



(19)



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

(11) Número de publicación: **2 345 559**

(51) Int. Cl.:

C07D 231/38 (2006.01)

C07D 403/12 (2006.01)

C07D 401/12 (2006.01)

C07D 401/04 (2006.01)

A61K 31/41 (2006.01)

A61K 31/435 (2006.01)

A61P 43/00 (2006.01)

(12)

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

(96) Número de solicitud europea: **05707703 .4**

(96) Fecha de presentación : **04.03.2005**

(97) Número de publicación de la solicitud: **1730115**

(97) Fecha de publicación de la solicitud: **13.12.2006**

(54)

Título: **Derivados de 5-aminoalquilpirazol como agentes pesticidas.**

(30)

Prioridad: **24.03.2004 EP 04007023**

(45)

Fecha de publicación de la mención BOPI:
27.09.2010

(45)

Fecha de la publicación del folleto de la patente:
27.09.2010

(73)

Titular/es: **MERIAL LTD.**
3239 Satellite Blvd.
Duluth, Georgia 30096-4640, US

(72)

Inventor/es: **Schnatterer, Stefan;**
Chou, David, Teh-Wei;
Knauf, Werner;
Jans, Daniela y
Seeger, Karl

(74)

Agente: **Ponti Sales, Adelaida**

ES 2 345 559 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 5-aminoalquilpirazol como agentes pesticidas.

La invención se refiere a derivados de 5-aminoalquilaminopirazol, a procedimientos para su preparación, a composiciones de los mismos y a su uso para el control de plagas (incluyendo artrópodos y helmintos).

El control de insectos, arácnidos y helmintos con compuestos de 1-arilpirazol se ha descrito en, por ejemplo, los números de publicación de patente WO 87/03781, EP 0295117 y US 4695308. El documento WO 03/074493 desvela derivados de alquilamina-pirazol 5-sustituídos y su uso en composiciones pesticidas.

Sin embargo, desde que los pesticidas modernos deben cumplir una amplia gama de exigencias, por ejemplo, con respecto al nivel, duración y espectro de acción, espectro de uso, toxicidad, combinación con otras sustancias activas, combinación con auxiliares de formulación o síntesis, y desde que es posible la aparición de resistencias, el desarrollo de tales sustancias nunca puede considerarse como finalizado y constantemente hay una gran demanda de compuestos novedosos que sean ventajosos respecto a los compuestos conocidos, al menos en la medida en que concierne a algunos aspectos.

Es un objeto de la presente invención proporcionar nuevos pesticidas que puedan usarse en animales de compañía domésticos.

Es ventajoso administrar pesticidas a animales en forma oral de manera que se evite la posible contaminación de seres humanos o el entorno circundante.

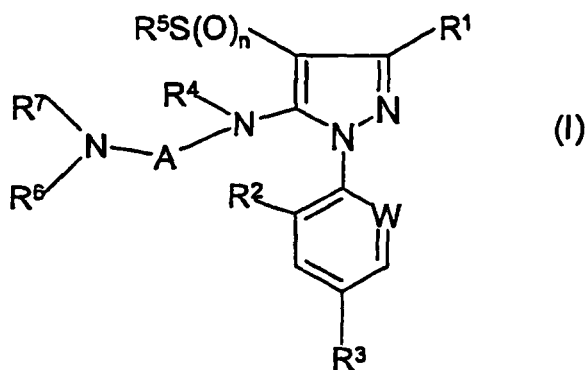
Otro objeto de la invención es proporcionar nuevos pesticidas que puedan usarse en dosis inferiores a los pesticidas existentes.

Otro objeto de la invención es proporcionar nuevos pesticidas que sean sustancialmente no eméticos.

Otro objeto de la invención es proporcionar nuevos pesticidas que sean más seguros para el usuario y el entorno.

Estos objetos se cumplen en su totalidad o en parte por la presente invención.

La presente invención proporciona un compuesto que es un derivado de 5-aminoalquilaminopirazol de fórmula (I):



en la que:

R¹ es CN, CH₃, CF₃, CSNH₂ o C(=N-ZFS(O)_r)-Q;

W es C-R⁸;

R² y R⁸ son cada uno independientemente halógeno, CH₃ o NR⁹R¹⁰;

R³ es haloalquilo (C₁-C₃), haloalcoxi (C₁-C₃) o SF₅;

R⁴ es hidrógeno, alqueno (C₂-C₆), haloalqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆), haloalquino (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₇), CO₂-alquilo (C₁-C₆), CO₂-alqueno (C₃-C₆), CO₂-alquino (C₂-C₆), CO₂-(CH₂)_mR¹¹, CO₂-(CH₂)_mR¹², CHO, CO-cicloalquilo (C₃-C₇), COR¹¹, COR¹², SO₂R¹³, alquilo (C₁-C₆) o CO-alquilo (C₁-C₆), cuyos dos últimos grupos mencionados están sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales R¹⁴;

ES 2 345 559 T3

R⁵ es alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), haloalqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆) o haloalquino (C₂-C₆);

A es alqueno (C₁-C₆) o alqueno (C₁-C₆) cuyos grupos están sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales R¹⁶; o es alqueno (C₂-C₆) en el que 2, 3 ó 4 átomos de carbono adyacentes forman un anillo de cicloalquilo (C₃-C₇), estando el alqueno (C₂-C₆) o los átomos de anillo de cicloalquilo (C₃-C₇) sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por alquilo (C₁-C₆) y halógeno;

R⁶ y R⁷ son cada uno independientemente H, R¹¹, R¹², alquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆) o alquino (C₂-C₆), cuyos tres últimos grupos mencionados están sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, cicloalquilo (C₃-C₇), R¹¹, R¹², alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), OR¹¹ y OR¹²; o son cada uno un radical acilo; o

R⁶ y R⁷ junto con el átomo de N unido forman un anillo saturado de cuatro a siete miembros o un anillo insaturado de cinco a siete miembros cuyo anillo contiene opcionalmente uno o más heteroátomos adicionales en el anillo que se seleccionan de O, S y N, estando el anillo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆) y oxo, y cuando está presente cualquier átomo de N adicional está sin sustituir o sustituido con un alquilo (C₁-C₆), CO-alquilo (C₁-C₆) o radical CH₂R¹¹; o

R⁶ y R⁷ junto con el átomo de N unido forman un radical ftalimido que está sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₆) y haloalquilo (C₁-C₆); o

si A es alqueno (C₁-C₆), R⁷ junto con el átomo de N unido y el resto A forman un anillo saturado de cuatro a siete miembros que está sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆) y oxo, y R⁶ es H, alquilo (C₁-C₆), CH₂R¹¹, CO-alquilo (C₁-C₆) o CO₂-alquilo (C₁-C₆);

R⁹ y R¹⁰ son cada uno independientemente H, alquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆) o alquino (C₂-C₆), cuyos tres últimos grupos mencionados están sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, cicloalquilo (C₃-C₇), R¹¹, R¹², alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), OR¹¹ y OR¹²;

R¹¹ es fenilo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), CN, NO₂, S(O)_pR¹⁷ y NR¹⁸R¹⁹;

R¹² es heterociclilo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), NO₂, CN, CO₂-alquilo (C₁-C₆), S(O)_pR¹⁷, OH y oxo;

