

(19)



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS
ESPAÑA



(11) Número de publicación: **2 894 301**

(51) Int. Cl.:

C07D 401/04 (2006.01)
C07D 215/48 (2006.01)
C07D 213/74 (2006.01)
C07D 471/04 (2006.01)
C07D 413/04 (2006.01)
C07D 487/04 (2006.01)
C07D 491/056 (2006.01)
C07D 498/04 (2006.01)
C07D 519/00 (2006.01)
A61P 33/00 (2006.01)

(12)

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

(86) Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **21.10.2016 PCT/EP2016/075365**

(87) Fecha y número de publicación internacional: **04.05.2017 WO17072039**

(96) Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **21.10.2016 E 16784525 (4)**

(97) Fecha y número de publicación de la concesión europea: **01.09.2021 EP 3368521**

(54) Título: **Derivados de heterociclos bicíclicos condensados como pesticidas**

(30) Prioridad:

26.10.2015 EP 15191440

(45) Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:
14.02.2022

(73) Titular/es:

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

(72) Inventor/es:

FISCHER, RÜDIGER;
HAGER, DOMINIK;
HOFFMEISTER, LAURA;
KAUSCH-BUSIES, NINA;
WILCKE, DAVID;
WILLOT, MATTHIEU;
GÖRGENS, ULRICH;
ILG, KERSTIN;
MOSRIN, MARC;
PORTZ, DANIELA y
TURBERG, ANDREAS

(74) Agente/Representante:

GONZÁLEZ PECES, Gustavo Adolfo

ES 2 894 301 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

Derivados de heterociclos bicíclicos condensados como pesticidas

La presente invención se refiere a nuevos derivados de heterociclos bicíclicos condensados de fórmula (I) o de fórmula (I'), a su uso como acaricidas y/o insecticidas para controlar plagas animales, particularmente artrópodos y especialmente insectos y arácnidos, y a procedimientos y productos intermedios para prepararlos.

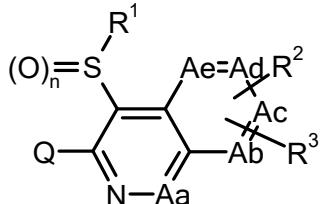
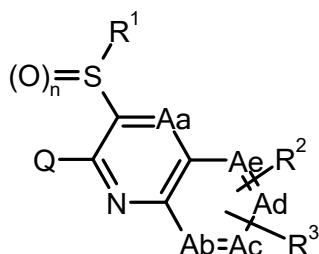
En la bibliografía ya se han descrito derivados de heterociclos bicíclicos condensados con propiedades insecticidas, por ejemplo, en los documentos WO 2010/125985, WO 2012/074135, WO 2012/086848, WO 2013/018928, WO 2013/191113, WO 2014/142292, WO 2014/148451, WO 2015/000715, EP 15153943.4, EP 15153948.3 y WO 2015/121136.

10 También se han descrito en la bibliografía derivados de heterociclos bicíclicos condensados con propiedades insecticidas, por ejemplo, en los documentos WO2016/091731, WO2016/039444, WO2015/198859, WO 2015/133603, WO 2015/198859, WO 2015/002211, WO 2015/071180, WO 2015/091945, WO 2016/005263, WO 2015/198817, WO 2016/041819, WO 2016/039441, WO 2016/026848, WO 2016/023954, WO 2016/020286 y WO 2016/046071.

15 Sin embargo, los principios activos ya conocidos de acuerdo con los documentos citados anteriormente tienen desventajas en la aplicación en un cierto grado, ya sea porque solamente tienen un intervalo de aplicación limitado o porque no tienen una acción insecticida o acaricida satisfactoria.

20 Recientemente, se han descubierto derivados de heterociclos bicíclicos condensados novedosos que tienen ventajas sobre los compuestos ya conocidos, entre las que por ejemplo cabe mencionar, a modo de ejemplo, mejores propiedades biológicas o ambientales, un intervalo de procedimientos de aplicación más amplio, una acción insecticida o acaricida mejor y una buena compatibilidad con las plantas útiles. Los derivados de heterociclos bicíclicos condensados pueden usarse en combinación con agentes adicionales para mejorar la efectividad, especialmente contra insectos que son difíciles de controlar.

Son objeto de la presente invención, por lo tanto, nuevos compuestos de fórmula (I) o (I')



25

(I)

(I')

en los que (configuración 1)

- Aa es nitrógeno o $=C(R^7)-$,
- Ab es nitrógeno o $=C(H)-$,
- Ac es nitrógeno o $=C(H)-$,
- 30 Ad es nitrógeno o $=C(H)-$,
- Ae es nitrógeno o $=C(H)-$,

donde Ab, Ac, Ad y Ae no pueden ser todos nitrógeno,

35 R¹ es alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), cianoalquilo (C₁-C₆), hidroxialquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆)-alquilo-(C₁-C₆), alquenilo (C₂-C₆), alqueniloxi (C₂-C₆)-alquilo (C₁-C₆), haloalqueniloxi (C₂-C₆)-alquilo (C₁-C₆), haloalquenilo (C₂-C₆), cianoalquenilo (C₂-C₆), alquinilo (C₂-C₆), alquiniloxi (C₂-C₆)-alquilo (C₁-C₆), haloalquiniloxi (C₂-C₆)-alquilo (C₁-C₆), haloalquinilo (C₂-C₆), cianoalquinilo (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₈), cicloalquil (C₃-C₈)-cicloalquilo (C₃-C₈), alquil (C₁-C₆)-cicloalquilo (C₃-C₈), halocicloalquilo (C₃-C₈), amino, alquilamino (C₁-C₆), dialquilamino (C₁-C₆), cicloalquilamino (C₃-C₈), alquilcarbonilamino (C₁-C₆), alquitio (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), haloalquitio (C₁-C₆)-(C₁-C₆)-alquilo, alquilsulfonil (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), haloalquilsulfonil (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquilsulfonil (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquilsulfonil (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquitio (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilsulfonil (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilsulfonil (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilsulfonil (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alcoxicarbonil (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), haloalquicarbonil (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alcoxicarbonil (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), haloalcoxicarbonil (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆),

alquilsulfonilamino (C_1 - C_6), aminosulfonilalquilo (C_1 - C_6), alquilaminosulfonil (C_1 - C_6)-alquilo (C_1 - C_6), dialquilaminosulfonil (C_1 - C_6)-alquilo (C_1 - C_6),

o alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), alquenilo (C₂-C₆), alquinilo (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₈), cada uno opcionalmente mono- o polisustituido de manera idéntica o diferente con arilo, hetarilo o heterociclico, donde arilo, hetarilo o heterociclico puede estar cada uno opcionalmente mono- o polisustituido de manera idéntica o diferente con halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, amino, carboxilo, carbamoilo, aminosulfonilo, alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), alcoxi (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), alquiltio (C₁-C₆), alquilsulfinilo (C₁-C₆), alquilsulfonilo (C₁-C₆), alquilsulfimino (C₁-C₆), alquilsulfimino (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquilsulfimino (C₁-C₆)-alquilcarbonilo (C₂-C₆), alquilsulfoximino (C₁-C₆), alquilsulfoximino (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquilsulfoximino (C₁-C₆)-alquilcarbonilo (C₂-C₆), alcoxcarbonilo (C₁-C₆), alquilcarbonilo (C₁-C₆), trialquilsililo (C₃-C₆) o bencilo, o

R¹ es arilo, hetarilo o heterociclico, cada uno mono- o polisustituido de manera idéntica o diferente con halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, amino, carboxilo, carbamoilo, alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₈), alcoxi (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), alquiltio (C₁-C₆), alquilsulfinilo (C₁-C₆), alquilsulfonilo (C₁-C₆), alquilsulfimino (C₁-C₆), alquilsulfimino (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquilsulfimino (C₁-C₆)-alquilcarbonilo (C₂-C₆), alquilsulfoximino (C₁-C₆), alquilsulfoximino (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquilsulfoximino (C₁-C₆)-alquilcarbonilo (C₂-C₆), alcoxicarbonilo (C₁-C₆), alquilcarbonilo (C₁-C₆), trialquilsililo (C₃-C₆), (=O) (en el caso de heterociclico solamente) y (=O)2 (en el caso de heterociclico solamente),

R², R³ son independientemente hidrógeno, ciano, halógeno, nitro, acetilo, hidroxilo, amino, SCN, trialquilsililo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₈), cicloalquil (C₃-C₈)-cicloalquilo (C₃-C₈), alquil (C₁-C₆)-cicloalquilo (C₃-C₆), halocicloalquilo (C₃-C₈), alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), cianoalquilo (C₁-C₆), hidroxialquilo (C₁-C₆), hidroxicarbonilalcoxi (C₁-C₆), alcoxicarbonil (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquenilo (C₂-C₆), haloalquenilo (C₂-C₆), cianoalquenilo (C₂-C₆), alquinilo (C₂-C₆), haloalquinilo (C₂-C₆), cianoalquinilo (C₂-C₆), alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), cianoalcoxi (C₁-C₆), alcoxicarbonil (C₁-C₆)-alcoxi (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alcoxi (C₁-C₆), alquilhidroxiimino (C₁-C₆), alcoxiimino (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆)-alcoxiimino (C₁-C₆), haloalquil (C₁-C₆)-alcoxiimino (C₁-C₆), alquilitio (C₁-C₆), haloalquilitio (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilitio (C₁-C₆), alquilitio (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquilsulfinilo (C₁-C₆), haloalquilsulfinilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilsulfinilo (C₁-C₆), alquilsulfinil (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquilsulfonilo (C₁-C₆), haloalquilsulfonilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilsulfonilo (C₁-C₆), alquilsulfonil (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquilsulfoniloxi (C₁-C₆), alquilcarbonilo (C₁-C₆), alquilitiocarbonilo (C₁-C₆), haloalquilcarbonilo (C₁-C₆), alquilcarboniloxi (C₁-C₆), alcoxicarbonilo (C₁-C₆), haloalcoxicarbonilo (C₁-C₆), aminocarbonilo, alquilaminocarbonilo (C₁-C₆), alquilaminotiocarbonilo (C₁-C₆), dialquilaminocarbonilo (C₁-C₆), dialquilaminotiocarbonilo (C₁-C₆), alquenilaminocarbonilo (C₂-C₆), dialquenilaminocarbonilo (C₂-C₆), cicloalquilamino (C₃-C₈)-carbonilo, alquilsulfonilamino (C₁-C₆), alquilamino (C₁-C₆), dialquilamino (C₁-C₆), aminosulfonilo, alquilaminosulfonilo (C₁-C₆), dialquilaminosulfonilo (C₁-C₆), alquilsulfoximino (C₁-C₆), aminotiocarbonilo, alquilaminotiocarbonilo (C₁-C₆), di- alquilaminotiocarbonilo (C₁-C₆), cicloalquilamino (C₃-C₈) o NHCO-alquilo (C₁-C₆) ((alquilcarbonilamino (C₁-C₆)),

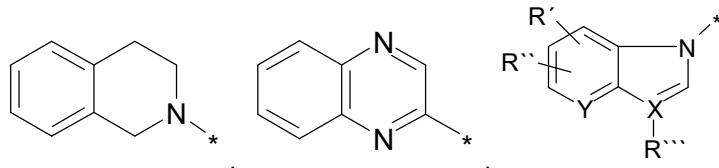
R⁷ es hidrógeno, ciano, halógeno, acetilo, hidroxilo, amino, cicloalquilo (C₃-C₈), halocicloalquilo (C₃-C₈), alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), cianoalquilo (C₁-C₆), alquenilo (C₂-C₆), haloalquenilo (C₂-C₆), alquinilo (C₂-C₆), haloalquinilo (C₂-C₆), alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), alquiltio (C₁-C₆), haloalquiltio (C₁-C₆), alquilsulfinilo (C₁-C₆), haloalquilsulfinilo (C₁-C₆), alquilsulfonilo (C₁-C₆) o haloalquilsulfonilo (C₁-C₆),

Q es un sistema de anillos bicílicos o tricílicos condensados de 8, 9, 10, 11 o 12 miembros heterocílicos o heteroaromáticos saturados o parcialmente saturados, donde al menos un grupo carbonilo puede estar presente opcionalmente y/o donde el sistema de anillos puede estar opcionalmente mono o polisustituido en forma idéntica o diferente, y donde los sustituyentes pueden seleccionarse independientemente entre sí de hidrógeno, ciano, halógeno, nitrógeno, acetilo, hidroxilo, amino, SCN, trialquilsililo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₈), cicloalquil (C₃-C₈)-cicloalquilo (C₃-C₈), alquil (C₁-C₆)-cicloalquilo (C₃-C₈), halocicloalquilo (C₃-C₈), alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), cianoalquilo (C₁-C₆), hidroxialquilo (C₁-C₆), hidroxicarbonil-alcoxi (C₁-C₆), alcoxicarbonil (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquenilo (C₂-C₆), haloalquenilo (C₂-C₆), cianoalquenilo (C₂-C₆), alquinilo (C₂-C₆), alquiniloxi (C₂-C₆)-alquilo (C₁-C₄), haloalquinilo (C₂-C₆), cianoalquinilo (C₂-C₆), alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alqueniloxi (C₂-C₆)-alquilo (C₁-C₆), haloalqueniloxi (C₂-C₆)-alquilo (C₁-C₆), cianoalcoxi (C₁-C₆), alcoxicarbonil (C₁-C₆)-alcoxi (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alcoxi (C₁-C₆), alquilihidroxiimino (C₁-C₆), alcoxiimino (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆)-alcoxiimino (C₁-C₆), haloalquil (C₁-C₆)-alcoxiimino (C₁-C₆), alquilitio (C₁-C₆), haloalquilitio (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilitio (C₁-C₆), alquilitio (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquilsulfinito (C₁-C₆), haloalquilsulfinito (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilsulfinito (C₁-C₆), alquilsulfinito (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquilsulfonilo (C₁-C₆), haloalquilsulfonilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilsulfonilo (C₁-C₆), alquilsulfonilo (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquilsulfoniloxi (C₁-C₆), alquilcarbonilo (C₁-C₆), alquilcarbonilo (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquilitiocarbonilo (C₁-C₆), haloalquilcarbonilo (C₁-C₆), alquilarboniloxi (C₁-C₆), alcoxicarbonilo (C₁-C₆), haloalcoxicarbonilo (C₁-C₆), aminocarbonilo, alquilaminocarbonilo (C₁-C₆), alquilaminotiocarbonilo (C₁-C₆), dialquilaminocarbonilo (C₁-C₆), dialquilarboniloxi (C₁-C₆), alquenilaminocarbonilo (C₂-C₆), dialquenilaminocarbonilo (C₂-C₆), cicloalquilaminocarbonilo (C₃-C₈), alquilsulfonilamino (C₁-C₆), alquilamino (C₁-C₆), dialquilamino (C₁-C₆), aminosulfonilo, alquilaminosulfonilo (C₁-C₆), dialquilaminosulfonilo (C₁-C₆), alquilsulfoximino (C₁-C₆),

5 aminotiocarbonilo, alquilaminotiocarbonilo (C₁-C₆), dialquilaminotiocarbonilo (C₁-C₆), cicloalquilamino (C₃-C₈), NHCO-alquilo (C₁-C₆) (alquilcarbonilamino (C₁-C₆)), o donde los sustituyentes pueden seleccionarse independientemente entre sí de fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, donde fenilo o el anillo puede estar opcionalmente mono- o polisustituido de manera idéntica o diferente con alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, halógeno, CN, NO₂, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄,

10 n es 0, 1 o 2,

donde, en el caso de la unidad estructural A4, Q no es ninguno de los siguientes sistemas de anillos:



10 donde X e Y, que pueden ser iguales o diferentes, son carbono o nitrógeno, R''' es hidrógeno, aldehído, oxima o -C(O)O-R_a, con la condición de que X sea carbono, donde R_a es alquilo inferior C₁-C₆, R' y R'', que pueden ser iguales o diferentes, son hidrógeno, halógeno, ciano, nitró, alquilo inferior C₁-C₆ o alcoxi inferior C₁-C₆, y, además, cuando Aa es =C(H)-, en el caso de los compuestos de fórmula (I), Q no es Q1, Q2, Q3, Q4, Q5, Q6, Q7, Q8, Q9, Q10, Q15, Q17, a excepción de los compuestos A3 y A4 del documento WO-A-2016 142 326.

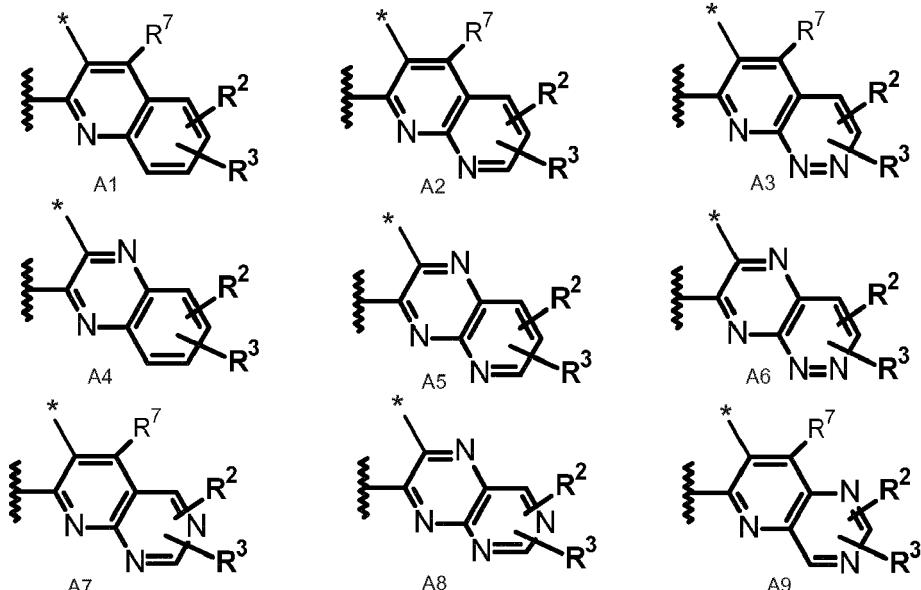
15 Se ha descubierto adicionalmente que los compuestos de fórmula (I) o (I') son altamente efectivos como pesticidas, preferentemente como insecticidas y/o acaricidas, y adicionalmente en general tienen muy buena compatibilidad con las plantas, especialmente con respecto a las plantas de cultivo.

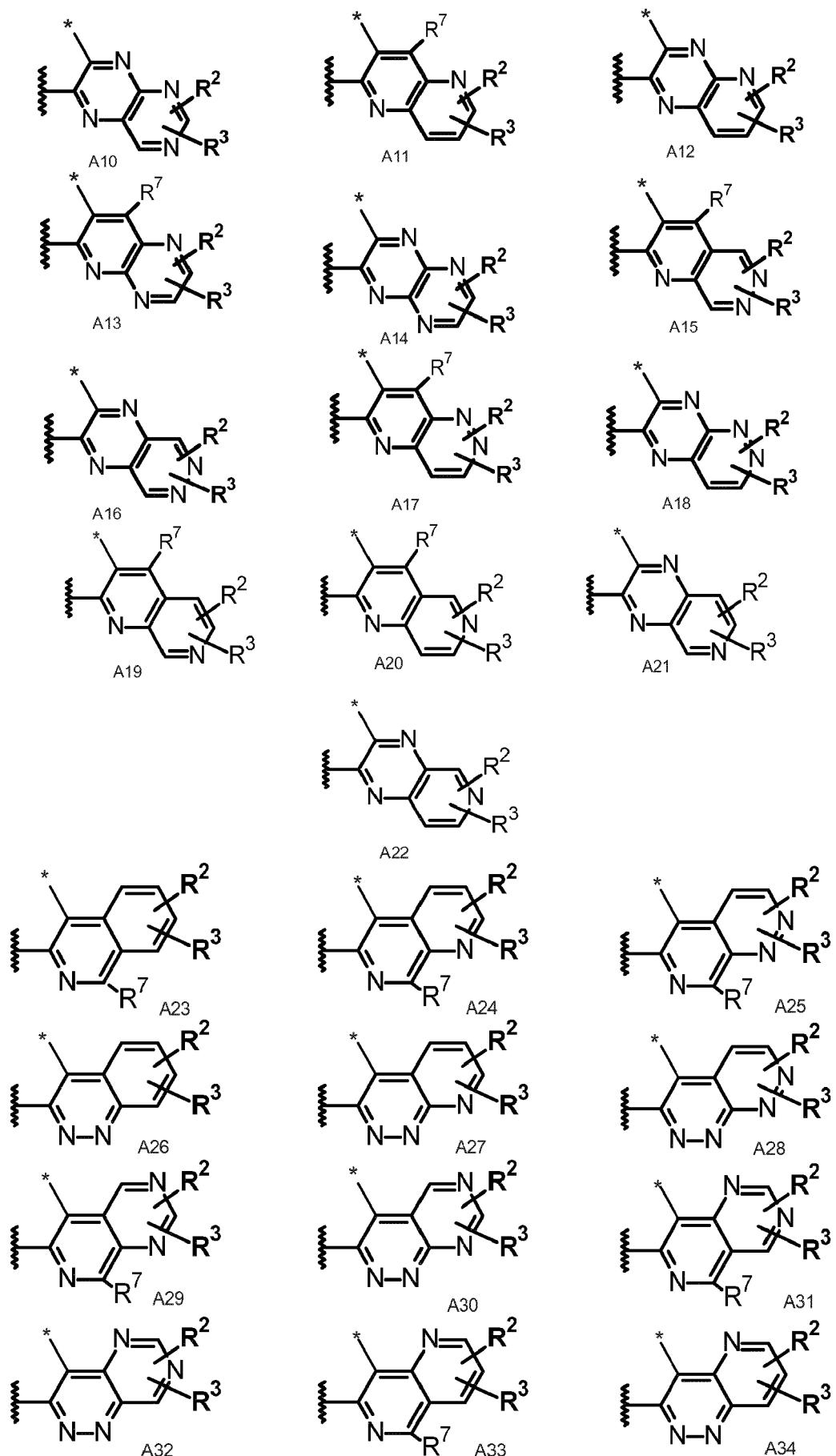
20 Los compuestos de acuerdo con la invención se definen en términos generales mediante las fórmulas (I) o (I'). En lo sucesivo en el presente documento se ilustran sustituyentes o intervalos preferidos para los restos enumerados en las fórmulas mencionadas anteriormente y a continuación:

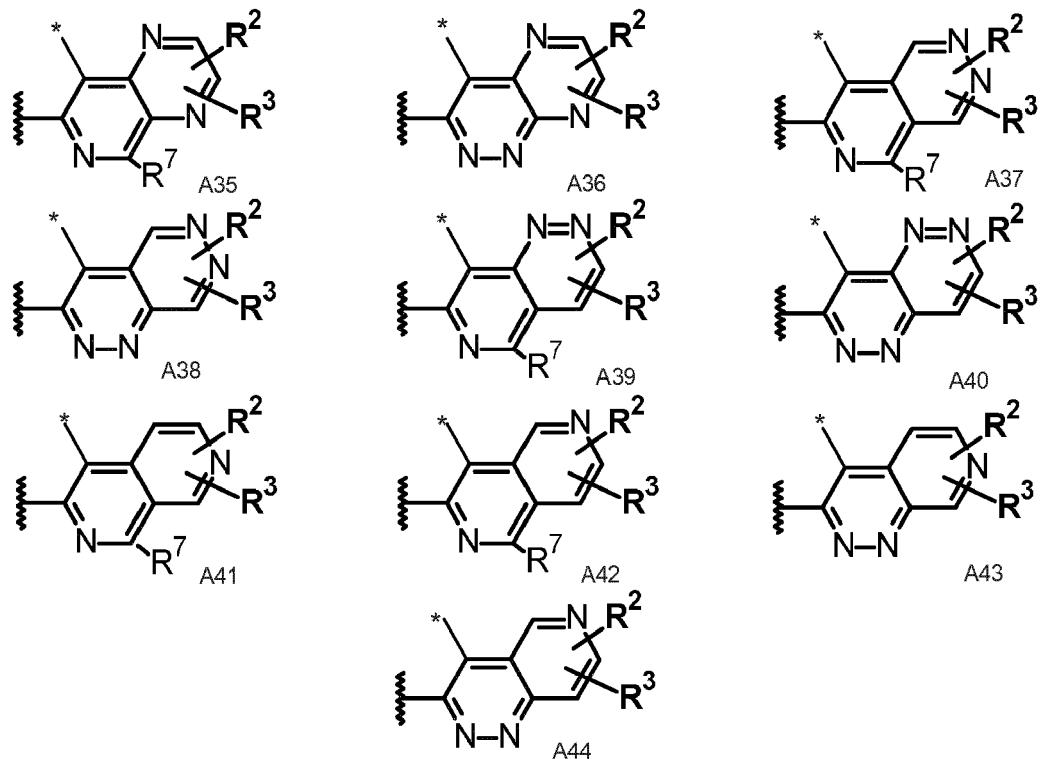
Configuración 2

25 Aa es preferentemente nitrógeno o =C(R⁷)-,
Ab es preferentemente nitrógeno o =C(H)-,
Ac es preferentemente nitrógeno o =C(H)-,
Ad es preferentemente nitrógeno o =C(H)-,
Ae es preferentemente nitrógeno o =C(H)-,

donde Ab, Ac, Ad y Ae no pueden ser todos nitrógeno,
preferentemente para dar como resultado las siguientes unidades estructurales A1 a A44:

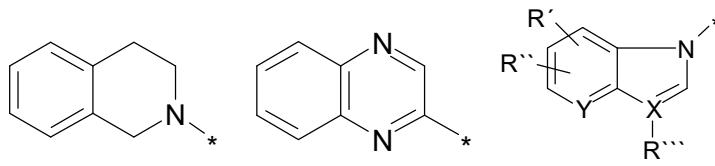






- R⁷ es preferentemente hidrógeno, ciano, halógeno, acetilo, hidroxilo, amino, cicloalquilo (C₃-C₈), halocicloalquilo (C₃-C₆), alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), cianoalquilo (C₁-C₄), alquenilo (C₂-C₄), haloalquenilo (C₂-C₄), alquinilo (C₂-C₄), haloalquinilo (C₂-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄), haloalquiltio (C₁-C₄), alquilsulfinilo (C₁-C₄), haloalquilsulfinilo (C₁-C₄), alquilsulfonilo (C₁-C₄) o haloalquilsulfonilo (C₁-C₄),
- 5 Q es preferentemente un sistema de anillos bicíclicos o tricíclicos condensados heteroaromáticos de 8, 9, 10, 11 o 12 miembros, donde el sistema de anillos puede estar opcionalmente mono o polisustituido en forma idéntica o diferente, y donde los sustituyentes pueden seleccionarse independientemente entre sí de hidrógeno, ciano, halógeno, nitro, acetilo, hidroxilo, amino, SCN, trialquilsililo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₈), cicloalquil (C₃-C₈)-cicloalquilo (C₃-C₈), alquil (C₁-C₆)-cicloalquilo (C₃-C₈), haloalquilo (C₃-C₈), alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), cianoalquilo (C₁-C₆), hidroxialquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquenilo (C₂-C₆), haloalquenilo (C₂-C₆), cianoalquenilo (C₂-C₆), alquinilo (C₂-C₆), alquinoloxi (C₂-C₆)-alquilo (C₁-C₄), haloalquinilo (C₂-C₆), alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquenoloxi (C₂-C₆)-alquilo (C₁-C₆), haloalquenoloxi (C₂-C₆)-alquilo (C₁-C₆), cianoalcoxi (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alcoxi (C₁-C₆), alquihidroxiimino (C₁-C₆), alcoxiimino (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆)-alcoxiimino (C₁-C₆), alquiltio (C₁-C₆), haloalquiltio (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquiltio (C₁-C₆), alquiltio (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquilsulfinilo (C₁-C₆), haloalquilsulfinilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilsulfinilo (C₁-C₆), alquilsulfinil (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquilsulfonilo (C₁-C₆), haloalquilsulfonilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilsulfonilo (C₁-C₆), alquilsulfonil (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquilsulfoniloxi (C₁-C₆), alquilcarbonilo (C₁-C₆), alquilcarbonil (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquiltiocarbonilo (C₁-C₆), haloalquiltiocarbonilo (C₁-C₆), alquilmaminocarbonilo (C₁-C₆), alquilmaminotiocarbonilo (C₁-C₆), dialquilmaminocarbonilo (C₁-C₆), dialquilmaminotiocarbonilo (C₁-C₆), cicloalquilmaminocarbonilo (C₃-C₈), alquilsulfonilamino (C₁-C₆), alquilmamino (C₁-C₆), dialquilmamino (C₁-C₆), aminosulfonilo, alquilmaminosulfonilo (C₁-C₆), dialquilmaminosulfonilo (C₁-C₆), alquilsulfoximino (C₁-C₆), aminotiocarbonilo, alquilmaminotiocarbonilo (C₁-C₆), dialquilmaminotiocarbonilo (C₁-C₆), cicloalquilmamino (C₃-C₈), NHCO-alquilo (C₁-C₆), (alquilcarbonilamino (C₁-C₆)),
- 10 o donde los sustituyentes pueden seleccionarse independientemente entre sí de fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, donde fenilo o el anillo puede estar opcionalmente mono- o polisustituido de manera idéntica o diferente con alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, halógeno, CN, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄,
- 15 n es preferentemente 0, 1 o 2,

donde, en el caso de la unidad estructural A4, Q no es ninguno de los siguientes sistemas de anillos:



- 35 donde X e Y, que pueden ser iguales o diferentes, son carbono o nitrógeno, R''' es hidrógeno, aldehído, oxima o -C(O)O-Ra, con la condición de que X sea carbono, donde Ra es alquilo inferior C₁-C₆, R' y R'', que pueden ser iguales o diferentes, son hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo inferior C₁-C₆ o alcoxi inferior C₁-C₆, y, además, cuando Aa es =C(H)-, en el caso de los compuestos de fórmula (I), Q no es Q1, Q2, Q3, Q4, Q5, Q6, Q7, Q8, Q9, Q10, Q15, Q17.

Configuración 3-1

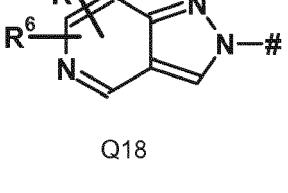
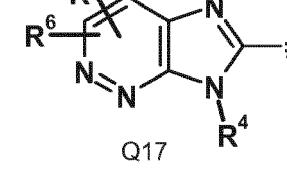
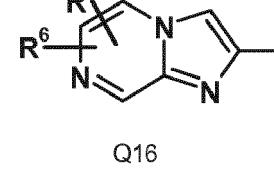
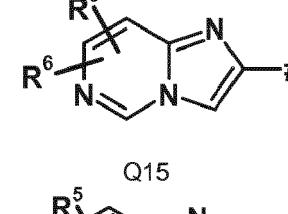
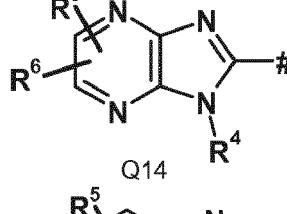
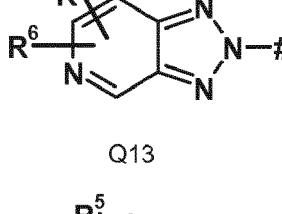
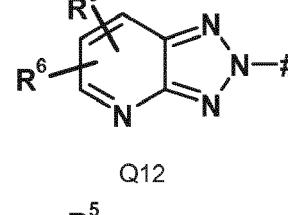
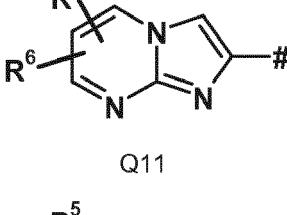
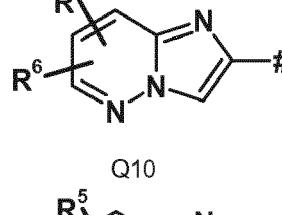
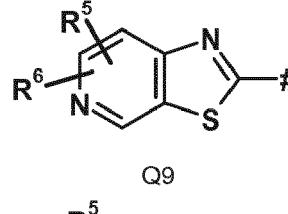
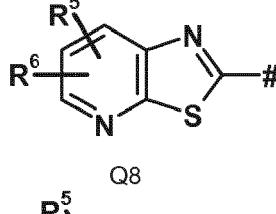
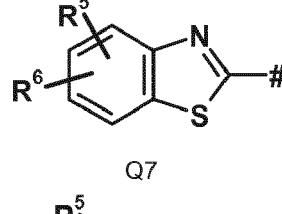
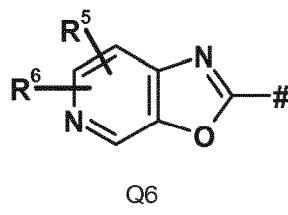
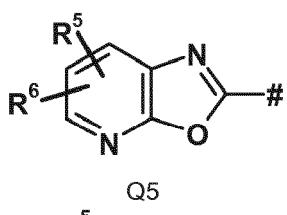
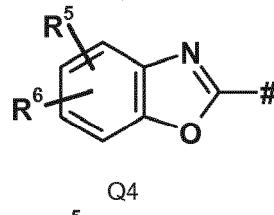
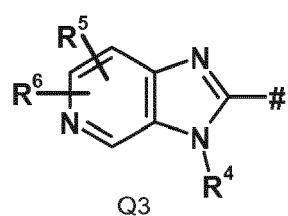
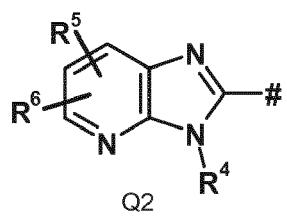
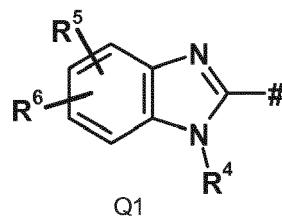
- 40 Aa es de manera especialmente preferente nitrógeno o =C(R⁷)-,
- Ab es de manera especialmente preferente nitrógeno o =C(H)-,
- Ac es de manera especialmente preferente nitrógeno o =C(H)-,
- Ad es de manera especialmente preferente nitrógeno o =C(H)-,
- Ae es de manera especialmente preferente nitrógeno o =C(H)-,
- 45 donde Ab, Ac, Ad y Ae no pueden ser todos nitrógeno, para dar más preferentemente las siguientes unidades estructurales: A1, A2, A3, A4, A5, A7, A8, A9, A10, A11, A12, A13, A14, A15, A17, A19, A20, A21, A22, A23, A24, A25, A26, A27, A29, A30, A31, A32, A33, A34, A35, A36, A37, A39, A41, A42, A43, A44,
- 50 R¹ es de manera especialmente preferente alquilo (C₁-C₄), hidroxialquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alquenilo (C₂-C₄), haloalquenilo (C₂-C₄), alquinilo (C₂-C₄), haloalquinilo (C₂-C₄), cicloalquilo (C₃-C₆), alquiltio (C₁-C₄)-

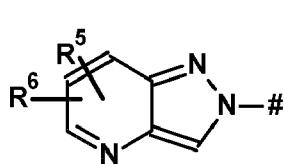
alquilo (C₁-C₄), alquilsulfinil (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄) o alquilsulfonil (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄),

R², R³ son de manera especialmente preferente independientemente hidrógeno, ciano, halógeno, nitro, hidroxilo, amino, SCN, trialquilsililo (C₁-C₄), cicloalquilo (C₃-C₈), cicloalquil (C₃-C₆)-cicloalquilo (C₃-C₆), alquil (C₁-C₄)-cicloalquilo (C₃-C₆), halocicloalquilo (C₃-C₆), alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), cianoalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), alquenilo (C₂-C₄), haloalquenilo (C₂-C₄), cianoalquenilo (C₂-C₄), alquinilo (C₂-C₄), haloalquinilo (C₂-C₄), cianoalquinilo (C₂-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), cianoalcoxi (C₁-C₄), alquilhidroxiimino (C₁-C₄), alcoxiimino (C₁-C₄), alquil (C₁-C₄)-alcoxiimino (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄), haloalquiltio (C₁-C₄), alquilsulfinilo (C₁-C₄), haloalquilsulfinilo (C₁-C₄), alquilsulfonilo (C₁-C₄), haloalquilsulfonilo (C₁-C₄), alquilsulfoniloxi (C₁-C₄), alquilcarbonilo (C₁-C₄), haloalquilcarbonilo (C₁-C₄), aminocarbonilo, alquilaminocarbonilo (C₁-C₄), dialquilaminocarbonilo (C₁-C₄), alquilsulfonilamino (C₁-C₄), alquilamino (C₁-C₄), dialquilamino (C₁-C₄), aminosulfonilo, alquilaminosulfonilo (C₁-C₄), dialquilaminosulfonilo (C₁-C₄) o NHCO-alquilo (C₁-C₄) (alquilcarbonilamino (C₁-C₄)),

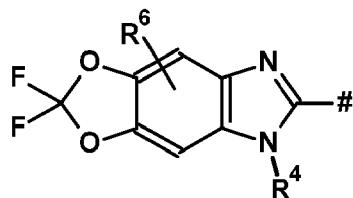
R⁷ es de manera especialmente preferente hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo (C₁-C₄) o haloalquilo (C₁-C₄),

Q es de manera especialmente preferente un sistema de anillos heteroaromáticos bicíclicos o tricíclicos condensados de 9 o 12 miembros del grupo de Q1 a Q20,





Q19



Q20

5 R^4 es de manera especialmente preferente alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), cianoalquilo (C₁-C₄), hidroxialquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), alquenilo (C₂-C₄), alqueniloxi (C₂-C₄)-alquilo (C₁-C₄), haloalqueniloxi (C₂-C₄)-alquilo (C₁-C₄), haloalquenilo (C₂-C₄), cianoalquenilo (C₂-C₄), alquinilo (C₂-C₄), alquiniloxi (C₂-C₄)-alquilo (C₁-C₄), haloalquinilo (C₂-C₄), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquil (C₃-C₆)-cicloalquilo (C₃-C₆), alquil (C₁-C₄)-cicloalquilo (C₃-C₆), halocicloalquilo (C₃-C₆), alquiltio (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), alquilsulfinil (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), alquilsulfonil (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄) o alquilcarbonil (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄),

10 R^5, R^6 son de manera especialmente preferente independientemente hidrógeno, ciano, halógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alquenilo (C₂-C₄), haloalquenilo (C₂-C₄), alquinilo (C₂-C₄), haloalquinilo (C₂-C₄), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquil (C₃-C₆)-cicloalquilo (C₃-C₆), alquil (C₁-C₄)-cicloalquilo (C₃-C₆), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alcoxiimino (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄), haloalquiltio (C₁-C₄), alquilsulfonilo (C₁-C₄), haloalquilsulfonilo (C₁-C₄), alquilsulfoniloxi (C₁-C₄), alquilcarbonilo (C₁-C₄), haloalquilcarbonilo (C₁-C₄), aminocarbonilo, alquilaminocarbonilo (C₁-C₄), dialquilaminocarbonilo (C₁-C₄), dialquilmaminocarbonilo (C₁-C₄), alquilsulfonilamino (C₁-C₄), alquilmamino (C₁-C₄), dialquilmamino (C₁-C₄), aminosulfonilo, alquilmaminosulfonilo (C₁-C₄) o dialquilmaminosulfonilo (C₁-C₄),

15 n es de manera especialmente preferente 0, 1 o 2.

Configuración 3-2

Aa, Ab, Ac, Ad, Ae, R¹, R², R³, R⁷, Q, R⁵, R⁶ y n tienen las definiciones que se presentan en la configuración 3-1 y

20 R^4 es de manera especialmente preferente hidrógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), cianoalquilo (C₁-C₄), hidroxialquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), alquenilo (C₂-C₄), alqueniloxi (C₂-C₄)-alquilo (C₁-C₄), haloalqueniloxi (C₂-C₄)-alquilo (C₁-C₄), haloalquenilo (C₂-C₄), cianoalquenilo (C₂-C₄), alquinilo (C₂-C₄), alquiniloxi (C₂-C₄)-alquilo (C₁-C₄), haloalquinilo (C₂-C₄), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquil (C₃-C₆)-cicloalquilo (C₃-C₆), alquil (C₁-C₄)-cicloalquilo (C₃-C₆), halocicloalquilo (C₃-C₆), alquiltio (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), alquilsulfinil (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), alquilsulfonil (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄) o alquilcarbonil (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄),

25 donde, cuando Aa es =C(H)-, en el caso de los compuestos de fórmula (I), Q no es Q1, Q2, Q3, Q4, Q5, Q6, Q7, Q8, Q9, Q10, Q15, Q17.

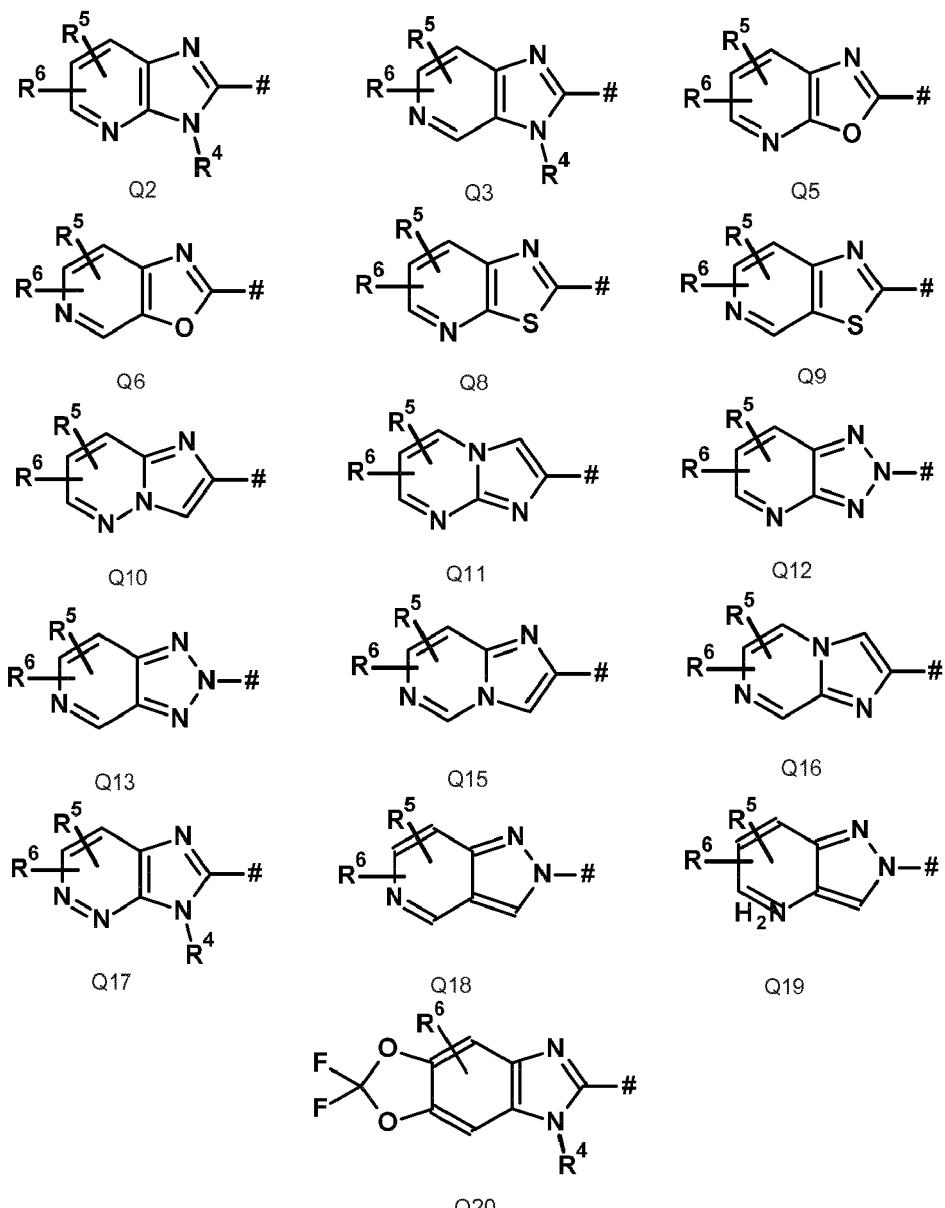
Configuración 4-1

30 Aa es de la manera más especialmente preferente nitrógeno o =C(R⁷)-,
Ab es de la manera más especialmente preferente nitrógeno o =C(H)-,
Ac es de la manera más especialmente preferente nitrógeno o =C(H)-,
Ad es de la manera más especialmente preferente nitrógeno o =C(H)-,
Ae es de la manera más especialmente preferente nitrógeno o =C(H)-,

35 35 donde Ab, Ac, Ad y Ae no pueden ser todos nitrógeno,
para dar de la manera más especialmente preferente las siguientes unidades estructurales: A1, A2, A4, A5, A7, A9, A11, A12, A13, A19, A20, A21, A22, A23, A24, A26, A27, A29, A31, A33, A34, A35, A41, A42, A43, A44,

40 R^1 es de la manera más especialmente preferente alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄) o cicloalquilo (C₃-C₈),
 R^2, R^3 son de la manera más especialmente preferente de forma independiente hidrógeno, ciano, halógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄), alquilsulfinil (C₁-C₄), alquilsulfonil (C₁-C₄), haloalquiltio (C₁-C₄), haloalquilsulfinil (C₁-C₄), haloalquilsulfonil (C₁-C₄) o NHCO-alquilo (C₁-C₄) (alquilcarbonilamino (C₁-C₄)),

45 R^7 es de la manera más especialmente preferente hidrógeno, halógeno, ciano o alquilo (C₁-C₄),
Q es de la manera más especialmente preferente un sistema de anillos heteroaromáticos bicíclicos o tricíclicos condensados de 9 miembros o 12 miembros del grupo de Q2, Q3, Q5, Q6, Q8, Q9, Q10, Q11, Q12, Q13, Q15, Q16, Q17, Q18, Q19 o Q20, donde, cuando Aa es =CH, en el caso de los compuestos de fórmula (I), Q no es Q2, Q3, Q5, Q6, Q8, Q9, Q10, Q15, Q17,



R⁴ es de la manera más especialmente preferente alquilo (C₁-C₄) o alcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄),

R⁵ es de la manera más especialmente preferente hidrógeno, ciano, halógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquil (C₃-C₆)-cicloalquilo (C₃-C₆), alquil (C₁-C₄)-cicloalquilo (C₃-C₆), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alcoxiimino (C₁-C₄), alquilitio (C₁-C₄), haloalquilitio (C₁-C₄), alquilsulfínico (C₁-C₄), haloalquilsulfínico (C₁-C₄), alquilsulfónico (C₁-C₄), haloalquilsulfónico (C₁-C₄), alquilcarbonilo (C₁-C₄), haloalquilcarbonilo (C₁-C₄), alquilaminocarbonilo (C₁-C₄), dialquilaminocarbonilo (C₁-C₄), alquilsulfonilamino (C₁-C₄), alquilaminosulfonilo (C₁-C₄) o dialquilaminosulfonilo (C₁-C₄),

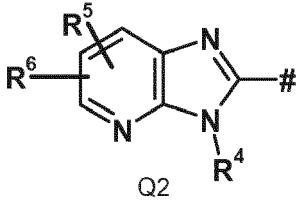
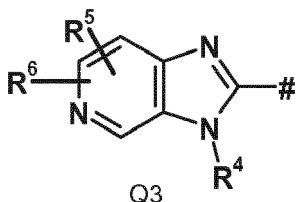
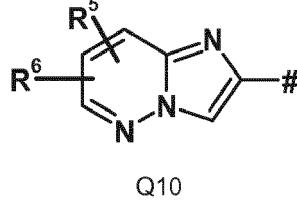
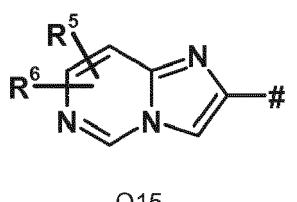
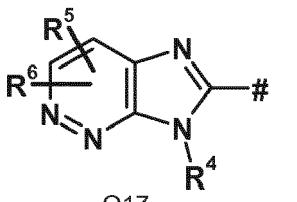
R⁶ es de la manera más especialmente preferente hidrógeno,

15 n es de la manera más especialmente preferente 0, 1 o 2.

Configuración 4-2

Aa, Ab, Ac, Ad, Ae, R¹, R⁵, R⁶ y n tienen las definiciones que se presentan en la configuración 4-1 y

R², R³ son de la manera más especialmente preferente independientemente hidrógeno, ciano, halógeno, alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquilitio (C₁-C₄), alquilsulfínico (C₁-C₄), alquilsulfónico (C₁-C₄), haloalquilitio (C₁-C₄), haloalquilsulfínico (C₁-C₄), haloalquilsulfónico (C₁-C₄) o NHCO-alquilo (C₁-C₄) (alquilcarbonilamino (C₁-C₄)),

	R^7	es de la manera más especialmente preferente hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo (C_1-C_4) o haloalquilo (C_1-C_4),
5	Q	es de la manera más especialmente preferente un sistema de anillos heteroaromáticos bicíclicos o tricíclicos condensados de 9 miembros o 12 miembros del grupo de Q1, Q2, Q3, Q5, Q6, Q8, Q9, Q10, Q11, Q12, Q13, Q15, Q16, Q17, Q18, Q19 o Q20,
	R^4	es de la manera más especialmente preferente hidrógeno, alquilo (C_1-C_4) o alcoxi (C_1-C_4)-alquilo (C_1-C_4),
10	donde, cuando Aa es $=C(H)-$, en el caso de los compuestos de fórmula (I), Q no es Q1, Q2, Q3, Q5, Q6, Q8, Q9, Q10, Q15, Q17.	
	Configuración 5-1	
	Aa	es de manera destacada nitrógeno o $=C(R^7)-$,
	Ab	es de manera destacada nitrógeno o $=C(H)-$,
	Ac	es de manera destacada nitrógeno o $=C(H)-$,
15	Ad	es de manera destacada nitrógeno o $=C(H)-$,
	Ae	es de manera destacada nitrógeno o $=C(H)-$,
	donde Ab, Ac, Ad y Ae no pueden ser todos nitrógeno, para dar de manera destacada las siguientes unidades estructurales: A1, A2, A4, A11, A13, A19, A20, A23, A24, A26, A33, A35, A41, A42,	
20	R^1	es de manera destacada metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, n-butilo, isobutilo, terc-butilo, ciclobutilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, fluoroetilo, difluoroetilo, trifluoroetilo, tetrafluoroetilo o pentafluoroetilo,
	R^2, R^3	son de manera destacada independientemente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, metilo, etilo, metoxi, trifluorometilo, trifluorometoxi o trifluorometiltio,
25	R^7	es de manera destacada hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo o trifluorometilo,
	Q	es de manera destacada un sistema de anillos bicíclicos heteroaromáticos de 9 miembros del grupo Q2, Q3, Q10, Q15 o Q17, donde, cuando Aa es $=CH$, en el caso de los compuestos de fórmula (I), Q no es Q2, Q3, Q10, Q17,
		Q2
		Q3
		Q10
		Q15
		Q17
30	R^4	es de manera destacada metilo, etilo, isopropilo, metoximetilo o metoxietilo,
	R^5	es de manera destacada flúor, cloro, bromo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, fluoroetilo (CH_2CFH_2 , $CHFCF_3$), difluoroetilo (CF_2CH_3 , CH_2CHF_2 , $CHFCFH_2$), trifluoroetilo, (CH_2CF_3 , $CHFCF_2$, CF_2CFH_2), tetrafluoroetilo ($CHFCF_3$, CF_2CHF_2), pentafluoroetilo, trifluorometoxi, difluoroclorometoxi, diclorofluorometoxi o trifluorometiltio,
35	R^6	es de manera destacada hidrógeno,
	n	es de manera destacada 0, 1 o 2.

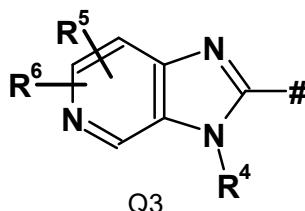
Configuración 5-2

- Aa es de manera destacada nitrógeno o $=C(R^7)-$,
 Ab es de manera destacada $=C(H)-$,
 Ac es de manera destacada $=C(H)-$,
 5 Ad es de manera destacada $=C(H)-$,
 Ae es de manera destacada nitrógeno o $=C(H)-$,
 para dar específicamente las siguientes unidades estructurales: A1, A4, A23, A26, A33,
 R¹ es de manera destacada metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, n-butilo, isobutilo, terc-butilo, ciclobutilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, fluoroetilo, difluoroetilo, trifluoroetilo, tetrafluoroetilo o pentafluoroetilo,
 10 R², R³ son de manera destacada independientemente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, metilo, etilo, metoxi, trifluorometilo, trifluorometoxi o trifluorometiltio,
 R⁷ es de manera destacada hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo o trifluorometilo,
 15 Q es de manera destacada un sistema de anillos heteroaromáticos bicíclicos condensados de 9 miembros o 12 miembros del grupo Q1, Q2, Q3, Q16, Q17 o Q20,
 R⁴ es de manera destacada hidrógeno, metilo, etilo, isopropilo, metoximetilo o metoxietilo,
 R⁵ es de manera destacada flúor, cloro, bromo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, fluoroetilo (CH_2CFH_2 , $CHFCCH_3$), difluoroetilo (CF_2CH_3 , CH_2CHF_2 , $CHFCFH_2$), trifluoroetilo, (CH_2CF_3 , $CHFCF_2$, CF_2CFH_2), tetrafluoroetilo ($CHFCF_3$, CF_2CHF_2), pentafluoroetilo, trifluorometoxi, difluoroclorometoxi, diclorofluorometoxi, trifluorometiltio, trifluoromethylsulfonilo o trifluoromethylsulfanilo,
 20 R⁶ es de manera destacada hidrógeno,
 n es de manera destacada 0, 1 o 2,

donde, cuando Aa es $=C(H)-$, en el caso de los compuestos de fórmula (I), Q no es Q1, Q2, Q3, Q17.

Configuración 6-1

- 25 Aa es en particular nitrógeno o $=C(R^7)-$,
 Ab es en particular $=C(H)-$,
 Ac es en particular $=C(H)-$,
 Ad es en particular $=C(H)-$,
 Ae es en particular $=C(H)-$,
 30 para dar en particular las siguientes unidades estructurales: A1 o A4,
 R¹ es en particular etilo,
 R², R³ son en particular hidrógeno, R⁷ es en particular hidrógeno,
 Q es en particular un sistema de anillos bicíclicos heteroaromáticos de 9 miembros del grupo de Q3



- 35 donde, cuando Aa es $=C(H)-$, en el caso de los compuestos de fórmula (I), Q no es Q3,
 R4 es en particular metilo,
 R5 es en particular trifluorometilo,
 R6 es en particular hidrógeno,
 n es en particular 0 o 2.

- 40 Configuración 6-2

- 5 Aa es en particular nitrógeno o $=C(R^7)-$,
 Ab es en particular $=C(H)-$,
 Ac es en particular $=C(H)-$,
 Ad es en particular $=C(H)-$,
 Ae es en particular nitrógeno o $=C(H)-$,

para dar en particular las siguientes unidades estructurales: A1, A4, A23, A26, A33

- 10 R^1 es en particular metilo o etilo,
 R^2 es en particular hidrógeno, cloro, metoxi o trifluorometilo,
 R^3 es en particular hidrógeno,
 R^7 es en particular hidrógeno,
 Q es en particular un sistema de anillos heteroaromáticos bicíclicos condensados de 9 miembros o 12 miembros del grupo de Q1, Q2, Q3, Q16, Q17, Q20,
 R^4 es en particular hidrógeno o metilo,
 R^5 es en particular trifluorometilo o pentafluoroetilo,
 15 R^6 es en particular hidrógeno,
 n es en particular 0, 1 o 2,

donde, cuando Aa es $=C(H)-$, en el caso de los compuestos de fórmula (I), Q no es Q1, Q2, Q3, Q17.

