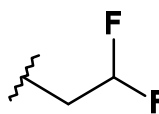
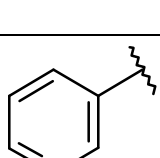
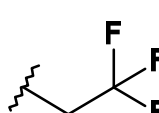
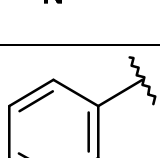
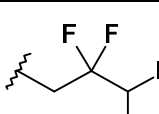
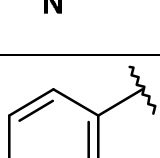
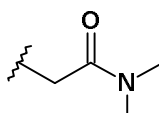
25 **RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO):** δ = 8,994(6,0); 8,757(5,4); 8,750(5,8); 8,193(2,8); 8,170(2,8); 7,143(4,8); 4,278(2,6); 4,260(7,7); 4,242(7,8); 4,225(2,7); 3,319(18,0); 2,673(0,3); 2,504(52,6); 2,331(0,3); 1,298(8,1); 1,280(16,0); 1,263(7,9); 0,000(11,1)

30 Otros compuestos de la fórmula (I) están indicados en la siguiente tabla.

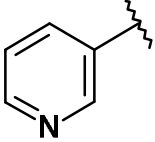
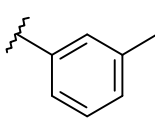
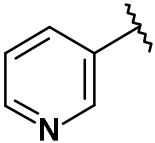
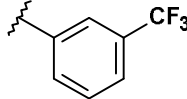
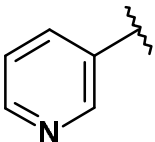
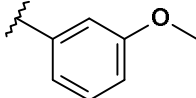
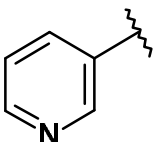
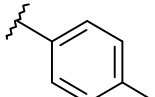
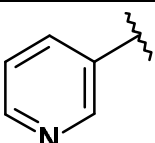
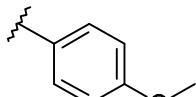
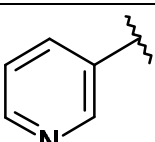
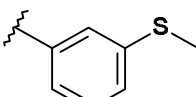
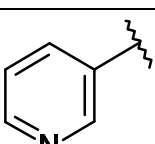
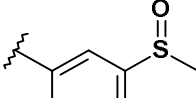
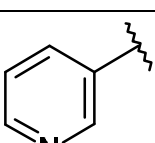
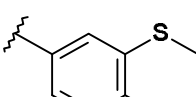
Tabla 1

Compuestos de la fórmula (I)

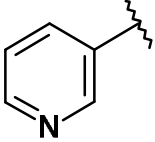
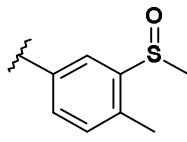
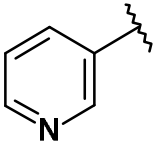
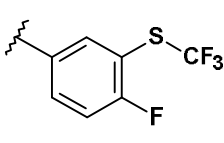
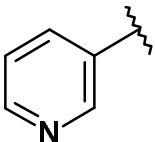
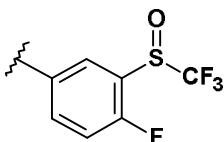
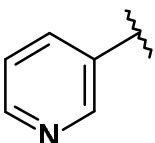
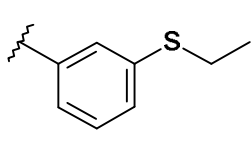
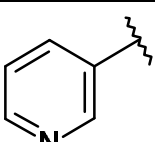
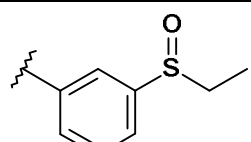
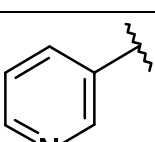
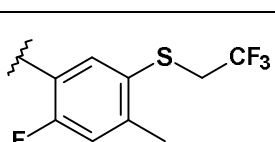
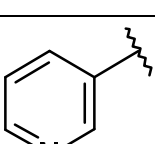
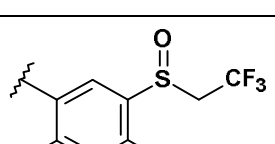
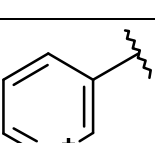
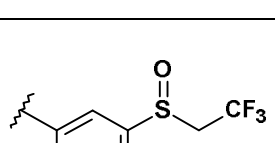


Nº de compuesto	Het	A	Q	V	R ¹
1		S	CH	O	
2		S	CH	O	
3		S	CH	O	
4		S	CH	O	
5		S	CH	O	
6		S	CH	O	
7		S	CH	O	

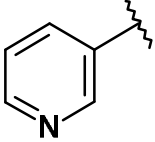
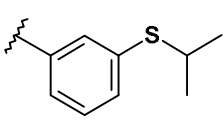
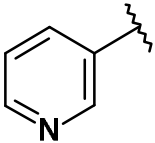
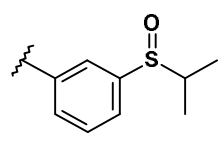
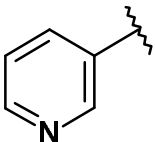
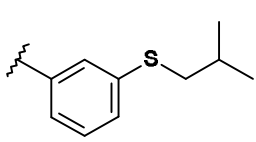
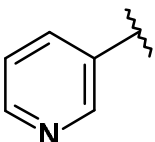
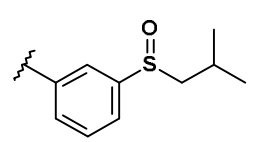
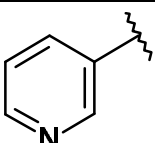
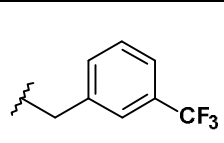
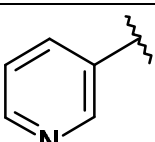
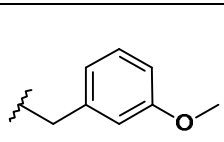
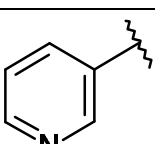
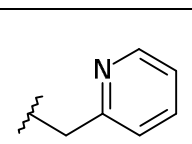
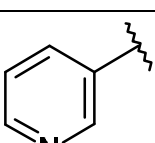
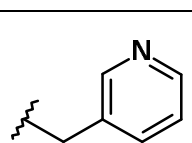
(continuación)

Nº de compuesto	Het	A	Q	V	R ¹
8		S	CH	O	
9		S	CH	O	
10		S	CH	O	
11		S	CH	O	
12		S	CH	O	
13		S	CH	O	
14		S	CH	O	
15		S	CH	O	

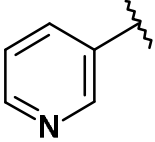
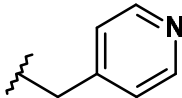
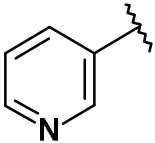
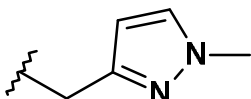
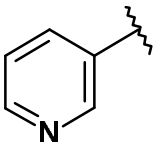
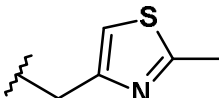
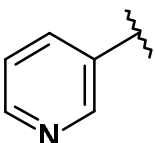
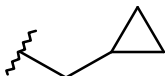
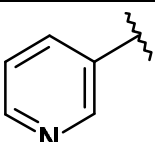
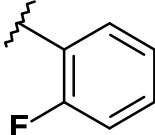
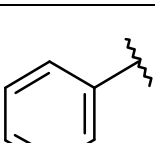
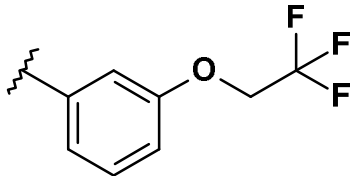
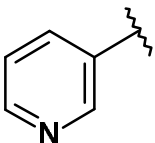
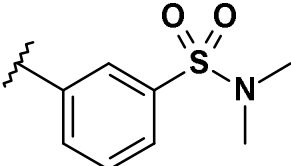
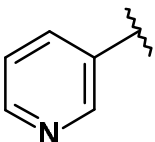
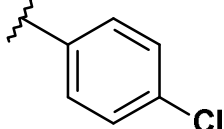
(continuación)

Nº de compuesto	Het	A	Q	V	R ¹
16		S	CH	O	
17		S	CH	O	
18		S	CH	O	
19		S	CH	O	
20		S	CH	O	
21		S	CH	O	
22		S	CH	O	
23		S	CH	O	

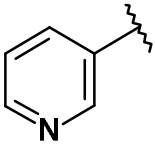
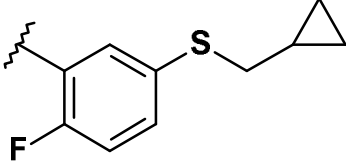
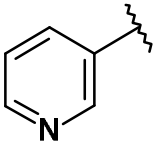
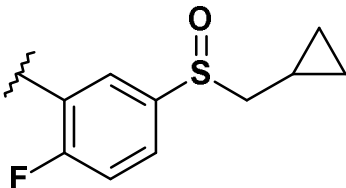
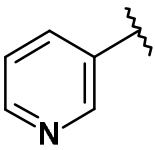
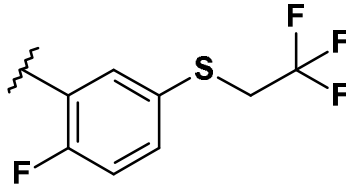
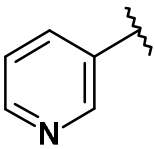
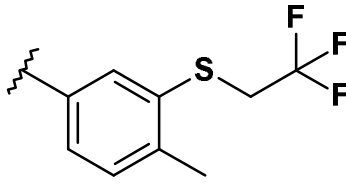
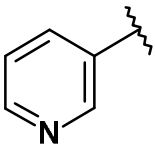
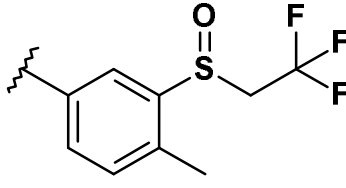
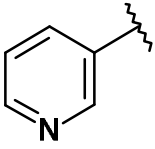
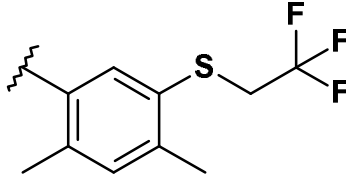
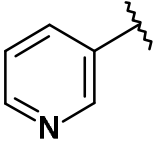
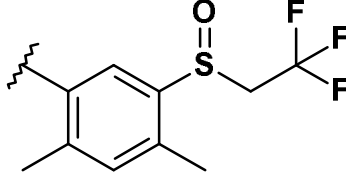
(continuación)

Nº de compuesto	Het	A	Q	V	R ¹
24		S	CH	O	
25		S	CH	O	
26		S	CH	O	
27		S	CH	O	
28		S	CH	O	
32		S	CH	O	
34		S	CH	O	
35		S	CH	O	

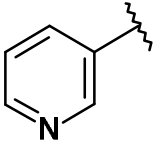
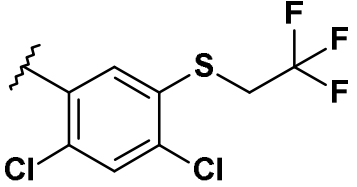
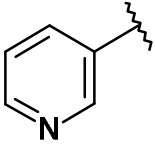
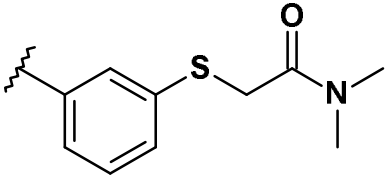
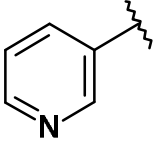
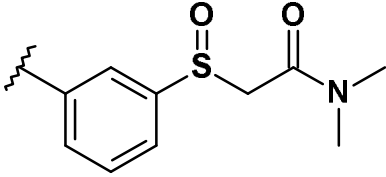
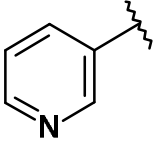
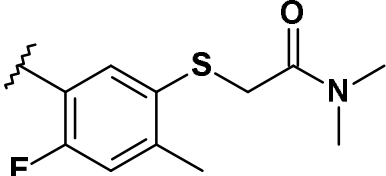
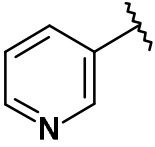
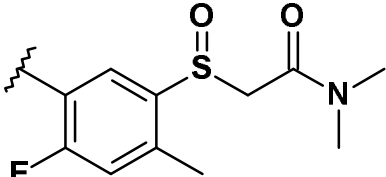
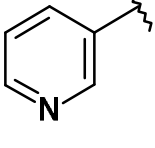
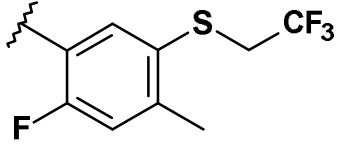
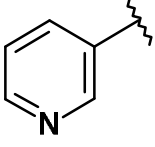
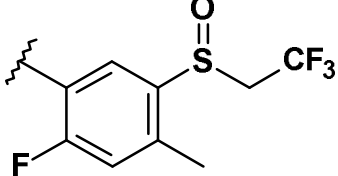
(continuación)

Nº de compuesto	Het	A	Q	V	R ¹
36		S	CH	O	
37		S	CH	O	
38		S	CH	O	
39		S	CH	O	
40		S	CH	O	
41		S	CH	O	
42		S	CH	O	
43		S	CH	O	

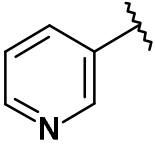
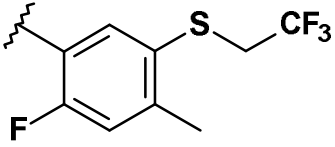
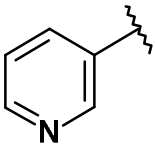
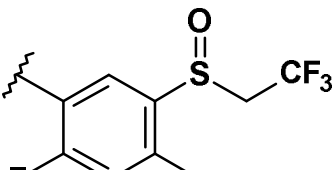
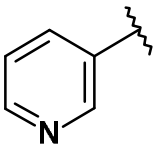
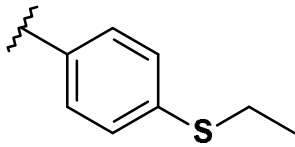
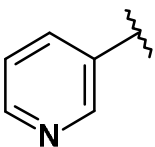
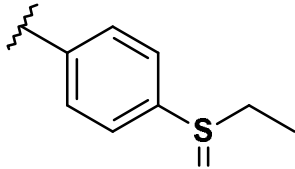
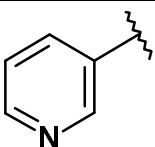
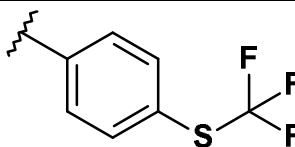
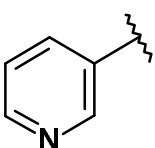
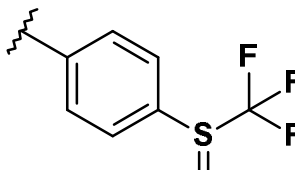
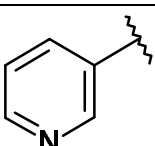
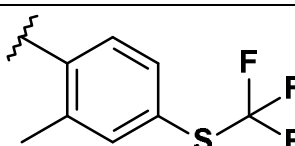
(continuación)

Nº de compuesto	Het	A	Q	V	R ¹
44		S	CH	O	
45		S	CH	O	
46		S	CH	O	
47		S	CH	O	
48		S	CH	O	
49		S	CH	O	
50		S	CH	O	

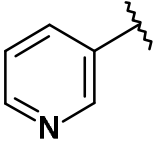
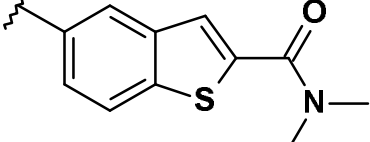
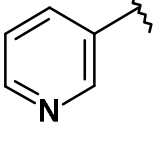
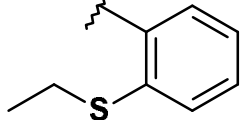
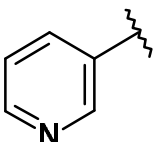
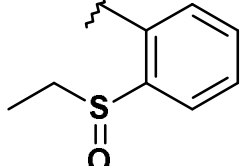
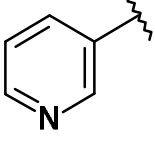
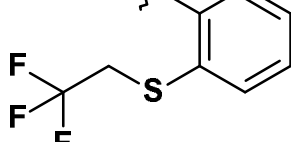
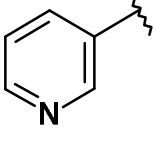
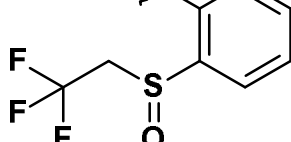
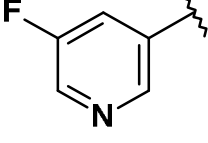
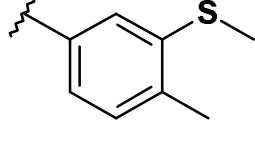
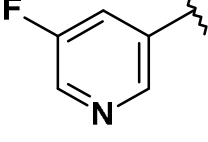
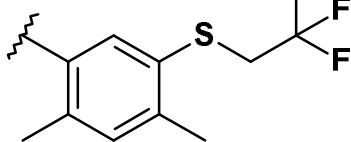
(continuación)

Nº de compuesto	Het	A	Q	V	R ¹
51		S	CH	O	
52		S	CH	O	
53		S	CH	O	
54		S	CH	O	
55		S	CH	O	
56		S	C-CH3	O	
57		S	C-CH3	O	

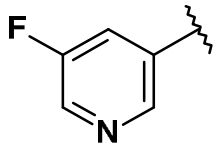
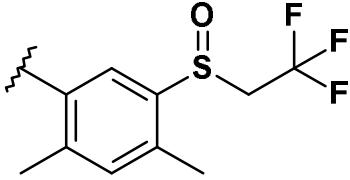
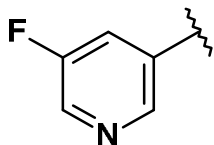
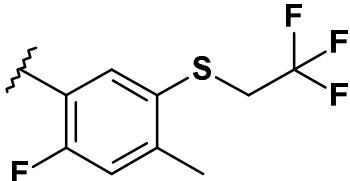
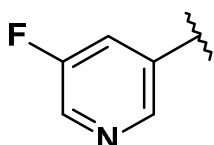
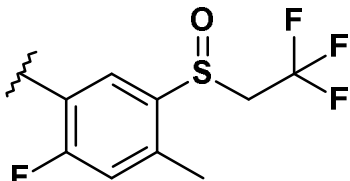
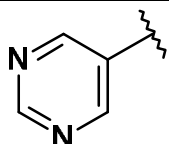
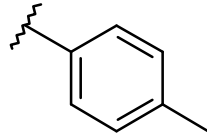
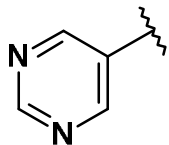
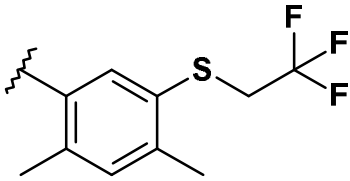
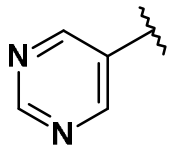
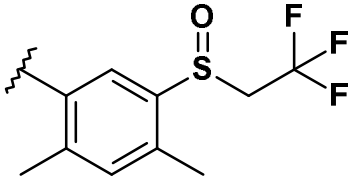
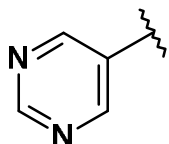
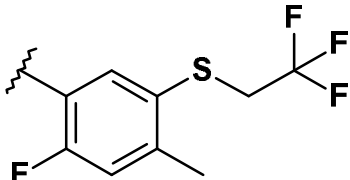
(continuación)

Nº de compuesto	Het	A	Q	V	R ¹
58		S	N	O	
59		S	N	O	
60		S	CH	O	
61		S	CH	O	
62		S	CH	O	
63		S	CH	O	
64		S	CH	O	

(continuación)

N° de compuesto	Het	A	Q	V	R ¹
65		S	CH	O	
66		S	CH	O	
67		S	CH	O	
68		S	CH	O	
69		S	CH	O	
70		S	CH	O	
71		S	CH	O	

(continuación)

Nº de compuesto	Het	A	Q	V	R ¹
72		S	CH	O	
73		S	CH	O	
74		S	CH	O	
75		S	CH	O	
76		S	CH	O	
77		S	CH	O	
78		S	CH	O	

(continuación)

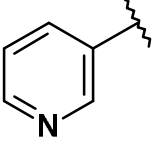
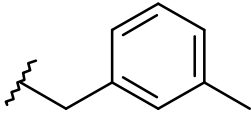
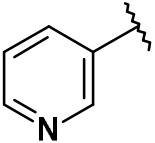
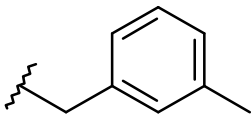
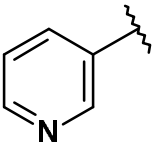
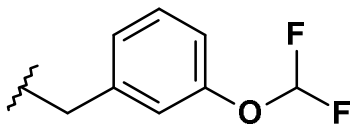
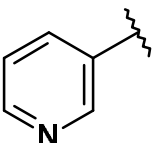
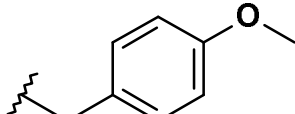
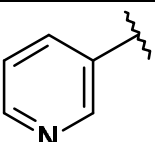
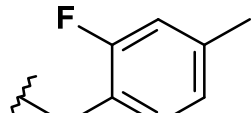
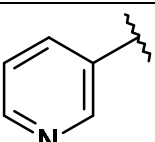
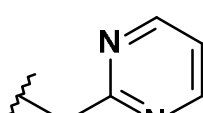
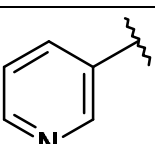
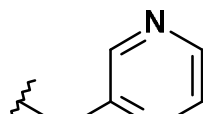
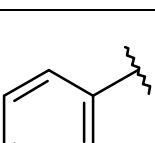
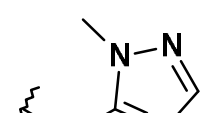
Nº de compuesto	Het	A	Q	V	R ¹
79		S	CH	O	
80		S	C-CH ₃	O	
81		S	CH	O	
82		S	CH	O	
83		S	CH	O	
84		S	CH	O	
85		S	CH	O	
86		S	CH	O	