R¹³ es cicloalquilo (C₃-C₇), alqueno (C₂-C₆), haloalqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆), haloalquino (C₂-C₆), R¹¹ o R¹²; o es alquilo (C₁-C₆) sin sustituir o sustituido con uno o más radicales R¹⁴;

R¹⁴ es halógeno, alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), alqueno (C₃-C₆), haloalqueno (C₃-C₆), alquino (C₃-C₆), haloalquino (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₇), S(O)_pR¹⁶, CN, NO₂, OH, R¹¹, R¹², COR¹⁶, NR⁹R¹⁸, OR¹⁶ o CO₂R¹⁶;

R¹⁵ es cicloalquilo (C₃-C₇), alqueno (C₂-C₆), haloalqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆), haloalquino (C₂-C₆), R¹¹ o R¹²; o es alquilo (C₁-C₆) sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, cicloalquilo (C₃-C₇), R¹¹ y R¹²;

R¹⁶ es alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), haloalqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆), haloalquino (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₇), cicloalquil (C₃-C₇)-alquilo (C₁-C₄), (CH₂)_qR¹¹ o (CH₂)_qR¹²;

R¹⁷ es alquilo (C₁-C₆) o haloalquilo (C₁-C₆);

R¹⁸ y R¹⁹ son cada uno independientemente H, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alqueno (C₃-C₆), haloalqueno (C₃-C₆), alquino (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₇) o cicloalquil (C₃-C₇)-alquilo (C₁-C₆); o

R¹⁸ y R¹⁹ junto con el átomo de N unido forman un anillo saturado de cinco o seis miembros que opcionalmente contiene un heteroátomo adicional en el anillo que se selecciona de O, S y N, estando el anillo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₆) y haloalquilo (C₁-C₆);

Z es H, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alqueno (C₃-C₆), alquino (C₃-C₆), (CH₂)_qR¹¹, COR¹⁷, CO₂-alquilo (C₁-C₆) o S(O)_pR¹⁷;

ES 2 345 559 T3

Q es alquilo (C_1-C_6) o CH_2R^{11} ;

n, p y r son cada uno independientemente cero, uno o dos;

m y q son cada uno independientemente cero o uno; y

cada heterociclilo en los radicales anteriormente mencionados es independientemente un radical heterocíclico que tiene 3 a 7 átomos de anillo y 1, 2 ó 3 heteroátomos en el anillo seleccionados del grupo que está constituido por N, O y S;

o una sal pesticidamente aceptable del mismo.

Estos compuestos poseen valiosas propiedades pesticidas.

La invención también engloba cualquier estereoisómero, enantiómero o isómero geométrico, y mezclas de los mismos.

Por el término “sales pesticidamente aceptables” se indica sales cuyos aniones o cationes son conocidos y aceptados en la técnica para la formación de sales para uso pesticida.

Sales con bases adecuadas, por ejemplo, formadas por compuestos de fórmula (I) que contienen un grupo ácido carboxílico incluyen sales de metal alcalino (por ejemplo, sodio y potasio), de metal alcalinotérreo (por ejemplo, calcio y magnesio), de amonio y amina (por ejemplo, dietanolamina, trietanolamina, octilamina, morfolina y dioctilmetilamina). Sales de adición de ácido adecuadas, por ejemplo, formadas por compuestos de fórmula (I) que contienen un grupo amino incluyen sales con ácidos inorgánicos, por ejemplo, clorhidratos, sulfatos, fosfatos y nitratos y sales con ácidos orgánicos, por ejemplo, ácido acético.

La expresión “uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por” en la definición debe entenderse que significa en cada caso uno o más radicales idénticos o diferentes seleccionados del grupo de radicales establecido, a menos que se definan expresamente limitaciones específicas.

En la presente memoria descriptiva, que incluye las reivindicaciones adjuntas, los sustituyentes anteriormente mencionados tienen los siguientes significados:

Átomo de halógeno significa flúor, cloro, bromo o yodo.

El término “halo” antes del nombre de un radical significa que este radical está parcial o completamente halogenado, es decir, sustituido con F, Cl, Br o I, en cualquier combinación, preferentemente con F o Cl.

Los grupos alquilo y porciones de los mismos (a menos que se defina de otro modo) pueden de cadena lineal o ramificada.

La expresión “alquilo (C_1-C_6)” debe entenderse que significa un radical de hidrocarburo sin ramificar o ramificado que tiene 1, 2, 3, 4, 5 ó 6 átomos de carbono tales como, por ejemplo, un radical metilo, etilo, propilo, isopropilo, 1-butilo, 2-butilo, 2-metilpropilo o *terc*-butilo.

Los radicales alquilo y también en grupos compuestos, a menos que se defina de otro modo, tienen preferentemente 1 a 4 átomos de carbono.

“Haloalquilo (C_1-C_6)” significa un grupo alquilo mencionado en la expresión “alquilo (C_1-C_6)” en el que uno o más átomos de hidrógeno están sustituidos con el mismo número de átomos de halógeno idénticos o diferentes tales como monohaloalquilo, perhaloalquilo, CF_3 , CHF_2 , CH_2F , $CHFCH_3$, CF_3CH_2 , CF_3CF_2 , CHF_2CF_2 , CH_2FCHCl , CH_2Cl , CCl_3 , $CHCl_2$ o CH_2CH_2Cl .

“Alcoxi (C_1-C_6)” significa un grupo alcoxi cuya cadena de carbono tiene el significado facilitado en la expresión “alquilo (C_1-C_6)”. “Haloalcoxi” es, por ejemplo, OCF_3 , $OCHF_2$, OCH_2F , CF_3CF_2O , OCH_2CF_3 o OCH_2CH_2Cl .

“Alquenilo (C_2-C_6)” significa una cadena de carbono no cíclica sin ramificar o ramificada que tiene varios átomos de carbono que se corresponden con este intervalo establecido y que contiene al menos un doble enlace que puede localizarse en cualquier posición del radical insaturado respectivo. Por consiguiente, “alquenilo (C_2-C_6)” denota, por ejemplo, el grupo vinilo, alilo, 2-metil-2-propenilo, 2-butenilo, pentenilo, 2-metilpentenilo o hexenilo.

“Alquinilo (C_2-C_6)” significa una cadena de carbono no cíclica sin ramificar o ramificada que tiene varios átomos de carbono que se corresponden con este intervalo establecido y que contiene un triple enlace que

ES 2 345 559 T3

puede localizarse en cualquier posición del radical insaturado respectivo. Por consiguiente, “alquinilo (C₂-C₆)” denota, por ejemplo, el grupo propargilo, 1-metil-2-propinilo, 2-butinilo o 3-butinilo.

Los grupos cicloalquilo tienen preferentemente de tres a siete átomos de carbono en el anillo y están opcionalmente sustituidos con halógeno o alquilo.

La expresión “cicloalquil (C₃-C₇)-alquilo (C₁-C₆)” significa un grupo alquilo (C₁-C₆) que está sustituido con un anillo de cicloalquilo (C₃-C₇).

En compuestos de fórmula (I) se proporcionan los siguientes ejemplos de radicales:

Un ejemplo de alquilo sustituido con cicloalquilo es ciclopropilmetilo;

un ejemplo de alquilo sustituido con alcoxi es metoximetilo (CH₂OCH₃); y

un ejemplo de alquilo sustituido con alquiltio es metiltiometilo (CH₂SCH₃).