Configuración 6-3

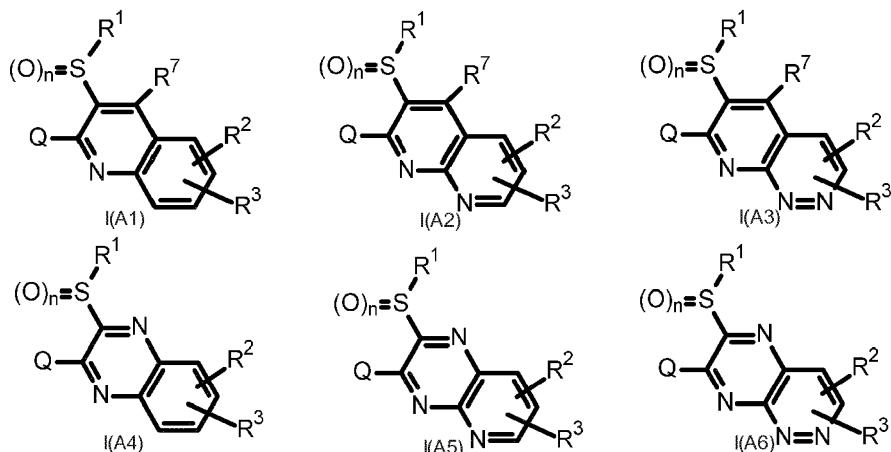
- 20 Aa es en particular nitrógeno o $=C(R^7)-$,
 Ab es en particular $=C(H)-$,
 Ac es en particular $=C(H)-$,
 Ad es en particular $=C(H)-$,
 Ae es en particular nitrógeno o $=C(H)-$,

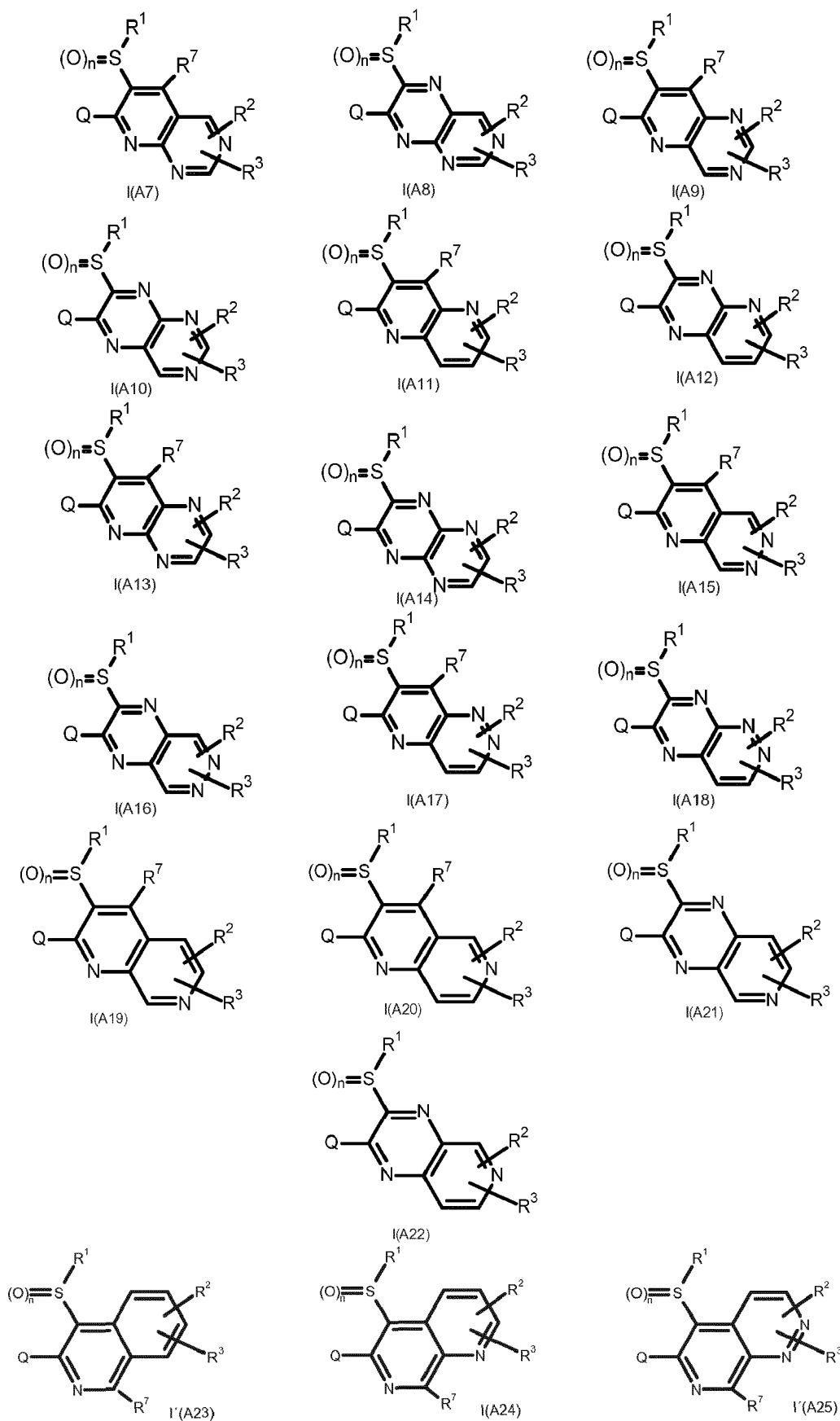
para dar preferentemente en particular las siguientes unidades estructurales: A23, A26, A33,

- 25 R^1 es en particular metilo o etilo,
 R^2 es en particular hidrógeno o trifluorometilo,
 R^3 es en particular hidrógeno,
 R^7 es en particular hidrógeno,
 Q es en particular un sistema de anillos del grupo Q1, Q2, Q3, Q17,
 30 R^4 es en particular metilo,
 R^5 es en particular trifluorometilo o pentafluoroetilo,
 R^6 es en particular hidrógeno,
 n es en particular 0, 1 o 2,

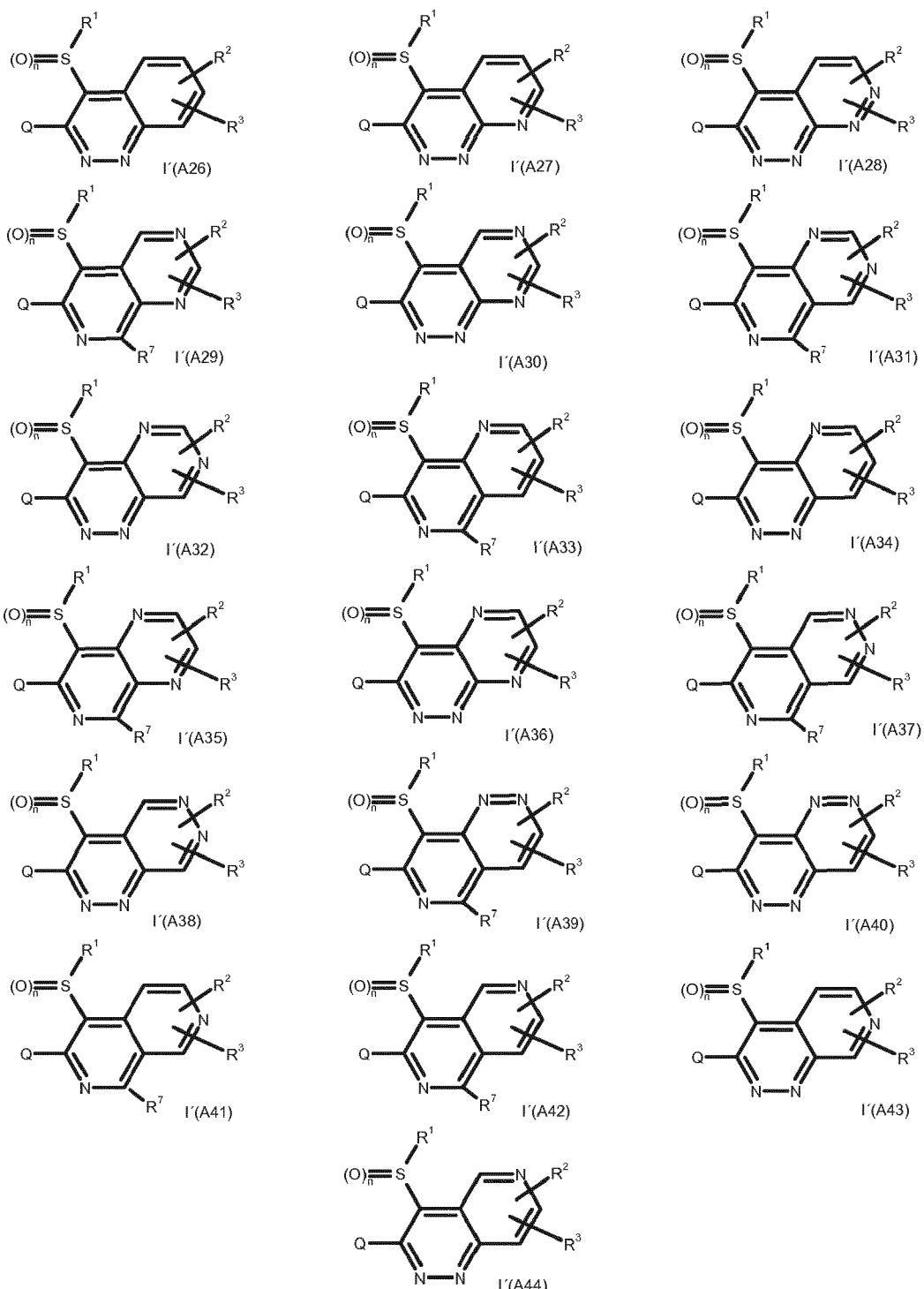
donde, cuando Aa es $=C(H)-$, en el caso de los compuestos de fórmula (I), Q no es Q1, Q2, Q3, Q17.

- 35 Con la inclusión de las unidades estructurales A1 a A44, esto resulta en las siguientes estructuras principales de fórmula (I) o fórmula (I'):





5



donde R¹, R², R³, R⁷, Q y n tienen las definiciones dadas anteriormente.

- 10 En una forma de realización preferente, la invención se refiere a compuestos de fórmula (I) donde R¹, R², R³, R⁷, Q, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae y n tienen las definiciones dadas en la configuración (1) o la configuración (2).
- En una forma de realización preferente, la invención se refiere a compuestos de fórmula (I) donde R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, Q, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae y n tienen las definiciones dadas en la configuración (3-1) o la configuración (3-2) o la configuración (4-1) o la configuración (4-2) o la configuración (5-1) o la configuración (5-2) o la configuración (6-1) o la configuración (6-2).
- 15 En una forma de realización preferente, la invención se refiere a compuestos de fórmula (I') donde R¹, R², R³, R⁷, Q, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae y n tienen las definiciones dadas en la configuración (1) o la configuración (2).

En una forma de realización preferente, la invención se refiere a compuestos de fórmula (I') donde R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, Q, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae y n tienen las definiciones dadas en la configuración (3-1) o la configuración (3-2) o la configuración (4-1) o la configuración (4-2) o la configuración (5-1) o la configuración (5-2) o la configuración (6-1) o la configuración (6-2) o la configuración (6-3).

la configuración (6-2) o la configuración (6-3).

$R^3, R^5, R^6, R^7, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae$ y n tienen las definiciones dadas en la configuración (3-1) o la configuración (3-2) o la configuración (4-1) o la configuración (4-2) o la configuración (5-1) o la configuración (5-2) o la configuración (6-1) o la configuración (6-2) o la configuración (6-3).

En una forma de realización preferente, la invención se refiere a compuestos de fórmula (I) con la unidad estructural A1 y donde Q es Q16 o Q20 y R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ y n tienen las definiciones dadas en la configuración (3-1) o la configuración (3-2) o la configuración (4-1) o la configuración (4-2) o la configuración (5-1) o la configuración (5-2) o la configuración (6-1) o la configuración (6-2) o la configuración (6-3).

5 En una forma de realización preferente, la invención se refiere a compuestos de fórmula (I) con la unidad estructural A4 y donde Q, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ y n tienen las definiciones dadas en la configuración (3-1) o la configuración (3-2) o la configuración (4-1) o la configuración (4-2) o la configuración (5-1) o la configuración (5-2) o la configuración (6-1) o la configuración (6-2) o la configuración (6-3).

10 En una forma de realización preferente, la invención se refiere a compuestos de fórmula (I) con la unidad estructural A23 y donde Q, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ y n tienen las definiciones dadas en la configuración (3-1) o la configuración (3-2) o la configuración (4-1) o la configuración (4-2) o la configuración (5-1) o la configuración (5-2) o la configuración (6-1) o la configuración (6-2) o la configuración (6-3).

15 En una forma de realización preferente, la invención se refiere a compuestos de fórmula (I) con la unidad estructural A26 y donde Q, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ y n tienen las definiciones dadas en la configuración (3-1) o la configuración (3-2) o la configuración (4-1) o la configuración (4-2) o la configuración (5-1) o la configuración (5-2) o la configuración (6-1) o la configuración (6-2) o la configuración (6-3).

20 En una forma de realización preferente, la invención se refiere a compuestos de fórmula (I) con la unidad estructural A33 y donde Q, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ y n tienen las definiciones dadas en la configuración (3-1) o la configuración (3-2) o la configuración (4-1) o la configuración (4-2) o la configuración (5-1) o la configuración (5-2) o la configuración (6-1) o la configuración (6-2) o la configuración (6-3).

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

Aa es nitrógeno o =C(R⁷)-,

Ab es =C(H)-,

Ac es =C(H)-,

Ad es =C(H)-,

Ae es nitrógeno o =C(H)-,

para dar preferentemente las siguientes unidades estructurales: A23, A26, A33,

R¹ es metilo o etilo,

R² es hidrógeno o trifluorometilo,

30 R³ es hidrógeno,

R⁷ es hidrógeno,

Q es un sistema de anillos del grupo de Q1, Q2, Q3, Q17,

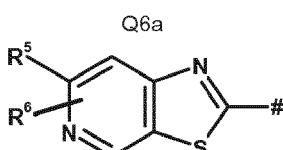
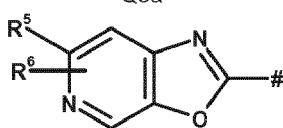
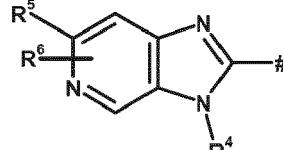
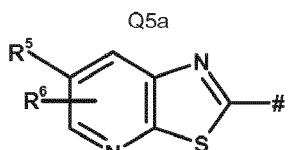
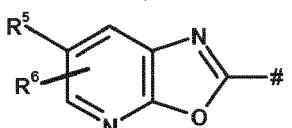
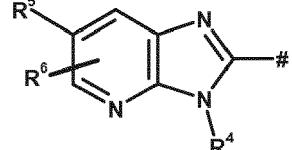
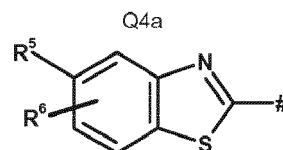
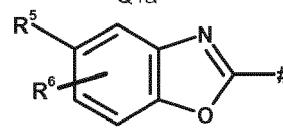
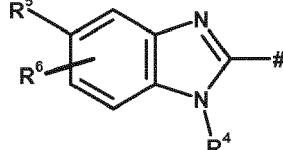
R⁴ es metilo,

R⁵ es trifluorometilo o pentafluoroetilo,

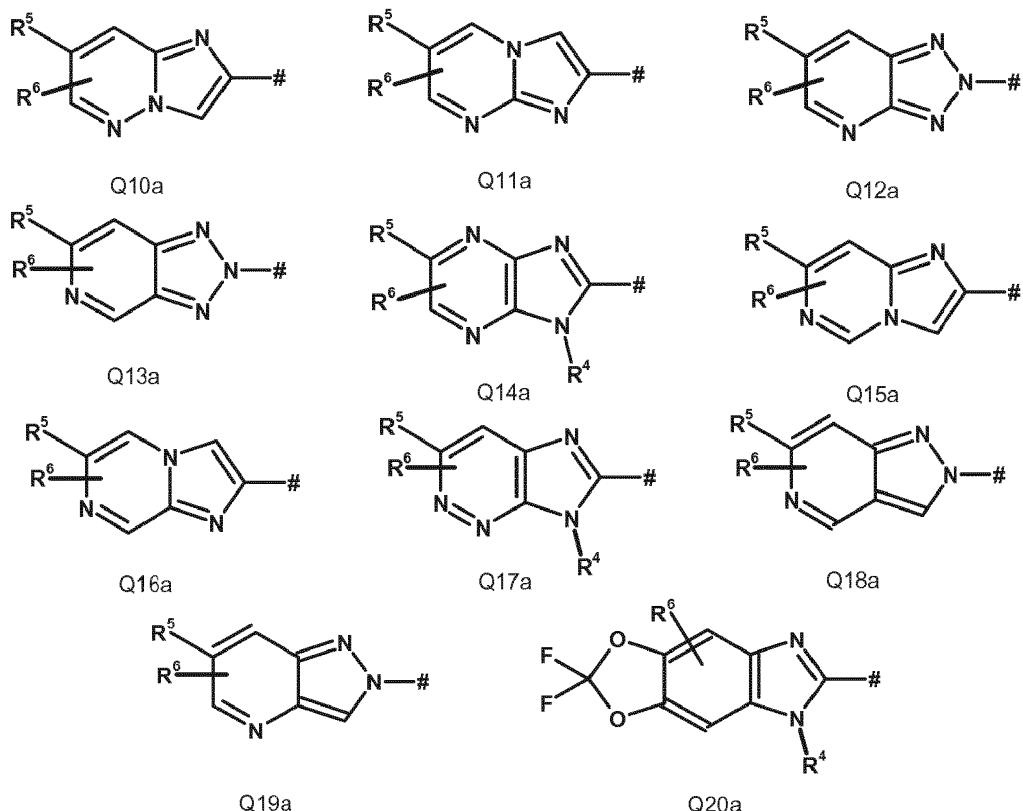
35 R⁶ es hidrógeno,

n es 0, 1 o 2.

En una forma de realización preferente, la invención se refiere a compuestos de fórmula (I) o (I') donde Q es el siguiente sistema de anillos:



40



5 donde R⁶ es hidrógeno y R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁷, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae y n tienen las definiciones dadas en la configuración (3-1) o la configuración (3-2) o la configuración (4-1) o la configuración (4-2) o la configuración (5-1) o la configuración (5-2) o la configuración (6-1) o la configuración (6-2) o la configuración (6-3).

En las definiciones preferentes, a menos que se indique lo contrario, halógeno se selecciona del grupo de flúor, cloro, bromo y yodo, preferentemente a su vez del grupo de flúor, cloro y bromo.

10 En las definiciones particularmente preferidas, a menos que se indique lo contrario, halógeno se selecciona del grupo de flúor, cloro, bromo y yodo, preferentemente a su vez del grupo de flúor, cloro y bromo.

15 En el contexto de la presente invención, a menos que se indique lo contrario, el término "alquilo", por sí solo o en combinación con términos adicionales, por ejemplo, haloalquilo, se entiende que significa un resto de un grupo hidrocarburo alifático saturado que comprende entre 1 y 12 átomos de carbono y que puede estar ramificado o no ramificado. Los ejemplos de los restos alquilo C₁-C₁₂ son metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec-butilo, terbutilo, n-pentilo, isopentilo, neopentilo, terpentilo, 1-metilbutilo, 2 metilbutilo, 1-ethylpropilo, 1,2-dimetilpropilo, hexilo, n-heptilo, n-octilo, n-nonilo, n-decilo, n-undecilo y n-dodecilo. Entre estos restos alquilo, se prefieren especialmente los restos alquilo C₁-C₆. En particular, se prefieren los restos alquilo C₁-C₄.

20 De acuerdo con la invención, a menos que se indique lo contrario, el término "alquenilo", por sí solo o en combinación con términos adicionales, se entiende que significa un resto alquenilo C₂-C₁₂ de cadena lineal o ramificada que comprende al menos un enlace doble, por ejemplo, vinilo, alilo, 1-propenilo, isopropenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1,3-butadienilo, 1-pentenilo, 2-pentenilo, 3-pentenilo, 4-pentenilo, 1, 3-pentadienilo, 1-hexenilo, 2-hexenilo, 3-hexenilo, 4-hexenilo, 5-hexenilo o 1,4-hexadienilo. Entre estos, se prefieren los restos alquenilo C₂-C₆, y se prefieren especialmente los restos alquenilo C₂-C₄.

25 De acuerdo con la invención, a menos que se indique lo contrario, el término "alquinilo", por sí solo o en combinación con términos adicionales, se entiende que significa un resto alquinilo C₂-C₁₂ de cadena lineal o ramificada que comprende al menos un enlace triple, por ejemplo etinilo, 1-propinilo o propargilo. Entre estos, se prefieren los restos alquinilo C₃-C₆ y se prefieren especialmente los restos alquinilo C₃-C₄. El resto alquinilo también puede contener, a este respecto, al menos un enlace doble.

30 De acuerdo con la invención, a menos que se indique lo contrario, el término "cicloalquilo", por sí solo o en combinación con términos adicionales, se entiende que significa un resto cicloalquilo C₃-C₈, por ejemplo ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo o ciclooctilo. Entre estos, se prefieren los restos cicloalquilo C₃-C₆.

35 En el presente documento, el término "alcoxilo", por sí solo o en combinación con términos adicionales, por ejemplo, haloalcoxilo, se entiende que significa un resto O-alquilo, donde el término "alquilo" es como se definió con anterioridad.

Los restos sustituidos con halógenos, por ejemplo, los haloalquilos, pueden estar mono o polihalogenados hasta alcanzar la cantidad máxima de sustituyentes posibles. En el caso de una polihalogenación, los átomos halógenos pueden ser idénticos o diferentes. En este caso, los halógenos pueden ser flúor, cloro, bromo o iodo, en particular flúor, cloro o bromo.

- 5 A menos que se indique lo contrario, los restos opcionalmente sustituidos pueden estar mono o polisustituidos, y los sustituyentes en el caso de las polisustituciones pueden ser idénticos o diferentes.

Las definiciones o las aclaraciones para los restos que se detallaron con anterioridad en términos generales o en intervalos de preferencia se aplican a los productos finales y de manera correspondiente a los materiales de partida y a los productos intermedios. Estas definiciones para los restos pueden combinarse arbitrariamente, es decir, incluso dentro de los intervalos de preferencia respectivos.

- 10 De acuerdo con la invención, se usan preferentemente compuestos de fórmula (I) o (I') que comprenden una combinación de las definiciones que se detallaron con anterioridad como preferentes.

De acuerdo con la invención, se usan de manera especialmente preferente compuestos de fórmula (I) o (I') que comprenden una combinación de las definiciones que se detallaron con anterioridad como especialmente preferentes.

- 15 De acuerdo con la invención, se usan de la manera lo más especialmente preferente compuestos de fórmula (I) o (I') que comprenden una combinación de las definiciones que se detallaron con anterioridad como lo más especialmente preferentes.

De acuerdo con la invención, se usan de manera destacada los compuestos de fórmula (I) o (I') que comprenden una combinación de las definiciones que se detallaron con anterioridad como destacadas.

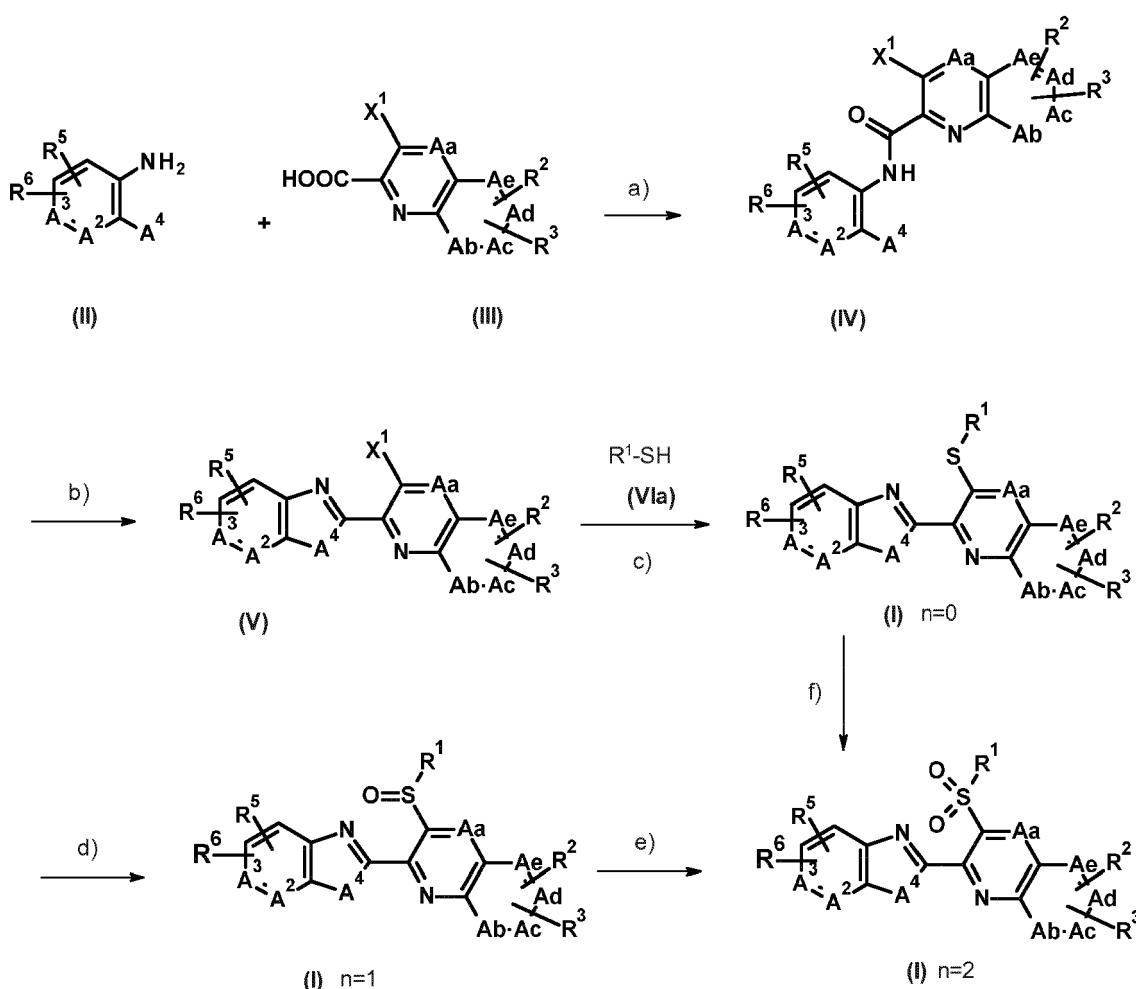
- 20 De acuerdo con la invención, se usan en particular los compuestos de fórmula (I) o (I') que comprenden una combinación de las definiciones que se detallaron con anterioridad como particulares.

Dependiendo de la naturaleza de los sustituyentes, los compuestos de fórmula (I) o (I') pueden adoptar la forma de isómeros geométricos y/u ópticamente activos o de correspondientes mezclas de isómeros con diversas composiciones. Estos estereoisómeros son, por ejemplo, los enantiómeros, los diastereómeros, los atropisómeros y los isómeros geométricos. Por consiguiente, la invención abarca tanto los estereoisómeros puros como cualquier mezcla de estos isómeros.

Los compuestos de fórmula (I) o (I') de acuerdo con la invención pueden obtenerse con los procedimientos que se representan en los esquemas a continuación.

Procedimiento A-1

- 30 Los compuestos de fórmula (I) en los que Q es Q1 a Q9 o Q20 pueden prepararse con procedimientos conocidos, por ejemplo, de manera análoga a los procedimientos que se describen en los documentos WO2009/131237, WO2010/125985, WO2011/043404, WO2011/040629, WO2012/086848, WO2013/018928, WO2015/000715, WO2015/198859, WO2016/039444, WO2016/039441, WO2016/116338 y WO2015/121136.



Los restos R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae y n tienen las definiciones que se detallaron con anterioridad, A² y A³ son CH o N (donde A² y A³ pueden no ser ambos N), A⁴ es O-H, S-H o N(H)R4, A⁴ también puede ser cloro y X¹ es un halógeno.

5 Etapa a)

Los compuestos de fórmula (IV) pueden prepararse de manera análoga al procedimiento que se describe en el documento US5576335, haciendo reaccionar compuestos de fórmula (II) con ácidos carboxílicos de fórmula (III) en presencia de un agente de condensación o una base.

10 Los compuestos de fórmula (II) están disponibles en el mercado o pueden prepararse con procedimientos conocidos, por ejemplo, de manera análoga a los procedimientos que se describen en los documentos US2003/69257, WO2006/65703, WO2009/131237, WO2010/125985, WO2011/043404, WO2011/040629, WO2012/086848, WO2013/018928 o WO2015/000715.

Los ácidos carboxílicos de fórmula (III) están disponibles en el mercado o pueden prepararse con procedimientos conocidos. En el procedimiento F se describen posibles rutas de preparación.

15 La reacción de los compuestos de fórmula (II) con los ácidos carboxílicos de fórmula (III) puede efectuarse sin otros componentes o en un disolvente, y la reacción preferentemente se efectúa en un disolvente que se selecciona de los disolventes habituales que son inertes en las condiciones preponderantes de la reacción. Se prefieren los éteres, por ejemplo, éter diisopropílico, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano; los hidrocarburos halogenados, por ejemplo, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; los nitrilos, por ejemplo, acetonitrilo o propionitrilo; los hidrocarburos aromáticos, por ejemplo, tolueno o xileno; los disolventes apróticos polares, por ejemplo, N,N-dimetilformamida o N-metilpirrolidona; o los compuestos que contienen nitrógeno, por ejemplo, piridina.

Los agentes de condensación apropiados abarcan, por ejemplo, las carbodiimidas, por ejemplo, clorhidrato de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etylcarbodiimida (EDCI) o 1,3-diciclohexilcarbodiimida.

25 Las bases apropiadas abarcan las bases inorgánicas que suelen usarse en estas reacciones. Se prefiere el uso de

bases que pueden seleccionarse, por ejemplo, del grupo que consiste en los acetatos, los fosfatos, los carbonatos y los hidrógenocarbonatos de metales alcalinos o metales alcalinotérreos. En particular, se prefiere el acetato de sodio, el fosfato de sodio, el fosfato de potasio, el carbonato de cesio, el carbonato de sodio, el carbonato de potasio, el hidrogenocarbonato de sodio, el hidrogenocarbonato de potasio.

- 5 La reacción puede efectuarse a presión reducida, a la presión convencional o a presión elevada, y a temperaturas de 0 °C a 180 °C; preferentemente, la reacción se realiza a la presión convencional y a temperaturas de 20 °C a 140 °C.

Etapa b)

Los compuestos de fórmula (V) pueden prepararse condensando compuestos de fórmula (IV), por ejemplo, de manera análoga a los procedimientos que se describen en los documentos WO2009/131237, WO2010/125985, 10 WO2011/043404, WO2011/040629, WO2012/086848, WO2013/018928, WO2015/000715 y WO2015/121136.

La conversión en los compuestos de fórmula (V) puede efectuarse sin otros componentes o en un disolvente, y la reacción preferentemente se efectúa en un disolvente que se selecciona de los disolventes habituales que son inertes en las condiciones preponderantes de la reacción. Se prefieren los éteres, por ejemplo, éter diisopropílico, dioxano, 15 tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, éter metil terbutílico; los hidrocarburos halogenados, por ejemplo, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; los nitrilos, por ejemplo, acetonitrilo o propionitrilo; los hidrocarburos aromáticos, por ejemplo, tolueno o xileno; los disolventes apróticos polares, por ejemplo, N,N-dimetilformamida o N-metilpirrolidona; o los compuestos que contienen nitrógeno, por ejemplo, piridina.

La reacción puede realizarse en presencia de un agente de condensación, un ácido, una base o un agente de cloración.

20 Los ejemplos de los agentes de condensación apropiados abarcan las carbodiimidas, por ejemplo, clorhidrato de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etylcarbodiimida (EDCI) o 1,3-diciclohexilcarbodiimida; los anhídridos, por ejemplo, anhídrido acético, anhídrido trifluoroacético; una mezcla de trifenilfosfina, una base y tetracloruro de carbono o una mezcla de trifenilfosfina y un azo diéster, por ejemplo, ácido dietilazodicarboxílico.

25 Los ejemplos de los ácidos apropiados que pueden usarse en esta reacción abarcan los ácidos sulfónicos, por ejemplo, ácido para-toluenosulfónico; los ácidos carboxílicos, por ejemplo, ácido acético; o los ácidos polifósforicos.

Los ejemplos de las bases apropiadas abarcan los heterociclos que contienen nitrógeno, por ejemplo, piridina, picolina, 2,6-lutidina, 1,8-diazabiciclo[5.4.0]-7-undeceno (DBU); las aminas terciarias, por ejemplo, trietilamina o N,N-diisopropiletilamina; las bases inorgánicas, por ejemplo, fosfato de potasio, carbonato de potasio o hidruro de sodio.

Un ejemplo de un agente de cloración apropiado es el oxicloruro de fósforo.

30 La reacción puede realizarse a presión reducida, a la presión convencional o a presión elevada, y a temperaturas de 0 °C a 200 °C.

Etapa c)

Los compuestos de fórmula (I) donde n es 0 pueden prepararse haciendo reaccionar los compuestos de fórmula (V) con los compuestos de fórmula (VIa) en presencia de una base.

35 Los derivados de mercaptano de fórmula (VIa), por ejemplo, metil mercaptano, etil mercaptano o isopropil mercaptano, están disponibles en el mercado o pueden prepararse con procedimientos conocidos, por ejemplo, de manera análoga a los procedimientos que se describen en los documentos US2006/25633, US2006/111591, US2820062, en Chemical Communications, 13 (2000), 1163-1164 o en Journal of the American Chemical Society, 44 (1922), pág. 1329.

40 La conversión en los compuestos de fórmula (I) donde n es 0 puede efectuarse sin otros componentes o en un disolvente, y la reacción preferentemente se efectúa en un disolvente que se selecciona de los disolventes habituales que son inertes en las condiciones preponderantes de la reacción. Se prefieren los éteres, por ejemplo, éter diisopropílico, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, éter metil terbutílico; los nitrilos, por ejemplo, acetonitrilo o propionitrilo; los hidrocarburos aromáticos, por ejemplo, tolueno o xileno; los disolventes apróticos polares, por ejemplo, N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona o dimetil sulfóxido.

45 Los ejemplos de las bases apropiadas abarcan las bases inorgánicas del grupo que consiste en los acetatos, los fosfatos y los carbonatos de metales alcalinos o metales alcalinotérreos. Se prefiere el carbonato de cesio, el carbonato de sodio y el carbonato de potasio. Otras bases apropiadas abarcan los hidruros de metales alcalinos, por ejemplo, hidruro de sodio.

50 Como alternativa, pueden usarse directamente sales de derivados de mercaptano, por ejemplo, etanotiolato de sodio, metanotiolato de sodio o isopropanotiolato de sodio, sin la adición de otra base. La reacción puede realizarse a presión reducida, a la presión convencional o a presión elevada, y a temperaturas de 0 °C a 200 °C.

En esta reacción, X¹ preferentemente es un átomo de flúor o cloro.

Si R^2 o R^3 es un halógeno (por ejemplo, cloro o flúor), y por ejemplo, se usa metil mercaptano, etil mercaptano o isopropil mercaptano, también puede realizarse un intercambio múltiple con el alquil mercaptano en combinación con una única sustitución en X^1 .

Etapa d)

- 5 Los compuestos de fórmula (I) donde n es 1 pueden prepararse oxidando compuestos de fórmula (I) donde n es 0. La oxidación generalmente se realiza en un disolvente que se selecciona de los disolventes habituales que son inertes en las condiciones preponderantes de la reacción. Se prefieren los hidrocarburos halogenados, por ejemplo, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; los alcoholes, por ejemplo, metanol o etanol; el ácido fórmico, el ácido acético, el ácido propiónico o el agua.
- 10 Los ejemplos de los agentes oxidantes apropiados abarcan el peróxido de hidrógeno, el ácido meta-cloroperbenzoico y el periodato de sodio.

La reacción puede realizarse a presión reducida, a la presión convencional o a presión elevada, y a temperaturas de -20 °C a 120 °C.

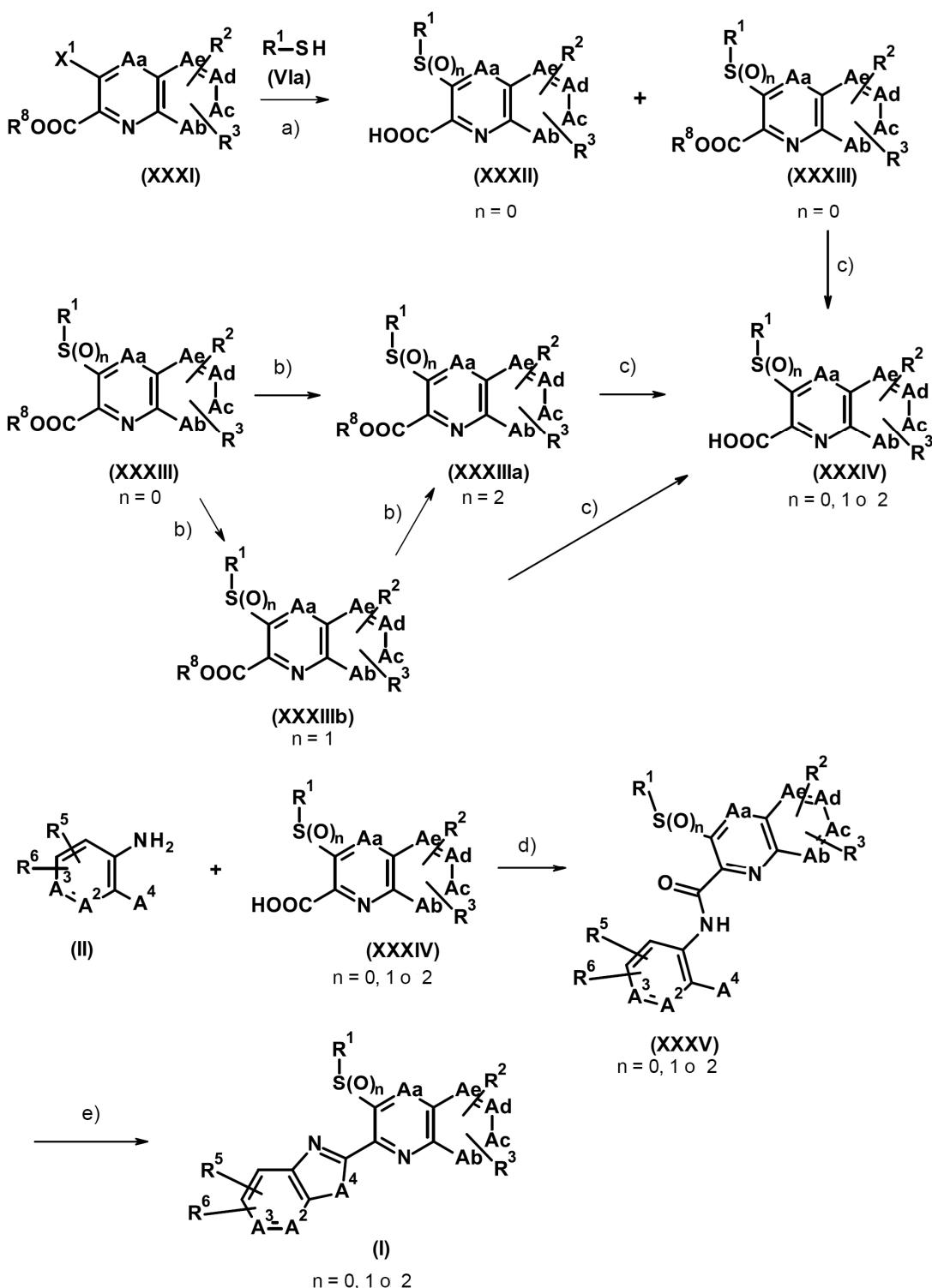
Etapa e)

- 15 Los compuestos de fórmula (I) donde n es 2 pueden prepararse oxidando compuestos de fórmula (I) donde n es 1. La oxidación generalmente se realiza en un disolvente. Se prefieren los hidrocarburos halogenados, por ejemplo, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; los alcoholes, por ejemplo, metanol o etanol; el ácido fórmico, el ácido acético, el ácido propiónico o el agua.
- Los ejemplos de los agentes oxidantes apropiados abarcan el peróxido de hidrógeno y el ácido meta-cloroperbenzoico.
- 20 La reacción puede realizarse a presión reducida, a la presión convencional o a presión elevada, y a temperaturas de -20 °C a 120 °C.

Etapa f)

- 25 Los compuestos de fórmula (I) donde n es 2 también pueden prepararse en un procedimiento con una etapa, oxidando compuestos de fórmula (I) donde n es 0. La oxidación generalmente se realiza en un disolvente. Se prefieren los hidrocarburos halogenados, por ejemplo, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; los alcoholes, por ejemplo, metanol o etanol; el ácido fórmico, el ácido acético, el ácido propiónico o el agua.
- Los ejemplos de los agentes oxidantes apropiados abarcan el peróxido de hidrógeno y el ácido meta-cloroperbenzoico.
- 30 La reacción puede realizarse a presión reducida, a la presión convencional o a presión elevada, y a temperaturas de -20 °C a 120 °C.
- Los compuestos de fórmula (I') en los que Q es Q1 a Q9 o Q20 también pueden prepararse de manera análoga al procedimiento A-1, a partir de los ácidos carboxílicos correspondientes de las fórmulas (III^{-A}) o (III^{-B}), y las rutas de preparación posibles se detallan en los procedimientos g y H.
- 35 Si R^2 o R^3 es alquilsulfanilo, puede usarse un agente oxidante apropiado, por ejemplo, peróxido de hidrógeno o ácido meta-cloroperbenzoico, y puede oxidarse el átomo de azufre junto con R^1 para obtener una sulfona, de manera que también se oxide el sustituyente de alquilsulfanilo en un alquilsulfonilo.

Procedimiento A-2



Los restos Aa, Ab, Ac, Ad, Ae, R¹, R², R³, R⁵, R⁶ y n tienen las definiciones que se detallaron con anterioridad, A² y A³ son CH o N, X¹ es un halógeno, A⁴ es O-H, S-H o N(H)R⁴, A⁴ también puede ser cloro y R⁸ es alquilo (C₁-C₄).

Etapa a)

- 5 Los compuestos de las fórmulas (XXXII) y (XXXIII) pueden prepararse haciendo reaccionar los compuestos de la fórmula (XXXI) con los compuestos de la fórmula (Vla) en presencia de una base.

Los compuestos de la fórmula (XXXI) están disponibles en el mercado o pueden prepararse con procedimientos conocidos, por ejemplo, a partir de derivados de 2-aminopiridina, de manera análoga a los procedimientos que se

describen en el documento WO2011/41713 o de manera análoga a los procedimientos F-1 y F-2.

Los derivados de mercaptano de fórmula (Vla), por ejemplo, metil mercaptano, etil mercaptano o isopropil mercaptano, están disponibles en el mercado o pueden prepararse con procedimientos conocidos, por ejemplo, de manera análoga a los procedimientos que se describen en los documentos US2006/25633, US2006/111591, US2820062, en Chemical Communications, 13 (2000), 1163-1164 o en Journal of the American Chemical Society, 44 (1922), pág. 1329.

La conversión en los compuestos de las fórmulas (XXXII) y (XXXIII) puede efectuarse sin otros componentes o en un disolvente; preferentemente, la reacción se realiza en un disolvente que se selecciona de los disolventes habituales que son inertes en las condiciones preponderantes de la reacción. Se prefieren los éteres, por ejemplo, éter diisopropílico, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, éter metil terbutílico; los nitrilos, por ejemplo, acetonitrilo o propionitrilo; los hidrocarburos aromáticos, por ejemplo, tolueno o xileno; los disolventes apróticos polares, por ejemplo, N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona o dimetil sulfóxido.

Los ejemplos de las bases apropiadas abarcan las bases inorgánicas del grupo que consiste en los acetatos, los fosfatos y los carbonatos de metales alcalinos o metales alcalinotérreos. Se prefiere el carbonato de cesio, el carbonato de sodio y el carbonato de potasio. Otras bases apropiadas abarcan los hidruros de metales alcalinos, por ejemplo, hidruro de sodio.

Como alternativa, pueden usarse directamente sales de derivados de mercaptano, por ejemplo, etanotiolato de sodio, metanotiolato de sodio o isopropanotiolato de sodio, sin la adición de otra base.

La reacción puede realizarse a presión reducida, a la presión convencional o a presión elevada, y a temperaturas de 0 °C a 200 °C.

20 **Etapa b)**

Los compuestos de fórmula (XXXIIb) pueden prepararse oxidando compuestos de fórmula (XXXIII). La oxidación generalmente se realiza en un disolvente. Se prefieren los hidrocarburos halogenados, por ejemplo, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; los alcoholes, por ejemplo, metanol o etanol; el ácido fórmico, el ácido acético, el ácido propiónico o el agua.

25 Los ejemplos de los agentes oxidantes apropiados abarcan el peróxido de hidrógeno y el ácido meta-cloroperbenzoico.

La reacción puede realizarse a presión reducida, a la presión convencional o a presión elevada, y a temperaturas de -20 °C a 120 °C.

Los compuestos de fórmula (XXXIIa) pueden prepararse de manera análoga, oxidando compuestos de fórmula (XXXIII).

30 Los compuestos de fórmula (XXXIIa) pueden prepararse de manera análoga, oxidando compuestos de fórmula (XXXIIb).

Etapa c)

Los compuestos de fórmula (XXXIV) donde n es 2 pueden prepararse hidrolizando compuestos de fórmula (XXXIIa) en presencia de una base. La hidrólisis generalmente se realiza en un disolvente. Se prefieren los alcoholes, por ejemplo, metanol o etanol; el agua; los éteres, por ejemplo, éter diisopropílico, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, éter metil terbutílico; los nitrilos, por ejemplo, acetonitrilo o propionitrilo; los hidrocarburos aromáticos, por ejemplo, tolueno o xileno; los disolventes apróticos polares, por ejemplo, N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona o dimetil sulfóxido; o las mezclas de los disolventes mencionados.

40 Los ejemplos de las bases apropiadas abarcan las bases inorgánicas del grupo que consiste en los acetatos, los fosfatos y los carbonatos de metales alcalinos o metales alcalinotérreos. Se prefiere el carbonato de cesio, el carbonato de sodio y el carbonato de potasio.

La reacción puede realizarse a presión reducida, a la presión convencional o a presión elevada, y a temperaturas de -20 °C a 200 °C.

45 Los compuestos de fórmula (XXXIV) donde n es 0 pueden prepararse de manera análoga, hidrolizando compuestos de fórmula (XXXII).

Los compuestos de fórmula (XXXIV) donde n es 1 pueden prepararse de manera análoga, hidrolizando compuestos de fórmula (XXXIIb).

La conversión de los compuestos de fórmula (XXXIV) en los compuestos de fórmula (I) se realiza de manera análoga al procedimiento A-1.

50 **Etapa d)**

Los compuestos de fórmula (XXXV) pueden prepararse haciendo reaccionar compuestos de fórmula (II) con ácidos carboxílicos de fórmula (XXXIV) en presencia de un agente de condensación o una base.

Los compuestos de fórmula (II) están disponibles en el mercado o pueden prepararse con procedimientos conocidos, por ejemplo, de manera análoga a los procedimientos que se describen en los documentos US2003/069257, 5 US2012/0319050, WO2011/107998 o WO2010/91310.

La reacción de los compuestos de fórmula (II) con los ácidos carboxílicos de fórmula (XXXIV) donde n es 0, 1 o 2 puede efectuarse sin otros componentes o en un disolvente, y la reacción preferentemente se efectúa en un disolvente que se selecciona de los disolventes habituales que son inertes en las condiciones preponderantes de la reacción. Se prefieren los éteres, por ejemplo, éter diisopropílico, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano; los hidrocarburos halogenados, por ejemplo, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; los nitrilos, por ejemplo, acetonitrilo o propionitrilo; los hidrocarburos aromáticos, por ejemplo, tolueno o xileno; los disolventes apróticos polares, por ejemplo, N,N-dimetilformamida o N-metilpirrolidona; o los compuestos que contienen nitrógeno, por ejemplo, piridina.

10 Los agentes de condensación apropiados abarcan, por ejemplo, las carbodiimidas, por ejemplo, clorhidrato de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida (EDCI), 1,3-diciclohexilcarbodiimida, cloruro de tionilo o cloruro de oxalilo.

15 Las bases apropiadas abarcan las bases inorgánicas que suelen usarse en estas reacciones. Se prefiere el uso de bases que pueden seleccionarse, por ejemplo, del grupo que consiste en los acetatos, los fosfatos, los carbonatos y los hidrógenocarbonatos de metales alcalinos o metales alcalinotérreos. En particular, se prefiere el acetato de sodio, el fosfato de sodio, el fosfato de potasio, el carbonato de cesio, el carbonato de sodio, el carbonato de potasio, el hidrógenocarbonato de sodio y el hidrógenocarbonato de potasio. Otras bases apropiadas abarcan los hidruros de metales alcalinos, por ejemplo, hidruro de sodio.

20 La reacción puede efectuarse a presión reducida, a la presión convencional o a presión elevada, y a temperaturas de 0 °C a 180 °C; preferentemente, la reacción se realiza a la presión convencional y a temperaturas de 20 °C a 140 °C.

Etapa e)

25 Los compuestos de fórmula (I) donde n es 0, 1 o 2 pueden prepararse condensando compuestos de fórmula (XXXV) en presencia de una base.

30 La conversión en los compuestos de fórmula (I) donde n es 0, 1 o 2 puede efectuarse sin otros componentes o en un disolvente, y la reacción preferentemente se efectúa en un disolvente que se selecciona de los disolventes habituales que son inertes en las condiciones preponderantes de la reacción. Se prefieren los éteres, por ejemplo, éter diisopropílico, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, éter metil terbutílico; los hidrocarburos halogenados, por ejemplo, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; los nitrilos, por ejemplo, acetonitrilo o propionitrilo; los hidrocarburos aromáticos, por ejemplo, tolueno o xileno; los disolventes apróticos polares, por ejemplo, N,N-dimetilformamida o N-metilpirrolidona; o los compuestos que contienen nitrógeno, por ejemplo, piridina.

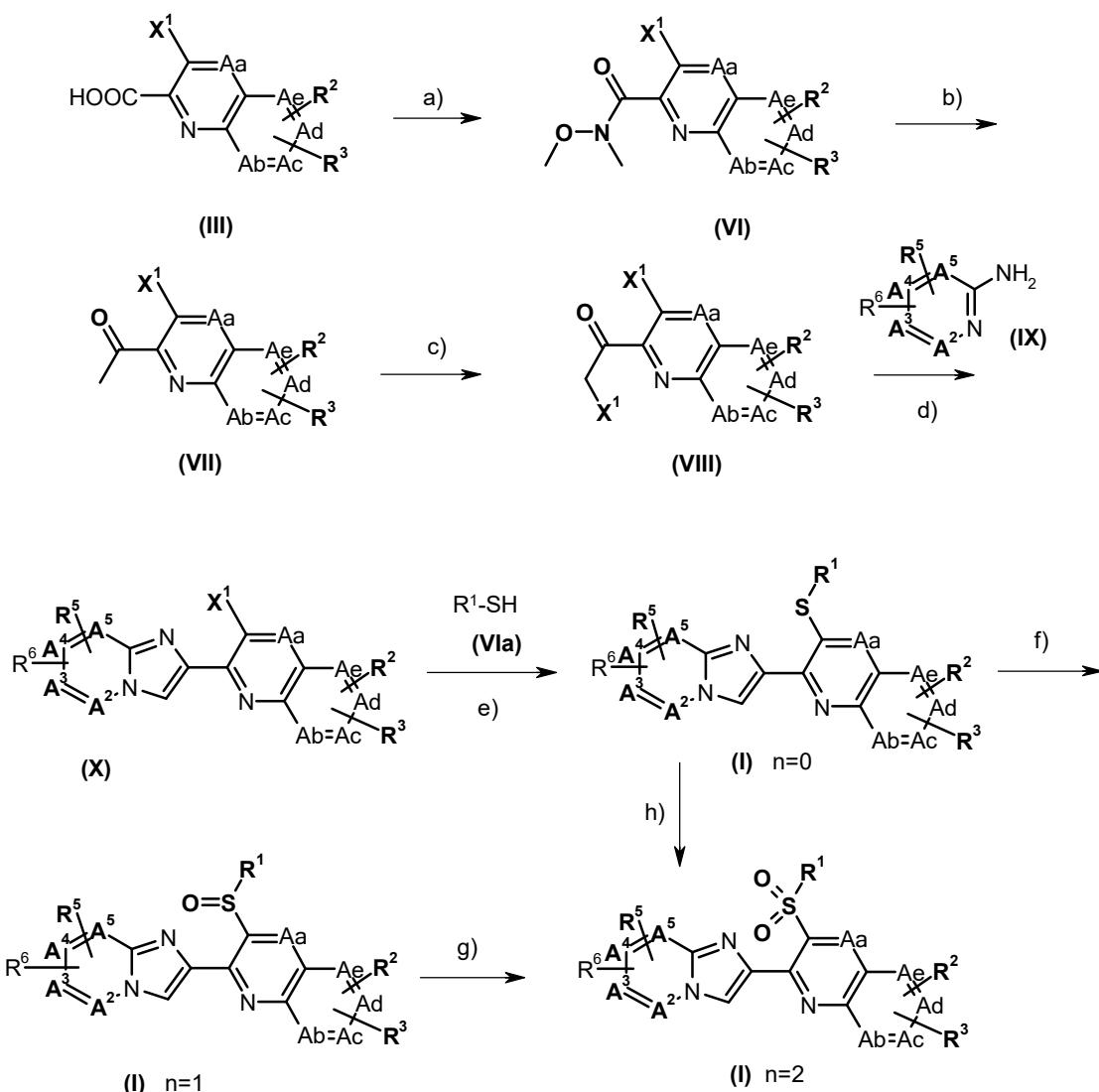
35 Las bases apropiadas abarcan las bases inorgánicas que suelen usarse en estas reacciones. Se prefiere el uso de bases que pueden seleccionarse, por ejemplo, del grupo que consiste en los acetatos, los fosfatos, los carbonatos y los hidrógenocarbonatos de metales alcalinos o metales alcalinotérreos. En particular, se prefiere el acetato de sodio, el fosfato de sodio, el fosfato de potasio, el carbonato de cesio, el carbonato de sodio, el carbonato de potasio, el hidrógenocarbonato de sodio y el hidrógenocarbonato de potasio.

40 La reacción puede realizarse a presión reducida, a la presión convencional o a presión elevada, y a temperaturas de 0 °C a 200 °C.

Los compuestos de fórmula (I') en los que Q es Q1 a Q9 o Q20 también pueden prepararse de manera análoga al procedimiento A-2.

Procedimiento B

45 Los compuestos de fórmula (I) en los que Q es Q10, Q11, Q15 y Q16 pueden prepararse con procedimientos conocidos, por ejemplo, de manera análoga a los procedimientos que se describen en los documentos US2009/203705, US2012/258951, WO2013/3298, WO2016/071214 o J. Med. Chem. 31, (1988) 1590-1595.



Los restos R^1 , R^2 , R^3 , R^5 , R^6 , Aa , Ab , Ac , Ad , Ae y n tienen las definiciones que se detallaron con anterioridad. A^2 , A^3 , A^4 y A^5 son CH o N (donde A^2 , A^3 , A^4 y A^5 no son todos N) y X^1 es un halógeno.

Etapa a)

- 5 Los ácidos carboxílicos de fórmula (III) son convertidos de manera análoga al procedimiento que se describe en el documento WO2011/75643 o el documento EP2671582, en presencia de clorhidrato de O,N -dimetilhidroxilamina, en las amidas de Weinreb de fórmula (VI).

Los ácidos carboxílicos de fórmula (III) están disponibles en el mercado o pueden prepararse con procedimientos conocidos. Las rutas de preparación posibles se describen en el procedimiento F.

10 **Etapa b, c)**

Los compuestos de fórmula (VI) luego pueden ser convertidos con procedimientos conocidos, por ejemplo, de manera análoga al procedimiento que se describe en el documento WO2011/75643, con un reactivo de Grignard, por ejemplo, bromuro de metilmagnesio, en las cetonas de fórmula (VII). Los compuestos de fórmula (VIII) pueden obtenerse con una halogenación subsiguiente, por ejemplo, de manera análoga al procedimiento conocido que se describe en el documento US2012/302573.

Etapa d)

20 Los compuestos de fórmula (X) pueden prepararse ciclando compuestos de fórmula (VIII) con aminas de fórmula (IX). El ciclado se efectúa, por ejemplo, en etanol, acetonitrilo o N,N -dimetilformamida, con procedimientos conocidos, por ejemplo, de manera análoga a los procedimientos que se describen en los documentos WO2005/66177, WO2012/88411, WO2013/3298, US2009/203705, US2012/258951, WO2012/168733, WO2014/187762 o J. Med. Chem. 31 (1988) 1590-1595.

Los compuestos de fórmula (IX) están disponibles en el mercado.

Etapa e)

Los compuestos de fórmula (I) donde n es 0 pueden prepararse haciendo reaccionar los compuestos de fórmula (X) con los compuestos de fórmula (Vla) en presencia de una base. Los derivados de mercaptano de fórmula (Vla), por ejemplo, metil mercaptano, etil mercaptano o isopropil mercaptano, están disponibles en el mercado o pueden prepararse con procedimientos conocidos, por ejemplo, de manera análoga a los procedimientos que se describen en los documentos US2006/25633, US2006/111591, US2820062, en Chemical Communications, 13 (2000), 1163-1164 o en Journal of the American Chemical Society, 44 (1922), pág. 1329.

Como alternativa, pueden usarse directamente sales de derivados de mercaptano, por ejemplo, etanotiolato de sodio, metanotiolato de sodio o isopropanotiolato de sodio, sin la adición de una base adicional.

Etapa f, g)

Los compuestos de fórmula (I) donde n es 1 pueden prepararse oxidando compuestos de fórmula (I) donde n es 0. La oxidación se efectúa con procedimientos conocidos, usando un agente oxidante apropiado, por ejemplo, peróxido de hidrógeno, ácido meta-cloroperbenzoico o periodato de sodio.

15 Los compuestos de fórmula (I) donde n es 2 pueden prepararse oxidando compuestos de fórmula (I) donde n es 1.

La oxidación generalmente se realiza en un disolvente. Se prefieren los hidrocarburos halogenados, por ejemplo, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; los alcoholes, por ejemplo, metanol o etanol; el ácido fórmico, el ácido acético, el ácido propiónico o el agua. Los ejemplos de los agentes oxidantes apropiados abarcan el peróxido de hidrógeno y el ácido meta-cloroperbenzoico.

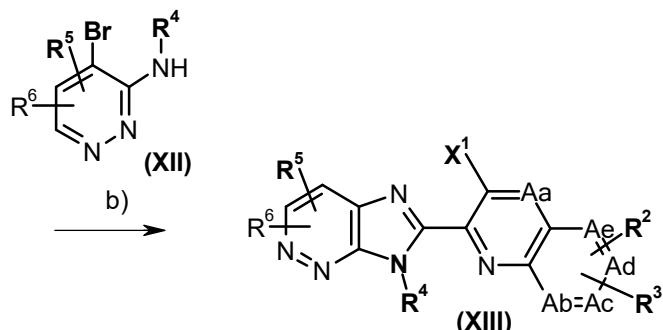
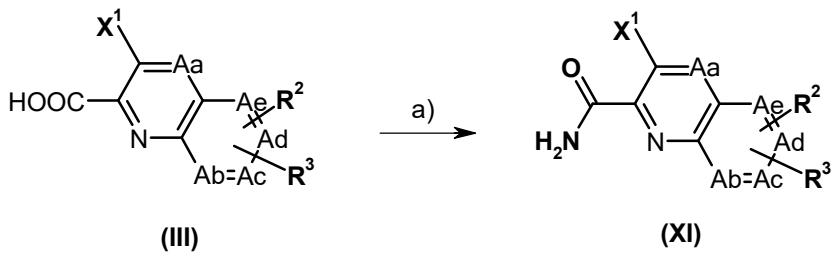
20 **Etapa h)**

Los compuestos de fórmula (I) donde n es 2 también pueden prepararse en un procedimiento con una etapa, oxidando compuestos de fórmula (I) donde n es 0. La oxidación generalmente se realiza en un disolvente. Se prefieren los hidrocarburos halogenados, por ejemplo, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; los alcoholes, por ejemplo, metanol o etanol; ácido fórmico, ácido acético, ácido propiónico o agua. Los ejemplos de los agentes oxidantes apropiados abarcan el peróxido de hidrógeno y el ácido meta-cloroperbenzoico.

25 Los compuestos de fórmula (I') en los que Q es Q10, Q11, Q15 y Q16 también pueden prepararse de manera análoga al procedimiento B.

Procedimiento C

30 Los compuestos de fórmula (I) en los que Q es Q17 pueden prepararse con procedimientos conocidos, por ejemplo, de manera análoga a los procedimientos que se describen en el documento WO2014/142292.



Los restos R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, Aa, Ab, Ac, Ad y Ae tienen las definiciones que se detallaron con anterioridad. X¹ es un

halógeno.

Etapa a)

Los compuestos de fórmula (XI) pueden prepararse de manera análoga al procedimiento que se describe en el documento US5374646 o Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters 2003, 13, 1093-1096, haciendo reaccionar los compuestos de fórmula (III) con una fuente de amoníaco en presencia de un agente de condensación.

5 Los ácidos carboxílicos de fórmula (III) están disponibles en el mercado o pueden prepararse con procedimientos conocidos. Las rutas de preparación posibles abarcan como se describe en el procedimiento F.

10 La reacción de los compuestos de fórmula (III) con la fuente de amoníaco preferentemente se realiza en un disolvente que se selecciona de los disolventes habituales que son inertes en las condiciones preponderantes de la reacción. Se prefieren los éteres, por ejemplo, dioxano o tetrahidrofurano.

15 Un agente de condensación apropiado es, por ejemplo, el carbonildiimidazol.

La reacción puede realizarse a presión reducida, a la presión atmosférica o a presión elevada. Preferentemente, la reacción se realiza a la presión atmosférica y a temperaturas de 20 °C a 70 °C.

Etapa b)

15 Los compuestos de fórmula (XIII) pueden prepararse de manera análoga al procedimiento que se describe en el documento WO2014/142292, haciendo reaccionar compuestos de fórmula (XI) con compuestos de fórmula (XII) en presencia de un catalizador con paladio en un medio básico.

20 Los compuestos de fórmula (XII) pueden prepararse, por ejemplo, de manera análoga a los procedimientos que se describen en el documento WO2014/142292. El catalizador con paladio usado puede ser, por ejemplo, el [1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno]dicloropaladio(II). Suelen usarse bases inorgánicas, por ejemplo, terbutóxido de potasio.

25 La reacción se efectúa en un disolvente. Suele usarse tolueno.

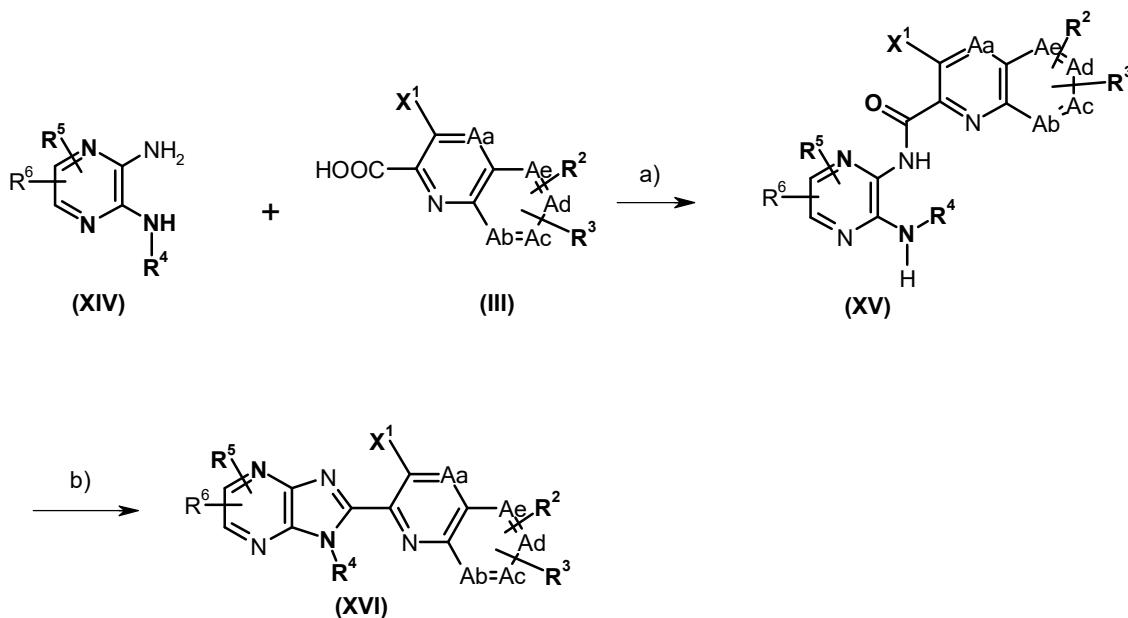
La reacción puede realizarse a presión reducida, a la presión convencional o a presión elevada. Preferentemente, la reacción se realiza a la presión atmosférica y a temperaturas de 20 °C a 110 °C.