Tabla 2

Datos analíticos de los compuestos indicados			
Ej. N°	logP[a]	logP[b]	RMN de ¹ H [σ (ppm)] o bien CL-EM [m/z]
1	1,35	1,43	RMN de ¹ H (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,307(2,2); 9,302(2,2); 8,814(1,6); 8,811(1,7); 8,802 (1,7); 8,799(1,7); 8,734(6,2); 8,516(1,0); 8,512(1,3); 8,506(1,0); 8,496(1,1); 8,491 (1,4); 8,486(1,0); 8,144(3,9); 7,659(1,3); 7,647(1,3); 7,641(1,3); 7,639(1,3); 7,628 (1,2); 7,627(1,2); 5,054(0,4); 5,037(1,1); 5,019(1,5); 5,002(1,1); 4,985(0,4); 3,337 (1,4); 2,526(0,8); 2,513(17,3); 2,508 (34,7); 2,504(45,2); 2,499(32,4); 2,495(15,5); 1,483 (16,0); 1,466(15,8); 1,142(0,4); 1,126 (0,4); 0,000(8,5)
2		1,05	CL-EM: masa resultante [m/z] = 270,06
3	1,70		RMN de ¹ H (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,302(2,1); 9,297(2,1); 9,049(0,4); 9,044(0,4); 8,815(1,8); 8,811(1,9); 8,803(1,8); 8,799 (1,8); 8,703(0,3); 8,699(0,4); 8,691(0,4); 8,687(0,4); 8,634(6,2); 8,510(1,1); 8,506 (1,4); 8,500(1,1); 8,490(1,1); 8,486(1,4); 8,484(1,4); 8,480(1,1); 7,662(1,3); 7,660(1,4); 7,650(1,3); 7,648(1,3); 7,642 (1,3); 7,640(1,3); 7,630(1,2); 7,628(1,3); 6,974(0,7); 3,895(4,7); 3,876(4,7); 3,323 (24,1); 3,022 (0,4); 3,005(0,6); 2,990(0,4); 2,512(10,6); 2,508(21,2); 2,503(27,9); 2,499(20,3); 2,495(10,0); 2,162(0,4); 2,145 (0,8); 2,128 (1,0); 2,111(0,9); 2,093(0,4); 0,916(16,0); 0,899(15,5); 0,873(3,2); 0,856 (3,1); 0,008(0,3); 0,000(8,4); -0,008(0,3)
4	1,19		RMN de ¹ H (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,317(7,3); 9,313(7,0); 9,064(1,2); 9,060(1,2); 8,824 (5,6); 8,820(6,0); 8,812(5,9); 8,808(5,8); 8,719(0,9); 8,716(1,0); 8,707(1,0); 8,704(0,9); 8,642(16,0); 8,527(3,3); 8,522 (4,3); 8,517 (3,2); 8,507(3,5); 8,502(4,6); 8,497(3,3); 8,317(0,5); 8,238(0,7); 8,233 (1,1); 8,229(0,7); 8,218(1,3); 8,214(1,0); 8,208(0,8); 8,149(2,5); 7,666(4,2); 7,654(4,2); 7,646(4,1); 7,636(3,8); 7,634 (3,9); 7,586(0,7); 7,574(0,7); 7,566(0,6); 7,554(0,6); 7,101(2,0); 6,573(1,0); 6,564(2,0); 6,555(0,9); 6,436(2,0); 6,427 (4,2); 6,418(1,9); 6,298(1,0); 6,289(2,1); 6,280(1,0); 6,077(0,6); 5,937(0,3); 4,626(3,1); 4,617(3,4); 4,589(6,9); 4,580 (6,7); 4,551(3,5); 4,542(3,3); 3,622(0,4); 3,611(0,3); 3,597(0,6); 3,583(0,7); 3,573 (0,6); 3,559(0,3); 3,545(0,4); 3,334(26,6); 2,677 (0,6); 2,673(0,8); 2,669(0,6); 2,526(1,7); 2,513(45,8); 2,508(92,2); 2,504 (120,6); 2,500(86,8); 2,495(41,6); 2,335(0,6); 2,331 (0,8); 2,326(0,6); 2,288(0,5); 0,008(0,6); 0,000(15,7); -0,009(0,6)
5	1,54		RMN de ¹ H (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,320(8,2); 9,315(8,2); 9,302(0,4); 8,829(6,4); 8,825 (6,8); 8,817(6,9); 8,813(6,6); 8,698(16,0); 8,530 (4,0); 8,526(5,1); 8,520(3,9); 8,510 (4,3); 8,506(5,3); 8,505(5,3); 8,500(4,0); 8,318(0,4); 7,672(4,8); 7,671(4,8); 7,660(4,8); 7,659(4,7); 7,652(4,8); 7,651 (4,6); 7,640(4,5); 7,639(4,4); 5,143(0,3); 5,121(0,4); 5,089(3,5); 5,067 (11,4); 5,044 (11,9); 5,021(4,0); 3,363(0,6); 3,336(289,1); 2,720(1,5); 2,678(0,6); 2,674 (0,8); 2,669(0,6); 2,527(2,1); 2,513(48,7); 2,509 (96,7); 2,505(125,4); 2,500(89,6); 2,496(42,7); 2,336(0,6); 2,331(0,8); 2,327 (0,6); 2,077(0,4); 0,008(1,2); 0,000(30,0); -0,008(1,1)

ES 2 747 810 T3

(continuación)

Ej. N°	logP[a]	logP[b]	RMN de ¹ H [σ (ppm)] o bien CL-EM [m/z]
6	1,57		RMN de ¹ H (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,313(4,1); 9,308 (4,1); 8,818 (2,9); 8,809 (2,9); 8,806 (3,0); 8,789 (13,6); 8,521 (2,0); 8,517 (2,8); 8,511 (2,1); 8,501 (2,3); 8,496 (3,3); 8,491 (4,6); 8,477 (3,1); 7,841 (1,8); 7,837 (1,8); 7,822 (3,6); 7,818 (3,7); 7,803 (2,1); 7,798 (2,1); 7,666 (2,5); 7,654 (2,5); 7,646 (2,4); 7,634 (2,3); 7,478 (4,2); 7,458 (3,8); 7,333 (2,2); 7,321 (2,3); 7,316 (2,3); 7,304 (2,0); 5,399 (16,0); 3,904 (5,6); 3,508 (0,3); 3,477 (0,4); 3,455 (0,5); 3,354 (684,8); 3,268 (0,4); 3,175 (0,6); 3,162 (0,6); 2,678 (0,9); 2,673 (1,3); 2,669 (1,0); 2,526 (3,9); 2,513 (80,9); 2,509 (159,9); 2,504 (207,8); 2,500 (153,1); 2,496 (77,4); 2,335 (0,9); 2,331 (1,2); 2,327 (0,9); 1,234 (0,5); 0,008 (0,5); 0,000 (16,1); -0,008 (0,6)
7	0,65		RMN de ¹ H (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,317(2,0); 9,312(2,1); 8,821(1,7); 8,817(1,8); 8,809 (1,8); 8,805(1,7); 8,525(1,0); 8,521(1,4); 8,516(1,1); 8,501(7,3); 7,667(1,3); 7,655 (1,3); 7,647(1,3); 7,635(1,2); 5,010(7,5); 3,320(48,4); 3,297(0,4); 3,104(16,0); 2,884 (14,6); 2,670(0,4); 2,540(0,3); 2,506(47,9); 2,502(61,3); 2,497(44,5); 2,328(0,4); 0,008(0,8); 0,000(16,9); -0,008(0,8)
8	1,94	1,94	RMN de ¹ H (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,342(3,0); 9,337(2,9); 8,832(2,2); 8,828(2,5); 8,820(2,4); 8,816(2,5); 8,612(9,7); 8,553 (1,3); 8,548(1,7); 8,543(1,4); 8,533(1,4); 8,527(1,8); 8,523(1,4); 7,678(1,8); 7,666(1,7); 7,658(1,7); 7,646(1,6); 7,497 (1,3); 7,477(2,7); 7,459(2,4); 7,398(3,1); 7,381(4,4); 7,362(3,0); 5,758(0,5); 3,327(46,7); 2,676(0,4); 2,671(0,6); 2,667 (0,4); 2,525(1,4); 2,520(2,2); 2,511(31,8); 2,507(65,7); 2,502(87,7); 2,498(64,6); 2,493(31,9); 2,402(16,0); 2,333(0,4); 2,329 (0,6); 2,325(0,4); 2,309(0,5); 1,299(0,5); 1,259(0,7); 1,233(0,9); 1,183(0,3); 0,146 (0,5); 0,008(3,7); 0,000(106,2); -0,009(3,7); -0,150(0,5)
9	2,26	2,23	RMN de ¹ H (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,352(4,9); 9,346(4,8); 8,836(3,7); 8,833(4,1); 8,824(4,0); 8,821(4,1); 8,707(16,0); 8,563(2,1); 8,558(2,8); 8,553(2,2); 8,543 (2,3); 8,537(3,1); 8,533(2,2); 8,089(5,0); 7,953(3,6); 7,933(6,0); 7,868(3,1); 7,848(3,3); 7,829(1,4); 7,681(2,8); 7,669 (2,8); 7,661(2,7); 7,650(2,5); 7,649(2,7); 4,038(0,5); 4,020(0,5); 3,328(60,0); 2,944 (5,2); 2,784(4,1); 2,676(0,4); 2,672(0,5); 2,667(0,4); 2,525(1,3); 2,512(28,1); 2,507 (57,8); 2,503(77,3); 2,498(57,0); 2,494(28,2); 2,334(0,4); 2,329(0,5); 2,325(0,4); 1,989(2,2); 1,957(4,3); 1,193(0,9); 1,175(1,3); 1,157(0,6); 0,008(2,3); 0,000(68,3); -0,009(2,6)
10	1,73	1,76	RMN de ¹ H (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,345(0,5); 9,340(0,5); 8,833(0,4); 8,829(0,4); 8,821 (0,4); 8,817(0,4); 8,620(1,4); 7,495(0,6); 7,475(0,4); 7,217(0,3); 7,211(0,6); 7,206 (0,4); 7,155(0,4); 7,134(0,5); 3,818(3,8); 3,328(15,7); 2,944(16,0); 2,784(13,5); 2,507(16,3); 2,502(21,3); 2,498(16,0); 1,957(14,1); 0,008(1,0); 0,000(24,1); -0,008(1,1)
11	1,92	1,96	RMN de ¹ H (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,341(3,2); 9,336(3,1); 8,831(2,4); 8,827(2,6); 8,819 (2,5); 8,815(2,6); 8,598(10,7); 8,552(1,4); 8,547(1,9); 8,542(1,4); 8,532(1,5); 8,526 (2,0); 8,522(1,4); 8,317(0,4); 7,677(1,9); 7,665(1,8); 7,657(1,8); 7,645(1,8); 7,462 (4,1); 7,442(8,2); 7,399(6,4); 7,378(3,3); 5,758(0,4); 3,325(150,9); 2,675(1,1); 2,671(1,5); 2,666(1,2); 2,524(3,5); 2,510(82,2); 2,506(170,6); 2,502(229,7); 2,497(169,6); 2,493(83,7); 2,408(16,0); 2,333 (1,1); 2,328(1,5); 2,324(1,1); 1,298(0,7); 1,258(1,0); 1,234(1,3); 0,000(2,4)

ES 2 747 810 T3

(continuación)

Ej. N°	logP[a]	logP[b]	RMN de ¹ H [σ (ppm)] o bien CL-EM [m/z]
12	1,73	1,76	RMN de ¹ H (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 8,591(0,4); 3,841(1,0); 3,328(7,1); 2,945(16,0); 2,784(13,9); 2,506(6,9); 2,502(8,5); 2,498(6,5); 1,958(14,6); 0,000(5,1)
13	2,09	2,08	RMN de ¹ H (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,344(5,3); 9,340(5,4); 8,829(4,0); 8,820(4,1); 8,631 (16,0); 8,554(2,6); 8,550(3,8); 8,545(2,8); 8,534(2,9); 8,529(4,0); 8,525(2,8); 8,150 (2,0); 7,678(3,4); 7,666(3,5); 7,658(3,5); 7,646(3,3); 7,534(2,8); 7,515(7,2); 7,495(13,4); 7,459(0,3); 7,440(5,4); 7,420 (3,2); 7,350(4,5); 7,329(3,5); 3,324(14,3); 2,859(0,4); 2,768(0,4); 2,671(0,9); 2,554 (1,1); 2,529(47,8); 2,506(102,3); 2,502 (131,0); 2,498(102,0); 2,476(2,9); 2,329(0,9); 1,295(0,3); 1,278(0,6); 1,187(0,4); 0,000(38,9)
14	1,04	1,09	RMN de ¹ H (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,351(2,4); 9,346(2,2); 8,835(1,7); 8,832(1,8); 8,823(1,8); 8,820(1,8); 8,721(1,4); 8,707 (6,9); 8,561(1,1); 8,556(1,4); 8,551(1,0); 8,541(1,2); 8,536(1,5); 8,531(1,0); 8,213 (0,5); 8,208(0,3); 8,152(0,6); 7,939(1,5); 7,935(2,7); 7,907(0,4); 7,888(0,5); 7,879(0,7); 7,875(1,2); 7,871(0,8); 7,860 (1,2); 7,856(2,2); 7,852(1,3); 7,828(1,2); 7,808(2,5); 7,789(1,8); 7,786(1,7); 7,782(2,4); 7,777(1,5); 7,767(0,6); 7,762(0,8); 7,758(0,4); 7,682(1,4); 7,670(1,3); 7,662(1,4); 7,650(1,3); 5,756(0,7); 3,323(10,5); 3,314(5,1); 2,847(0,7); 2,837(16,0); 2,671(0,4); 2,511(20,1); 2,507(40,7); 2,502(54,5); 2,498(41,2); 2,494(21,4); 2,329(0,3); 0,146(0,4); 0,008(3,0); 0,000(74,0); -0,008(4,1); -0,150(0,3)
15	2,42	2,35	RMN de ¹ H (601,6 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,357(2,9); 9,354(2,9); 9,353(2,8); 8,842(2,5); 8,839 (2,6); 8,834(2,6); 8,831(2,6); 8,636(10,4); 8,564(1,4); 8,561(1,9); 8,560(1,7); 8,557(1,4); 8,551(1,5); 8,548(1,8); 8,547(1,9); 8,544(1,5); 7,686(1,7); 7,685 (1,7); 7,678(1,7); 7,677(1,7); 7,672(1,7); 7,671(1,7); 7,665(1,7); 7,663(1,7); 7,403(3,7); 7,400(3,9); 7,393(2,6); 7,380 (2,9); 7,266(2,3); 7,263(2,2); 7,253(1,9); 7,249(1,9); 3,342(244,4); 2,955(1,3); 2,794(1,0); 2,627(0,7); 2,625(1,0); 2,622(0,7); 2,534(1,7); 2,531(2,2); 2,528(2,4); 2,519(52,0); 2,516(108,9); 2,513(148,0); 2,510(110,3); 2,507(54,0); 2,500(25,7); 2,400(0,7); 2,397(1,0); 2,394(0,7); 2,327(16,0); 2,297(0,4); 1,968(1,1)
16	1,25	1,26	RMN de ¹ H (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,348(2,8); 9,343(2,8); 8,831(2,2); 8,819(2,3); 8,675 (6,0); 8,554(1,7); 8,534(1,8); 7,960(3,2); 7,956(3,2); 7,679(1,7); 7,667(2,9); 7,660(2,0); 7,647(3,3); 7,541(2,8); 7,521 (2,1); 3,326(55,5); 2,944(0,5); 2,773(16,0); 2,690(0,5); 2,671(0,5); 2,502(76,7); 2,436 (13,1); 2,328(0,5); 2,301(0,4); 1,957(0,4); 1,234(0,6); 0,000(0,5)
17	2,70	2,66	RMN de ¹ H (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,353(5,0); 9,347(5,0); 8,837(3,7); 8,833(4,2); 8,825 (4,0); 8,821(4,2); 8,659(16,0); 8,563(2,1); 8,558(2,9); 8,554(2,2); 8,543(2,2); 8,538(3,1); 8,534(2,3); 8,443(0,5); 8,317 (0,6); 8,187(2,6); 8,181(2,8); 8,172(2,7); 8,165(2,8); 7,993(1,6); 7,986(1,6); 7,982(1,9); 7,975(1,8); 7,971(2,1); 7,964(2,1); 7,960(2,1); 7,953(1,9); 7,773(3,5); 7,751(6,1); 7,729(2,9); 7,682(2,9); 7,669(2,8); 7,662(2,8); 7,649(2,8); 5,758(0,5); 3,326(262,3); 2,675(2,1); 2,671(3,0); 2,666(2,3); 2,524(7,8); 2,519(11,5); 2,511(161,4); 2,506(336,0); 2,502(452,0); 2,497(336,0); 2,493(167,4); 2,333(2,1); 2,329(3,0); 2,324(2,2); 1,298(0,6); 1,259(0,8); 1,234(1,2); 1,203(0,4); 1,185(0,8); 1,167(0,4); 1,148(0,3); 0,146(2,7); 0,025(0,6); 0,008(19,5); 0,000(584,9); -0,009(21,7); -0,150(2,7)

(continuación)

Ej. N°	logP[a]	logP[b]	RMN de ¹ H [σ (ppm)] o bien CL-EM [m/z]
18	2,01	1,95	RMN de ¹ H (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,347(0,3); 8,927(7,1); 8,670(16,0); 8,659(1,1); 8,461(3,7); 8,459(3,6); 8,445(3,9); 8,443(3,8); 8,317(0,5); 8,182(3,0); 8,175 (3,3); 8,166(3,2); 8,160(3,1); 8,083(3,7); 8,063(4,1); 7,987(1,8); 7,980(1,9); 7,976(2,1); 7,969(2,0); 7,965(2,4); 7,958 (2,4); 7,954(2,4); 7,947(1,9); 7,773(3,7); 7,751(6,6); 7,730(3,1); 7,665(3,7); 7,648(4,1); 7,645(4,1); 7,628(3,2); 5,758(0,4); 3,325(270,0); 2,675(2,0); 2,671(2,7); 2,667(2,1); 2,574(0,4); 2,506(313,6); 2,502(411,0); 2,498(314,6); 2,333(1,9); 2,329(2,7); 2,324(2,0); 1,297(0,3); 1,259(0,4); 1,235(1,5); 1,196(0,4); 1,178(0,7); 1,160(0,4); 0,146(1,4); 0,008(11,9); 0,000(302,6); -0,150(1,5)
19	2,39	2,43	RMN de ¹ H (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,343(3,7); 9,338(3,7); 8,832(2,7); 8,828(3,0); 8,820(2,9); 8,816(3,1); 8,633(11,2); 8,554 (1,5); 8,549(2,2); 8,544(1,7); 8,534(1,7); 8,528(2,3); 8,524(1,7); 8,316(0,7); 7,677(2,1); 7,665(2,1); 7,657(2,1); 7,645 (2,0); 7,545(2,7); 7,540(5,9); 7,519(4,3); 7,500(3,6); 7,468(3,5); 7,448(1,7); 7,373(2,6); 7,357(1,6); 7,353(2,0); 3,324 (30,1); 3,083(2,3); 3,065(7,5); 3,046(7,6); 3,028(2,5); 2,945(1,3); 2,785(1,1); 2,671(0,4); 2,525(1,0); 2,507(46,5); 2,502(62,8); 2,498(47,8); 2,329(0,4); 1,957(1,1); 1,302(7,8); 1,284(16,0); 1,266(7,5); 0,008(2,3); 0,000(63,4); -0,008(3,2)
20	1,24	1,26	RMN de ¹ H (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,356(4,7); 9,351(4,7); 8,841(3,4); 8,838(3,6); 8,829(3,6); 8,826(3,6); 8,735(0,5); 8,712 (12,7); 8,566(2,0); 8,562(2,8); 8,557(2,0); 8,546(2,2); 8,541(2,9); 8,537(2,0); 8,164(2,1); 7,889(5,6); 7,823(5,6); 7,821 (5,6); 7,814(4,9); 7,809(7,5); 7,797(1,3); 7,787(3,5); 7,782(2,9); 7,778(2,2); 7,772(2,6); 7,764(1,0); 7,759(0,9); 7,687(2,6); 7,675(2,6); 7,667(2,6); 7,655(2,5); 3,407(0,5); 3,388(0,7); 3,332(3,2); 3,172(0,5); 3,154(1,8); 3,136 (2,2); 3,120(2,5); 3,102(2,2); 3,084(0,7); 2,901(0,6); 2,883(2,2); 2,864(2,5); 2,849(2,1); 2,830(1,8); 2,812(0,5); 2,679(0,4); 2,674(0,3); 2,514(50,7); 2,510(65,6); 2,506(49,5); 2,341(0,3); 2,337(0,4); 1,169(0,6); 1,106(7,5); 1,088(16,0); 1,070(7,3); 1,058(0,8)
21	2,95	2,91	RMN de ¹ H (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,350(3,0); 9,346(3,1); 9,344(3,0); 8,839(2,4); 8,836 (2,6); 8,827(2,6); 8,824(2,6); 8,679(8,7); 8,561(1,4); 8,557(1,8); 8,551(1,4); 8,541(1,5); 8,537(1,9); 8,535(1,9); 8,531 (1,5); 7,939(3,1); 7,921(3,1); 7,684(1,8); 7,683(1,7); 7,672(1,7); 7,671(1,7); 7,664(1,8); 7,663(1,7); 7,652(1,7); 7,651 (1,7); 7,518(2,7); 7,491(2,6); 4,062(1,2); 4,037(3,9); 4,011(4,0); 3,985(1,4); 3,330(57,6); 2,945(1,0); 2,785(0,7); 2,672(0,4); 2,526(1,0); 2,512(19,8); 2,508(40,6); 2,503(53,8); 2,499(39,4); 2,494(19,5); 2,471(16,0); 2,330(0,3); 2,076(10,9); 1,958(0,8); 0,008(1,0); 0,000(30,1); -0,009(1,2)
22	2,01	1,98	RMN de ¹ H(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,761(0,5); 9,353(6,6); 9,347(6,9); 9,102(0,4); 8,836(5,2); 8,828(4,9); 8,824(5,2); 8,738(0,5); 8,723(15,6); 8,557(4,0); 8,553(2,9); 8,543(2,8); 8,537(4,3); 8,533(3,1); 8,315(2,5); 8,195(6,5); 8,176 (6,5); 8,039(0,4); 7,951(2,4); 7,685(3,8); 7,673(3,8); 7,665(4,0); 7,653(3,8); 7,635(5,0); 7,608(5,1); 7,366(0,4); 7,238 (0,6); 5,755(1,0); 4,293(0,9); 4,271(1,2); 4,263(1,3); 4,233(1,1); 4,182(0,4); 4,124 (1,0); 4,100(1,2); 3,505(1,6); 3,322(748,9); 2,944(1,9); 2,891(16,0); 2,784(1,6); 2,731(14,3); 2,716(0,5); 2,670(6,0); 2,666 (4,8); 2,505(695,9); 2,501(960,0); 2,497(767,5); 2,395(0,8); 2,373(2,4); 2,328 (6,2); 2,324(5,1); 2,283(0,4); 1,957(1,9); 1,303(0,3); 1,284(0,6); 1,233(2,0); 0,854(0,4); 0,146(3,0); 0,008(21,8); 0,000(638,0); -0,078(0,4);