La expresión “alquilenio (C₁-C₆)” debe entenderse que significa un grupo alcanodiño de cadena sin ramificar que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, según la IUPAC Nomenclature of Organic Chemistry 1979, por ejemplo, -CH₂-, -CH₂CH₂- o -CH₂CH₂CH₂-.

La expresión “alquenileno (C₂-C₆)” debe entenderse que significa un grupo alquenodiño de cadena sin ramificar que tiene de 2 a 6 átomos de carbono, según la IUPAC Nomenclature of Organic Chemistry 1979, por ejemplo, -CH=CH-, -CH=CHCH₂- o -CH₂CH=CH-.

Un grupo “heterociclilo” puede ser saturado, insaturado o heteroaromático; preferentemente contiene uno o más, en particular 1, 2 ó 3 heteroátomos en el anillo heterocíclico seleccionados preferentemente del grupo que está constituido por N, O y S; es preferentemente un radical heterociclilo alifático que tiene 3 a 7 átomos de anillo o un radical heteroaromático que tiene 5 a 7 átomos de anillo. El radical heterocíclico puede ser, por ejemplo, un radical heteroaromático o anillo (heteroarilo) tal como, por ejemplo, un sistema aromático mono, bi o policíclico en el que al menos 1 anillo contiene uno o más heteroátomos, por ejemplo, piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, triazinilo, tienilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, furilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo y triazolilo, o es un radical parcial o completamente hidrogenado tal como oxiranilo, oxetanilo, oxolanilo (= tetrahidrofurilo), oxanilo, pirrolidilo, piperidilo, piperazinilo, dioxolanilo, oxazolinilo, isoxazolinilo, oxazolidinilo, isoxazolidinilo y morfolinilo. El grupo “heterociclilo” puede estar sin sustituir o sustituido, preferentemente con uno o más radicales (preferentemente 1, 2 ó 3 radicales) seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, alcoxi, haloalcoxi, alquiltio, hidroxilo, amino, nitro, carboxilo, ciano, alcocarbonilo, alquilcarbonilo, formilo, carbamoilo, mono y dialquilaminocarbonilo, amino sustituido tal como acilamino, mono y dialquilsulfino, mono y dialquilsulfonilo, haloalquilsulfino, haloalquilsulfonilo, alquilo y haloalquilo, y adicionalmente también oxo. El grupo oxo también puede estar presente en aquellos heteroátomos de anillo en los que son posibles diversos números de oxidación, por ejemplo, en el caso de N y S.

Un radical acilo es, en un amplio sentido, el radical de un ácido orgánico que se forma formalmente eliminando un grupo OH, por ejemplo, el radical de un ácido carboxílico y radicales de ácidos derivados del mismo tales como ácido tiocarboxílico, ácidos iminocarboxílicos sin sustituir o N-sustituidos o el radical de monoésteres carbónicos, ácido carbámico sin sustituir o N-sustituido, ácido tiocarbámico sin sustituir o N-sustituido, ácidos sulfónicos, ácidos sulfínicos, ácidos fosfónicos y ácidos fosfínicos. Acilo es, por ejemplo, formilo, alquilcarbonilo tal como [alquil (C₁-C₄)]carbonilo, fenilcarbonilo, alquiloalquilcarbonilo, feniloalquilcarbonilo, bencilalquilcarbonilo, alquilsulfonilo, alquilsulfonilo, fenilsulfonilo, N-alquil-1-iminoalquilo y otros radicales de ácidos orgánicos. En este contexto, los radicales pueden estar incluso adicionalmente sustituidos en cada uno de los restos alquilo o fenilo, por ejemplo, en el resto alquilo por uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, alcoxi, fenilo y fenoxi; ejemplos de sustituyentes en el resto fenilo son radicales mono o polisustituidos, preferentemente hasta trisustituidos, idénticos o diferentes seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄) y nitro, por ejemplo o-, m- y p-tolilo, dimetilfenilo, 2-, 3- y 4-clorofenilo, 2-, 3- y 4-trifluoro y triclorofenilo, 2,4-, 3,5-, 2,5- y 2,3-diclorofenilo, o-, m- y p-metoxifenilo.

El radical acilo tiene generalmente 1 a 24 átomos de carbono, preferentemente 1 a 18, más preferentemente 1 a 12, lo más preferentemente 1 a 7, en particular 1 a 4.

Acilo en el sentido más estricto es, por ejemplo, el radical de un ácido alcanico, ácido alquenoico, ácido alquinoico, ácido arilcarboxílico (por ejemplo, benzilo), alcocarbonilo, alqueniloalquilcarbonilo, alquiloalquilcarbonilo, alquilsulfonilo, alquilsulfonilo o fenilsulfonilo; en un sentido incluso más estricto, acilo es un radical de un ácido alcanico, por ejemplo un ácido alcanico (C₁-C₂₄), preferentemente un ácido alcanico (C₁-C₁₈), en particular un ácido alcanico (C₁-C₁₂), muy especialmente un ácido alcanico (C₁-C₆) tal como formilo, acetilo o propionilo.

ES 2 345 559 T3

Preferentemente, acilo es formilo, CO-alquilo (C₁-C₆), CO₂-alquilo (C₁-C₆) o SO₂-alquilo (C₁-C₆), cuyos tres últimos grupos mencionados están sin sustituir o sustituidos con uno o más halógenos, cicloalquilo (C₃-C₇), radicales R¹¹ o R¹².

5 El término plagas significa plagas de artrópodos (incluyendo insectos y arácnidos) y helmintos (incluyendo nematodos).

En las siguientes definiciones preferidas generalmente va a entenderse que, cuando los símbolos no se definen específicamente, van a ser como se han definido previamente en la descripción.

10

Preferentemente R¹ es CN o CSNH₂ (más preferentemente R¹ es CN).

Preferentemente W es C-halógeno (más preferentemente W es C-Cl).

15

Preferentemente R² es Cl.

Preferentemente R³ es CF₃ o OCF₃ (más preferentemente R³ es CF₃).

20

Preferentemente R⁴ es hidrógeno, alqueno (C₂-C₆), haloalqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆), haloalquino (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₇), CO₂-alquilo (C₁-C₆), CO₂-alqueno (C₃-C₆), CO₂-alquino (C₂-C₆), CO₂-(CH₂)_mR¹¹, CHO, CO-cicloalquilo (C₃-C₇), COR¹¹, COR¹², SO₂R¹³, alquilo (C₁-C₆) o CO-alquilo (C₁-C₆), cuyos dos últimos grupos mencionados están sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales R¹⁴.

25

Preferentemente R⁵ es CF₃.

Preferentemente A es alqueno (C₁-C₆) sin sustituir o sustituido con uno o más radicales R¹⁶, o alqueno (C₂-C₆) sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por alquilo (C₁-C₃), haloalquilo (C₁-C₃), alqueno (C₂-C₃), alquino (C₂-C₃), cicloalquilo (C₃-C₇), cicloalquil (C₃-C₇)-alquilo (C₁-C₃) y (CH₂)_qR¹¹ (más preferentemente A es alqueno (C₁-C₆)).