25 La conversión de los compuestos de fórmula (XIII) en los compuestos de fórmula (I) se realiza de manera análoga al procedimiento A.

30 Los compuestos de fórmula (I') en los que Q es Q17 también pueden prepararse de manera análoga al procedimiento C.

Procedimiento D

30 Los compuestos de fórmula (I) en los que Q es Q14 pueden prepararse con procedimientos conocidos, por ejemplo, de manera análoga a los procedimientos que se describen en el documento WO2011/073149.



Los restos R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, Aa, Ab, Ac, Ad y Ae tienen las definiciones que se detallaron con anterioridad. X¹ es un halógeno.

Etapa a)

Los compuestos de fórmula (XV) pueden prepararse de manera análoga al procedimiento que se describe en los documentos WO2011/073149 o US5576335, haciendo reaccionar los compuestos de fórmula (XIV) con un ácido carboxílico de fórmula (III) en presencia de un agente de condensación o una base.

Los compuestos de fórmula (XIV) están disponibles en el mercado o pueden prepararse con procedimientos conocidos, por ejemplo, de manera análoga a los procedimientos que se describen en los documentos WO2008/51493 o Bioorganic and Medicinal Chemistry 2014, 22, 13, 3515-3526.

10 Los ácidos carboxílicos de fórmula (III) están disponibles en el mercado o pueden prepararse con procedimientos conocidos. Las rutas de preparación posibles abarcan como se describe en el procedimiento F.

La reacción de los compuestos de fórmula (XIV) con los ácidos carboxílicos de fórmula (III) puede efectuarse sin otros componentes o en un disolvente, y la reacción preferentemente se efectúa en un disolvente que se selecciona de los disolventes habituales que son inertes en las condiciones preponderantes de la reacción. Se prefieren los éteres, por ejemplo, éter diisopropílico, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano; los hidrocarburos halogenados, por ejemplo,

15 díclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; los nitrilos, por ejemplo, acetonitrilo o propionitrilo; los hidrocarburos aromáticos, por ejemplo, tolueno o xileno; los disolventes apróticos polares, por ejemplo, N,N-dimetilformamida o N-metilpirrolidona; o los compuestos que contienen nitrógeno, por ejemplo, piridina.

20 Los agentes de condensación apropiados abarcan, por ejemplo, las carbodiimidas, por ejemplo, clorhidrato de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etylcarbodiimida (EDCI) o 1,3-diciclohexilcarbodiimida.

Las bases apropiadas abarcan las bases inorgánicas que suelen usarse en estas reacciones. Se prefiere el uso de bases que pueden seleccionarse, por ejemplo, del grupo que consiste en los acetatos, los fosfatos, los carbonatos y los hidrógenocarbonatos de metales alcalinos o metales alcalinotérreos. En particular, se prefiere el acetato de sodio,

25 el fosfato de sodio, el fosfato de potasio, el carbonato de cesio, el carbonato de sodio, el carbonato de potasio, el hidrógenocarbonato de sodio y el hidrógenocarbonato de potasio.

La reacción puede efectuarse a presión reducida, a la presión convencional o a presión elevada, y a temperaturas de 0 °C a 180 °C; preferentemente, la reacción se realiza a la presión convencional y a temperaturas de 20 °C a 140 °C.

Etapa b)

30 Los compuestos de fórmula (XVI) pueden prepararse condensando compuestos de fórmula (XV), por ejemplo, de manera análoga a los procedimientos que se describen en los documentos WO2009/131237, WO2010/125985, WO2011/043404, WO2011/040629, WO2012/086848, WO2013/018928 o WO2015/000715.

La conversión en los compuestos de fórmula (XVI) puede efectuarse sin otros componentes o en un disolvente, y la reacción preferentemente se efectúa en un disolvente que se selecciona de los disolventes habituales que son inertes

35 en las condiciones preponderantes de la reacción. Se prefieren los éteres, por ejemplo, éter diisopropílico, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, éter metil terbutílico; los hidrocarburos halogenados, por ejemplo, díclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; los nitrilos, por ejemplo, acetonitrilo o propionitrilo; los hidrocarburos aromáticos, por ejemplo, tolueno o xileno; los disolventes apróticos polares, por ejemplo, N,N-dimetilformamida o N-metilpirrolidona; o los compuestos que contienen nitrógeno, por ejemplo, piridina.

40 La reacción puede realizarse en presencia de un agente de condensación, un ácido, una base o un agente de cloración.

Los ejemplos de los agentes de condensación apropiados abarcan las carbodiimidas, por ejemplo, clorhidrato de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etylcarbodiimida (EDCI) o 1,3-diciclohexilcarbodiimida; los anhídridos, por ejemplo, anhídrido acético, anhídrido trifluoroacético; una mezcla de trifenilfosfina, una base y tetracloruro de carbono o una mezcla de trifenilfosfina y un azo diéster, por ejemplo, ácido dietilazodicarboxílico.

45 Los ejemplos de los ácidos apropiados que pueden usarse en esta reacción abarcan los ácidos sulfónicos, por ejemplo, ácido para-toluenosulfónico; los ácidos carboxílicos, por ejemplo, ácido acético; o los ácidos polifósforicos.

50 Los ejemplos de las bases apropiadas abarcan los heterociclos que contienen nitrógeno, por ejemplo, piridina, picolina, 2,6-lutidina, 1,8-diazabiciclo[5.4.0]-7-undeceno (DBU); las aminas terciarias, por ejemplo, trietilamina o N,N-diisopropiletilamina; las bases inorgánicas, por ejemplo, fosfato de potasio, carbonato de potasio o hidruro de sodio.

Un ejemplo de un agente de cloración apropiado es el oxicloruro de fósforo.

La reacción puede realizarse a presión reducida, a la presión convencional o a presión elevada, y a temperaturas de

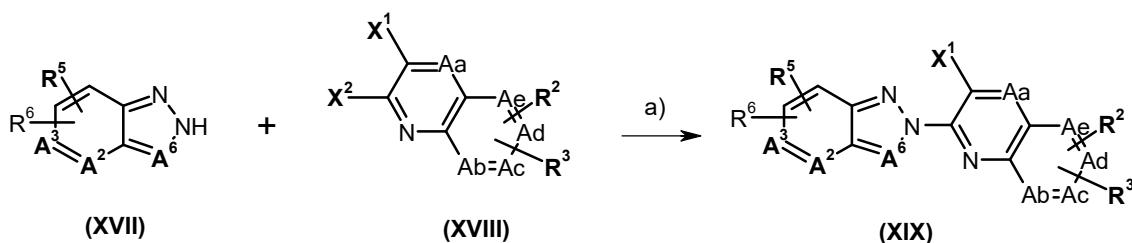
0 °C a 200 °C.

La conversión de los compuestos de fórmula (XVI) en los compuestos de fórmula (I) se realiza de manera análoga al procedimiento A.

5 Los compuestos de fórmula (I') en los que Q es Q14 también pueden prepararse de manera análoga al procedimiento D.

Procedimiento E

Los compuestos de fórmula (I) en los que Q es Q12, Q13, Q18 y Q19 pueden prepararse con procedimientos conocidos, por ejemplo, de manera análoga a los procedimientos que se describen en los documentos WO2010/091310, WO 2012/66061 o WO2013/099041.



Los restos R^2 , R^3 , R^5 , R^6 , Aa, Ab, Ac, Ad y Ae tienen las definiciones que se detallaron con anterioridad. A^2 , A^3 y A^6 son CH o N (donde A^2 y A^3 no pueden ser ambos N). X^1 y X^2 son halógenos.

Etapa a)

Los compuestos de fórmula (XIX) pueden prepararse haciendo reaccionar compuestos de fórmula (XVII) con compuestos de fórmula (XVIII) en condiciones básicas, por ejemplo, de manera análoga a los procedimientos que se describen en los documentos WO2010/091310, WO 2012/66061, WO2013/099041 o Tetrahedron 1993, 49, 10997-11008.

Los compuestos de fórmula (XVII) están disponibles en el mercado o pueden prepararse con procedimientos conocidos, por ejemplo, de manera análoga a los procedimientos que se describen en los documentos WO2005/100353, WO 2012/66061 o en European Journal of Medicinal Chemistry 2010, 45, 2214-2222.

Los compuestos de fórmula (XVIII) están disponibles en el mercado o pueden prepararse con procedimientos conocidos, por ejemplo, de manera análoga a los procedimientos que se describen en los documentos WO2013/43518, EP2168965 o en *Journal of Medicinal Chemistry* 2003, 46, 1449-1455.

Las bases que se emplean suelen ser bases inorgánicas, por ejemplo, hidruro de sodio, carbonato de potasio o carbonato de cesio.

La conversión en los compuestos de fórmula (XIX) usualmente se efectúa en un disolvente, preferentemente en un nitrilo, por ejemplo, acetonitrilo o propionitrilo, o en un disolvente aprótico polar, por ejemplo, N,N-dimetilformamida o N-metilpirrolidona.

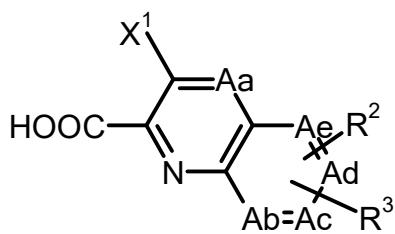
La reacción puede realizarse a presión reducida, a la presión convencional o a presión elevada, y a temperaturas de 0 °C a 200 °C.

Como alternativa, la reacción de los compuestos de fórmula (XVII) con los compuestos de fórmula (XVIII) para obtener los compuestos de fórmula (XIX) también puede basarse en una N-ariilación catalizada con paladio, por ejemplo, de manera análoga a los procedimientos que se describen en *Angewandte Chemie Int. Ed.* 2011, 50, 8944-8947.

La conversión de los compuestos de fórmula (XIX) en los compuestos de fórmula (I) se efectúa de manera análoga al procedimiento A.

Los compuestos de fórmula (I') en los que Q es Q12, Q13, Q18 y Q19 también pueden prepararse de manera análoga al procedimiento E.

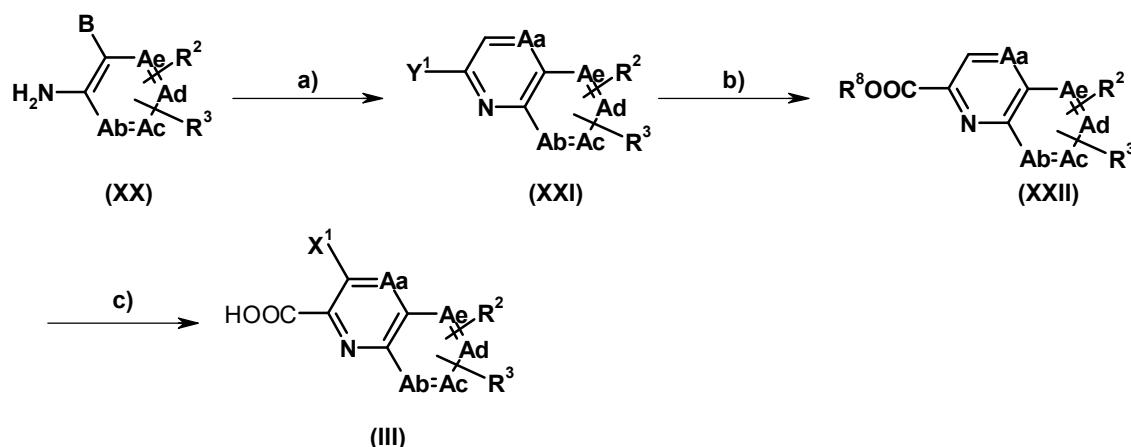
Procedimiento F-1



(III)

Los ácidos carboxílicos de fórmula (III) están disponibles en el mercado o pueden prepararse con procedimientos conocidos, por ejemplo, a partir de derivados de aminoarilo, diaminoarilo, aminohetarilo o diaminohetarilo, de manera análoga a los procedimientos que se describen en *Journal of the American Chemical Society*, 137 (2015), 6168-6171;

- 5 *Journal of the American Chemical Society*, 137 (2015), 2996-3003; *Synlett*, 3 (2006), 379-382; *Organic Letters*, 14, (2012), 836-839; *Indian Journal of Chemistry, sección B: Organic Chemistry, incluyendo Medicinal Chemistry*, 22B (1983), 178-179; *Journal of Organic Chemistry*, 55 (1990), 2838-2842; *Tetrahedron Letters*, 41 (2000), 8053-8057; US2013/0225552; *Organic Reactions* (Hoboken, NJ, EEUU), 28, 1982; WO2011/150156; JP2009/173589; *Synthetic Communications* 41 (2011), 1843-1851; *Journal of the Chemical Society*, (1954), 1879-1882; *Heterocycles*, 60 (2003), 953-957; *Organic & Biomolecular Chemistry*, 5 (2007), 61-64; *Chemical Communications*, 2 (2002), 180-181; *Tetrahedron Letters*, 48 (2007), 5371-5374; *Chemistry – A European Journal*, 20 (2014), 5569-5572; CN103420927; *Medicinal Chemistry Research*, 22 (2013), 1660-1673; *Medicinal Chemistry Letters*, 6 (2015), 282-286 y en el documento WO2015/071178.



- 15 Los restos R², R³, Aa, Ab, Ac, Ad y Ae tienen las definiciones que se detallaron con anterioridad. B es hidrógeno, halógeno, NH₂ o CHO. X¹ es halógeno y Y¹ es halógeno, metilo, C(O)OR⁸ o ciano. R⁸ es hidrógeno o alquilo C₁-C₆.

Etapa a)

- 20 Los compuestos de fórmula (XXI) en los que Aa es N pueden prepararse de manera análoga a los procedimientos que se describen en *Tetrahedron Letters*, 48 (2007), 5371-5374; *Chemistry – A European Journal*, 20 (2014), 5569-5572; CN103420927; *Medicinal Chemistry Research*, 22 (2013), 1660-1673; *Medicinal Chemistry Letters*, 6 (2015), 282-286, haciendo reaccionar los compuestos de fórmula (XX) donde B es NH₂ con un compuesto de carbonilo en condiciones básicas, ácidas o térmicas.

- 25 Los compuestos de fórmula (XXI) en los que Aa es CR⁷ pueden prepararse de manera análoga a los procedimientos que se describen en *Journal of the American Chemical Society*, 137 (2015), 6168-6171; *Journal of the American Chemical Society*, 137 (2015), 2996-3003; *Synlett*, 3 (2006), 379-382; *Organic Letters*, 14, (2012), 836-839; *Tetrahedron Letters*, 41 (2000), 8053-8057; US2013/0225552; *Organic Reactions* (Hoboken, NJ, EEUU), 28, 1982; WO2011/150156; *Synthetic Communications* 41 (2011), 1843-1851; *Journal of the Chemical Society*, (1954), 1879-1882; *Organic & Biomolecular Chemistry*, 5 (2007), 61-64, condensando y ciclando compuestos de fórmula (XX) en los que B es hidrógeno, halógeno o CHO con un compuesto de carbonilo o un derivado de un ácido carboxílico apropiado en condiciones básicas, ácidas o térmicas. La funcionalización adicional en la posición 4 para introducir los restos del tipo de R⁷ (\neq hidrógeno) puede realizarse, por ejemplo, como se describe en el documento WO2013/066736, por medio de una halogenación; como se describe en *Practical Methods for Biocatalysis and Biotransformations* 2, (2012), 153-157, por medio de una hidroxilación; como se describe en *Organometallics*, 9 (1990), 1778-1784, por medio de una alquilación; como se describe en *Journal of Heterocyclic Chemistry*, 22 (1985), 353-355, por medio de una aminación; o como se describe en el documento WO2010/020981, por medio de una nitración.

Los compuestos de fórmula (XX) están disponibles en el mercado o pueden prepararse con procedimientos conocidos, por ejemplo, de manera análoga a los procedimientos que se describen en Chemical Reviews, 12 (1933), 43-179; Chemical Reviews, 57 (1957), 525-581; Journal of Organic Chemistry, 15 (1950), 1224-1232; Recueil Travaux Chimiques des Pays-Bas et de la Belgique, 69 (1950), 468-673; Journal of Chemical Technology and Biotechnology, 37 (1987), 195-202; el documento WO2012/117000; Chemistry – A European Journal, 18 (2012), 16358-16368; Journal of Organic Chemistry, 48 (1983), 1064-1069; Organic Synthesis, 44 (1964), 34-39; Journal of Heterocyclic Chemistry, 23 (1986), 669-672; Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, 18 (2008), 5023-5026; Journal of Organic Chemistry, 48 (1983), 3401-3408; Journal of Heterocyclic Chemistry, 48 (2011), 1383-1387; el documento WO2003/051366; Helvetica Chimica Acta, 18 (1935), 1229-1239; Synthesis, 1 (1978), 23-24; Organic Synthesis, 19 (1939), 70-72; Canadian Journal of Chemistry, 38 (1960), 2363-2366; Journal of Organic Chemistry, 42 (1977), 3491-3496.

Etapa b)

Los compuestos de fórmula (XXII) pueden prepararse con procedimientos conocidos, por ejemplo, hidrolizando compuestos de fórmula (XXI) (si $Y^1 = C(O)OR^8$ o ciano) en condiciones básicas, ácidas o térmicas.

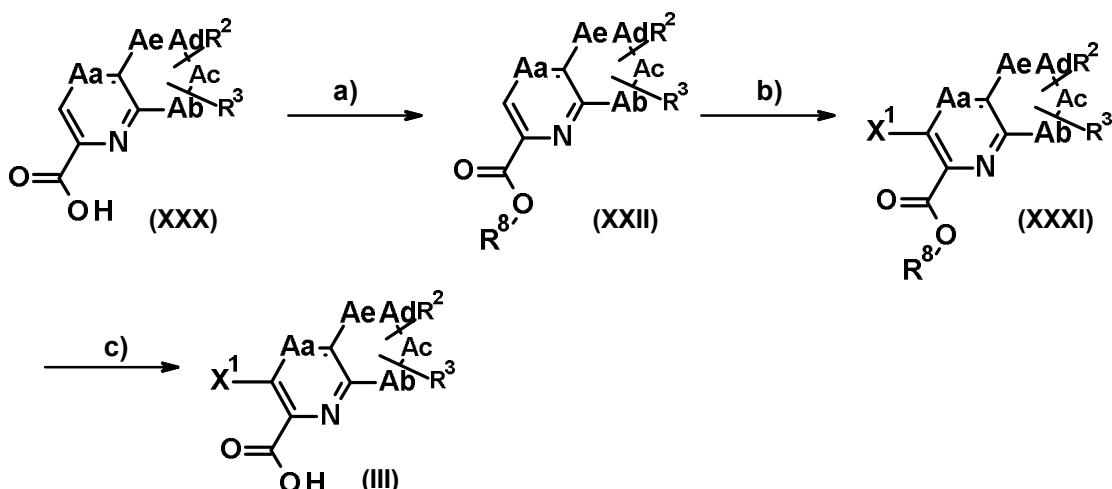
- 15 Los compuestos de fórmula (XXII) pueden prepararse de manera análoga a los procedimientos que se describen en Synlett, 3 (2006), 379-382; Indian Journal of Chemistry, sección B: Organic Chemistry, incluyendo Medicinal Chemistry, 22B (1983), 178-179; Journal of Organic Chemistry, 55 (1990), 2838-2842; Heterocycles, 60 (2003), 953-957; Chemical Communications, 2 (2002), 180-181 y en el documento WO2015/071178, sometiendo compuestos de fórmula (XXI) (si $Y^1 =$ metilo) a una oxidación bencílica.
- 20 Los compuestos de fórmula (XXII) pueden prepararse de manera análoga a los procedimientos que se describen en Journal of the American Chemical Society, 135 (2013), 2891-2894; Synlett, 11 (2006), 1663-1666; Helvetica Chimica Acta, 55 (1972), 2295-2300; WO2013/149997 y European Journal of Organic Chemistry, 29 (2014), 6418-6430, sometiendo compuestos de fórmula (XXI) (si $Y^1 =$ halógeno) a una carbonilación ($R^8 =$ alquilo) o una carboxilación ($R^8 =$ hidrógeno).

Etapa c)

- 30 Los compuestos de fórmula (III) pueden prepararse con procedimientos conocidos, halogenando compuestos de fórmula (XXII). Esto puede efectuarse, por ejemplo, por medio de una orto-litacióndirigida, seguida por la captura del carbanión con un reactivo halogenante electrófilo apropiado, o como alternativa, por medio de una halogenación dirigida con un derivado de un ácido carboxílico, de manera análoga a los procedimientos que se describen en Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, 24 (2014), 4236-4238; Tetrahedron, 58 (2002), 6723-6728 y en el documento WO2003/010146.

- 35 Si R^8 es alquilo C₁-C₆, después de la halogenación, los ésteres carboxílicos de fórmula (XXII) pueden hidrolizarse en condiciones ácidas o básicas en un disolvente protíco polar, por ejemplo, etanol o metanol, o en un disolvente aprótico polar, por ejemplo, tetrahidrofurano, usando, por ejemplo, ácido clorhídrico o un hidróxido de un metal alcalino diluido, para obtener los ácidos carboxílicos de fórmula (III).

Procedimiento F-2



Los restos R^2 , R^3 , Aa , Ab , Ac , Ad y Ae tienen las definiciones que se detallaron con anterioridad. X^1 es halógeno. R^8 es alquilo C₁-C₆.

Etapa a)

Los compuestos de fórmula (XXII) están disponibles en el mercado o pueden obtenerse de manera análoga a los procedimientos que se describen en ChemSusChem 2015, 8, 1916-1925, Chemical Engineering Journal 2015, 271, 269-275, Catalysis Communications 2015, 59, 122-126, Synthetic Communications 2014, 44, 2386-2392, Synthetic

5 Communications 2014, 44, 836-846, Journal of Organic Chemistry 2013, 78, 11606-11611, Organic Letters 2011, 13, 320-323 y Journal of the American Chemical Society 1948, 70, 3135-3136, esterificando o alquilando ácidos carboxílicos de fórmula (XXX) en condiciones ácidas o neutras.

Los compuestos de fórmula (XXX) están disponibles en el mercado o pueden prepararse hidrolizando compuestos de fórmula (XXII).

10 La reacción puede efectuarse a presión reducida, a la presión convencional o a presión elevada, y a temperaturas de 0 °C a 180 °C; preferentemente, la reacción se realiza a la presión convencional y a temperaturas de 20 °C a 140 °C.

Etapa b)

Los compuestos de fórmula (XXXI) pueden prepararse con procedimientos conocidos, halogenando compuestos de fórmula (XXII). Esto puede efectuarse, por ejemplo, por medio de una orto-litiazación dirigida, seguida por la captura del carbanión con un reactivo halogenante electrófilo apropiado, o como alternativa, por medio de una halogenación

15 dirigida con un derivado de un ácido carboxílico, de manera análoga a los procedimientos que se describen en Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, 24 (2014), 4236-4238; Tetrahedron, 58 (2002), 6723-6728 y el documento WO2003/010146.

Etapa c)

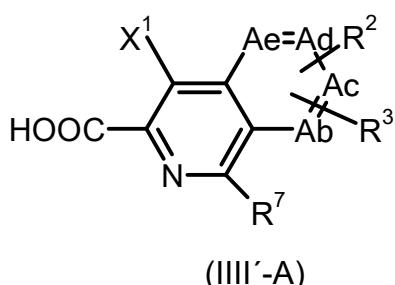
20 Los compuestos de fórmula (III) están disponibles en el mercado o pueden sintetizarse de manera análoga a los procedimientos que se describen en Synthesis 1987, 6, 586-587, Tetrahedron Letters 2006, 47, 565-567 o ChemMedChem 2010, 5, 65-78, hidrolizando compuestos de fórmula (XXXI).

Como alternativa, los derivados de quinolina de fórmula (III) también pueden prepararse de manera análoga a los procedimientos que se describen en Organic Reactions (Hoboken, NJ, EE.UU.), 28, 1982 y Journal of Organic Chemistry 2016, 81, 57-65, expandiendo los anillos de los derivados de indol correspondientes.

Los ejemplos de las bases apropiadas abarcan el hidróxido de litio y el hidróxido de sodio. Pueden usarse disolventes polares apróticos o próticos o mezclas de estos, por ejemplo, etanol, tetrahidrofurano o agua.

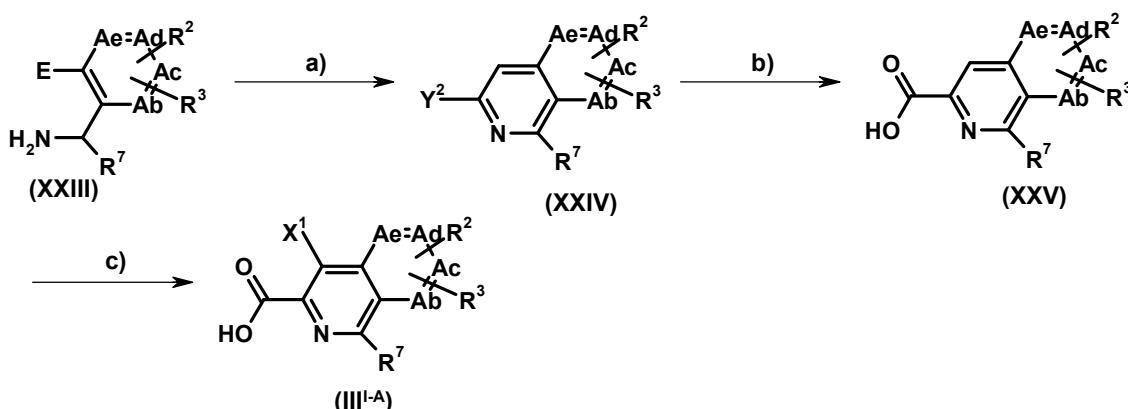
La reacción puede realizarse a presión reducida, a la presión convencional o a presión elevada, y a temperaturas de -20 °C a 120 °C.

30 **Procedimiento G-1**



Los ácidos carboxílicos de fórmula (III'-A) están disponibles en el mercado o pueden prepararse con procedimientos conocidos, por ejemplo, a partir de bencilaminas o hetarilmetanaminas, de manera análoga a los procedimientos que se describen en Tetrahedron, 40 (1984), 311-314, Monatshefte für Chemie, 139 (2008), 673-684, Synlett, 3 (2006),

35 379-382; Indian Journal of Chemistry, sección B: Organic Chemistry, incluyendo Medicinal Chemistry, 22B (1983), 178-179; Journal of Organic Chemistry, 55 (1990), 2838-2842; Heterocycles, 60 (2003), 953-957; Chemical Communications, 2 (2002), 180-181, WO2015/071178, Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, 24 (2014), 4236-4238; Tetrahedron, 58 (2002), 6723-6728 y en el documento WO2003/010146.



Los restos R^2 , R^3 , R^7 , Aa, Ab, Ac, Ad y Ae tienen las definiciones que se detallaron con anterioridad. E es hidrógeno o halógeno y X^1 es halógeno, $C(O)OR^8$ o ciano. R^8 es hidrógeno o alquilo C_1-C_6 .

Etapa a)

- 5 Los compuestos de fórmula (XXIV) pueden sintetizarse de manera análoga a los procedimientos que se describen en Tetrahedron, 40 (1984), 311-314 o Monatshefte für Chemie, 139 (2008), 673-684, condensando bencilaminas o hetarilmelanaminas de fórmula (XXIII) con los compuestos de carbonilo correspondientes en condiciones ácidas o básicas.
- 10 Los compuestos de fórmula (XXIII) están disponibles en el mercado o pueden prepararse con procedimientos conocidos, por ejemplo, de manera análoga a los procedimientos que se describen en los documentos WO1997/41846; US2011/0105753; en Journal of Medicinal Chemistry, 46 (2003), 461-473; en los documentos WO2010/024430; WO2005/111003; en Journal of Heterocyclic Chemistry, 23 (1986), 989-990.

Etapa b)

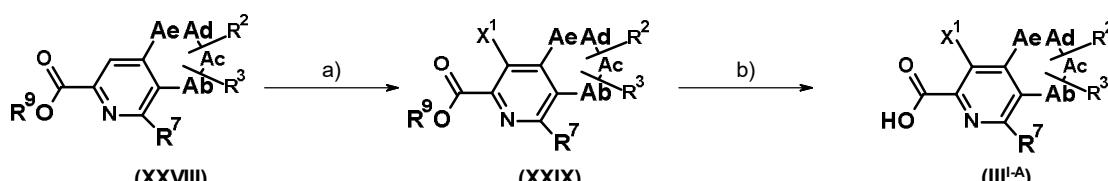
- 15 Los compuestos de fórmula (XXV) pueden prepararse con procedimientos conocidos, por ejemplo, hidrolizando compuestos de fórmula (XXIV) (si $Y^2 = C(O)OR^8$ o ciano) en condiciones básicas, ácidas o térmicas.

- 20 Los compuestos de fórmula (XXV) pueden prepararse de manera análoga a los procedimientos que se describen en Synlett, 3 (2006), 379-382; Indian Journal of Chemistry, sección B: Organic Chemistry, incluyendo Medicinal Chemistry, 22B (1983), 178-179; Journal of Organic Chemistry, 55 (1990), 2838-2842; Heterocycles, 60 (2003), 953-957; Chemical Communications, 2 (2002), 180-181 y en el documento WO2015/071178, sometiendo compuestos de fórmula (XXIV) (si $Y^2 =$ metilo) a una oxidación bencílica.

Etapa c)

- 25 Los compuestos de fórmula (III^{1-A}) pueden prepararse con procedimientos conocidos, halogenando compuestos de fórmula (XXV). Esto puede efectuarse, por ejemplo, por medio de una orto-litación dirigida, seguida por la captura del carbánion con un reactivo halogenante electrófilo apropiado, o como alternativa, por medio de una halogenación dirigida con un derivado de un ácido carboxílico, de manera análoga a los procedimientos que se describen en Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, 24 (2014), 4236-4238; Tetrahedron, 58 (2002), 6723-6728 y en el documento WO2003/010146 (véase el procedimiento F, etapa c).

Procedimiento G-2



- 30 **Etapa a)**

- Los compuestos de fórmula (XXIX) pueden prepararse con procedimientos conocidos, halogenando compuestos de fórmula (XXVIII). Esto puede efectuarse, por ejemplo, por medio de una orto-litación dirigida, seguida por la captura del carbánion con un reactivo halogenante electrófilo apropiado, o como alternativa, por medio de una halogenación electrofílica aromática, de manera análoga a los procedimientos que se describen en Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, 24 (2014), 4236-4238; Tetrahedron, 58 (2002), 6723-6728 y en el documento WO2003/010146 (véase el procedimiento F-1, etapa c). Los compuestos de fórmula (XXVIII) están disponibles en el mercado o pueden

sintetizarse esterificando compuestos de fórmula (XXV).

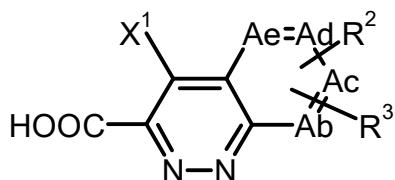
Etapa b)

Los compuestos de fórmula (IIII'-A) pueden sintetizarse de manera análoga a los procedimientos que se describen en Synthesis 1987, 6, 586-587, Tetrahedron Letters 2006, 47, 565-567 o ChemMedChem 2010, 5, 65-78, hidrolizando compuestos de fórmula (XXIX).

Los ejemplos de las bases apropiadas abarcan, por ejemplo, el hidróxido de litio y el hidróxido de sodio. Pueden usarse disolventes polares apróticos o próticos o mezclas de estos, por ejemplo, etanol, tetrahidrofurano o agua.

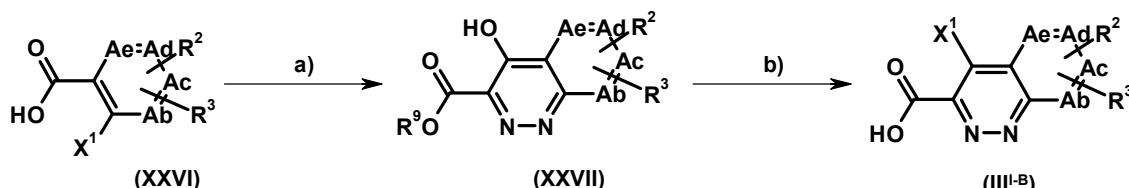
La reacción puede realizarse a presión reducida, a la presión convencional o a presión elevada, y a temperaturas de -20 °C a 120 °C.

10 Procedimiento H



(IIII'-B)

Los ácidos carboxílicos de fórmula (III'-B) están disponibles en el mercado o pueden prepararse con procedimientos conocidos, por ejemplo, a partir de los ácidos haloarilcarboxílicos o los ácidos haloalquilcarboxílicos correspondientes, de manera análoga a los procedimientos que se describen en Science de Synthesis, 16 (2004), 1109-1153 y Journal of Medicinal Chemistry, 58 (2015), 480-511.



Los restos R², R³, Ab, Ac, Ad y Ae tienen las definiciones que se detallaron con anterioridad. X¹ es halógeno. R⁹ es alquilo C₁-C₆.

Etapa a)

20 Los compuestos de fórmula (XXVII) pueden sintetizarse de manera análoga a los procedimientos que se describen en el documento WO2004/039802 o Science of Synthesis, 16 (2004), 1109-1153, acetilando un 2-diazoacetato de alquilo con un compuesto de fórmula (XXVI) y luego realizando una N-ariilación, de manera que se obtenga un sistema bicíclico condensado.

25 Los compuestos de fórmula (XXVI) están disponibles en el mercado o pueden prepararse con procedimientos conocidos, por ejemplo, de manera análoga a los procedimientos que se describen en Synthesis, 47 (2015), 1861-1868; Justus Liebigs Annalen der Chemie, (1893), 54-57; Journal of the American Chemical Society, 65 (1943), 476-477; Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, 24 (2014), 4236-4238; Organic Letters, 10 (2008), 2701-2704; Journal of Pharmacie de Belgique, 22 (1967), 257-263; Journal of Organic Chemistry, 60 (1995), 292-296; Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, 23 (2013), 1846-1852; JP2012/092060; EU1983/92117; Tetrahedron, 71 (2015), 252-258.

Etapa b)

Los compuestos de fórmula (IIII'-B) pueden prepararse con procedimientos conocidos, por ejemplo, sometiendo compuestos de fórmula (XXVII) a una cloración con fósforo, como se describe en Journal of Medicinal Chemistry, 58 (2015), 480-511.

35 Procedimientos y usos

La invención también se refiere a procedimientos para controlar plagas animales, en los cuales se dejan actuar compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') sobre plagas animales y/o su hábitat. El control de las plagas animales preferentemente se lleva a cabo en agricultura y en silvicultura, y en protección de materiales. Esto preferentemente excluye procedimientos para el tratamiento quirúrgico o terapéutico del cuerpo humano o animal y procedimientos

diagnósticos realizados en el cuerpo humano o animal.

La invención además se refiere al uso de los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') como pesticidas, especialmente agentes fitoprotectores.

En el contexto de la presente solicitud, el término "pesticida" en cada caso siempre abarca el término "agente fitoprotector".

Los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I'), debido a la buena tolerancia en plantas, toxicidad homeotérmica favorable y buena compatibilidad ambiental, son adecuados para proteger plantas y órganos de las plantas contra factores estresantes bióticos y abióticos, para aumentar los rendimientos de cosecha, para mejorar la calidad del material cosechado y para controlar plagas animales, especialmente insectos, arácnidos, helmintos, especialmente 10 nematodos y moluscos, que se encuentran en la agricultura, horticultura, ganadería, acuicultura, en bosques, en jardines y en infraestructuras de ocio, en la protección de productos almacenados y de materiales, y en el sector de la higiene.

En el contexto de la presente solicitud de patente, el término "higiene" debe interpretarse que se refiere a todas y cada una de las medidas, disposiciones y procedimientos que tienen como objetivo prevenir enfermedades, especialmente 15 enfermedades infecciosas, y que sirven para proteger la salud de humanos y animales y/o proteger el medio ambiente y/o mantener la limpieza. De acuerdo con la invención, esto incluye especialmente medidas para limpieza, desinfección y esterilización, por ejemplo de textiles y superficies duras, especialmente superficies hechas de vidrio, madera, cemento, porcelana, cerámica, plástico u otros metales, con el objetivo de asegurar que estas estén libres de plagas de la higiene y/o sus secreciones. El alcance de protección de la invención en este sentido preferentemente excluye 20 tratamientos quirúrgicos o terapéuticos para aplicar en el cuerpo humano o en los cuerpos de animales, y procedimientos diagnósticos que se realizan en el cuerpo humano o en los cuerpos de animales.

El término "sector de la higiene" cubre todas las áreas, campos técnicos y aplicaciones industriales en los cuales son 25 importantes las medidas, disposiciones y procedimientos de higiene, por ejemplo respecto a la higiene en cocinas, hornos, aeropuertos, baños, piletas de natación, almacenes, hoteles, hospitales, establos, explotaciones de animales, etc.

El término "plaga de higiene" por lo tanto debe interpretarse que se refiere a una o más plagas animales cuya presencia en el sector de la higiene es problemática, especialmente por razones de salud. Un objetivo principal por lo tanto es evitar, o limitar a un grado mínimo, la presencia de plagas de higiene y/o la exposición a estas en el sector de la higiene. Esto puede lograrse especialmente mediante el uso de un pesticida que puede usarse para la prevención de 30 infestación y para la prevención de una infestación existente. También es posible usar formulaciones que previenen o reducen la exposición a plagas. Las plagas de higiene incluyen, por ejemplo, los organismos mencionados más adelante.

El término "protección de la higiene" por lo tanto cubre todos los actos mediante los cuales se mantienen y/o mejoran estas medidas, disposiciones y procedimientos relacionados con la higiene.

35 Los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') pueden usarse preferentemente como pesticidas. Estos son activos contra especies con sensibilidad normal y resistentes y también contra todos o algunos estadios de desarrollo. Las plagas mencionadas precedentemente incluyen:

plagas del filo de los Arthropoda, especialmente de la clase de los Arachnida, por ejemplo *Acarus* spp., por ejemplo 40 *Acarus* siro, *Aceria* kuko, *Aceria* sheldoni, *Aculops* spp., *Aculus* spp., por ejemplo *Aculus* fockeui, *Aculus* schlechtendali, *Amblyomma* spp., *Amphitetranychus* viennensis, *Argas* spp., *Boophilus* spp., *Brevipalpus* spp., por ejemplo *Brevipalpus* phoenicis, *Bryobia* graminum, *Bryobia* praetiosa, *Centruroides* spp., *Chorioptes* spp., *Dermanyssus* gallinae, *Dermatophagooides* pteronyssinus, *Dermatophagooides* farinae, *Dermacentor* spp., *Eotetranychus* spp., por ejemplo *Eotetranychus* hicorniae, *Epitrimerus* pyri, *Eutetranychus* spp., por ejemplo 45 *Eutetranychus* banksi, *Eriophyes* spp., por ejemplo *Eriophyes* pyri, *Glycyphagus* domesticus, *Halotydeus* destructor, *Hemitarsonemus* spp., por ejemplo *Hemitarsonemus* latus (=*Polyphagotarsonemus* latus), *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Latrodectus* spp., *Loxosceles* spp., *Neutrombicula* autumnalis, *Nuphersa* spp., *Oligonychus* spp., por ejemplo 50 *Oligonychus* coffeae, *Oligonychus* coniferarum, *Oligonychus* ilicis, *Oligonychus* indicus, *Oligonychus* mangiferus, *Oligonychus* pratensis, *Oligonychus* punicae, *Oligonychus* yothersi, *Ornithodoros* spp., *Ornithonyssus* spp., *Panonychus* spp., por ejemplo *Panonychus* citri (=*Metatetranychus* citri), *Panonychus* ulmi (=*Metatetranychus* ulmi), *Phyllocoptuta* oleivora, *Platytranychus* multidigituli, *Polyphagotarsonemus* latus, *Psoroptes* spp., *Rhipicephalus* spp., *Rhizoglyphus* spp., *Sarcoptes* spp., *Scorpio* maurus, *Steneotarsonemus* spp., *Steneotarsonemus* spinki, *Tarsonemus* spp., por ejemplo *Tarsonemus* confusus, *Tarsonemus* pallidus, *Tetranychus* spp., por ejemplo *Tetranychus* canadensis, *Tetranychus* cinnabarinus, *Tetranychus* turkestanii, *Tetranychus* urticae, *Trombicula* alfreddugesi, *Vaejovis* spp., *Vasates* lycopersici;

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

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

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

de la clase de los Insecta, por ejemplo del orden de los Blattodea, por ejemplo *Blatta orientalis*, *Blattella asahinai*, *Blattella germanica*, *Leucophaea maderae*, *Loboptera decipiens*, *Neostylopyga rhombifolia*, *Panchlora* spp., *Parcoblatta* spp., *Periplaneta* spp., por ejemplo *Periplaneta americana*, *Periplaneta australasiae*, *Pycnoscelus surinamensis*, *Supella longipalpa*;

5 del orden de los Coleoptera por ejemplo *Acalymma vittatum*, *Acanthoscelides obtectus*, *Adoretus* spp., *Aethina tumida*, *Agelastica alni*, *Agriotes* spp., por ejemplo *Agriotes lineatus*, *Agriotes mancus*, *Alphitobius diaperinus*, *Amphimallon solstitialis*, *Anobium punctatum*, *Anoplophora* spp., *Anthonomus* spp., por ejemplo *Anthonomus grandis*, *Anthrenus* spp., *Apion* spp., *Apogonia* spp., *Atomaria* spp., por ejemplo *Atomaria linearis*, *Attagenus* spp., *Baris caerulescens*, *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp., por ejemplo *Bruchus pisorum*, *Bruchus rufimanus*, *Cassida* spp., *Cerotoma trifurcata*, *Ceutorhynchus* spp., por ejemplo *Ceutorhynchus assimilis*, *Ceutorhynchus quadridens*, *Ceutorhynchus rapae*, *Chaetocnema* spp., por ejemplo *Chaetocnema confinis*, *Chaetocnema denticulata*, *Chaetocnema ectypa*, *Cleonus mendicus*, *Conoderus* spp., *Cosmopolites* spp., por ejemplo *Cosmopolites sordidus*, *Costelytra zealandica*, *Ctenicera* spp., *Curculio* spp., por ejemplo *Curculio carya*, *Curculio caryatipes*, *Curculio obtusus*, *Curculio sayi*, *Cryptolestes ferrugineus*, *Cryptolestes pusillus*, *Cryptorhynchus lapathi*, *Cryptorhynchus mangiferae*, *Cylindrocopturus* spp., *Cylindrocopturus adspersus*, *Cylindrocopturus furnissi*, *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp., por ejemplo *Diabrotica balteata*, *Diabrotica barberi*, *Diabrotica undecimpunctata howardi*, *Diabrotica undecimpunctata*, *Diabrotica virgifera*, *Diabrotica virgifera zeae*, *Dichocrocis* spp., *Dicladispa armigera*, *Diloboderus* spp., *Epicaerus* spp., *Epilachna* spp., por ejemplo *Epilachna borealis*, *Epilachna varivestis*, *Epitrix* spp., por ejemplo *Epitrix cucumeris*, *Epitrix fuscula*, *Epitrix hirtipennis*, *Epitrix subcrinita*, *Epitrix tuberis*, *Faustinus* spp., *Gibbium psylloides*, *Gnathocerus cornutus*, *Hellula undalis*, *Heteronychus arator*, *Heteronyx* spp., *Hylamorpha elegans*, *Hylotruples bajulus*, *Hypera postica*, *Hypomeces squamosus*, *Hypothenemus* spp., por ejemplo *Hypothenemus hampei*, *Hypothenemus obscurus*, *Hypothenemus pubescens*, *Lachnostenra consanguinea*, *Lasioderma serricorne*, *Latheticus oryzae*, *Lathridius* spp., *Lema* spp., *Leptinotarsa decemlineata*, *Leucoptera* spp., por ejemplo *Leucoptera coffeeella*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Listronotus* (= *Hyperodes*) spp., *Lixus* spp., *Luperodes* spp., *Luperomorpha xanthodera*, *Lyctus* spp., *Megascelis* spp., *Melanotus* spp., por ejemplo *Melanotus longulus*, *oregonensis*, *Meligethes aeneus*, *Melolontha* spp., por ejemplo *Melolontha melolontha*, *Migdolus* spp., *Monochamus* spp., *Naupactus xanthographus*, *Necrobia* spp., *Neogalerucella* spp., *Niptus hololeucus*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Oryzaphagus oryzae*, *Otiorhynchus* spp., por ejemplo *Otiorhynchus cribricollis*, *Otiorhynchus ligustici*, *Otiorhynchus ovatus*, *Otiorhynchus rugosostriatus*, *Otiorhynchus sulcatus*, *Oulema* spp., por ejemplo *Oulema melanopus*, *Oulema oryzae*, *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllophaga* spp., *Phyllophaga helleri*, *Phyllotreta* spp., por ejemplo *Phyllotreta armoraciae*, *Phyllotreta pusilla*, *Phyllotreta ramosa*, *Phyllotreta striolata*, *Popillia japonica*, *Premnotypes* spp., *Prostephanus truncatus*, *Psylliodes* spp., por ejemplo *Psylliodes affinis*, *Psylliodes chrysocephala*, *Psylliodes punctulata*, *Ptinus* spp., *Rhizobius ventralis*, *Rhizopertha dominica*, *Rhynchophorus ferrugineus*, *Rhynchophorus palmarum*, *Sinoxylon perforans*, *Sitophilus* spp., por ejemplo *Sitophilus granarius*, *Sitophilus linearis*, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Sphenophorus* spp., *Stegobium paniceum*, *Sternechus* spp., por ejemplo *Sternechus paludatus*, *Symplyctes* spp., *Tanymecus* spp., por ejemplo *Tanymecus dilaticollis*, *Tanymecus indicus*, *Tanymecus palliatus*, *Tenebrio molitor*, *Tenebrioides mauretanicus*, *Tribolium* spp., por ejemplo *Tribolium audax*, *Tribolium castaneum*, *Tribolium confusum*, *Trogoderma* spp., *Tychius* spp., *Xylotrechus* spp., *Zabrus* spp., por ejemplo *Zabrus tenebrioides*;

del orden de los Dermaptera, por ejemplo *Anisolabis maritime*, *Forficula auricularia*, *Labidura riparia*;

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

del orden de los Hemiptera, por ejemplo *Acizzia acaciae* baileyanae, *Acizzia dodonaeae*, *Acizzia uncatooides*, *Acrida turrita*, *Acythosipon* spp., por ejemplo *Acythosiphon pisum*, *Acrogonia* spp., *Aenedolamia* spp., *Agonoscena* spp., *Aleurocanthus* spp., *Aleyrodes proletella*, *Aleurolobus barodensis*, *Aleurothrixus flocosus*, *Allocardara malayensis*, *Amrasca* spp., por ejemplo *Amrasca biguttula*, *Amrasca devastans*, *Anuraphis cardui*, *Aonidiella* spp., por ejemplo *Aonidiella aurantii*, *Aonidiella citrina*, *Aonidiella inornata*, *Aphanostigma piri*, *Aphis* spp., por ejemplo *Aphis citricola*, *Aphis craccivora*, *Aphis fabae*, *Aphis forbesi*, *Aphis glycines*, *Aphis gossypii*, *Aphis hederae*, *Aphis illinoensis*, *Aphis middletoni*, *Aphis nasturtii*, *Aphis nerii*, *Aphis pomi*, *Aphis spiraecola*, *Aphis viburniphila*, *Arboridia apicalis*, *Arytainilla* spp., *Aspidiella* spp., *Aspidotus* spp., por ejemplo *Aspidotus nerii*, *Atanus* spp., *Aulacorthum solani*, *Bemisia tabaci*, *Blastopsylla occidentalis*, *Boreioglycaspis melaleucae*, *Brachycaudus helichrysi*, *Brachycolus* spp., *Brevicoryne brassicae*, *Cacopsylla* spp., por ejemplo *Cacopsylla pyricola*, *Calligypuna marginata*, *Capulinia* spp., *Carneocephala fulgida*, *Ceratovacuna lanigera*, *Cercopidae*, *Ceroptastes* spp., *Chaetosiphon fragaefolii*, *Chionaspis tegalensis*, *Chlorita onukii*, *Chondracris rosea*, *Chromaphis juglandicola*, *Chrysomphalus aonidum*, *Chrysomphalus ficus*, *Cicadulina mbila*, *Coccoomytilus halli*, *Coccus* spp., por ejemplo *Coccus hesperidum*, *Coccus longulus*, *Coccus pseudomagnolarum*, *Coccus viridis*, *Cryptomyzus ribis*, *Cryptoneossa* spp., *Ctenarytaina* spp., *Dalbulus* spp., *Dialeurodes chittendeni*, *Dialeurodes citri*, *Diaphorina citri*, *Diaspis* spp., *Diuraphis* spp., *Doralis* spp., *Drosicha* spp., *Dysaphis* spp., por ejemplo *Dysaphis apiifolia*, *Dysaphis plantaginea*, *Dysaphis tulipae*, *Dysmicoccus* spp., *Empoasca* spp., por ejemplo *Empoasca abrupta*, *Empoasca fabae*, *Empoasca maligna*, *Empoasca solana*, *Empoasca stevensi*, *Eriosoma* spp., por ejemplo *Eriosoma americanum*, *Eriosoma lanigerum*, *Eriosoma pyricola*, *Erythroneura* spp., *Eucalyptolyma* spp., *Euphyllura* spp., *Euscelis bilobatus*, *Ferrisia* spp., *Furcaspis oceanica*, *Geococcus coffeae*, *Glycaspis* spp., *Heteropsylla cubana*, *Heteropsylla spinulosa*, *Homalodisca coagulata*, *Hyalopterus arundinis*, *Hyalopterus pruni*, *Icerya* spp., por ejemplo *Icerya purchasi*, *Idiocerus* spp., *Idioscopus* spp., *Laodelphax striatellus*, *Lecanium* spp., por ejemplo *Lecanium corni* (=Parthenolecanium corni), *Lepidosaphes* spp., por ejemplo *Lepidosaphes ulmi*, *Lipaphis erysimi*, *Lopholeucaspis japonica*, *Lycorma delicatula*, *Macrosiphum* spp., por ejemplo *Macrosiphum euphorbiae*, *Macrosiphum lili*, *Macrosiphum rosae*, *Macrosteles* facifrons, *Mahanarva* spp., *Melanaphis sacchari*, *Metcalfiella* spp., *Metcalfa pruinosa*, *Metopolophium dirhodum*, *Monellia costalis*, *Monelliopsis pecanis*, *Myzus* spp., por ejemplo *Myzus ascalonicus*, *Myzus cerasi*, *Myzus ligustri*, *Myzus ornatus*, *Myzus persicae*, *Myzus nicotianae*, *Nasonovia ribisnigri*, *Neomaskellia* spp., *Nephrotettix* spp., por ejemplo *Nephrotettix cincticeps*, *Nephrotettix nigropictus*, *Nettigonella spectra*, *Nilaparvata lugens*, *Oncometopia* spp., *Orthezia praelonga*, *Oxya chinensis*, *Pachypsylla* spp., *Parabemisia myricae*, *Paratriozza* spp., por ejemplo *Paratriozza cockerelli*, *Parlatoria* spp., *Pemphigus* spp., por ejemplo *Pemphigus bursarius*, *Pemphigus populivae*, *Peregrinus maidis*, *Perkinsiella* spp., *Phenacoccus* spp., por ejemplo *Phenacoccus madeirensis*, *Phloeomyzus passerinii*, *Phorodon humuli*, *Phylloxera* spp., por ejemplo *Phylloxera devastatrix*, *Phylloxera notabilis*, *Pinnaspis aspidistrae*, *Planococcus* spp., por ejemplo *Planococcus citri*, *Prosopidopsylla flava*, *Protopulvinaria pyriformis*, *Pseudaulacaspis pentagona*, *Pseudococcus* spp., por ejemplo *Pseudococcus calceolariae*, *Pseudococcus comstocki*, *Pseudococcus longispinus*, *Pseudococcus maritimus*, *Pseudococcus viburni*, *Psyllopsis* spp., *Psylla* spp., por ejemplo *Psylla buxi*, *Psylla mali*, *Psylla pyri*, *Pteromalus* spp., *Pulvinaria* spp., *Pyrilla* spp., *Quadrapsidiotus* spp., por ejemplo *Quadrapsidiotus juglansregiae*, *Quadrapsidiotus ostreaeformis*, *Quadrapsidiotus perniciosus*, *Quesada gigas*, *Rastrococcus* spp., *Rhopalosiphum* spp., por ejemplo *Rhopalosiphum maidis*, *Rhopalosiphum oxyacanthae*, *Rhopalosiphum padi*, *Rhopalosiphum rufiabdominale*, *Saissetia* spp., por ejemplo *Saissetia coffeae*, *Saissetia miranda*, *Saissetia neglecta*, *Saissetia oleae*, *Scaphoideus titanus*, *Schizaphis graminum*, *Selenaspis articulatus*, *Sipha flava*, *Sitobion avenae*, *Sogata* spp., *Sogatella furcifera*, *Sogatodes* spp., *Stictocephala festina*, *Siphoninus phillyreae*, *Tenalaphara malayensis*, *Tetragonocephela* spp., *Tinocallis caryaefoliae*, *Tomaspis* spp., *Toxoptera* spp., por ejemplo *Toxoptera aurantii*, *Toxoptera citricidus*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Trioza* spp., por ejemplo *Trioza diospyri*, *Typhlocyba* spp., *Unaspis* spp., *Viteus vitifolii*, *Zygina* spp.;

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

del orden de los Hymenoptera, por ejemplo *Acromyrmex* spp., *Athalia* spp., por ejemplo *Athalia rosae*, *Atta* spp., *Camponotus* spp., *Dolichovespula* spp., *Diprion* spp., por ejemplo *Diprion similis*, *Hoplocampa* spp., por ejemplo *Hoplocampa cookei*, *Hoplocampa testudinea*, *Lasius* spp., *Linepithema* (Iridomyrmex) *humile*, *Monomorium pharaonis*, *Paratrechina* spp., *Paravespula* spp., *Plagiolepis* spp., *Sirex* spp., *Solenopsis invicta*, *Tapinoma* spp., *Technomyrmex albipes*, *Urocerus* spp., *Vespa* spp., por ejemplo *Vespa crabro*, *Wasmannia auropunctata*, *Xeris* spp.;

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

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

- 5 del orden de los Lepidoptera, por ejemplo *Achroia grisella*, *Acronicta major*, *Adoxophyes* spp., por ejemplo *Adoxophyes orana*, *Aedia leucomelas*, *Agrotis* spp., por ejemplo *Agrotis segetum*, *Agrotis ipsilon*, *Alabama* spp., por ejemplo *Alabama argillacea*, *Amyelois transitella*, *Anarsia* spp., *Anticarsia* spp., por ejemplo *Anticarsia gemmatalis*, *Argyroploce* spp., *Autographa* spp., *Barathra brassicae*, *Blastodacna atra*, *Borbo cinnara*, *Bucculatrix thurberiella*, *Bupalus piniarius*, *Busseola* spp., *Cacoecia* spp., *Caloptilia theivora*, *Capua reticulana*, *Carpocapsa pomonella*, *Carposina nipponensis*, *Cheimatobia brumata*, *Chilo* spp., por ejemplo *Chilo plejadellus*, *Chilo suppressalis*, *Choreutis pariana*, *Choristoneura* spp., *Chrysodeixis chalcites*, *Clytia ambigua*, *Cnaphalocerus* spp., *Cnaphalocrocis medicinalis*, *Cnephacia* spp., *Conopomorpha* spp., *Conotrachelus* spp., *Copitarsia* spp., *Cydia* spp., por ejemplo *Cydia nigricana*, *Cydia pomonella*, *Dalaca noctuides*, *Diaphania* spp., *Diparopsis* spp., *Diatraea saccharalis*, *Earias* spp., *Ecdytolopha aurantium*, *Elasmopalpus lignosellus*, *Eldana saccharina*, *Ephestia* spp., por ejemplo *Ephestia elutella*, *Ephestia kuehniella*, *Epinotia* spp., *Epiphyas postvittana*, *Erannis* spp., *Erschoviella* spp., *Etiella* spp., *Eudocima* spp., *Eulia* spp., *Eupoecilia* spp., *Euproctis* spp., por ejemplo *Euproctis chrysorrhoea*, *Euxoa* spp., *Feltia* spp., *Galleria mellonella*, *Gracillaria* spp., *Grapholita* spp., por ejemplo *Grapholita molesta*, *Grapholita prunivora*, *Hedylepta* spp., *Helicoverpa* spp., por ejemplo *Helicoverpa armigera*, *Helicoverpa zea*, *Heliothis* spp., por ejemplo *Heliothis virescens*, *Hofmannophila pseudospretella*, *Homoeosoma* spp., *Homona* spp., *Hyponomeuta padella*, *Kakivoria* spp., *Lamprides* spp., *Laphygma* spp., *Laspeyresia* spp., *Leucinodes orbonalis*, *Leucoptera* spp., por ejemplo *Leucoptera coffeella*, *Lithocolletis* spp., por ejemplo *Lithocolletis blanchardella*, *Lithophane antennata*, *Lobesia* spp., por ejemplo *Lobesia botrana*, *Loxagrotis albicosta*, *Lymantria* spp., por ejemplo *Lymantria dispar*, *Lyonetia* spp., por ejemplo *Lyonetia clerkella*, *Malacosoma neustria*, *Maruca testulalis*, *Mamestra brassicae*, *Melanitis leda*, *Mocis* spp., *Monopis obviella*, *Mythimna separata*, *Nemapogon cloacellus*, *Nymphula* spp., *Oiketicus* spp., *Omphisa* spp., *Operophtera* spp., *Oria* spp., *Orthaga* spp., *Ostrinia* spp., por ejemplo *Ostrinia nubilalis*, *Panolis flammea*, *Parnara* spp., *Pectinophora* spp., por ejemplo *Pectinophora gossypiella*, *Perileucoptera* spp., *Phthorimaea* spp., por ejemplo *Phthorimaea operculella*, *Phylloconistis citrella*, *Phyllonorycter* spp., por ejemplo *Phyllonorycter blanchardella*, *Phyllonorycter crataegella*, *Pieris* spp., por ejemplo *Pieris rapae*, *Platynota stultana*, *Plodia interpunctella*, *Plusia* spp., *Plutella xylostella* (= *Plutella maculipennis*), *Prays* spp., *Prodenia* spp., *Protoparce* spp., *Pseudaletia* spp., por ejemplo *Pseudaletia unipuncta*, *Pseudoplusia includens*, *Pirausta* spp., *Rachiplusia* spp., *Schoenobius* spp., por ejemplo *Schoenobius bipunctifer*, *Scirpophaga* spp., por ejemplo *Scirpophaga innotata*, *Scotia* spp., por ejemplo *Scotia segetum*, *Sesamia* spp., por ejemplo *Sesamia inferens*, *Sparganothis* spp., *Spodoptera* spp., por ejemplo *Spodoptera eradiana*, *Spodoptera exigua*, *Spodoptera frugiperda*, *Spodoptera praefica*, *Stathmopoda* spp., *Stenoma* spp., *Stomopteryx subsecivella*, *Sinanthesdon* spp., *Tecia solanivora*, *Thaumetopoea* spp., *Thermesia* spp., *Tinea* spp., *Tinea cloacella*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*, *Tortrix* spp., *Trichophaga tapetzella*, *Trichoplusia* spp., por ejemplo *Trichoplusia ni*, *Tryporyza incertulas*, *Tuta absoluta*, *Virachola* spp.;
- 20 del orden de los Orthoptera o Saltatoria, por ejemplo *Acheta domesticus*, *Dichroplus* spp., *Gryllotalpa* spp., por ejemplo *Gryllotalpa*, *Hieroglyphus* spp., *Locusta* spp., por ejemplo *Locusta migratoria*, *Melanoplus* spp., por ejemplo *Melanoplus* spp., *Paratlanticus ussuriensis*, *Schistocerca gregaria*;
- 25 del orden de los Phthiraptera, por ejemplo *Damalinia* spp., *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phylloxera* spp., *Phthirus* spp., *Trichodectes* spp.;
- 30 del orden de los Psocoptera, por ejemplo *Lepinotus* spp., *Liposcelis* spp.;
- 35 del orden de los Siphonaptera, por ejemplo *Ceratophyllus* spp., *Ctenocephalides* spp., por ejemplo *Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, *Xenopsylla cheopis*;
- 40 del orden de los Thysanoptera, por ejemplo *Anaphothrips obscurus*, *Baliothrips biformis*, *Chaetanaphothrips leeuweni*, *Drepanothrips reuteri*, *Enneothrips flavens*, *Frankliniella* spp., por ejemplo *Frankliniella fusca*, *Frankliniella occidentalis*, *Frankliniella schultzei*, *Frankliniella tritici*, *Frankliniella vaccinii*, *Frankliniella williamsi*, *Haplothrips* spp., *Heliothrips* spp., *Hercinothrips femoralis*, *Kakothrips* spp., *Rhipiphorothrips cruentatus*, *Scirtothrips* spp., *Taeniothrips cardamomi*, *Thrips* spp., por ejemplo *Thrips palmi*, *Thrips tabaci*;
- 45 del orden de los Zygentoma (= Thysanura), por ejemplo *Ctenolepisma* spp., *Lepisma* spp., *Lepismodes inquilinus*, *Thermobia domestica*;
- 50 de la clase de los Symphyla, por ejemplo *Scutigerella* spp., por ejemplo *Scutigerella immaculata*;
- 55 plagas del filo de los Mollusca, por ejemplo de la clase de los Bivalvia, por ejemplo *Dreissena* spp.; y también de la clase de los Gastropoda, por ejemplo *Arion* spp., por ejemplo *Arion ater rufus*, *Biomphalaria* spp., *Bulinus* spp., *Deroceras* spp., por ejemplo *Deroceras laeve*, *Galba* spp., *Lymnaea* spp., *Oncomelania* spp., *Pomacea* spp., *Succinea* spp.;

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

20 Los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') pueden, dado el caso, a determinadas concentraciones o cantidades de aplicación, también usarse como herbicidas, protectores, reguladores del crecimiento o agentes para mejorar propiedades vegetales, como microbílicas o gametocidas, por ejemplo como fungicidas, antimicóticos, bactericidas, viricidas (incluyendo agentes contra viroides) o como agentes contra MLO (organismos similares a micoplasma, por sus siglas en inglés) y RLO (organismos similares a rickettsia, por sus siglas en inglés). Ellos pueden, tal como puede ser el caso, también usarse como productos intermedios o precursores para la síntesis de otros principios activos.