(continuación)

Ej. N°	logP[a]	logP[b]	RMN de ¹ H [σ (ppm)] o bien CL-EM [m/z]
			-0,150(3,2)
23	1,49	1,45	RMN de ¹ H (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 8,928(9,2); 8,734(16,0); 8,463(5,2); 8,446(5,3); 8,315(0,9); 8,196(7,0); 8,177(7,1); 8,082(5,1); 8,061(5,7); 7,668(4,5); 7,649(5,9); 7,633(8,7); 7,608(5,6); 7,573(0,4); 7,251(0,4); 4,265(1,6); 4,236(1,3); 4,117(1,2); 4,106(1,2); 4,092(1,4); 3,322(182,5); 2,671(2,1); 2,502(339,3); 2,498(298,4); 2,402(0,7); 2,373(1,6); 2,329(2,4); 0,146(1,6); 0,000(312,8); -0,083(0,4); -0,150(1,7)
24	2,76	2,70	RMN de ¹ H (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,345(0,4); 9,340(0,4); 8,640(1,0); 7,597(0,5); 7,539(0,3); 7,520(0,4); 7,512(0,4); 3,327(6,0); 2,945(16,0); 2,785(13,5); 2,507(6,8); 2,503(9,0); 2,498(6,9); 1,989(0,6); 1,958(14,1); 1,305(2,7); 1,289(2,7); 0,000(8,3); -0,008(0,4)
25	1,39	1,43	RMN de ¹ H (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,351(4,6); 9,347(4,5); 8,835(3,5); 8,832(3,8); 8,823(3,7); 8,820(3,8); 8,727(0,5); 8,701 (15,5); 8,562(2,1); 8,558(2,7); 8,556(2,6); 8,552(2,1); 8,542(2,3); 8,538(2,7); 8,536 (2,9); 8,532(2,1); 8,317(0,3); 7,858(3,3); 7,853(5,8); 7,828(0,7); 7,821(0,4); 7,810 (2,1); 7,791(7,7); 7,788(7,6); 7,785(6,6); 7,783(5,9); 7,777(5,1); 7,772(3,1); 7,765(1,1); 7,759(1,4); 7,754(1,0); 7,682(2,6); 7,680(2,6); 7,670(2,5); 7,668(2,6); 7,662(2,5); 7,660(2,5); 7,650(2,4); 7,648(2,5); 5,757(16,0); 3,325(116,5); 3,085(0,8); 3,068(2,2); 3,051(3,1); 3,034(2,3); 3,016(0,9); 2,680(0,4); 2,676(0,9); 2,671(1,3); 2,667(0,9); 2,524(3,1); 2,511(71,5); 2,507(145,1); 2,502(193,0); 2,498(144,3); 2,493(72,7); 2,425(0,5); 2,333(1,0); 2,329(1,3); 2,324(1,0); 1,259(0,6); 1,241(15,6); 1,224(15,5); 1,205(1,6); 1,186(1,2); 1,172(0,6); 1,169(0,5); 0,996(15,2); 0,979(15,1); 0,965(0,8); 0,853(0,3); 0,000(1,5)
26	3,18	3,08	RMN de ¹ H (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,345(1,9); 9,340(2,0); 8,833(1,4); 8,829(1,6); 8,821 (1,5); 8,817(1,6); 8,625(6,3); 8,556(0,8); 8,551(1,2); 8,546(0,9); 8,536(0,9); 8,530 (1,2); 8,526(0,9); 7,679(1,1); 7,667(1,1); 7,660(1,1); 7,646(1,0); 7,550(1,4); 7,546(2,6); 7,542(1,7); 7,525(0,7); 7,505(2,0); 7,486(2,0); 7,477(1,3); 7,473(2,2); 7,469(1,4); 7,457(0,6); 7,453 (0,8); 7,364(1,0); 7,360(1,5); 7,355(1,0); 7,345(0,9); 7,340(1,1); 7,337(0,8); 3,329 (56,9); 2,941(4,9); 2,924(5,0); 2,676(0,4); 2,671(0,5); 2,667(0,4); 2,524(1,7); 2,511 (32,1); 2,507(63,8); 2,502(83,8); 2,498(62,6); 2,333(0,4); 2,329(0,5); 2,324(0,4); 1,895 (0,4); 1,878(0,9); 1,862(1,1); 1,845(0,9); 1,828(0,5); 1,234(0,5); 1,020(16,0); 1,003(15,4); 0,000(8,1)
27	1,73	1,68	RMN de ¹ H (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,351(5,0); 9,346(5,1); 8,835(3,7); 8,831(4,0); 8,823(4,0); 8,819(3,9); 8,724(0,3); 8,706(14,0); 8,561(2,1); 8,557(2,9); 8,552(2,2); 8,541(2,3); 8,536(3,1); 8,532(2,2); 7,924(6,3); 7,860(2,3); 7,857(1,6); 7,846(3,0); 7,842(5,0); 7,838(3,2); 7,824(2,8); 7,805(5,5); 7,786(4,3); 7,784(4,2); 7,779(5,4); 7,774(3,3); 7,764(1,3); 7,760(1,8); 7,755(1,0); 7,681(2,8); 7,669(2,8); 7,661(2,8); 7,649(2,6); 5,757(4,4); 3,332(67,3); 2,853(0,6); 2,820(4,9); 2,814(4,8); 2,800(8,5); 2,782(0,7); 2,766(0,3); 2,672(0,7); 2,507(77,9); 2,503(99,5); 2,498(76,3); 2,330(0,7); 2,325(0,5); 2,160(0,9); 2,143(1,5); 2,126(1,8); 2,108(1,5); 2,091(0,9); 2,075(0,3); 1,233(1,0); 1,192(0,4); 1,130(15,9); 1,113(15,7); 1,094(0,8); 1,034(15,8); 1,017(16,0); 1,004(1,2); 0,995(0,9); 0,977(0,3); 0,000(0,8)
28	2,47	2,43	RMN de ¹ H 600,1 MHz, CD ₃ CN): δ = 9,2734(3,7); 9,2728(3,7); 9,270(3,8); 8,751(2,8); 8,748(2,9); 8,743(2,9); 8,740(2,8);

(continuación)

Ej. N°	logP[a]	logP[b]	RMN de ¹ H [σ (ppm)] o bien CL-EM [m/z]
			8,469(9,8); 8,403(1,8); 8,400(2,4); 8,399(2,3); 8,396(1,7); 8,389(1,9); 8,387(2,4); 8,386(2,3); 8,383(1,7); 7,744(3,9); 7,662(2,1); 7,650(3,1); 7,641(2,5); 7,576(2,2); 7,563(3,2); 7,550(1,3); 7,534(2,3); 7,533(2,2); 7,526(2,3); 7,525(2,2); 7,521(2,3); 7,520(2,1); 7,513(2,2); 7,512(2,0); 5,293(16,0); 2,957(13,9); 2,827(11,1); 2,154(11,6); 1,972(12,0); 1,967(0,5); 1,959(0,6); 1,955(0,8); 1,951(5,6); 1,947(10,0); 1,943(14,5); 1,938(9,7); 1,934(4,8); 0,000(6,8)
32	1,91	1,92	RMN de ¹ H (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,303(2,1); 9,297(2,1); 8,859(5,1); 8,814(1,4); 8,810(1,7); 8,802(1,5); 8,798(1,6); 8,513(0,8); 8,508(1,2); 8,503(0,9); 8,493(0,9); 8,487(1,3); 8,483(0,9); 7,658(1,2); 7,646(1,2); 7,638(1,1); 7,626(1,1); 7,300(1,2); 7,280(2,2); 7,260(1,4); 6,987(2,0); 6,943(1,5); 6,924(1,3); 6,899(1,2); 6,894(1,1); 6,879(1,0); 6,873(1,0); 5,241(6,2); 3,744(16,0); 3,332(39,1); 2,945(0,5); 2,785(0,5); 2,673(0,4); 2,668(0,4); 2,508(50,3); 2,504(67,2); 2,499(52,6); 2,330(0,4); 1,958(0,5); 1,233(0,5); 0,008(1,6); 0,000(42,7)
34	1,09		RMN de ¹ H (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,324 (8,2); 9,320 (8,0); 8,828 (5,9); 8,819 (5,7); 8,652 (16,0); 8,533 (4,1); 8,528 (5,4); 8,523 (3,9); 8,513 (4,3); 8,508 (5,6); 8,503 (3,8); 7,673 (4,7); 7,661 (4,8); 7,653 (4,6); 7,641 (4,2); 6,830 (1,0); 6,818 (1,8); 6,805 (0,9); 6,700 (2,0); 6,688 (3,9); 6,676 (2,0); 6,570 (1,0); 6,558 (2,0); 6,546 (1,0); 4,914 (5,2); 4,875 (10,9); 4,837 (5,5); 3,905 (7,6); 3,506 (0,4); 3,338 (626,8); 3,225 (1,1); 3,062 (0,9); 2,677 (2,1); 2,672 (2,7); 2,668 (2,1); 2,508 (339,6); 2,503 (425,1); 2,499 (319,3); 2,334 (1,9); 2,330 (2,5); 2,325 (1,9); 1,298 (0,4); 1,258 (0,5); 1,233 (0,7); 1,145 (0,7); 0,000 (37,7)
35		0,72	CL-EM: masa resultante [m/z] = 321,07
36	0,55		RMN de ¹ H (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,319 (4,3); 9,314 (4,3); 8,846 (14,5); 8,822 (3,1); 8,813 (3,3); 8,554 (4,4); 8,542 (4,4); 8,527 (2,8); 8,522 (3,4); 8,517 (2,5); 8,507 (2,8); 8,501 (3,4); 8,497 (2,4); 8,489 (0,5); 8,364 (0,4); 8,357 (0,4); 7,669 (2,7); 7,657 (2,8); 7,649 (2,9); 7,637 (2,6); 7,331 (6,3); 7,317 (6,1); 5,316 (16,0); 3,905 (6,2); 3,508 (0,4); 3,469 (0,4); 3,349 (770,9); 2,678 (1,1); 2,673 (1,5); 2,669 (1,1); 2,526 (4,9); 2,513 (93,8); 2,508 (184,1); 2,504 (238,5); 2,500 (175,4); 2,495 (88,2); 2,335 (1,1); 2,331 (1,4); 2,326 (1,1); 1,234 (0,6); 0,008 (0,7); 0,000 (21,0); -0,008 (0,8)
37	0,97	1,08	RMN de ¹ H (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,295(1,6); 9,290(1,6); 8,809(6,3); 8,797(1,4); 8,793 (1,4); 8,746(0,3); 8,743(0,3); 8,503(0,8); 8,498(1,1); 8,493(0,9); 8,483(0,9); 8,478(1,2); 8,473(0,9); 8,350(0,3); 7,772 (3,5); 7,652(1,1); 7,640(1,1); 7,632(1,1); 7,622(1,3); 7,603(0,3); 7,595(0,4); 7,583 (0,3); 7,563(0,6); 7,554(0,3); 7,506(3,6); 7,480(0,5); 7,460(0,5); 7,363(0,8); 7,325(0,5); 7,118(0,4); 7,008(0,3); 5,757 (1,6); 5,097(6,4); 4,268(0,7); 4,254(0,7); 4,205(0,4); 4,191(0,4); 3,950(0,3); 3,788 (4,5); 3,782(16,0); 3,750(0,6); 3,703(0,3); 3,394(0,4); 3,328(25,5); 3,264(0,5); 2,676(0,4); 2,672(0,5); 2,667(0,4); 2,542(0,4); 2,525(1,2); 2,512(29,4); 2,507(60,8); 2,503(81,9); 2,498(62,0); 2,494(32,1); 2,334(0,4); 2,330(0,6); 2,325(0,4); 2,287(1,3); 1,318(0,3); 1,298(1,0); 1,278(0,4); 1,259(1,3); 1,233(1,3); 1,212(0,4); 1,196(0,3); 0,008(2,4); 0,000(75,0); -0,008(3,4); -0,150(0,3)
38	1,36	1,42	RMN de ¹H (400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9,305(2,2); 9,301(2,3); 8,815(1,6); 8,812(1,9); 8,798 (6,3); 8,511(1,3); 8,506(1,0); 8,495(1,0); 8,490(1,4); 8,486(1,1); 7,661(1,3); 7,648(1,3); 7,641(1,3); 7,628(1,2); 7,454 (4,1); 7,277(0,5); 5,759(0,4);

ES 2 747 810 T3

(continuación)

Ej. N°	logP[a]	logP[b]	RMN de ¹ H [σ (ppm)] o bien CL-EM [m/z]
			5,308(7,1); 4,489(0,4); 4,476(0,4); 3,332(61,6); 2,945(0,9); 2,784(0,8); 2,672(0,9); 2,655 (1,3); 2,637(2,1); 2,611(16,0); 2,507(95,2); 2,503(124,7); 2,499(102,9); 2,446(0,4); 2,330(0,8); 2,288(0,7); 1,958(0,8); 1,313(0,5); 0,146(0,4); 0,000(71,2); -0,150(0,4)
39	1,53	1,52	RMN de ¹H (601,6 MHz, CDCl ₃): δ = 9,341(5,1); 9,338(5,0); 8,781(3,5); 8,775(3,6); 8,426(2,9); 8,423(3,9); 8,420(2,8); 8,413(3,1); 8,410(4,0); 8,407(2,8); 8,299 (16,0); 7,484(3,2); 7,476(3,3); 7,471(3,3); 7,463(3,1); 7,432(0,6); 7,261(86,9); 7,084 (0,5); 5,299(2,5); 3,958(15,5); 3,946(15,6); 3,278(0,4); 3,269(0,5); 3,266(0,4); 3,257(0,4); 2,232(0,4); 2,220(0,6); 2,207 (0,4); 1,637(0,4); 1,558(13,5); 1,445(0,4); 1,368(0,5); 1,360(0,9); 1,355(1,3); 1,352(0,9); 1,347(2,2); 1,342(2,1); 1,339(1,8); 1,334(3,5); 1,329(2,0); 1,326(2,4); 1,321(2,7); 1,313(2,0); 1,309(1,8); 1,301(1,4); 1,255(7,8); 0,892(1,0); 0,881(1,8); 0,869(1,1); 0,856(0,4); 0,841(0,4); 0,715(2,2); 0,707(6,7); 0,705(7,1); 0,697(3,5); 0,694(7,0); 0,692(6,7); 0,684(2,5); 0,577(0,4); 0,575(0,4); 0,564(0,4); 0,562(0,4); 0,491(2,4); 0,483(8,8); 0,473(8,4); 0,465(2,0); 0,276(0,4); 0,267(0,5); 0,097(0,4); 0,005(2,9); 0,000(86,6); -0,006(3,2); -0,100(0,4)
40	1,70	1,69	RMN de ¹H (400,0 MHz, d6-DMSO): δ = 9,347(5,5); 9,343(5,8); 8,838(4,1); 8,835(4,6); 8,826 (4,5); 8,823(4,6); 8,709(16,0); 8,692(0,3); 8,558(3,0) ;8,554(4,0); 8,553(3,9); 8,549 (3,2); 8,538(3,3); 8,534(4,1); 8,533(4,3); 8,528(3,4); 8,319(0,3); 8,236(1,6); 7,749(2,1); 7,745(2,5); 7,730(4,4); 7,726 (5,0); 7,711(2,6); 7,706(2,9); 7,683(4,8); 7,678(1,9); 7,670(4,7); 7,664(6,0); 7,650 (5,7); 7,644(3,1); 7,639(2,1); 7,630(1,9); 7,626(1,7); 7,556(3,1); 7,554(3,4); 7,532(4,4); 7,528(3,8); 7,510(2,4); 7,507(2,4) ;7,481(0,3); 7,470(3,3); 7,468(3,3); 7,451(5,2); 7,449(5,3); 7,432(2,5); 7,429 (2,5); 5,758(1,7); 4,354(0,3); 4,336(0,4); 4,252(0,6); 4,234(0,6); 3,364(1,0); 2,678(0,5); 2,673(0,7); 2,669(0,5); 2,526 (1,6); 2,522(2,4); 2,513(34,4); 2,508(71,9); 2,504(96,4); 2,499(71,1); 2,495(35,5); 2,335(0,6); 2,331(0,8); 2,326(0,6); 2,287 (0,4); 2,077(2,4); 1,342(0,5); 1,335(0,6); 1,318(1,0); 1,300(0,8); 1,296(1,0); 1,278 (1,5); 1,260(0,9); 1,232(0,7); 0,146(0,9); 0,008(7,0); 0,000(192,4); -0,009(8,3); -0,150(0,9)
41	2,33	2,34	RMN de ¹H (400,0 MHz, d6-DMSO): δ = 9,344(5,7); 9,339(6,0); 8,833(4,1); 8,829(4,6); 8,821 (4,4); 8,817(4,6); 8,627(16,0); 8,554(2,3); 8,549(3,4); 8,544(2,5); 8,534(2,5); 8,529(3,6); 8,524(2,5); 7,678(3,2); 7,666 (3,2); 7,658(3,2); 7,646(3,0); 7,576(3,2); 7,556(6,7); 7,535(4,2); 7,372(3,8); 7,366(6,9); 7,361(4,9); 7,283(4,3); 7,278(4,5); 7,275(4,6); 7,266(4,6); 7,261 (3,9); 7,254(3,7); 7,248(3,1); 5,754(0,8); 4,878(2,5); 4,856(8,1); 4,834(8,5); 4,812(2,9); 4,738(0,4); 3,319(61,3); 2,676(0,6); 2,671(0,8); 2,667(0,7); 2,506(96,9); 2,502(128,4); 2,498(98,2); 2,333(0,6); 2,329(0,8); 2,324(0,6); 1,234(1,8); 1,187(0,5); 0,008(0,6); 0,000(16,4)
42	1,63	1,72	RMN de ¹H (400,0 MHz, d6-DMSO): δ = 9,350(1,3); 9,345(1,3); 8,835(0,9); 8,831(1,0); 8,823 (1,0); 8,819(1,0); 8,714(3,3); 8,560(0,5); 8,556(0,7); 8,551(0,5); 8,540(0,6); 8,535 (0,8); 8,531(0,5); 8,055(1,6); 7,967(0,6); 7,962(0,4); 7,948(1,0); 7,944(0,7); 7,929(0,5); 7,925(0,4); 7,909(1,4); 7,894(1,3); 7,875(1,1); 7,856(0,4); 7,680(0,7); 7,668(0,7); 7,660(0,7); 7,648(0,7); 3,320(7,9); 2,681(16,0); 2,507(13,0); 2,502(16,4); 2,498(12,5); 0,000(16,1)

(continuación)

Ej. N°	logP[a]	logP[b]	RMN de ¹ H [σ (ppm)] o bien CL-EM [m/z]
43	2,05	2,06	RMN de ¹H (400,0 MHz, d6-DMSO): δ = 9,343(2,6); 8,829(1,8); 8,820(1,9); 8,635(3,7); 8,549 (1,5); 8,530(1,6); 7,666(6,6); 7,647(6,5); 7,625(2,2); 7,459(0,4); 7,412(0,5); 7,390 (0,6); 7,364(0,7); 7,333(0,9); 7,267(0,4); 7,245(0,3); 7,181(1,3); 7,115(0,4); 3,318 (83,2); 2,671(2,4); 2,501(395,6); 2,327(3,0); 2,286(1,2); 2,180(0,5); 1,988(0,4); 1,386 (2,2); 1,335(12,4); 1,298(9,2); 1,249(16,0); 1,235(16,0); 1,188(3,6); 1,105(1,7); 0,852 (4,1); 0,834(3,9); 0,146(0,4); 0,000(59,8); -0,151(0,4)
44	2,91	3,00	RMN de ¹H (400,0 MHz, d6-DMSO): δ = 9,345(7,4); 9,340(7,7); 8,836(5,3); 8,834(5,7); 8,825(5,5); 8,822(5,6); 8,700(16,0); 8,550 (4,4); 8,534(3,2); 8,530(4,5); 7,753(4,1); 7,747(4,7); 7,736(4,3); 7,730(4,5); 7,681 (4,1); 7,669(4,1); 7,661(4,1); 7,649(3,9); 7,601(1,9); 7,595(2,1); 7,589(2,3); 7,579 (3,1); 7,573(3,1); 7,568(3,1); 7,562(2,6); 7,490(4,6); 7,467(6,6); 7,444(3,2); 3,312 (33,5); 2,988(15,3); 2,970(15,6); 2,672(0,7); 2,502(104,5); 2,329(0,6); 2,074(2,1); 1,234(0,4); 1,085(0,6); 1,078(1,0); 1,066(1,9); 1,059(1,8); 1,047(2,9); 1,035(1,9); 1,029(2,1); 1,016(1,1); 1,010(0,7); 0,998(0,3); 0,567(2,3); 0,556(7,5); 0,552(8,2); 0,536(7,6); 0,532(7,5); 0,522(2,6); 0,282(2,7); 0,269(9,5); 0,256(9,5); 0,245(2,2); 0,000(8,6)
45	1,63	1,66	RMN de ¹H (400,0 MHz, d6-DMSO): δ = 9,354(9,8); 9,353(9,9); 9,349(9,7); 8,841(7,9); 8,837 (8,0); 8,829(8,1); 8,825(7,7); 8,759(8,5); 8,753(16,0); 8,564(4,8); 8,560(6,0); 8,554 (4,1); 8,544(5,1); 8,540(6,0); 8,538(5,7); 8,534(3,9); 8,369(1,6); 8,363(1,7); 8,352 (1,6); 8,346(1,6); 8,318(1,2); 8,185(0,9); 8,179(0,9); 8,173(1,1); 8,167(1,1); 8,163 (1,1); 8,157(1,1); 8,152(1,1); 8,146(0,9); 8,087(4,6); 8,082(5,1); 8,070(4,8); 8,065 (4,8); 7,965(2,7); 7,960(2,7); 7,954(3,4); 7,948(3,1); 7,943(3,4); 7,938(3,3); 7,932 (3,3); 7,927(2,7); 7,872(1,0); 7,869(1,3); 7,862(1,7); 7,851(0,7); 7,840(2,5); 7,817 (1,4); 7,785(5,2); 7,762(7,2); 7,740(4,3); 7,687(6,0); 7,675(5,9); 7,667(5,8); 7,655 (5,5); 7,589(0,4); 7,571(0,6); 5,758(8,2); 5,599(0,5); 4,153(0,4); 4,142(0,5); 4,129 (0,4); 3,852(0,4); 3,601(0,5); 3,589(0,5); 3,577(0,4); 3,519(1,8); 3,506(0,8); 3,378 (4,0); 3,360(4,6); 3,329(329,8); 3,279(0,4); 3,273(0,5); 2,977(0,4); 2,927(7,4); 2,909 (7,4); 2,891(3,0); 2,844(0,4); 2,820(8,6); 2,748 (0,5); 2,732(1,9); 2,676(2,3); 2,672 (3,1); 2,667(2,4); 2,650(0,3); 2,621(0,4); 2,595 (2,0); 2,584(0,8); 2,525(12,9); 2,511(184,2); 2,507(356,1); 2,503(459,1); 2,498(337,4); 2,494(171,5); 2,334(2,2); 2,329(2,9); 2,325 (2,2); 2,087 (6,4); 1,492 (0,4); 1,474(0,5); 1,454(0,4); 1,291(0,4); 1,274(0,6); 1,259 (0,9); 1,234 (2,5); 1,187(0,4); 0,996(0,9); 0,984(1,8); 0,977 (1,8); 0,965(2,6); 0,953 (1,9); 0,946 (2,0); 0,934(1,4); 0,921(0,9); 0,915(1,0); 0,902(1,1); 0,889(0,8); 0,883 (0,9); 0,870 (0,8); 0,862(1,0); 0,852(0,9); 0,844(1,8); 0,825(1,8); 0,806(0,7); 0,608 (0,5); 0,585 (2,5); 0,574(8,6); 0,565(4,7); 0,554(8,4); 0,545(2,8); 0,531(0,7); 0,522 (1,0); 0,504 (2,6); 0,484(2,4); 0,342(1,8); 0,336(1,9); 0,322(4,0); 0,311(3,7); 0,296 (0,9); 0,284 (0,9); 0,270(3,7); 0,258(4,0); 0,245(2,0); 0,238(1,7); 0,227(0,8); 0,146 (5,9); 0,137 (2,5); 0,053(0,3); 0,008(34,5); 0,000(766,5); -0,008(43,1); -0,064(0,6); -0,079(0,4); -0,099(0,3); -0,150(3,6)
46	2,60	2,56	RMN de ¹H (400,0 MHz, d6-DMSO): δ = 9,351(5,7); 9,347(5,7); 8,841(4,5); 8,837(5,0); 8,829 (4,8); 8,825(4,9); 8,710(16,0); 8,563(2,6); 8,558(3,5); 8,553(2,7); 8,543(2,9); 8,537 (3,6); 8,533(2,7); 8,317(1,0); 7,948(3,6); 7,942(4,0); 7,931(3,7); 7,925(3,8); 7,791 (1,9); 7,785(2,0); 7,780(2,2); 7,774(2,1); 7,770(2,3); 7,763(2,4); 7,758(2,4); 7,752 (2,0); 7,685(3,4); 7,672(3,3); 7,666(3,3); 7,654(3,1); 7,652(3,1); 7,571(3,9);