30

Preferentemente R⁶ y R⁷ son cada uno independientemente H, R¹¹, R¹², alquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆) o alquino (C₂-C₆), cuyos tres últimos grupos mencionados están sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, cicloalquilo (C₃-C₇), R¹¹, R¹², alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), OR¹¹ y OR¹²; o son SO₂R¹⁵, CO₂-alqueno (C₃-C₆), CO₂-alquino (C₂-C₆), CHO, CO-cicloalquilo (C₃-C₇), COR¹¹, COR¹², CO-alquilo (C₁-C₆) o CO₂-alquilo (C₁-C₆), cuyos dos últimos grupos mencionados están sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, cicloalquilo (C₃-C₇), R¹¹ y R¹²;

35

o

R⁶ y R⁷ junto con el átomo de N unido forman un anillo saturado de cuatro a siete miembros o un anillo insaturado de cinco a siete miembros cuyo anillo contiene opcionalmente uno o más heteroátomos adicionales en el anillo que se seleccionan de O, S y N, estando el anillo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆) y oxo, y cuando está presente cualquier átomo de N adicional está sin sustituir o sustituido con un alquilo (C₁-C₆), CO-alquilo (C₁-C₆) o radical CH₂R¹¹; o

40

R⁶ y R⁷ junto con el átomo de N unido forman un radical ftalimido que está sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₆) y haloalquilo (C₁-C₆); o

45

si A es alqueno (C₁-C₆), R⁷ junto con el átomo de N unido y el resto A forman un anillo saturado de cuatro a siete miembros que está sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆) y oxo, y R⁶ es H, alquilo (C₁-C₆), CH₂R¹¹, CO-alquilo (C₁-C₆) o CO₂-alquilo (C₁-C₆).

50

Más preferentemente R⁶ y R⁷ son cada uno independientemente H, R¹¹, R¹², alquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆) o alquino (C₂-C₆), cuyos tres últimos grupos mencionados están sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, cicloalquilo (C₃-C₇), R¹¹, R¹², alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), OR¹¹ y OR¹²; o son SO₂R¹⁵, CO₂-alqueno (C₃-C₆), CO₂-alquino (C₂-C₆), CHO, CO-cicloalquilo (C₃-C₇), COR¹¹, COR¹², CO-alquilo (C₁-C₆) o CO₂-alquilo (C₁-C₆), cuyos dos últimos grupos mencionados están sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, cicloalquilo (C₃-C₇), R¹¹ y R¹²; o

55

R⁶ y R⁷ junto con el átomo de N unido forman un anillo saturado de cuatro a siete miembros o un anillo insaturado de cinco a siete miembros cuyo anillo contiene opcionalmente uno o más heteroátomos adicionales en el anillo que se seleccionan de O, S y N, estando el anillo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆) y oxo, y cuando está presente cualquier átomo de N adicional está sin sustituir o sustituido con un alquilo (C₁-C₆), CO-alquilo (C₁-C₆) o radical CH₂R¹¹; o

60

65

ES 2 345 559 T3

R^6 y R^7 junto con el átomo de N unido forman un radical ftalimido que está sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, alquilo (C_1-C_6) y haloalquilo (C_1-C_6); o

si A es alquileo (C_1-C_6), R^7 junto con el átomo de N unido y el resto A forman un anillo saturado de cuatro a siete miembros que está sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6) y oxo, y R^6 es H, alquilo (C_1-C_6), CH_2R^{11} , CO-alquilo (C_1-C_6) o CO_2 -alquilo (C_1-C_6).

Una clase preferida de compuestos de fórmula (I) son aquellos en los que:

R^1 es CN;

W es C-halógeno;

R^2 es halógeno;

R^3 es CF_3 , OCF_3 o SF_5 ;

R^4 es hidrógeno, alqueno (C_2-C_6), haloalqueno (C_2-C_6), alquino (C_2-C_6), haloalquino (C_2-C_6), cicloalquilo (C_3-C_7), CO_2 -alquilo (C_1-C_6), CO_2 -alqueno (C_3-C_6), CO_2 -alquino (C_2-C_6), $CO_2-(CH_2)_mR^{11}$, CHO, CO-cicloalquilo (C_3-C_7), COR^{11} , SO_2R^{13} , alquilo (C_1-C_6) o CO-alquilo (C_1-C_6), cuyos dos últimos grupos mencionados están sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales R^{14} ;

R^5 es CF_3 ;

A es alquileo (C_1-C_6) sin sustituir o sustituido con uno o más radicales R^{16} , o alqueno (C_2-C_6) sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por alquilo (C_1-C_3), haloalquilo (C_1-C_3), alqueno (C_2-C_3), alquino (C_2-C_3), cicloalquilo (C_3-C_7), cicloalquil (C_3-C_7)-alquilo (C_1-C_3) y $(CH_2)_qR^{11}$;

R^6 y R^7 son cada uno independientemente H, R^{11} , alquilo (C_1-C_6), alqueno (C_2-C_6) o alquino (C_2-C_6), cuyos tres últimos grupos mencionados están sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, cicloalquilo (C_3-C_7), R^{11} , R^{12} , alcoxi (C_1-C_6), haloalcoxi (C_1-C_6), OR^{11} y OR^{12} ; o son SO_2R^{15} , CO_2 -alqueno (C_3-C_6), CO_2 -alquino (C_2-C_6), CHO, CO-cicloalquilo (C_3-C_7), COR^{11} , COR^{12} , CO-alquilo (C_1-C_6) o CO_2 -alquilo (C_1-C_6), cuyos dos últimos grupos mencionados están sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, cicloalquilo (C_3-C_7), R^{11} y R^{12} ; o

R^6 y R^7 junto con el átomo de N unido forman un anillo saturado de cuatro a siete miembros o un anillo insaturado de cinco a siete miembros cuyo anillo contiene opcionalmente uno o más heteroátomos adicionales en el anillo que se seleccionan de O, S y N, estando el anillo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, alquilo (C_1-C_3), haloalquilo (C_1-C_3) y oxo, y cuando está presente cualquier átomo de N adicional está sin sustituir o sustituido con un alquilo (C_1-C_6), CO-alquilo (C_1-C_6) o radical CH_2R^{11} ; o

R^6 y R^7 junto con el átomo de N unido forman un radical ftalimido que está sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, alquilo (C_1-C_6) y haloalquilo (C_1-C_6); o

si A es alquileo (C_1-C_6), R^7 junto con el átomo de N unido y el resto A forman un anillo saturado de cuatro a siete miembros que está sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6) y oxo, y R^6 es H, alquilo (C_1-C_6), CH_2R^{11} , CO-alquilo (C_1-C_6) o CO_2 -alquilo (C_1-C_6);

R^9 es H, alqueno (C_2-C_3), alquino (C_2-C_3) o alquilo (C_1-C_3), cuyo último grupo mencionado está sin sustituir o sustituido con un radical R^{11} ;

R^{11} es fenilo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, alquilo (C_1-C_3), haloalquilo (C_1-C_3), alcoxi (C_1-C_3), haloalcoxi (C_1-C_3), CN, NO_2 , $S(O)_pR^{17}$ y $NR^{18}R^{19}$;

R^{12} es heterociclilo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, alquilo (C_1-C_3), haloalquilo (C_1-C_3), alcoxi (C_1-C_3), haloalcoxi (C_1-C_3), NO_2 , CN, CO_2 -alquilo (C_1-C_3), $S(O)_pR^{17}$, OH y oxo;