Formulaciones

25 La presente invención además se refiere a formulaciones y formas de uso preparadas a partir de ellas como pesticidas, por ejemplo licores para empapar, sumergir y rociar, que comprenden al menos un compuesto de la fórmula (I) o de la fórmula (I'). Opcionalmente, las formas de uso comprenden otros pesticidas y/o adyuvantes que mejoran la acción, tal como penetrantes, por ejemplo 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 éster metílico de aceite de colza o éster metílico de aceite de soja, o alanol alcóxilatos y/o esparcidores, por ejemplo alquilsiloxanos y/o sales, por ejemplo sales orgánicas o inorgánicas de amonio o fosfonio, por ejemplo sulfato de amonio o fosfato ácido de diamonio y/o promotores de retención, por ejemplo sulfosuccinato de dióctilo o polímeros de hidroxipropilguar y/o humectantes, por ejemplo glicerol y/o fertilizantes, por ejemplo fertilizantes que contienen amonio, potasio o fósforo.

30 Las formulaciones tradicionales son, por ejemplo, líquidos solubles en agua (SL), concentrados de emulsiones (EC), emulsiones en agua (EW), concentrados en suspensión (SC, SE, FS, OD), gránulos dispersables en agua (WG), gránulos (GR) y concentrados en cápsulas (CS); estos y otros tipos de formulación son descritos, por ejemplo, por la 35 Crop Life International y en Pesticide Specifications, Manual on development and use of FAO and WHO specifications for pesticides, FAO Plant Production and Protection Papers – 173, prepared by the FAO/WHO Joint Meeting in Pesticide Specifications, 2004, ISBN: 9251048576. Las formulaciones, adicionalmente a uno o más compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I'), opcionalmente comprenden otros principios activos agroquímicos.

40 Se da preferencia a formulaciones o formas de uso que comprenden sustancias auxiliares, por ejemplo extensores, disolventes, promotores de espontaneidad, vehículos, emulsionantes, dispersantes, agentes anticongelantes, biocidas, espesantes y/u otras sustancias auxiliares, por ejemplo adyuvantes. Un adyuvante en este contexto es un componente que potencia el efecto biológico de la formulación, sin que el propio componente tenga un efecto biológico. Los ejemplos de adyuvantes abarcan agentes que promueven la retención, el esparcimiento, la unión o la penetración a la superficie de la hoja.

45 50 Estas formulaciones se preparan de una manera conocida, por ejemplo por mezclado de los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') con sustancias auxiliares, por ejemplo extensores, disolventes y/o vehículos sólidos y/u otras sustancias auxiliares, por ejemplo tensioactivos. Las formulaciones se producen en instalaciones adecuadas o en otro lugar antes o durante la aplicación.

55 55 Las sustancias auxiliares usadas pueden ser sustancias adecuadas para conferir propiedades especiales, tales como determinadas propiedades físicas, técnicas y/o biológicas, a la formulación de los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I'), o a las formas de uso preparadas a partir de estas formulaciones (por ejemplo pesticidas listos para usar tales como licores para rociar o productos para tratar semillas).

Los extensores adecuados son, por ejemplo, agua, líquidos químicos orgánicos polares y no polares, por ejemplo de las clases de los hidrocarburos aromáticos y no aromáticos (tales como parafinas, alquilbencenos, alquilnaftalenos,

clorobencenos), los alcoholes y polioles (que, si es apropiado, también pueden estar sustituidos, eterificados y/o esterificados), las cetonas (tales como acetona, ciclohexanona), ésteres (que incluyen grasas y aceites) y (poli)éteres, las aminas simples y sustituidas, amidas, lactamas (tal como N-alquilpirrolidonas) y lactonas, las sulfonas y sulfóxidos (tales como dimetilsulfóxido).

- 5 Si el extensor utilizado es agua, también es posible usar, por ejemplo, disolventes orgánicos como disolventes auxiliares. Los disolventes líquidos útiles son esencialmente: aromáticos tales como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, hidrocarburos aromáticos clorados o 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, metil etil cetona, metil isobutil cetona o ciclohexanona, disolventes fuertemente polares tales como dimetilformamida y dimetilsulfóxido, así como agua.

En principio, es posible usar todos los disolventes adecuados. Los ejemplos de disolventes adecuados abarcan hidrocarburos aromáticos, por ejemplo xileno, tolueno o alquilnaftalenos, hidrocarburos aromáticos clorados o alifáticos clorados, por ejemplo clorobenceno, cloroetileno o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos, por ejemplo ciclohexano, parafinas, fracciones de petróleo, aceites minerales y vegetales, alcoholes, por ejemplo metanol, etanol, isopropanol, butanol o glicol y sus éteres y ésteres, cetonas, por ejemplo acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona o ciclohexanona, disolventes fuertemente polares, por ejemplo dimetilsulfóxido, así como agua.

En principio, es posible usar todos los vehículos adecuados. Los vehículos considerados especialmente abarcan, por ejemplo, sales de amonio y rocas finamente molidas naturales, tales como caolines, alúminas, talco, tiza, cuarzo, atapulguita, montmorillonita o tierras de diatomeas, y rocas finamente molidas sintéticas, tales como sílice altamente dispersa, óxido de aluminio y silicatos naturales o sintéticos, resinas, ceras y/o fertilizantes sólidos. Además es posible usar mezclas de los mencionados vehículos. Los vehículos considerados para gránulos incluyen: por ejemplo rocas naturales aplastadas o fraccionadas tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita, y gránulos sintéticos de harinas inorgánicas y orgánicas, así como gránulos de material orgánico tal como aserrín, papel, cáscara de coco, mazorca de maíz y tallos de tabaco.

También es posible usar extensores o disolventes gaseosos licuados. Los extensores o vehículos especialmente adecuados son aquellos que son gaseosos a temperatura estándar y a presión atmosférica, por ejemplo propulsores de aerosoles tales como hidrocarburos halogenados, y también butano, propano, nitrógeno y dióxido de carbono.

30 Los ejemplos de emulsionantes y/o formadores de espuma, dispersantes o agentes humectantes que tienen propiedades iónicas o no iónicas o mezclas de estas sustancias tensioactivas 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 sulfosuccínicos, derivados de taurina (preferentemente tauratos de alquilo), ésteres fosfóricos de alcoholes polietoxilados o fenoles, ésteres de ácidos grasos de polioles, y derivados de los compuestos 35 que contienen sulfatos, sulfonatos y fosfatos, por ejemplo alquilaryl poliglicol éteres, alquilsulfonatos, sulfatos de alquilo, arilsulfonatos, hidrolizados proteicos, licores de desechos de lignosulfito y metilcelulosa. La presencia de un tensioactivo es ventajosa si uno de los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') y/o uno de los vehículos inertes es insoluble en agua y cuando la aplicación se realiza en agua.

40 Otras sustancias auxiliares que pueden estar presentes en las formulaciones y en las formas de uso derivadas de las mismas incluyen colorantes tal como pigmentos inorgánicos, por ejemplo óxido de hierro, óxido de titanio y azul de Prusia, y colorantes orgánicos tal como colorantes de alizarina, colorantes azo y colorantes de ftalocianinas metálicas, y nutrientes y nutrientes traza tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc.

45 También pueden estar presentes estabilizantes, tales como estabilizantes contra el frío, conservantes, antioxidantes, estabilizantes contra la luz, u otros agentes que mejoran la estabilidad química y/o física. También pueden estar presentes generadores de espuma o antiespumantes.

50 Adicionalmente, las formulaciones y las formas de uso derivadas de las mismas también pueden comprender, como sustancias auxiliares adicionales, aglutinantes tales como carboximetilcelulosa y polímeros naturales y sintéticos en forma de polvos, gránulos o látex, tales como goma arábiga, alcohol polivinílico y acetato polivinílico, u otros fosfolípidos naturales tales como cefalinas y lecitinas y fosfolípidos sintéticos. Otras sustancias auxiliares pueden ser aceites minerales y vegetales.

55 Resulta posible, dado el caso, que estén presentes aún otras sustancias auxiliares en las formulaciones y en las formas de uso que derivan de las mismas. Los ejemplos de tales aditivos abarcan fragancias, coloides protectores, aglutinantes, adhesivos, espesantes, agentes tixotrópicos, penetrantes, promotores de retención, estabilizantes, secuestrantes, agentes complejantes, humectantes, espardidores. En general, los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') pueden combinarse con cualquier aditivo sólido o líquido usado comúnmente para propósitos de formulación.

Los promotores de retención útiles incluyen todas aquellas sustancias que reducen la tensión superficial, por ejemplo dioctil sulfosuccinato, o que aumentan la viscoelasticidad, por ejemplo polímeros de hidroxipropilgual.

- Los penetrantes adecuados en el presente contexto son todas aquellas sustancias que se usan habitualmente para mejorar la penetración de las sustancias activas agroquímicas en las plantas. Los penetrantes se definen en este contexto por su capacidad para penetrar desde el licor de aplicación (en general acuoso) y/o desde el recubrimiento por aspersión en la cutícula de la planta y poder aumentar así la movilidad de los principios activos en la cutícula. El procedimiento descrito en la bibliografía (Baur y col., 1997, Pesticide Science 51, 131-152) puede usarse para determinar esta propiedad. Los ejemplos incluyen alcohol alcoxilatos tales como etoxilato graso de coco (10) o etoxilato de isotridecilo (12), ésteres de ácidos grasos, por ejemplo éster metílico de aceite de colza o éster metílico de aceite de soja, alcoxilatos de amina grasos, por ejemplo etoxilato de talowamina (15), o sales de amonio y/o fosfonio, por ejemplo sulfato de amonio o fosfato ácido de diamonio.
- 10 Las formulaciones preferentemente comprenden entre el 0,00000001 % y el 98 % en peso del compuesto de fórmula (I) o de fórmula (I'), más preferentemente entre el 0,01 % y el 95 % en peso del compuesto de fórmula (I) o de fórmula (I'), más preferentemente entre el 0,5 % y el 90 % en peso del compuesto de fórmula (I) o de fórmula (I'), con respecto al peso de la formulación.
- 15 El contenido del compuesto de fórmula (I) o de fórmula (I') en las formas de uso preparadas a partir de las formulaciones (en particular pesticidas) puede variar dentro de intervalos amplios. La concentración del compuesto de fórmula (I) o de fórmula (I') en las formas de uso típicamente puede estar entre el 0,00000001 % y el 95 % en peso del compuesto de fórmula (I) o de fórmula (I'), preferentemente entre el 0,00001 % y el 1 % en peso, con respecto al peso de la forma de uso. La aplicación se lleva a cabo de la manera habitual de manera adaptada a las formas de uso.
- 20 **Mezclas**
- Los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') también pueden usarse en mezcla con uno o más fungicidas, bactericidas, acaricidas, moluscicidas, nematicidas, insecticidas, agentes microbiológicos, organismos beneficiosos, herbicidas, fertilizantes, repelentes de aves, fitotónicos, esterilizantes, protectores, semioquímicos y/o reguladores del crecimiento vegetal adecuados, con el objetivo de, por ejemplo, ampliar de esta manera el espectro de acción, prolongar el periodo de acción, mejorar la velocidad de acción, prevenir la repelencia o prevenir la evolución de resistencia. Adicionalmente, las combinaciones de principios activos de este tipo pueden mejorar el crecimiento vegetal y/o la tolerancia a factores abióticos, por ejemplo temperaturas altas o bajas, a sequía o a contenidos elevados de agua o salinidad del suelo. También es posible mejorar la floración y el rendimiento de frutos, optimizar la capacidad de germinación y el desarrollo de raíces, facilitar la recolección y mejorar los rendimientos, influir en la maduración, mejorar la calidad y/o el valor nutricional de los productos cosechados, prolongar la vida útil y/o mejorar la procesabilidad de los productos cosechados.
- 25 30 35 Adicionalmente, los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') pueden estar presentes en mezcla con otros principios activos o semioquímicos tal como sustancias atrayentes y/o repelentes de aves y/o activadores de plantas y/o reguladores del crecimiento y/o fertilizantes. Análogamente, los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') pueden usarse para mejorar propiedades vegetales, por ejemplo crecimiento, rendimiento y calidad del material cosechado.
- 40 En una forma de realización particular de acuerdo con la invención, los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') están presente en formulaciones o en las formas de uso preparadas a partir de estas formulaciones en mezcla con otros compuestos, preferentemente aquellos que se describen más adelante.
- 45 Si uno de los compuestos mencionados más adelante puede existir en diferentes formas tautoméricas, estas formas también se incluyen incluso aunque no se mencionen explícitamente en cada caso. Todos los componentes de mezcla mencionados, también pueden formar, dado el caso, sales con bases o ácidos adecuados si tienen la capacidad de hacerlo debido a sus grupos funcionales.
- Insecticidas/acaricidas/nematicidas**
- 50 Los principios activos especificados en el presente documento con sus nombres comunes ("Common Name") son conocidos y se describen por ejemplo en "The Pesticide Manual", 16^a ed., British Crop Protection Council 2012, o pueden buscarse en Internet (por ejemplo <http://www.alanwood.net/pesticides>). La clasificación se basa en IRAC Mode of Action Classification Scheme aplicable en el momento de presentación de esta solicitud de patente.
- (1) inhibidores de acetilcolinesterasa (AChE), por ejemplo carbamatos, por ejemplo alanicarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxicarboxim, carbarilo, carbofurano, carbosulfano, etiofencarb, fenobucarb, formetanato, furatiocarb, isoprocarb, metiocarb, metomilo, metolcarb, oxamilo, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, triazamato, trimetacarb, XMC y xililcarb; u organofosfatos, por ejemplo acefato, azametifos, azinfos-etilo, azinfos-metilo, cadusafos, cloretoxifos, clorfenvinifos, clormefos, clorpirifos-metilo, coumafos, cianofos, demeton-S-metilo, diazinon, diclorvos/DDVP, dicrotos, dimetoato, dimetilvinfos, disulfoton, EPN, etion, etoprofos, famfur, fenamifos, fenitrotion, fention, fostiazato, heptenofos, imiciasfos, isofenfos, isopropilo O-(metoxiaminotiofosforil) salicilato, isoxation, malation, mecarbam, metamidofos, metidation, mevinfos, monocrotofos, naled, ometoato, oxidemeton-metilo, paration-metilo, fentoato, forato, fosalona, fosmet, fosfamidon, foxim, pirimifos-metilo, profenofos, propetamfos, protios, piraclofos, piridafenton, quinalfos, sulfotep, tebupirimfos, temefos, terbufos, tetraclorvinfos, tiometon, triazofos, triclorfon y vamidotion.

- (2) bloqueantes del canal de cloruro controlado por GABA, por ejemplo ciclodieno-organocloruros, por ejemplo clordano y endosulfano o fenilpirazoles (fiproles), por ejemplo etiprol y fipronilo.
- 5 (3) moduladores del canal de sodio, por ejemplo piretroides, por ejemplo acrinatrina, aletrina, d-cis-trans aletrina, d-trans aletrina, bifentrina, bioaletrina, bioaletrina isómero S-ciclopentenilo, bioresmetrina, cicloprotrina, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, lambda-циhalotrina, gamma-циhalotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, beta-cipermetrina, theta-cipermetrina, zeta-cipermetrina, cifenotrina [isómero (1R)-trans], deltametrina, empentrina [isómero (EZ)-(1R)], esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flumetrina, tau-fluvalinato, halfenprox, imiprotrina, kadetrina, momfluorotrina, permetrina, fenotrina [isómero (1R)-trans], praletrina, piretrinas (piretrum), resmetrina, silafluofen, teflutrina, tetrametrina, tetrametrina [isómero (1R)], tralometrina y transflutrina o DDT o metoxiclor.
- 10 (4) moduladores competitivos del receptor nicotínico de acetilcolina (nAChR), por ejemplo neonicotinoides, por ejemplo acetamiprid, clotianidina, dinotefurano, imidacloprid, nitenpiram, tiacloprid y tiamectoxam o nicotina o sulfoxaflor o flupiradifurona.
- 15 (5) moduladores alostéricos del receptor nicotínico de acetilcolina (nAChR), por ejemplo espinosinas, por ejemplo espinetoram y espinosad.
- (6) moduladores alostéricos del canal de cloruro modulado por glutamato (GluCl), por ejemplo avermectinas/milbemicinas, por ejemplo abamectina, benzoato de emamectina, lepimectina y milbemectina.
- 20 (7) imitadores de hormonas juveniles, por ejemplo, análogos de hormonas juveniles, por ejemplo hidropreno, kinopreno y metopreno o fenoxicarb o piriproxifeno.
- (8) inhibidores no específicos diversos (multisitio), por ejemplo haluros de alquilo, por ejemplo bromuro de metilo y otros haluros de alquilo; o cloropicrina o fluoruro de sulfurilo o bórax o tártaro emético o generador de isocianato de metilo, por ejemplo diazomet y metam.
- (9) moduladores del órgano cordotonal, por ejemplo pimetrozina o flonicamida.
- (10) inhibidores del crecimiento de acáridos, por ejemplo clofentezina, hexithiazox y diflovidazina o etoxazol.
- 25 (11) alteradores microbianos de la membrana de 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 de planta *B.t.*: Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry1A.105, Cry2Ab, VIP3A, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb, Cry34Ab1/35Ab1.
- 30 (12) inhibidores de la sintasa de ATP mitocondrial, tales como alteradores de ATP, por ejemplo diafenturon o compuestos de organotina, por ejemplo azociclotina, cihexatina y óxido de fenbutatina o propargita o tetradifon.
- (13) desacoplantes de la fosforilación oxidativa mediante alteración del gradiente de protones, por ejemplo clorfenapir, DNOC y sulfluramid.
- (14) bloqueantes del canal receptor nicotínico de acetilcolina, por ejemplo bensultap, clorhidrato de cartap, tiociclam, y tiosultap-sodio.
- 35 (15) inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 0, por ejemplo bistrifluron, clorfluazuron, diflubenzuron, flucicloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, teflubenzuron y triflumuron.
- (16) inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 1, por ejemplo buprofezina.
- (17) alteradores de muda (especialmente en el caso de los Diptera, es decir, los dípteros), por ejemplo ciromazina.
- (18) agonistas del receptor de ecdisona, por ejemplo cromafenozida, halofenozida, metoxifenozida y tebufenozida.
- 40 (19) agonistas del receptor de octopamina, por ejemplo amitraz.
- (20) inhibidores del transporte de electrones en el complejo III mitocondrial, por ejemplo hidrametilnon o acequinocil o fluacripirim.
- (21) inhibidores del transporte de electrones en el complejo I mitocondrial, por ejemplo METI acaridas, por ejemplo fenazaquina, fenpiroximato, pirimidifeno, piridabeno, tebufenpirad y tolfenpirad o rotenona (Derris).
- 45 (22) bloqueantes del canal de sodio dependiente de voltaje, por ejemplo indoxacarb o metaflumizona.
- (23) inhibidores de acetil CoA carboxilasa, por ejemplo derivados del ácido tetrónico y tetrámico, por ejemplo espirodiclofeno, espiromesifeno y espirotetramat.
- (24) inhibidores del transporte de electrones en el complejo IV mitocondrial, por ejemplo fosfinas, por ejemplo

fosfuro de aluminio, fosfuro de calcio, fosfina y fosfuro de cinc, o cianuros, cianuro de calcio, cianuro de potasio cianuro de sodio.

(25) inhibidores del transporte de electrones en el complejo II mitocondrial, por ejemplo derivados de beta-ceto nitrilo, por ejemplo cienopirafeno y ciflumetofeno y carboxanilida, por ejemplo piflubumida.

5 (28) moduladores del receptor de rianodina, por ejemplo diamidas, por ejemplo clorantraniliprol, ciantraniliprol y flubendiamida,

principios activos adicionales, por ejemplo afidopiropeno, afoxolaner, azadiractina, benclotiaz, benzoximato, bifenazato, broflanilida, bromopropilato, cinometionat, cloropraletrina, criolita, ciclaniliprol, cicloxaiprid, cihalodiamida, 10 dicloromezotiaz, dicofol, épsilon metoflutrina, épsilon momflutrina, flometoquina, fluazaindolizina, fluensulfona, flufenirim, flufenoxistrobina, flufiprol, fluhexafon, fluopiram, fluralaner, fluxametamida, fufenozida, guadipir, heptaflutrina, imidaclotiz, iprodiona, kappa bifentrina, kappa teflutrina, lotilaner, meperflutrina, paichongding, piridalilo, 15 pirifluquinazon, pirimostrobina, espirobudiclofeno, tetrametilflutrina, tetraniiprol, tetraclorantraniliprol, tioxazafeno, tiofluoximato, triflumezopirim e iodometano; preparaciones adicionales basadas en *Bacillus firmus* (I-1582, BioNeem, Votivo), así como los siguientes compuestos: 1-[2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]fenil]-3-(trifluorometil)-1H- 20 1,2,4-triazol-5-amina (conocido por el documento WO2006/043635) (CAS 885026-50-6), {1'-(2E)-3-(4-clorofenil)prop-2-en-1-il}-5-fluorospiro[indol-3,4'-piperidina]-1(2H)-il}{2-cloropiridin-4-il}metanona (conocido por el documento WO2003/106457) (CAS 637360-23-7), 2-cloro-N-[2-{1-[(2E)-3-(4-clorofenil)prop-2-en-1-il]piperidin-4-il}-4-(trifluorometil)fenil]isonicotinamida (conocido por el documento WO2006/003494) (CAS 872999-66-1), 3-(4-cloro-2,6-dimetilfenil)-4-hidroxi-8-metoxi-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-2-ona (conocido por el documento WO 2010052161) (CAS 20 1225292-17-0), 3-(4-cloro-2,6-dimetilfenil)-8-metoxi-2-oxo-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-4-il etilcarbonato (conocido por el documento EP 2647626) (CAS 1440516-42-6), 4-(but-2-in-1-iloxy)-6-(3,5-dimetilpiperidin-1-il)-5-fluoropirimidina (conocido por el documento WO2004/099160) (CAS 792914-58-0), PF1364 (conocido por el documento JP2010/018586) (n.º de reg. de CAS 1204776-60-2), N-[(2E)-1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]piridin-2(1H)-ilideno]-2,2,2-trifluoroacetamida (conocido por el documento WO2012/029672) (CAS 1363400-41-2), (3E)-3-[1-(6-cloro-3-piridil)metil]-2-piridilideno]-1,1,1-trifluoropropan-2-ona (conocido por el documento WO2013/144213) (CAS 1461743-15-6), N-[3-(bencilcarbamoil)-4-clorofenil]-1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocido por el documento WO2010/051926) (CAS 1226889-14-0), 5-bromo-4-cloro-N-[4-cloro-2-metil-6-(metilcarbamoil)fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)pirazol-3-carboxamida (conocido por el documento CN103232431) (CAS 1449220-44-3), 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-2-metil-N-(cis-1-oxido-3-tietanil)benzamida, 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-2-metil-N-(trans-1-oxido-3-tietanil)benzamida y 4-[(5S)-5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-2-metil-N-(cis-1-oxido-3-tietanil)benzamida (conocido por el documento WO 2013/050317 A1) (CAS 1332628-83-7), N-[3-cloro-1-(3-piridinil)-1H-pirazol-4-il]-N-etyl-3-[(3,3,3-trifluoropropil)sulfinil]propanamida, (+)-N-[3-cloro-1-(3-piridinil)-1H-pirazol-4-il]-N-etyl-3-[(3,3,3-trifluoropropil)sulfinil]propanamida y (-)-N-[3-cloro-1-(3-piridinil)-1H-pirazol-4-il]-N-etyl-3-[(3,3,3-trifluoropropil)sulfinil]propanamida (conocido por el documento WO 2013/162715 A2, WO 2013/162716 A2, US 2014/0213448 A1) (CAS 1477923-37-7), 5-[[[(2E)-3-cloro-2-propen-1-il]amino]-1-[2,6-dicloro-4-(trifluorometil)fenil]-4-[(trifluorometil)sulfinil]-1H-pirazol-3-carbonitrilo (conocido por el documento CN 101337937 A) (CAS 1105672-77-2), 3-bromo-N-[4-cloro-2-metil-6-[(metilamino)tioxometil]fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-carboxamida, (Liudaibenjiaxuanan, conocido a partir de CN 103109816 A) (CAS 1232543-85-9); N-[4-cloro-2-[(1,1-dimetiletil)amino]carbonil]-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(fluorometoxi)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocido por el documento WO 2012/034403 A1) (CAS 1268277-22-0), N-[2-(5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-il)-4-cloro-6-metilfenil]-3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocido por el documento WO 2011/085575 A1) (CAS 1233882-22-8), 4-[3-[2,6-dicloro-4-[(3,3-dicloro-2-propen-1-il)oxi]fenoxi]propoxi]-2-metoxi-6-(trifluorometil)pirimidina (conocido por el documento CN 101337940 A) (CAS 1108184-52-6); (2E)-y 2(Z)-2-[2-(4-cianofenil)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etilideno]-N-[4-(difluorometoxi)fenil]hidrazinacarboxamida (conocido por el documento CN 101715774 A) (CAS 1232543-85-9); éster 3-(2,2-dicloroetenil)-2,2-dimetil-4-(1H-benzimidazol-2-il)fenílico de ácido ciclopropanocarboxílico (conocido por el documento CN 103524422 A) (CAS 1542271-46-4); ester metílico de ácido (4aS)-7-cloro-2,5-dihidro-2-[[metoxicarbonil]4-[(trifluorometil)tio]fenil]amino]carbonil]indeno[1,2-e][1,3,4]oxadiazina-4a(3H)-carboxílico (conocido por el documento CN 102391261 A) (CAS 1370358-69-2); 6-deoxi-3-O-etyl-2,4-di-O-metil-1-[N-[4-[1-[4-(1,1,2,2,2-pentafluoroetoxi)fenil]-1H-1,2,4-triazol-3-il]fenil]carbamato]- α -L-manopiranosa (conocido por el documento US 2014/0275503 A1) (CAS 1181213-14-8); 8-(2-ciclopropilmetoxi-4-trifluorometilfenoxi)-3-(6-trifluorometilpiridazin-3-il)-3-azabiciclo[3.2.1]octano (CAS 1253850-56-4), (8-anti)-8-(2-ciclopropilmetoxi-4-trifluorometilfenoxi)-3-(6-trifluorometilpiridazin-3-il)-3-azabiciclo[3.2.1]octano (CAS 933798-27-7), (8-sin)-8-(2-ciclopropilmetoxi-4-trifluorometilfenoxi)-3-(6-trifluorometilpiridazin-3-il)-3-azabiciclo[3.2.1]octano (conocido por el documento WO 2007040280 A1, WO 2007040282 A1) (CAS 934001-66-8) y N-[3-cloro-1-(3-piridinil)-1H-pirazol-4-il]-N-etyl-3-[(3,3,3-trifluoropropil)tio]propanamida (conocido por el documento WO 2015/058021 A1, WO 2015/058028 A1) (CAS 1477919-27-9).

Fungicidas

60 Los principios activos especificados en el presente documento por sus nombres comunes ("Common Name") son conocidos y se describen, por ejemplo, en el "Pesticide Manual" (16^a ed., British Crop Protection Council) o pueden buscarse en Internet (por ejemplo: <http://www.alanwood.net/pesticides>).

Todos los componentes de mezcla mencionados de las clases (1) a (15), pueden formar, dado el caso, sales con bases o ácidos adecuados si tienen la capacidad de hacerlo debido a sus grupos funcionales. Todos los componentes de mezcla fungicidas de las clases (1) a (15) mencionados, pueden incluir, dado el caso, formas tautoméricas.

- 5 1) inhibidores de la biosíntesis de ergosterol, por ejemplo (1.001) ciproconazol, (1.002) difenoconazol, (1.003) epoxiconazol, (1.004) fenhexamid, (1.005) fenpropidina, (1.006) fenpropimorf, (1.007) fenpirazamina, (1.008) fluquinconazol, (1.009) flutriafol, (1.010) imazalilo, (1.011) sulfato de imazalilo, (1.012) ipconazol, (1.013) metconazol, (1.014) miclobutanilo, (1.015) paclobutrazol, (1.016) procloraz, (1.017) propiconazol, (1.018) protoconazol, (1.019) pirisoxazol, (1.020) espiroxamina, (1.021) tebuconazol, (1.022) tetaconazol, (1.023) triadimenol, (1.024) tridemorf, (1.025) triticonazol, (1.026) (1R,2S,5S)-5-(4-clorobencil)-2-(clorometil)-2-metil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ilmetil)ciclopentanol, (1.027) (1S,2R,5R)-5-(4-clorobencil)-2-(clorometil)-2-metil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ilmetil)ciclopentanol, (1.028) (2R)-2-(1-clorociclopropil)-4-[(1R)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.029) (2R)-2-(1-clorociclopropil)-4-[(1S)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.030) (2R)-2-[4-(4-clorofenoxy)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol, (1.031) (2S)-2-(1-clorociclopropil)-4-[(1R)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.032) (2S)-2-(1-clorociclopropil)-4-[(1S)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.033) (2S)-2-[4-(4-clorofenoxy)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol, (1.034) (R)-[3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (1.035) (S)-[3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (1.036) [3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (1.037) 1-({(2R,4S)-2-[2-cloro-4-(4-clorofenoxy)fenil]-4-metil-1,3-dioxolan-2-il}metil)-1H-1,2,4-triazol, (1.038) 1-({(2S,4S)-2-[2-cloro-4-(4-clorofenoxy)fenil]-4-metil-1,3-dioxolan-2-il}metil)-1H-1,2,4-triazol, (1.039) tiocianato de 1-[{3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il}metil]-1H-1,2,4-triazol-5-ilo, (1.040) tiocianato de 1-[{rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il}metil]-1H-1,2,4-triazol-5-ilo, (1.041) tiocianato de 1-[{rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il}metil]-1H-1,2,4-triazol-5-ilo, (1.042) 2-[{(2R,4R,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il}-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.043) 2-[{(2R,4R,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il}-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.044) 2-[{(2R,4S,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il}-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.045) 2-[{(2R,4S,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il}-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.046) 2-[{(2S,4R,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il}-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.047) 2-[{(2S,4R,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il}-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.048) 2-[{(2S,4S,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il}-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.049) 2-[{(2S,4S,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il}-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.050) 2-[1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.051) 2-[2-cloro-4-(2,4-diclorofenoxy)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol, (1.052) 2-[2-cloro-4-(4-clorofenoxy)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.053) 2-[4-(4-clorofenoxy)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.054) 2-[4-(4-clorofenoxy)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)pentan-2-ol, (1.055) 2-[4-(4-clorofenoxy)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol, (1.056) 2-[{3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il}metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.057) 2-[{rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il}metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.058) 2-[{rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il}metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.059) 5-(4-clorobencil)-2-(clorometil)-2-metil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ilmetil)ciclopentanol, (1.060) 5-(alilsulfanil)-1-{{3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il}metil}-1H-1,2,4-triazol, (1.061) 5-(alilsulfanil)-1-{{rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il}metil}-1H-1,2,4-triazol, (1.062) 5-(alilsulfanil)-1-{{rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il}metil}-1H-1,2,4-triazol, (1.063) N'-(2,5-dimetil-4-{{3-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil}sulfanil}fenil)-N-etyl-N-metilimidoformamida, (1.064) N'-(2,5-dimetil-4-{{3-(2,2,2-trifluoroetoxi)fenil}sulfanil}fenil)-N-etyl-N-metilimidoformamida, (1.065) N'-(2,5-dimetil-4-{{3-(2,2,3,3-tetrafluoropropoxi)fenil}sulfanil}fenil)-N-etyl-N-metilimidoformamida, (1.066) N'-(2,5-dimetil-4-{{3-(pentafluoroetoxi)fenil}sulfanil}fenil)-N-etyl-N-metilimidoformamida, (1.067) N'-(2,5-dimetil-4-{{3-(tetrafluoroetil)sulfanil}fenoxi}fenil)-N-etyl-N-metilimidoformamida, (1.068) N'-(2,5-dimetil-4-{{3-(trifluoroetil)sulfanil}fenoxi}fenil)-N-etyl-N-metilimidoformamida, (1.069) N'-(2,5-dimetil-4-{{3-(tetrafluoropropil)sulfanil}fenoxi}fenil)-N-etyl-N-metilimidoformamida, (1.070) N'-(2,5-dimetil-4-{{3-(pentafluoroetil)sulfanil}fenoxi}fenil)-N-etyl-N-metilimidoformamida, (1.071) N'-(2,5-dimetil-4-fenoxyfenil)-N-etyl-N-metilimidoformamida, (1.072) N'-(4-{{3-(difluorometoxi)fenil}sulfanil}-2,5-dimetilfenil)-N-etyl-N-metilimidoformamida, (1.073) N'-(4-{{3-(difluorometil)sulfanil}fenoxi}-2,5-dimetilfenil)-N-etyl-N-metilimidoformamida, (1.074) N'-[5-bromo-6-(2,3-dihidro-1H-inden-2-iloxi)-2-metilpiridin-3-il]-N-etyl-N-metilimidoformamida, (1.075) N'-(4-{{4,5-dicloro-1,3-thiazol-2-il}oxi}-2,5-dimetilfenil)-N-etyl-N-metilimidoformamida, (1.076) N'-(5-bromo-6-[(1R)-1-(3,5-difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridin-3-il)-N-etyl-N-metilimidoformamida, (1.077) N'-(5-bromo-6-[(1S)-1-(3,5-difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridin-3-il)-N-etyl-N-metilimidoformamida, (1.078) N'-(5-bromo-6-[(cis-4-isopropilciclohexyl)oxi]-2-metilpiridin-3-il)-N-etyl-N-metilimidoformamida, (1.079) N'-(5-bromo-6-[(trans-4-isopropilciclohexyl)oxi]-2-metilpiridin-3-il)-N-etyl-N-metilimidoformamida, (1.080) N'-(5-bromo-6-[1-(3,5-difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridin-3-il)-N-etyl-N-metilimidoformamida.
- 60 2) inhibidores de la cadena respiratoria en los complejos I o II, por ejemplo (2.001) benzovindiflupir, (2.002) bixafeno, (2.003) boscalid, (2.004) carboxina, (2.005) fluopiram, (2.006) flutolanilo, (2.007) fluxapiroxad, (2.008) furametpir, (2.009) isofetamid, (2.010) isopirazam (enantiómero antiepimérico 1R,4S,9S), (2.011) isopirazam (enantiómero antiepimérico 1S,4R,9R), (2.012) isopirazam (racemato antiepimérico 1RS,4SR,9SR), (2.013) isopirazam (mezcla del racemato sin-epimérico 1RS,4SR,9RS y del racemato antiepimérico 1RS,4SR,9SR),

- (2.014) isopirazam (enantiómero sin-epimérico 1R,4S,9R), (2.015) isopirazam (enantiómero sin-epimérico 1S,4R,9S), (2.016) isopirazam (racemato sin-epimérico 1RS,4SR,9RS), (2.017) penflufen, (2.018) pentiopirad, (2.019) pidiflumetofeno, (2.020) piraziflumid, (2.021) sedaxano, (2.022) 1,3-dimetil-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.023) 1,3-dimetil-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.024) 1,3-dimetil-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.025) 1-metil-3-(trifluorometil)-N-[2-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.026) 2-fluoro-6-(trifluorometil)-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)benzamida, (2.027) 3-(difluorometil)-1-metil-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.028) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.029) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.030) 3-(difluorometil)-N-(7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.031) 3-(difluorometil)-N-[(3R)-7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.032) 3-(difluorometil)-N-[(3S)-7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.033) 5,8-difluoro-N-[2-(2-fluoro-4-[(4-(trifluorometil)piridin-2-il)oxi]fenil)etil]quinazolin-4-amina, (2.034) N-(2-ciclopentil-5-fluorobencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.035) N-(2-terc-butil-5-metilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.036) N-(2-terc-butilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.037) N-(5-cloro-2-etylbenzil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.038) N-(5-cloro-2-isopropilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.039) N-[(1R,4S)-9-(dclorometileno)-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.040) N-[(1S,4R)-9-(dclorometileno)-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.041) N-[1-(2,4-dclorofenil)-1-metoxipropan-2-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.042) N-[2-cloro-6-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.043) N-[3-cloro-2-fluoro-6-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.044) N-[5-cloro-2-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.045) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-N-[5-metil-2-(trifluorometil)bencil]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.046) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-fluoro-6-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.047) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropil-5-metilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.048) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carbotoamida, (2.049) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.050) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(5-fluoro-2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.051) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etyl-4,5-dimetilbencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.052) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etyl-5-fluorobencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.053) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etyl-5-metilbencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.054) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropil-5-fluorobencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.055) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropil-5-metilbencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.056) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropilbencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida.
- 3) inhibidores de la cadena respiratoria en el complejo III, por ejemplo (3.001) ametoctradina, (3.002) amisulbrom, (3.003) azoxistrobina, (3.004) coumetoxistrobina, (3.005) coumoxistrobina, (3.006) ciazofamid, (3.007) dimoxistrobina, (3.008) enoxastrobina, (3.009) famoxadon, (3.010) fenamidon, (3.011) flufenoxistrobina, (3.012) fluoxastrobina, (3.013) kresoxim-metilo, (3.014) metominostrobina, (3.015) orisastrobina, (3.016) picoxistrobina, (3.017) piraclostrobina, (3.018) pirametostrobina, (3.019) piraoxistrobina, (3.020) trifloxistrobina (3.021) (2E)-2-{2-[(1E)-1-3-[(E)-1-fluoro-2-fenilvinil]oxi]fenil}etilideno]amino}oxi)metil]fenil}-2-(metoxiimino)-N-metilacetamida, (3.022) (2E,3Z)-5-[(1-(4-clorofenil)-1H-pirazol-3-il)oxi]-2-(metoxiimino)-N,3-dimetilpent-3-enamida, (3.023) (2R)-2-{2-[(2,5-dimetilfenooxi)metil]fenil}-2-metoxi-N-metilacetamida, (3.024) (2S)-2-{2-[(2,5-dimetilfenooxi)metil]fenil}-2-metoxi-N-metilacetamida, (3.025) (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-il 2-metilpropanoato, (3.026) 2-{2-[(2,5-dimetilfenooxi)metil]fenil}-2-metoxi-N-metilacetamida, (3.027) N-(3-etyl-3,5,5-trimetilciclohexil)-3-formamido-2-hidroxibenzamida, (3.028) (2E,3Z)-5-[(1-(4-cloro-2-fluorofenil)-1H-pirazol-3-il)oxi]-2-(metoxiimino)-N,3-dimetilpent-3-enamida.
- 4) inhibidores de la mitosis y división celular, por ejemplo (4.001) carbendazim, (4.002) dietofencarb, (4.003) etaboxam, (4.004) fluopicolid, (4.005) pencicuron, (4.006) tiabendazol, (4.007) tiofanato-metilo, (4.008) zoxamida, (4.009) 3-cloro-4-(2,6-difluorofenil)-6-metil-5-fenilpiridazina, (4.010) 3-cloro-5-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-6-metilpiridazina, (4.011) 3-cloro-5-(6-cloropiridin-3-il)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorofenil)piridazina, (4.012) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.013) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-bromo-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.014) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-bromofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.015) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-cloro-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.016) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-clorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.017) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.018) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-N-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.019) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-N-(2-cloro-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.020) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-N-(2-clorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.021) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-N-(2-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.022) 4-(4-clorofenil)-5-(2,6-difluorofenil)-3,6-dimetilpiridazina, (4.023) N-(2-bromo-6-fluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.024) N-(2-bromofenil)-4-(2-

cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.025) N-(4-cloro-2,6-difluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina.

5) compuestos que tienen capacidad de actividad multisitio, por ejemplo (5.001) mezcla Bordeaux, (5.002) captafol, (5.003) captan, (5.004) clortalonilo, (5.005) hidróxido de cobre, (5.006) naftenato de cobre, (5.007) óxido de cobre, (5.008) oxicloruro de cobre, (5.009) sulfato de cobre(2+), (5.010) ditianona, (5.011) dodina, (5.012) folpet, (5.013) mancozeb, (5.014) maneb, (5.015) metiram, (5.016) cinc metiram, (5.017) oxina de cobre, (5.018) propineb, (5.019) azufre y preparaciones de azufre que incluyen polisulfuro de calcio, (5.020) tiram, (5.021) zineb, (5.022) ziram.

6) compuestos con capacidad de iniciar una defensa de huésped, por ejemplo (6.001) acibenzolar-S-metilo, (6.002) isotianilo, (6.003) probenazol, (6.004) tiadnilo.

10 7) inhibidores de la biosíntesis de aminoácidos y/o proteínas, por ejemplo (7.001) ciprodinilo, (7.002) kasugamicina, (7.003) clorhidrato de kasugamicina hidrato, (7.004) oxitetraciclina, (7.005) pirimetanilo, (7.006) 3-(5-fluoro-3,3,4,4-tetrametil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina.

(8) inhibidores de la producción de ATP, por ejemplo (8.001) siltiofam.

15 9) inhibidores de la síntesis de pared celular, por ejemplo (9.001) bentiavalicarb, (9.002) dimetomorf, (9.003) flumorf, (9.004) iprovalicarb, (9.005) mandipropamid, (9.006) pirimorf, (9.007) valifenalato, (9.008) (2E)-3-(4-terc-butilfenil)-3-(2-cloropiridin-4-il)-1-(morfolin-4-il)prop-2-en-1-ona, (9.009) (2Z)-3-(4-terc-butilfenil)-3-(2-cloropiridin-4-il)-1-(morfolin-4-il)prop-2-en-1-ona.

10 10) inhibidores de la síntesis de lípidos y membrana, por ejemplo (10.001) propamocarb, (10.002) clorhidrato de propamocarb, (10.003) tolclofos-metilo.

20 11) inhibidores de la biosíntesis de melanina, por ejemplo (11.001) tricicazol, (11.002) {3-metil-1-[(4-metilbenzoi)amino]butan-2-il}carbamato de 2,2,2-trifluoroetilo.

12) inhibidores de la síntesis de ácidos nucleicos, por ejemplo (12.001) benalaxilo, (12.002) benalaxil-M (kiralaxilo), (12.003) metalaxilo, (12.004) metalaxil-M (mefenoxam).

25 13) inhibidores de la transducción de señales, por ejemplo (13.001) fludioxonilo, (13.002) iprodiona, (13.003) procimidona, (13.004) proquinazid, (13.005) quinoxifeno, (13.006) vinclozolina.

14) compuestos que pueden actuar como desacoplantes, por ejemplo (14.001) fluazinam, (14.002) meptildinocap.

15) otros compuestos, por ejemplo (15.001) ácido abscísico, (15.002) bentiazol, (15.003) betoxazina, (15.004) capsimicina, (15.005) carvona, (15.006) quinometionat, (15.007) cufraneb, (15.008) ciflufenamid, (15.009) cimoxanilo, (15.010) ciprosulfamida, (15.011) flutianilo, (15.012) fosetyl-aluminio, (15.013) fosetyl-calcio, (15.014) fosetyl-sodio, (15.015) isotiocianato de metilo, (15.016) metrafenon, (15.017) mildiomicina, (15.018) natamicina, (15.019) dimetilditiocarbamato de níquel, (15.020) nitrotal-isopropilo, (15.021) oxamocarb, (15.022) oxatiapiprolina, (15.023) oxifentiina, (15.024) pentaclorofenol y sales, (15.025) ácido fosfónico y sales del mismo, (15.026) propamocarb-fosetylato, (15.027) pirufenona (clazafenona) (15.028) tebuflouquina, (15.029) tecloftalam, (15.030) tolifenida, (15.031) 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, (15.032) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona, (15.033) 2-(6-bencipiridin-2-il)quinazolina, (15.034) 2,6-dimetil-1H,5H-[1,4]ditiino[2,3-c:5,6-c']dipirrol-1,3,5,7(2H,6H)-tetrona, (15.035) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{2-(prop-2-in-1-iloxy)fenil}-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il]etanona, (15.036) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{5-[2-cloro-6-(prop-2-in-1-iloxy)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il}-1,3-tiazol-2-il)2-[5R)-3-[2-(1-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil)piperidin-4-il]-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il]-3-clorofenilo, (15.040) metanosulfonato de 2-[6-(3-fluoro-4-metoxifenil)-5-metilpiridin-2-il]quinazolina, (15.039) 2-[5R)-3-[2-(1-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil)piperidin-4-il]-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il]-3-clorofenilo, (15.041) 2-[2-(7,8-difluoro-2-metilquinolin-3-il)oxi]fenil]propan-2-ol, (15.042) metanosulfonato de 2-[2-fluoro-6-[8-fluoro-2-metilquinolin-3-il)oxi]fenil]propan-2-ol, (15.043) 2-[3-[2-(1-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil)piperidin-4-il]-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il]-3-clorofenilo, (15.044) metanosulfonato de 2-[3-[2-(1-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil)piperidin-4-il]-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il]-3-clorofenilo, (15.045) 2-fenilfenol y sales del mismo, (15.046) 3-(4,4,5-trifluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina, (15.047) 3-(4,4-difluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina, (15.048) 4-amino-5-fluoropirimidin-2-ol (forma tautomérica: 4-amino-5-fluoropirimidin-2(1H)-ona), (15.049) ácido 4-oxo-4-[2-feniletil]amino]butírico, (15.050) 5-amino-1,3,4-tdiazole-2-tiol, (15.051) 5-cloro-N'-fenil-N'-(prop-2-in-1-iloxy)fenol 2-sulfonohidrazida, (15.052) 5-fluoro-2-[(4-fluorobencil)oxi]pirimidin-4-amina, (15.053) 5-fluoro-2-[(4-metilbencil)oxi]pirimidin-4-amina, (15.054) 9-fluoro-2,2-dimetil-5-(quinolin-3-il)-2,3-dihidro-1,4-benzoxazepina, (15.055) but-3-in-1-il {6-[(Z)-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metileno]amino}oxi]metil]piridin-2-il]carbamato, (15.056) (2Z)-3-amino-2-ciano-3-fenilacrilato de etilo, (15.057) ácido fenoazina-1-carboxílico, (15.058) 3,4,5-trihidroxibenzoato de propilo, (15.059) quinolin-8-ol, (15.060)

sulfato de quinolin-8-ol (2:1), (15.061) {6-[{[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metileno]amino}oxi]metil}piridin-2-il}carbamato de terc-butilo.

Pesticidas biológicos como componentes de mezcla

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

5 Los pesticidas biológicos especialmente incluyen bacterias, hongos, levaduras, extractos vegetales y productos formados por microorganismos, que incluyen proteínas y metabolitos secundarios.

Los pesticidas biológicos incluyen bacterias tales como bacterias formadoras de esporas, bacterias colonizadoras de raíces y bacterias que actúan como insecticidas, fungicidas o nematicidas biológicos.

10 Los ejemplos de las mencionadas bacterias que se usan o que pueden usarse como pesticidas biológicos son:

Bacillus amyloliquefaciens, cepa FZB42 (DSM 231179), o *Bacillus cereus*, especialmente *B. cereus* cepa CNCM I-1562 o *Bacillus firmus*, cepa I-1582 (número de acceso CNCM I-1582) o *Bacillus pumilus*, especialmente cepa GB34 (n.º de acceso ATCC 700814) y cepa QST2808 (n.º de acceso NRRL B-30087), o *Bacillus subtilis*, especialmente cepa GB03 (n.º de acceso ATCC SD-1397), o *Bacillus subtilis* cepa QST713 (n.º de acceso NRRL B-21661) o *Bacillus subtilis* cepa OST 30002 (n.º de acceso NRRL B-50421) *Bacillus thuringiensis*, especialmente *B. thuringiensis* subspecies *israelensis* (serotype H-14), cepa AM65-52 (n.º de acceso ATCC 1276), o *B. thuringiensis* subsp. *aizawai*, especialmente 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 (número de acceso ATCC SD-5834), *Streptomyces microflavus* cepa AQ6121 (= QRD 31.013, NRRL B-50550), *Streptomyces galbus* cepa AQ 6047 (número de acceso NRRL 30232).

20 Los ejemplos de hongos y levaduras que se usan o que pueden usarse como pesticidas biológicos son:

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

30 Los ejemplos de virus que se usan o que pueden usarse como pesticidas biológicos son:

35 Virus granuloso (GV) *Adoxophyes orana* (tortrix de la fruta de verano), virus granuloso *Cidia pomonella* (gusano) (GV), virus de polihedrosis nuclear (NPV) *Helicoverpa armigera* (de la cápsula del algodón), mNPV *Spodoptera exigua* (gusano soldado de la remolacha), mNPV *Spodoptera frugiperda* (gusano cogollero), NPV *Spodoptera littoralis* (gusano de la hoja de algodón africano).

35 También se incluyen bacterias y hongos que se añaden como "inoculantes" a plantas o partes de plantas u órganos de plantas y que, en virtud de sus propiedades particulares, promueven el crecimiento vegetal y la salud de la planta. Los ejemplos abarcan:

40 *Agrobacterium* spp., *Azorhizobium caulinodans*, *Azospirillum* spp., *Azotobacter* spp., *Bradyrhizobium* spp., *Burkholderia* spp., especialmente *Burkholderia cepacia* (previamente conocido como *Pseudomonas cepacia*), *Gigaspora* spp., o *Gigaspora monosporum*, *Glomus* spp., *Laccaria* spp., *Lactobacillus buchneri*, *Paraglomus* spp., *Pisolithus tinctorius*, *Pseudomonas* spp., *Rhizobium* spp., especialmente *Rhizobium trifolii*, *Rhizopogon* spp., *Sclerotium* spp., *Suillus* spp., *Streptomyces* spp.

45 Los ejemplos de extractos vegetales y productos formados por microorganismos, que incluyen proteínas y metabolitos secundarios, que se usan o que pueden usarse como pesticidas biológicos son:

45 Allium sativum, Artemisia absinthium, azadiractina, Biokeeper WP, Cassia nigricans, Celastrus angulatus, Chenopodium anthelminticum, quitina, Armour-Zen, Dryopteris filix-mas, Equisetum arvense, Fortune Aza, Fungastop, Heads Up (extracto de saponina de Chenopodium quinoa), piretrum/piretrinas, Quassia amara, Quercus, Quillaja, Regalia, "Requiem™ Insecticida", rotenona, riania/rianodina, Symphytum officinale, Tanacetum vulgare, timol, Triact 70, TriCon, Tropaeolum majus, Urtica dioica, Veratrin, Viscum album, extracto de Brassicaceae, especialmente polvo de colza oleaginosa o polvo de mostaza.

50 Protectores como componentes de mezcla

Los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') pueden combinarse con protectores, por ejemplo benoxacor, cloquintocet(-mexil), ciometrinilo, ciprosulfamida, diclormid, fenclorazol(-etil), fenclorim, flurazol, fluxofenim, furilazol, isoxadifeno(-etil), mefenpir(-dietyl), anhídrido naftálico, oxabetrinilo, 2-metoxi-N-(4-[(metilcarbamoil)amino]fenil)sulfonil)benzamida (CAS 129531-12-0), 4-(dicloroacetil)-1-oxa-4-azaspiro[4.5]decano (CAS 71526-07-3), 2,2,5-trimetil-3-(dicloroacetil)-1,3-oxazolidina (CAS 52836-31-4).

55 Plantas y partes de plantas

Todas las plantas y partes de plantas pueden tratarse de acuerdo con la invención. Se comprende que las plantas en el presente documento se refiere a todas las plantas y poblaciones de plantas, tales como plantas silvestres deseables y no deseables o plantas de cultivo (que incluyen plantas de cultivo de origen natural), por ejemplo cereales (trigo, arroz, triticale, cebada, centeno, avena), maíz, judía de soja, patata, remolacha, caña de azúcar, tomates, pimiento 5 morrón, pepinos, melones, zanahorias, sandía, cebollas, lechuga, espinaca, puerros, judías, *Brassica oleracea* (por ejemplo repollo) u otras especies de vegetales, algodón, tabaco, colza oleaginosa, así como plantas frutales (siendo las frutas manzanas, peras, frutas cítricas y uvas). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que pueden obtenerse 10 por cruce convencional y procedimientos de optimización o por procedimientos de diseño biotecnológico y genético o combinaciones de estos procedimientos, que incluyen las plantas transgénicas e incluyen las variedades de plantas que están protegidas o no están protegidas por derechos de obtentor. Debe comprenderse que las plantas se refieren 15 a todos los estadios de desarrollo tales como semilla, plántula, plantas jóvenes (inmaduras), hasta e incluyendo plantas maduras. Debe comprenderse que las partes de plantas se refieren a todas las partes y órganos de las plantas por encima y debajo del suelo, tales como brote, hoja, flor y raíz, siendo ejemplos las hojas, agujas, tallos, troncos, flores, 20 cuerpos frutales, frutos y semillas, y también raíces, tubérculos y rizomas. Las partes de las plantas también incluyen plantas cosechadas o partes de las plantas cosechadas y material de propagación vegetativo o generativo, por ejemplo esquejes, tubérculos, rizomas, hijuelos y semillas.

El tratamiento de acuerdo con la invención de las plantas y partes de plantas con los compuestos de fórmula (I) o de la fórmula (I') se realiza directamente o permitiendo que los compuestos actúen en el entorno, el hábitat o el espacio 25 de almacenamiento de las mismas mediante procedimientos de tratamiento convencionales, por ejemplo por inmersión, aspersión, evaporación, niebla, dispersión, pintado, inyección, y, en el caso de material de propagación, especialmente en el caso de semillas, también por aplicación de uno o más recubrimientos.

Como ya se mencionó anteriormente, es posible tratar todas las plantas y sus partes de acuerdo con la invención. En una forma de realización preferente, se tratan especies de plantas y variedades de plantas silvestres, y partes de las 25 mismas, obtenidas por procedimientos de cruce biológico convencionales, tales como cruce o fusión de protoplastos.

En otra forma de realización preferente, se tratan plantas transgénicas y variedades de plantas obtenidas por 30 procedimientos de diseño genético, dado el caso en combinación con procedimientos convencionales (Genetically Modified Organisms (organismos modificados genéticamente)), y partes de las mismas. El término "partes" o "partes de plantas" o "partes vegetales" ha sido explicado precedentemente.

De manera especialmente preferente, de acuerdo con la invención se tratan plantas de las respectivas variedades de 35 plantas utilizadas o comúnmente comercializadas. Por variedades de plantas se entienden plantas con nuevas propiedades (*traits*, (características)), que se han cultivado tanto mediante cultivo convencional, mediante mutagénesis o mediante técnicas de ADN recombinante. Pueden ser variedades, raza, biotipos y genotipos.

Plantas transgénicas, tratamiento de semillas y eventos de integración

Las plantas o variedades de plantas transgénicas (aquellas obtenidas por ingeniería genética) preferidas que pueden 35 tratarse de acuerdo con la invención incluyen todas las plantas que, por modificación genética, recibieron material genético que confiere propiedades útiles ventajosas particulares (*traits*, "características") a esas plantas. Los ejemplos de las mencionadas propiedades son mejor crecimiento vegetal, tolerancia aumentada a altas y bajas temperaturas, tolerancia aumentada a sequías o a niveles de agua o salinidad de suelo, rendimiento de floración mejorado, facilidad 40 de cosecha, maduración acelerada, mayores rendimientos de cosecha, mayor calidad y/o mayor valor nutricional de los productos cosechados, mejor vida útil y/o procesabilidad de los productos cosechados. Otros ejemplos y ejemplos particularmente destacados de tales propiedades son la resistencia aumentada de las plantas contra plagas animales y microbianas, tales como insectos, arácnidos, nematodos, acáridos, babosas y caracoles, debido, por ejemplo, a toxinas formadas en las plantas, en particular aquellas formadas en las plantas por el material genético de *Bacillus thuringiensis* (por ejemplo por los genes CryI(a), CryI(b), CryI(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb 45 y CryIF así como combinaciones de los mismos), y también resistencia aumentada de las plantas contra hongos fitopatógenos, bacterias y/o virus provocada, por ejemplo, por resistencia adquirida sistémica (SAR), sistemina, fitoalexinas, elicidores y genes de resistencia y proteínas y toxinas correspondientemente expresadas, y también tolerancia aumentada de las plantas a determinados principios activos herbicidas, por ejemplo imidazolinonas, sulfonilureas, glifosatos o fosfinotricina (por ejemplo el gen "PAT"). Los genes que confieren las propiedades deseadas 50 (*traits*, "características") en cuestión también pueden estar presentes en combinaciones con otras plantas transgénicas. Los ejemplos de plantas transgénicas mencionadas incluyen las plantas de cultivos importantes, tales como cereales (trigo, arroz, triticale, cebada, centeno, avena), maíz, judía de soja, patata, remolacha, caña de azúcar, tomates, guisantes y otros tipos de vegetales, algodón, tabaco, colza oleaginosa, y también plantas frutales (siendo las frutas manzanas, peras, frutas cítricas y uvas), destacándose en particular maíz, soja, trigo, arroz, patata, algodón, 55 caña de azúcar, tabaco y colza oleaginosa. Las propiedades (*traits*, "características") que se destacan particularmente son la resistencia aumentada de las plantas a insectos, arácnidos, nematodos y babosas y caracoles.

Protección de plantas – tipos de tratamiento

Las plantas y partes de plantas se tratan con los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') directamente o permitiendo 60 que actúen en su entorno, hábitat o espacio de almacenamiento usando procedimientos de tratamiento habituales, por ejemplo por inmersión, aspersión, atomización, irrigación, evaporación, espolvoreado, niebla, difusión, espuma,

5 pintado, rociado, inyección, riego (mojado), irrigación por riego y, en el caso de material de propagación, en particular en el caso de semillas, adicionalmente por tratamiento de semillas en seco, tratamiento de semillas en húmedo, tratamiento por lechada, por incrustación, por recubrimiento con uno o más recubrimientos, etc. También es posible aplicar los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') por el procedimiento de volumen ultrabajo o inyectar la forma de aplicación o el propio compuesto de fórmula (I) o de fórmula (I') al suelo.

Un tratamiento directo preferido de las plantas es la aplicación foliar, es decir los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') se aplican al follaje, en cuyo caso la frecuencia del tratamiento y las cantidades de aplicación deben ajustarse de acuerdo con el nivel de infestación de la plaga en cuestión.