ES 2 747 810 T3

(continuación)

Ej. N°	logP[a]	logP[b]	RMN de ¹ H [σ (ppm)] o bien CL-EM [m/z]
			7,548 (5,4); 7,525(3,2); 4,139(2,5); 4,114(7,7); 4,088(8,1); 4,062(2,7); 3,330(493,3); 3,288(0,4); 2,676(2,0); 2,671(2,7); 2,667 (2,0); 2,525(7,4); 2,511(147,5); 2,507(299,9); 2,502(398,3); 2,498(297,0); 2,494(151,2); 2,457(1,0); 2,437(0,6); 2,334(2,0); 2,329 (2,7); 2,325(2,0); 2,075(3,9); 0,146(0,9); 0,008(6,8); 0,000(200,5); -0,008(8,5); -0,150(0,9)
47	2,73	2,75	RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 10,481(0,3); 9,349(3,0); 9,344(3,0); 8,834(2,4); 8,830(2,6); 8,822(2,5); 8,818(2,6); 8,612(10,2); 8,559(1,4); 8,554(1,8); 8,549(1,4); 8,539(1,5); 8,534(2,0); 8,529(1,5); 8,435(0,6); 7,787(0,4); 7,769(3,7); 7,764(3,7); 7,679(1,8); 7,667(1,8); 7,659(1,8); 7,647(1,7); 7,472(2,0); 7,451(3,9); 7,415(2,9); 7,410(2,8); 7,395(1,5); 7,390(1,5); 5,757(0,9); 4,118(1,2); 4,092(3,8); 4,066(4,0); 4,040(1,4); 3,880(0,4); 3,865(0,4); 3,854(0,4); 3,848(0,4); 3,328(110,4); 2,676(0,7); 2,671(0,9); 2,667(0,7); 2,525(2,5); 2,511 (52,6); 2,507(105,2); 2,502(138,7); 2,498(103,1); 2,493(51,6); 2,427(16,0); 2,358(1,6); 2,334(0,7); 2,329(1,0); 2,324(0,8); 1,233(0,5); 1,201(0,4); 1,184(0,9); 1,166(0,4); 0,146(0,9); 0,008(7,4); 0,000(188,5); -0,009(7,9); -0,150(0,9)
48	1,86	1,85	RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9,350(3,3); 9,345(3,3); 8,834(2,3); 8,830(2,5); 8,822(2,4); 8,818(2,4); 8,689(8,7); 8,559(1,4); 8,555(1,9); 8,550(1,4); 8,539(1,5); 8,534(2,0); 8,530(1,4); 8,145(1,0); 8,046(4,0); 8,041(4,2); 7,895(0,7); 7,891(0,6); 7,878(0,4); 7,758(1,9); 7,753(1,8); 7,738(2,4); 7,733(2,4); 7,679(1,9); 7,668(2,0); 7,660(1,8); 7,648(1,7); 7,594(3,3); 7,573(2,6); 7,531(0,4); 4,272(0,9); 4,263(0,5); 4,253(0,7); 4,245(1,1); 4,235(1,8); 4,217(0,6); 4,208(1,3); 4,181(0,4); 4,123(0,4); 4,096(1,2); 4,087(0,4); 4,069(1,4); 4,059(1,0); 4,042(0,5); 4,032(0,9); 3,320(6,0); 2,996(0,5); 2,671(0,5); 2,667(0,4); 2,506(55,7); 2,502(71,4); 2,498(55,1); 2,477(16,0); 2,329(0,5); 1,296(0,5); 1,278(1,1); 1,260(0,5); 0,000(2,1)
49	3,04	2,98	RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9,347(2,9); 9,342(3,0); 8,838(2,3); 8,834(2,4); 8,826(2,4); 8,822(2,5); 8,558(1,3); 8,554(1,9); 8,548(1,4); 8,536(10,2); 8,528(1,5); 8,317(0,8); 7,924(0,4); 7,683(1,9); 7,675(6,4); 7,665(2,0); 7,651(1,5); 7,360(4,7); 6,025(1,0); 4,055(0,6); 4,038(2,6); 4,020(2,4); 4,014(3,6); 4,002(0,9); 3,988(3,6); 3,962(1,3); 3,855(0,8); 3,837(0,8); 3,392(0,3); 3,374(0,5); 3,332(421,8); 2,676(1,7); 2,671 (2,3); 2,667(1,7); 2,525(5,6); 2,511(131,6); 2,507(269,9); 2,502(357,0); 2,498(264,5); 2,494(133,5); 2,407(15,0); 2,365(0,4); 2,334(1,8); 2,329(2,4); 2,325(1,8); 2,078(16,0); 1,989(7,6); 1,890(0,3); 1,398 (1,9); 1,235(0,6); 1,193(2,1); 1,175(4,1); 1,157(2,1); 1,100(0,8); 1,083(1,5); 1,065(0,8); 0,146(0,5); 0,008(3,7); 0,000(116,2); -0,008(4,9); -0,150(0,5)
50	2,06	2,01	RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9,351(4,6); 9,346(4,6); 8,839(3,4); 8,835(3,7); 8,827(3,6); 8,823(3,7); 8,591(14,3); 8,561(1,9); 8,556(2,7); 8,551(1,9); 8,541(2,0); 8,536(2,8); 8,531(1,9); 8,317(1,3); 7,937(6,3); 7,928(4,2); 7,685(2,6); 7,673(2,6); 7,667(2,5); 7,653(2,4); 7,496(3,0); 7,470(4,4); 4,323(0,5); 4,295(0,6); 4,286(0,7); 4,259(0,7); 4,178(0,6); 4,171(0,6); 4,151(1,8); 4,144(1,8); 4,124(1,8); 4,117(1,8); 4,097(0,7); 4,090(0,6); 4,055(0,4); 4,037(1,0); 4,020(1,0); 4,002(0,4); 3,977(0,7); 3,951(0,8); 3,940(0,7); 3,924(0,3); 3,914(0,7); 3,372(0,9); 3,332 (833,0); 2,676(2,9); 2,671(3,9); 2,667(2,9); 2,525(9,7); 2,507(449,3); 2,502(587,2); 2,498(437,0); 2,451(12,1); 2,446(16,0); 2,408(0,8); 2,353(0,6); 2,334(3,2); 2,329(4,0); 2,325(3,0); 2,279(0,4); 2,258(0,5);

ES 2 747 810 T3

(continuación)

Ej. N°	logP[a]	logP[b]	RMN de ¹ H [σ (ppm)] o bien CL-EM [m/z]
			2,188(15,9); 2,182(12,0); 1,989(4,2); 1,193(1,1); 1,175(2,3); 1,157(1,1); 0,146(0,8); 0,008(6,5); 0,000(190,8); -0,008(8,2); -0,150(0,9)
51	3,25	3,17	RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9,354(5,1); 9,348(5,2); 8,844(3,9); 8,840(4,4); 8,832(4,1); 8,828(4,4); 8,658(16,0); 8,565(2,1); 8,561 (3,0); 8,556(2,3); 8,546(2,3); 8,540(3,2); 8,536(2,3); 8,138(10,9); 8,091(13,9); 8,003 (0,3); 7,812(0,5); 7,687(2,9); 7,675(2,9); 7,667(2,9); 7,655(2,8); 5,757(3,1); 4,262(0,4); 4,248(0,9); 4,238(1,2); 4,223(2,7); 4,213(2,8); 4,198(2,9); 4,188(2,8); 4,173(1,3); 4,163(1,0); 4,149(0,4); 3,340(73,8); 2,676(0,9); 2,671(1,2); 2,667(0,9); 2,524(3,2); 2,511(67,2); 2,507(136,2); 2,502(181,2); 2,498(135,3); 2,493(68,1); 2,333(0,8); 2,329(1,2); 2,324(0,9); 2,287(0,6); 1,234(0,3); 0,000(7,9)
52	1,57	1,55	RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9,342(2,1); 9,337(2,1); 8,831(1,5); 8,828(1,6); 8,819(1,6); 8,816(1,6); 8,620(5,9); 8,552(0,9); 8,547(1,3); 8,542(0,9); 8,532(1,0); 8,527(1,3); 8,522(0,9); 7,677(1,2); 7,664(1,2); 7,657(1,3); 7,645(1,2); 7,601(2,8); 7,543(0,5); 7,539(0,5); 7,525(4,0); 7,509(2,3); 7,489(0,8); 7,397(1,0); 7,392(1,6); 7,386(1,0); 7,380(0,9); 7,375(1,3); 7,370(0,8); 5,754(9,1); 4,101(8,1); 3,986(0,9); 3,977(0,6); 3,962(0,4); 3,320(15,8); 3,053(16,0); 3,044(2,3); 2,849(15,1); 2,507(32,7); 2,502(41,4); 2,498(30,9); 1,187(0,4); 0,000(3,5)
53	0,91	1,08	RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9,349(2,0); 8,833(1,5); 8,823(1,5); 8,697(5,9); 8,556(1,4); 8,552(1,1); 8,541(1,1); 8,536(1,5); 8,140(1,0); 7,968(3,1); 7,904(0,8); 7,900(0,8); 7,893(1,7); 7,886(1,2); 7,882(1,3); 7,878(1,2); 7,820(0,4); 7,799(3,8); 7,788(3,6); 7,682(1,3); 7,669(1,3); 7,662(1,4); 7,649(1,2); 5,754(3,5); 4,219(0,7); 4,182(3,7); 4,166(3,5); 4,129(0,8); 4,100(0,4); 4,090(0,3); 3,318(8,9); 3,053(0,6); 2,934 (16,0); 2,915(1,8); 2,858(14,1); 2,844(2,3); 2,671(0,7); 2,505(83,9); 2,502(106,8); 2,498(84,9); 2,328(0,7); 2,074(0,6); 0,000(3,2)
54	1,90	1,91	RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9,347(2,8); 9,342(2,6); 8,837(2,0); 8,825(2,0); 8,668(5,5); 8,552(1,6); 8,532(1,6); 8,141(0,9); 7,718(2,4); 7,700(2,4); 7,682(1,5); 7,669(1,5); 7,662(1,4); 7,649(1,3); 7,448(2,1); 7,422(2,1); 5,754(0,6); 4,011(8,8); 3,320(45,4); 3,027(16,0); 2,891(0,5); 2,832(14,9); 2,731(0,5); 2,670(0,6); 2,502(95,0); 2,406(12,3); 2,328(0,6); 0,000(4,0)
55	1,38	1,38	RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9,350(3,2); 9,345(3,1); 8,838(2,2); 8,835(2,3); 8,826(2,3); 8,823(2,3); 8,722(6,2); 8,556(1,8); 8,540(1,4); 8,535(1,9); 8,531(1,3); 8,139(4,6); 8,119(2,9); 7,685(1,7); 7,672(1,7); 7,665(1,7); 7,653(1,5); 7,568(2,4); 7,541(2,4); 4,185(1,3); 4,148(2,5); 4,086(1,2); 4,047(0,6); 3,340(160,4); 2,955 (16,0); 2,863(15,8); 2,672(0,6); 2,507(78,3); 2,503(97,2); 2,473(15,1); 2,330(0,6); 0,000(3,2)
56	3,25	3,00	RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9,333(2,4); 9,328(2,4); 8,834(1,8); 8,830(2,0); 8,822(1,9); 8,818(2,0); 8,535(1,1); 8,531(1,4); 8,526(1,1); 8,515(1,2); 8,510(1,5); 8,506(1,1); 7,939(2,4); 7,920(2,4); 7,680(1,4); 7,668(1,4); 7,661(1,4); 7,648(1,3); 7,541(2,1); 7,515(2,1); 4,085(0,5); 4,071(0,5); 4,060(0,6); 4,046(1,3); 4,037(0,6); 4,021(1,3); 4,012(1,3); 3,995(0,7); 3,986(1,3); 3,972(0,5); 3,960(0,5); 3,946(0,5); 3,329(49,4); 2,676(0,4); 2,672(0,5); 2,668(0,4); 2,525(1,3); 2,512(29,6); 2,507(59,8); 2,503(79,0); 2,498(58,4)

ES 2 747 810 T3

(continuación)

Ej. N°	logP[a]	logP[b]	RMN de ¹ H [σ (ppm)] o bien CL-EM [m/z]
			2,494(29,1); 2,469(13,3); 2,443(0,6); 2,417(0,6); 2,339(0,3); 2,334(0,5); 2,329(0,6); 2,325(0,5); 2,302(0,4); 2,281(16,0); 2,076(1,0); 0,008(1,9); 0,000(57,6); -0,009(2,3)
57	2,25	2,05	RMN de ¹H (601,6 MHz, CDCl₃): δ = 9,363(2,0); 8,807(1,5); 8,469(0,8); 8,466(1,1); 8,463(0,8); 8,452(1,9); 8,441(0,9); 8,438(1,1); 8,435(0,8); 8,065(1,7); 8,029(1,8); 8,017(1,8); 8,003(1,8); 7,991(1,8); 7,979(1,0); 7,966(1,1); 7,556(0,7); 7,554(0,7); 7,542(0,9); 7,541(0,9); 7,526(0,9); 7,519(1,3); 7,513(1,7); 7,507(1,3); 7,500(0,9); 7,415(1,0); 7,402(1,7); 7,389(0,8); 7,304(1,8); 7,302(1,9); 7,288(1,9); 7,286(1,8); 7,272(7,2); 5,302(6,3); 3,617(0,5); 3,609(0,4); 3,601(0,6); 3,593(1,0); 3,576(1,1); 3,563(1,1); 3,555(0,3); 3,547(3,0); 3,539(0,6); 3,530(3,1); 3,523(0,8); 3,514(1,2); 3,506(0,7); 2,590(0,5); 2,517(16,0); 2,501(0,6); 2,493(0,4); 2,484(0,3); 2,418(0,7); 2,408(12,8); 2,395(0,6); 2,386(12,7); 2,378(1,1); 2,369(0,4); 2,356(0,5); 2,352(0,4); 2,344(0,4); 2,332(0,4); 1,335(0,5); 1,329(0,3); 1,306(0,6); 1,295(0,9); 1,286(1,3); 1,283(1,3); 1,271(1,3); 1,255(6,2); 1,232(0,7); 1,221(0,5); 1,212(0,5); 0,891(0,8); 0,880(1,4); 0,868(1,0); 0,856(0,5); 0,843(0,9); 0,841(0,9); 0,834(0,9); 0,005(0,5); 0,000(14,7); -0,006(0,7)
58	3,45	3,32	RMN de ¹H (400,0 MHz, DMSO): δ = 9,430(10,3); 9,425(10,4); 8,891(8,1); 8,887(8,8); 8,879 (8,5); 8,875(8,7); 8,651(4,7); 8,646(6,4); 8,641(4,7); 8,631(5,1); 8,625(6,5); 8,621(4,7); 8,317(0,4); 8,260(1,0); 8,242(1,1); 7,992(9,9); 7,973(9,9); 7,729(6,1); 7,717(6,0); 7,709(6,0); 7,697(6,2); 7,673(0,9); 7,583(8,6); 7,556(8,5); 5,758(16,0); 4,361(0,7); 4,351(0,4); 4,344 (0,4); 4,324(0,4); 4,086(0,4); 4,059(0,4); 4,049(0,4); 4,018(4,1); 3,993(12,7); 3,967 (13,1); 3,941(4,5); 3,331(218,6); 2,677(1,1); 2,672(1,5); 2,668(1,1); 2,512(92,5); 2,508 (154,3); 2,503(197,3); 2,499(145,6); 2,495(73,3); 2,374(0,4); 2,353(0,4); 2,334(1,0); 2,330(1,3); 2,326(1,0); 1,343(0,4); 1,326(0,8); 1,308(0,4); 0,146(0,4); 0,008(3,0); 0,000(84,9); -0,008(3,4); -0,150(0,4)
59	2,40	2,35	RMN de ¹H (400,0 MHz, DMSO): δ = 9,432(5,9); 9,428(6,0); 8,891(4,5); 8,887(4,8); 8,879(4,8); 8,875(4,8); 8,652(2,6); 8,648(3,5); 8,642(2,6); 8,632(2,8); 8,626(3,7); 8,622(2,7); 8,260(5,9); 8,241(6,0); 7,729(3,3); 7,717(3,3); 7,709(3,5); 7,699(7,6); 7,673(4,8); 5,758(16,0); 4,415 (0,5); 4,388(1,7); 4,378(0,8); 4,360(2,0); 4,351(2,3); 4,333(0,8); 4,323(2,3); 4,296(0,7); 4,112(0,6); 4,085(2,0); 4,075(0,7); 4,058(2,3); 4,048(1,9); 4,031(0,9); 4,021(1,8); 3,994(0,6); 3,331(101,6); 2,676(0,7); 2,672(1,0); 2,668 (0,8); 2,507(117,2); 2,503(134,4); 2,498 (99,6); 2,334(0,6); 2,330(0,9); 2,325(0,7); 1,233(0,7); 0,008(1,1); 0,000(27,5)
60	2,41	2,45	RMN de ¹H (400,0 MHz, d6-DMSO): δ = 9,339(7,0); 8,827(5,1); 8,818(4,9); 8,618(9,6); 8,546(4,0); 8,527(4,0); 8,312(0,4); 7,676(3,3); 7,661(3,9); 7,646(2,9); 7,529(5,3); 7,509(15,6); 7,494(14,9); 7,475(4,6); 3,643(0,5); 3,637(0,5); 3,606(0,5); 3,586(0,6); 3,331(671,5); 3,145(0,9); 3,109(3,6); 3,091(8,5); 3,073(8,4); 3,055(3,4); 3,009(0,5); 2,987(0,4); 2,974(0,3); 2,959(0,3); 2,937(0,3); 2,919(0,4); 2,897(0,4); 2,885(0,3); 2,803(0,4); 2,671(3,3); 2,502(411,9); 2,395(1,4); 2,330(3,0); 2,243(0,3); 2,073(0,6); 1,318(8,9); 1,300(16,0); 1,282(8,2); 1,235(0,6); 0,146(0,7); 0,000(103,8); -0,073(0,5); -0,141(0,3); -0,150(0,7)
61	1,10	1,22	RMN de ¹H (400,0 MHz, d6-DMSO): δ = 9,349(4,7); 9,344(4,8); 8,835(3,5); 8,831(3,6); 8,823(3,7); 8,819(3,5); 8,683(11,9);

(continuación)