R^{13} es cicloalquilo (C_3-C_7), alqueno (C_2-C_3), haloalqueno (C_2-C_3), alquino (C_2-C_3), haloalquino (C_2-C_3), R^{11} o R^{12} ; o es alquilo (C_1-C_3) sin sustituir o sustituido con uno o más radicales R^{14} ;

ES 2 345 559 T3

R^{14} es halógeno, alcoxi (C_1-C_3), haloalcoxi (C_1-C_3), alqueniloxi (C_3-C_4), haloalqueniloxi (C_3-C_4), alquiniloxi (C_3-C_4), haloalquiniloxi (C_3-C_4), cicloalquilo (C_3-C_7), $S(O)_p R^{16}$, CN, NO_2 , OH, R^{11} , R^{12} , COR^{16} , $NR^9 R^{18}$, OR^{16} o $CO_2 R^{16}$;

R^{15} es cicloalquilo (C_3-C_7), alquenilo (C_2-C_3), haloalquenilo (C_2-C_3), alquinilo (C_2-C_3), haloalquinilo (C_2-C_3), R^{11} o R^{12} ; o es alquilo (C_1-C_3) sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, cicloalquilo (C_3-C_7), R^{11} y R^{12} ;

R^{16} es alquilo (C_1-C_3), haloalquilo (C_1-C_3), alquenilo (C_2-C_4), haloalquenilo (C_2-C_4), alquinilo (C_2-C_4), haloalquinilo (C_2-C_4), cicloalquilo (C_3-C_7), cicloalquil (C_3-C_7)-alquilo (C_1-C_3), $(CH_2)_q R^{11}$ o $(CH_2)_q R^{12}$;

R^{17} es alquilo (C_1-C_3) o haloalquilo (C_1-C_3);

R^{18} y R^{19} son cada uno independientemente H, alquilo (C_1-C_3), haloalquilo (C_1-C_3), alquenilo (C_3-C_4), haloalquenilo (C_3-C_4), alquinilo (C_3-C_4), cicloalquilo (C_3-C_7) o cicloalquil (C_3-C_7)-alquilo (C_1-C_3); o

R^{18} y R^{19} junto con el átomo de N unido forman un anillo saturado de cinco o seis miembros que opcionalmente contiene un heteroátomo adicional en el anillo que se selecciona de O, S y N, estando el anillo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, alquilo (C_1-C_3) y haloalquilo (C_1-C_3);

n y p son cada uno independientemente cero, uno o dos;

m y q son cada uno independientemente cero o uno; y

cada heterocíclico en los radicales anteriormente mencionados es independientemente un radical heterocíclico que tiene 3 a 7 átomos de anillo y 1, 2 ó 3 heteroátomos en el anillo seleccionados del grupo que está constituido por N, O y S.

Una clase más preferida de compuestos de fórmula (I) son aquellos en los que:

R^1 es CN;

W es C-Cl;

R^2 es Cl;

R^3 es CF_3 ;

R^4 es hidrógeno, alquenilo (C_2-C_6), haloalquenilo (C_2-C_6), alquinilo (C_2-C_6), haloalquinilo (C_2-C_6), cicloalquilo (C_3-C_7), CO_2 -alquilo (C_1-C_6), CO_2 -alquenilo (C_3-C_6), CO_2 -alquinilo (C_2-C_6), CO_2 -(CH_2)_m R^{11} , CHO, COR^{11} , $SO_2 R^{13}$, alquilo (C_1-C_6) o CO-alquilo (C_1-C_6), cuyos dos últimos grupos están sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales R^{14} ;

R^5 es CF_3 ;

A es alquilenilo (C_1-C_6);

R^6 y R^7 son cada uno independientemente H, R^{11} , alquilo (C_1-C_6), alquenilo (C_2-C_6) o alquinilo (C_2-C_6), cuyos tres últimos grupos mencionados están sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, cicloalquilo (C_3-C_6), R^{11} , R^{12} , alcoxi (C_1-C_6), haloalcoxi (C_1-C_6), OR^{11} y OR^{12} ; o son $SO_2 R^{15}$, CO_2 -alquenilo (C_3-C_6), CO_2 -alquinilo (C_2-C_6), CHO, CO-cicloalquilo (C_3-C_6), COR^{11} , CO-alquilo (C_1-C_6) o CO_2 -alquilo (C_1-C_6), cuyos dos últimos grupos mencionados están sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, cicloalquilo (C_3-C_6), R^{11} y R^{12} ; o

R^6 y R^7 junto con el átomo de N unido forman un anillo saturado de cuatro a siete miembros o un anillo insaturado de cinco a siete miembros cuyo anillo contiene opcionalmente uno o más heteroátomos adicionales en el anillo que se seleccionan de O, S y N, estando el anillo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6) y oxo, y cuando está presente cualquier átomo de N adicional está sin sustituir o sustituido con un alquilo (C_1-C_6), CO-alquilo (C_1-C_6) o radical bencilo; o

R^6 y R^7 junto con el átomo de N unido forman un radical ftalimido que está sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, alquilo (C_1-C_3) y haloalquilo (C_1-C_3); o

ES 2 345 559 T3

si A es alquileo (C_1-C_6), R^7 junto con el átomo de N unido y el resto A forman un anillo saturado de cuatro a siete miembros que está sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6) y oxo, y R^6 es H, alquilo (C_1-C_6), CH_2R^{11} , CO-alquilo (C_1-C_6) o CO_2 -alquilo (C_1-C_6);

R^9 es H, alqueno (C_2-C_3), alquino (C_2-C_3) o alquilo (C_1-C_3), cuyo último grupo mencionado está sin sustituir o sustituido con un radical R^{11} ;

R^{11} es fenilo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, alquilo (C_1-C_3), haloalquilo (C_1-C_3), alcoxi (C_1-C_3), haloalcoxi (C_1-C_3), CN, NO_2 , $S(O)_pR^{17}$ y $NR^{18}R^{19}$;

R^{12} es heterociclilo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, alquilo (C_1-C_3), haloalquilo (C_1-C_3), alcoxi (C_1-C_3), haloalcoxi (C_1-C_3), NO_2 , CN, CO_2 -alquilo (C_1-C_3), $S(O)_pR^{17}$, OH y oxo;

R^{13} es cicloalquilo (C_3-C_6), alqueno (C_2-C_3), haloalqueno (C_2-C_3), alquino (C_2-C_3), haloalquino (C_2-C_3), R^{11} o R^{12} ; o es alquilo (C_1-C_3) sin sustituir o sustituido con uno o más radicales R^{14} ;

R^{14} es halógeno, alcoxi (C_1-C_3), haloalcoxi (C_1-C_3), alquenoilo (C_3-C_4), haloalquenoilo (C_3-C_4), alquinoilo (C_3-C_4), haloalquinoilo (C_3-C_4), cicloalquilo (C_3-C_6), $S(O)_pR^{16}$, CN, NO_2 , OH, R^{11} , R^{12} , COR^{16} , NR^9R^{18} , OR^{16} o CO_2R^{16} ;

R^{15} es cicloalquilo (C_3-C_6), alqueno (C_2-C_3), haloalqueno (C_2-C_3), alquino (C_2-C_3), haloalquino (C_2-C_3), R^{11} o R^{12} ; o es alquilo (C_1-C_3) sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, cicloalquilo (C_3-C_6), R^{11} y R^{12} ;