10 En el caso de principios activos sistémicamente eficaces, los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') también logran el acceso a las plantas mediante el sistema de raíces. En ese caso, las plantas se tratan por acción de los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') en el hábitat de la planta. Esto puede realizarse, por ejemplo, por mojado, o por mezcla en el suelo o en la solución de nutrientes, refiriéndose a que la ubicación de la planta (por ejemplo suelo o sistemas hidropónicos) se impregna con una forma líquida de los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I'), o por aplicación al suelo, refiriéndose a que los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') de la invención se introducen en forma 15 sólida (por ejemplo en forma de gránulos) en la ubicación de las plantas. En el caso de cultivos de arrozales, esto también puede realizarse por dosificación del compuesto de fórmula (I) o de fórmula (I') en una forma de aplicación sólida (por ejemplo como gránulos) en un campo de arrozales inundado.

Tratamiento de semillas

20 El control de plagas animales por el tratamiento de la semilla de la planta se conoce desde hace mucho tiempo y es objeto de constantes mejoras. Sin embargo, el tratamiento de semillas acarrea una serie de problemas que no siempre son resueltos de una manera satisfactoria. Por lo tanto, se desea desarrollar procedimientos para proteger la semilla y la planta en germinación que prescindan de, o al menos reduzcan considerablemente, la aplicación adicional de 25 pesticidas durante el almacenamiento, después de la siembra o después de la emergencia de las plantas. También se desea optimizar la cantidad de principio activo usado para proporcionar una protección óptima para la semilla y la planta en germinación del ataque por plagas animales, pero sin dañar la planta en sí misma con el principio activo usado. En particular, los procedimientos para el tratamiento de semillas también deben considerar las propiedades 30 intrínsecas insecticidas o nematicidas de las plantas transgénicas resistentes o tolerantes a plagas con el objetivo de lograr una protección óptima de la semilla y también de la planta en germinación con un gasto mínimo de pesticidas.

35 Por lo tanto la presente invención también se refiere en particular a un procedimiento para la protección de semillas y de las plantas en germinación del ataque de plagas, por tratamiento de la semilla con uno de los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I'). El procedimiento de acuerdo con la invención para proteger semillas y plantas en germinación contra el ataque de plagas además comprende un procedimiento en el cual la semilla se trata simultáneamente en una operación o secuencialmente con un compuesto de fórmula (I) o de fórmula (I') y un componente mezcla. También comprende un procedimiento en el cual la semilla se trata en momentos diferentes con 40 un compuesto de fórmula (I) o la fórmula (I') y un componente de mezcla.

35 La invención además se refiere al uso de los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') para el tratamiento de semillas para proteger la semilla y la planta resultante de plagas animales.

40 La invención además se refiere a una semilla que ha sido tratada con un compuesto de fórmula (I) o de fórmula (I') de la invención para la protección de plagas animales. La invención también se refiere a una semilla que ha sido tratada simultáneamente con un compuesto de fórmula (I) o de fórmula (I') y un componente de mezcla. La invención además 45 se refiere a una semilla que ha sido tratada en momentos diferentes con un compuesto de fórmula (I) o de fórmula (I') y un componente de mezcla. En el caso de semillas que han sido tratadas en momentos diferentes con un compuesto de fórmula (I) o de fórmula (I') y un componente de mezcla, las sustancias individuales pueden estar presentes en la semilla en diferentes capas. En este caso, las capas que comprenden un compuesto de fórmula (I) o de fórmula (I') y componentes de mezcla pueden separarse opcionalmente por una capa intermedia. La invención también se refiere 50 a semillas en las cuales se ha aplicado un compuesto de fórmula (I) o de fórmula (I') y un componente de mezcla como parte de un recubrimiento o como una capa adicional o capas adicionales además del recubrimiento.

La invención además se refiere a una semilla que, después del tratamiento con un compuesto de fórmula (I) o de fórmula (I'), se sometió a un procedimiento de recubrimiento con película para prevenir la abrasión por polvo en la 55 semilla.

Una de las ventajas relacionadas cuando uno de los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') actúa sistémicamente es que el tratamiento de la semilla protege no solo la semilla en sí misma sino también las plantas que resultan de la misma, después de la emergencia, de plagas animales. En este sentido, puede prescindirse del tratamiento inmediato del cultivo en el momento de la siembra o poco después de la misma.

55 Una ventaja adicional es que el tratamiento de la semilla con un compuesto de fórmula (I) o de fórmula (I') puede mejorar la germinación y la emergencia de la semilla tratada.

Igualmente se considera ventajoso que los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') también puedan usarse

especialmente para semillas transgénicas.

Los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') también pueden usarse en combinación con agentes de tecnología de señalización, lo que da como resultado, por ejemplo, una mejor colonización de simbiontes, por ejemplo rizobios, micorizobios y/o bacterias u hongos endófiticos, y/o una fijación optimizada de nitrógeno.

- 5 Los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') son adecuados para la protección de semillas de cualquier variedad de planta que se use en agricultura, en invernaderos, en bosques o en horticultura. Más particularmente, se trata de semillas de cereales (por ejemplo trigo, cebada, centeno, mijo y avena), maíz, algodón, judías de soja, arroz, patatas, girasoles, café, tabaco, canola, colza oleaginosa, remolachas (por ejemplo remolachas azucareras y remolachas para pienso), cacahuetes, verduras (por ejemplo tomates, pepinos, judías, vegetales crucíferos, cebollas y lechuga), plantas frutales, plantas para césped y ornamentales. Tiene una significancia particular el tratamiento de la semilla de cereales (tal como trigo, cebada, centeno y avena), maíz, judías de soja, algodón, canola, colza oleaginosa, verduras y arroz.

10 Como ya se mencionó previamente, el tratamiento de semillas transgénicas con un compuesto de fórmula (I) o de fórmula (I') también tiene una importancia particular. Este involucra a las semillas de las plantas que generalmente contienen al menos un gen heterólogo que controla la expresión de un polipéptido que tiene propiedades insecticidas y/o nematicidas, en particular. Los genes heterólogos en la semilla transgénica pueden tener origen en microorganismos tales como *Bacillus*, *Rhizobium*, *Pseudomonas*, *Serratia*, *Trichoderma*, *Clavibacter*, *Glomus* o *Gliocladium*. La presente invención es particularmente adecuada para el tratamiento de semilla transgénica que comprende al menos un gen heterólogo con origen en *Bacillus* sp. El gen heterólogo más preferentemente deriva de *Bacillus thuringiensis*.

- 15 20 En el contexto de la presente invención, el compuesto de fórmula (I) o de fórmula (I') se aplica a la semilla. La semilla preferentemente se trata en un estado en el que es suficientemente estable para que no ocurra ningún daño durante el curso del tratamiento. En general, la semilla se puede tratar en cualquier momento entre la cosecha y la siembra. Convencionalmente se usan semillas que se han separado de la planta y que se han liberado de las mazorcas, cubiertas, cañas, recubrimiento, pelos o la pulpa de las frutas. Por ejemplo, es posible usar semillas que se han cosechado, limpiado y secado hasta un contenido de humedad que permite su almacenamiento. Como alternativa, es posible usar semillas que, después de su secado, se han tratado con, por ejemplo, agua y luego se han secado nuevamente, por ejemplo por imprimación. En el caso de la semilla de arroz, también es posible usar semillas que se han sumergido, por ejemplo en agua, hasta que las mismas alcancen un cierto estadio del embrión del arroz ("Pigeon Breast Stage" (estadio de pechuga de paloma)) que da como resultado la estimulación de la germinación y una emergencia más uniforme.

25 30 En general, en el tratamiento de la semilla, hay que asegurarse que la cantidad del compuesto de fórmula (I) y/o de fórmula (I') y/o aditivos adicionales que se aplican a la semilla se selecciona de forma que la germinación de la semilla no se vea alterada y que la planta que surge de la misma no resulte dañada. Esto debe asegurarse particularmente en el caso de los principios activos que pueden exhibir efectos fitotóxicos a ciertas cantidades de aplicación.

- 35 40 Los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') en general se aplican a la semilla en una formulación adecuada. Las formulaciones y procedimientos adecuados para el tratamiento de semillas son conocidos para los expertos en la técnica.

45 Los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') se pueden convertir a las formulaciones convencionales de recubrimiento de semillas, tales como soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, espumas, lechadas u otras composiciones de recubrimiento para semillas, y también formulaciones ULV.

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

- 55 60 Los colorantes que pueden estar presentes en las formulaciones de recubrimiento de semillas que se pueden usar de acuerdo con la invención son todos los colorantes convencionales para tales procedimientos. Es posible usar cualquier pigmento que sea moderadamente soluble en agua, o colorantes que sean solubles en agua. Los ejemplos incluyen los colorantes conocidos por los nombres Rhodamin B, C.I. Pigment Red 112 y C.I. Solvent Red 1.

65 Los agentes humectantes que pueden estar presentes en las formulaciones de recubrimiento de semillas que se pueden usar de acuerdo con la invención son todas sustancias que promueven la humectación y que son convencionales en la formulación de principios activos agroquímicos. Con preferencia se usan alquilnaftalenosulfonatos, tales como diisopropil o diisobutilnaftalenosulfonatos.

- 70 75 Los dispersantes y/o emulsionantes adecuados que pueden estar presentes en las formulaciones de recubrimiento de semillas que se pueden usar de acuerdo con la invención son todos los dispersantes no iónicos, aniónicos y catiónicos convencionales en la formulación de principios activos agroquímicos. Pueden usarse con preferencia los dispersantes no iónicos o aniónicos o las mezclas de dispersantes no iónicos o aniónicos. Los dispersantes no iónicos adecuados especialmente incluyen a polímeros en bloque de óxido de etileno/óxido de propileno, alquilfenol poliglicol éteres y

tristirilfenol poliglicol éteres, y los derivados fosfatados o sulfatados de los mismos. Los dispersantes aniónicos adecuados son especialmente lignosulfonatos, sales de ácido poliacrílico y arilsulfonato-formaldehído condensados.

Los antiespumantes que pueden estar presentes en las formulaciones de recubrimiento de semillas que se pueden usar de acuerdo con la invención son todas las sustancias inhibidoras de espuma convencionales en la formulación

5 de principios activos agroquímicos. Se pueden usar con preferencia los antiespumantes siliconados y esteárate de magnesio.

Los conservantes que pueden estar presentes en las formulaciones de recubrimiento de semillas que se pueden usar de acuerdo con la invención son todas las sustancias que se pueden usar para dichos propósitos en agentes agroquímicos. Los ejemplos incluyen diclorofeno y bencil alcohol hemiformal.

10 Los espesantes secundarios que pueden estar presentes en las formulaciones de recubrimiento de semillas que se pueden usar de acuerdo con la invención son todas las sustancias que se usan para dichos propósitos en agentes agroquímicos. Los ejemplos preferidos incluyen derivados de celulosa, derivados de ácido acrílico, xantano, arcillas modificadas y sílice finamente dividida.

15 Los aglutinantes que pueden estar presentes en las formulaciones de recubrimiento de semillas que se pueden usar de acuerdo con la invención son todos los aglutinantes convencionales que se pueden usar en los productos para recubrimiento de semillas. Los ejemplos preferidos incluyen polivinilpirrolidona, polí(acetato de vinilo), alcohol polivinílico y tilosa.

20 Las giberelinas que pueden estar presentes en las formulaciones de recubrimiento de semillas que se pueden usar de acuerdo con la invención son preferentemente las giberelinas A1, A3 (= ácido giberélico), A4 y A7; tiene una preferencia particular el uso de ácido giberélico. Las giberelinas son conocidas (cf. R. Wegler "Chemie der Pflanzenschutz-and Schädlingsbekämpfungsmittel" [Chemistry of Crop Protection Compositions and Pesticids], vol. 2, Springer Verlag, 1970, pág. 401-412).

25 Las formulaciones de recubrimiento de semillas que se pueden usar de acuerdo con la invención se pueden usar para tratar a una amplia variedad de diferentes tipos de semillas, ya sea directamente o bien después de una dilución previa en agua. Por ejemplo, los concentrados o las preparaciones que se pueden obtener de los mismos por dilución con agua pueden usarse para recubrir la semilla de cereales, tales como trigo, cebada, centeno, avena, y triticale, y también la semilla de maíz, arroz, colza oleaginosa, guisantes, judías, algodón, girasoles, soja y remolachas, o también una amplia variedad de semillas de diferentes verduras. Las formulaciones de recubrimiento de semillas que se pueden usar de acuerdo con la invención, o las formas de uso diluidas de las mismas, también se pueden usar para recubrir 30 semillas de plantas transgénicas.

35 Para el tratamiento de semillas con las formulaciones de recubrimiento de semillas que se pueden usar de acuerdo con la invención, o las formas de uso preparadas a partir de las mismas, son útiles todas las unidades de mezclado que se pueden usar convencionalmente para el recubrimiento de semillas. Específicamente, el procedimiento de recubrimiento de semillas tiene las etapas de colocar la semilla en una mezcladora en funcionamiento continuo o discontinuo, agregar una cantidad particular deseada de formulaciones de recubrimiento de semillas, ya sea como tal o después de dilución previa con agua, y mezclar hasta que la formulación se distribuya homogéneamente sobre las semillas. Dado el caso, esto es seguido por una operación de secado.

40 La cantidad de aplicación de las formulaciones de recubrimiento de semillas que se pueden usar de acuerdo con la invención puede variar dentro de un intervalo relativamente amplio. Dependerá del contenido particular de los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') en las formulaciones y de la semilla. Las cantidades de aplicación del compuesto de fórmula (I) o de fórmula (I') en general están en el intervalo entre 0,001 y 50 g por kilogramo de semilla, preferentemente entre 0,01 y 15 g por kilogramo de semilla.

Salud animal

45 En el campo de la salud animal, es decir el campo de la medicina veterinaria, los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') son activos contra parásitos de animales, en particular ectoparásitos o endoparásitos. El término "endoparásito" incluye especialmente a helmintos y protozoos, tales como coccidios. Los ectoparásitos típica y preferentemente son artrópodos, especialmente insectos o acáridos.

50 En el campo de la medicina veterinaria, los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') que tienen toxicidad homeotérmica favorable son adecuados para controlar a parásitos que existen en la explotación ganadera y la cría de animales en ganado, animales de cría, animales de zoológico, animales de laboratorio, animales de laboratorio y animales domésticos. Son activos contra todas las etapas o contra etapas específicas del desarrollo de los parásitos.

55 El ganado agropecuario incluye, por ejemplo, a mamíferos, tales como ovejas, cabras, caballos, burros, camellos, búfalos, conejos, renos, gamos y especialmente ganado ovino y porcino; o aves de corral tales como pavos, patos, gansos y especialmente pollos; o peces o crustáceos, por ejemplo en acuicultura; o, dado el caso, insectos tales como abejas.

Los animales domésticos incluyen, por ejemplo, a mamíferos, tales como hámster, conejillo de las indias, ratas, ratones, chinchillas, hurones, y particularmente perros, gatos, aves de corral, reptiles, anfibios o peces de acuario.

De acuerdo con una forma de realización particular, los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') se administran a mamíferos.

5 De acuerdo con otra forma de realización particular, los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') se administran a aves, a saber aves de corral y particularmente gallináceas.

El uso de los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') para el control de parásitos animales pretende reducir o prevenir la enfermedad, los casos de muerte o las reducciones de desempeño (en el caso de carne, leche, lana, cuero, huevos, miel y similares), de forma que se permita una explotación ganadera más rentable y simple y se consiga un mejor bienestar animal.

10 En relación al campo de la salud animal, el término "control" o "controlar" en el presente contexto significa que los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') son eficaces para reducir la incidencia del parásito particular en un animal infectado con dichos parásitos hasta un grado inocuo. Más específicamente, "controlar" en el presente contexto significa que los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') matan al respectivo parásito, inhiben su crecimiento, o 15 inhiben su proliferación.

15 Los artrópodos incluyen, pero no se limitan a,

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

20 del orden de Mallophagida y los subórdenes Amblycerina e Ischnocerina, por ejemplo, *Bovicola* spp., *Damalina* spp., *Felicola* spp.; *Lepikentron* spp., *Menopon* spp., *Trichodectes* spp., *Trimenopon* spp., *Trinoton* spp., *Werneckiella* spp.;

25 del orden de Diptera y los subórdenes Nematocerina y Brachycerina, por ejemplo, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Atylotus* spp., *Braula* spp., *Calliphora* spp., *Chrysomyia* spp., *Chrysops* spp., *Culex* spp., *Culicoides* spp., *Eusimulium* spp., *Fannia* spp., *Gasterophilus* spp., *Glossina* spp., *Haematobia* spp., *Haematopota* spp., *Hippobosca* spp., *Hybomitra* spp., *Hydrotaea* spp., *Hypoderma* spp., *Lipoptena* spp., *Lucilia* spp., *Lutzomyia* spp., *Melophagus* spp., *Morellia* spp., *Musca* spp., *Odagmia* spp., *Oestrus* spp., *Philipomyia* spp., *Phlebotomus* spp., *Rhinoestrus* spp., *Sarcophaga* spp., *Simulium* spp., *Stomoxys* spp., *Tabanus* spp., *Tipula* spp., *Wilhelmia* spp., *Wohlfahrtia* spp.;

30 del orden de Siphonapterida, por ejemplo, *Ceratophyllus* spp., *Ctenocephalides* spp., *Pulex* spp., *Tunga* spp., *Xenopsylla* spp.;

35 del orden de Heteropterida, por ejemplo *Cimex* spp., *Panstrongylus* spp., *Rhodnius* spp., *Triatoma* spp.; y también plagas molestas y plagas de higiene del orden Blattarida.

Adicionalmente, en el caso de los artrópodos, cabe mencionar, pero no se limitan a, los siguientes Acari: de la subclase Acari (Acarina) y del orden de Metastigmata, por ejemplo de la familia de Argasidae tales como *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Otobius* spp., de la familia de Ixodidae tales como *Amblyomma* spp., *Dermacentor* spp., *Haemaphysalis* spp., *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Rhipicephalus* (*Boophilus*) spp., *Rhipicephalus* spp. (el género original de las garrapatas de huéspedes múltiples); del orden de los Mesostigmata tales como *Dermanyssus* spp., *Ornithonyssus* spp., *Pneumonyssus* spp., *Raillietia* spp., *Sternostoma* spp., *Tropilaelaps* spp., *Varroa* spp.; del orden de los Actinedida (Prostigmata), por ejemplo, *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp., *Demodex* spp., *Listrophorus* spp., *Myobia* spp., *Neotrombicula* spp., *Ornithocheyletia* spp., *Psorergates* spp., *Trombicula* spp.; y del orden de los Acaridida (Astigmata), por ejemplo, *Acarus* spp., *Caloglyphus* spp., *Chorioptes* spp., *Cytodites* spp., *Hypodectes* spp., *Knemidocoptes* spp., *Laminosioptes* spp., *Notoedres* spp., *Otodectes* spp., *Psoroptes* spp., *Pterolichus* spp., *Sarcoptes* spp., *Trixacarus* spp., *Tyrophagus* spp.

40 Los ejemplos de protozoos parásitos incluyen, pero no se limitan a:

45 Mastigophora (Flagellata), tales como:

Metamonada: del orden de los Diplomonadida, por ejemplo *Giardia* spp., *Spironucleus* spp.

Parabasala: del orden de los Trichomonadida, por ejemplo *Histomonas* spp., *Pentatrichomonas* spp., *Tetra spp., *Trichomonas* spp., *Tritrichomonas* spp.*

Euglenozoa: del orden de los Trypanosomatida, por ejemplo *Leishmania* spp., *Trypanosoma* spp.

50 Sarcomastigophora (Rhizopoda) tales como Entamoebidae, por ejemplo *Entamoeba* spp., Centramoebidae, por ejemplo *Acanthamoeba* sp., Euamoebidae, por ejemplo *Hartmanella* sp.

Alveolata tales como Apicomplexa (Sporozoa): por ejemplo *Cryptosporidium* spp.; del orden de Eimeriida, por ejemplo,

- 5 Besnoitia spp., Cystoisospora spp., Eimeria spp., Hammondia spp., Isospora spp., Neospora spp., Sarcocystis spp., Toxoplasma spp.; del orden de los Adeleida, por ejemplo, Hepatozoon spp., Klossiella spp.; del orden de los Haemosporida, por ejemplo, Leucocytzoon spp., Plasmodium spp.; del orden de los Piroplasmida, por ejemplo, Babesia spp., Ciliophora spp., Echinocytzoon spp., Theileria spp.; del orden de los Vesibuliferida, por ejemplo, Balantidium spp., Buxtonella spp.
- Microspora tales como Encephalitozoon spp., Enterocytozoon spp., Globidium spp., Nosema spp., y también, por ejemplo, Myxozoa spp.
- Los helmintos que son patógenos para humanos o animales incluyen, por ejemplo, a Acanthocephala, Nematoden, Pentastoma y Platyhelminthes (por ejemplo Monogenea, cestodos y trematodos).
- 10 Los ejemplos ilustrativos de helmintos incluyen, pero no se limitan a:
- Monogenea: por ejemplo: Dactylogyrus spp., Gyrodactylus spp., Microbothrium spp., Polistoma spp., Troglecephalus spp.;
- Cestodes: del orden de los Pseudophyllidea, por ejemplo: Bothridium spp., Diphyllobothrium spp., Diplogonoporus spp. Ichtyobothrium spp., Ligula spp., Schistocephalus spp., Spirometra spp.
- 15 El orden de los Cyclophylliida, por ejemplo: Andyra spp., Anoplocephala spp., Avitellina spp., Bertiella spp., Cittotaenia spp., Davainea spp., Diorchis spp., Diplopylidium spp., Dipylidium spp., Echinococcus spp., Echinocotyle spp., Echinolepis spp., Hydatigera spp., Hymenolepis spp., Joyeuxiella spp., Mesocestoides spp., Moniezia spp., Paranoplocephala spp., Raillietina spp., Stilesia spp., Taenia spp., Thysaniezia spp., Thysanosoma spp.
- 20 Trematodos: de la clase de los Digenea, por ejemplo: Austrobilharzia spp., Brachylaima spp., Calicophoron spp., Catatropis spp., Clonorchis spp. Collyriclum spp., Cotylophoron spp., Ciclocoelum spp., Dicrocoelium spp., Diplostomum spp., Echinochasmus spp., Echinoparyphium spp., Echinostoma spp., Eurytrema spp., Fasciola spp., Fasciolides spp., Fasciolopsis spp., Fischoederius spp., Gastrothylacus spp., Gigantobilharzia spp., Gigantocotyle spp., Heterophyes spp., Hypoderaeum spp., Leucocloridium spp., Metagonimus spp., Metorchis spp., Nanophyetus spp., Notocotylus spp., Opisthorchis spp., Ornithobilharzia spp., Paragonimus spp., Paramphistomum spp., Plagiorchis spp., Posthodiplostomum spp., Prosthogonimus spp., Schistosoma spp., Trichobilharzia spp., Troglotrema spp., Typhlocoelum spp.
- 25 Nematodos: del orden de los Trichinellida, por ejemplo: Capillaria spp., Trichinella spp., Trichomosoides spp., Trichuris spp.
- 30 Del orden de los Tylenchida, por ejemplo: Micronema spp., Parastrangyloides spp., Strongyloides spp.
- Del orden de los Rhabditida, por ejemplo: Aelurostrongylus spp., Amidostomum spp., Ancylostoma spp., Angiostrongylus spp., Bronchonema spp., Bunostomum spp., Chabertia spp., Cooperia spp., Cooperioides spp., Crenosoma spp., Cyathostomum spp., Ciclocercus spp., Ciclodontostomum spp., Cylicocyclus spp., Cylicostephanus spp., Cylindropharynx spp., Cystocaulus spp., Dictyocaulus spp., Elaphostrongylus spp., Filaroides spp., Globocephalus spp., Graphidium spp., Gyalopephalus spp., Haemonchus spp., Heligmosomoides spp., Hyostrongylus spp., Marshallagia spp., Metastrongylus spp., Muellerius spp., Necator spp., Nematodirus spp., Neostrongylus spp., Nippostrongylus spp., Obeliscoides spp., Oesophagodontus spp., Oesophagostomum spp., Ollulanus spp.; Ornithostrongylus spp., Oslerus spp., Ostertagia spp., Paracooperia spp., Paracrenosoma spp., Parafilaroides spp., Parelaphostrongylus spp., Pneumocaulus spp., Pneumostrongylus spp., Pteriostomum spp., Protostrongylus spp., Spicocaulus spp., Stephanurus spp., Strongylus spp., Syngamus spp., Teladorsagia spp., Trichonema spp., Trichostrongylus spp., Triodontophorus spp., Troglostrongylus spp., Uncinaria spp.
- 35 Del orden de los Spirurida, por ejemplo: Acanthocheilonema spp., Anisakis spp., Ascaridia spp.; Ascaris spp., Ascarops spp., Aspicularis spp., Baylisascaris spp., Brugia spp., Cercopithifilaria spp., Crassicauda spp., Dipetalonema spp., Dirofilaria spp., Dracunculus spp.; Draschia spp., Enterobius spp., Filaria spp., Gnathostoma spp., Gongylonema spp., Habronema spp., Heterakis spp.; Litomosoides spp., Loa spp., Onchocerca spp., Oxyuris spp., Parabronema spp., Parafilaria spp., Parascaris spp., Passalurus spp., Physaloptera spp., Probstmayria spp., Pseudofilaria spp., Setaria spp., Skjabinema spp., Spirocerca spp., Stephanofilaria spp., Strongyluris spp., Syphacia spp., Thelazia spp., Toxascaris spp., Toxocara spp., Wuchereria spp.
- 40 Acanthocephala: del orden de los Oligacanthorhynchida, por ejemplo: Macracanthorhynchus spp., Prosthenorchis spp.; del orden de los Moniliformida, por ejemplo: Moniliformis spp.
- 45 Del orden de los Polymorphida, por ejemplo: Filicollis spp.; del orden de los Echinorhynchida, por ejemplo Acanthocephalus spp., Echinorhynchus spp., Leptorhynchoides spp.
- 50 Pentastoma: del orden de los Porocephalida, por ejemplo, Linguatula spp.

En el campo veterinario y de la explotación ganadera, los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') se administran

por procedimientos generalmente conocidos en la técnica, tales como por vía enteral, parenteral, dérmica o ruta nasal en forma de preparaciones adecuadas. La administración puede ser profiláctica, metafiláctica o terapéutica.

Por lo tanto, una forma de realización de la presente invención se refiere a los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') para su uso como medicamento.

- 5 Otro aspecto se refiere a los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') para su uso como agente antiendoparásito.
- Un aspecto específico adicional de la invención se refiere a los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') para su uso como agente antihelmíntico, especialmente para su uso como nematicida, platihelminticida, acantocefalizida o pentastomicida.
- 10 Un aspecto específico adicional se refiere a los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') para su uso como agente antiprotozoico.
- Otro aspecto se refiere a los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') para usar como agente antiectoparasítico, especialmente como artropodicida, muy particularmente como insecticida o como acaricida.
- 15 Aspectos adicionales la invención son las formulaciones para medicina veterinaria que comprenden una cantidad eficaz de al menos un compuesto de fórmula (I) o de fórmula (I') y al menos uno de los siguientes: un excipiente farmacéuticamente compatible (por ejemplo diluyente sólido o líquido), un agente adyuvante farmacéuticamente compatible (por ejemplo tensioactivos), especialmente un excipiente farmacéuticamente compatible que se usa convencionalmente en las formulaciones para medicina veterinaria y/o un agente adyuvante farmacéuticamente compatible que se usa convencionalmente en formulaciones para medicina veterinaria.
- 20 Un aspecto de la invención relacionado es un procedimiento para la producción de una formulación para medicina veterinaria como se describe en el presente documento, que comprende la etapa de mezclar al menos un compuesto de fórmula (I) o de fórmula (I') con excipientes y agentes adyuvantes farmacéuticamente compatibles, especialmente con excipientes farmacéuticamente compatibles que se usan convencionalmente en formulaciones para medicina veterinaria y/o agentes adyuvantes que se usan convencionalmente en formulaciones para medicina veterinaria.
- 25 Otro aspecto específico de la invención son formulaciones para medicina veterinaria seleccionadas del grupo de formulaciones ectoparasitidas y endoparasitidas, especialmente seleccionadas del grupo de formulaciones antihelmínticas, antiprotozoarias y artropodicidas, muy particularmente seleccionadas del grupo de formulaciones nematicidas, platihelminticidas, acantocefalidicas, pentastomicidas, insecticidas y acaricidas, de acuerdo con los aspectos y procedimientos mencionados para la producción de las mismas.
- 30 Otro aspecto se refiere a un procedimiento para el tratamiento de una infección parasitaria, especialmente una infección causada por un parásito que se selecciona del grupo de los ectoparásitos y los endoparásitos que se mencionan en el presente documento, mediante el uso de una cantidad eficaz de un compuesto de fórmula (I) o de fórmula (I') en un animal, especialmente un animal no humano, que tenga necesidad del mismo.
- 35 Otro aspecto se refiere a un procedimiento para el tratamiento de una infección parasitaria, especialmente una infección causada por un parásito que se selecciona del grupo de los ectoparásitos y los endoparásitos que se mencionan en el presente documento, mediante el uso de una formulación para medicina veterinaria como se define en el presente documento en un animal, especialmente un animal no humano, que tenga una necesidad del mismo.
- Otro aspecto se refiere a el uso de los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') en el tratamiento de una infección por parásitos, especialmente una infección causada por un parásito que se selecciona del grupo de los ectoparásitos y los endoparásitos que se mencionan en el presente documento, en un animal, especialmente un animal no humano.
- 40 En el presente contexto de salud animal o de medicina veterinaria, el término "tratamiento" se refiere un tratamiento profiláctico, metafiláctico y terapéutico.
- En una realización particular, en este sentido, se proporcionan mezclas de al menos un compuesto de fórmula (I) o de fórmula (I') con principios activos, especialmente con endo y ectoparasitidas, para el campo de la medicina veterinaria.
- 45 En el campo de la salud animal, "mezcla" significa no solo que dos (o más) principios activos diferentes se formulan en una formulación común y que se emplean correspondientemente juntos, sino también se refiere a productos que comprenden formulaciones separadas para cada principio activo. En consecuencia, cuando se van a emplear más de dos principios activos, todos los principios activos se pueden formular en una formulación común o bien todos los principios activos se pueden formular en formulaciones separadas; son igualmente concebibles formas mixtas en las que algunos de los principios activos se formulan juntos y algunos de los principios activos se formulan por separado. Las formulaciones separadas permiten una aplicación por separado o sucesiva de los principios activos en cuestión.
- 50 Los principios activos que se especifican en el presente documento por sus nombres comunes ("Common Name") se conocen y se describen, por ejemplo, en el "Pesticid Manual" (véase anteriormente) o se pueden buscar en Internet (por ejemplo: <http://www.alanwood.net/pesticidas>).

Los principios activos a modo de ejemplo del grupo de los ectoparasitidas como componentes mixtos, sin ninguna intención de que esto constituya una restricción, incluyen los insecticidas y acaricidas que se enumeraron en detalle anteriormente. Otros principios activos que se pueden usar se enumeran más adelante de acuerdo con la clasificación mencionada anteriormente basada en IRAC Mode of Action Classification Scheme actual: (1) inhibidores de acetilcolinesterasa (AChE); (2) bloqueantes del canal de cloruro controlado por GABA; (3) moduladores del canal de sodio; (4) moduladores competitivos del receptor nicotínico de acetilcolina (nAChR); (5) moduladores alostéricos del receptor nicotínico de acetilcolina (nAChR); (6) moduladores alostéricos del canal de cloruro controlado por glutamato (GluCl); (7) imitadores de hormonas juveniles; (8) diversos inhibidores no específicos (multisitio); (9) moduladores del órgano cordotonal; (10) inhibidores del crecimiento de acáridos; (12) inhibidores de la sintasa de ATP mitocondrial, tales como alteradores de ATP; (13) desacoplantes de la fosforilación oxidativa mediante alteración del gradiente de protones; (14) bloqueantes del canal receptor nicotínico de acetilcolina; (15) inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 0; (16) inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 1; (17) alteradores de muda (especialmente en el caso de los Diptera, es decir, los dípteros); (18) agonistas del receptor de ecdisona; (19) agonistas del receptor de octopamina; (21) inhibidores del transporte de electrones en el complejo I mitocondrial; (25) inhibidores del transporte de electrones en el complejo II mitocondrial; (20) inhibidores del transporte de electrones en el complejo III mitocondrial; (22) bloqueantes del canal de sodio dependiente de voltaje; (23) inhibidores de acetil CoA carboxilasa; (28) moduladores del receptor de rianodina;

principios activos que tienen mecanismos de acción desconocidos o no específicos, por ejemplo fentrifanilo, fenoxacrim, ciclopreno, clorobenzilato, clordimeform, flubenzimín, diciclanil, amidoflumet, quinometionat, triaratenp, clotiazoben, tetrasul, oleato de potasio, petróleo, metoxadiazona, gossyplur, flutenzina, brompropilato, criolita;

compuestos de otras clases, por ejemplo butacarb, dimetilan, cloetocarb, fosfocarb, pirimifos(-etilo), paration(-etilo), metacrifos, isopropil o-salicilato, triclorfon, sulprofos, propafos, sebufos, piridation, protoato, diclofentión, demeton-S-metil sulfona, isazofos, cianofenfos, dialifos, carbofenotión, autatofos, aromfenvinfos(-metilo), azinfos(-etilo), clorpirifos(-etilo), fosmetilano, iodofenfos, dioxabenzofos, formotion, fonofos, flupirazofos, fensulfotión, etrimfos;

25 compuestos organoclorados, por ejemplo camfeclor, lindano, heptaclor; o fenilpirazoles, por ejemplo acetoprol, pirafluprol, piriprol, vaniliprol, sisapronil; o isoxazolines, por ejemplo sarolaner, afoxolaner, lotilaner, fluralaner;

piretroides, por ejemplo (cis, trans)metoflutrina, proflutrina, flufenprox, flubrocitrinaato, fubfenprox, fenflutrina, protrifenbut, piresmetrina, RU15525, teralletrina, cis-resmetrina, heptaflutrina, bioetanometrina, biopermetrina, fenpiritrina, cis-cipermetrina, cis-permetrina, clocitrina, cihalotrina (lambda), clovaportrina, o compuestos halogenados de hidrocarburo (HCH),

30 neonicotinoides, por ejemplo nitiazina

dicloromezotiaz, triflumezopirim

lactonas macrocíclicas, por ejemplo nemalectina, ivermectina, latidectina, moxidectina, selamectina, eprinomectina, doramectina, emamectina benzoato; milbemicina oxima

35 tripreno, epofenonano, diofenolan;

compuestos biológicos, hormonas o feromonas, por ejemplo productos naturales, por ejemplo turingiensina, codlemona o componentes de nim

dinitrofenoles, por ejemplo dinocap, dinobuton, binapacril;

benzoilureas, por ejemplo fluazurón, penflurón,

40 derivados de amidina, por ejemplo clormebuform, cimiazol, demiditraz

acaricidas de varroa de colmenas, por ejemplo ácidos orgánicos, por ejemplo ácido fórmico, ácido oxálico.

Los principios activos ilustrativos del grupo de los endoparasitidas, como componentes en mezcla, incluyen pero no se limitan a, principios activos antihelmínticos y principios activos antiprotozoicos.

45 Los principios activos antihelmínticos incluyen pero no se limitan a los siguientes principios nematicidas, trematicidas y/o cestocidas activos:

de la clase de las lactonas macrocíclicas, por ejemplo: eprinomectina, abamectina, nemalectina, moxidectina, doramectina, selamectina, lepimectina, latidectina, milbemicina, ivermectina, emamectina, milbemicina;

de la clase de los benzimidazoles y probenzimidazoles, por ejemplo: oxibendazol, mebendazol, triclabendazol, tiofanato, parbendazol, oxfendazol, netobimin, fenbendazol, febantel, tiabendazol, ciclobendazol, cambendazol, albendazol sulfóxido, albendazol, flubendazol;

50 de la clase de los depsipéptidos, preferentemente depsipéptidos cíclicos, especialmente depsipéptidos cíclicos de

24 miembros, por ejemplo: emodépsido, PF1022A;

de la clase de las tetrahidropirimidinas, por ejemplo: morantel, pirantel, oxantel;

de la clase de los imidazotiazoles, por ejemplo: butamisol, levamisol, tetramisol;

de la clase de las aminofenilamidinas, por ejemplo: amidantel, amidantel desacilado (dAMD), tribendimidina;

5 de la clase de los aminoacetonitrilos, por ejemplo: monepantel;

de la clase de las paraherquamicidas, por ejemplo: paraherquamida, derquantel;

de la clase de las salicilanilidas, por ejemplo: tribromsalan, bromoxanida, brotianida, clioxanida, closantel, niclosamida, oxiclozanida, rafoxanida;

10 de la clase de los fenoles sustituidos, por ejemplo: nitroxinil, bitionol, disofenol, hexaclorofeno, niclofolán, meniclofolán;

de la clase de los organofosfatos, por ejemplo: triclorfón, naftalofos, diclorvos/DDVP, crufomato, coumafós, haloxón;

de la clase de las piperazinonas/quinolinas, por ejemplo: praziquantel, epsiprantel;

de la clase de las piperazinas, por ejemplo: piperazina, hidroxizina;

15 de la clase de las tetraciclinas, por ejemplo: tetraciclina, clorotetraciclina, doxiciclina, oxitetraciclina, rolitetraciclina;

de varias otras clases, por ejemplo: bunamidina, niridazol, resorantel, omfalotin, oltipraz, nitroscanato, nitroxinil, oxamníquin, mirasan, miracilo, lucantón, hicantón, hetolin, emetin, dietilcarbamazina, diclorofeno, diamfenétilo, clonazepam, befenio, amoscanato, clorsulón.

Los principios activos antiprotozoicos incluyen pero no se limitan a los siguientes principios activos:

20 de la clase de las triazinas, por ejemplo: diclazuril, ponazuril, letazuril, toltrazuril;

de la clase de los ionóforos de poliéster, por ejemplo: monensina, salinomicina, maduramicina, narasina;

de la clase de las lactonas macrícíclicas, por ejemplo: milbemicina, eritromicina;

de la clase de las quinolonas, por ejemplo: enrofloxacina, pradofloxacina;

de la clase de las quininas, por ejemplo: cloroquina;

25 de la clase de las pirimidinas, por ejemplo: pirimetamina;

de la clase de las sulfonamidas, por ejemplo: sulfaquinoxalina, trimetoprima, sulfaclozina;

de la clase de las tiaminas, por ejemplo: amprolio;

de la clase de las lincosamidas, por ejemplo: clindamicina;

de la clase de las carbanilidas, por ejemplo: imidocarb;

30 de la clase de los nitrofuranos, por ejemplo: nifurtimox;

de la clase de los alcaloides de quinazolinona, por ejemplo: halofuginona;

de varias otras clases, por ejemplo: oxamníquina, paromomicina;

de la clase de las vacunas o antígenos de microorganismos, por ejemplo: Babesia canis rossi, Eimeria tenella, Eimeria praecox, Eimeria necatrix, Eimeria mitis, Eimeria maxima, Eimeria brunetti, Eimeria acervulina, Babesia canis vogeli, Leishmania infantum, Babesia canis, Dictyocaulus viviparus.

Todos los componentes de mezcla mencionados, también pueden formar, dado el caso, sales con bases o ácidos adecuados si es que son capaces de hacerlo en base a sus grupos funcionales.

Control de vectores

40 Los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') también se pueden usar en el control de vectores. En el contexto de la presente invención, un vector es un artrópodo, especialmente un insecto o arácnido, capaz de transmitir patógenos, por ejemplo virus, gusanos, organismos unicelulares y bacterias, desde un reservorio (planta, animal, humano, etc.) a

un huésped. Los patógenos se pueden transmitir a un huésped ya sea por vía mecánica (por ejemplo tracoma por moscas que no pican) a un huésped o después de inyección (por ejemplo parásitos de malaria por mosquitos).

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

1) mosquitos

- 5 - Anopheles: malaria, filariasis;
- Culex: encefalitis japonesa, filariasis, otras enfermedades virales, transmisión de otros gusanos;
- Aedes: fiebre amarilla, fiebre de dengue, otros trastornos virales, filariasis;
- Simuliidae: transmisión de gusanos, especialmente Onchocerca volvulus;
- Psychodidae: transmisión de leishmaniasis
- 10 2) Piojo: infecciones en la piel, tifus epidémico;
- 3) Pulgas: plaga, tifus endémico, gusanos cinta;
- 4) Moscas: enfermedad del sueño (trypanosomiasis); cólera, otras enfermedades bacterianas;
- 5) Acáridos: acariosis, tifus epidémico, rickettsialpox, tularemia, encefalitis de Saint Louis, encefalitis transmitida por garrapatas (TBE), fiebre hemorrágica de Crimea-Congo, borreliosis;
- 15 6) Garrapatas: borelioses tales como *Borrelia bungdorferi* sensu lato., *Borrelia duttoni*, encefalitis transmitida por garrapatas, fiebre Q (*Coxiella burnetii*), babesioses (*Babesia canis canis*), ehrlichiosis.

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

20 Otros ejemplos de vectores en el contexto de la presente invención son insectos y arácnidos tales como mosquitos, especialmente del género Aedes, Anopheles, por ejemplo A. gambiae, A. arabiensis, A. funestus, A. dirus (malaria) y Culex, Psychodidae tales como *Phlebotomus*, *Lutzomyia*, piojo, pulgas, moscas, acáridos y garrapatas, que pueden transmitir patógenos a animales y/o humanos.

25 El control de vectores también es posible si los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') son superadores de resistencias.

Los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') son adecuados para usar en la prevención de enfermedades y/o patógenos transmitidos por vectores. Por lo tanto, otro aspecto de la presente invención es el uso de compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') para el control de vectores, por ejemplo en agricultura, en horticultura, en forestación, en jardines y en lugares de esparcimiento, y también en la protección de materiales y productos almacenados.

30 **Protección de materiales industriales**

Los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') son adecuados para proteger materiales industriales contra ataque o destrucción por insectos, por ejemplo de los órdenes Coleoptera, Hymenoptera, Isoptera, Lepidoptera, Psocoptera y Zygentoma.

35 Los materiales industriales en el presente contexto designan a materiales inanimados, tales como preferentemente plásticos, adhesivos, telas, papeles y cartones, cuero, lana, productos procesados de lana y composiciones de recubrimiento. El uso de la invención para la protección de lana es particularmente preferido.

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

40 En una forma de realización adicional, los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') tienen la forma de un pesticida listo para usar, lo que significan que se pueden aplicar al material en cuestión sin modificaciones adicionales. Otros insecticidas o fungicidas especialmente útiles incluyen los que se mencionaron previamente.

45 También se ha hallado que, sorprendentemente, los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') se pueden usar para proteger objetos que se ponen en contacto con agua salada o agua salobre, especialmente cascos de buques, pantallas, redes, edificios, amarras y sistemas de señalización, contra las incrustaciones. También es posible usar los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I'), solos o en combinaciones con otros principios activos, como agentes antiincrustaciones.

Control de plagas animales en el sector de la higiene

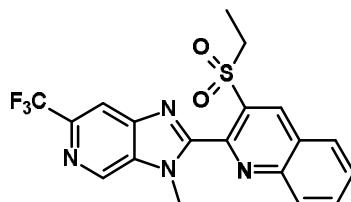
5 Los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') son adecuados para controlar plagas animales en el sector de higiene. Más particularmente, la invención se puede usar en la protección doméstica, de la higiene y de productos almacenados, particularmente para el control de insectos, arácnidos, garrapatas y acáridos que se hallan en espacios cerrados, por ejemplo habitaciones, espacios de fábricas, oficinas, cabinas de vehículos, establecimientos de cría de animales. Para el control de plagas animales, los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') se usan solos o en combinación con otros principios activos y/o agentes auxiliares. Los mismos se usan preferentemente en productos insecticida domésticos. Los compuestos de fórmula (I) o de fórmula (I') son eficaces contra especies sensibles y resistentes, y contra todas las etapas de desarrollo.

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

15 La aplicación se efectúa, por ejemplo, en aerosoles, productos de atomización sin presión, por ejemplo aspersores de bomba y atomizadores, sistemas automáticos de niebla, difusores, espumas, geles, productos de evaporación con comprimidos de evaporación hechos de celulosa o plástico, evaporadores líquidos, evaporadores de gel y membrana, evaporadores impulsados por propelente, sistemas de evaporación libres de energía o pasivos, papeles para polillas, bolsas para polillas y geles para polillas, como gránulos o polvos, en cebos para dispersar o estaciones de cebado.

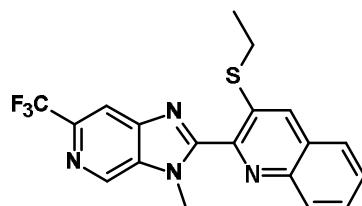
Ejemplos de preparación:

3-Etilsulfanil-2-[3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridin-2-il]quinolina (I-1)



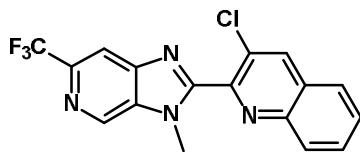
20 Se disolvieron 800 mg (2,06 mmol) de 3-ethylsulfanil-2-[3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridin-2-il]quinolina en 200 ml de diclorometano, se añadieron 948 mg (20,5 mmol) de ácido fórmico y 2,00 g (20,5 mmol) de peróxido de hidrógeno a temperatura ambiente, y luego la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 5 h. La mezcla se diluyó con agua, se añadió solución de bisulfito de sodio, la mezcla se agitó durante 1 h, y luego se añadió solución al 10 % de carbonato ácido de sodio. La fase orgánica se separó, la fase acuosa se extrajo dos veces con diclorometano y las fases orgánicas combinadas luego se liberaron del disolvente a presión reducida. El residuo se purificó mediante purificación por cromatografía de columna de HPLC preparativa con un gradiente de agua/acetonitrilo como eluyente. (logP (neutro): 2,75; MH⁺: 421; RMN de ¹H (400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 1,23 (t, 3H), 3,83 (q, 2H), 3,93 (s, 3H), 7,97 (t, 1H), 8,15 (t, 1H), 8,29 (d, 1H), 8,33 (s, 1H), 8,51 (d, 1H), 9,32 (s, 1H), 9,34 (s, 1H).

30 **3-Etilsulfanil-2-[3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridin-2-il]quinolina (I-2)**



35 Se agitaron 800 mg (2,20 mmol) de 3-cloro-2-[3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridin-2-il]quinolina y 557 mg (6,61 mmol) de etanotiolato de sodio en DMF a temperatura ambiente en argón durante 4 h. Se añadió agua y la mezcla se extrajo dos veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se lavaron con una solución de cloruro de sodio, se eliminaron, se secó sobre sulfato de sodio y se liberaron del disolvente a presión reducida. (logP (neutro): 3,30; MH⁺: 389; RMN de ¹H (400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 1,27 (t, 3H), 3,12 (q, 2H), 4,03 (s, 3H), 7,74-7,84 (m, 2H), 8,08-8,11 (m, 2H), 8,32 (s, 1H), 8,58 (s, 1H), 9,29 (s, 1H).

3-Cloro-2-[3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridin-2-il]quinolina (V-1)

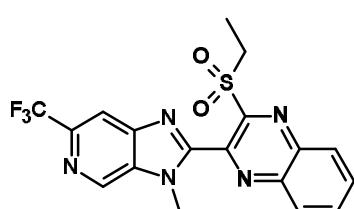


5 Se agitaron 450 mg (2,35 mmol) de N3-metil-6-(trifluorometil)piridin-3,4-diamina, 489 g (2,35 mmol) de ácido 3-cloroquinolin-2-carboxílico y 451 mg (2,35 mmol) de clorhidrato de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etylcarbodiimida (EDCI) en 6 ml de piridina a 120 °C durante 9 h. La mezcla de la reacción se separó del disolvente a presión reducida, luego se añadió agua y la mezcla se extrajo tres veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y se concentró nuevamente.

10 El residuo se disolvió en 15 ml de tolueno, se añadieron 582 mg (3,06 mmol) de ácido paratoluensulfónico, y la mezcla se agitó a 80 °C durante 1 h y 120 °C durante 3 h. A continuación, la mezcla de la reacción se mezcló con solución saturada de carbonato ácido de sodio y se extrajo dos veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y se liberaron del disolvente a presión reducida.

(logP (neutro): 2,89; MH⁺: 363; RMN de ¹H (400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 4,03 (s, 3H), 7,83-7,87 (m, 1H), 7,93-7,97 (m, 1H), 8,15-8,19 (m, 1H), 8,33 (s, 1H), 8,95 (s, 1H), 9,31 (s, 1H).

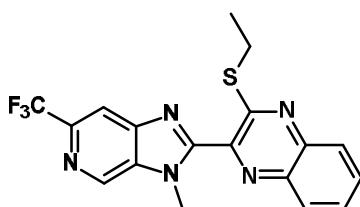
2-Etilsulfonil-3-[3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridin-2-yl]quinoxalina (I-3)



15 Se disolvieron 160,7 mg (0,41 mmol) de 3-ethylsulfanil-2-[3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridin-2-yl]quinoxalina en 10 ml de diclorometano, se añadieron 195,1 mg (0,82 mmol) de ácido meta-cloroperbenzoico a 0 °C, y la mezcla se agitó a 0 °C por 5 min y a temperatura ambiente durante 2 h. La mezcla se mezcló con solución de bisulfito de sodio, se agitó durante 1 h, se diluyó con 20 ml de agua y se ajustó a pH 9-10 con 45 % hidróxido de sodio solución. Luego la mezcla se extrajo tres veces con diclorometano y luego las fases orgánicas combinadas se separaron del disolvente a presión reducida.

20 (logP (neutro): 2,45; MH⁺: 422; RMN de ¹H (400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 1,28 (t, 3H), 3,82 (q, 2H), 4,00 (s, 3H), 8,22-8,26 (m, 2H), 8,33 (s, 1H), 8,38-8,40 (m, 1H), 8,45-8,47 (m, 1H), 9,32 (s, 1H).

2-Etilsulfanil-3-[3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridin-2-yl]quinoxalina (I-4)

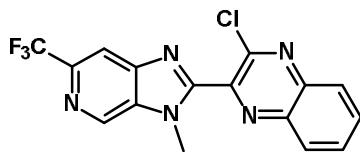


25 Se agitaron 280 mg (0,66 mmol) de 2-cloro-3-[3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridin-2-yl]quinoxalina y 111,4 mg (1,32 mmol) de etanotiolato de sodio en 8 ml de DMF a temperatura ambiente en argón durante 30 min. Se añadió agua y la mezcla se extrajo dos veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se lavaron con una solución de cloruro de sodio, se eliminaron, se secó sobre sulfato de sodio y se liberaron del disolvente a presión reducida. El residuo se purificó mediante purificación por cromatografía de columna con un gradiente de

30 ciclohexano/acetato de etilo como eluyente.

(logP (neutro): 4,10; MH⁺: 390; RMN de ¹H (400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 1,37 (t, 3H), 3,31 (q, 2H), 4,18 (s, 3H), 7,85 (t, 1H), 7,96 (t, 1H), 8,08 (d, 1H), 8,16 (d, 1H), 8,37 (s, 1H), 9,33 (s, 1H).

2-Cloro-3-[3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridin-2-yl]quinoxalina (V-2)

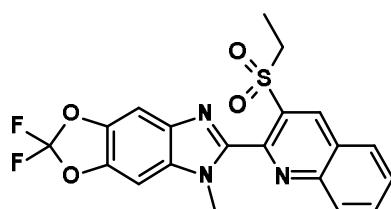


Se agitaron 385 mg (2,01 mmol) de N3-metil-6-(trifluorometil)piridin-3,4-diamina, 504 mg (2,41 mmol) de ácido 3-cloroquinoxalina-2-carboxílico y 386 mg (2,01 mmol) de clorhidrato de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-ethylcarbodiimida (EDCI) en 10 ml de piridina a temperatura ambiente durante 18 h. La mezcla de la reacción se separó del disolvente a presión reducida, luego se añadió agua y la mezcla se extrajo tres veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y se concentró nuevamente.

El residuo se disolvió en 5 ml de tolueno, se añadieron 181,3 mg (0,95 mmol) de ácido paratoluensulfónico, y la mezcla se agitó a 120 °C durante 2 h. A continuación, la mezcla de la reacción se mezcló con solución saturada de carbonato ácido de sodio y se extrajo dos veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y se liberaron del disolvente a presión reducida.

(logP (neutro): 2,84; M⁺: 364; RMN de ¹H (400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 4,12 (s, 3H), 8,03-8,13 (m, 2H), 8,22-8,31 (m, 2H), 8,37 (s, 1H), 9,33 (s, 1H).

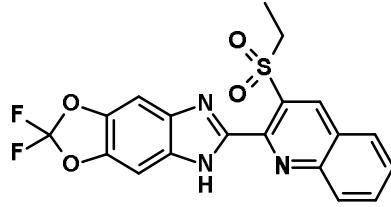
6-(3-Etulsulfonil-2-quinolil)-2,2-difluoro-7-metil-[1,3]dioxolo[4,5-f]bencimidazol



Se disolvieron 13 mg (0,03 mmol) de 6-(3-etulsulfonil-2-quinolil)-2,2-difluoro-5H-[1,3]dioxolo[4,5-f]bencimidazol, 4,9 mg (0,03 mmol) de yoduro de metilo y 8,6 mg (0,06 mmol) de carbonato de potasio en 3 ml de acetona y se agitó a reflujo durante 3 h. La mezcla de la reacción se retiró por filtración, el licor madre se separó del disolvente, el residuo se colocó en diclorometano, se lavó con agua, se secó sobre sulfato de sodio y luego el disolvente se eliminó por destilación a presión reducida.

(logP (neutro): 3,39; M⁺: 432; RMN de ¹H(400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 1,23 (t, 3H), 3,76 (s, 3H), 3,90 (q, 2H), 7,80 (s, 1H), 7,91 (s, 1H), 7,93 (t, 1H), 8,12 (t, 1H), 8,25 (d, 1H), 8,47 (d, 1H), 9,28 (s, 1H).

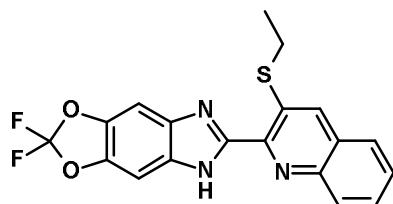
6-(3-Etulsulfonil-2-quinolil)-2,2-difluoro-5H-[1,3]dioxolo[4,5-f]bencimidazol



Se disolvieron 26 mg (0,06 mmol) de 6-(3-etulsulfanil-2-quinolil)-2,2-difluoro-5H-[1,3]dioxolo[4,5-f]bencimidazol en 3 ml de diclorometano, 9,2 mg (0,20 mmol) de ácido fórmico y se añadieron 45,4 mg (0,46 mmol) de peróxido de hidrógeno 35 % a temperatura ambiente, y luego la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 4 h. A continuación, se añadieron otros 3 equivalentes de ácido fórmico y 7 equivalentes de peróxido de hidrógeno 35 % y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante otras 2 h. La mezcla de la reacción se diluyó con agua y se mezcló por adición con solución de bisulfito de sodio, se agitó durante 30 min, y luego se mezcló por adición con solución saturada de carbonato ácido de sodio. La fase orgánica se separó, la fase acuosa se extrajo dos veces con diclorometano, y las fases orgánicas combinadas luego se liberaron del disolvente a presión reducida. El residuo se purificó mediante purificación por cromatografía de columna con un gradiente de ciclohexano/acetato de etilo (70:30 a 30:70) como eluyente.

(logP (neutro): 3,37; M⁺: 418; RMN de ¹H(400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 1,30 (t, 3H), 4,31 (q, 2H), 7,63 (br. s, 1H), 7,80 (br. s, 1H), 7,89 (t, 1H), 8,10 (t, 1H), 8,24 (d, 1H), 8,43 (d, 1H), 9,27 (s, 1H), 13,54 (s, 1H).

6-(3-Etulsulfanil-2-quinolil)-2,2-difluoro-5H-[1,3]dioxolo[4,5-f]bencimidazol

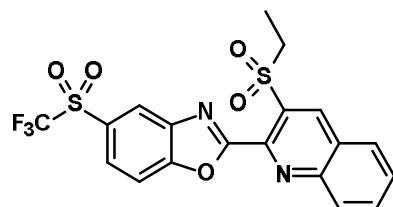


Se agitaron 590 mg (2,97 mmol) de 2,2-difluoro-1,3-benzodioxol-5,6-diamina, 926,7 mg (3,57 mmol) de ácido 3-ethylsulfanilquinolin-2-carboxílico, 576,9 mg (2,97 mmol) de clorhidrato de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-ethylcarbodiimida (EDCI) y 4,4 mg de filtro molecular (4 A) en 30 ml de piridina en argón a 120 °C durante 8 h. La mezcla de la reacción

5 se separó del disolvente a presión reducida, y el residuo se colocó en acetato de etilo y se lavó con agua. La fase acuosa se extrajo dos veces con acetato de etilo, las fases orgánicas se combinaron y se secó sobre sulfato de sodio, y luego el disolvente se eliminó por destilación a presión reducida. El residuo se agitó a reflujo en 30 ml de cloruro de fosforilo durante 4 h y luego el disolvente se eliminó nuevamente a presión reducida. El residuo se colocó en diclorometano, se lavó con agua y se secó sobre sulfato de sodio, y luego el disolvente se eliminó por destilación a presión reducida. El residuo se purificó mediante purificación por cromatografía de columna con un gradiente de ciclohexano/acetato de etilo (70:30 a 0:100) como eluyente.

10 (logP (neutro): 4,26; MH⁺: 386; RMN de ¹H(400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 1,39 (t, 3H), 3,14 (q, 2H), 7,56 (br. s, 1H), 7,66 (t, 1H), 7,76 (t, 1H), 7,84 (br. s, 1H), 8,02 (d, 1H), 8,07 (d, 1H), 8,37 (s, 1H), 13,31 (s, 1H).

15 **2-(3-Etilsulfonil-2-quinolil)-5-(trifluorometilsulfonil)-1,3-benzoxazol;** caso Aa = CH con Q = Q4; Ejemplo comparativo

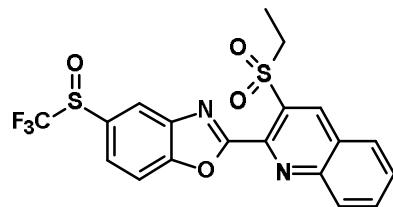


Se disolvieron 103 mg (0,06 mmol) de 2-(3-ethylsulfonil-2-quinolil)-5-(trifluorometilsulfanil)-1,3-benzoxazol en 12 ml de diclorometano, y se añadieron 182 mg (3,93 mmol) de ácido fórmico y 1,81 g (18,59 mmol) de peróxido de hidrógeno 35 % a temperatura ambiente, y luego la mezcla se agitó a 40 °C por 72 h. La mezcla de la reacción se diluyó con agua y se mezcló por adición con solución de bisulfito de sodio, se agitó durante 30 min, y luego se mezcló por adición

20 con solución saturada de carbonato ácido de sodio. La fase orgánica se separó, la fase acuosa se extrajo dos veces con diclorometano y las fases orgánicas combinadas luego se liberaron del disolvente a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía de columna con un gradiente de diclorometano/acetato de etilo (0:100 a 40:60) como eluyente.

25 (logP (neutro): 3,62; MH⁺: 471; RMN de ¹H(400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 1,33 (t, 3H), 4,00 (q, 2H), 8,00 (t, 1H), 8,18 (t, 1H), 8,32-8,37 (m, 2H), 8,45 (d, 1H), 8,51 (d, 1H), 8,87 (s, 1H), 9,40 (s, 1H).

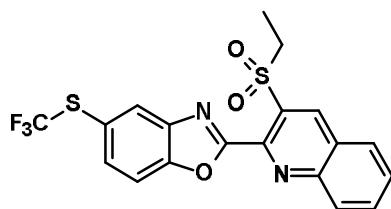
2-(3-Etilsulfonil-2-quinolil)-5-(trifluorometilsulfinil)-1,3-benzoxazol; caso Aa = CH con Q = Q4; Ejemplo comparativo



30 El mismo procedimiento que se describió para la síntesis de 2-(3-ethylsulfonil-2-quinolil)-5-(trifluorometilsulfonil)-1,3-benzoxazol se utilizó también para obtener el derivado correspondiente de trifluorometilsulfóxido 2-(3-ethylsulfonil-2-quinolil)-5-(trifluorometilsulfonil)-1,3-benzoxazol.