Ej. N°	logP[a]	logP[b]	RMN de ¹ H [σ (ppm)] o bien CL-EM [m/z]
			8,558(2,0); 8,554 (2,8); 8,548(1,9); 8,538(2,2); 8,533(2,8); 8,528(1,9); 8,313(0,4); 7,870(4,9); 7,849 (12,5); 7,822(12,3); 7,801(4,7); 7,681(2,6); 7,669(2,6); 7,661(2,6); 7,649(2,4); 5,753(3,4); 3,317(42,6); 3,178(0,5); 3,159(1,7); 3,141(2,1); 3,125(2,5); 3,107(2,2); 3,089(0,7); 2,898(0,6); 2,879(2,1); 2,861(2,5); 2,845(2,1); 2,827(1,8); 2,809(0,5); 2,671(0,9); 2,506(103,2); 2,502(129,1); 2,498(96,5); 2,333(0,6); 2,329(0,8); 1,235(0,7); 1,113(7,6); 1,094(16,0); 1,076(7,2); 0,146(1,0); 0,033(0,4); 0,000(200,8); -0,150(1,0)
62	2,71	2,69	RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9,954(1,2); 9,347(5,1); 9,343(5,1); 9,341(5,2); 9,106(0,9); 9,100(0,9); 8,835(3,9); 8,831 (4,4); 8,823(4,0); 8,819(4,4); 8,744(0,7); 8,740(0,8); 8,732(0,8); 8,728(0,8); 8,701 (16,0); 8,636(1,4); 8,558(2,1); 8,552(3,1); 8,548 (2,5); 8,538(2,3); 8,532(3,3); 8,528(2,5); 8,280(0,4); 8,275(0,5); 8,271 (0,4); 8,260(0,4); 8,255(0,6); 8,251(0,4); 7,969(7,3); 7,948(9,3); 7,881(1,5); 7,859 (2,0); 7,806(1,5); 7,799 (11,4); 7,795(3,7); 7,783(3,0); 7,778(9,2); 7,772 (1,0); 7,688 (0,6); 7,679(4,0); 7,667(4,3); 7,660(3,6); 7,647(4,4); 7,625(0,4); 7,612(0,5); 7,600 (0,5); 7,592(0,5); 7,579 (0,5); 7,333(1,3); 3,324(74,8); 2,676(0,7); 2,671(0,9); 2,667 (0,7); 2,524(2,5); 2,511(45,7); 2,507(92,5); 2,502(124,5); 2,498 (94,2); 2,493(47,7); 2,333(0,5); 2,329(0,8); 2,325(0,6); 1,298(0,5); 1,259(0,7); 1,233(1,0); 0,000(1,1)
63	2,03	1,99	RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9,344(0,4); 8,925(9,0); 8,748(0,7); 8,714(16,0); 8,649(1,1); 8,542(0,3); 8,462(5,6); 8,446(5,9); 8,317(1,5); 8,137(0,4); 8,117(0,7); 8,081(5,4); 8,061(5,8); 7,970 (10,5); 7,950(13,1); 7,793(14,1); 7,772(11,5); 7,689(0,8); 7,666(5,7); 7,647(6,7); 7,629(4,4); 5,757(7,6); 3,507(0,3); 3,487 (0,3); 3,447(0,4); 3,439(0,4); 3,409(0,5); 3,326(536,7); 3,245 (0,3); 2,840(0,4); 2,820 (0,4); 2,805(0,4); 2,765(0,4); 2,671(8,5); 2,622(1,1); 2,618(1,1); 2,502(1215,9); 2,329 (7,9); 2,184(0,3); 1,355(0,6); 1,299(1,8); 1,259(2,9); 1,235(7,6); 1,166(0,5); 1,149(1,1); 1,066(0,4); 0,854(1,6); 0,843(1,0); 0,834(1,1); 0,814(0,7); 0,784(0,5); 0,146(5,7); 0,083(0,5); 0,000(1101,9); -0,150(5,9)
64	2,91	2,89	RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9,343(2,9); 9,338(3,0); 8,837(2,1); 8,833(2,4); 8,825 (2,3); 8,821(2,4); 8,623(8,0); 8,552(1,2); 8,548(1,7); 8,543(1,3); 8,532(1,3); 8,527(1,8); 8,523(1,3); 7,871(3,3); 7,793 (1,4); 7,772(1,9); 7,769(1,9); 7,691(4,1); 7,683(1,9); 7,670(4,3); 7,663(1,8); 7,650 (1,6); 5,751(1,5); 3,310(93,8); 2,675(0,6); 2,670(0,8); 2,666(0,6); 2,523(2,1); 2,506 (94,0); 2,501(124,8); 2,497(95,6); 2,328(0,8); 2,323(0,6); 2,200(16,0); 1,235(0,4); 0,008(0,4); 0,000(12,5)
65	1,70	1,70	RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 10,654(0,5); 10,355(0,5); 9,356(2,4); 9,351(2,4); 9,213(0,4); 8,839(2,0); 8,835(2,0); 8,827(1,9); 8,823(1,7); 8,775(0,4); 8,718(7,1); 8,560(1,4); 8,557(1,3); 8,546(1,4); 8,542(1,6); 8,466(0,9); 8,383(0,5); 8,362(0,6); 8,337(1,0); 8,314(5,1); 8,241(2,4); 8,220(2,6); 8,143(2,9); 8,138(2,9); 8,110(0,4); 7,994(0,4); 7,973(0,4); 7,940(0,9); 7,910(5,0); 7,848(0,7); 7,837(0,5); 7,794(1,6); 7,715(0,6); 7,685(1,4); 7,673(1,7); 7,667(1,6); 7,651(2,4); 7,645(2,1); 7,629(2,0); 7,624(2,0); 7,593(0,5); 7,530(0,4); 7,520(0,6); 7,516(0,6); 7,494(0,6); 5,924(0,4); 5,754(1,3); 5,584(0,4); 4,637(0,4); 4,306(0,4); 4,273(0,5); 4,186(0,4); 4,151(0,4); 4,130(0,4); 4,096(0,4); 4,055(0,4); 4,039(0,5); 4,021(0,5); 3,986(0,5); 3,967(0,6); 3,941(0,4); 3,921(0,5); 3,905(0,6); 3,884(0,6); 3,868(0,7); 3,851(0,5); 3,838(0,5); 3,823(0,5); 3,765(0,5); 3,692(0,6); 3,637(0,6); 3,608(0,6); 3,585(0,7); 3,573(0,7); 3,544(0,7); 3,530(0,7);

(continuación)

Ej. N°	logP[a]	logP[b]	RMN de ¹ H [σ (ppm)] o bien CL-EM [m/z]
			3,509(0,9); 3,470(1,0); 3,452(1,0); 3,438(1,0); 3,398(1,3); 3,392(1,4); 3,378(1,8); 3,317 (1231,0); 3,277(1,8); 3,265(2,1); 3,259(1,7); 3,254(1,7); 3,217(1,2); 3,189(1,1); 3,174(1,2); 3,147(1,3); 3,123(1,4); 3,095(2,1); 3,071(2,2); 3,041(1,8); 3,002(2,0); 2,979(1,8); 2,937(1,6); 2,916(0,8); 2,902(0,7); 2,889(0,8); 2,861(0,9); 2,830(0,9); 2,812(1,0); 2,775(1,2); 2,710(1,6); 2,694(2,0); 2,675(12,0); 2,670(16,0); 2,666 (12,5); 2,561(4,8); 2,557(5,4); 2,523(51,5); 2,510(893,1); 2,506(1772,8); 2,501(2326,4); 2,497(1726,9); 2,332(9,4); 2,328(13,4); 2,324(9,8); 1,352(0,6); 1,336(0,7); 1,300(0,5); 1,235(6,1); 1,213(1,1); 1,194(1,3); 1,176(1,0); 1,158(0,7); 0,854(1,1); 0,837(0,7); 0,214(0,4); 0,196(0,4); 0,146(13,9); 0,121(0,7); 0,112 (0,7); 0,104(0,8); 0,091(0,7); 0,082(1,1); 0,074(1,0); 0,061(1,2); 0,056(1,0); 0,008(120,2); 0,000(2914,5); -0,008(142,9); -0,052(1,8); -0,058(0,9); -0,063(0,7); -0,068(0,7); -0,150(13,4)
66	2,20	2,21	RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9,340(4,1); 9,334(4,3); 8,836(2,9); 8,833(3,2); 8,825(3,0); 8,821(3,2); 8,548(1,6); 8,544(2,5); 8,539(1,8); 8,525(12,5); 7,682 (2,3); 7,670(2,3); 7,661(2,7); 7,656(2,6); 7,650(2,8); 7,638(3,8); 7,635(3,5); 7,599(2,2); 7,585(4,8); 7,566(4,6); 7,459(2,0); 7,456(2,1); 7,437(3,1); 7,421(1,2); 7,418(1,3); 4,039(0,5); 4,021(0,5); 3,321(22,4); 2,983(1,3); 2,979(1,6); 2,964(4,1); 2,961(4,4); 2,946(4,3); 2,943(4,4); 2,928(1,6); 2,671(0,3); 2,507 (39,0); 2,503(51,4); 2,499(39,7); 2,330(0,3); 1,989(1,9); 1,187(7,9); 1,175(1,7); 1,168(16,0); 1,158(1,1); 1,150(7,6); 0,000(1,1)
67	1,28	1,29	RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9,347(8,0); 9,342(8,3); 8,839(6,5); 8,832(13,6); 8,734(8,2); 8,553(4,6); 8,533(4,8); 8,315(0,3); 8,010(3,0); 7,991(3,8); 7,974(2,1); 7,955(2,9); 7,883(2,4); 7,864(5,3); 7,845(3,6); 7,834(1,8); 7,818(4,0); 7,816(4,1); 7,797(4,2); 7,781(1,6); 7,712(7,0); 7,688(6,1); 7,675(4,2); 7,667(4,2); 7,655(3,9); 4,356(0,5); 4,343(0,9); 4,331(0,5); 3,456(0,9); 3,443(0,9); 3,439(1,0); 3,426(0,9); 3,409(0,3); 3,319(49,2); 2,979(0,5); 2,961(1,6); 2,943(2,1); 2,927(2,4); 2,920(1,6); 2,908(2,3); 2,902(1,7); 2,886(2,0); 2,867(1,6); 2,849(0,5); 2,700(0,6); 2,690(0,8); 2,682(2,1); 2,672(3,4); 2,664(2,7); 2,654(2,7); 2,648(2,0); 2,638(2,3); 2,630(1,6); 2,620(1,8); 2,611(0,7); 2,602(0,7); 2,541(1,1); 2,502(179,7); 2,329 (1,0); 1,077(7,4); 1,059(16,0) ;1,040(8,1); 1,026(5,7); 1,007(11,5); 0,989(5,3); 0,146 (1,0); 0,027(0,5); 0,000(183,4); -0,150(1,0)
68	2,34	2,29	RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9,348(4,6); 9,344(4,6); 8,841(3,7); 8,837(4,0); 8,829(4,0); 8,825(4,0); 8,558(2,5); 8,551(16,0); 8,539 (2,6); 8,533(3,3); 8,529(2,4); 7,918(3,2); 7,915(3,1); 7,899(4,0); 7,688(2,9); 7,686(2,8); 7,676(2,9); 7,674(2,9); 7,667(5,2); 7,663(4,0); 7,654(4,6); 7,648(3,9); 7,645(5,9); 7,639(5,5); 7,635(3,0); 7,620(3,2); 7,616(2,2); 7,598(3,4); 7,595(3,5); 7,579(3,1); 7,576(3,5); 7,561(1,3); 7,557(1,2); 5,757(3,6); 4,056(0,6); 4,038(1,0); 4,031(1,1); 4,020(1,3); 4,017(1,0); 4,006(1,3); 3,992(2,6); 3,980(0,7); 3,967(3,0); 3,944(2,9); 3,930(0,6); 3,918(2,8); 3,905(1,2); 3,892(1,0); 3,878(1,2); 3,852(0,4); 3,329(31,2); 2,677(0,4); 2,672(0,5); 2,668 (0,4); 2,526(1,3); 2,512(26,5); 2,508(53,3); 2,503(70,5); 2,499(52,7); 2,495(27,0); 2,335(0,3); 2,330(0,5); 2,325(0,4); 1,990(3,7); 1,397(1,3); 1,299(0,8); 1,259(1,1); 1,250(0,4); 1,234(1,6); 1,193(1,2); 1,176(2,1); 1,158(1,1); 0,146(0,6); 0,008(4,9); 0,000(120,6); -0,008(6,0); -0,150(0,6)
69	1,74	1,75	RMN de ¹H (601,6 MHz, CDCl₃): δ = 9,372(12,3); 8,822(9,3); 8,817(9,2); 8,465(7,5); 8,453 (8,0); 8,307(16,0); 8,291 (8,4);

(continuación)

Ej. N°	logP[a]	logP[b]	RMN de ¹ H [σ (ppm)] o bien CL-EM [m/z]
			8,278(8,2); 8,192 (1,6); 8,154(0,9); 7,937(0,8); 7,910 (4,3); 7,898(8,3); 7,885(5,1); 7,837(5,4); 7,825(9,3); 7,813(6,0); 7,583(0,8); 7,525 (6,1); 7,516(7,8); 7,513(7,9); 7,505(6,3); 7,451(9,5); 7,439(8,9); 7,263(66,7); 7,086 (0,4); 5,301(4,1); 4,129(1,1); 4,112(3,4); 4,094(4,4); 4,072(3,5); 4,055(1,2); 3,882 (0,3); 3,859(0,5); 3,841(0,4); 3,642(0,4); 3,625(0,5); 3,597(1,4); 3,580(3,6); 3,564 (4,4); 3,558(4,0); 3,541(3,2); 3,525(1,1); 3,490(0,5); 1,577 (178,8); 1,426(0,4); 1,371 (1,1); 1,333(2,4); 1,285(4,4); 1,256(10,6); 1,104(0,5); 0,881(1,6); 0,842(1,6); 0,070 (0,6); 0,000(47,7)
70	2,82	2,75	RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9,238(3,7); 8,867(3,7); 8,861(4,0); 8,636(9,5); 8,528 (1,2); 8,522(1,6); 8,517(1,2); 8,505(1,3); 8,500(1,7); 8,494(1,2); 8,175(0,4); 7,395 (3,9); 7,389(5,0); 7,366(3,3); 7,259(2,5); 7,254(2,4); 7,239(2,0); 7,234(1,9); 7,199 (0,4); 5,758(0,4); 3,437(0,3); 3,329(65,1); 2,676(0,7); 2,671(1,0); 2,667 (0,8); 2,662 (0,5); 2,541(0,4); 2,525(2,4); 2,511(55,7); 2,507(114,5); 2,502(153,6); 2,498(117,2); 2,494(63,2); 2,489(35,6); 2,474(2,6); 2,424 (0,4); 2,333(1,1); 2,329(1,5); 2,316(16,0); 2,287(0,4); 2,216(1,0); 1,434 (0,6); 1,296 (0,4); 1,234(1,3); 1,073(0,9); 1,055(1,8); 1,038(0,9); 0,700(0,7); 0,000(0,3)
71	3,64	3,34	RMN de ¹H(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9,238(2,3); 9,234(3,8); 8,869(3,7); 8,862(3,9); 8,547 (9,3); 8,524(1,2); 8,519(1,5); 8,517(1,5); 8,512(1,2); 8,500(1,3); 8,496(1,6); 8,489 (1,1); 7,676(5,9); 7,360(4,8); 5,754(0,4); 4,038(0,8); 4,033(1,2); 4,021(0,8); 4,007 (3,6); 3,981(3,7); 3,955(1,3); 3,319(43,7); 2,671(0,4); 2,525(1,1); 2,511 (20,9); 2,507 (41,2); 2,502(53,7); 2,498(39,5); 2,494(19,6); 2,410(14,9); 2,329(0,4); 2,080 (16,0); 1,989 (2,6); 1,398 (0,9); 1,193(0,7); 1,176(1,4); 1,158(0,7); 0,008(0,8); 0,000 (20,9); -0,008(0,8)
72	2,35	2,29	RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9,241(5,8); 8,872(5,8); 8,866(6,0); 8,604(14,2); 8,532 (1,9); 8,526(2,5); 8,521(1,8); 8,509(2,0); 8,504(2,6); 8,498(1,8); 7,944(6,4); 7,934 (4,4); 7,496(3,1); 7,470(4,6); 5,757(13,7); 4,324 (0,6); 4,297(0,7); 4,287(0,7); 4,260 (0,7); 4,178(0,6); 4,168(0,5); 4,160(0,5); 4,150(1,7); 4,142(1,6); 4,133(0,5); 4,124 (1,8); 4,115(1,8); 4,105(0,5); 4,097(0,6); 4,087(0,7); 3,970(0,7); 3,943(0,8); 3,933 (0,6); 3,906(0,6); 3,328 (81,6); 2,676(0,5); 2,672(0,7); 2,667(0,5); 2,507(83,1); 2,503 (109,0); 2,498(81,5); 2,451(12,1); 2,446 (15,8); 2,408(0,6); 2,333(0,6); 2,329(0,8); 2,325(0,6); 2,189 (16,0); 2,183(11,7); 2,076 (11,2); 0,000(1,0)
73	3,36	3,25	RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9,243(3,5); 8,875(3,5); 8,868(3,6); 8,693(7,7); 8,535(1,2); 8,530(1,7); 8,524(1,2); 8,512(1,2); 8,507(1,7); 8,501(1,1); 7,940(3,1); 7,922(3,1); 7,521(2,7); 7,494(2,7); 4,061(1,2); 4,035(3,8); 4,009(3,9); 3,984(1,4); 3,329 (53,8); 2,676(0,3); 2,672(0,5); 2,668(0,3); 2,507(49,1); 2,503(64,3); 2,499(49,1); 2,471 (16,0); 2,414(0,5); 2,334(0,3); 2,330(0,4); 2,325(0,3); 2,076(14,3); 1,233(0,9); 0,000(0,4)
74	2,34	2,26	RMN de ¹H(400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9,249(4,3); 9,246(7,4); 9,242(4,4); 8,876(7,8); 8,870(8,1); 8,738(16,0); 8,538 (2,5); 8,533(3,1); 8,531 (3,1); 8,527(2,4); 8,515(2,6); 8,510(3,3); 8,503(2,4); 8,447(0,5); 8,317(0,7); 8,200(6,2); 8,182(6,2); 7,639(4,3); 7,613(4,3); 5,758(2,5); 4,299(0,6); 4,266(1,0); 4,241(0,8); 4,147(0,4); 4,126(0,7); 4,099(0,8); 4,038(0,5); 4,020(0,4); 3,568(3,3); 3,329 (336,9); 2,676(1,4); 2,671(2,0); 2,667(1,5); 2,525(5,0); 2,520(7,9); 2,511(110,1); 2,507(225,1); 2,502(308,8); 2,498(233,4); 2,494(111,7); 2,377(1,3);

ES 2 747 810 T3

(continuación)

Ej. Nº	logP[a]	logP[b]	RMN de ¹ H [σ (ppm)] o bien CL-EM [m/z]
			2,334(1,5); 2,329(2,0); 2,325(1,5); 1,989(1,2); 1,234(0,4); 1,207(0,4); 1,193(0,6); 1,189(0,7); 1,175(0,8); 1,157(0,3); 0,000(0,9)
75	1,80	1,72	RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9,532(12,8); 9,421(6,3); 9,396(0,9); 9,367(0,5); 8,619 (6,6); 8,449(0,5); 7,792(0,7); 7,772(0,8); 7,525(0,5); 7,493(1,2); 7,466(4,3); 7,446(7,2); 7,401(6,7); 7,381(4,2); 7,252(0,3); 7,239(0,4); 7,183(0,6); 7,163(0,6); 7,116(0,3); 5,754(1,6); 4,095(0,3); 4,077(0,8); 4,060(0,8); 4,041(0,3); 3,865(0,3); 3,846(0,3); 3,318(48,1); 2,671(0,9); 2,566 (0,8); 2,502(128,3); 2,424(4,2); 2,409(16,0); 2,328(1,3); 2,306(0,5); 2,284(2,0); 1,344(0,4); 1,326(0,4); 1,302(0,5); 1,285(0,6); 1,265(0,5); 1,248(0,5); 1,242(0,5); 1,225(0,6); 1,205(1,4); 1,187(2,1); 1,178(1,2); 1,169(1,3); 1,098(0,4); 0,146(0,6); 0,000(109,4); -0,150(0,6)
76	2,88	2,77	RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9,538(16,0); 9,429(7,5); 8,559(8,5); 7,680(4,9); 7,362(3,9); 5,754(1,8); 4,034(1,0); 4,008(2,9); 3,982(3,1); 3,956(1,1); 3,318 (38,5); 2,671(0,4); 2,524(1,0); 2,511(23,9); 2,506(47,7); 2,502(62,3); 2,497(45,4); 2,493(22,1); 2,411(12,3); 2,368(0,6); 2,329(0,4); 2,170(0,5); 2,080(13,3); 1,352(1,1); 1,336(0,4); 1,259(0,4); 1,250(0,6); 1,229(1,2); 0,000(3,8)
77	1,84	1,82	RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9,542(16,0); 9,429(7,8); 8,612(8,8); 7,949(4,1); 7,939(2,8); 7,497(2,0); 7,471(3,0); 5,754(0,9); 4,321(0,4); 4,293(0,5); 4,284(0,5); 4,257(0,5); 4,175(0,4); 4,166(0,4); 4,148(1,1); 4,139(1,1); 4,121(1,1); 4,112(1,2); 4,094(0,4); 4,085(0,4); 3,969(0,5); 3,942(0,5); 3,932(0,4); 3,905(0,5); 3,317(54,5); 2,675(0,5); 2,671 (0,7); 2,666(0,5); 2,506(79,6); 2,502(106,3); 2,497(82,4); 2,452(8,0); 2,447(10,7); 2,338(0,5); 2,333(0,6); 2,328(0,7); 2,324(0,6); 2,258(0,4); 2,188(10,5); 2,182(8,0); 1,234(0,7); 0,008(0,5); 0,000(13,1)
78	2,73	2,65	RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9,543(16,0); 9,448(1,1); 9,430(7,6); 9,399(0,4); 9,365(0,8); 8,700(6,9); 8,313(0,4); 7,943(2,5); 7,925(2,5); 7,520(2,1); 7,493(2,0); 6,896(0,8); 6,706(0,5); 5,753(0,7); 4,364(0,5); 4,346(0,6); 4,058(1,0); 4,032(3,1); 4,006(3,2); 3,981(1,2); 3,974(0,6); 3,317(53,6); 2,675(0,6); 2,671(0,8); 2,666(0,6); 2,538(0,6); 2,524(2,2); 2,519(3,5); 2,511(44,1); 2,506(91,2); 2,502(121,8); 2,497(89,5); 2,493(43,8); 2,473(12,9); 2,415 (0,6); 2,333(0,6); 2,329(0,8); 2,324(0,6); 1,352(7,8); 1,336(2,3); 1,322(1,5); 1,315(0,6); 1,304(0,9); 1,298(1,5); 1,259(2,2); 1,250(3,5); 1,229(7,3); 1,180(0,4); 0,868(0,3); 0,851(0,8); 0,834(0,3); 0,008(0,4); 0,000(12,0); -0,008(0,4)
79	2,20	2,17	RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9,302(2,4); 9,298(2,4); 9,296(2,3); 8,849(7,4); 8,813(1,9); 8,809(2,1); 8,801(2,1); 8,797(2,1); 8,511(1,1); 8,507(1,5); 8,506(1,4); 8,501(1,2); 8,491(1,2); 8,487(1,5); 8,485(1,6); 8,481(1,2); 7,658(1,4); 7,657(1,5); 7,646(1,4); 7,645(1,4); 7,638(1,4); 7,637(1,4); 7,626(1,4); 7,625(1,4); 7,271(1,0); 7,252(2,8); 7,233(2,2); 7,209(2,7); 7,184(2,0); 7,164(1,2); 7,134(1,7); 7,115(1,5); 7,030(0,5); 5,232(8,1); 4,363(0,3); 4,348(0,3); 3,329(63,9); 2,672(0,5); 2,668 (0,3); 2,543(1,8); 2,526(0,9); 2,512(24,0); 2,508(49,4); 2,503(66,3); 2,499(49,7); 2,494(25,0); 2,334(0,3); 2,330(0,5); 2,325(0,3); 2,288(16,0); 0,000(0,4)
80	2,39	2,42	RMN de ¹H (400,0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9,307(2,7); 8,818(2,1); 8,808(2,0); 8,506(1,8); 8,486(1,8); 7,669(1,5); 7,657(1,7); 7,649(1,6); 7,637(1,4); 7,270(1,2); 7,251(2,7); 7,232(1,7);

(continuación)