R^{16} es alquilo (C_1-C_3), haloalquilo (C_1-C_3), alqueno (C_2-C_3), haloalqueno (C_2-C_3), alquino (C_2-C_3), haloalquino (C_2-C_3), cicloalquilo (C_3-C_6), cicloalquil (C_3-C_6)-alquilo (C_1-C_3), $(CH_2)_qR^{11}$ o $(CH_2)_qR^{12}$;

R^{17} es alquilo (C_1-C_3) o haloalquilo (C_1-C_3);

R^{18} y R^{19} son cada uno independientemente H, alquilo (C_1-C_3), haloalquilo (C_1-C_3), alqueno (C_3-C_4), haloalqueno (C_3-C_4), alquino (C_3-C_4), cicloalquilo (C_3-C_6) o cicloalquil (C_3-C_6)-alquilo (C_1-C_3); o

R^{18} y R^{19} junto con el átomo de N unido forman un anillo saturado de cinco o seis miembros que opcionalmente contiene un heteroátomo adicional en el anillo que se selecciona de O, S y N, estando el anillo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, alquilo (C_1-C_3) y haloalquilo (C_1-C_3);

n y p son cada uno independientemente cero, uno o dos;

m y q son cada uno independientemente cero o uno; y

cada heterociclilo en los radicales anteriormente mencionados es independientemente un radical heterocíclico que tiene 3 a 7 átomos de anillo y 1, 2 ó 3 heteroátomos en el anillo seleccionados del grupo que está constituido por N, O y S.

Otra clase más preferida de compuestos de fórmula (I) son aquellos en los que:

R^1 es CN;

W es C-Cl;

R^2 es Cl;

R^3 es CF_3 ;

R^4 es hidrógeno, alqueno (C_2-C_6), alquino (C_2-C_6), CO_2 -alquilo (C_1-C_6), $CO_2-(CH_2)_mR^{11}$, SO_2R^{13} , CO-alquilo (C_1-C_6), CO-haloalquilo (C_1-C_6) o alquilo (C_1-C_6), cuyo último grupo mencionado está sin sustituir o sustituido con uno o más radicales R^{14} ;

R^5 es CF_3 ;

A es alquileo (C_1-C_5);

ES 2 345 559 T3

R^6 y R^7 son cada uno independientemente H, R^{11} , alqueno (C_2-C_6), alquino (C_2-C_6) o alquilo (C_1-C_6), cuyo último grupo mencionado está sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, cicloalquilo (C_3-C_6), R^{11} , R^{12} , alcoxi (C_1-C_6) y OR^{11} ; o son SO_2R^{15} , CO-cicloalquilo (C_3-C_6), COR^{11} , CO_2 -alquilo (C_1-C_6) o CO-alquilo (C_1-C_6), cuyo último grupo mencionado está sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, cicloalquilo (C_3-C_6), R^{11} y R^{12} ; o

R^6 y R^7 junto con el átomo de N unido forman un anillo saturado de cinco a siete miembros o un anillo insaturado de cinco a siete miembros cuyo anillo contiene opcionalmente uno o más heteroátomos adicionales en el anillo que se seleccionan de O, S y N, estando el anillo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por alquilo (C_1-C_6) y oxo, y cuando está presente cualquier átomo de N adicional está sin sustituir o sustituido con un alquilo (C_1-C_6), CO-alquilo (C_1-C_6) o radical bencilo; o

R^6 y R^7 junto con el átomo de N unido forman un radical ftalimido que está sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, alquilo (C_1-C_3) y haloalquilo (C_1-C_3); o

si A es alqueno (C_1-C_5), R^7 junto con el átomo de N unido y el resto A forman un anillo saturado de cinco a siete miembros que está sin sustituir o sustituido con uno o más radicales alquilo (C_1-C_6), y R^6 es H, alquilo (C_1-C_6), CH_2R^{11} , CO-alquilo (C_1-C_6) o CO_2 -alquilo (C_1-C_6);

R^9 es H, alqueno (C_2-C_3), alquino (C_2-C_3) o alquilo (C_1-C_3), cuyo último grupo mencionado está sin sustituir o sustituido con un radical R^{11} ;

R^{11} es fenilo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, alquilo (C_1-C_3), haloalquilo (C_1-C_3), alcoxi (C_1-C_3), haloalcoxi (C_1-C_3), CN, NO_2 , $S(O)_pR^{17}$ y $NR^{18}R^{19}$;

R^{12} es heterociclilo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, alquilo (C_1-C_3), haloalquilo (C_1-C_3), alcoxi (C_1-C_3), haloalcoxi (C_1-C_3), NO_2 , CN, CO_2 -alquilo (C_1-C_3), $S(O)_pR^{17}$, OH y oxo;

R^{13} es R^{11} o R^{12} ; o es alquilo (C_1-C_3) sin sustituir o sustituido con uno o más radicales R^{14} ;

R^{14} es halógeno, alcoxi (C_1-C_3), haloalcoxi (C_1-C_3), cicloalquilo (C_3-C_6), $S(O)_pR^{16}$, CN, NO_2 , OH, R^{11} , R^{12} , COR^{16} , $NR^{18}R^{19}$, OR^{16} o CO_2R^{16} ;

R^{15} es cicloalquilo (C_3-C_6), alqueno (C_2-C_3), alquino (C_2-C_3) o R^{11} ; o es alquilo (C_1-C_3) sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, cicloalquilo (C_3-C_6) y R^{11} ;

R^{16} y R^{17} son cada uno independientemente alquilo (C_1-C_3) o haloalquilo (C_1-C_3);

R^{18} y R^{19} son cada uno independientemente H o alquilo (C_1-C_3);

n y p son cada uno independientemente cero, uno o dos;

m es cero o uno; y

cada heterociclilo en los radicales anteriormente mencionados es independientemente un radical heterocíclico que tiene 3 a 7 átomos de anillo y 1, 2 ó 3 heteroátomos en el anillo seleccionados del grupo que está constituido por N, O y S.

Una clase más preferida de compuestos de fórmula (I) son aquellos en los que:

R^1 es CN;

W es C-Cl;

R^2 es Cl;

R^3 es CF_3 ;

R^4 es hidrógeno, CO_2 -alquilo (C_1-C_6), CO-alquilo (C_1-C_6) o alquilo (C_1-C_6), cuyo último grupo mencionado está sin sustituir o sustituido con un radical $S(O)_p$ -alquilo (C_1-C_6);

R^5 es CF_3 ;

A es alquileo (C_1-C_4);

R^6 es H, R^{11} , alqueno (C_2-C_6), CO-alquilo (C_1-C_6) o alquilo (C_1-C_6), cuyo último grupo mencionado está sin sustituir o sustituido con un radical R^{11} ;

R^7 es hidrógeno o alquilo (C_1-C_6); o

R^6 y R^7 junto con el átomo de N unido forman un anillo saturado de cinco o seis miembros cuyo anillo contiene opcionalmente un heteroátomo adicional en el anillo que se selecciona de O, S y N, estando el anillo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por alquilo (C_1-C_6) y oxo, y cuando está presente cualquier átomo de nitrógeno adicional está sin sustituir o sustituido con un alquilo (C_1-C_6), CO-alquilo (C_1-C_6) o radical bencilo; o