(logP (neutro): 3,05; MH⁺: 455; RMN de ¹H(400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 1,32 (t, 3H), 3,99 (q, 2H), 7,99 (t, 1H), 8,11-8,18 (m, 2H), 8,32-8,34 (m, 2H), 8,50 (d, 1H), 8,55 (s, 1H), 9,38 (s, 1H).

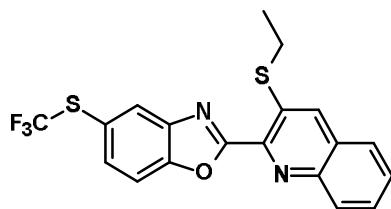
35 **2-(3-Etilsulfonil-2-quinolil)-5-(trifluorometilsulfanil)-1,3-benzoxazol;** caso Aa = CH con Q = A4; Ejemplo comparativo



Se disolvieron 244 mg (0,57 mmol) de 2-(3-ethylsulfanil-2-quinolil)-5-(trifluoromethylsulfanil)-1,3-benzoxazol en 16 ml de diclorometano, se añadieron 157,5 mg (3,42 mmol) de ácido fórmico y 554,0 mg (5,7 mmol) de peróxido de hidrógeno 35 % a temperatura ambiente, y luego la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 6 h. La mezcla de la reacción

- 5 se diluyó con agua y se mezcló por adición con solución de bisulfito de sodio, se agitó durante 30 min, y luego se mezcló por adición con solución saturada de carbonato ácido de sodio. La fase orgánica se separó, la fase acuosa se extrajo dos veces con diclorometano y las fases orgánicas combinadas luego se liberaron del disolvente a presión reducida. El residuo se purificó mediante purificación por cromatografía de columna con un gradiente de ciclohexano/acetato de etilo (70:30 a 0:100) como eluyente.
- 10 (logP (neutro): 4,17; MH⁺: 439; RMN de ¹H(400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 1,32 (t, 3H), 3,98 (q, 2H), 7,93-8,00 (m, 2H), 8,13-8,18 (m, 2H), 8,31 (d, 1H), 8,40 (s, 1H), 8,50 (d, 1H), 9,37 (s, 1H).

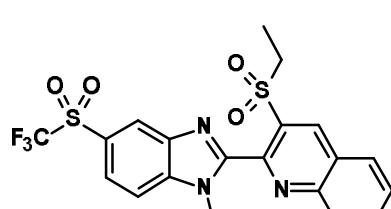
2-(3-Etilsulfanil-2-quinolil)-5-(trifluoromethylsulfanil)-1,3-benzoxazol: caso Aa = CH con Q = Q4; Ejemplo comparativo



- 15 Se agitaron 446 mg (2,02 mmol) de 2-amino-4-(trifluoromethylsulfanil)fenol, 708,8 mg (2,43 mmol) de ácido 3-ethylsulfanilquinolin-2-carboxílico y 465,9 mg (2,97 mmol) de clorhidrato de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etylcarbodiimida (EDCI) en 20 ml de piridina en argón a 80 °C durante 4 h. La mezcla de la reacción se separó del disolvente a presión reducida y el residuo se purificó mediante purificación por cromatografía de columna con ciclohexano/acetato de etilo como eluyente.

- 20 Se agitaron 540 mg (1,17 mmol) del intermediario 3-ethylsulfanil-N-[2-hidroxi-5-(trifluoromethylsulfanil)fenil]quinolin-2-carboxamida preparado de esta manera en 30 ml de tetrahidrofurano en presencia de 409 mg (1,68 mmol) de azodicarboxilato de di-2-metoxietilo (DMEAD) y 434 mg de trifenilfosfina a temperatura ambiente durante 1 h y a 50 °C durante 1 h. A continuación, la mezcla de la reacción se separó del disolvente a presión reducida y el residuo se purificó mediante purificación por cromatografía de columna con un gradiente de ciclohexano/acetato de etilo (80:20 a 40:60) como eluyente.
- 25 (logP (neutro): 5,43; MH⁺: 407; RMN de ¹H(400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 1,38 (t, 3H), 3,21 (q, 2H), 7,73-7,82 (m, 2H), 7,90 (d, 1H), 8,07-8,15 (m, 3H), 8,41 (s, 1H), 8,54 (s, 1H).

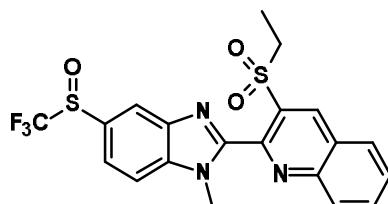
3-Etilsulfonil-2-[1-metil-5-(trifluoromethylsulfonil)bencimidazol-2-il]quinolina: caso Aa = CH con Q = Q1; Ejemplo comparativo



- 30 Se disolvieron 71 mg (0,15 mmol) de 3-ethylsulfonil-2-[1-metil-5-(trifluoromethylsulfonil)bencimidazol-2-il]quinolina en 6 ml de acetonitrilo, se añadieron 10,0 mg (0,02 mmol) de tungstato de sodio(VI) dihidrato y 738,0 mg (7,58 mmol) de peróxido de hidrógeno 35 % a temperatura ambiente, y luego la mezcla se agitó a reflujo por 24 h. La mezcla de la reacción se diluyó con agua y se mezcló por adición con solución de bisulfito de sodio, se agitó durante 30 min, y luego se mezcló por adición con solución saturada de carbonato ácido de sodio. La fase orgánica se separó, la fase acuosa se extrajo dos veces con diclorometano y las fases orgánicas combinadas luego se liberaron del disolvente a presión reducida. El residuo se purificó mediante purificación por cromatografía de columna con un gradiente de diclorometano/acetato de etilo (70:30 a 0:100) como eluyente.

(logP (neutro): 3,42; MH⁺: 484; RMN de ¹H(400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 1,24 (t, 3H), 3,87 (q, 2H), 3,89 (s, 3H), 7,97 (t, 1H), 8,10-8,28 (m, 4H), 8,50 (d, 1H), 8,56 (s, 1H), 9,34 (s, 1H).

3-Etilsulfonil-2-[1-metil-5-(trifluorometilsulfanil)bencimidazol-2-il]quinolina; caso Aa = CH con Q = Q1; Ejemplo comparativo

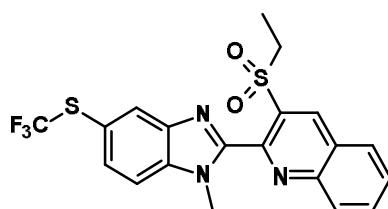


5

Se disolvieron 262 mg (0,62 mmol) de 3-ethylsulfanil-2-[1-metil-5-(trifluorometilsulfanil)bencimidazol-2-il]quinolina en 6 ml de diclorometano, se añadieron 143,7 mg (3,12 mmol) de ácido fórmico y 424,9 mg (4,37 mmol) de peróxido de hidrógeno 35 % a temperatura ambiente, y luego la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 4 h. La mezcla de la reacción se diluyó con agua y se mezcló por adición con solución de bisulfito de sodio, se agitó durante 30 min, y luego se mezcló por adición con solución saturada de carbonato ácido de sodio. La fase orgánica se separó, la fase acuosa se extrajo dos veces con diclorometano y las fases orgánicas combinadas luego se liberaron del disolvente a presión reducida. El residuo se purificó mediante purificación por cromatografía de columna con un gradiente de ciclohexano/acetato de etilo (80:20 a 0:100) como eluyente.

(logP (neutro): 2,79; MH⁺: 468; RMN de ¹H(400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 1,24 (t, 3H), 3,85 (s, 1H), 3,90 (q, 2H), 7,91-7,97 (m, 2H), 8,10-8,15 (m, 2H), 8,26 (d, 1H), 8,34 (s, 1H), 8,50 (d, 1H), 9,32 (s, 1H).

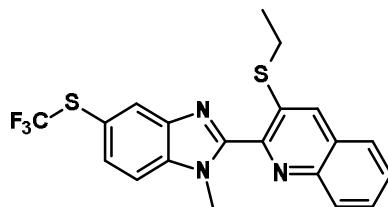
3-Etilsulfonil-2-[1-metil-5-(trifluorometilsulfanil)bencimidazol-2-il]quinolina; caso Aa = CH con Q = Q1; Ejemplo comparativo



El mismo procedimiento que se describió para la síntesis de 3-ethylsulfonil-2-[1-metil-5-(trifluorometilsulfanil)bencimidazol-2-il]quinolina se utilizó también para obtener el derivado correspondiente de trifluorometilsulfuro 3-ethylsulfonil-2-[1-metil-5-(trifluorometilsulfanil)bencimidazol-2-il]quinolina.

(logP (neutro): 3,96; MH⁺: 452; RMN de ¹H(400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 1,23 (t, 3H), 3,80 (s, 1H), 3,90 (q, 2H), 7,71 (d, 1H), 7,90-7,97 (m, 2H), 8,11-8,15 (m, 2H), 8,26 (d, 1H), 8,49 (d, 1H), 9,31 (s, 1H).

3-Etilsulfanil-2-[1-metil-5-(trifluorometilsulfanil)bencimidazol-2-il]quinolina

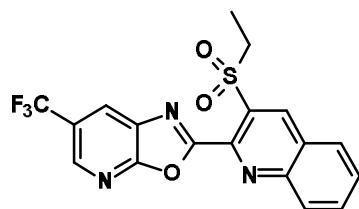


25

Se agitaron 806 mg (3,37 mmol) de N1-metil-4-(trifluorometilsulfanil)fenilen-1,2-diamina, 966,5 mg (4,04 mmol) de ácido 3-ethylsulfanilquinolin-2-carboxílico, 673,0 mg (3,37 mmol) de clorhidrato de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-ethylcarbodiimida (EDCI) y 4 mg de filtro molecular (4 A) en 30 ml de piridina en argón a 120 °C durante 8 h. La mezcla de la reacción se separó del disolvente a presión reducida, y el residuo se colocó en acetato de etilo y se lavó una vez con agua. La fase acuosa se extrajo dos veces con acetato de etilo, las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y el disolvente luego se eliminó por destilación a presión reducida. El residuo se purificó mediante purificación por cromatografía de columna con un gradiente de agua/acetonitrilo además de 0,1 ml/l de ácido fórmico como eluyente.

(logP (neutro): 4,63; MH⁺: 420; RMN de ¹H(400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 1,27 (t, 3H), 3,11 (q, 2H), 3,91 (s, 1H), 7,69-7,80 (m, 4H), 7,89 (d, 1H), 8,07 (d, 1H), 8,16 (s, 1H), 8,53 (s, 1H).

2-(3-Etilsulfonil-2-quinolil)-6-metiloxazolo[5,4-b]piridina

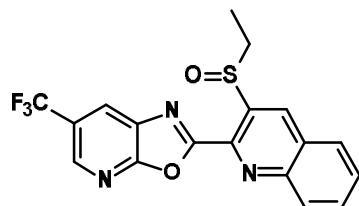


Se disolvieron 86 mg (0,21 mmol) de 2-(3-ethylsulfanil-2-quinolil)-6-metioxazolo[5,4-b]piridina en 6 ml de diclorometano, se añadieron 49,6 mg (1,07 mmol) de ácido fórmico y 188,4 mg (1,93 mmol) de peróxido de hidrógeno 35 % a temperatura ambiente, y luego la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 7 h. La mezcla de la reacción se

5 diluyó con agua y se mezcló por adición con solución de bisulfito de sodio, se agitó durante 30 min, y luego se mezcló por adición con solución saturada de carbonato ácido de sodio. La fase orgánica se separó, la fase acuosa se extrajo dos veces con diclorometano y las fases orgánicas combinadas luego se liberaron del disolvente a presión reducida. El residuo se purificó mediante purificación por cromatografía de columna con un gradiente de ciclohexano/acetato de etilo (80:20 a 0:100) como eluyente.

10 (logP (neutro): 3,27; MH⁺: 408; RMN de ¹H(400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 1,32 (t, 3H), 3,93 (q, 2H), 8,00 (t, 1H), 8,18 (t, 1H), 8,35 (d, 1H), 8,51 (d, 1H), 9,03 (s, 1H), 9,04 (s, 1H), 9,40 (s, 1H).

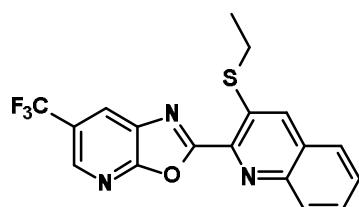
2-(3-Etilsulfinil-2-quinolil)-6-metioxazolo[5,4-b]piridina; caso Aa = CH con Q = Q5; Ejemplo comparativo



15 El mismo procedimiento que se describió para la síntesis de 2-(3-ethylsulfonil-2-quinolil)-6-metioxazolo[5,4-b]piridina se utilizó también para obtener el derivado correspondiente de sulfóxido 2-(3-ethylsulfinil-2-quinolil)-6-metioxazolo[5,4-b]piridina.

(logP (neutro): 2,98; MH⁺: 492; RMN de ¹H(400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 1,25 (t, 3H), 2,93-3,02 (m, 1H), 3,47-3,56 (m, 1H), 7,90 (t, 1H), 8,05 (t, 1H), 8,37-8,41 (m, 2H), 8,99 (s, 1H), 9,03 (s, 1H), 9,10 (s, 1H).

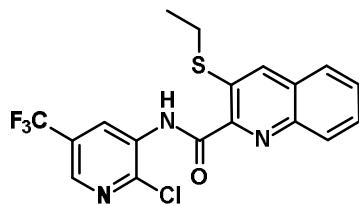
2-(3-Etilsulfanil-2-quinolil)-6-metioxazolo[5,4-b]piridina



20 Se disolvieron 172 mg (0,36 mmol) de N-(2-cloro-5-metil-3-piridil)-3-ethylsulfanilquinolin-2-carboxamida en 6 ml de dimetilformamida, se añadieron 38,9 mg (0,36 mmol) de carbonato de sodio y la mezcla se agitó a 145 °C durante 4 h. La mezcla se añadió a hielo-agua y se extrajo dos veces con acetato de etilo, las fases orgánicas combinadas se lavaron con agua y se secó sobre sulfato de sodio, y el disolvente se eliminó por destilación a presión reducida. El residuo se purificó mediante purificación por cromatografía de columna con un gradiente de ciclohexano/acetato de etilo como eluyente.

25 (logP (neutro): 4,36; MH⁺: 376; RMN de ¹H(400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 1,38 (t, 3H), 3,22 (q, 2H), 7,75-7,85 (m, 2H), 8,09 (d, 1H), 8,17 (d, 1H), 8,55 (s, 1H), 8,97 (s, 1H), 9,01 (s, 1H).

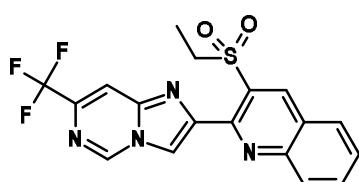
N-(2-Cloro-5-metil-3-piridil)-3-ethylsulfanilquinolin-2-carboxamida (IV-1)



Se disolvieron 240 mg (1,19 mmol) de 2-cloro-5-(trifluorometil)piridin-3-amina y 357 mg (1,31 mmol) de 3-
 5 etilsulfanilquinolin-2-ácido carboxílico junto con 0,39 ml (4,78 mmol) de piridina en 20 ml de dioxano, se añadieron
 367 mg (2,39 mmol) de cloruro de fosforilo, y la mezcla se agitó a reflujo por 90 min. La mezcla se concentró, el residuo
 10 se colocó en acetato de etilo y se lavó con agua, y la fase acuosa se extrajo dos veces con acetato de etilo. Las fases
 orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y el disolvente se eliminó por destilación a presión reducida.
 El residuo se purificó mediante purificación por cromatografía de columna con un gradiente de ciclohexano/acetato de
 etilo (80:20 a 40:60) como eluyente.

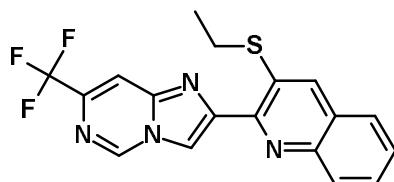
10 (logP (neutro): 5,71; MH⁺: 412; RMN de ¹H(400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 1,37 (t, 3H), 3,12 (q, 2H), 7,74-7,84 (m, 2H),
 8,07-8,14 (m, 2H), 8,49 (s, 1H), 8,70 (s, 1H), 9,02 (s, 1H), 11,12 (s, 1H).

3-(Etilsulfonil)-2-[7-(trifluorometil)imidazo[1,2-c]pirimidin-2-il]quinolina



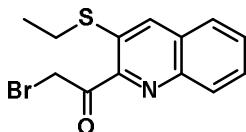
15 Se disolvió 3-(etilsulfanil)-2-[7-(trifluorometil)imidazo[1,2-c]pirimidin-2-il]quinolina (24 mg, 0,06 mmol) en 2 ml de
 diclorometano. Se añadieron peróxido de hidrógeno (solución acuosa 35 %, 43 mg, 0,44 mmol) y ácido fórmico (15 mg,
 0,32 mmol) y la mezcla de la reacción se agitó durante 12 h. Mientras se enfriaba con hielo, se añadió por goteo 1 ml
 20 de solución 40 % de bisulfito de sodio y la mezcla se agitó durante 1 h. Las fases se separaron, y la fase orgánica se
 lavó con solución de carbonato ácido de sodio, se secó sobre sulfato de sodio y se concentró en un evaporador
 rotativo. El residuo se purificó mediante cromatografía (eluyente: ciclohexano, acetato de etilo).
 logP (neutro): 2,63; MH⁺: 407; RMN de ¹H (400MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 9,70 (s, 1H), 9,23 (s, 1H), 8,74 (s, 1H), 8,41 –
 8,39 (m, 2H), 8-21-8,19 (m, 1H), 8,08 – 8,04 (m, 1H), 7,87-7,83 (m, 1H), 4,17 – 4,12 (m, 2H), 1,30 – 1,27 (m, 3H).

3-(Etilsulfanil)-2-[7-(trifluorometil)imidazo[1,2-c]pirimidin-2-il]quinolina



25 Se disolvieron 2-bromo-1-[3-(etilsulfanil)quinolin-2-il]etanona (453 mg, 0,92 mmol) y 6-(trifluorometil)pirimidin-4-amina
 (150 mg, 0,92 mmol) en 5 ml de terc-butanol, y se añadió carbonato ácido de sodio (386 mg, 4,59 mmol). La mezcla
 de la reacción se agitó a 80 °C durante 5 h. Despues de eliminar el disolvente en un evaporador rotativo, el residuo se
 purificó mediante cromatografía.
 logP (neutro): 3,24; MH⁺: 375; RMN de ¹H (400MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 9,68 (s, 1H), 8,80 (s, 1H), 8,37 (s, 2H), 8,02 –
 7,99 (m, 2H), 7,75 – 7,70 (m, 1H), 7,66 – 7,62 (m, 1H), 3,16 – 3,10 (m, 2H), 1,34 – 1,30 (m, 3H).

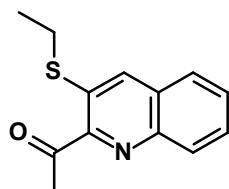
2-Bromo-1-[3-(etilsulfanil)quinolin-2-il]etanona



30 Se disolvió brohidruro perbromuro de piridina (PyBr₃, 100 mg, 0,43 mmol) en 4 ml de ácido acético glacial. Se añadió
 HBr (32 % en ácido acético glacial, 0,15 ml) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 30 min. Luego se
 añadió por goteo 1-[3-(etilsulfanil)quinolin-2-il]etanona (100 mg, 0,43 mmol) disuelta en 1 ml de ácido acético glacial.
 La mezcla de la reacción se agitó a temperatura ambiente durante 12 h y luego se concentró. El residuo se colocó con

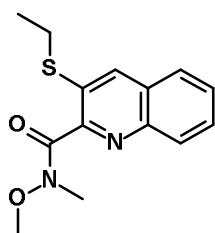
acetato de etilo y se lavó con solución saturada de carbonato ácido de sodio y solución saturada de cloruro de sodio. Después de secar la fase orgánica sobre sulfato de sodio, el disolvente se eliminó en un evaporador rotativo. El residuo se convirtió en la reacción subsiguiente sin purificación adicional.
 $\log P$ (ácido): 3,95; MH^+ : 312

5 **1-[3-(Etilsulfanil)quinolin-2-il]etanona**



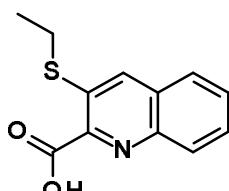
En una atmósfera de argón, se disolvió 3-(etilsulfanil)-N-metoxi-N-metilquinolin-2-carboxamida (2,8 g, 8,1 mmol) en 155 ml de THF seco y se enfrió a 0 °C. Se añadió lentamente por goteo bromuro de metilmagnesio (3M en éter dietílico, 8,1 ml, 24,3 mmol), luego la mezcla se agitó durante 2 h a 0 °C. Para finalizar la reacción, se añadieron gradualmente 10 5 ml de cloruro de amonio solución con enfriamiento. La fase orgánica se separó y se lavó con solución saturada de cloruro de sodio. El disolvente se eliminó en un evaporador rotativo y el producto crudo se usó en la reacción subsiguiente sin purificación adicional.
 $\log P$ (neutro): 3,31; MH^+ : 232; RMN de 1H (400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 8,38 (s, 1H), 8,08-8,00 (m, 2H), 7,79 – 7,70 (m, 2H), 3,10 – 3,04 (m, 2H), 2,75 (s, 3H), 1,35 – 1,31 (m, 3H).

15 **3-(Etilsulfanil)-N-metoxi-N-metilquinolin-2-carboxamida**



20 Se disolvieron ácido 3-(etilsulfanil)quinolin-2-carboxílico (240 mg, 1,02 mmol) y N,O-dimetilclorhidrato de hidroxilamina (100 mg, 1,02 mmol) en 3 ml de diclorometano y se enfrió a 0 °C. Se añadieron 4-dimetilaminopiridina (DMAP, 150 mg, 1,23 mmol) y clorhidrato de N-(dimetilaminopropil)-N'-etilcarbodiimida (EDCI, 217 mg, 1,13 mmol) y la mezcla de la reacción se agitó durante 2 h a 0 °C, luego durante 12 h a temperatura ambiente. La solución se lavó una vez con solución saturada de carbonato ácido de sodio y una vez con solución de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de sodio y se concentró. El producto crudo se usó en la reacción subsiguiente sin purificación adicional.
 $\log P$ (neutro): 2,17; MH^+ : 277; RMN de 1H (400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 8,46 (s, 1H), 8,02 – 7,98 (m, 2H), 7,78-7,75 (m, 1H), 7,70 – 7,64 (m, 1H), 3,51 (s, 3H), 3,32 (s, 3H), 3,12 – 3,05 (m, 2H), 1,28 – 1,24 (m, 3H).

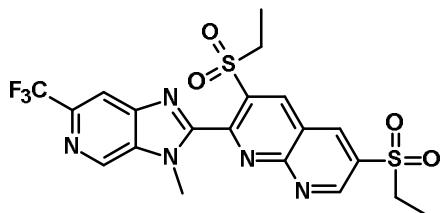
25 **Ácido 3-(etilsulfanil)quinolin-2-carboxílico**



30 En una atmósfera de argón, se disolvió 2,2,6,6-tetrametilpiperidina (5,34 g, 38 mmol) en 50 ml de THF seco y se enfrió a-25 °C. Se añadió por goteo n-butillitio (2,5 M en hexano, 2,44 g, 38,1 mmol, 15,2 ml) y la mezcla se agitó a-25 °C por 20 min. Luego se añadió por goteo ácido quinolin-2-carboxílico (3,00 g, 17,3 mmol) disuelto en 20 ml de THF y la mezcla se agitó a-25 °C por otros 30 min. Se añadió por goteo disulfuro de dietilo (5,29 g, 43,3 mmol) y, luego de agitar a-25 °C durante 30 min, la mezcla se calentó gradualmente a temperatura ambiente. La mezcla de la reacción se concentró en un evaporador rotativo y el residuo se colocó en 100 ml de ciclohexano/éter dietílico (3:7). Los restantes sólidos se aislaron mediante filtración. Se añadió agua, y se añadió solución de HCl 2,5 M hasta obtener un pH de 4. La solución acuosa se extrajo tres veces con diclorometano. Los extractos orgánicos combinados se secaron sobre sulfato de sodio y el disolvente se eliminó en un evaporador rotativo. El producto crudo se usó en la reacción subsiguiente sin purificación adicional.
 $\log P$ (neutro): 0,48; MH^+ : 234; RMN de 1H (400MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 8,43 (s, 1H), 8,03 – 8,00 (m, 2H), 7,78 – 7,74

(m, 1H), 7,70 – 7,67 (m, 1H), 3,13 – 3,07 (m, 2H), 1,32 – 1,28 (m, 3H).

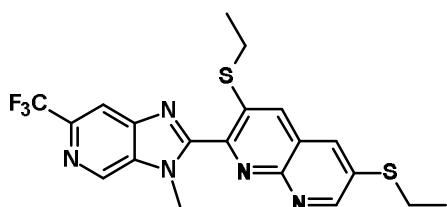
3,6-Bis(etilsulfonil)-2-[3-metil-6-(trifluorometil)-3H-imidazo[4,5-c]piridin-2-il]-1,8-naftiridina



Se disolvieron 35 mg (0,078 mmol) de 3,6-bis(etilsulfanil)-2-[3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridin-2-il]-1,8-naftiridina en 3,5 ml de diclorometano, se añadieron 18 mg (0,39 mmol) de ácido fórmico y 53 mg (0,545 mmol) de peróxido de hidrógeno a temperatura ambiente, y luego la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 18 h. La mezcla se separó del disolvente a presión reducida. El residuo se purificó mediante purificación por cromatografía de columna con un gradiente de ciclohexano/acetato de etilo como eluyente.

logP (neutro): 2,21; MH^+ : 514; RMN de 1H (400 MHz, CD3CN) δ ppm: 1,29 (t, 3H), 1,33 (t, 3H), 3,41 (q, 2H), 3,92 (q, 2H), 4,00 (s, 3H), 8,22 (s, 1H), 9,155 (s, 1H), 9,26 (d, 1H), 9,43 (s, 1H), 9,65 (d, 1H).

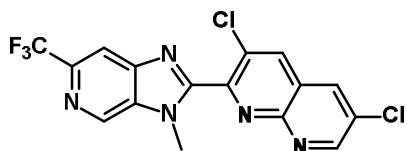
3,6-Bis(etilsulfanil)-2-[3-metil-6-(trifluorometil)-3H-imidazo[4,5-c]piridin-2-il]-1,8-naftiridina



Se agitaron 255 mg (0,493 mmol) de 3,6-dicloro-2-[3-metil-6-(trifluorometil)-3H-imidazo[4,5-c]piridin-2-il]-1,8-naftiridina y 156 mg (1,48 mmol) de etanotiolato de sodio en 14,2 ml de DMF a temperatura ambiente en argón durante 2 h. Se añadió agua y la mezcla se extrajo dos veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y se liberaron del disolvente a presión reducida. El residuo se purificó mediante purificación por cromatografía de columna con un gradiente de ciclohexano/acetato de etilo como eluyente.

logP (neutro): 3,23; MH^+ : 450; RMN de 1H (400 MHz, CD3CN) δ ppm: 1,34 (t, 3H), 1,42 (t, 3H), 3,10 (q, 2H), 3,19 (q, 2H), 4,06 (s, 3H), 8,15 (d, 1H), 8,18 (s, 1H), 8,29 (s, 1H), 8,92 (d, 1H), 9,10 (s, 1H).

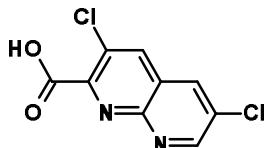
20 3,6-Dicloro-2-[3-metil-6-(trifluorometil)-3H-imidazo[4,5-c]piridin-2-il]-1,8-naftiridina (V-3)



Se agitaron 310 mg (1,62 mmol) de N^3 -metil-6-(trifluorometil)piridin-3,4-diamina, 512 mg (2,11 mmol) de ácido 3,6-dicloro-1,8-naftiridina-2-carboxílico y 622 mg (3,24 mmol) de clorhidrato de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etylcarbodiimida (EDCI) en 18 ml de piridina a 120 °C durante 18 h. Se añadieron 140 mg (0,811 mmol) de ácido paratoluensulfónico y la mezcla de la reacción se agitó a 120 °C durante 18 h. La mezcla se diluyó con acetonitrilo, se filtró y se liberaron del disolvente a presión reducida. El residuo se purificó mediante purificación por cromatografía de columna con un gradiente de diclorometano/metanol como eluyente.

logP (neutro): 2,44; MH^+ : 398; RMN de 1H (400 MHz, CD3CN) δ ppm: 4,03 (s, 3H), 8,22 (s, 1H), 8,48 (d, 1H), 8,65 (s, 1H), 9,13 (s, 2H).

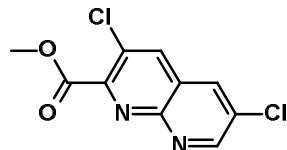
30 Ácido 3,6-dicloro-1,8-naftiridina-2-carboxílico (III-1)



Se agitaron 990 mg (3,85 mmol) de 3,6-dicloro-1,8-naftiridina-2-carboxilato de metilo y 184 mg (7,70 mmol) de hidróxido de litio en 6,9 ml de tetrahidrofurano y 2,3 ml de agua a temperatura ambiente durante 18 h. Se añadió una solución acuosa 1 N de solución de ácido clorhídrico, y la mezcla se separó del disolvente a presión reducida. Se añadió tolueno dos veces al residuo y la mezcla se separó del disolvente a presión reducida.

5 logP (ácido): 0,70; MH^+ : 243; RMN de 1H (400 MHz, CD3CN) δ ppm: 8,39 (m, 1H), 8,49 (s, 1H), 9,07 (m, 1H).

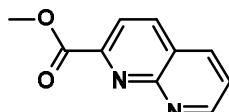
3,6-Dicloro-1,8-naftiridina-2-carboxilato de metilo (XXXI-1)



Se agitaron 2,37 g (12,6 mmol) de 1,8-naftiridina-2-carboxilato de metilo y 1,93 g (14,5 mmol) de N-clorosuccinimida en 118 ml de acetonitrilo a 60 °C durante 18 h. La mezcla se separó del disolvente a presión reducida. El residuo se purificó mediante purificación por cromatografía de columna con un gradiente de acetato de etilo/metanol como eluyente.

10 logP (neutro): 1,93; MH^+ : 257; RMN de 1H (400 MHz, CD3CN) δ ppm: 4,01 (s, 3H), 8,71 (d, 1H), 8,845 (s, 1H), 9,20 (d, 1H).

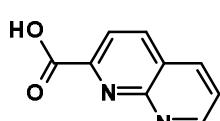
1,8-Naftiridina-2-carboxilato de metilo (XXII-1)



15 Se agitaron 600 mg (3,44 mmol) de ácido 1,8-naftiridina-2-carboxílico y 0,754 ml (10,3 mmol) de cloruro de tionilo en 15 ml de metanol a 60 °C durante 6 h. La mezcla se separó del disolvente a presión reducida. Se añadió eter metílico terc-butílico al residuo y la mezcla se separó del disolvente a presión reducida.

20 logP (neutro): 0,77; MH^+ : 189; RMN de 1H (400 MHz, CD3CN) δ ppm: 4,00 (s, 3H), 7,84 (dd, 1H), 8,27 (d, 1H), 8,70 (dd, 1H), 8,76 (d, 1H), 9,28 (m, 1H).

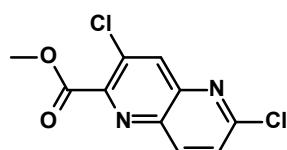
Ácido 1,8-naftiridina-2-carboxílico (XXX-1)



25 Se agitaron 3,00 g (24,6 mmol) de 2-aminonicotinaldehido y 4,44 ml (49,1 mmol) de piruvato de metilo en 30 ml de etanol y 5,0 ml de agua a 0 °C. Se añadieron 30 ml (90,0 mmol) de una solución acuosa 3N de hidróxido de sodio y la mezcla de la reacción se agitó a temperatura ambiente durante 18 h. La mezcla se ajustó a pH = 1 a 0 °C con aproximadamente 50 ml de una solución acuosa 1 N de ácido clorhídrico, se liberó de etanol a presión reducida y se filtró.

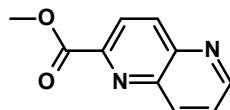
logP (ácido): -0,12; MH^+ : 175; RMN de 1H (400 MHz, CD3CN) δ ppm: 7,72 (dd, 1H), 8,30 (d, 1H), 8,495 (dd, 1H), 8,62 (d, 1H), 9,22 (m, 1H).

30 **3,6-Dicloro-1,5-naftiridina-2-carboxilato de metilo (XXXI-2)**

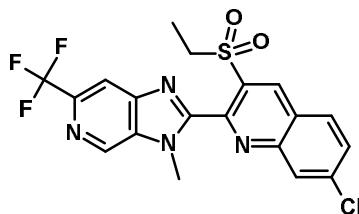


35 Se agitaron 1,07 g (5,69 mmol) de 1,5-naftiridina-2-carboxilato de metilo y 873 mg (6,54 mmol) de N-clorosuccinimida en 100 ml de acetonitrilo a 60 °C durante 18 h. La mezcla se separó del disolvente a presión reducida. El residuo se purificó mediante purificación por cromatografía de columna con un gradiente de acetato de etilo/metanol como eluyente.

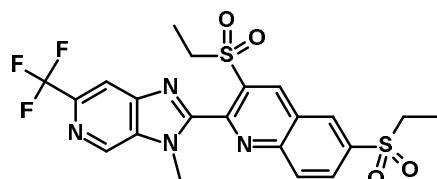
logP (neutro): 2,46; MH^+ : 257; RMN de 1H (400 MHz, CD3CN) δ ppm: 4,02 (s, 3H), 8,49 (m, 1H), 8,61 (s, 1H), 9,01 (d, 1H).

1,5-Naftiridina-2-carboxilato de metilo (XXII-2)

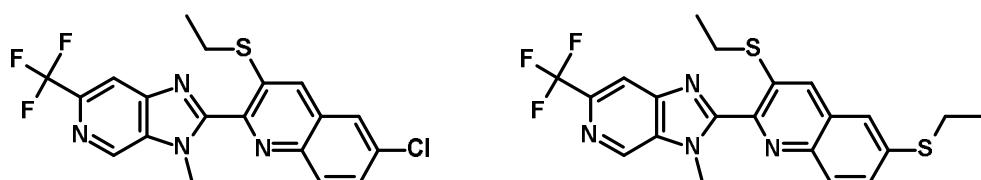
- Se agitaron 1,00 g (5,74 mmol) de ácido 1,5-naftiridina-2-carboxílico y 1,26 ml (17,2 mmol) de cloruro de tionilo en 15 ml de metanol a 60 °C durante 6 h. La mezcla se separó del disolvente a presión reducida. Se añadió éter metílico terc-butílico al residuo y la mezcla se separó del disolvente a presión reducida.
 5 logP (neutro): 0,92; MH^+ : 189; RMN de ^1H (400 MHz, CD3CN) δ ppm: 4,04 (s, 3H), 8,19 (dd, 1H), 8,57 (d, 1H), 9,06 (dd, 1H), 9,15-9,19 (m, 2H).

7-Cloro-3-etilsulfonil-2-[3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridin-2-il]quinolina

- 10 Se disolvió 6-cloro-3-etilsulfanil-2-[3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridin-2-il]quinolina (250 mg, 0,59 mmol, mezcla con disulfuro) en diclorometano (20 ml), y luego se añadieron ácido fórmico (136 mg, 2,95 mmol) y H_2O_2 (402 mg, 4,13 mmol). La mezcla se agitó a temperatura ambiente por 14 h y se lavó con solución de tiosulfato de sodio. La fase orgánica se retiró, se secó sobre Na_2SO_4 y se concentró. Los sólidos se trituraron con MeCN, se retiró por filtración y se secó a presión reducida, para dar el compuesto del título como un producto limpio.
 15 (logP (neutro): 2,63; MH^+ : 455; RMN de ^1H (400 MHz, CDCl3): δ 9,05 (s, 1H), 8,79 (s, 1H), 8,57 (s, 1H), 8,23 (dd, 1H), 8,14 (d, 1H), 8,12 (d, 1H), 4,11 (s, 3H), 3,26 (q, 2H), 1,34 (t, 3H).

3,6-Bis(etilsulfonil)-2-[3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridin-2-il]quinolina

- 20 Se disolvió 3,6-bis(etilsulfanil)-2-[3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridin-2-il]quinolina (25 mg, 0,05 mmol) en diclorometano (5 ml), y luego se añadieron ácido fórmico (13 mg, 0,27 mmol) y H_2O_2 (38 mg, 0,39 mmol). La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 14 h y se lavó con solución de tiosulfato de sodio. La fase orgánica se retiró, se secó sobre Na_2SO_4 y se concentró, para dar el compuesto del título como un producto limpio.
 (logP (neutro): 2,58; MH^+ : 513; RMN de ^1H (400 MHz, CDCl3): δ 9,25 (s, 1H), 9,05 (s, 1H), 8,79 (d, 1H), 8,44 (m, 1H), 8,42 (m, 1H), 8,15 (s, 1H), 4,00 (s, 3H), 3,91 (q, 2H), 3,29 (q, 2H), 1,42 (t, 3H), 1,38 (t, 3H).
- 25 **6-Cloro-3-etilsulfanil-2-[3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridin-2-il]quinolina & 3,6-bis(etilsulfanil)-2-[3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridin-2-il]quinolina**

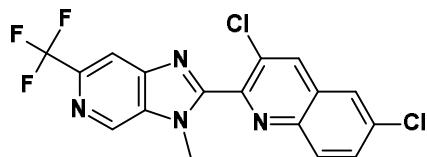


- 30 Se disolvió 3,6-dicloro-2-[3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridin-2-il]quinolina (0,20 g, 0,50 mmol) en DMF (5 ml), y se añadió etilmercaptano de sodio (0,169 g, 2,01 mmol). La mezcla de la reacción se agitó a temperatura ambiente durante 14 h, se diluyó con ciclohexano/acetato de etilo y se filtró. El material filtrado se concentró. La purificación por cromatografía de columna del material crudo por medio de HPLC preparativa con un gradiente de MeCN/agua como eluyente dio los dos compuestos del título como una mezcla, que luego se convirtió sin purificación adicional.

(logP (neutro): 3,99; MH^+ : 423.

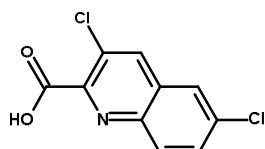
(logP (neutro): 4,35; MH⁺: 423.

3,6-Dicloro-2-[3-metil-6-(trifluorometil)imidazo[4,5-c]piridin-2-il]quinolina (V-4)



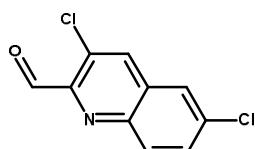
- 5 Se disolvieron ácido 3,6-dicloroquinolin-2-carboxílico (1,00 g, 4,13 mmol), N3-metil-6-(trifluorometil)piridin-3,4-diamina (0,61 g, 3,17 mmol) y EDCI*HCl (0,61 g, 3,17 mmol) en piridina (20 ml), se añadió ácido p-toluenulfónico (0,60 g, 3,17 mmol) y luego la mezcla se agitó a 120 °C durante 9 h. Después de enfriar a temperatura ambiente, se añadió acetonitrilo y la suspensión obtenida se filtró. El material filtrado se concentró y el residuo se separó de las sales mediante purificación por cromatografía de columna con un gradiente de CH₂Cl₂/MeOH como eluyente. El producto crudo obtenido luego se convirtió sin purificación adicional.
- 10 (logP (neutro): 3,53; MH⁺: 397; RMN de ¹H (400 MHz, DMSO-D₆): δ 9,31 (s, 1H), 8,91 (s, 1H), 8,34 (s, 1H), 8,29 (d, 1H), 8,20 (d, 1H), 7,95 (dd, 1H), 4,03 (s, 3H).

Ácido 3,6-dicloroquinolin-2-carboxílico (III-2)



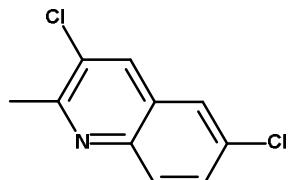
- 15 Una solución de NaClO₂ (6,02 g, 66,7 mmol) y NaH₂PO₄ (8,00 g, 66,7 mmol) en agua (25 ml) se añadió a 0 °C a una solución de 3,6-dicloroquinolin-2-carbaldehido (3,00 g, 13,33 mmol) en t-BuOH (30 ml). La mezcla se calentó gradualmente a temperatura ambiente y se agitó a esta temperatura durante 3 h. Después de agregar agua, el producto se extrajo con diclorometano. Las fases orgánicas combinadas se lavaron con solución acuosa saturada de NaHSO₃ y solución acuosa saturada de NaCl, se secó sobre Na₂SO₄ y se concentró. El producto crudo luego se convirtió sin purificación adicional.
- 20 MH⁺: 240; RMN de ¹H (400 MHz, DMSO-D₆): δ 7,86-7,89 (dd, J = 2,4 & 9,04 Hz, 1H), 8,09-8,11 (d, J = 9,08 Hz, 1H), 8,17 (d, J = 2,36 Hz, 1H), 8,71 (s, 1H), 14,26 (s a, 1H).

3,6-Dicloroquinolin-2-carbaldehido



- 25 A una solución de 3,6-dicloro-2-metilquinolina (3,00 g, 14,2 mmol) en 1,4-dioxano (30 ml) se añadió SeO₂ (4,73 g, 42,7 mmol). La mezcla obtenida se sometió a reflujo durante 3 h y luego se concentró hasta secar. El producto crudo se colocó con agua. El sólido blanco que precipitó se retiró por filtración, se lavó con hexano y se secó a presión reducida.
- MH⁺: 226; RMN de ¹H (400 MHz, CDCl₃): δ 7,72-7,75 (dd, J = 2,28 & 9,0 Hz, 1H), 7,80-7,81 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 8,17-8,19 (d, J = 9,24 Hz, 1H), 8,2 (s, 1H), 10,37 (s, 1H).

30 **3,6-Dicloro-2-metilquinolina**

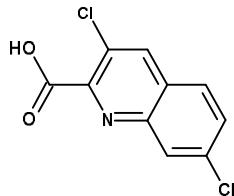


A una solución de 5-cloro-2-metil-1H-indol (5,00 g, 30,3 mmol) y TEBAC (0,60 g, 0,300 mmol) en CHCl₃ (150 ml) se añadió, a 0 °C, NaOH en agua. La mezcla se agitó a 0 °C durante 3 h y luego a temperatura ambiente durante 14 h. La mezcla de la reacción luego se añadió gradualmente a hielo-agua y se extrajo con cloroformo. La fase orgánica se

lavó con agua, se secó sobre Na_2SO_4 y se concentró en un evaporador rotativo. El residuo se purificó mediante purificación por cromatografía de columna con un gradiente de hexano/acetato de etilo como eluyente.

MH^+ : 212; RMN de ^1H (400 MHz, CDCl_3): δ 2,78 (s, 3H), 7,58-7,61 (dd, J = 2,32 & 9,0 Hz, 1H), 7,68-7,69 (d, J = 2,28 Hz, 1H), 7,91-7,94 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 8,01 (s, 1H).

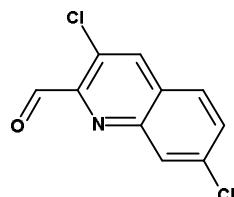
5 **Ácido 3,7-dicloroquinolin-2-carboxílico (III-3)**



Una solución de NaClO_2 (6,02 g, 66,7 mmol) y NaH_2PO_4 (8,00 g, 66,7 mmol) en agua (25 ml) se añadió a 0 °C a una solución de 3,7-dicloroquinolin-2-carbaldehido (3,00 g, 13,33 mmol) en $t\text{-BuOH}$ (30 ml). La mezcla se calentó gradualmente a temperatura ambiente y se agitó a esta temperatura durante 3 h. Despues de agregar agua, el producto se extrajo con diclorometano. Las fases orgánicas combinadas se lavaron con solución acuosa saturada de NaHCO_3 y solución acuosa saturada de NaCl , se secó sobre Na_2SO_4 y se concentró. El producto crudo luego se convirtió sin purificación adicional.

MH^+ : 241; RMN de ^1H (400 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$) δ ppm: 14,29 (a, 1H), 8,81 (s, 1H), 8,18 (d, 1H), 8,08 (d, 1H), 7,79 (dd, 1H).

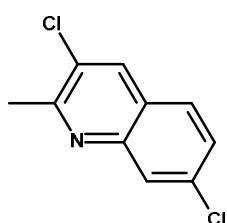
15 **3,7-Dicloroquinolin-2-carbaldehido**



A una solución de 3,7-dicloro-2-metilquinolina (3,00 g, 14,2 mmol) en 1,4-dioxano (30 ml) se añadió SeO_2 (4,73 g, 42,7 mmol). La mezcla obtenida se sometió a reflujo durante 3 h y luego se concentró hasta secar. El producto crudo se colocó con agua. El sólido blanco que precipitó se retiró por filtración, se lavó con hexano y se secó a presión reducida.

MH^+ : 226; RMN de ^1H (400 MHz, CDCl_3): δ 7,64-7,67 (dd, J = 1,96 & 8,76 Hz, 1H), 7,76-7,78 (d, J = 8,84 Hz, 1H), 8,24-8,25 (d, J = 1,92 Hz, 1H), 8,26 (s, 1H), 10,36 (s, 1H).

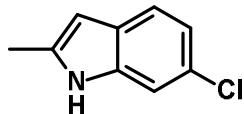
3,7-Dicloro-2-metilquinolina



25 A una solución de 6-cloro-2-metil-1H-indol (5,00 g, 30,3 mmol) y TEBAC (0,60 g, 0,300 mmol) en CHCl_3 (150 ml) se añadió, a 0 °C, NaOH en agua. La mezcla se agitó a 0 °C durante 3 h y luego a temperatura ambiente durante 14 h. La mezcla de la reacción luego se añadió gradualmente a hielo-agua y se extrajo con cloroformo. La fase orgánica se lavó con agua, se secó sobre Na_2SO_4 y se concentró en un evaporador rotativo. El residuo se purificó mediante purificación por cromatografía de columna con un gradiente de hexano/acetato de etilo como eluyente.

30 MH^+ : 214; RMN de ^1H (400 MHz, CDCl_3): δ 2,79 (s, 3H), 7,44-7,47 (dd, J = 2,08 & 8,72 Hz, 1H), 7,63-7,65 (d, J = 8,72 Hz, 1H), 7,99-8,00 (d, J = 1,92 Hz, 1H), 8,07 (s, 1H).

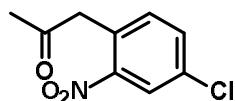
6-Cloro-2-metil-1H-indol



A una solución de 1-(4-cloro-2-nitrofenil)propan-2-ona (10,0 g, 46,9 mmol) en EtOH/H₂O (1:1, 50 ml) se añadieron, a 0 °C, ácido acético glacial (50 ml) y polvo de hierro (12,4 g, 234,7 mmol). La mezcla de la reacción obtenida luego se agitó a 100 °C durante 4 h. La mezcla se concentró, y el residuo se diluyó con agua y se extrajo con acetato de etilo.

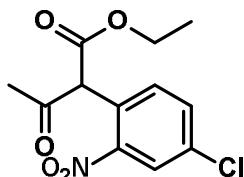
- 5 La fase orgánica se lavó con agua, se secó sobre Na₂SO₄ y luego se concentró. El residuo se purificó mediante purificación por cromatografía de columna con un gradiente de hexano/acetato de etilo como eluyente.
 MH⁺: 166; RMN de ¹H (400 MHz, CDCl₃): δ 2,42 (s, 3H), 7,00-7,02 (dd, J = 1,84 & 8,36 Hz, 1H), 7,25 (s, 1H), 7,37-7,39 (d, J = 8,36 Hz, 1H), 7,84 (bs, 1H).

1-(4-Cloro-2-nitrofenil)propan-2-ona



- 10 Se añadió éster etílico del ácido 2-(2-nitro-4-cloro-fenil)-3-oxo-butírico (28,0 g, 98,2 mmol) a 0 °C a una solución de ácido acético glacial (60 ml) y ácido sulfúrico (40 ml). La mezcla de la reacción luego se agitó a 100 °C durante 8 h. Después de enfriar a temperatura ambiente, la mezcla se añadió gradualmente a hielo-agua y se extrajo con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se lavaron con agua, se secó sobre Na₂SO₄ y se liberaron del disolvente.
 15 El producto crudo se purificó mediante purificación por cromatografía de columna con un gradiente de hexano/acetato de etilo como eluyente.
 MH⁺: 212; RMN de ¹H (400 MHz, CDCl₃): δ 2,32 (s, 3H), 4,09 (s, 2H), 7,19-7,21 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,54-7,57 (dd, J = 2,2 & 8,2 Hz, 1H), 8,11 (d, J = 2,16 Hz, 1H).

Éster etílico del ácido 2-(2-nitro-4-cloro-fenil)-3-oxo-butírico



- 20 Se añadió acetoacetato de etilo (8,16 g, 62,8 mmol) a 0 °C a una suspensión de Cs₂CO₃ (51,2 g, 157,1 mmol) en DMF (150 ml). Después de entibiar a temperatura ambiente, se añadió lentamente por goteo 1,4-dicloro-2-metilbenceno (10,0 g, 52,4 mmol). La mezcla de la reacción obtenida luego se calentó a 80 °C durante 4 h. Para detener la reacción, la mezcla se añadió a hielo-agua y se extrajo con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se lavaron con agua, se secó sobre Na₂SO₄ y se concentró. El residuo luego se convirtió sin purificación adicional.
 25 MH⁺: 286.

Análogamente a los ejemplos y de acuerdo a los procedimientos de preparación descritos anteriormente, se pueden obtener los siguientes compuestos de fórmula (I) (los ejemplos I-6 a I-8, I-10, I-13, I-14, I-17 a I-21, I-23, I-24, I-27 a I-30, I-32 a I-35, I-37; I-38, I-40 y I-41 han de considerarse Ejemplos comparativos):

Ejemplo	Estructura
I-1	

(continuación)

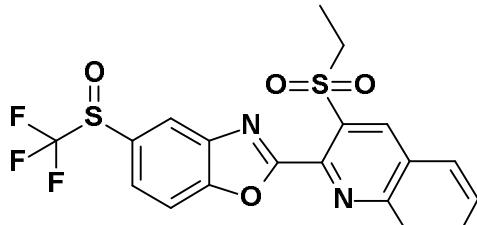
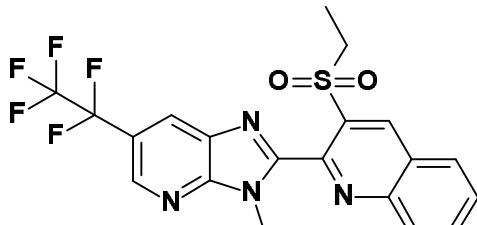
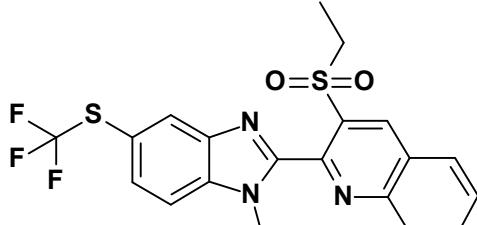
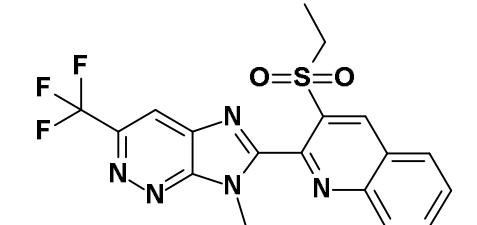
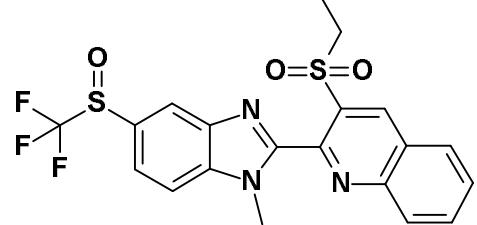
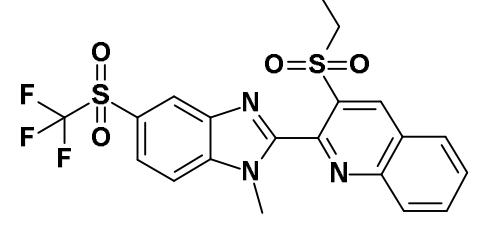
Ejemplo	Estructura
I-2	
I-3	
I-4	
I-5	
I-6	
I-7	

(continuación)

Ejemplo	Estructura
I-8	
I-9	
I-10	
I-11	
I-12	
I-13	

(continuación)

(continuación)

Ejemplo	Estructura
I-19	
I-20	
I-21	
I-22	
I-23	
I-24	

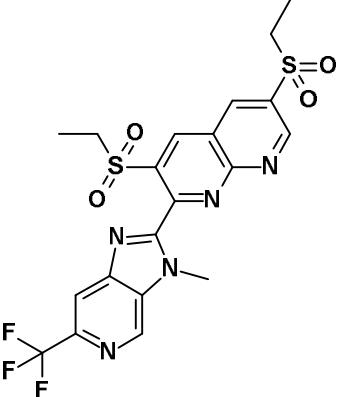
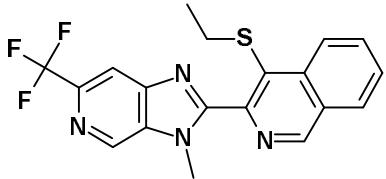
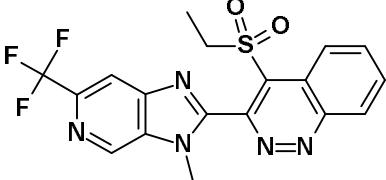
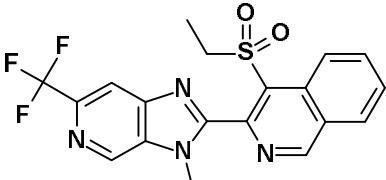
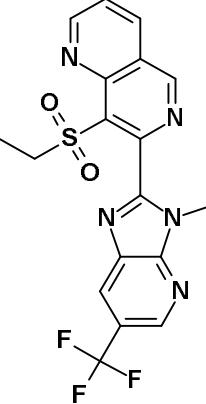
(continuación)

(continuación)

(continuación)

Ejemplo	Estructura
I-37	
I-38	
I-39	
I-40	

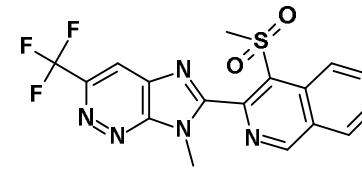
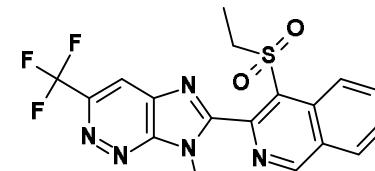
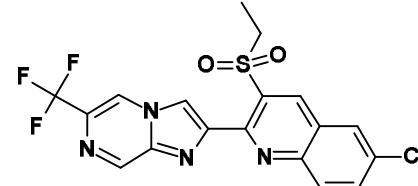
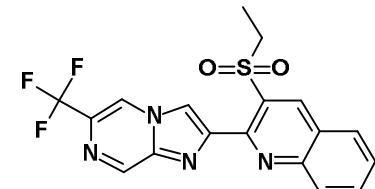
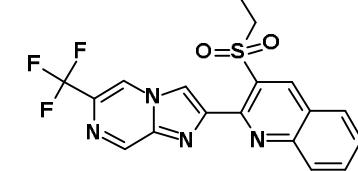
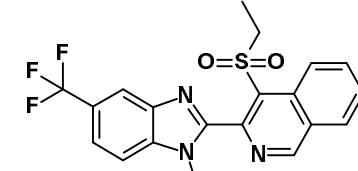
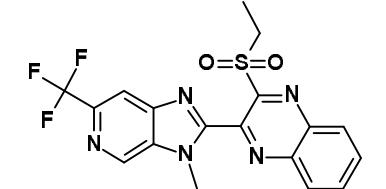
(continuación)

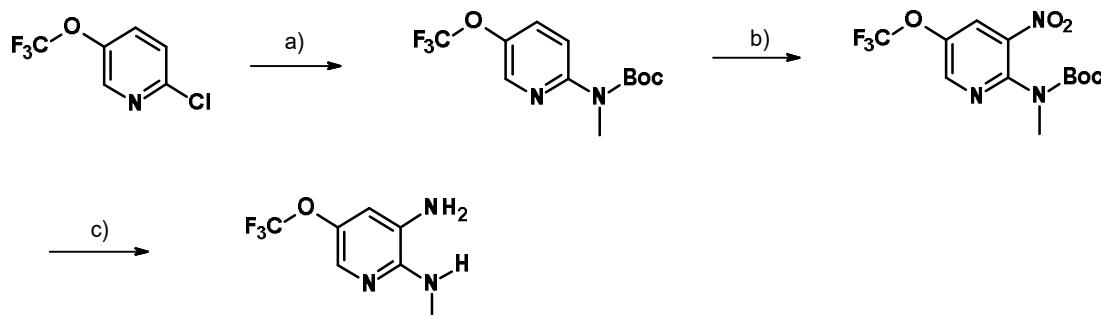
Ejemplo	Estructura
I-41	
I'-42	
I'-43	
I'-44	
I'-45	

(continuación)

Ejemplo	Estructura
I-46	
I'-47	
I'-48	
I'-49	
I'-50	
I'-51	
I'-52	

(continuación)

Ejemplo	Estructura
I'-53	
I'-54	
I-55	
I-56	
I-57	
I-58	
I-59	

Preparación de N2-metil-5-(trifluorometoxi)piridina-2,3-diamina (II-1)**Etapa a)**

5 Se disolvieron 24 g (120 mmol) de 2-cloro-5-(trifluorometoxi)piridina, 19,1 g (150 mmol) de terc-butil N-metilcarbamato y 17,5 g (180 mmol) de terc-butóxido de sodio en 400 ml de tolueno, se añadieron 2,8 g (3 mmol) de tris(dibencilidenoacetona)dipaladio(0) y 1,73 g (3 mmol) de Xantphos en atmósfera de argón, y se agitó la mezcla a entre 100 y 105 °C durante 12 h. Subsiguientemente, se filtró la mezcla a través de Celite y se eliminó el disolvente por destilación a presión reducida.

Etapa b)

10 A 100 ml de solución de ácido sulfúrico enfriada a 0 °C se añadieron 30 g (103 mmol) de terc-butil N-metil-N-[5-(trifluorometoxi)-2-piridil]carbamato y después 10,4 ml (166 mmol) de ácido nítrico concentrado. La mezcla se agitó a entre 5 y 10 °C durante 2 h y se mezcló con hielo-agua. Se neutralizó la solución con hidróxido de sodio y se extrajo con acetato de etilo. Se secó la fase orgánica sobre sulfato de magnesio y se eliminó el disolvente por destilación a presión reducida. Se purificó el residuo por purificación por cromatografía en columna con una mezcla de cloroformo/hexano (1:2) como eluyente.

15

Etapa c)

Una mezcla de 10,0 g (42,2 mmol) de terc-butil N-metil-N-[3-nitro-5-(trifluorometoxi)-2-piridil]carbamato y 0,7 g de paladio/carbón (10 %) se agitó en 250 ml de metanol en una atmósfera de hidrógeno a temperatura ambiente durante 2 h. Subsiguientemente, se filtró la mezcla a través de Celite y se eliminó el disolvente por evaporación a presión reducida. La purificación adicional del producto se efectuó por destilación al vacío a entre 88 y 90 °C y 0,1 mbar.

20 RMN de ^1H (400 MHz, CDCl_3 , ppm): δ 7,70 (d, $J = 0,8$ Hz, 1 H), 6,75 (d, $J = 0,8$ Hz, 1 H), 4,20 (s, a, 1 H), 3,32 (s, a, 1 H), 3,00 (s, 3 H). Esta medición del espectro de RMN se hizo en un Bruker Avance 3300 equipado con una sonda líquida de banda ancha de 5 mm.