Ej. N°	logP[a]	logP[b]	RMN de ¹ H [σ (ppm)] o bien CL-EM [m/z]
			7,124(2,2); 7,106(1,7); 7,048(3,5); 7,014(2,1); 6,995(1,8); 5,390(6,4); 3,329(45,5); 2,672(0,8); 2,564(16,0); 2,503(112,3); 2,330(0,9); 2,281(14,1); 1,398(0,4); 0,000(18,3)
81	2,17	2,13	RMN de ¹H (400,0 MHz, d6-DMSO): δ = 9,895(0,4); 9,305(5,1); 9,300(5,1); 9,276(0,3); 9,215(0,6); 8,956(0,7); 8,940(0,8); 8,871(12,3); 8,815(4,1); 8,811(4,4); 8,803(4,3); 8,799(4,1); 8,514(2,4); 8,509(3,3); 8,504(2,5); 8,494(2,6); 8,489(3,4); 8,484(2,4); 8,362(0,4); 8,150(0,5); 7,659(3,0); 7,647(3,1); 7,640(3,1); 7,627(2,8); 7,481(0,6); 7,461(0,9); 7,446(2,4); 7,438(1,3); 7,425(6,7); 7,406(3,8); 7,385(0,5); 7,363(0,3); 7,294(0,5); 7,266(4,8); 7,247(10,3); 7,238(9,9); 7,215(0,9); 7,202 (0,7); 7,143(3,5); 7,138(3,6); 7,120(3,6); 7,099(0,9); 7,069(1,1); 7,053(3,7); 7,030(0,4); 5,286(16,0); 4,789(0,4); 4,770(0,4); 4,583(0,6); 4,570(0,6); 4,327(0,8); 4,311(0,7); 4,198(0,5); 4,181(0,5); 3,329(67,5); 2,945 (1,8); 2,785(1,5); 2,672(1,0); 2,508(109,0); 2,504(135,0); 2,499(106,7); 2,330(1,0); 2,288(2,1); 2,076(1,3); 1,959(1,5); 1,630(0,5); 1,612(1,0); 1,594(0,5); 1,248(0,7); 1,231(1,3); 1,213(0,6); 0,146(0,6); 0,000(110,1); -0,150(0,6)
82	1,91	1,90	RMN de ¹H(400,0 MHz, d6-DMSO): δ = 9,296(1,8); 9,291(1,7); 8,862(4,8); 8,809(1,3); 8,805 (1,4); 8,797(1,4); 8,794(1,3); 8,505(0,9); 8,500(1,2); 8,495(0,8); 8,485(0,9); 8,480 (1,2); 8,475(0,8); 7,653(1,1); 7,641(1,1); 7,633(1,1); 7,621(1,0); 7,391(3,4); 7,369 (3,6); 6,940(0,8); 6,933(4,0); 6,911(3,6); 5,193(6,3); 3,750(0,9); 3,728 (16,0); 3,331 (54,2); 2,508(36,4); 2,503(46,4); 2,499(35,6); 2,330(0,3); 2,287(0,7); 1,397(0,6); 1,183(0,3)
83	2,27	2,27	RMN de ¹H (400,0 MHz, d6-DMSO): δ = 9,310(3,1); 9,306(3,1); 8,817(2,4); 8,808(2,4); 8,781 (5,0); 8,525(1,9); 8,505(2,0); 7,673 (1,6); 7,660(1,8); 7,653(1,8); 7,641(1,5); 7,481(1,4); 7,461(1,6); 7,243(1,3); 7,223 (2,6); 7,203(1,5); 7,119(1,6); 7,099(1,6); 7,083(2,2); 7,054(2,1); 7,009(2,5); 6,990 (2,1); 5,271(8,3); 4,109(1,6); 2,672 (0,7); 2,503(100,4); 2,329(1,0); 2,295(16,0); 0,146(0,3); 0,000(64,6); -0,150(0,4)
84	0,90		RMN de ¹H (600,1 MHz, d6-DMSO): δ = 9,317(4,7); 9,314(4,5); 9,313(4,4); 8,941(0,8); 8,927 (0,7); 8,821(3,7); 8,819 (3,9); 8,813(3,9); 8,810(3,9); 8,794(13,9); 8,788(14,8); 8,785(15,5); 8,521(2,1); 8,518(2,7); 8,517 (2,7); 8,514(2,1); 8,508 (2,2); 8,505(2,7); 8,504(2,9); 8,501(2,1); 7,664(2,6); 7,663 (2,6); 7,656(2,6); 7,655(2,6); 7,651(2,6); 7,649(2,6); 7,643 (2,5); 7,641(2,5); 7,468 (2,9); 7,460(5,5); 7,452(2,8); 5,513(16,0); 4,987 (0,4); 4,973(0,4); 4,966(0,4); 4,952 (0,4); 3,325 (57,1); 3,256(0,3); 3,085(2,2); 3,075(0,4); 2,788(2,2); 2,524(0,7); 2,521 (0,9); 2,518 (1,0); 2,509(17,5); 2,506(35,7); 2,503 (48,2); 2,500(35,3); 2,498(16,9); 2,076(1,3); 1,352(0,6); 1,232(1,0); 1,225 (0,7); 0,000(0,8)
85	0,90	1,00	RMN de ¹H (400,0 MHz, d6-DMSO): δ = 9,306(5,5); 8,832(9,0); 8,817(14,8); 8,696(0,4); 8,685 (0,4); 8,587(7,8); 8,571(7,3); 8,513(3,8); 8,493(3,8); 8,317(0,3); 7,663 (3,2); 7,650(3,5); 7,643(3,5); 7,631 (2,9); 5,758(1,0); 5,481(16,0); 3,327(92,7); 2,808(0,3); 2,785 (0,3); 2,672(2,6); 2,502 (293,6); 2,329(2,1); 2,288(0,5); 1,990(0,5); 1,397(1,9); 1,175(0,4); 1,150(0,4); 0,146 (1,2); 0,000(186,4); -0,084(0,5); -0,150(1,1)
86	1,01	1,07	RMN de ¹H (400,0 MHz, d6-DMSO): δ = 9,307(1,7); 9,303(1,7); 8,817(1,4); 8,814(1,5); 8,805 (1,4); 8,802(1,5); 8,701(5,3); 8,519(0,8); 8,514(1,0); 8,509(0,8); 8,498(0,9); 8,493 (1,1); 8,489(0,8); 7,941(4,3); 7,661(1,0); 7,660(1,0); 7,647(1,0);

(continuación)

Ej. N°	logP[a]	logP[b]	RMN de ¹ H [σ (ppm)] o bien CL-EM [m/z]
			7,641(1,0); 7,640 (1,0); 7,629(0,9); 7,627(0,9); 6,445 (0,4); 6,427(1,4); 6,409(1,4); 6,392(0,4); 5,758 (1,5); 3,895 (16,0); 3,329(46,3); 2,672(0,4); 2,542(1,1); 2,525(1,0); 2,512 (22,5); 2,507 (45,6); 2,503(60,2); 2,498(44,0); 2,494(21,6); 2,330(0,4); 1,890(4,9); 1,872 (4,9); 0,000(1,4)

Ejemplos biológicos**Boophilus microplus – ensayo de inyección**

Disolvente: sulfóxido de dimetilo

5 Para producir una preparación adecuada de compuesto activo, se mezcla 10 mg de compuesto activo con 0,5 ml de solvente, y se diluye el concentrado con solvente hasta la concentración deseada.

Se inyecta 1 µl de la solución de compuesto activo en el abdomen de 5 garrapatas de ganado hembra adultas bien alimentadas (*Boophilus microplus*). Se transfieren los animales a platos y se los mantiene en una habitación con clima controlado.

10 Se evalúa la actividad luego de 7 días mediante la deposición de huevos fértiles. Se almacenan los huevos, cuya fertilidad no es visible desde el exterior, en un gabinete con clima controlado hasta la incubación de las larvas luego de aproximadamente 42 días. Una eficacia del 100 % significa que ninguna de las garrapatas ha puesto huevos fértiles; 0 % significa que todos los huevos son fértiles.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los Ejemplos de Preparación muestran una eficacia del 100 % a una cantidad de aplicación de 20 µg/animal: 57

15 **Ensayo con Meloidogyne incognita**

Disolvente: 125,0 partes en peso de acetona

Para la elaboración de un preparado conveniente de principio activo se disuelve 1 parte en peso de principio activo con las cantidades indicadas de disolvente y se diluye en concentrado con agua a la concentración deseada.

20 Se llenan recipientes con arena, la solución de principio activo, una suspensión con larvas y huevos del nematodo sureño de agallas de raíz (*Meloidogyne incognita*) y semillas de lechuga. Las semillas de lechuga germinan y se desarrollan las plantitas. En las raíces se forman las agallas.

Al cabo de 14 días se determina el efecto nematocida por medio del % de la formación de agallas. A este respecto un 100 % significa que no se encontraron agallas; 0 % significa que la cantidad de agallas en las plantas tratadas equivale al control sin tratar.

25 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de ejemplos de la preparación presentan un efecto de 90 % a una cantidad aplicada de 20 ppm: 63

Myzus persicae – ensayo de rociado

Disolvente: 78,0 partes en peso de acetona

1,5 partes en peso de dimetilformamida

30 Emulsionante: 0,5 partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

Para la preparación de un preparado adecuado de principio activo se mezcló 1 parte en peso principio activo con las cantidades indicadas de disolvente y emulsionante y se diluyó el concentrado con agua que contenía emulsionante a la concentración deseada (en g/ha). Para la preparación de otras concentraciones de ensayo se diluye con agua que contiene emulsionante.

35 Se rociaron discos de hojas de col de quina (*Brassica pekinensis*) infestadas por el pulgón verde del melocotonero (*Myzus persicae*) en todos sus estadios con un preparado de principio activo de la concentración deseada.

Al cabo de 6 días se determinó el efecto en %. Aquí 100% significa que fueron exterminados todos los áfidos; 0% significa que ningún áfido fue exterminado.

40 En este ensayo p. ej., el siguiente compuesto de los ejemplos de preparación mostró un efecto de 100 % con una cantidad de aplicación de 500 g/ha: 1, 2, 3, 4, 5, 7, 9, 15, 20, 23, 34, 35, 39, 40, 43, 45, 48, 49, 50, 51, 54, 57, 60, 61, 64, 66, 70, 77, 83, 84

En este ensayo p. ej., el siguiente compuesto de los ejemplos de preparación mostró un efecto de 90 % con una

cantidad de aplicación de 500 g/ha: 6, 8, 12, 13, 14, 16, 17, 18, 21, 22, 24, 25, 26, 27, 36, 37, 41, 46, 47, 52, 53, 55, 56, 58, 59, 62, 63, 67, 71, 72, 73, 74, 76, 78, 80, 81, 86

En este ensayo p. ej., el siguiente compuesto de los ejemplos de preparación mostró un efecto de 90 % con una cantidad de aplicación de 100 g/ha: 19, 79

5

Phaedon cochleariae – ensayo de rociado

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

10

Para la preparación de un preparado adecuado de principio activo se mezcló 1 parte en peso principio activo con las cantidades indicadas de disolvente y emulsionante y se diluyó el concentrado con agua que contenía emulsionante a la concentración deseada. Para la preparación de otras concentraciones de ensayo se diluye con agua que contiene emulsionante.

15

Se rociaron discos de hojas de col de China (*Brassica pekinensis*) con un preparado de principio activo de la concentración deseada y después del secado se les colocaron larvas del escarabajo de la mostaza (*Phaedon cochleariae*).

Al cabo de 7 días se determinó el efecto en %. Aquí 100 % significa que fueron exterminadas todas las larvas de escarabajo; 0 % significa que ninguna larva de escarabajo fue exterminada.

En esta prueba p. ej., el siguiente compuesto de los ejemplos de preparación mostró un efecto de 100 % con una cantidad de aplicación de 500g/ha: 11, 37, 62

20

Spodoptera frugiperda – ensayo de rociado

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

25

Para la preparación de un preparado adecuado de principio activo se mezcló 1 parte en peso principio activo con las cantidades indicadas de disolvente y emulsionante y se diluyó el concentrado con agua que contenía emulsionante en la concentración de 1000 ppm. Para la preparación de otras concentraciones de ensayo se diluye con agua que contiene emulsionante.

Se rociaron hojas de maíz (*Zea mays*) con un preparado de principio activo de la concentración deseada y después del secado se les colocaron orugas del gusano cogollero (*Spodoptera frugiperda*).

30

Al cabo de 7 días se determinó el efecto en %. Aquí 100% significa que fueron exterminadas todas las orugas; 0% significa que ninguna oruga fue exterminada.

En esta prueba p. ej., el siguiente compuesto de los ejemplos de preparación mostró un efecto de 100 % con una cantidad de aplicación de 500 g/ha: 11, 37

35

Tetranychus urticae – ensayo de rociado, resistente a OP

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

40

Para la preparación de un preparado adecuado de principio activo se mezcló 1 parte en peso de principio activo con las cantidades indicadas de disolvente y emulsionante y se diluyó el concentrado con agua que contenía emulsionante en la concentración de 1000 ppm. Para la preparación de otras concentraciones de ensayo se diluye con agua que contiene emulsionante.

Se rociaron plantas de alubias (*Phaseolus vulgaris*), afectadas por la araña roja común (*Tetranychus urticae*) en todos sus estadios con un preparado de principio activo de la concentración deseada.

45

Al cabo de 6 días se determinó el efecto en %. Aquí 100 % significa que fueron exterminados todos los arácnidos; 0 % significa que ningún arácnido fue exterminado.

En esta prueba p. ej., el siguiente compuesto de los ejemplos de preparación mostró un efecto de 90 % con una cantidad de aplicación de 500 g/ha: 11, 57

50

Myzus persicae – ensayo de rociado

Disolvente: 7 partes en peso de dimetilformamida
Emulsionante: alquilarilpoliglicoléter

Para la preparación de un preparado adecuado de principio activo se mezcló 1 parte en peso principio activo con las

cantidades indicadas de disolvente y emulsionante y se diluyó el concentrado con agua que contenía emulsionante a la concentración deseada (en g/ha). Para la preparación de otras concentraciones de ensayo se diluye con agua que contiene emulsionante. En caso de requerir a adición de sales de amonio o/y agentes de penetración, estos se adicionan en cada caso en una concentración de 1000 ppm a la solución de preparado.

- 5 Se rociaron plantas de paprika (*Capsicum annuum*) muy infestadas por el pulgón verde del melocotonero (*Myzus persicae*) en todos sus estadios con un preparado de principio activo en la concentración deseada.

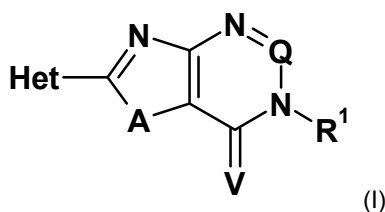
Al cabo de 6 días se determinó el efecto en %. Aquí 100% significa que fueron exterminados todos los áfidos; 0% significa que ningún áfido fue exterminado.

- 10 En este ensayo p. ej., el siguiente compuesto de los ejemplos de preparación mostró un efecto de 100 % con una cantidad de aplicación de 4 p.p.: 44

En este ensayo p. ej., el siguiente compuesto de los ejemplos de preparación mostró un efecto de 96 % con una cantidad de aplicación de 4 p.p.: 10

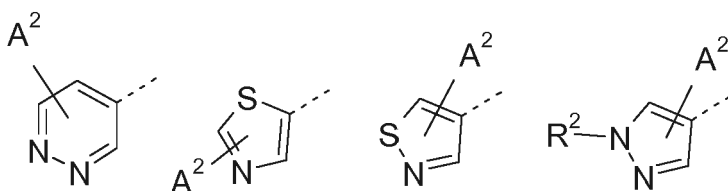
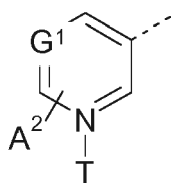
REIVINDICACIONES

1. Compuestos de la fórmula (I)



en la que

5 Het representa un resto de la serie



en la que la línea discontinua representa la unión con el átomo de carbono en el grupo N=C-A unido a Het y

G¹ representa N o C-A¹,

10 A¹ representa hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi o cicloalquilo o cicloalqueno
cada uno dado el caso sustituidos,

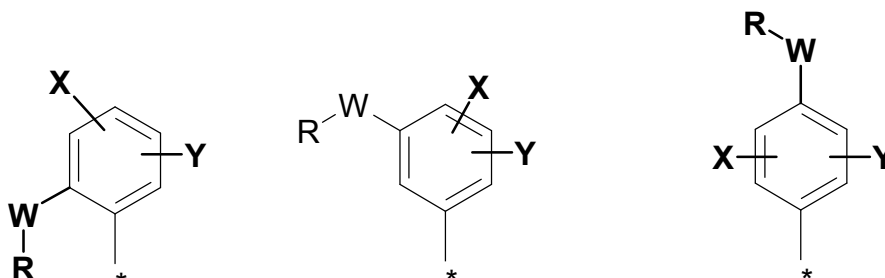
A² representa hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi o cicloalquilo o cicloalqueno
cada uno dado el caso sustituidos,

T representa oxígeno o un par de electrones,

15 R² representa hidrógeno, alquilo, haloalquilo o cicloalquilo dado el caso sustituidos,

R¹ representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo, haloalquilo, cianoalquilo, alqueno, haloalqueno, alquino,
haloalquino, alcoxi, haloalcoxi, alcóxialquilo dado el caso sustituido con halógeno, bis(alcoxi)alquilo dado el caso
sustituido con halógeno, alquilsulfonilalquilo dado el caso sustituido con halógeno, alquilsulfonilalquilo dado el
caso sustituido con halógeno, dialquilaminosulfonilalquilo, dialquilaminosulfonilalquilo, dialquilamino-sulfonilalquilo,
20 alcóxicarbonilo dado el caso sustituido con halógeno, alcóxicarbonilalquilo dado el caso sustituido con halógeno,
alquinoxiloxi dado el caso sustituido con halógeno, alquinoxiloxicarbonilo dado el caso sustituido con halógeno,
dialquilaminocarbonilo, N-alquil-N-cicloalquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilalquilo, N-alquil-N-
cicloalquilaminocarbonilalquilo, heterociclil-carbonilalquilo, alquilsulfanilo, haloalquilsulfanilo, alquilsulfonilo,
25 haloalquilsulfonilo, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, cicloalquilo sustituido dado el caso con halógeno, ciano, nitro,
alquilo, cicloalquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alcóxicarbonilo, haloalcoxicarbonilo o hetarilo (que dado el caso
también está sustituido con alquilo o halógeno), cicloalquilcarbonilo dado el caso sustituido con halógeno, ciano,
nitro, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alcóxicarbonilo, haloalcoxicarbonilo o hetarilo (que dado el
caso también está sustituido con alquilo o halógeno), cicloalquilalquilo dado el caso sustituido con halógeno, ciano,
nitro, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alcóxicarbonilo, haloalcoxicarbonilo o hetarilo (que dado
30 el caso también está sustituido con alquilo o halógeno), heterociclilo dado el caso sustituido, heterocicilalquilo dado
el caso sustituido con halógeno, ciano (también en la parte alquilo), nitro, hidroxil, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo
(que dado el caso está sustituido), alcoxi, haloalcoxi, alquiltio, haloalquiltio, alquilsulfonilo, alquilsulfonilo,
haloalquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, amino, alquilamino, dialquilamino, alquilcarbonilamino, alcóxicarbonilamino,
alcóxialquilo, haloalcoxi-alquilo, alqueno, alquino, cicloalquilalquilo, alquilcarbonilo, alcóxicarbonilo o
35 aminocarbonilo, arilo dado el caso sustituido con halógeno, ciano, nitro, hidroxil, amino, alquilo, haloalquilo,
cicloalquilo (que dado el caso está sustituido) alcoxi o haloalcoxi, arilalquilo dado el caso sustituido con halógeno,
ciano (también en la parte alquilo), nitro, hidroxil, amino, alquilo, cicloalquilo (que dado el caso está sustituido),
haloalquilo, alcoxi o haloalcoxi, hetarilo dado el caso sustituido con halógeno, ciano, nitro, hidroxil, alquilo,
haloalquilo, cicloalquilo (que dado el caso está sustituido), alcoxi, haloalcoxi, alquiltio, haloalquiltio, alquilsulfonilo,
40 alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, amino, alquilamino, dialquilamino, alquilaminocarbonilo,

5 dialquilaminocarbonilo, alquilcarbonilamino, alcoxicarbonilamino, alcoxialquilo, haloalcoxialquilo, alqueno, alquinilo, cicloalquilalquilo, alquilcarbonilo, alcoxicarbonilo o aminocarbonilo, hetarilalquilo dado el caso sustituido con halógeno, ciano (también en la parte alquilo), nitro, hidroxilo, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo (que dado el caso está sustituido), alcoxi, haloalcoxi, alquiltio, haloalquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, haloalquilsulfinilo, haloalquilsulfonilo, amino, alquilamino, dialquilamino, alquilcarbonilamino, alcoxicarbonilamino, alcoxialquilo, haloalcoxialquilo, alqueno, alquinilo, cicloalquilalquilo, alquilcarbonilo, alcoxicarbonilo o aminocarbonilo, R¹ también representa un resto de la serie



10 en el que la unión con el átomo de nitrógeno en el grupo C(=V)-N-Q en la fórmula (I) está marcada con el asterisco (*),

R representa NR⁷R⁸ o representa en cada caso un resto dado el caso sustituido de la serie alquilo, alqueno, alquinilo, alcoxialquilo, alquil-S(O)_m-alquilo, R⁷-CO-alquilo, NR⁷R⁸-CO-alquilo, cicloalquilo, cicloalqueno, cicloalquilalquilo, cicloalquenalquilo, heterociclilo, heterocicilalquilo, fenilo, fenilalquilo, hetarilo y hetarilalquilo, W representa un resto de la serie O, S, SO y SO₂,

15 X representa un resto de la serie hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi y cicloalquilo,

Y representa un resto de la serie hidrógeno, halógeno, alquilo, cicloalquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, ciano y NR⁵R⁶,

A representa oxígeno o azufre

20 Q representa nitrógeno o C-R³, en el que

R³ representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo, cicloalquilo, haloalquilo, OH, alcoxi, haloalcoxi, SH, alquilsulfanilo, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, NH₂, alquilamino y dialquilamino,

V representa un resto de la serie oxígeno, azufre y NR⁴,

25 R⁴ representa un resto de la serie hidrógeno, ciano, alquilo, haloalquilo y cicloalquilo,

R⁵ representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo, cicloalquilo y haloalquilo,

R⁶ representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo, cicloalquilo y haloalquilo,

o

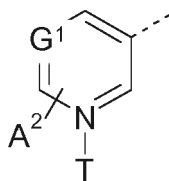
30 R⁵ y R⁶ junto con el nitrógeno al que están unidos, representan un anillo de 3 a 6 miembros saturado o insaturado dado el caso sustituido y que dado el caso contiene uno o varios otros heteroátomos,

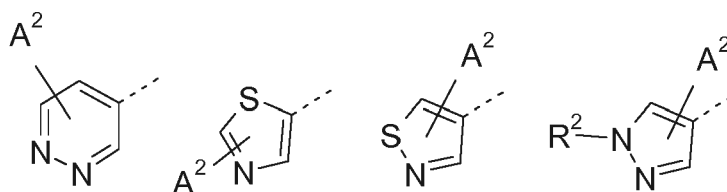
R⁷ representa hidrógeno, hidroxilo o en cada caso un resto dado el caso sustituido de la serie alquilo, alcoxi, alcoxialquilo, alquil-S(O)_m-alquilo, alquilcarbonilo, alcoxicarbonilo, cicloalquilo, cicloalqueno, cicloalquilalquilo, cicloalquenalquilo, heterociclilo, heterocicilalquilo, fenilo, fenilalquilo, hetarilo y hetarilalquilo,

R⁸ representa hidrógeno, un ión metálico, un ión de amonio dado el caso sustituido o en cada caso un resto dado el caso sustituido de la serie alquilo, alcoxi, alcoxialquilo, alquil-S(O)_m-alquilo y

35 m representa un número de la serie 0, 1 y 2.

2. Compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1, en la que Het representa un resto de la serie





en la que la línea discontinua representa la unión con el átomo de carbono en el grupo N=C-A unido a Het,

G¹ representa N o C-A¹.

A¹ representa un resto de la serie hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₆ y haloalquilo C₁-C₄.

5 A² representa un resto de la serie hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₆ y haloalquilo C₁-C₄.

T representa oxígeno o un par de electrones.

R² representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ y dado el caso mono- a trisustituido con halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃ y monosustituido con cicloalquilo C₃-C₆ cicloalquilo C₃-C₆ sustituido.

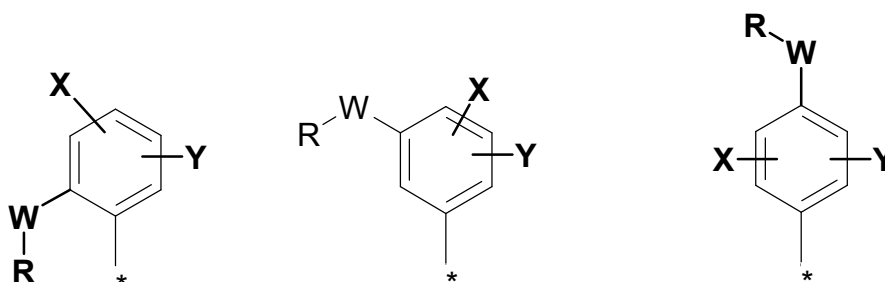
10 R¹ representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₂-C₆, ciano-alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₄, haloalqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, haloalquino C₂-C₄, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ dado el caso sustituido con halógeno, Bis(alcoxi C₁-C₆)-alquilo C₁-C₆ dado el caso sustituido con halógeno, C₁-C₆-alquilsulfanil-alquilo C₁-C₆ dado el caso sustituido con halógeno, alquilcarbonil C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ dado el caso sustituido con halógeno, alquilsulfinil C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ dado el caso sustituido con halógeno, alquilsulfonil C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ dado el caso sustituido con halógeno, di-(alquil C₁-C₆)-aminosulfanil-alquilo C₁-C₆, di-

15 alquilaminosulfinil (C₁-C₆)-alquilo C₁-C₆, di-(alquil C₁-C₆)-aminosulfonil-alquilo C₁-C₆, alcocixarbonilo C₁-C₆ dado el caso sustituido con halógeno, alcocixarbonil C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ dado el caso sustituido con halógeno, alquiloxi C₂-C₄ dado el caso sustituido con halógeno, alquiloxi C₂-C₄ dado el caso sustituido con halógeno, di-

20 (alquil C₁-C₆)-aminocarbonilo, N-alquilo C₁-C₆-N-cicloalquilaminocarbonilo C₃-C₆, di-(alquil C₁-C₆)-aminocarbonil-alquilo C₁-C₆, N-alquil C₁-C₆-N-cicloalquilaminocarbonil C₃-C₆-alquilo C₁-C₆, heterociclicarbonil-alquilo C₁-C₆, alquilsulfanilo C₁-C₆, haloalquilsulfanilo C₁-C₆, alquilsulfinilo C₁-C₆, haloalquilsulfinilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ dado el caso sustituido con halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alcocixarbonilo C₁-C₆, haloalcoxicarbonilo C₁-C₆ o hetarilo (que dado el caso también esta sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno), cicloalquilcarbonilo C₃-C₆ dado el caso sustituido con halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alcocixarbonilo C₁-C₆, haloalcoxicarbonilo C₁-C₆ o hetarilo (que dado el caso también esta sustituido con alquilo C₁-C₆ o halógeno),

25 heterociclicarbonil-alquilo C₁-C₆ dado el caso sustituido con halógeno, ciano (también en la parte alquilo C₁-C₆ de heterociclicarbonil-alquilo C₁-C₆), nitro, hidroxil, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ (que dado el caso está sustituido con halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆ y cicloalquilo C₃-C₆), alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, alquilsulfinilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquilsulfinilo C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, amino, alquilamino C₁-C₆, di-(alquil C₁-C₆)-amino, alquilcarbonilamino C₁-C₆, alcocixarbonilamino C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₆, alcocixarbonilo C₁-C₆ o aminocarbonilo, arilo dado el caso sustituido con halógeno, ciano, nitro, hidroxil, amino, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ (que dado el caso está sustituido con halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆ y cicloalquilo C₃-C₆), arilo sustituido con alcoxi C₁-C₆ o haloalcoxi C₁-C₆, aril-alquilo C₁-C₆ dado el caso sustituido con halógeno, ciano (también en la parte alquilo C₁-C₆ de aril-alquilo C₁-C₆), nitro, hidroxil, amino, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ (que dado el caso está sustituido con halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆ y cicloalquilo C₃-C₆), alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, alquilsulfinilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquilsulfinilo C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, amino, alquilamino C₁-C₆, di-(alquil C₁-C₆)-amino, alquilcarbonilamino C₁-C₆, alquilaminocarbonilo C₁-C₆, di-(alquil C₁-C₆)-aminocarbonilo, alcocixarbonilamino C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₆, alcocixarbonilo C₁-C₆ o aminocarbonilo, hetaril-alquilo C₁-C₆ dado el caso sustituido con halógeno, ciano (también en la parte alquilo C₁-C₆ von hetaril-alquilo C₁-C₆), nitro, hidroxil, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ (que dado el caso está sustituido con halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆ y cicloalquilo C₃-C₆), alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, alquilsulfinilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquilsulfinilo C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, amino, alquilamino C₁-C₆, di-(alquil C₁-C₆)-amino, alquilcarbonilamino C₁-C₆, alcocixarbonilamino C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₆, alcocixarbonilo C₁-C₆ o aminocarbonilo.

55 R¹ también representa un resto de la serie



en el que la unión con el átomo de nitrógeno en el grupo C(=V)-N-Q en la fórmula (I) está marcada con el asterisco (*).

5 R representa NR⁷R⁸ o representa alquilo C₁-C₆, alqueno C₃-C₆, alquino C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₆-S(O)_m-alquilo C₁-C₄, cada uno dado el caso sustituido con halógeno, oxígeno (produce C=O) o ciano, representa R⁷-CO-alquilo C₁-C₄, representa NR⁷R⁸-CO-alquilo C₁-C₄, representa cicloalquilo C₃-C₈ mono- o disustituido dado el caso con oxígeno (produce C=O), alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₈, alcoxi C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄, representa cicloalqueno C₃-C₈ mono- o disustituido dado el caso con oxígeno (produce C=O), alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄, representa cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄ mono- o disustituido dado el caso con oxígeno (produce C=O), alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄, representa cicloalqueno C₃-C₆-alquilo C₁-C₄ mono- o disustituido dado el caso con oxígeno (produce C=O), alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄, representa heterociclilo mono- o disustituido dado el caso con oxígeno (produce C=O), alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄, representa heterociclil-alquilo C₁-C₄ mono- o disustituido dado el caso con oxígeno (produce C=O), alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄ o representa fenilo dado el caso mono- a trisustituido con halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄, fenil-alquilo C₁-C₄, hetarilo y hetaril-alquilo C₁-C₄.

W representa un resto de la serie O, S, SO y SO₂.

20 X representa un resto de la serie hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ y haloalcoxi C₁-C₆.

Y representa un resto de la serie hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, ciano y NR⁵R⁶.

A representa azufre.

Q representa nitrógeno o C-R³.

25 R³ representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, OH, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, SH, alquilsulfanilo C₁-C₆, alquilsulfino C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, NH₂, alquilamino C₁-C₆ y di-(alquil C₁-C₆)-amino.

V representa un resto de la serie oxígeno, azufre y NR⁴.

30 R⁴ representa un resto de la serie hidrógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₂-C₆ y cicloalquilo C₃-C₆.

R⁵ representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ y haloalquilo C₂-C₆.

R⁶ representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ y haloalquilo C₂-C₆.

35 R⁵ y R⁶ también junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, pueden representar un anillo de 3 a 6 miembros saturado o insaturado hasta tres veces dado el caso sustituido con halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄.

40 R⁷ representa un resto de la serie hidrógeno, hidroxilo, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₆-S(O)_m-alquilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalqueno C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₃, cicloalqueno C₃-C₆-alquilo C₁-C₃, heterociclilo, heterociclil-alquilo C₁-C₃ en cada caso mono- o polisustituidos dado el caso con halógeno o mono- o disustituido con ciano y fenilo, fenil-alquilo C₁-C₃, hetarilo y hetaril-alquilo C₁-C₃ en cada caso mono- a tetrasustituidos dado el caso con alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halógeno o ciano.

R⁸ representa hidrógeno, un ión de metal alcalino o alcalinotérreo o representa un ión amonio mono- a tetrasustituido dado el caso con alquilo C₁-C₄ o representa un resto de la serie alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ y alquil C₁-C₄-S(O)_m-alquilo C₁-C₄ en cada caso mono- o polisustituido dado el caso con halógeno o mono o disustituido con ciano.

45 m representa un número de la serie 0, 1 y 2, y en donde

el ión alcalino se selecciona de la serie litio, sodio, potasio, rubidio, cesio,

el ión alcalinotérreo se selecciona de la serie berilio, magnesio, calcio, estroncio, bario,

halógeno se selecciona de la serie flúor, cloro, bromo y yodo,

50 arilo (también como parte de una unidad más grande, como por ejemplo arilalquilo) se selecciona de la serie fenilo, naftilo, antrilo, fenantrenilo,

hetarilo (del mismo significado que heteroarilo, también como parte de una unidad más grande, como por ejemplo hetarilalquilo) se selecciona de la serie furilo, tienilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo,

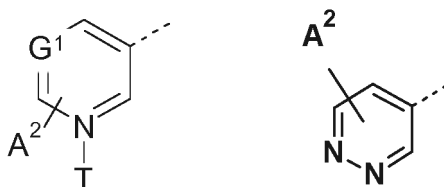
oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 1,2,3-oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5-

oxadiazolilo, 1,2,3-tiadiazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridacinilo,

55 piracinilo, 1,2,3-triacinilo, 1,2,4-triacinilo, 1,3,5-triacinilo, benzofurilo, benzisofurilo, benzotienilo, benzisotienilo,

indolilo, isoindolilo, indazolilo, benzotiazolilo, benzisotiazolilo, benzoxazolilo, benzisoxazolilo, bencimidazolilo, 2,1,3-benzoxadiazol, quinolinilo, isoquinolinilo, cinolinilo, ftalacinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, naftiridinilo, benzotriacinilo, purinilo, fteridinilo e indolicinilo y heterociclilo es un anillo de 4, 5 o 6 miembros saturado que contiene 1 o 2 átomos de nitrógeno y/o un átomo de oxígeno y/o un átomo de azufre.

3. Compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1 en los que Het representa un resto de la serie



en el que la línea discontinua representa la unión con el átomo de carbono en el grupo N=C-A unido a Het,

G¹ representa N o C-A¹.

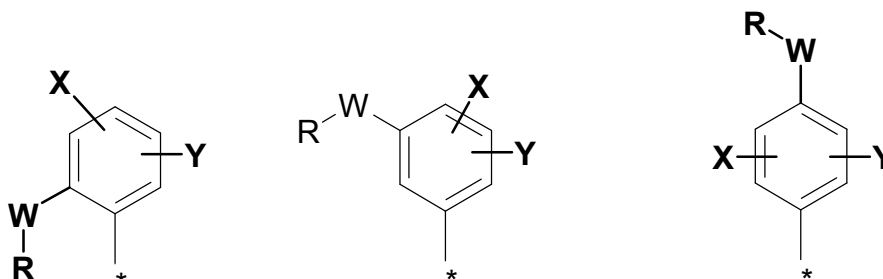
A¹ representa un resto de la serie hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄.

A² representa un resto de la serie hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄.

T representa oxígeno o un par de electrones.

R¹ representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₂-C₄, ciano-alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, haloalqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, haloalquino C₂-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₂-alquilo C₁-C₄ dado el caso sustituido con halógeno, Bis(alcoxi C₁-C₂)-alquilo C₁-C₄ dado el caso sustituido con halógeno, alquilsulfanil C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ dado el caso sustituido con halógeno, alquilcarbonil C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ dado el caso sustituido con halógeno, alquilsulfonil C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ dado el caso sustituido con halógeno, alquilsulfonil C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ dado el caso sustituido con halógeno, di-(alquil C₁-C₄)-aminosulfanil-alquilo C₁-C₄, di-(alquil C₁-C₄)-aminosulfonil-alquilo C₁-C₄, di-(alquil C₁-C₄)-aminosulfonil-alquilo C₁-C₄, alcoxycarbonil C₁-C₄ dado el caso sustituido con halógeno, alcoxycarbonil C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ dado el caso sustituido con halógeno, alquinoxil C₂-C₄ dado el caso sustituido con halógeno, alquinoxil C₂-C₄ dado el caso sustituido con halógeno, di-(alquil C₁-C₄)-aminocarbonil, N-alquil C₁-C₄-N-cicloalquilaminocarbonil C₃-C₆, di-(alquil C₁-C₄)-aminocarbonil-alquilo C₁-C₄, N-alquil C₁-C₄-N-cicloalquilaminocarbonil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, heterociclicarbonil-alquilo C₁-C₄, alquilsulfanilo C₁-C₄, haloalquilsulfanilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ dado el caso sustituido con halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alcoxycarbonil C₁-C₄, haloalcoxycarbonil C₁-C₄ o piridilo (que dado el caso también está sustituido con alquilo C₁-C₄ o halógeno), cicloalquilcarbonil C₃-C₆ dado el caso sustituido con halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alcoxycarbonil C₁-C₄, haloalcoxycarbonil C₁-C₄ o piridilo (que dado el caso también está sustituido con alquilo C₁-C₄ o halógeno), cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄ dado el caso sustituido con halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alcoxycarbonil C₁-C₄, haloalcoxycarbonil C₁-C₄, piridilo, pirimidilo, pirazano, piridacilino, tiazolilo, isotiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, oxadiazolilo, pirazolilo, triacilino o triazolilo (estando los hetarilos mencionados también dado el caso sustituidos con alquilo C₁-C₄ o halógeno), heterociclicil-alquilo C₁-C₄ dado el caso sustituido con halógeno, ciano (también en la parte alquilo C₁-C₄ de heterociclicil-alquil C₁-C₄), nitro, hidroxilo, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ (que dado el caso está sustituido con halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄ y cicloalquilo C₃-C₆), alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, amino, alquilamino C₁-C₄, di-(alquil C₁-C₄)-amino, alquilcarbonilamino C₁-C₄, alcoxycarbonilamino C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, alquilcarbonil C₁-C₄, alcoxycarbonil C₁-C₄ o aminocarbonil, arilo dado el caso sustituido con halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, amino, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ (que dado el caso está sustituido con halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄ y cicloalquilo C₃-C₆), alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄, aril-alquilo C₁-C₄ dado el caso sustituido con halógeno, ciano (también en la parte alquilo C₁-C₄ de aril-alquil C₁-C₄), nitro, hidroxilo, amino, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ (que dado el caso está sustituido con halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄ y cicloalquilo C₃-C₆), alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄, hetarilo dado el caso sustituido con halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ (que dado el caso está sustituido con halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄ y cicloalquilo C₃-C₆), alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, amino, alquilamino C₁-C₄, di-(alquil C₁-C₄)-amino, alquilcarbonilamino C₁-C₄, alquilaminocarbonil C₁-C₄, di-(alquil C₁-C₄)-aminocarbonil, alcoxycarbonilamino C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, alquilcarbonil C₁-C₄, alcoxycarbonil C₁-C₄ o aminocarbonil, hetaril-alquilo C₁-C₄ dado el caso sustituido con halógeno, ciano (también en la parte alquilo C₁-C₄ de hetaril-alquil C₁-C₄), nitro, hidroxilo, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ (que dado el caso está sustituido con halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄ y cicloalquilo C₃-C₆), alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, amino, alquilamino C₁-C₄, di-(alquil C₁-C₄)-amino, alquilcarbonilamino C₁-C₄,

alcoxicarbonilamino C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₁-C₄, alcoxicarbonilo C₁-C₄ o aminocarbonilo.
R¹ también representa un resto de la serie



5 en el que la unión con el átomo de nitrógeno en el grupo C(=V)-N-Q en la fórmula (I) está marcada con el asterisco (*).

R representa NR⁷R⁸ o representa alquilo C₁-C₆, alqueno C₃-C₆, alquino C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₃, alquil C₁-C₄-S(O)_m-alquilo C₁-C₃ en cada caso sustituidos una a siete veces con halógeno, mono o disustituidos con oxígeno (produce C=O) o mono- o disustituido con ciano, representa R⁷-CO-alquilo C₁-C₂, representa NR⁷R⁸-CO-alquilo C₁-C₂, representa cicloalquilo C₃-C₈, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄ mono- o disustituidos dado el caso con oxígeno (produce C=O), representa cicloalqueno C₃₋₈ mono- o disustituido dado el caso con oxígeno (produce C=O), alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄, representa cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄ mono- o disustituido dado el caso con oxígeno (produce C=O), alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄, representa cicloalqueno C₃-C₆-alquilo C₁-C₄ mono- o disustituido dado el caso con oxígeno (produce C=O), alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄, representa heterociclilo mono- o disustituido dado el caso con oxígeno (produce C=O), alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄, representa heterociclil-alquilo C₁-C₄ mono- o disustituido dado el caso con oxígeno (produce C=O), alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄ o representa fenilo, fenil-alquilo C₁-C₄, hetarilo y hetaril-alquilo C₁-C₄ dado el caso mono- a trisustituido con halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄.

W representa un resto de la serie S, SO y SO₂.

X representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄.

Y representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄.

A representa azufre.

Q representa nitrógeno o C-R³.

R³ representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, OH, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, SH, alquilsulfanilo C₁-C₄, alquilsulfino C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, NH₂, alquilamino C₁-C₄ y di-(alquil C₁-C₄)-amino.

V representa oxígeno.

R⁷ representa un resto de la serie hidrógeno, hidroxilo, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₄-S(O)_m-alquilo C₁-C₃, alquilcarbonilo C₁-C₄, alcoxicarbonilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₃, heterociclilo, heterociclil-alquilo C₁-C₃ en cada caso mono- o polisustituidos dado el caso con halógeno o mono- o disustituido con ciano, y fenilo, bencilo, piridilo, pirimidilo, tiazolilo, oxazolilo, pirazolilo, tienilo, furanilo, piridinilmetilo y tiazolilmetilo cada uno dado el caso mono- a trisustituidos con alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, ciclopropilo, flúor cloro, bromo o ciano.

R⁸ representa hidrógeno, representa un ión de metal alcalino o alcalinotérreo o representa un ión de amonio mono- a tetrasustituido dado el caso con alquilo C₁-C₄ o representa un resto de la serie alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₂ y alquil C₁-C₄-S(O)_m-alquilo C₁-C₂ en cada caso mono- o polisustituido dado el caso con halógeno o mono o disustituido con ciano.

m representa un número de la serie 0, 1 y 2 y en donde

el ión alcalino se selecciona de la serie litio, sodio, potasio, rubidio, cesio,

el ión alcalinotérreo se selecciona de la serie berilio, magnesio, calcio, estroncio, bario,

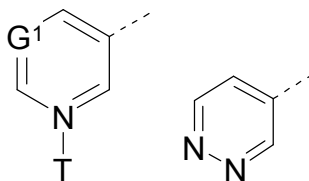
halógeno se selecciona de la serie flúor, cloro, bromo y yodo,

arilo (también como parte de una unidad más grande, como por ejemplo arilalquilo) se selecciona de la serie fenilo, naftilo, antrilo y fenantrenilo,

hetarilo (del mismo significado que heteroarilo, también como parte de una unidad más grande, como por ejemplo hetarilalquilo) se selecciona de la serie pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridacinilo, piracinilo, 1,2,3-triacinilo, 1,2,4-triacinilo, 1,3,5-triacinilo, benzotienilo y

heterociclilo se selecciona de la serie azetidino, azolidinilo, azinano, oxetano, oxolano, oxano, dioxano, tietano, tiolano, tiano, tetrahidrofurilo, piperacino, morfolinilo.

4. Compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1 en los que Het representa un resto de la serie



en el que la línea discontinua representa la unión con el átomo de carbono en el grupo N=C-A unido a Het,

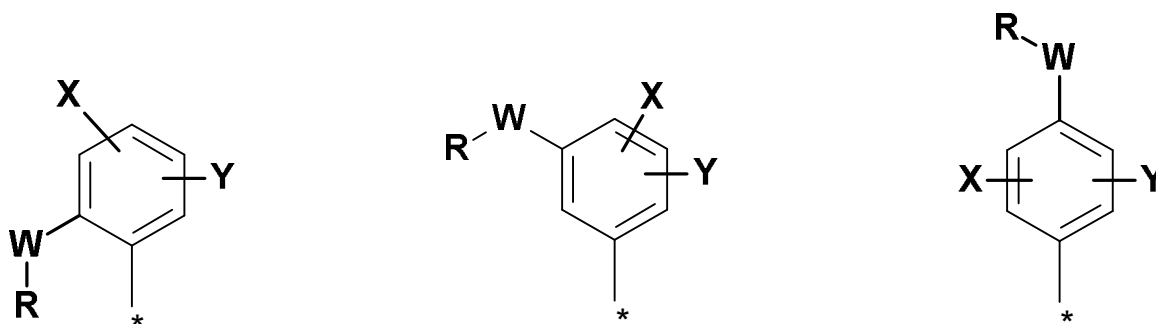
G¹ representa N o C-A¹,

A¹ representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro,

T representa hidrógeno o un par de electrones,

R¹ representa un resto de la serie metilo, etilo, isopropilo, n-propilo, n-butilo, iso-butilo, sec-butilo, *terc*-butilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2-difluoro-n-propilo, metilsulfanil-metilo, metilsulfaniletilo, metilsulfanil-n-propilo, trifluorometilsulfonilmetilo, etilsulfonilmetilo, 2,2,2-trifluoroetilsulfonilmetilo, 2,2-difluoroetilsulfonilmetilo, isopropilsulfanilmetilo, metilsulfonilmetilo, trifluorometilsulfonilmetilo, etilsulfonil-metilo, 2,2,2-trifluoroetilsulfonilmetilo, 2,2-difluoroetilsulfonilmetilo, isopropilsulfonilmetilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, metoxicarbonilmetilo, etoxicarboniletilo, metoxicarboniletilo, dimetilaminocarbonilo, dietilaminocarbonilo, *N*-etil-*N*-metilaminocarbonilo, *N*-isopropil-*N*-metilaminocarbonilo, dimetilaminocarbonil-metilo, dietilaminocarbonilmetilo, *N*-etil-*N*-metilaminocarbonilmetilo, *N*-isopropil-*N*-metilaminocarbonilmetilo, dimetilaminocarboniletilo, dietilaminocarboniletilo, *N*-etil-*N*-metilaminocarboniletilo, *N*-isopropil-*N*-metilaminocarboniletilo, *N*-ciclopropil-*N*-metilaminocarbonilmetilo, *N*-ciclopropil-*N*-metilaminocarboniletilo, metilsulfanilo, trifluorometilsulfanilo, etilsulfanilo, 2,2,2-trifluoroetilsulfanilo, 2,2-difluoroetilsulfanilo, isopropilsulfanilo, metilsulfonilo, trifluorometilsulfonilo, etilsulfonilo, 2,2,2-trifluoroetilsulfonilo, 2,2-difluoroetilsulfonilo, isopropilsulfonilo, ciclopropilo, 1-cianociclopropilo, 1-clorociclopropilo, 1-fluorociclopropilo, 2-cianociclopropilo, 2-clorociclopropilo, 2-fluorociclopropilo, 2,2,3,3-tetrafluorciclopropilo, 2-ciclopropilciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, 4-trifluorometilciclohexilo, ciclopropilmetilo, ciclopropiletilo, ciclobutilmetilo *N*-ciclopropil-*N*-metilaminocarbonilo, morfolin-4-ilcarbonilmetilo, piperazin-1-ilcarbonilmetilo, 4-metil-piperazin-1-ilcarbonilmetilo, heterocicilmetilo y heterocicilmetilo cada uno mono-, di- o trisustituidos dado el caso de manera igual o diferente con flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, hidroxilo, amino, metilo, etilo, isopropilo, *terc*-butilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, trifluorometoxi, difluorometoxi, y heterocicilmetilo y heterocicilmetilo sustituidos cada uno con ciclopropilo, estando el resto ciclopropilo mono- o disustituido dado el caso con metilo, flúor, cloro, ciano o monosustituido con ciclopropilo, estando el resto ciclopropilo mono- o disustituido de manera igual o diferente con flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, hidroxilo, amino, metilo, etilo, isopropilo, *terc*-butilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, trifluorometoxi, difluorometoxi, arilmetilo y ariletilo cada uno mono-, di- o trisustituidos dado el caso de manera igual o diferente con flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, hidroxilo, amino, metilo, etilo, isopropilo, *terc*-butilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, trifluorometoxi, difluorometoxi, arilmetilo y ariletilo sustituidos cada uno con ciclopropilo, estando el resto ciclopropilo mono- o disustituido dado el caso con metilo, flúor, cloro, ciano o monosustituido con ciclopropilo, arilmetilo y ariletilo cada uno mono-, di- o trisustituidos dado el caso de manera igual o diferente con flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, hidroxilo, amino, metilo, etilo, isopropilo, *terc*-butilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, trifluorometoxi, difluorometoxi, y hetarilmetilo y hetariletilo sustituidos cada uno con ciclopropilo, estando el resto ciclopropilo mono- o disustituido dado el caso con metilo, flúor, cloro, ciano o monosustituido con ciclopropilo.

R¹ también representa el resto de la fórmula



en el que la unión con el átomo de nitrógeno en el grupo C(=V)-N-Q en la fórmula (I) está marcada con el asterisco (*).

5 R representa NR⁷R⁸ o representa un resto de la serie alquilo C₁-C₄, alquenilo C₃-C₄, alquinilo C₃-C₄, alcoxi C₁-C₂-alquilo C₁-C₂ y alquil C₁-C₂-S(O)_m-alquilo C₁-C₂ cada uno sustituidos dado el caso una, dos, tres, cuatro o cinco veces con flúor, cloro o mono o disustituido con ciano, representa R⁷-CO-alquilo C₁-C₂, representa NR⁷R⁸-CO-alquilo C₁-C₂, representa cicloalquilo C₃-C₆ mono- o disustituido dado el caso con alquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂ o haloalquilo C₁-C₂ o con un átomo de oxígeno (produce C=O), representa cicloalquenilo C₃-C₆ mono- o disustituido dado el caso con alquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂ o haloalquilo C₁-C₂ o con un átomo de oxígeno (produce C=O),

10 representa cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₂ mono- a disustituido dado el caso con alquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂ o haloalquilo C₁-C₂, representa cicloalquenil C₃-C₆-alquilo C₁-C₂ mono- o disustituido dado el caso con alquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂ o haloalquilo C₁-C₂, representa heterociclilo mono- o disustituido dado el caso con alquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂ o haloalquilo C₁-C₂, representa heterocicliil-alquilo C₁-C₂ mono- o disustituido dado el caso con alquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂ o haloalquilo C₁-C₂ o representa fenilo, bencilo, piridilo, pirimidilo, tiazolilo, oxazolilo, pirazolilo, tienilo, furanilo, piridinilmetilo o tiazolilmetilo cada uno mono- o disustituido dado el caso con flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi o trifluorometoxi.

W representa un resto de la serie S, SO y SO₂.

15 X representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi y trifluorometoxi.

20 Y representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi y trifluorometoxi.

A representa azufre.

Q representa nitrógeno o C-R³.

25 R³ representa hidrógeno.

V representa oxígeno.

30 R⁷ representa un resto de la serie hidrógeno, hidroxilo, representa fenilo, bencilo, piridilo, pirimidilo, tiazolilo, oxazolilo, pirazolilo, tienilo, furanilo, piridinilmetilo y tiazolilmetilo cada uno sustituidos dado el caso una, dos, tres, cuatro o cinco veces con flúor, cloro o mono- o disustituido con ciano alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₄-S(O)_m-alquilo C₁-C₂, alquilcarbonilo C₁-C₄, alcoxycarbonilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₃, heterociclilo y heterocicliil-alquilo C₁-C₃ y cada uno dado el caso mono- a trisustituido con alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, ciclopropilo, flúor, cloro, bromo o ciano.

35 R⁸ representa hidrógeno, un ión alcalino o alcalinotérreo, representa un ión amonio mono- a tetrasustituido dado el caso con alquilo C₁-C₄ o representa un resto de la serie alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₂ y alquil C₁-C₄-S(O)_m-alquilo C₁-C₂ cada uno sustituido dado el caso una, dos, tres, cuatro o cinco veces con flúor, cloro o mono o disustituido con ciano.

m representa un número de la serie 0, 1 y 2, y en donde

un ión alcalino representa un ión de la serie litio, sodio, potasio, rubidio, cesio,

el ión alcalinotérreo representa un ión de la serie berilio, magnesio, calcio, estroncio y bario,

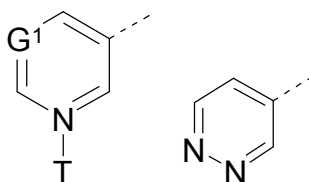
halógeno representa flúor, cloro, bromo y yodo,

40 heterociclilo representa un resto de la serie oxetanilo, tietanilo, tetrahidrofurilo y morfolinilo,

arilo representa fenilo y

hetarilo (del mismo significado que heteroarilo, también como parte de una unidad más grande, como por ejemplo hetarilalquilo) representa un resto de la serie piridilo, pirimidilo, piracínilo, piridacínilo, tiazolilo, pirazolilo y benzotienilo.

45 5. Compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1 en los que Het representa un resto de la serie



en el que la línea discontinua representa la unión con el átomo de carbono en el grupo N=C-A unido a Het,

G¹ representa N o C-A¹,

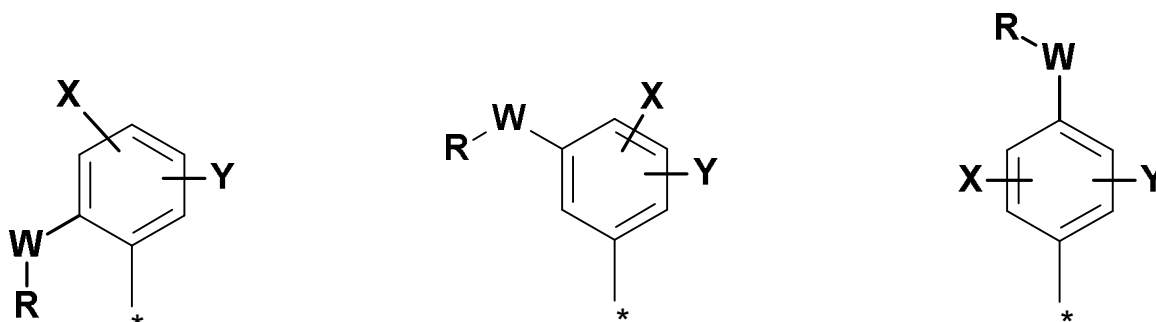
A¹ representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro,

5 T representa oxígeno o un par de electrones,

R¹ representa un resto de la serie metilo, etilo, isopropilo, n-propilo, n-butilo, iso-butilo, sec-butilo, *terc*-butilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2-difluoro-n-propilo, metilsulfanil-metilo, metilsulfaniletilo, metilsulfanil-n-propilo, trifluorometilsulfonilmetilo, etilsulfonilmetilo, 2,2,2-trifluoroetilsulfonilmetilo, 2,2-difluoroetilsulfonilmetilo, isopropilsulfanilmetilo, metilsulfonilmetilo, trifluorometilsulfonilmetilo, etilsulfonil-metilo, 2,2,2-trifluoroetilsulfonilmetilo, 2,2-difluoroetilsulfonilmetilo, isopropilsulfonil-metilo, metilsulfonilmetilo, trifluorometilsulfonilmetilo, etilsulfonilmetilo, 2,2,2-trifluoroetilsulfonilmetilo, 2,2-difluoroetilsulfonilmetilo, isopropilsulfonilmetilo, metoxycarbonilo, etoxycarbonilo, metoxycarbonilmetilo, etoxycarbonilmetilo, metoxycarboniletilo, etoxycarboniletilo, dimetilaminocarbonilo, dietilaminocarbonilo, *N*-etil-*N*-metilaminocarbonilo, *N*-isopropil-*N*-metilaminocarbonilo, dimetilaminocarbonil-metilo, dietilaminocarbonilmetilo, *N*-etil-*N*-metilaminocarbonilmetilo, *N*-isopropil-*N*-metilaminocarbonilmetilo, dimetilaminocarboniletilo, dietilaminocarboniletilo, *N*-etil-*N*-metilaminocarboniletilo, *N*-isopropil-*N*-metilaminocarboniletilo, *N*-ciclopropil-*N*-metilaminocarbonilmetilo, *N*-ciclopropil-*N*-metilaminocarboniletilo, metilsulfanilo, trifluorometilsulfanilo, etilsulfanilo, 2,2,2-trifluoroetilsulfanilo, 2,2-difluoroetilsulfanilo, isopropilsulfanilo, metilsulfonilo, trifluorometilsulfonilo, etilsulfonilo, 2,2,2-trifluoroetilsulfonilo, 2,2-difluoroetilsulfonilo, isopropilsulfonilo, metilsulfonilo, trifluorometilsulfonilo, etilsulfonilo, 2,2,2-trifluoroetilsulfonilo, 2,2-difluoroetilsulfonilo, isopropilsulfonilo, ciclopropilo, 1-cianociclopropilo, 1-clorociclopropilo, 1-fluorociclopropilo, 2-cianociclopropilo, 2-clorociclopropilo, 2-fluorociclopropilo, 2,2,3,3-tetrafluorociclopropilo, 2-ciclopropilciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, 4-trifluorometilciclohexilo, ciclopropilmetilo, ciclopropiletilo, ciclobutilmetilo *N*-ciclopropil-*N*-metilaminocarbonilo, morfolin-4-ilcarbonilmetilo, piperazin-1-ilcarbonilmetilo, 4-metil-piperazin-1-ilcarbonilmetilo,

heterociclietilo y heterociclietilo cada uno mono-, di- o trisustituidos dado el caso de manera igual o diferente con flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, hidroxilo, amino, metilo, etilo, isopropilo, *terc*-butilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, trifluorometoxi, difluorometoxi, y heterociclietilo y heterociclietilo sustituidos cada uno con ciclopropilo, estando el resto ciclopropilo mono- o disustituido dado el caso con metilo, flúor, cloro, ciano o monosustituido con ciclopropilo, dado el caso mono- o disustituidos de manera igual o diferente con flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, hidroxilo, amino, metilo, etilo, isopropilo, *terc*-butilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, trifluorometoxi, difluorometoxi, hetaarilo sustituido con dimetilaminocarbonilo, hetaarilo sustituido con ciclopropilo, estando el resto ciclopropilo mono- o disustituido dado el caso con metilo, flúor, cloro, ciano o monosustituido con ciclopropilo, arilo dado el caso mono-, di- o trisustituido, de manera igual o diferente con flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, hidroxilo, amino, metilo, etilo, isopropilo, *terc*-butilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, trifluorometoxi, difluorometoxi, trifluoroetoxi, arilo sustituido con ciclopropilo, estando el resto ciclopropilo mono- o disustituido dado el caso con metilo, flúor, cloro, ciano o monosustituido con ciclopropilo, y arilmetilo y ariletilo cada uno mono-, di- o trisustituidos dado el caso de manera igual o diferente con flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, hidroxilo, amino, metilo, etilo, isopropilo, *terc*-butilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, trifluorometoxi, difluorometoxi, y arilmetilo y ariletilo sustituidos cada uno con ciclopropilo, estando el resto ciclopropilo mono- o disustituido dado el caso con metilo, flúor, cloro, ciano o monosustituido con ciclopropilo, y hetaarilmetilo y hetaariletilo dado el caso mono o disustituidos en cada caso de manera igual o diferente con flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, hidroxilo, amino, metilo, etilo, isopropilo, *terc*-butilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, trifluorometoxi, difluorometoxi, y hetaarilmetilo y hetaariletilo sustituidos cada uno con ciclopropilo, estando el resto ciclopropilo mono- o disustituido dado el caso con metilo, flúor, cloro, ciano o monosustituido con ciclopropilo.

45 R¹ también representa el resto de la fórmula



en el que la unión con el átomo de nitrógeno en el grupo C(=V)-N-Q en la fórmula (I) está marcada con el asterisco (*).

5 R representa metilo, etilo, propilo, iso-propilo, n-butilo, iso-butilo, sec-butilo, terc-butilo, alilo, 2-butenilo, propargilo, 2-butenilo cada uno mono-, di- o trisustituidos dado el caso con flúor o monosustituidos con ciano, representa cicloalquilo C₃-C₆ dado el caso monosustituido con metilo, etilo, metoxi, etoxi o trifluorometilo, representa cicloalquilmetilo C₃-C₆ dado el caso monosustituido con metilo, etilo, metoxi o trifluorometilo o representa fenilo, bencilo, piridilo, pirimidilo, tiazolilo y piridinilmetilo cada uno mono- o disustituido dado el caso con flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo, iso-propilo, terc-butilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi o trifluorometoxi.

10 W representa un resto de la serie S, SO y SO₂.

X representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi y trifluorometoxi.

15 Y representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi y trifluorometoxi.

A representa azufre.

Q representa nitrógeno o C-R³.

R³ representa hidrógeno o metilo.

V representa oxígeno, y en donde

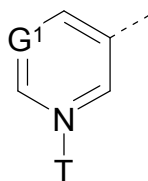
20 el ión alcalino representa un ión de la serie litio, sodio, potasio, rubidio, cesio, el ión alcalinotérreo representa un ión de la serie berilio, magnesio, calcio, estroncio y bario, halógeno representa flúor, cloro, bromo y yodo,

heterocidilo representa un resto de la serie oxetanilo, tietanilo, tetrahidrofurilo y morfolinilo,

arilo representa fenilo y

25 hetarilo (del mismo significado que heteroarilo, también como parte de una unidad más grande, como por ejemplo hetarilalquilo) representa un resto de la serie piridilo, pirimidilo, piracnilo, piridacnilo, tiazolilo, pirazolilo y benzotienilo.

6. Compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1, en la que Het representa



30

en el que la línea discontinua representa la unión con el átomo de carbono en el grupo N=C-A unido a Het,

G¹ representa C-A¹,

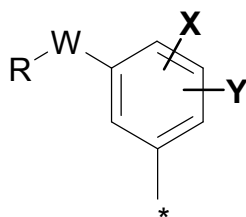
A¹ representa hidrógeno,

T representa hidrógeno o un par de electrones,

35 R¹ representa metilo, isopropilo, n-propilo, n-butilo, iso-butilo, sec-butilo, terc-butilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2-difluoro-n-propilo, dimetilaminocarbonilo, dietilaminocarbonilo, N-etil-N-metilaminocarbonilo, N-isopropil-N-metilaminocarbonilo, dimetilaminocarbonilmetilo, dietilaminocarbonilmetilo, N-etil-N-metilaminocarbonilmetilo, N-isopropil-N-metilaminocarbonilmetilo, dimetilaminocarboniletilo,

40 dietilaminocarboniletilo, N-etil-N-metilaminocarboniletilo, N-isopropil-N-metilaminocarboniletilo, N-ciclopropil-N-metilaminocarbonilmetilo, N-ciclopropil-N-metilaminocarboniletilo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, y hetarilmetilo y hetariletilo dado el caso mono o disustituidos en cada caso de manera igual o diferente con flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, hidroxilo, amino, metilo, etilo, isopropilo, terc-butilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, trifluorometoxi, difluorometoxi,

R¹ también representa



en el que la unión con el átomo de nitrógeno en el grupo C(=V)-N-Q en la fórmula (I) está marcada con el asterisco (*).

R representa alquilo C₁-C₄ dado el caso mono- a trisustituido con flúor o cloro,

W representa un resto de la serie S y SO,

X representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, difluorometilo y trifluorometilo,

Y representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo y etilo,

A representa azufre,

Q representa nitrógeno o C-R³,

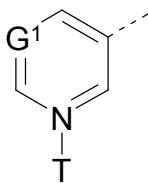
R³ representa hidrógeno,

V representa oxígeno y en donde

halógeno representa flúor, cloro, bromo y yodo y

hetarilo representa un resto de la serie piridilo, pirimidinilo, tiazolilo, pirazolilo y benzotienilo.

7. Compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1 en los que Het representa



en el que la línea discontinua representa la unión con el átomo de carbono en el grupo N=C-A unido a Het,

G¹ representa C-A¹ o N,

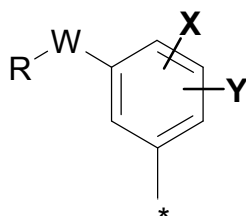
A¹ representa hidrógeno o flúor,

T representa oxígeno o un par de electrones,

R¹ representa metilo, etilo, isopropilo, n-propilo, n-butilo, iso-butilo, sec-butilo, *terc*-butilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2-difluoro-n-propilo, dimetilaminocarbonilo, dietilaminocarbonilo, *N*-etil-*N*-metilaminocarbonilo, *N*-isopropil-*N*-metilaminocarbonilo, dimetilaminocarbonilmetilo, dietilaminocarbonilmetilo, *N*-etil-*N*-metilaminocarbonilmetilo, *N*-isopropil-*N*-metilaminocarbonilmetilo, dimetilaminocarboniletilo, dietilaminocarboniletilo, *N*-etil-*N*-metilaminocarboniletilo, *N*-isopropil-*N*-metilaminocarboniletilo, *N*-ciclopropil-*N*-metilaminocarbonilmetilo, *N*-ciclopropil-*N*-metilaminocarboniletilo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopropilmetilo, benzotienilo sustituido dado el caso con dimetilaminocarbonilo, fenilo sustituido dado el caso con

halógeno, metilo o trifluoroetoxi, fenilmetilo sustituido dado el caso con metilo, metoxi, difluorometoxi o halógeno, y hetarilmetilo y hetariletilo dado el caso mono o disustituidos en cada caso de manera igual o diferente con flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, hidroxilo, amino, metilo, etilo, isopropilo, *terc*-butilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoxi, trifluorometoxi, difluorometoxi,

R¹ también representa



en el que la unión con el átomo de nitrógeno en el grupo C(=V)-N-Q en la fórmula (I) está marcada con el asterisco (*),

R representa alquilo C₁-C₄ dado el caso mono- a trisustituido con flúor o cloro,

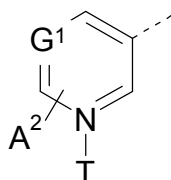
W representa un resto de la serie S, SO y SO₂,

X representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, difluorometilo y trifluorometilo,

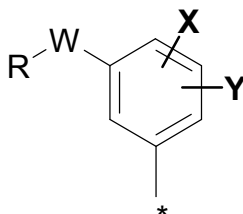
Y representa un resto de la serie hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo y etilo,

A representa azufre,
 Q representa nitrógeno o C-R³,
 R³ representa hidrógeno o metilo,
 V representa oxígeno y en donde
 halógeno representa flúor, cloro, bromo y yodo y
 hetarilo representa un resto de la serie piridilo, pirimidinilo, tiazolilo, pirazolilo y benzotienilo.

- 5 8. Compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 3 en los que Het representa el resto de la fórmula

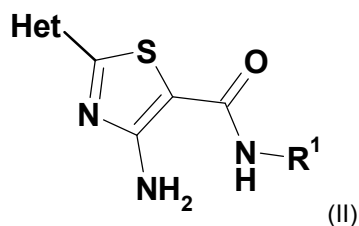


- 10 9. Compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 8 en los que T representa un par de electrones.
 10. Compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 7 en los que Het representa piridin-3-ilo.
 11. Compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 7 en los que Het representa 5-fluoro-piridin-3-ilo.
 12. Compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 5 en los que R¹ representa el resto



- 15 13. Agentes, caracterizados por un contenido de al menos un compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 12 y diluyentes y/o sustancias tensioactivas usuales.
 14. Uso no terapéutico de compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con una de las reivindicaciones 1 a 12 o de agentes de acuerdo con la reivindicación 13 para combatir parásitos.

- 20 15. Compuestos de la fórmula (II)



en los que Het y R¹ tienen los significados indicados en la reivindicación 1.