R^6 y R^7 junto con el átomo de N unido forman un radical ftalimido; o si A es alquileo (C_1-C_4), R^7 junto con el átomo de N unido y el resto A forman un anillo saturado de cinco o seis miembros, que está sin sustituir o sustituido con uno o más radicales alquilo (C_1-C_6), y R^6 es H, alquilo (C_1-C_6), bencilo, CO-alquilo (C_1-C_6) o CO_2 -alquilo (C_1-C_6);

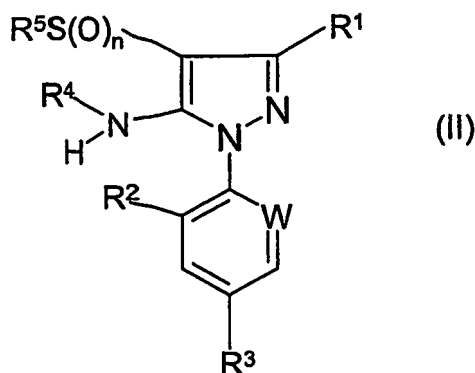
R^{11} es fenilo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, alquilo (C_1-C_3), haloalquilo (C_1-C_3), alcoxi (C_1-C_3) (lo más preferentemente R^{11} es fenilo); y

n y p son cada uno independientemente cero, uno o dos.

Los compuestos de fórmula general (I) pueden prepararse mediante la aplicación o adaptación de procedimientos conocidos (es decir, procedimientos usados hasta este momento o descritos en la bibliografía química).

En la siguiente descripción de procedimientos, cuando los símbolos que aparecen en las fórmulas no se definen específicamente, se entiende que son "como se definen anteriormente" según la primera definición de cada símbolo en la memoria descriptiva.

Según una característica adicional de la invención, compuestos de fórmula (I) en la que R^1 es CN, CH_3 o CF_3 , y R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , W, A y n son como se definen anteriormente pueden prepararse mediante la reacción de un compuesto de fórmula (II):

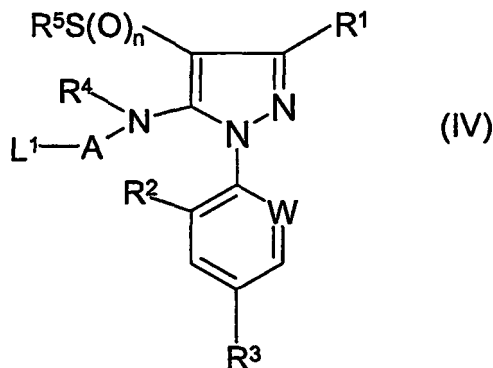


en la que R^1 es CN, CH_3 o CF_3 y los otros valores son como se definen anteriormente, con un agente alquilante de fórmula (III):



en la que R^6 , R^7 y A son como se definen anteriormente y L es un grupo saliente generalmente halógeno y preferentemente cloro, bromo o yodo, y una base. La reacción se lleva a cabo generalmente usando un disolvente tal como tetrahidrofurano, dioxano o acetonitrilo a una temperatura de 20°C a 120°C. La base es preferentemente un hidruro de metal alcalino tal como hidruro de sodio, o un carbonato de metal alcalino tal como carbonato de potasio o carbonato de sodio, o un fosfato de metal alcalino tal como fosfato de potasio, o una base orgánica tal como una amina terciaria, por ejemplo, trietilamina o etildisopropilamina (se prefieren particularmente fosfatos de metal alcalino tales como fosfato de potasio).

Según una característica adicional de la invención, compuestos de fórmula (I) en la que R^1 es CN, CH_3 o CF_3 , y R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , W, A y n son como se definen anteriormente pueden prepararse mediante la reacción de un compuesto de fórmula (IV):

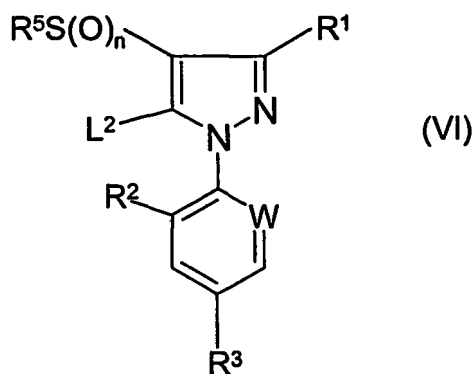


en la que L^1 es un grupo saliente generalmente halógeno y preferentemente cloro, bromo o yodo, y los otros valores son como se definen anteriormente, con un compuesto de fórmula (V):



en la que R^6 y R^7 son como se definen anteriormente. La reacción se realiza preferentemente en presencia de una base tal como un hidruro de metal alcalino, por ejemplo, hidruro de sodio, o un carbonato de metal alcalino tal como carbonato de potasio o carbonato de sodio, o una base orgánica tal como una amina terciaria, por ejemplo, trietilamina o etildiisopropilamina, y opcionalmente en presencia de un catalizador, preferentemente un yoduro de metal alcalino tal como yoduro de sodio. Preferentemente se emplean disolventes tales como tetrahidrofurano, dioxano o acetonitrilo, a una temperatura de reacción de $20^\circ C$ a $150^\circ C$.

Según una característica adicional de la invención, compuestos de fórmula (I) en la que R^1 es CN, CH_3 o CF_3 , y R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , W, A y n son como se definen anteriormente pueden prepararse mediante la reacción de un compuesto de fórmula (VI):



en la que L^2 es un grupo saliente generalmente halógeno y preferentemente bromo, y los otros valores son como se definen anteriormente, con un compuesto de fórmula (VII):



en la que R^4 , R^6 , R^7 y A son como se definen anteriormente. La reacción se realiza preferentemente en presencia de una base tal como un hidruro de metal alcalino tal como hidruro de sodio, o un carbonato de metal alcalino tal como carbonato de potasio o carbonato de sodio, o una base orgánica tal como una amina terciaria, por ejemplo, trietilamina o etildiisopropilamina, en un disolvente tal como tetrahidrofurano, dioxano o acetonitrilo, a una temperatura de $20^\circ C$ a $150^\circ C$.

ES 2 345 559 T3

Según una característica adicional de la invención, compuestos de fórmula (I) en la que R^1 es CN, CH^3 o CF^3 , n es 1 ó 2, y R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , W y A son como se definen anteriormente pueden prepararse oxidando un compuesto correspondiente en el que n es 0 ó 1. La oxidación se realiza generalmente usando un perácido tal como ácido 3-cloroperbenzoico en un disolvente tal como diclorometano o 1,2-dicloroetano, a una temperatura de 0°C a la temperatura de reflujo del disolvente.

Según una característica adicional de la invención, compuestos de fórmula (I) en la que R^1 es $CSNH_2$, y R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , W, A y n son como se definen anteriormente pueden prepararse mediante la reacción del compuesto correspondiente de fórmula (I) en la que R^1 es CN, con un hidrosulfuro de metal alcalino o alcalinotérreo tal como hidrosulfuro de litio, potasio, calcio o preferentemente de sodio, en un disolvente inerte, por ejemplo, N,N-dimetilformamida, piridina, dioxano, tetrahidrofurano, sulfolano, dimetilsulfóxido, metanol o etanol a una temperatura de -35°C a 50°C, preferentemente 0°C a 30°C. Opcionalmente, el hidrosulfuro puede generarse *in situ* mediante tratamiento con H_2S en presencia de una base orgánica tal como un alcóxido o trialkilamina metálico o una base inorgánica tal como un hidróxido o carbonato de metal alcalino o alcalinotérreo tal como carbonato de sodio, potasio o amonio. El uso de un agente complejante de metales tal como un éter corona puede ser beneficioso en la aceleración de la reacción. La reacción de la sal de hidrosulfuro con el compuesto de fórmula (I) en la que R^1 es CN también puede realizarse en un sistema bifásico de agua/disolvente orgánico usando un catalizador de transferencia de fases tal como un éter corona o una sal de tetraalkilamonio tal como bromuro de tetra-n-butilamonio o cloruro de benciltrimetilamonio. Disolventes orgánicos adecuados para uso en un sistema bifásico con agua incluyen benceno, tolueno, diclorometano, 1-clorobutano y éter metilbútilico terciario.