25 Los valores de logP se miden de acuerdo con la Directiva CEE 79/831, Anexo V.A8 mediante HPLC (cromatografía líquida de alto rendimiento) en una columna de fase reversa (C 18). Temperatura: 55 °C.

La determinación con la LC-MS en el intervalo ácido se efectúa a pH 2,7 usando ácido fórmico acuoso al 0,1 % y acetonitrilo (contiene 0,1 % de ácido fórmico) como eluyentes; gradiente lineal entre 10 % de acetonitrilo y 95 % de acetonitrilo. El logP (HCOOH) se muestra en la Tabla.

30 La determinación con la LC-MS en el intervalo neutro se efectúa a pH 7,8 con solución acuosa de carbonato ácido de amino 0,001 molar y acetonitrilo como eluyentes; gradiente lineal entre 10 % de acetonitrilo y 95 % de acetonitrilo. El logP (neutro) se muestra en la Tabla.

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

35 Los datos de RMN de ejemplos seleccionados se listan en forma convencional (valores δ , división en multipletes, número de átomos de hidrógeno) o bien como listas de picos de RMN.

En cada caso, se menciona el disolvente en el que se registró el espectro de RMN.

Procedimiento para lista de picos de RMN

40 Los datos de RMN de ^1H de ejemplos seleccionados se mencionan en forma de listas de picos de RMN de ^1H . Para cada pico de la señal, se lista primero el valor δ en ppm y luego la intensidad de señal entre paréntesis. Los pares números de valor δ -intensidad de señal para los diferentes picos de señal se listan con separación entre sí con punto

y coma.

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

δ_1 (intensidad₁); δ_2 (intensidad₂);.....; δ_i (intensidad_i);.....; δ_n (intensidad_n)

5 La intensidad de las señales agudas se correlaciona con la altura de las señales en un ejemplo impreso de un espectro de RMN en cm, y muestra las proporciones verdaderas de las intensidades de señal. En el caso de las señales anchas, se pueden mostrar varios picos o la señal media y la intensidad relativa de los mismos en comparación con la señal más intensa en el espectro.

10 La calibración del desplazamiento químico de los espectros de RMN de ¹H se lleva a cabo usando tetrametilsilano y/o el desplazamiento químico del disolvente, particularmente en el caso de los espectros que se miden en DMSO. Por lo tanto, el pico de tetrametilsilano puede estar, aunque no necesariamente, en las listas de picos de RMN.

15 Las listas de los picos de RMN de ¹H son similares a las impresiones convencionales de RMN de ¹H y por lo tanto usualmente contienen todos los picos listados en una interpretación convencional de RMN.

Además, como en las impresiones convencionales de ¹H RMN, se muestran las señales de disolvente, señales de estereoisómeros de los compuestos blanco que probablemente sean provistos por la invención, y/o los picos de impurezas.

20 En el informe de las señales de los compuestos dentro del intervalo delta de disolventes y/o agua, las listas de los inventores de picos de RMN de ¹H muestran los picos estándar del disolvente, por ejemplo los picos de DMSO en DMSO-D₆ y el pico de agua, que usualmente tiene una alta intensidad en promedio.

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

Dichos estereoisómeros y/o impurezas pueden ser típicos del procedimiento particular de preparación. De esa forma los picos pueden ayudar a identificar la reproducción del procedimiento de preparación de los inventores con referencia a "huellas de productos secundarios".

30 Un experto, mediante el cálculo de los picos de los compuestos blanco mediante procedimientos conocidos (MestreC, ACD simulation, pero también con valores esperados evaluados en forma empírica) puede, si se requiere, aislar los picos de los compuestos blanco, opcionalmente usando filtros adicionales de intensidad. Este aislamiento sería similar a la elección de picos en cuestión en la interpretación convencional del RMN de ¹H.

Pueden hallarse detalles adicionales de las listas de picos de RMN de ¹H en la Research Disclosure Database Number 564025.

Ejemplo I-1:

RMN de ¹H (400,0 MHz, D₆-DMSO): δ = 9,338 (4,4); 9,320 (3,8); 8,518 (1,5); 8,498 (1,6); 8,328 (4,0); 8,300 (1,5); 8,278 (2,0); 8,172 (0,9); 8,168 (0,9); 8,154 (1,2); 8,151 (1,6); 8,133 (0,8); 8,130 (0,8); 7,993 (1,0); 7,991 (1,0); 7,973 (1,7); 7,955 (0,8); 7,953 (0,8); 3,927 (16,0); 3,864 (1,0); 3,846 (3,4); 3,827 (3,4); 3,809 (1,0); 3,321 (49,5); 2,672 (0,4); 2,525 (0,9); 2,512 (22,4); 2,507 (46,3); 2,503 (61,4); 2,498 (44,5); 2,494 (21,5); 2,330 (0,4); 2,074 (1,7); 1,252 (3,6); 1,234 (8,1); 1,215 (3,5); 0,000 (1,7)

Ejemplo I-2:

RMN de ¹H (400,0 MHz, D₆-DMSO): δ = 9,289 (4,1); 8,816 (0,4); 8,584 (4,4); 8,317 (4,4); 8,290 (0,7); 8,135 (0,5); 8,107 (3,4); 8,085 (3,9); 7,953 (0,4); 7,838 (0,8); 7,823 (1,4); 7,820 (1,7); 7,799 (1,3); 7,776 (1,3); 7,774 (1,3); 7,756 (1,6); 7,736 (0,7); 7,572 (0,3); 6,839 (0,4); 4,029 (16,0); 3,385 (0,8); 3,333 (91,2); 3,324 (82,2); 3,151 (1,2); 3,133 (3,8); 3,115 (3,9); 3,096 (1,3); 2,891 (2,9); 2,879 (0,8); 2,811 (0,6); 2,799 (0,6); 2,732 (2,0); 2,671 (0,7); 2,667 (0,6); 2,507 (91,1); 2,502 (120,9); 2,498 (95,2); 2,329 (0,7); 1,316 (0,5); 1,310 (0,3); 1,298 (0,9); 1,285 (4,1); 1,267 (8,5); 1,249 (4,0); 1,169 (0,3); 0,000 (1,3)

Ejemplo I-3:

RMN de ¹H (400,0 MHz, D₆-DMSO): δ = 9,382 (0,4); 9,321 (4,0); 8,471 (1,3); 8,466 (0,9); 8,458 (1,4); 8,454 (1,0); 8,447 (1,5); 8,439 (0,3); 8,401 (1,2); 8,395 (1,0); 8,390 (1,8); 8,382 (1,3); 8,377 (1,8); 8,370 (0,6); 8,333 (4,2); 8,265 (0,6); 8,252 (2,6); 8,248 (1,9); 8,240 (2,2); 8,233 (1,6); 8,228 (2,3); 8,216 (0,4); 5,754 (0,7); 4,390 (1,7); 3,993 (16,0); 3,847 (1,2); 3,829 (4,0); 3,810 (4,0); 3,792 (1,2); 3,317 (37,4); 2,676 (0,4); 2,671 (0,5); 2,667 (0,4); 2,506 (58,3); 2,502 (77,1); 2,497 (58,9); 2,333 (0,4); 2,329 (0,5); 2,324 (0,4); 1,425 (0,4); 1,406 (0,9); 1,388 (0,4); 1,289 (4,1); 1,270 (8,8); 1,252 (4,0); 0,000 (2,9)

(continuación)

Ejemplo I-4:

RMN de ^1H (400,0 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$): δ = 9,331 (3,4); 8,368 (3,5); 8,366 (3,6); 8,184 (1,3); 8,181 (1,4); 8,163 (1,6); 8,161 (1,6); 8,086 (1,2); 8,084 (1,3); 8,065 (1,7); 8,063 (1,7); 7,980 (0,9); 7,976 (1,0); 7,963 (1,2); 7,959 (1,6); 7,956 (0,8); 7,942 (0,9); 7,938 (0,9); 7,872 (1,1); 7,868 (1,1); 7,854 (0,9); 7,851 (1,6); 7,848 (1,1); 7,834 (0,7); 7,830 (0,7); 4,178 (16,0); 3,327 (2,2); 3,317 (49,6); 3,309 (4,9); 3,290 (4,0); 3,272 (1,3); 2,671 (0,4); 2,511 (24,5); 2,507 (48,6); 2,502 (65,4); 2,498 (49,8); 2,493 (25,2); 2,472 (0,5); 2,329 (0,4); 1,398 (0,4); 1,384 (4,1); 1,366 (8,9); 1,347 (4,0); 0,146 (0,3); 0,008 (3,7); 0,000 (82,5); -0,008 (3,5); -0,150 (0,4)

Ejemplo I-5:

RMN de ^1H (400,0 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$): δ = 9,342 (4,1); 8,924 (2,2); 8,921 (2,2); 8,712 (2,2); 8,708 (2,2); 8,518 (1,4); 8,498 (1,5); 8,304 (1,3); 8,283 (1,8); 8,172 (0,9); 8,168 (0,9); 8,154 (1,1); 8,151 (1,5); 8,147 (0,8); 8,133 (0,9); 8,129 (0,8); 7,992 (1,0); 7,989 (1,0); 7,971 (1,6); 7,969 (1,1); 7,954 (0,8); 7,951 (0,8); 5,756 (0,9); 3,903 (0,9); 3,884 (3,2); 3,866 (3,2); 3,847 (1,0); 3,833 (16,0); 3,323 (80,9); 2,676 (0,3); 2,672 (0,4); 2,667 (0,3); 2,525 (1,0); 2,511 (25,5); 2,507 (54,0); 2,502 (75,3); 2,498 (55,4); 2,493 (25,9); 2,329 (0,5); 1,265 (3,3); 1,246 (7,6); 1,228 (3,3); 0,008 (0,5); 0,000 (17,4); -0,009 (0,6)

Ejemplo I-6:

RMN de ^1H (400,0 MHz, CDCl_3): δ = 9,245 (4,5); 9,045 (3,7); 8,795 (2,5); 8,791 (2,5); 8,464 (1,0); 8,442 (3,3); 8,426 (2,5); 8,421 (2,3); 8,403 (0,8); 8,399 (0,8); 8,148 (3,9); 7,265 (14,1); 5,301 (0,7); 3,996 (16,0); 3,939 (1,0); 3,921 (3,5); 3,902 (3,6); 3,884 (1,1); 3,319 (1,1); 3,300 (3,6); 3,281 (3,7); 3,263 (1,2); 1,624 (11,0); 1,440 (3,6); 1,421 (7,7); 1,402 (6,1); 1,382 (8,0); 1,364 (3,6); 1,255 (0,9); 0,000 (0,5)

Ejemplo I-7:

RMN de ^1H (601,6 MHz, CDCl_3): δ = 9,014 (3,6); 8,996 (4,2); 8,211 (2,0); 8,197 (2,3); 8,128 (6,8); 7,970 (2,0); 7,966 (1,5); 7,955 (1,8); 7,952 (1,3); 7,265 (1,8); 7,261 (4,8); 5,302 (0,6); 5,298 (1,5); 3,950 (16,0); 3,872 (1,2); 3,859 (3,8); 3,847 (3,8); 3,835 (1,2); 1,565 (3,0); 1,401 (3,9); 1,388 (8,0); 1,376 (3,7); 1,257 (0,4); 0,004 (1,9); 0,000 (5,0)

Ejemplo I-8:

RMN de ^1H (601,6 MHz, CDCl_3): δ = 9,053 (3,3); 8,793 (2,3); 8,792 (2,5); 8,790 (2,4); 8,565 (3,7); 8,227 (3,4); 8,226 (3,4); 8,153 (1,0); 8,150 (1,1); 8,138 (2,0); 8,136 (2,1); 8,108 (2,8); 8,094 (1,6); 7,265 (6,5); 5,299 (1,2); 4,114 (16,0); 4,011 (0,4); 3,938 (0,4); 3,279 (1,1); 3,267 (3,6); 3,254 (3,6); 3,242 (1,2); 1,612 (2,0); 1,370 (3,7); 1,357 (7,9); 1,345 (3,7); 1,322 (0,5); 1,256 (0,4); 0,000 (4,7)

Ejemplo I-9:

RMN de ^1H (400,0 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$): δ = 9,340 (4,1); 8,840 (2,5); 8,685 (1,7); 8,663 (2,1); 8,490 (1,7); 8,485 (1,6); 8,468 (1,3); 8,463 (1,4); 8,357 (4,4); 8,315 (0,5); 4,096 (0,4); 4,025 (16,0); 3,896 (1,1); 3,877 (3,9); 3,859 (3,9); 3,840 (1,2); 3,320 (70,9); 2,676 (1,0); 2,671 (1,4); 2,666 (1,0); 2,524 (3,5); 2,510 (79,2); 2,506 (167,8); 2,502 (236,0); 2,497 (178,5); 2,333 (1,0); 2,328 (1,4); 2,324 (1,0); 1,305 (4,1); 1,287 (8,9); 1,268 (4,0); 1,235 (0,9); 0,146 (0,7); 0,008 (5,0); 0,000 (162,7); -0,008 (6,4); -0,150 (0,7)

Ejemplo I-10:

RMN de ^1H (400,0 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$): δ = 9,344 (8,5); 8,520 (1,5); 8,501 (1,6); 8,360 (4,4); 8,358 (4,3); 8,297 (1,5); 8,276 (2,0); 8,173 (0,9); 8,170 (0,9); 8,156 (1,2); 8,152 (1,6); 8,135 (0,9); 8,131 (0,9); 7,996 (1,1); 7,993 (1,1); 7,975 (1,7); 7,958 (0,8); 7,955 (0,8); 3,929 (16,0); 3,873 (1,0); 3,854 (3,4); 3,836 (3,5); 3,817 (1,0); 3,319 (42,6); 2,675 (0,9); 2,671 (1,2); 2,666 (0,9); 2,524 (2,9); 2,519 (4,5); 2,511 (74,4); 2,506 (154,2); 2,502 (204,0); 2,497 (145,1); 2,493 (69,5); 2,333 (0,9); 2,328 (1,2); 2,324 (0,9); 1,398 (8,1); 1,251 (3,6); 1,232 (8,1); 1,214 (3,5); 0,146 (0,3); 0,008 (2,3); 0,000 (74,8); -0,008 (2,7); -0,150 (0,3)

Ejemplo I-11:

RMN de ^1H (400,0 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$): δ = 9,701 (6,1); 9,234 (8,6); 8,736 (9,1); 8,412 (3,2); 8,395 (8,0); 8,206 (2,9); 8,184 (4,0); 8,084 (1,9); 8,081 (1,9); 8,067 (2,4); 8,064 (3,2); 8,046 (1,7); 8,043 (1,6); 7,871 (2,1); 7,869 (2,1); 7,851 (3,4); 7,833 (1,7); 7,831 (1,6); 5,758 (0,9); 4,174 (1,9); 4,156 (6,5); 4,137 (6,5); 4,119 (2,0); 4,099 (0,5); 4,085 (0,4); 3,322 (51,5); 3,176 (2,4); 3,163 (2,3); 2,676 (0,6); 2,672 (0,8); 2,667 (0,6); 2,525 (2,1); 2,507 (108,3); 2,503 (142,1); 2,498 (103,3); 2,334 (0,6); 2,329 (0,8); 2,325 (0,6); 1,305 (7,2); 1,286 (16,0); 1,268 (7,1); 1,259 (1,4); 1,241 (1,0); 1,233 (1,0); 0,880 (0,6); 0,008 (0,9); 0,000 (29,2); -0,009 (1,2)

Ejemplo I-12:

RMN de ^1H (400,0 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$): δ = 9,308 (4,8); 8,502 (1,7); 8,482 (1,8); 8,282 (1,6); 8,261 (2,2); 8,151 (4,0); 8,134 (1,7); 8,116 (0,8); 8,113 (0,9); 7,984 (1,9); 7,970 (1,4); 7,963 (2,4); 7,952 (1,8); 7,932 (0,9); 7,753 (1,7); 7,732 (1,4); 3,926 (1,0); 3,908 (3,5); 3,889 (3,5); 3,871 (1,1); 3,817 (16,0); 3,320 (31,9); 2,670 (1,3); 2,666 (1,1); 2,523 (2,9); 2,506 (167,3); 2,501 (228,6); 2,497 (175,1); 2,332 (1,0); 2,328 (1,3); 2,324 (1,1); 1,397 (2,8); 1,253 (3,6); 1,235 (8,0); 1,217 (3,6); 0,146 (0,4); 0,008 (2,2); 0,000 (74,0); -0,150 (0,4)

Ejemplo I-13:

RMN de ^1H (400,0 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$): δ = 9,396 (8,7); 9,044 (6,3); 9,032 (5,5); 8,522 (3,1); 8,502 (3,3); 8,360 (3,1); 8,339 (4,0); 8,203 (1,8); 8,200 (1,8); 8,185 (2,4); 8,182 (3,2); 8,164 (1,8); 8,161 (1,7); 8,025 (2,1); 8,023 (2,1); 8,005 (3,4); 7,987 (1,7); 3,962 (2,1); 3,943 (7,0); 3,925 (7,1); 3,906 (2,2); 3,321 (41,5); 3,151 (0,8); 2,676 (0,8); 2,672 (1,1); 2,667 (0,8); 2,525 (2,7); 2,507 (143,3); 2,503 (183,1); 2,498 (133,7); 2,334 (0,8); 2,329 (1,1); 2,325 (0,8); 1,990 (0,7); 1,397 (7,6); 1,340 (7,4); 1,322 (16,0); 1,303 (7,1); 1,175 (0,4); 0,000 (2,0)

(continuación)

Ejemplo I-14:

RMN de ^1H (400,0 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$): δ = 9,366 (8,9); 8,510 (3,2); 8,490 (3,4); 8,406 (5,6); 8,403 (5,7); 8,329 (3,1); 8,308 (4,1); 8,183 (1,9); 8,180 (1,9); 8,165 (2,6); 8,162 (3,6); 8,157 (5,8); 8,144 (2,1); 8,141 (2,1); 8,135 (6,2); 8,004 (2,2); 7,984 (3,5); 7,966 (1,8); 7,950 (3,3); 7,946 (3,2); 7,929 (2,7); 7,925 (2,7); 4,013 (2,0); 3,995 (6,9); 3,976 (7,0); 3,958 (2,1); 3,322 (22,1); 2,677 (0,5); 2,673 (0,6); 2,508 (83,7); 2,504 (107,7); 2,499 (78,2); 2,330 (0,6); 2,326 (0,5); 1,990 (0,5); 1,397 (15,1); 1,336 (7,3); 1,317 (16,0); 1,299 (7,1); 0,146 (0,4); 0,008 (3,0); 0,000 (78,2); -0,008 (3,8); -0,149 (0,4)

Ejemplo I-15:

RMN de ^1H (400,0 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$): δ = 13,544 (4,7); 9,270 (10,1); 8,445 (4,0); 8,424 (4,2); 8,256 (3,8); 8,235 (5,0); 8,121 (2,3); 8,103 (3,7); 8,082 (2,0); 7,907 (2,6); 7,888 (4,0); 7,869 (2,2); 7,800 (1,0); 7,632 (1,0); 4,342 (2,2); 4,324 (7,0); 4,305 (7,1); 4,287 (2,3); 3,319 (42,7); 2,671 (2,2); 2,502 (366,5); 2,329 (2,1); 1,397 (2,2); 1,322 (7,5); 1,304 (16,0); 1,286 (7,5); 1,233 (0,5); 0,000 (53,2)

Ejemplo I-16:

RMN de ^1H (400,0 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$): δ = 9,280 (4,8); 8,483 (1,6); 8,462 (1,8); 8,265 (1,6); 8,244 (2,2); 8,139 (1,0); 8,137 (1,0); 8,119 (1,8); 8,101 (1,0); 8,098 (0,9); 7,952 (1,2); 7,933 (1,8); 7,913 (1,2); 7,906 (5,8); 7,804 (6,0); 4,548 (0,7); 3,935 (1,0); 3,917 (3,4); 3,898 (3,5); 3,880 (1,1); 3,763 (16,0); 3,320 (48,0); 2,675 (0,7); 2,671 (0,9); 2,506 (120,5); 2,502 (157,3); 2,497 (116,2); 2,333 (0,7); 2,328 (0,9); 2,324 (0,7); 2,117 (2,2); 1,304 (0,4); 1,244 (4,1); 1,226 (8,4); 1,207 (3,7); 1,140 (4,9); 0,008 (0,8); 0,000 (16,0)

Ejemplo I-17:

RMN de ^1H (400,0 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$): δ = 9,370 (8,8); 8,513 (3,1); 8,493 (3,3); 8,435 (5,2); 8,339 (3,1); 8,318 (4,0); 8,216 (3,6); 8,194 (4,5); 8,186 (2,1); 8,183 (2,0); 8,169 (2,4); 8,165 (3,2); 8,148 (1,8); 8,144 (1,7); 8,007 (2,1); 8,005 (2,2); 7,987 (6,2); 7,967 (4,0); 4,013 (2,0); 3,995 (6,9); 3,976 (7,0); 3,958 (2,2); 3,323 (27,9); 2,677 (0,5); 2,672 (0,6); 2,668 (0,5); 2,508 (85,4); 2,503 (111,3); 2,499 (81,1); 2,334 (0,5); 2,330 (0,6); 1,990 (0,6); 1,397 (4,8); 1,338 (7,3); 1,320 (16,0); 1,301 (7,2); 1,175 (0,3); 0,000 (2,1)

Ejemplo I-18:

RMN de ^1H (400,0 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$): δ = 9,396 (8,7); 8,872 (5,2); 8,868 (5,4); 8,524 (3,1); 8,504 (3,4); 8,460 (4,0); 8,438 (6,5); 8,371 (3,4); 8,367 (3,4); 8,345 (5,2); 8,323 (4,1); 8,198 (1,8); 8,195 (1,8); 8,177 (3,2); 8,159 (1,8); 8,156 (1,9); 8,022 (2,2); 8,002 (3,4); 7,984 (1,8); 4,038 (0,7); 4,021 (2,7); 4,003 (7,1); 3,984 (6,9); 3,965 (2,1); 3,319 (112,3); 2,675 (1,5); 2,671 (2,1); 2,667 (1,6); 2,507 (270,1); 2,502 (351,4); 2,498 (258,1); 2,333 (1,5); 2,329 (2,0); 1,989 (2,5); 1,344 (7,3); 1,325 (16,0); 1,307 (7,2); 1,241 (1,7); 1,193 (0,7); 1,175 (1,4); 1,157 (0,7); 0,146 (1,6); 0,008 (18,0); 0,000 (369,9); -0,008 (19,6); -0,150 (1,7)

Ejemplo I-19:

RMN de ^1H (400,0 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$): δ = 9,377 (9,2); 8,555 (6,3); 8,517 (3,5); 8,496 (3,7); 8,344 (5,2); 8,336 (3,8); 8,323 (6,5); 8,315 (5,1); 8,189 (2,0); 8,187 (2,0); 8,169 (3,5); 8,151 (1,9); 8,148 (1,9); 8,126 (3,5); 8,105 (2,9); 8,009 (2,4); 7,991 (3,7); 7,973 (1,9); 4,038 (0,8); 4,019 (2,7); 4,001 (7,2); 3,982 (7,2); 3,964 (2,3); 3,320 (127,4); 2,671 (1,9); 2,502 (328,7); 2,498 (252,0); 2,329 (2,0); 1,989 (2,9); 1,341 (7,4); 1,322 (16,0); 1,304 (7,3); 1,193 (0,8); 1,175 (1,6); 1,158 (0,9); 0,146 (1,5); 0,000 (314,0); -0,150 (1,5)

Ejemplo I-20:

RMN de ^1H (400,0 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$): δ = 9,347 (4,5); 8,856 (2,4); 8,851 (2,5); 8,671 (2,5); 8,667 (2,4); 8,520 (1,5); 8,501 (1,6); 8,299 (1,5); 8,278 (2,0); 8,172 (0,9); 8,168 (0,9); 8,154 (1,2); 8,151 (1,6); 8,133 (0,9); 8,130 (0,8); 7,990 (1,1); 7,972 (1,7); 7,955 (0,9); 4,418 (0,4); 3,912 (0,9); 3,894 (3,4); 3,876 (3,5); 3,857 (1,2); 3,844 (16,0); 3,320 (26,1); 2,676 (0,6); 2,671 (0,7); 2,667 (0,6); 2,525 (1,9); 2,511 (47,8); 2,507 (97,0); 2,502 (127,6); 2,498 (91,3); 2,494 (44,2); 2,333 (0,5); 2,329 (0,8); 1,264 (3,5); 1,246 (8,1); 1,235 (2,1); 1,227 (3,8); 0,146 (0,6); 0,008 (4,6); 0,000 (125,9); -0,008 (5,3); -0,150 (0,6)

Ejemplo I-21:

RMN de ^1H (400,0 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$): δ = 9,306 (4,5); 8,500 (1,6); 8,480 (1,7); 8,270 (1,5); 8,249 (2,1); 8,153 (3,5); 8,131 (1,7); 8,113 (0,9); 8,110 (0,8); 7,969 (1,1); 7,967 (1,1); 7,949 (1,7); 7,927 (2,7); 7,906 (2,8); 7,735 (1,6); 7,732 (1,6); 7,714 (1,4); 7,710 (1,4); 3,930 (0,9); 3,911 (3,2); 3,893 (3,3); 3,875 (1,0); 3,803 (15,0); 3,325 (91,4); 2,671 (0,5); 2,667 (0,4); 2,507 (72,7); 2,502 (93,6); 2,498 (68,1); 2,329 (0,5); 1,398 (16,0); 1,253 (3,4); 1,234 (7,8); 1,216 (3,4); 0,146 (0,4); 0,008 (3,7); 0,000 (79,4); -0,008 (3,7); -0,150 (0,4)

Ejemplo I-22:

RMN de ^1H (400,0 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$): δ = 9,389 (4,7); 8,807 (6,3); 8,542 (2,0); 8,523 (1,9); 8,329 (1,7); 8,308 (2,3); 8,197 (1,2); 8,177 (1,9); 8,159 (1,0); 8,023 (1,4); 8,003 (2,0); 7,983 (1,0); 5,756 (0,5); 4,007 (16,0); 3,833 (1,2); 3,814 (3,6); 3,796 (3,6); 3,778 (1,1); 3,539 (0,4); 3,321 (145,9); 3,256 (0,6); 2,671 (1,6); 2,506 (238,8); 2,502 (294,2); 2,497 (210,6); 2,329 (1,6); 1,264 (4,1); 1,246 (8,7); 1,227 (4,4); 1,207 (0,7); 1,189 (1,0); 1,182 (0,4); 1,173 (0,9); 1,155 (0,5); 0,854 (0,3); 0,146 (0,5); 0,000 (101,4); -0,149 (0,5)

Ejemplo I-23:

RMN de ^1H (400,0 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$): δ = 9,320 (5,2); 8,508 (1,9); 8,488 (2,1); 8,338 (3,8); 8,276 (1,8); 8,254 (2,5); 8,157 (1,1); 8,138 (1,9); 8,117 (3,4); 8,096 (3,1); 7,976 (1,3); 7,957 (2,0); 7,938 (1,1); 7,921 (2,0); 7,900 (1,7); 3,927 (1,1); 3,908 (3,5); 3,890 (3,6); 3,871 (1,3); 3,844 (16,0); 3,321 (40,5); 2,672 (0,6); 2,502 (109,7); 2,329 (0,6); 1,397 (4,1); 1,257 (3,8); 1,238 (8,3); 1,220 (3,8); 0,000 (48,0)

(continuación)

Ejemplo I-24:

RMN de ^1H (400,0 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$): δ = 9,340 (4,6); 8,561 (3,1); 8,518 (1,7); 8,497 (1,8); 8,285 (1,6); 8,263 (2,2); 8,225 (2,1); 8,203 (3,1); 8,165 (1,0); 8,147 (1,7); 8,124 (2,2); 8,102 (1,2); 8,098 (1,2); 7,987 (1,1); 7,969 (1,8); 7,951 (0,9); 4,056 (0,4); 4,039 (1,1); 4,021 (1,1); 4,003 (0,4); 3,908 (1,1); 3,884 (16,0); 3,871 (3,8); 3,853 (1,1); 3,322 (25,6); 2,672 (0,5); 2,507 (61,5); 2,503 (79,8); 2,498 (59,6); 2,329 (0,4); 1,989 (4,6); 1,397 (2,1); 1,260 (3,5); 1,242 (7,7); 1,224 (3,5); 1,193 (1,3); 1,175 (2,4); 1,158 (1,2); 0,000 (29,1)

Ejemplo I-25:

RMN de ^1H (400,0 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$): δ = 8,896 (2,3); 8,893 (2,3); 8,700 (2,5); 8,697 (2,3); 8,569 (4,0); 8,111 (1,6); 8,096 (1,6); 8,091 (1,8); 8,080 (1,6); 7,835 (0,7); 7,832 (0,7); 7,818 (1,2); 7,814 (1,5); 7,797 (1,1); 7,793 (1,0); 7,769 (1,2); 7,766 (1,2); 7,749 (1,5); 7,732 (0,7); 3,982 (16,0); 3,319 (54,7); 3,159 (1,1); 3,140 (3,5); 3,122 (3,5); 3,104 (1,1); 2,672 (0,5); 2,507 (51,6); 2,503 (69,7); 2,498 (51,9); 2,330 (0,4); 1,397 (2,4); 1,299 (3,8); 1,280 (8,0); 1,262 (3,7); 0,008 (1,8); 0,000 (40,5); -0,008 (1,7)

Ejemplo I-26:

RMN de ^1H (400,0 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$): δ = 9,080 (4,2); 8,356 (1,5); 8,337 (1,6); 8,305 (1,5); 8,284 (1,8); 8,203 (2,6); 8,028 (1,9); 8,005 (3,0); 7,987 (0,9); 7,984 (0,9); 7,860 (1,0); 7,857 (1,0); 7,840 (1,7); 7,822 (0,8); 7,820 (0,8); 7,768 (1,4); 7,765 (1,4); 7,746 (1,2); 7,743 (1,2); 4,383 (16,0); 3,643 (0,9); 3,624 (1,0); 3,610 (1,1); 3,591 (1,0); 3,320 (13,3); 3,031 (1,0); 3,013 (1,1); 2,998 (1,0); 2,980 (1,0); 2,676 (0,4); 2,671 (0,6); 2,667 (0,4); 2,524 (1,4); 2,511 (34,4); 2,507 (70,4); 2,502 (92,9); 2,498 (67,2); 2,494 (32,9); 2,333 (0,4); 2,329 (0,5); 2,325 (0,4); 1,989 (0,4); 1,313 (3,7); 1,295 (8,0); 1,276 (3,6); 1,231 (0,4); 0,146 (0,5); 0,008 (3,3); 0,000 (96,4); -0,008 (4,1); -0,150 (0,5)

Ejemplo I-27:

RMN de ^1H (400,0 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$): δ = 9,013 (3,9); 9,008 (5,0); 8,972 (4,4); 8,968 (3,8); 8,555 (7,2); 8,185 (2,9); 8,164 (3,2); 8,100 (2,5); 8,081 (2,8); 8,079 (2,8); 7,850 (1,2); 7,846 (1,4); 7,832 (2,2); 7,829 (2,9); 7,825 (1,5); 7,812 (2,1); 7,808 (2,0); 7,785 (2,1); 7,782 (2,5); 7,765 (2,9); 7,762 (2,4); 7,748 (1,2); 7,745 (1,3); 3,321 (34,2); 3,248 (1,9); 3,230 (6,5); 3,212 (6,6); 3,193 (2,1); 3,078 (1,1); 2,677 (0,5); 2,672 (0,8); 2,668 (0,6); 2,525 (1,7); 2,521 (2,6); 2,512 (43,1); 2,508 (92,6); 2,503 (125,7); 2,499 (91,2); 2,494 (44,3); 2,334 (0,5); 2,330 (0,7); 2,325 (0,5); 1,402 (7,3); 1,384 (16,0); 1,365 (7,1); 1,350 (0,4); 0,008 (0,3); 0,000 (11,2); -0,008 (0,4)

Ejemplo I-28:

RMN de ^1H (400,0 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$): δ = 9,097 (9,4); 9,036 (4,7); 9,032 (5,7); 8,994 (5,2); 8,411 (3,4); 8,388 (5,7); 8,365 (4,1); 8,073 (1,8); 8,054 (3,2); 8,036 (1,9); 7,922 (2,4); 7,903 (3,4); 7,884 (1,8); 3,555 (0,5); 3,536 (1,8); 3,518 (2,1); 3,502 (2,3); 3,484 (2,1); 3,465 (0,6); 3,319 (76,6); 3,020 (0,6); 3,001 (2,1); 2,983 (2,3); 2,968 (2,2); 2,949 (1,9); 2,931 (0,6); 2,671 (2,4); 2,506 (320,5); 2,502 (411,7); 2,498 (298,4); 2,328 (2,4); 1,989 (0,5); 1,397 (0,8); 1,263 (7,5); 1,245 (16,0); 1,226 (7,3); 1,175 (0,4); 0,000 (4,5)

Ejemplo I-29:

RMN de ^1H (400,0 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$): δ = 8,537 (7,6); 8,408 (4,8); 8,405 (4,9); 8,154 (3,2); 8,142 (5,2); 8,133 (3,7); 8,120 (6,0); 8,092 (2,8); 8,073 (3,1); 7,915 (3,1); 7,911 (3,1); 7,894 (2,6); 7,890 (2,6); 7,834 (1,3); 7,830 (1,5); 7,817 (2,5); 7,813 (3,0); 7,796 (2,2); 7,792 (2,0); 7,769 (2,3); 7,767 (2,4); 7,749 (3,1); 7,732 (1,3); 7,729 (1,3); 3,321 (49,4); 3,236 (2,0); 3,218 (6,7); 3,199 (6,8); 3,181 (2,2); 2,676 (1,0); 2,672 (1,3); 2,667 (1,0); 2,525 (2,9); 2,507 (128,8); 2,503 (169,0); 2,498 (122,4); 2,334 (1,0); 2,329 (1,3); 2,325 (1,0); 1,393 (7,8); 1,375 (16,0); 1,357 (7,2); 0,000 (4,8)

Ejemplo I-30:

RMN de ^1H (400,0 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$): δ = 9,068 (8,7); 8,425 (5,6); 8,421 (5,7); 8,393 (3,1); 8,374 (3,3); 8,345 (3,4); 8,324 (3,8); 8,185 (5,1); 8,164 (6,0); 8,053 (1,8); 8,032 (3,2); 8,014 (1,8); 8,011 (1,9); 7,936 (3,3); 7,932 (3,0); 7,915 (2,7); 7,911 (2,6); 7,900 (2,2); 7,880 (3,3); 7,862 (1,8); 3,578 (0,5); 3,559 (1,9); 3,540 (2,1); 3,525 (2,3); 3,506 (2,0); 3,487 (0,7); 3,318 (145,3); 3,027 (0,7); 3,008 (2,2); 2,990 (2,3); 2,975 (2,3); 2,956 (1,9); 2,938 (0,6); 2,675 (3,6); 2,670 (4,9); 2,666 (3,6); 2,608 (0,5); 2,524 (13,1); 2,506 (637,5); 2,502 (820,8); 2,497 (582,4); 2,333 (3,4); 2,328 (4,6); 2,324 (3,5); 1,988 (0,4); 1,398 (3,3); 1,266 (7,4); 1,248 (16,0); 1,229 (7,3); 1,167 (0,3); 0,146 (2,5); 0,008 (20,7); 0,000 (548,6); -0,008 (20,5); -0,149 (2,3)

Ejemplo I-31:

RMN de ^1H (400,0 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$): δ = 13,309 (3,9); 8,373 (8,3); 8,084 (3,5); 8,063 (4,0); 8,032 (3,2); 8,012 (3,5); 7,844 (2,7); 7,784 (1,7); 7,781 (1,8); 7,764 (3,3); 7,747 (2,1); 7,743 (2,0); 7,680 (2,4); 7,661 (3,4); 7,643 (1,6); 7,558 (2,7); 3,321 (90,4); 3,172 (2,1); 3,153 (6,8); 3,135 (7,0); 3,117 (2,2); 2,675 (1,5); 2,671 (2,0); 2,666 (1,5); 2,524 (4,7); 2,506 (259,4); 2,502 (340,0); 2,498 (245,8); 2,333 (1,5); 2,329 (2,0); 2,324 (1,5); 1,404 (7,5); 1,386 (16,0); 1,368 (7,2); 1,312 (0,3); 0,146 (0,7); 0,008 (5,3); 0,000 (154,9); -0,008 (6,2); -0,150 (0,7)

Ejemplo I-32:

RMN de ^1H (400,0 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$): δ = 8,541 (8,1); 8,431 (5,4); 8,196 (3,8); 8,174 (4,6); 8,158 (3,4); 8,137 (3,7); 8,094 (3,0); 8,075 (3,3); 7,946 (3,0); 7,943 (3,0); 7,925 (2,6); 7,921 (2,6); 7,836 (1,4); 7,833 (1,5); 7,819 (2,6); 7,816 (3,1); 7,798 (2,3); 7,795 (2,1); 7,771 (2,4); 7,769 (2,5); 7,751 (3,3); 7,734 (1,4); 3,322 (44,3); 3,237 (2,1); 3,218 (7,0); 3,200 (7,1); 3,182 (2,3); 2,677 (0,8); 2,672 (1,0); 2,668 (0,8); 2,508 (124,2); 2,503 (160,8); 2,499 (118,4); 2,330 (0,9); 2,325 (0,7); 1,393 (7,7); 1,374 (16,0); 1,356 (7,3); 0,000 (17,4)

Ejemplo I-33:

RMN de ^1H (400,0 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$): δ = 9,073 (6,9); 8,444 (4,4); 8,394 (2,6); 8,374 (2,8); 8,345 (2,7); 8,323 (3,1); 8,238 (2,9); 8,216 (3,4); 8,051 (1,4); 8,033 (2,4); 8,013 (1,5); 7,964 (2,4); 7,942 (2,1); 7,900 (1,8); 7,881 (2,6); 7,862 (1,4); 3,575 (0,4); 3,557 (1,3); 3,538 (1,6); 3,523 (1,6); 3,504 (1,5); 3,486 (0,5); 3,321 (52,8); 3,021 (0,4); 3,003 (1,5); 2,984 (1,8); 2,969 (1,6); 2,951 (1,4); 2,933 (0,4); 2,671 (1,0); 2,502 (172,9); 2,329 (1,0); 1,397 (16,0); 1,276 (5,4); 1,258 (11,4); 1,240 (5,3); 0,000 (2,6)

(continuación)

Ejemplo I-34:

RMN de ^1H (400,0 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$): δ = 8,526 (4,4); 8,316 (0,4); 8,159 (3,3); 8,081 (2,7); 8,060 (3,1); 7,900 (2,4); 7,878 (2,9); 7,815 (0,8); 7,796 (1,6); 7,778 (1,2); 7,750 (1,4); 7,729 (1,8); 7,713 (2,5); 7,693 (1,5); 3,906 (16,0); 3,322 (207,8); 3,143 (1,2); 3,125 (3,8); 3,107 (3,9); 3,088 (1,3); 2,671 (1,8); 2,506 (247,9); 2,502 (313,4); 2,498 (227,1); 2,328 (1,7); 2,074 (0,6); 1,292 (4,1); 1,274 (8,7); 1,255 (3,9); 0,146 (1,2); 0,008 (12,9); 0,000 (260,3); -0,149 (1,2)

Ejemplo I-35:

RMN de ^1H (400,0 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$): δ = 9,317 (3,9); 8,590 (4,2); 8,348 (4,0); 8,346 (4,1); 8,109 (3,0); 8,086 (3,7); 7,842 (0,7); 7,839 (0,7); 7,825 (1,3); 7,822 (1,4); 7,804 (1,0); 7,801 (1,1); 7,779 (1,2); 7,776 (1,2); 7,758 (1,4); 7,741 (0,6); 7,739 (0,7); 4,032 (16,0); 3,157 (1,1); 3,138 (3,7); 3,120 (3,8); 3,102 (1,2); 2,513 (14,0); 2,509 (28,3); 2,504 (37,2); 2,500 (27,4); 1,396 (8,0); 1,288 (4,1); 1,269 (8,7); 1,251 (4,0); 1,197 (0,4); 0,000 (3,6)

Ejemplo I-36:

RMN de ^1H (600,1 MHz, CD3CN): δ = 11,745 (0,5); 8,966 (6,6); 8,206 (2,5); 8,192 (2,7); 8,191 (2,7); 8,163 (2,3); 8,161 (2,3); 8,149 (2,4); 8,148 (2,5); 7,936 (1,6); 7,934 (1,5); 7,925 (1,9); 7,922 (2,9); 7,920 (1,5); 7,911 (1,6); 7,908 (1,5); 7,755 (1,7); 7,753 (1,7); 7,743 (1,8); 7,741 (3,0); 7,739 (1,8); 7,730 (1,5); 7,728 (1,4); 7,579 (1,4); 7,483 (1,4); 3,575 (0,6); 3,562 (1,8); 3,552 (0,8); 3,550 (2,0); 3,540 (2,1); 3,538 (0,8); 3,528 (2,0); 3,515 (0,6); 2,984 (0,6); 2,971 (2,0); 2,959 (2,2); 2,949 (2,0); 2,947 (0,9); 2,937 (1,9); 2,925 (0,6); 2,130 (50,4); 2,058 (0,4); 2,054 (0,6); 2,050 (0,9); 2,046 (0,6); 1,964 (3,8); 1,956 (6,9); 1,951 (8,6); 1,948 (62,4); 1,943 (113,2); 1,939 (164,6); 1,935 (112,0); 1,931 (56,5); 1,922 (1,1); 1,833 (0,4); 1,828 (0,7); 1,824 (0,9); 1,820 (0,6); 1,816 (0,3); 1,451 (0,4); 1,340 (0,7); 1,320 (7,8); 1,308 (16,0); 1,296 (7,6); 1,285 (1,1); 1,268 (1,8); 0,881 (0,4); 0,005 (0,5); 0,000 (16,1); -0,006 (0,6)

Ejemplo I-37:

RMN de ^1H (400,0 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$): δ = 8,829 (2,3); 8,824 (2,4); 8,659 (2,4); 8,655 (2,3); 8,574 (4,0); 8,110 (1,6); 8,102 (1,4); 8,089 (1,8); 8,082 (1,6); 7,836 (0,7); 7,833 (0,7); 7,819 (1,2); 7,815 (1,5); 7,798 (1,0); 7,794 (1,0); 7,772 (1,1); 7,768 (1,2); 7,751 (1,5); 7,734 (0,7); 7,731 (0,6); 3,989 (16,0); 3,328 (1,2); 3,164 (1,1); 3,146 (3,6); 3,127 (3,7); 3,109 (1,2); 2,673 (0,4); 2,526 (0,9); 2,512 (23,0); 2,508 (47,2); 2,504 (62,5); 2,499 (44,6); 2,495 (21,3); 2,330 (0,3); 1,301 (3,9); 1,283 (8,3); 1,265 (3,8); 1,232 (1,7); 0,008 (0,4); 0,000 (12,0); -0,009 (0,4)

Ejemplo I-38:

RMN de ^1H (400,0 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$): δ = 8,618 (2,6); 8,553 (4,3); 8,428 (2,5); 8,100 (2,0); 8,090 (1,9); 8,079 (2,3); 8,074 (2,1); 7,825 (0,9); 7,807 (1,6); 7,790 (1,2); 7,786 (1,1); 7,760 (1,3); 7,742 (1,7); 7,724 (0,8); 3,951 (16,0); 3,814 (0,5); 3,323 (100,5); 3,156 (1,2); 3,137 (3,7); 3,119 (3,8); 3,100 (1,3); 2,671 (1,3); 2,506 (182,8); 2,502 (229,6); 2,498 (173,1); 2,329 (1,2); 1,299 (4,0); 1,281 (8,3); 1,263 (4,1); 1,235 (3,3); 0,854 (0,3); 0,146 (0,8); 0,000 (148,6); -0,149 (0,7)

Ejemplo I-39:

RMN de ^1H (400,0 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$): δ = 8,532 (4,8); 8,427 (0,4); 8,150 (3,6); 8,089 (4,0); 8,068 (4,4); 7,958 (2,1); 7,936 (2,5); 7,819 (0,9); 7,802 (1,9); 7,782 (1,4); 7,753 (1,6); 7,733 (4,3); 7,713 (2,5); 3,923 (16,0); 3,325 (15,4); 3,140 (1,2); 3,122 (3,9); 3,104 (4,0); 3,085 (1,4); 2,805 (0,6); 2,794 (0,6); 2,671 (0,5); 2,502 (80,3); 2,329 (0,5); 1,397 (1,5); 1,347 (0,4); 1,329 (0,7); 1,311 (0,4); 1,288 (4,2); 1,269 (8,6); 1,251 (4,0); 0,000 (9,9)

Ejemplo I-40:

RMN de ^1H (400,0 MHz, CD3CN): δ = 9,101 (3,4); 8,922 (2,5); 8,916 (2,5); 8,287 (4,5); 8,180 (3,7); 8,153 (2,5); 8,147 (2,4); 4,062 (16,0); 3,219 (1,2); 3,201 (3,7); 3,183 (3,8); 3,164 (1,3); 3,131 (1,1); 3,112 (3,5); 3,094 (3,5); 3,076 (1,2); 2,131 (29,4); 2,129 (37,1); 2,113 (0,7); 2,107 (0,7); 2,100 (0,5); 1,971 (1,0); 1,963 (2,8); 1,952 (40,0); 1,945 (73,2); 1,939 (97,8); 1,933 (67,1); 1,927 (34,0); 1,774 (0,4); 1,768 (0,6); 1,762 (0,4); 1,438 (4,0); 1,420 (8,0); 1,401 (3,9); 1,361 (3,9); 1,342 (7,9); 1,324 (3,7); 1,204 (0,4); 0,000 (1,5)

Ejemplo I-41:

RMN de ^1H (400,0 MHz, CD3CN): δ = 9,656 (2,7); 9,649 (2,7); 9,429 (5,4); 9,267 (2,9); 9,261 (2,6); 9,155 (3,5); 8,217 (3,8); 4,068 (0,4); 4,050 (0,4); 4,000 (16,0); 3,944 (1,2); 3,926 (3,8); 3,907 (3,8); 3,889 (1,2); 3,440 (1,1); 3,422 (3,6); 3,403 (3,7); 3,385 (1,2); 2,463 (0,6); 2,249 (0,4); 2,230 (0,4); 2,144 (556,5); 2,119 (2,0); 2,113 (2,2); 2,107 (2,5); 2,101 (1,7); 2,095 (0,9); 1,971 (2,3); 1,964 (9,6); 1,952 (134,3); 1,946 (247,3); 1,940 (334,2); 1,933 (228,1); 1,927 (116,0); 1,780 (0,7); 1,774 (1,4); 1,768 (1,8); 1,762 (1,3); 1,756 (0,6); 1,351 (3,8); 1,333 (7,7); 1,313 (5,9); 1,293 (7,9); 1,286 (1,6); 1,275 (5,1); 1,222 (0,4); 1,203 (0,7); 1,186 (0,4); 0,908 (0,5); 0,881 (0,4); 0,000 (25,0)

Ejemplo I-42:

RMN de ^1H (400,0 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$): δ = 9,531 (4,5); 9,255 (3,9); 8,638 (1,7); 8,616 (1,8); 8,391 (1,6); 8,371 (1,8); 8,285 (4,2); 8,104 (0,8); 8,102 (0,9); 8,084 (1,6); 8,066 (1,0); 8,063 (1,0); 7,960 (1,2); 7,942 (1,7); 7,922 (0,9); 3,860 (16,0); 3,386 (0,9); 3,319 (36,4); 2,854 (1,3); 2,835 (4,1); 2,817 (4,2); 2,798 (1,4); 2,672 (0,4); 2,525 (0,8); 2,512 (19,0); 2,507 (40,4); 2,503 (57,2); 2,498 (44,0); 2,494 (22,1); 2,330 (0,3); 1,236 (0,4); 1,001 (4,4); 0,983 (9,2); 0,964 (4,3); 0,008 (1,7); 0,000 (51,1); -0,008 (2,1)

Ejemplo I-43:

RMN de ^1H (400,0 MHz, CDCl₃): δ = 9,131 (1,1); 9,111 (1,2); 9,108 (1,1); 9,064 (2,8); 9,052 (0,4); 9,013 (0,6); 8,871 (1,0); 8,868 (1,2); 8,850 (1,1); 8,848 (1,1); 8,184 (0,4); 8,180 (0,5); 8,166 (1,1); 8,163 (1,1); 8,146 (1,2); 8,137 (4,0); 8,124 (0,6); 8,120 (1,1); 8,116 (1,1); 8,103 (0,6); 8,099 (0,4); 7,264 (22,4); 5,301 (3,3); 4,373 (0,4); 4,339 (0,5); 4,008 (13,2); 3,989 (2,7); 3,913 (0,4); 3,900 (0,7); 3,882 (2,3); 3,863 (2,3); 3,844 (0,8); 3,778 (0,4); 3,760 (0,4); 3,416 (0,4); 1,619 (16,0); 1,501 (3,0); 1,492 (0,8); 1,482 (6,3); 1,473 (1,5); 1,463 (3,0); 1,454 (0,7); 1,256 (0,9); 0,070 (1,9); 0,000 (3,1)

(continuación)

Ejemplo I'-44:

RMN de ^1H (400,0 MHz, D₆-DMSO): δ = 9,805 (5,2); 9,277 (4,7); 8,954 (2,1); 8,933 (2,2); 8,518 (1,9); 8,498 (2,1); 8,248 (5,0); 8,194 (0,9); 8,176 (1,7); 8,156 (1,1); 8,060 (1,5); 8,041 (2,0); 8,022 (1,1); 5,755 (0,6); 3,886 (16,0); 3,785 (1,4); 3,766 (1,4); 3,320 (25,3); 2,672 (0,4); 2,507 (44,1); 2,503 (58,0); 2,500 (45,6); 2,330 (0,4); 1,280 (4,0); 1,261 (8,3); 1,243 (3,8); 0,001 (13,6); 0,000 (14,1)

Ejemplo I'-45:

RMN de ^1H (300,1 MHz, D₆-DMSO): δ = 9,884 (6,3); 9,464 (1,7); 9,458 (1,8); 9,450 (1,8); 9,444 (1,7); 8,955 (1,5); 8,949 (1,6); 8,927 (1,7); 8,921 (1,6); 8,858 (2,4); 8,854 (2,4); 8,606 (2,5); 8,601 (2,4); 8,083 (1,7); 8,069 (1,6); 8,055 (1,6); 8,041 (1,6); 7,906 (0,4); 7,899 (0,4); 7,546 (0,4); 5,756 (0,9); 3,977 (1,0); 3,952 (3,2); 3,927 (3,3); 3,902 (1,0); 3,745 (16,0); 3,316 (7,7); 2,514 (4,6); 2,509 (8,9); 2,503 (11,6); 2,497 (8,0); 1,235 (0,8); 1,182 (3,7); 1,158 (8,1); 1,133 (3,5); 0,000 (5,7)

Ejemplo I'-46:

RMN de ^1H (400,0 MHz, D₆-DMSO): δ = 10,312 (1,0); 9,681 (6,0); 8,972 (0,9); 8,800 (9,0); 8,368 (11,7); 8,164 (0,4); 8,143 (0,4); 8,075 (0,5); 8,055 (0,5); 8,019 (3,2); 8,003 (3,3); 7,999 (3,8); 7,987 (3,3); 7,811 (0,3); 7,793 (0,5); 7,748 (1,6); 7,745 (1,6); 7,731 (2,4); 7,728 (3,0); 7,710 (2,0); 7,707 (1,8); 7,655 (2,3); 7,652 (2,2); 7,635 (3,2); 7,617 (1,7); 7,084 (1,3); 5,758 (1,2); 3,322 (39,8); 3,157 (2,1); 3,139 (6,9); 3,120 (7,0); 3,102 (2,3); 2,676 (0,7); 2,672 (1,0); 2,668 (0,8); 2,525 (2,2); 2,507 (132,8); 2,503 (172,9); 2,498 (123,6); 2,334 (0,8); 2,329 (1,0); 2,325 (0,8); 1,990 (0,9); 1,398 (1,7); 1,360 (0,5); 1,352 (0,8); 1,340 (7,8); 1,321 (16,0); 1,303 (7,5); 1,274 (0,3); 1,259 (1,2); 1,250 (0,7); 1,232 (1,8); 1,193 (0,5); 1,175 (0,9); 1,158 (0,5); 0,853 (0,5); 0,842 (0,3); 0,835 (0,4); 0,147 (0,4); 0,008 (2,7); 0,000 (87,3); -0,007 (3,3); -0,008 (3,3); -0,149 (0,4)

Ejemplo I'-47:

RMN de ^1H (400,0 MHz, D₆-DMSO): δ = 9,806 (4,4); 8,956 (1,8); 8,934 (1,9); 8,873 (2,7); 8,611 (2,7); 8,515 (1,7); 8,495 (1,8); 8,192 (0,9); 8,174 (1,5); 8,155 (1,0); 8,153 (1,1); 8,057 (1,3); 8,038 (1,8); 8,019 (0,9); 4,038 (0,3); 3,828 (0,7); 3,808 (1,9); 3,783 (16,0); 3,752 (0,5); 3,701 (0,9); 3,645 (0,4); 3,626 (0,4); 3,323 (184,7); 2,671 (1,2); 2,506 (162,5); 2,502 (211,5); 2,498 (167,4); 2,329 (1,2); 1,988 (1,4); 1,398 (0,6); 1,339 (0,4); 1,321 (0,9); 1,292 (4,0); 1,273 (8,1); 1,255 (4,0); 1,235 (1,6); 1,220 (0,9); 1,207 (0,4); 1,201 (0,5); 1,192 (0,5); 1,175 (0,8); 1,157 (0,4); 0,981 (0,4); 0,146 (0,9); -0,001 (180,5); -0,150 (0,9)

Ejemplo I'-48:

RMN de ^1H (400,0 MHz, D₆-DMSO): δ = 9,809 (4,1); 9,654 (0,3); 8,956 (1,7); 8,934 (1,8); 8,808 (2,5); 8,804 (2,5); 8,571 (2,6); 8,567 (2,5); 8,517 (1,6); 8,497 (1,7); 8,195 (0,8); 8,177 (1,4); 8,158 (1,0); 8,061 (1,2); 8,041 (1,8); 8,023 (0,9); 4,045 (1,1); 3,825 (0,7); 3,806 (1,9); 3,788 (16,0); 3,369 (11,9); 2,671 (1,1); 2,506 (157,0); 2,502 (197,3); 2,498 (147,4); 2,329 (1,2); 1,989 (0,4); 1,453 (0,6); 1,398 (1,1); 1,290 (3,5); 1,271 (7,5); 1,253 (3,6); 1,236 (2,1); 0,146 (0,5); 0,008 (6,4); 0,000 (105,6); -0,149 (0,5)

Ejemplo I'-49:

RMN de ^1H (400,0 MHz, D₆-DMSO): δ = 9,806 (4,7); 9,299 (4,4); 8,951 (1,9); 8,929 (2,1); 8,517 (1,7); 8,498 (1,9); 8,272 (4,6); 8,196 (0,9); 8,178 (1,6); 8,157 (1,1); 8,062 (1,4); 8,043 (1,9); 8,024 (1,0); 4,038 (0,4); 4,020 (0,4); 3,884 (16,0); 3,782 (1,3); 3,764 (1,3); 3,335 (11,1); 2,671 (0,9); 2,506 (123,8); 2,502 (160,6); 2,498 (121,6); 2,329 (0,9); 1,989 (1,6); 1,277 (4,1); 1,259 (8,7); 1,240 (4,5); 1,193 (0,4); 1,175 (0,8); 1,157 (0,4); 0,146 (0,4); 0,008 (4,6); 0,000 (90,8); -0,150 (0,4)

Ejemplo I'-50:

RMN de ^1H (400,0 MHz, D₆-DMSO): δ = 9,654 (5,0); 9,326 (4,5); 9,234 (1,5); 9,213 (1,5); 8,453 (1,7); 8,433 (1,8); 8,323 (4,9); 8,066 (0,9); 8,048 (1,7); 8,031 (1,3); 8,027 (1,3); 7,996 (1,5); 7,978 (1,8); 7,959 (0,8); 4,105 (16,0); 4,038 (0,4); 3,884 (0,3); 3,767 (0,7); 3,749 (0,9); 3,735 (1,4); 3,717 (1,3); 3,698 (0,4); 3,684 (0,4); 3,666 (1,3); 3,647 (1,4); 3,634 (0,8); 3,628 (0,5); 3,615 (0,7); 3,323 (114,7); 2,675 (1,0); 2,671 (1,4); 2,666 (1,0); 2,506 (178,7); 2,502 (236,7); 2,497 (177,5); 2,333 (1,0); 2,329 (1,3); 2,324 (1,0); 1,989 (1,5); 1,435 (3,9); 1,416 (8,3); 1,398 (3,9); 1,259 (0,7); 1,234 (0,7); 1,193 (0,4); 1,175 (0,8); 1,157 (0,4); 0,146 (0,6); 0,008 (6,3); 0,000 (145,6); -0,008 (7,2); -0,150 (0,6)

Ejemplo I'-51:

RMN de ^1H (400,1 MHz, D₆-DMSO): δ = 9,990 (4,2); 9,839 (0,4); 9,166 (1,5); 9,144 (1,7); 9,048 (2,3); 8,896 (2,4); 8,893 (2,4); 8,644 (2,5); 8,640 (2,5); 8,450 (1,4); 8,445 (1,3); 8,427 (1,3); 8,422 (1,3); 4,086 (1,3); 3,886 (0,6); 3,867 (1,8); 3,849 (1,8); 3,830 (0,7); 3,803 (16,0); 3,325 (50,7); 3,301 (0,6); 2,511 (16,3); 2,507 (32,4); 2,502 (42,6); 2,498 (30,2); 1,989 (0,3); 1,505 (0,6); 1,310 (3,7); 1,292 (8,1); 1,273 (3,7); 1,234 (2,0); 0,940 (0,3); 0,008 (1,1); 0,000 (27,8); -0,008 (1,1)

Ejemplo I'-52:

RMN de ^1H (400,0 MHz, D₆-DMSO): δ = 9,796 (4,4); 9,286 (4,0); 8,949 (1,7); 8,928 (1,9); 8,518 (1,6); 8,497 (1,7); 8,245 (4,3); 8,202 (0,8); 8,199 (0,9); 8,185 (1,1); 8,181 (1,5); 8,163 (1,0); 8,160 (1,0); 8,061 (1,2); 8,043 (1,8); 8,024 (0,9); 5,757 (7,5); 4,122 (0,7); 4,039 (0,3); 4,021 (0,3); 3,924 (16,0); 3,643 (15,0); 3,430 (0,7); 3,327 (44,1); 2,512 (14,8); 2,508 (29,0); 2,503 (38,1); 2,499 (28,3); 1,990 (1,5); 1,193 (0,4); 1,175 (0,8); 1,158 (0,4); 0,008 (2,2); 0,000 (43,4); -0,008 (1,8)

Ejemplo I'-53:

RMN de ^1H (400,0 MHz, D₆-DMSO): δ = 9,839 (4,4); 8,941 (1,7); 8,920 (1,9); 8,714 (6,3); 8,549 (1,6); 8,529 (1,7); 8,232 (0,8); 8,229 (0,8); 8,214 (1,1); 8,211 (1,6); 8,193 (1,0); 8,189 (1,0); 8,095 (1,2); 8,075 (1,8); 8,057 (0,9); 4,039 (0,5); 4,021 (0,6); 4,003 (0,4); 3,990 (16,0); 3,639 (14,8); 3,321 (26,3); 2,525 (0,9); 2,511 (17,4); 2,507 (35,5); 2,503 (48,7); 2,498 (37,1); 1,989 (2,2); 1,193 (0,6); 1,175 (1,2); 1,158 (0,6); 0,008 (2,0); 0,000 (52,4); -0,008 (2,1)

(continuación)

Ejemplo I-54:

RMN de ^1H (400,0 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$): δ = 9,847 (4,7); 8,937 (1,8); 8,916 (2,0); 8,717 (6,4); 8,549 (1,7); 8,529 (1,8); 8,226 (0,8); 8,223 (0,9); 8,208 (1,2); 8,205 (1,6); 8,186 (1,0); 8,183 (1,0); 8,091 (1,3); 8,073 (1,9); 8,054 (0,9); 3,952 (16,0); 3,781 (0,7); 3,762 (1,9); 3,744 (1,9); 3,726 (0,7); 3,320 (59,5); 2,675 (0,5); 2,671 (0,6); 2,667 (0,5); 2,506 (72,1); 2,502 (98,9); 2,498 (76,0); 2,333 (0,4); 2,329 (0,6); 2,325 (0,5); 1,989 (1,0); 1,398 (0,9); 1,277 (3,8); 1,259 (8,2); 1,240 (3,8); 1,175 (0,5); 0,146 (0,4); 0,008 (3,6); 0,000 (90,1); -0,008 (4,1); -0,150 (0,4)

Ejemplo I-55:

RMN de ^1H (600,1 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$): δ = 9,449 (6,4); 9,348 (6,1); 9,249 (9,4); 8,769 (10,1); 8,577 (5,6); 8,573 (5,7); 8,217 (4,2); 8,202 (5,2); 8,074 (3,6); 8,070 (3,6); 8,059 (3,0); 8,055 (3,0); 4,175 (2,1); 4,163 (7,0); 4,150 (7,0); 4,138 (2,2); 4,025 (0,3); 3,327 (87,0); 2,617 (0,4); 2,526 (0,8); 2,523 (1,0); 2,520 (1,2); 2,508 (46,7); 2,505 (63,1); 2,502 (48,2); 2,389 (0,4); 1,991 (1,4); 1,397 (1,5); 1,307 (7,4); 1,295 (16,0); 1,282 (7,3); 1,188 (0,4); 1,176 (0,7); 1,165 (0,4); 0,005 (0,5); 0,000 (11,7)

Ejemplo I-56:

RMN de ^1H (400,0 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$): δ = 9,467 (6,2); 9,350 (6,1); 9,302 (9,1); 8,754 (10,4); 8,480 (5,2); 8,458 (5,7); 8,337 (0,7); 8,315 (0,7); 8,280 (4,9); 8,275 (5,1); 7,918 (3,6); 7,913 (3,5); 7,896 (3,4); 7,891 (3,4); 7,720 (0,3); 7,699 (0,4); 7,355 (0,4); 7,350 (0,4); 7,299 (0,5); 7,283 (0,7); 7,272 (0,4); 7,262 (0,7); 4,180 (1,9); 4,161 (6,7); 4,143 (6,8); 4,124 (2,0); 4,038 (0,4); 4,020 (0,5); 3,318 (243,1); 2,689 (0,4); 2,675 (2,1); 2,671 (2,9); 2,666 (2,2); 2,524 (9,5); 2,510 (168,3); 2,506 (345,7); 2,502 (476,8); 2,497 (360,5); 2,493 (179,4); 2,333 (2,0); 2,328 (2,8); 2,324 (2,0); 1,989 (2,0); 1,649 (0,8); 1,398 (0,7); 1,315 (7,2); 1,296 (16,0); 1,278 (7,0); 1,236 (0,7); 1,193 (0,5); 1,175 (1,0); 1,157 (0,5); 1,105 (0,3); 0,146 (1,9); 0,008 (15,6); 0,000 (415,4); -0,008 (16,8); -0,150 (1,8)

Ejemplo I-57:

RMN de ^1H (400,0 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$): δ = 9,449 (6,0); 9,345 (5,9); 9,246 (9,0); 8,767 (10,0); 8,418 (3,1); 8,399 (3,2); 8,212 (3,0); 8,190 (4,0); 8,088 (1,9); 8,084 (2,0); 8,071 (2,4); 8,067 (3,3); 8,063 (1,8); 8,049 (1,7); 8,046 (1,7); 7,877 (2,0); 7,874 (2,2); 7,857 (3,5); 7,839 (1,7); 7,837 (1,7); 4,177 (2,0); 4,159 (6,7); 4,140 (6,8); 4,122 (2,0); 3,321 (82,5); 2,676 (0,6); 2,672 (0,8); 2,667 (0,6); 2,525 (2,6); 2,512 (45,0); 2,507 (93,8); 2,503 (130,7); 2,498 (100,0); 2,494 (50,3); 2,334 (0,6); 2,330 (0,8); 2,325 (0,6); 2,075 (3,4); 1,316 (7,1); 1,297 (16,0); 1,279 (7,0); 1,233 (0,5); 0,146 (0,6); 0,008 (5,0); 0,000 (132,8); -0,008 (5,6); -0,150 (0,6)

Ejemplo I-58:

RMN de ^1H (601,6 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$): δ = 9,774 (4,2); 8,964 (1,7); 8,950 (1,8); 8,488 (1,6); 8,475 (1,6); 8,165 (0,8); 8,163 (0,8); 8,153 (1,1); 8,151 (1,6); 8,149 (1,0); 8,139 (1,0); 8,137 (0,9); 8,068 (2,6); 8,027 (1,1); 8,015 (1,8); 8,003 (0,9); 7,937 (1,8); 7,923 (2,0); 7,712 (1,5); 7,710 (1,5); 7,698 (1,3); 7,696 (1,3); 4,036 (0,4); 4,024 (0,4); 3,819 (0,8); 3,780 (16,0); 3,307 (52,0); 2,615 (0,6); 2,612 (0,8); 2,609 (0,6); 2,521 (1,6); 2,518 (2,1); 2,515 (2,4); 2,506 (49,3); 2,503 (98,4); 2,500 (132,6); 2,497 (99,9); 2,495 (50,3); 2,387 (0,6); 2,384 (0,8); 2,381 (0,6); 1,988 (1,7); 1,907 (1,0); 1,287 (3,8); 1,274 (8,1); 1,262 (3,8); 1,235 (0,5); 1,187 (0,5); 1,175 (0,9); 1,163 (0,5); 0,005 (1,4); 0,000 (33,4); -0,006 (1,5)

Ejemplo I-59:

RMN de ^1H (601,6 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$): δ = 9,313 (3,6); 8,347 (3,0); 8,331 (3,3); 8,324 (3,9); 7,870 (1,7); 7,865 (1,8); 7,854 (1,6); 7,850 (1,7); 7,741 (2,9); 7,737 (2,7); 4,060 (15,2); 3,968 (16,0); 3,776 (1,1); 3,763 (3,8); 3,751 (3,9); 3,739 (1,2); 3,309 (240,8); 3,281 (0,4); 2,615 (0,8); 2,612 (1,1); 2,609 (0,8); 2,521 (2,2); 2,518 (2,7); 2,515 (2,9); 2,506 (66,9); 2,503 (136,7); 2,500 (184,0); 2,497 (137,4); 2,495 (66,9); 2,388 (0,8); 2,385 (1,1); 2,382 (0,8); 2,072 (0,9); 1,255 (4,1); 1,243 (8,8); 1,230 (4,0); 0,005 (1,4); 0,000 (37,9); -0,006 (1,5)

Ejemplos de aplicación (los compuestos I-6 a I-8, I-10, I-13, I-14, I-17 a I-21, I-23, I-24, I-27 a I-30, I-32 a I-35, I-37, I-38, I-40 y I-41 han de considerarse como ejemplos comparativos).

Ctenocephalides felis – pruebas de contacto *in vitro* con pulgas de gato adultas

- 5 Para el recubrimiento de los tubos de ensayo, primero se disuelven 9 mg de principio activo en 1 ml de acetona p.a. y luego se diluyen a la concentración deseada con acetona p.a. Se distribuyen 250 μl de la solución homogéneamente en las paredes internas y en la base de un tubo de ensayo de 25 ml dando vuelta el tubo y girándolo en un agitador orbital (rotación con balanceo a 30 rpm durante 2 h). Con 900 ppm de solución de principio activo y área de superficie interna de 44,7 cm^2 , teniendo en cuenta una distribución homogénea, se consigue una dosis de en base a área de 5 $\mu\text{g}/\text{cm}^2$.
- 10 Despues de eliminar el disolvente por evaporación, se agregan a los tubos entre 5 y 10 pulgas de gato adultas (*Ctenocephalides felis*), se sellan los mismos con una tapa plástica perforada y se incuban en una posición horizontal a temperatura ambiente y humedad ambiente. Despues de 48 h, se determina la eficacia. Para este fin, se colocan los tubos de ensayo en posición vertical y se golpean los mismos para que las pulgas caigan a la base. Las pulgas que permanecen sin moverse en la base o que se mueven de una forma descoordinada se consideran como muertas o moribundas.
- 15 Una sustancia muestra una buena eficacia contra *Ctenocephalides felis* si se consigue una eficacia de al menos 80 % en este ensayo a una tasa de aplicación de 5 $\mu\text{g}/\text{cm}^2$. Una eficacia del 100 % significa que todas las pulgas estaban muertas o moribundas. Una eficacia del 0 % que no se dañó a las pulgas.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 5 µg/cm² (= 500 g/ha): I-1

Ctenocephalides felis – prueba oral

Disolvente: dimetilsulfóxido

5 Para el propósito de la producción de una preparación adecuada de principio activo, se mezclan 10 mg de principio activo con 0,5 ml de dimetilsulfóxido. La dilución con sangre de bovino tratada con citrato da la concentración deseada.

10 Se colocan aproximadamente 20 pulgas de gato adultas no alimentadas (*Ctenocephalides felis*) en una cámara que se cierra en la parte superior e inferior con gasa. Se coloca un en la cámara cilindro metálico cuyo extremo está cerrado con parafina. El cilindro contiene la preparación de sangre/principio activo, en donde se pueden embeber las pulgas a través de la membrana de parafina.

Después de 2 días, se determina el % de muerte. Un 100 % significa que se han muerto todas las pulgas; un 0 % significa que no se ha muerto ninguna de las pulgas.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 100 ppm: I-1

15 **Lucilia cuprina – prueba**

Disolvente: dimetilsulfóxido

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

20 Se transfieren aproximadamente 20 larvas L1 de la mosca azul de las ovejas australianas (*Lucilia cuprina*) a un recipiente de prueba que contiene carene de caballo molida y la preparación de ingrediente de la concentración deseada.

Después de 2 días, se determina el % de muerte. Un 100 % significa que todas las larvas han muerto; un 0 % significa que no ha muerto ninguna larva.

25 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 100 ppm: I-1

Musca domestica – prueba

Disolvente: dimetilsulfóxido

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

30 Los recipientes que contienen una esponja tratada con solución de azúcar y la preparación de ingrediente de la concentración deseada reciben 10 moscas domésticas adultas (*Musca domestica*).

Después de 2 días, se determina el % de muerte. Un 100 % significa que todas las moscas han muerto; un 0 % significa que ninguna de las moscas ha muerto.

35 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 75 % a una tasa de aplicación de 4 ppm: I-1

Meloidogyne incógnita – prueba

Disolvente: 125,0 partes en peso de acetona

Para producir una preparación adecuada de principio activo, se mezcla 1 parte en peso de principio activo con la mencionada cantidad de disolvente y se diluye el concentrado con agua a la concentración deseada.

40 Se llenan los recipientes con arena, solución de principio activo, una suspensión de huevos/larvas del nematodo de nudo de raíz del sur (*Meloidogyne incognita*) y semillas de lechuga. Las semillas de lechuga germinan y se desarrollan las plantas. Se desarrollan irritaciones en las raíces.

45 Despues de 14 días, se determina la eficacia del nematicida en % mediante la formación de irritaciones. Un 100 % significa que no se hallaron irritaciones; un 0 % significa que el número de irritaciones en las plantas tratadas corresponde al control no tratado.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del

100 % a una tasa de aplicación de 20 ppm: I-32

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 90 % a una tasa de aplicación de 20 ppm: I-40

5 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 70 % a una tasa de aplicación de 20 ppm: I-1

Myzus persicae – prueba de aspersión

Disolvente:	78	partes en peso de acetona
	1,5	partes en peso de dimetilformamida
Emulsionante:		alquilaryl poliglicol éter

10 Para producir una preparación adecuada de principio activo, se disocia 1 parte en peso de principio activo con las partes en peso de disolvente mencionadas y se completa con agua conteniendo una concentración de emulsionante de 1000 ppm hasta llegar a la concentración deseada. Para producir concentraciones de prueba adicionales, se diluye la preparación con agua conteniendo emulsionante.

15 Se atomizan discos de hojas de repollo chino (*Brassica pekinensis*) infestadas por todas las etapas del pulgón de la pera verde (*Myzus persicae*) con una preparación de ingrediente de la concentración deseada.

Después de entre 5 y 6 días, se determina la eficacia en %. Un 100 % significa que todos los pulgones han muerto; un 0 % significa que no ha muerto ningún pulgón.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 500 g/ha: I-13

20 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 90 % a una tasa de aplicación de 500 g/ha: I-6, I-7, I-8, I-10, I-12, I-14, I-16, I-17, I-41, I-42, I-44

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia de 70 % a una tasa de aplicación de 500 g/ha: I-5, I-11, I-30

25 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 100 g/ha: I-2, I-18, I-20, I-21, I-22, I-23

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 90 % a una tasa de aplicación de 100 g/ha: I-1, I-19

Phaedon cochleariae – prueba de aspersión

Disolvente:	78,0	partes en peso de acetona
	1,5	partes en peso de dimetilformamida
Emulsionante:		alquilaryl poliglicol éter

30 Para producir una preparación adecuada de principio activo, se disuelve 1 parte en peso de principio activo con las mencionadas partes en peso de disolvente y se completa con agua que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm hasta llegar a la concentración deseada. Para producir concentraciones adicionales de prueba, se diluye la preparación con agua conteniendo emulsionante.

35 Se atomizan discos de hoja de repollo chino (*Brassica pekinensis*) con una preparación de ingrediente de la concentración deseada y, luego de secar, se agregan larvas del escarabajo de la mostaza (*Phaedon cochleariae*).

Después de 7 días, se determina la eficacia en %. Un 100 % significa que todas las larvas de escarabajo han muerto; un 0 % significa que no ha muerto ninguna larva de escarabajo.

40 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 500 g/ha: I-1, I-5, I-7, I-8, I-10, I-11, I-12, I-14, I-15, I-16, I-17, I-25

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 83 % a una tasa de aplicación de 500 g/ha: I-6, I-30, I-35, I-44

45 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 100 g/ha: I-13, I-18, I-19, I-20, I-21, I-23

Spodoptera frugiperda – prueba de aspersión

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

Emulsionante: alquilaril poliglicol éter

Para producir una preparación adecuada de principio activo, se disuelve 1 parte en peso de principio activo con las mencionadas partes en peso de disolvente y se completa con agua que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm hasta llegar a la concentración deseada. Para producir concentraciones adicionales de prueba, se diluye la preparación con agua conteniendo emulsionante.

5 Se atomizan discos de hoja de maíz (*Zea mays*) con una preparación de ingrediente de la concentración deseada y, luego de secar, se agregan orugas del gusano de polilla (*Spodoptera frugiperda*).

Después de 7 días, se determina la eficacia en %. Un 100 % significa que todas las orugas han muerto; un 0 % significa que no ha muerto ninguna oruga.

10 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 500 g/ha: I-1, I-2, I-5, I-6, I-7, I-8, I-10, I-11, I-12, I-14, I-15, I-16, I-17, I-25, I-30, I-35, I-44

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 83 % a una tasa de aplicación de 500 g/ha: I-13

15 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 100 g/ha: I-19, I-18, I-20, I-21, I-22, I-23

Tetranychus urticae – prueba de aspersión, resistencia a OP

20 Disolvente: 78,0 partes en peso de acetona
Emulsionante: 1,5 partes en peso de dimetilformamida
alquilaril poliglicol éter

Para producir una preparación adecuada de principio activo, se disuelve 1 parte en peso de principio activo con las mencionadas partes en peso de disolvente y se completa con agua que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm hasta llegar a la concentración deseada. Para producir concentraciones adicionales de prueba, se diluye la preparación con agua conteniendo emulsionante.

25 Se atomizan discos de hojas de planta de judía (*Phaseolus vulgaris*) infestadas con todas las etapas de la garrapata araña roja de invernadero (*Tetranychus urticae*) con una preparación de ingrediente de la concentración deseada.

Después de 6 días, se determina la eficacia en %. Un 100 % significa que todas las garrapatas araña han muerto; un 0 % significa que no ha muerto ninguna garrapata araña.

30 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 70 % a una tasa de aplicación de 500 g/ha: I-42

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 100 g/ha: I-34

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 90 % a una tasa de aplicación de 100 g/ha: I-22, I-36, I-37

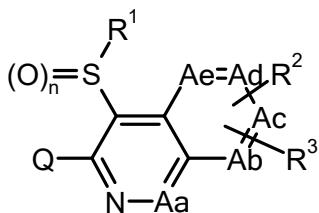
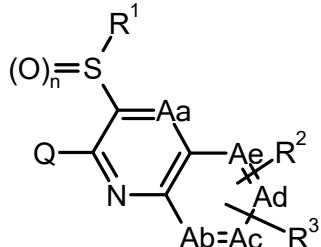
35 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 70 % a una tasa de aplicación de 100 g/ha: I-4, I-18, I-29

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 20 g/ha: I-23

40 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 70 % a una tasa de aplicación de 20 g/ha: I-21, I-40

REIVINDICACIONES

1. Compuestos de fórmula (I) o (I')



(1)

(I')

5 en los que

Aa es nitrógeno o $=C(R^7)-$,
 Ab es nitrógeno o $=C(H)-$,
 Ac es nitrógeno o $=C(H)-$,
 Ad es nitrógeno o $=C(H)-$,
 Ae es nitrógeno o $=C(H)-$

donde Ab , Ac , Ad y Ae no pueden ser todos nitrógeno,

R¹ es alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), cianoalquilo (C₁-C₆), hidroxialquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquenilo (C₂-C₆), alqueniloxi (C₂-C₆)-alquilo (C₁-C₆), haloalqueniloxi (C₂-C₆)-alquilo (C₁-C₆), haloalquenilo (C₂-C₆), cianoalquenilo (C₂-C₆), alquinilo (C₂-C₆), alquiniloxi (C₂-C₆)-alquilo (C₁-C₆), haloalquiniloxi (C₂-C₆)-alquilo (C₁-C₆), haloalquinilo (C₂-C₆), cianoalquinilo (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₈), cicloalquil (C₃-C₈)-cicloalquilo (C₃-C₈), alquil (C₁-C₆)-cicloalquilo (C₃-C₈), halocicloalquilo (C₃-C₈), amino, alquilamino (C₁-C₆), dialquilamino (C₁-C₆), cicloalquilamino (C₃-C₈), alquilcarbonilamino (C₁-C₆), alquiltio (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), haloalquiltio (C₁-C₆)-(C₁-C₆)-alquilo, alquilsulfinil (C₁-C₆)-(C₁-C₆)-alquilo, haloalquilsulfinil (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquilsulfonil (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), haloalquilsulfonil (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquiltio (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilsulfinil (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilsulfonil (C₁-C₆)-(C₁-C₆)-alquilo, alquilcarbonil (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), haloalquilcarbonil (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alcoxicarbonil (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), haloalcoxicarbonil (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquilsulfonilamino (C₁-C₆), aminosulfonil-alquilo (C₁-C₆), alquilaminosulfonil (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), dialquilaminosulfonil (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), o alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), alquenilo (C₂-C₆), alquinilo (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₈), cada uno opcionalmente mono- o polisustituido de manera idéntica o diferente con arilo, hetarilo o heterociclico, donde arilo, hetarilo o heterociclico puede estar cada uno opcionalmente mono- o polisustituido de manera idéntica o diferente con halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, amino, carboxilo, carbamoilo, aminosulfonilo, alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₆), alcoxi (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), alquiltio (C₁-C₆), alquilsulfinilo (C₁-C₆), alquilsulfonilo (C₁-C₆), alquilsulfimino (C₁-C₆), alquilsulfimino (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquilsulfimino (C₁-C₆)-alquilcarbonilo (C₂-C₆), alquilsulfoximino (C₁-C₆), alquilsulfoximino (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquilsulfoximino (C₁-C₆)-alquilcarbonilo (C₂-C₆), alcoxicarbonilo (C₁-C₆), alquilarbonilo (C₁-C₆), trialquilsililo (C₃-C₆) o bencilo, o

R¹ es arilo, hetarilo o heterociclico, cada uno mono- o polisustituido de manera idéntica o diferente con halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, amino, carboxilo, carbamoilo, alquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₈), alcoxi (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), alquilitio (C₁-C₆), alquilsulfinilo (C₁-C₆), alquilsulfonilo (C₁-C₆), alquilsulfimino (C₁-C₆), alquilsulfimino (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquilsulfimino (C₁-C₆)-alquilcarbonilo (C₂-C₆), alquilsulfoximino (C₁-C₆), alquilsulfoximino (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquilsulfoximino (C₁-C₆)-alquilcarbonilo (C₂-C₆), alcoxcarbonilo (C₁-C₆), alquilcarbonilo (C₁-C₆), trialquilsililo (C₃-C₆), (=O) (en el caso de heterociclico solamente) y (=O)₂ (en el caso de heterociclico solamente),

40 R², R³ son independientemente hidrógeno, ciano, halógeno, nitro, acetilo, hidroxilo, amino, SCN, trialquilsililo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₈), cicloalquil (C₃-C₈)-cicloalquilo (C₃-C₈), alquil (C₁-C₆)-cicloalquilo (C₃-C₈), halocicloalquilo (C₃-C₈), alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), cianoalquilo (C₁-C₆), hidroxialquilo (C₁-C₆), hidroxicarbonil-alcoxi (C₁-C₆), alcoxicarbonil (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquenilo (C₂-C₆), haloalquenilo (C₂-C₆), cianoalquenilo (C₂-C₆), alquinilo (C₂-C₆), haloalquinilo (C₂-C₆), cianoalquinilo (C₂-C₆), alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), cianoalcoxi (C₁-C₆), alcoxicarbonil (C₁-C₆)-alcoxi (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alcoxi (C₁-C₆), alquilhidroxiimino (C₁-C₆), alcoxiimino (C₁-C₆), alquil (C₁-C₆)-alcoxiimino (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆)-alcoxiimino (C₁-C₆), alquiltio (C₁-C₆), haloalquiltio (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquiltio (C₁-C₆), alquiltio (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquilsulfinilo (C₁-C₆), haloalquilsulfinilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilsulfinilo (C₁-C₆), alquilsulfinil (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquilsulfonilo (C₁-C₆), haloalquilsulfonilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆)-alquilsulfonilo (C₁-C₆), alquilsulfonil (C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆), alquilsulfoniloxi (C₁-C₆), alquilcarbonilo (C₁-C₆), alquiltiocarbonilo (C₁-C₆), haloalquilcarbonilo (C₁-C₆), alquilcarboniloxi (C₁-C₆), alcoxicarbonilo (C₁-C₆), haloalcoxicarbonilo (C₁-C₆), aminocarbonilo, alquilaminocarbonilo (C₁-C₆), alquilaminotiocarbonilo (C₁-C₆), dialquilaminocarbonilo (C₁-C₆), dialquilaminotiocarbonilo (C₁-C₆), alquenilaminocarbonilo (C₂-C₆), dialquenilaminocarbonilo (C₂-C₆),

cicloalquilaminocarbonilo (C₃-C₈), alquilsulfonilamino (C₁-C₆), alquilamino (C₁-C₆), dialquilamino (C₁-C₆), aminosulfonilo, alquilaminosulfonilo (C₁-C₆), dialquilaminosulfonilo (C₁-C₆), alquilsulfoximino (C₁-C₆), aminotiocarbonilo, alquilaminotiocarbonilo (C₁-C₆), di- alquilaminotiocarbonilo (C₁-C₆), cicloalquilamino (C₃-C₈) o NHCO-alquilo (C₁-C₆) (alquilcarbonilamino (C₁-C₆)),

5 R⁷ es hidrógeno, ciano, halógeno, acetilo, hidroxilo, amino, cicloalquilo (C₃-C₈), halocicloalquilo (C₃-C₈), alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), cianoalquilo (C₁-C₆), alquenilo (C₂-C₆), haloalquenilo (C₂-C₆), alquinilo (C₂-C₆), haloalquinilo (C₂-C₆), alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), alquiltio (C₁-C₆), haloalquiltio (C₁-C₆), alquilsulfinilo (C₁-C₆), haloalquilsulfinilo (C₁-C₆), alquilsulfonilo (C₁-C₆) o haloalquilsulfonilo (C₁-C₆),

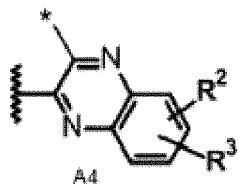
10 Q es un sistema de anillos bicíclicos o tricíclicos condensados de 8, 9, 10, 11 o 12 miembros heterocíclicos o heteroaromáticos saturados o parcialmente saturados, donde al menos un grupo carbonilo puede estar presente opcionalmente y/o donde el sistema de anillos puede estar opcionalmente mono o polisustituido en forma idéntica o diferente, y donde los sustituyentes pueden seleccionarse independientemente entre sí de hidrógeno, ciano, halógeno, hidroxilo, hidroxióxido, CONH_2 , hidroxióxido (O^-), hidroxiol (O^-), hidroxiol (O^-),

25 aquilsulfoniloxi (C_1-C_6), alquicarbonilo (C_1-C_6), alquicarbonilo (C_1-C_6)-alquilo (C_1-C_8), alquicarbonilo (C_1-C_6), haloalquicarbonilo (C_1-C_6), alquilcarboniloxi (C_1-C_6), alcoxicarbonilo (C_1-C_6), halo alcoxicarbonilo (C_1-C_6), aminocarbonilo, alquilaminocarbonilo (C_1-C_6), alquilaminotiocarbonilo (C_1-C_6), dialquilaminocarbonilo (C_1-C_6), dialquilaminotiocarbonilo (C_1-C_6), alquenilaminocarbonilo (C_2-C_6), dialquenilaminocarbonilo (C_2-C_6), cicloalquilaminocarbonilo (C_3-C_8), alquilsulfonilamino (C_1-C_6), alquilamino (C_1-C_6), dialquilamino (C_1-C_6), aminosulfonilo, alquilaminosulfenilo (C_1-C_6), dialquilaminosulfenilo (C_1-C_6), alquilsulfoximino (C_1-C_6),

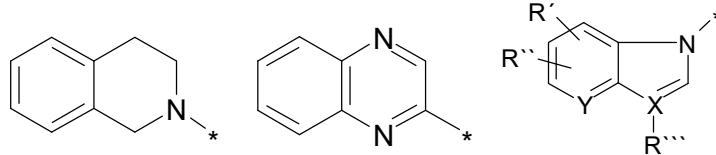
30 aminosufoxínilo, alquilaminosufoxínilo (C_1 - C_6), dialquilaminosufoxínilo (C_1 - C_6), alquilsufoxínilo (C_1 - C_6), aminotiocarbonilo, alquilaminotiocarbonilo (C_1 - C_6), dialquilaminotiocarbonilo (C_1 - C_6), cicloalquilamino (C_3 - C_8), NHCO-alkilo (C_1 - C_6) (alquilcarbonilamino (C_1 - C_6)),
o donde los sustituyentes pueden seleccionarse independientemente entre sí de fenilo o un anillo heteroaromático.

35 o donde los sustituyentes pueden seleccionarse independientemente entre si de ferroc y un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, donde fenilo o el anillo puede estar opcionalmente mono- o polisustituido de manera idéntica o diferente con alquilo C₁-C₆, alquienilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, halógeno, CN, NO₂, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, n es 0, 1 o 2.

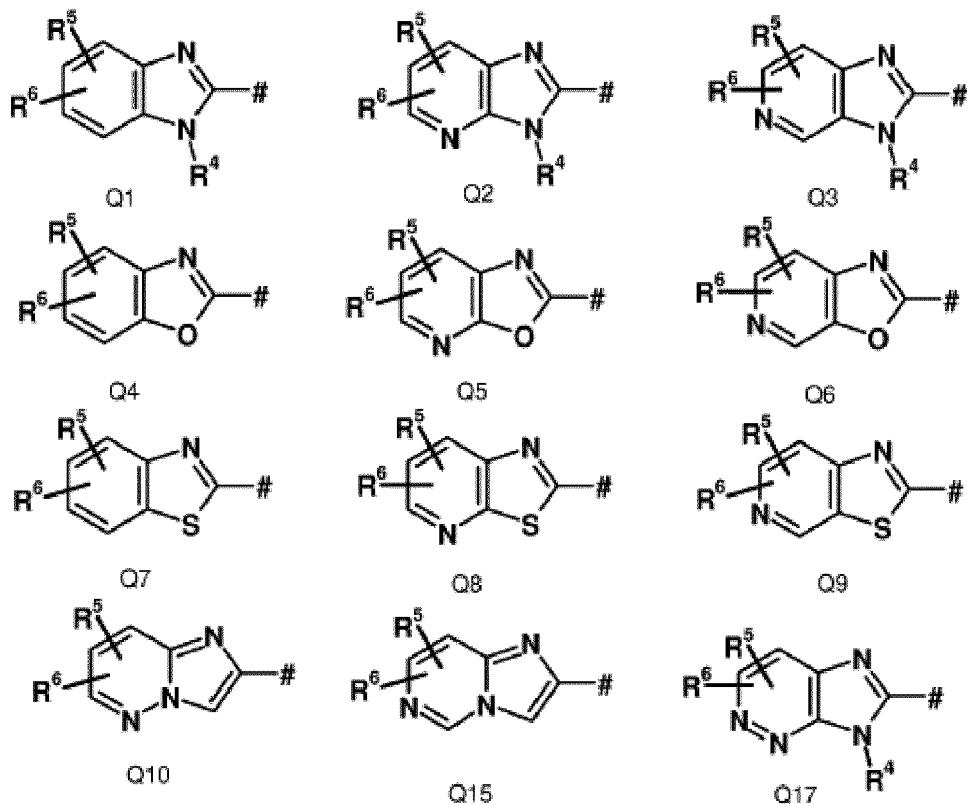
donde, en el caso de la unidad estructural A4,



Q no es ninguno de los siguientes sistemas de anillos:

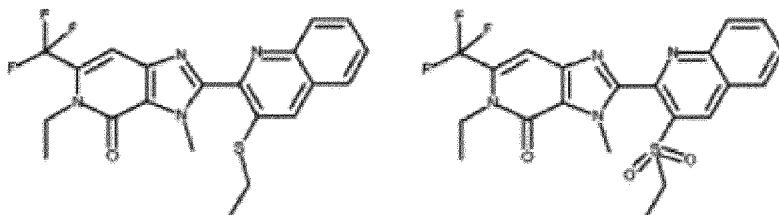


donde X e Y, que pueden ser iguales o diferentes, son carbono o nitrógeno, R''' es hidrógeno, aldehído, oxima o $-C(O)O-R_a$, con la condición de que X sea carbono, donde R_a es alquilo inferior C_1-C_6 , R' y R'', que pueden ser iguales o diferentes, son hidrógeno, halógeno, ciano, nitró, alquilo inferior C_1-C_6 o alcoxi inferior C_1-C_6 , y, además, cuando Aa es $=C(H)-$, en el caso de los compuestos de fórmula (I), Q no es Q1, Q2, Q3, Q4, Q5, Q6, Q7, Q8, Q9, Q10, Q15, Q17,



5 donde

R⁴ es hidrógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), cianoalquilo (C₁-C₄), hidroxialquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), alquenilo (C₂-C₄), alqueniloxi (C₂-C₄)-alquilo (C₁-C₄), haloalqueniloxi (C₂-C₄)-alquilo (C₁-C₄), haloalquenilo (C₂-C₄), cianoalquenilo (C₂-C₄), alquinilo (C₂-C₄), alquiniloxi (C₂-C₄)-alquilo (C₁-C₄), haloquiniloxi (C₂-C₄), haloalquinilo (C₂-C₄), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquil (C₃-C₆)-cicloalquilo (C₃-C₆), alquil (C₁-C₄)-cicloalquilo (C₃-C₆), halocicloalquilo (C₃-C₆), alquiltio (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), alquilsulfonil (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), alquilsulfonil (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), R⁵, R⁶ son independientemente hidrógeno, ciano, halógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alquenilo (C₂-C₄), haloalquenilo (C₂-C₄), alquinilo (C₂-C₄), haloalquinilo (C₂-C₄), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquil (C₃-C₆)-cicloalquilo (C₃-C₆), alquiltio (C₁-C₄)-cicloalquilo (C₃-C₆), alquilsulfonilo (C₁-C₄), haloalquilsulfonilo (C₁-C₄), alquilsulfoniloxi (C₁-C₄), alquilcarbonilo (C₁-C₄), haloalquilcarbonilo (C₁-C₄), aminocarbonilo, alquilaminocarbonilo (C₁-C₄), dialquilaminocarbonilo (C₁-C₄), alquilsulfonilamino (C₁-C₄), alquilamino (C₁-C₄), dialquilamino (C₁-C₄), aminosulfonilo, alquilaminosulfonilo (C₁-C₄) o dialquilaminosulfonilo (C₁-C₄), a excepción de

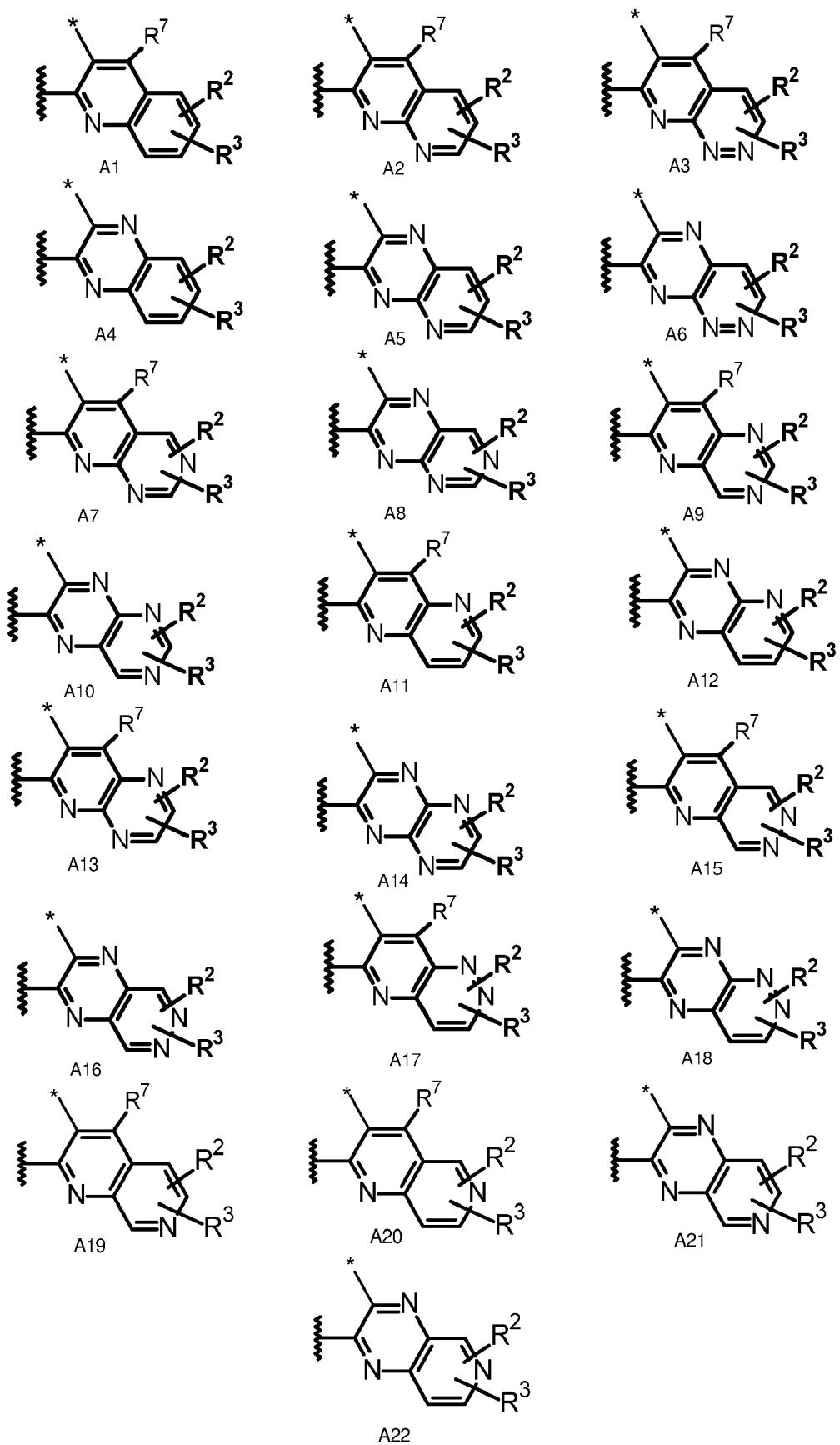


20

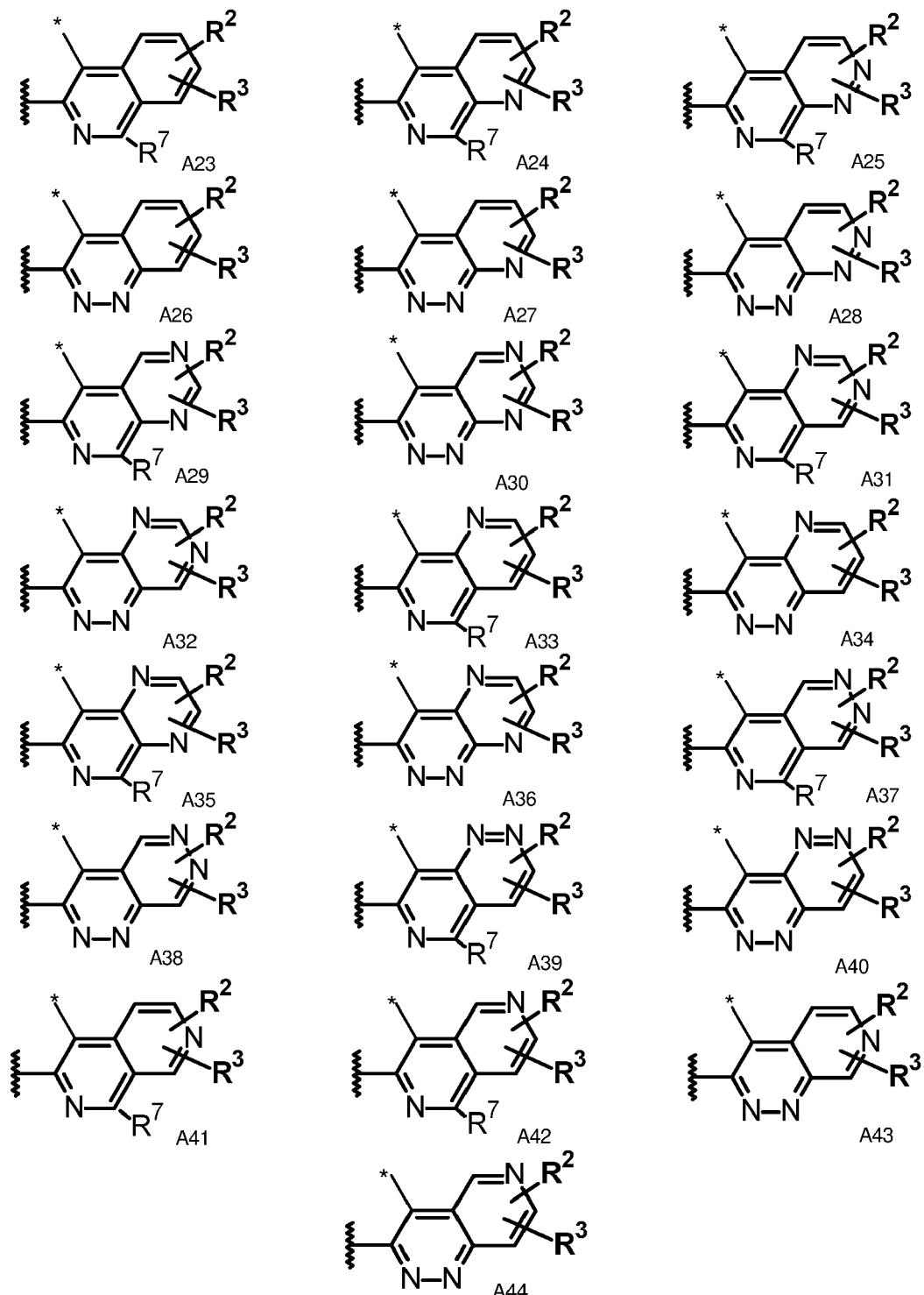
2. Compuestos de fórmula (I) o (I') de acuerdo con la reivindicación 1, en los que

- Aa es nitrógeno o =C(R⁷)-,
 Ab es nitrógeno o =C(H)-,
 Ac es nitrógeno o =C(H)-,
 Ad es nitrógeno o =C(H)-,
 Ae es nitrógeno o =C(H)-,

donde Ab, Ac, Ad y Ae no pueden ser todos nitrógeno,
 para dar preferentemente las siguientes unidades estructurales A1 a A44:



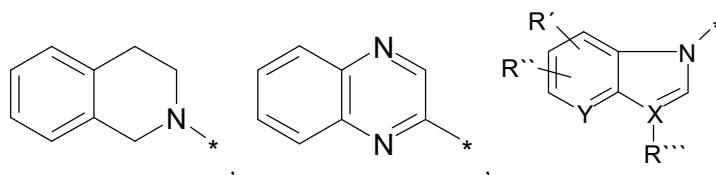
5



10 donde la unión al sustituyente Q se identifica con una línea ondulada y la unión con el átomo de azufre mediante un asterisco *

15 R¹ es alquilo (C₁-C₄), hidroxialquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), cianoalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), alquenilo (C₂-C₄), alqueniloxi (C₂-C₄)-alquilo (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), haloalqueniloxi (C₂-C₄)-alquilo (C₁-C₄), cianoalquenilo (C₂-C₄), alquinilo (C₂-C₄), alquiniloxi (C₂-C₄)-alquilo (C₁-C₄), haloalquiniloxi (C₂-C₄)-alquilo (C₁-C₄), haloalquinil (C₂-C₄), cianoalquinil (C₂-C₄), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquil (C₃-C₆) cicloalquilo (C₃-C₆), alquil (C₁-C₄)-cicloalquilo (C₃-C₆), halo cicloalquilo (C₃-C₆), alquilamino (C₁-C₄), dialquilamino (C₁-C₄), cicloalquilamino (C₃-C₆), alquilcarbonilamino (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), haloalquiltio (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), alquilsulfinil (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), haloalquilsulfinil (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), alquilsulfonil (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), alquilcarbonil (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), haloalquilcarbonil (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), alquilsulfonilamino (C₁-C₄),

donde, en el caso de la unidad estructural A4, Q no es ninguno de los siguientes sistemas de anillos:



donde X e Y, que pueden ser iguales o diferentes, son carbono o nitrógeno, R'' es hidrógeno, aldehído, oxima o $-C(O)O-R_a$, con la condición de que X sea carbono, donde R_a es alquilo inferior C₁-C₆, R' y R'', que pueden ser iguales o diferentes, son hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo inferior C₁-C₆ o alcoxi inferior C₁-C₆, y, además, cuando Aa es $=C(H)-$, en el caso de los compuestos de fórmula (I), Q no es Q₁, Q₂, Q₃, Q₄, Q₅, Q₆, Q₇, Q₈, Q₉, Q₁₀, Q₁₅, Q₁₇.

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

- 5 Aa es nitrógeno o $=C(R^7)-$,
 Ab es nitrógeno o $=C(H)-$,
 Ac es nitrógeno o $=C(H)-$,
 Ad es nitrógeno o $=C(H)-$,
 Ae es nitrógeno o $=C(H)-$,

donde Ab, Ac, Ad y Ae no pueden ser todos nitrógeno,

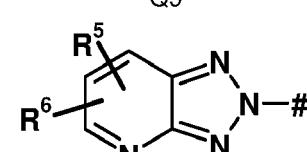
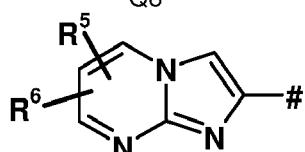
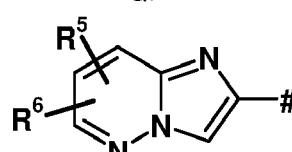
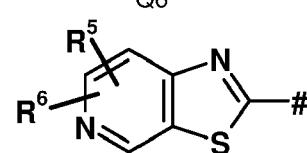
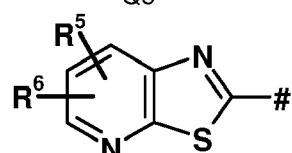
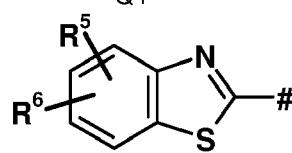
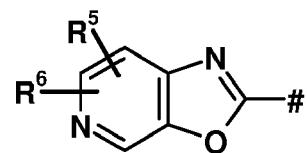
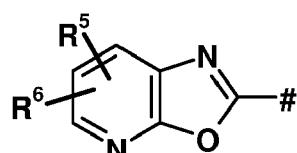
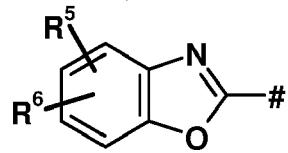
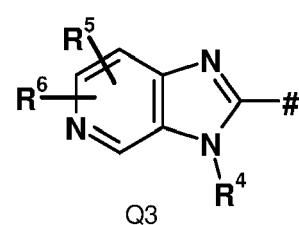
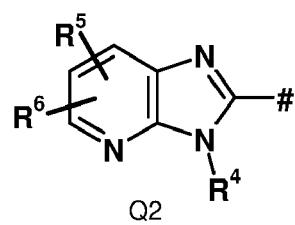
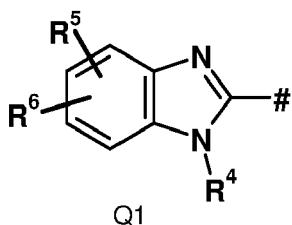
para dar de manera especialmente preferente las siguientes unidades estructurales: A1, A2, A3, A4, A5, A7, A8, A9, A10, A11, A12, A13, A14, A15, A17, A19, A20, A21, A22, A23, A24, A25, A26, A27, A29, A30, A31, A32, A33, A34, 10 A35, A36, A37, A39, A41, A42, A43, A44,

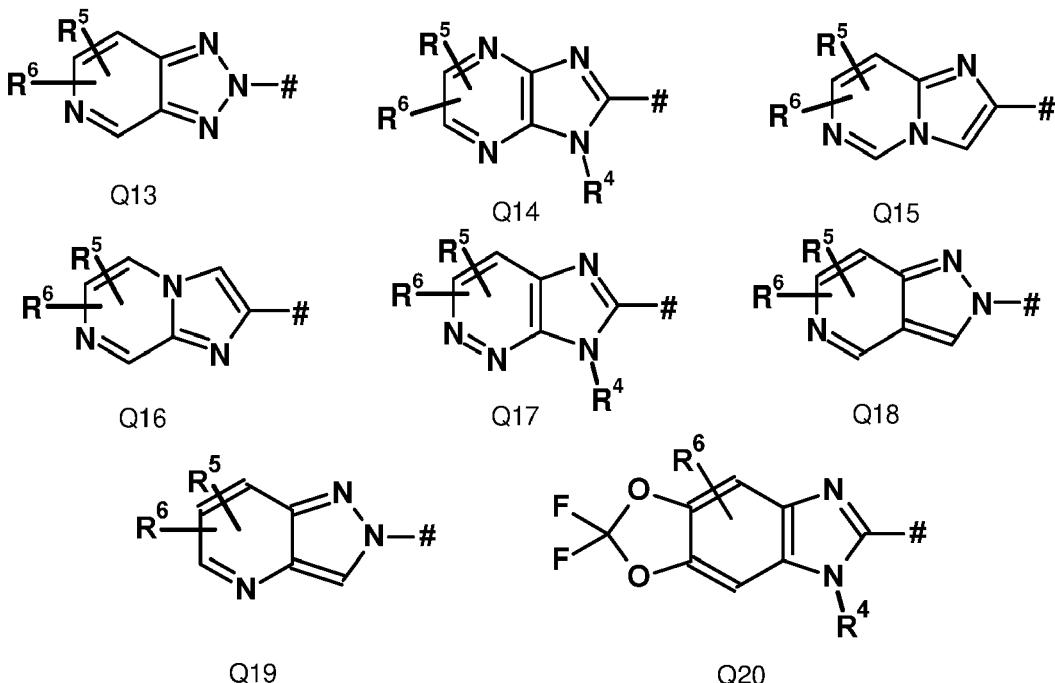
15 R¹ es (C₁-C₄)-alquilo, hidroxialquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alquenilo (C₂-C₄), haloalquenilo (C₂-C₄), alquinilo (C₂-C₄), haloalquinilo (C₂-C₄), (C₃-C₆)cicloalquilo, alquiltio (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), alquilsulfinil (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄) o alquilsulfonil (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄),

15 R², R³ son independientemente hidrógeno, ciano, halógeno, nitro, hidroxilo, amino, SCN, trialquilsililo (C₁-C₄), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquil (C₃-C₆)-cicloalquilo (C₃-C₆), alquil (C₁-C₄)-cicloalquilo (C₃-C₆), alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), cianoalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), alquenilo (C₂-C₄), haloalquenilo (C₂-C₄), cianoalquenilo (C₂-C₄), alquinilo (C₂-C₄), haloalquinilo (C₂-C₄), cianoalquinilo (C₂-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), cianoalcoxi (C₁-C₄), alquihidroxiimino (C₁-C₄), alcoxiimino (C₁-C₄), alquil (C₁-C₄)-alcoxiimino (C₁-C₄), alquiltio (C₁-C₄), haloalquiltio (C₁-C₄), alquilsulfinilo (C₁-C₄), haloalquilsulfinilo (C₁-C₄), alquilsulfonilo (C₁-C₄), haloalquilsulfonilo (C₁-C₄), aminocarbonilo, alquilaminocarbonilo (C₁-C₄), dialquilaminocarbonilo (C₁-C₄), alquilsulfonilamino (C₁-C₄), alquilamino (C₁-C₄), dialquilamino (C₁-C₄), aminosulfonilo, alquilaminosulfonilo (C₁-C₄), dialquilaminosulfonilo (C₁-C₄) o NHCO-alquilo (C₁-C₄) (alquilcarbonilamino (C₁-C₄)),

20 R⁷ es hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo (C₁-C₄) o haloalquilo (C₁-C₄),

25 Q es un sistema de anillos heteroaromáticos bicíclicos o tricíclicos condensados de 9 o 12 miembros del grupo de Q1 a Q20





R^4 es hidrógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), cianoalquilo (C₁-C₄), hidroxialquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), alquenilo (C₂-C₄), alqueniloxi (C₂-C₄)-alquilo (C₁-C₄), haloalqueniloxi (C₂-C₄)-alquilo (C₁-C₄), haloalquenilo (C₂-C₄), cianoalquenilo (C₂-C₄), alquinilo (C₂-C₄), alquiniloxi (C₂-C₄)-alquilo (C₁-C₄), haloalquinilo (C₂-C₄), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquil (C₃-C₆)-cicloalquilo (C₃-C₆), alquil (C₁-C₄)-cicloalquilo (C₃-C₆), halocicloalquilo (C₃-C₆), alquilitio (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), alquilsulfuril (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), alquilsulfonil (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄) o alquilcarbonil (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄),

R^5 , R^6 son independientemente hidrógeno, ciano, halógeno, alquilo (C_1 - C_4), haloalquilo (C_1 - C_4), alquenilo (C_2 - C_4), haloalquenilo (C_2 - C_4), alquinilo (C_2 - C_4), haloalquinilo (C_2 - C_4), cicloalquilo (C_3 - C_6), cicloalquil (C_3 - C_6)-cicloalquilo (C_3 - C_6), alquil (C_1 - C_4)-cicloalquilo (C_3 - C_6), alcoxi (C_1 - C_4), haloalcoxi (C_1 - C_4), alcoxiimino (C_1 - C_4), alquiltio (C_1 - C_4), haloalquiltio (C_1 - C_4), alquilsulfinilo (C_1 - C_4), haloalquilsulfinilo (C_1 - C_4), alquilsulfonilo (C_1 - C_4), haloalquilsulfonilo (C_1 - C_4), alquilsulfoniloxi (C_1 - C_4), alquilcarbonilo (C_1 - C_4), haloalquilcarbonilo (C_1 - C_4), aminocarbonilo, alquilaminocarbonilo (C_1 - C_4), dialquilaminocarbonilo (C_1 - C_4), alquilsulfonilamino (C_1 - C_4), alquilamino (C_1 - C_4), dialquilamino (C_1 - C_4), aminosulfonilo, alquilaminosulfonilo (C_1 - C_4) o dialquilaminosulfonilo (C_1 - C_4).

C_4),

22 donde, cuando Aa es =C(H)-, en el caso de los compuestos de fórmula (I), Q no es Q1, Q2, Q3, Q4, Q5, Q6, Q7, Q8, Q9, Q10, Q11, Q12, Q13.

4. Compuestos de fórmula (I) o (I') de acuerdo con la reivindicación 1, en los que

Aa es nitrógeno o $=C(R^7)-$,
 Ab es nitrógeno o $=C(H)-$,
 Ac es nitrógeno o $=C(H)-$,
 Ad es nitrógeno o $=C(H)-$,
 Ae es nitrógeno o $=C(H)-$.

donde Ab , Ac , Ad y Ae no pueden ser todos nitrógeno,

para dar de la manera más especialmente preferente las siguientes unidades estructurales: A1, A2, A4, A5, A7, A9, A11, A12, A13, A19, A20, A21, A22, A23, A24, A26, A27, A29, A31, A33, A34, A35, A41, A42, A43, A44,

30 R¹ es alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄) o cicloalquilo (C₃-C₆),

R^2 , R^3 son independientemente hidrógeno, ciano, halógeno, alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), haloalquilo (C_1-C_4), haloalcoxi (C_1-C_4), alquiltio (C_1-C_4), alquilsulfinilo (C_1-C_4), alquilsulfonilo (C_1-C_4), haloalquiltio (C_1-C_4), haloalquilsulfinilo (C_1-C_4), haloalquilsulfonilo (C_1-C_4) o $NHCO$ -alquilo (C_1-C_4) (alquilcarbonilamino (C_1-C_4)), R^7 es hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo (C_1-C_4) o haloalquilo (C_1-C_4).

R' es hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo (C_1-C_4) o haloalquilo (C_1-C_4), C es un sistema de anillos heterocíclicos bicíclicos o tricíclicos es

Q₁ es un sistema de anillos heteroaromaticos biciclicos o triciclicos condensados de 9 o 12 miembros del grupo de Q1, Q2, Q3, Q5, Q6, Q8, Q9, Q10, Q11, Q12, Q13, Q15, Q16, Q17, Q18, Q19 o Q20, P₁ es hidrógeno, cloruro (C₁C₁) o cloruro (C₁C₂) cloruro (C₂C₂)

R^4 es hidrógeno, alquilo (C_1-C_4) o alcoxi (C_1-C_4)-alquilo (C_1-C_4), R^5 es hidrógeno, cloro, halógeno, alquilo (C_1-C_4)-haloalquilo

R^b es hidrógeno, ciano, halógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), cicloalquilo (C₃-C₆), cicloalquil (C₃-C₆)-cicloalquilo (C₃-C₆), alquil (C₁-C₄)-cicloalquilo (C₃-C₆), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alcoximino (C₁-C₄),

alquiltio (C₁-C₄), haloalquiltio (C₁-C₄), alquilsulfinilo (C₁-C₄), haloalquilsulfinilo (C₁-C₄), alquilsulfonilo (C₁-C₄), haloalquilsulfonilo (C₁-C₄), alquilcarbonilo (C₁-C₄), haloalquilcarbonilo (C₁-C₄), alquilaminocarbonilo (C₁-C₄), dialquilaminocarbonilo (C₁-C₄), alquilsulfonilamino (C₁-C₄), alquilaminosulfonilo (C₁-C₄) o dialquilaminosulfonilo (C₁-C₄),

5 R⁶ es hidrógeno,
n es 0, 1 o 2,

donde, cuando Aa es =C(H)-, en el caso de los compuestos de fórmula (I), Q no es Q1, Q2, Q3, Q5, Q6, Q8, Q9, Q10, Q15, Q17.

5. Compuestos de fórmula (I) o (I') de acuerdo con la reivindicación 1, en donde

10 Aa es nitrógeno o =C(R⁷)-,
Ab es =C(H)-,
Ac es =C(H)-,
Ad es =C(H)-,
Ae es nitrógeno o =C(H)-,

15 para dar específicamente las siguientes unidades estructurales: A1, A4, A23, A26, A33,

R¹ es metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, n-butilo, isobutilo, terc-butilo, ciclobutilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, fluoroetilo, difluoroetilo, trifluoroetilo, tetrafluoroetilo o pentafluoroetilo,

R², R³ son independientemente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, metilo, etilo, metoxi, trifluorometilo, trifluorometoxi o trifluorometiltio,

20 R⁷ es hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo o trifluorometilo,

Q es un sistema de anillos bicíclicos heteroaromáticos de 9 miembros del grupo de Q1, Q2, Q3, Q16, Q17 o Q20,

R⁴ es hidrógeno, metilo, etilo, isopropilo, metoximetilo o metoxietilo,

R⁵ es flúor, cloro, bromo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, fluoroetilo (CH₂CFH₂, CHFCH₃), difluoroetilo

25 (CF₂CH₃, CH₂CHF₂, CHFCFH₂), trifluoroetilo, (CH₂CF₃, CHFCFH₂, CF₂CFH₂), tetrafluoroetilo (CHFCF₃, CF₂CHF₂), pentafluoroetilo, trifluorometoxi, difluoroclorometoxi, diclorofluorometoxi, trifluorometiltio, trifluoromethylsulfinilo o trifluoromethylsulfanilo,

R⁶ es hidrógeno,

n es 0, 1 o 2,

30 donde, cuando Aa es =C(H)-, en el caso de los compuestos de fórmula (I), Q no es Q1, Q2, Q3, Q17.

6. Compuestos de fórmula (I) o (I') de acuerdo con la reivindicación 1, en los que

Aa es nitrógeno o =C(R⁷)-,

Ab es =C(H)-,

Ac es =C(H)-,

35 Ad es =C(H)-,

Ae es nitrógeno o =C(H)-,

para dar las siguientes unidades estructurales: A1, A4, A23, A26, A33

R¹ es metilo o etilo,

R² es hidrógeno, cloro, metoxi o trifluorometilo,

40 R³ es hidrógeno,

R⁷ es hidrógeno,

Q es un sistema de anillos heteroaromáticos bicíclicos condensados de 9 miembros o 12 miembros del grupo de Q1, Q2, Q3, Q16, Q17, Q20,

R⁴ es hidrógeno o metilo,

45 R⁵ es trifluorometilo o pentafluoroetilo,

R⁶ es hidrógeno,

n es 0, 1 o 2,

donde, cuando Aa es =C(H)-, en el caso de los compuestos de fórmula (I), Q no es Q1, Q2, Q3, Q17.

7. Compuestos de fórmula (I') de acuerdo con la reivindicación 1, donde R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, Q, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae y n tienen las definiciones que se detallaron con anterioridad.

8. Compuestos de fórmula (I) o (I') de acuerdo con la reivindicación 1, con las estructuras de acuerdo con los ejemplos I-3, I-4, I-9, I-15, I-16, I-31, I-36, I'-42, I'-43, I'-44, I'-45, I'-47, I'-48, I'-49, I'-50, I'-51, I'-52, I'-53, I'-54, I-55, I-56, I-57, I'-58, I-59:

I-3	
I-4	
I-9	
I-15	
I-16	
I-31	

(continuación)

(continuación)

I'-48	
I'-49	
I'-50	
I'-51	
I'-52	
I'-53	
I'-54	

(continuación)

I-55	
I-56	
I-57	
I'-58	
I-59	

9. Formulación agroquímica que comprende compuestos de fórmula (I) o (I') de acuerdo con la reivindicación 1, así como extensores y/o agentes tensioactivos.

5 10. Formulación agroquímica de acuerdo con la reivindicación 9, que comprende adicionalmente un principio activo agroquímico adicional.

11. Procedimiento para controlar plagas de animales, **caracterizado por que** se permite que un compuesto de fórmula (I) o (I') de acuerdo con la reivindicación 1 o una formulación agroquímica de acuerdo con la reivindicación 9 o 10 actúe sobre las plagas animales y/o sobre su hábitat, a excepción de procedimientos para el tratamiento quirúrgico o terapéutico del cuerpo humano o animal.

10 12. Uso de los compuestos de fórmula (I) o (I') de acuerdo con la reivindicación 1 o de formulaciones agroquímicas de acuerdo con la reivindicación 9 o 10 para el control de plagas animales, a excepción del uso en procedimientos para el tratamiento quirúrgico o terapéutico del cuerpo humano o animal.

13. Compuestos de fórmula (III-1), (III-2), (III-2)