Alternativamente, compuestos de fórmula (I) en la que R^1 es $CSNH_2$ también pueden prepararse a partir del compuesto correspondiente de fórmula (I) en la que R^1 es CN mediante tratamiento con el reactivo Ph_2PS_2 , por ejemplo, como se describe en Tet. Lett., 24 (20), 2059 (1983).

Según una característica adicional de la invención, compuestos de fórmula (I) en la que R^1 es $CSNH_2$, y R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , W, A y n son como se definen anteriormente pueden prepararse mediante la reacción del compuesto correspondiente de fórmula (I) en la que R^1 es CN con un sulfuro de bis(trialkilsililo), preferentemente sulfuro de bis(trimetilsililo), en presencia de una base, generalmente un alcóxido de metal alcalino tal como metóxido de sodio, en un disolvente tal como N,N-dimetilformamida, a una temperatura de 0°C a 60°C. El procedimiento se describe generalmente por Lin, Ku y Shiao en Synthesis 1219 (1992).

Según una característica adicional de la invención, compuestos de fórmula (I) en la que R^1 es $C(=N-H)-S-Q$, y Q, R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , W, A y n son como se definen anteriormente pueden prepararse mediante la reacción del compuesto correspondiente de fórmula (I) en la que R^1 es $CSNH_2$ con un agente alquilante de fórmula (VIII) o (IX):



en las que Q es como se define anteriormente y L^3 es un grupo saliente, generalmente halógeno y preferentemente cloro, bromo o yodo. La reacción se realiza generalmente en presencia de una base, por ejemplo un hidruro de metal alcalino tal como hidruro de sodio, o un alcóxido de metal alcalino tal como *tert*-butóxido de potasio, en un disolvente inerte tal como tetrahidrofurano a una temperatura de 0 a 60°C. Alternativamente puede usarse un carbonato de metal alcalino tal como carbonato de potasio, o una base orgánica tal como una trialkilamina, por ejemplo trietilamina o N,N-diisopropiletilamina, en un disolvente inerte tal como acetona, a una temperatura de 0°C a la temperatura de reflujo del disolvente. Cuando un compuesto de fórmula (IX) tal como tetrafluoroborato de trimetiloxonio se usa como agente alquilante, la base es preferentemente un bicarbonato de metal alcalino tal como bicarbonato de sodio, el disolvente es, por ejemplo, diclorometano y la temperatura es de 0°C a la temperatura de reflujo del disolvente.

Según una característica adicional de la presente invención, compuestos de fórmula (I) en la que R^1 es $C(=N-Z)-S-$ Q, Z es como se define anteriormente con la exclusión de H, y Q, R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , W, A y n son como se definen en la fórmula (I) pueden prepararse mediante alquilación, acilación o sulfonilación del compuesto correspondiente de fórmula (I) en la que Z es H con un compuesto de fórmula (X):



en la que Z es como se define anteriormente con la exclusión de H, y L^4 es un grupo saliente. Para las alquilaciones en las que Z es alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), alqueno (C_3-C_6), alquino (C_3-C_6) o $(CH_2)_4R^{11}$, L^4 es preferentemente halógeno, alkilsulfonilo o arilsulfonilo (más preferentemente cloro, bromo, yodo, metilsulfonilo o p-toluenosulfonilo). Una base está opcionalmente presente en la reacción que se realiza generalmente en un disolvente inerte tal como tetrahidrofurano, dioxano, acetonitrilo, tolueno, éter dietílico, diclorometano, dimetilsulfóxido o N,N-dimetilformamida, a una temperatura de -30°C a 200°C, preferentemente a 20°C a 100°C. La base es generalmente hidróxido de metal alcalino tal como hidróxido de potasio, un hidruro de metal alcalino tal como hidruro de sodio,

un carbonato de metal alcalino tal como carbonato de potasio o carbonato de sodio, un alcóxido de metal alcalino tal como metóxido de sodio, un carbonato de metal alcalinotérreo tal como carbonato de calcio, o una base orgánica tal como una amina terciaria, por ejemplo trietilamina o etildiisopropilamina, o piridina, o 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno (DBU).

Para las acilaciones en las que Z es COR¹⁷ o CO₂-alquilo (C₁-C₆), (X) es preferentemente un haluro de ácido en el que L⁴ es preferentemente cloro o bromo (más preferentemente cloro). Una base está opcionalmente presente en la reacción, que se realiza generalmente usando bases, disolventes y temperaturas similares a los que se emplean para las alquilaciones.

Para las sulfonilaciones en las que Z es SO₂R¹⁷, (X) es preferentemente un haluro de sulfonilo en el que L⁴ es preferentemente cloro o bromo (más preferentemente cloro). Una base está opcionalmente presente en la reacción, que se realiza generalmente usando bases, disolventes y temperaturas similares a las que se emplean para las alquilaciones.

Los productos intermedios de fórmula (IV) anterior pueden prepararse mediante la reacción de un compuesto de fórmula (II) como se define anteriormente con un compuesto de fórmula (XI):



en la que L¹ y L⁵ son grupos salientes como se definen anteriormente, preferentemente en la que L⁵ se elige para ser más reactivo que L¹, por ejemplo en la que L⁵ es bromo y L¹ es cloro, en presencia de una base y un disolvente tal como tetrahidrofurano, a una temperatura de 30°C a 120°C. La base es, por ejemplo, hidruro de sodio o un carbonato de metal alcalino tal como carbonato de potasio o carbonato de sodio, o una base orgánica tal como una amina terciaria, por ejemplo trietilamina o etildiisopropilamina.

Las colecciones de compuestos de fórmula (I) que pueden sintetizarse por el procedimiento anteriormente mencionado también pueden prepararse de una forma paralela, y esto puede efectuarse manualmente o en un modo semi-automatizado o completamente automatizado. En este caso es posible, por ejemplo, automatizar el procedimiento de la reacción, el tratamiento final o la purificación de los productos o de los productos intermedios. En total, esto debe entenderse que significa un procedimiento como se describe, por ejemplo, por S.H. DeWitt en "Annual Reports in Combinatorial Chemistry and Molecular Diversity: Automated Synthesis", volumen 1, Verlag Escom 1997, páginas 69 a 77.

Para el procedimiento paralelo de la reacción y el tratamiento final puede usarse una serie de aparatos comercialmente disponibles tales como se ofrecen, por ejemplo, por Stem Corporation, Woodrolfe Road, Tollesbury, Essex, CM9 8SE, Inglaterra o H+P Labortechnik GmbH, Bruckmannring 28, 85764 Oberschleißheim, Alemania o Radleys, Shirehill, Saffron Walden, Essex, Inglaterra. Para la purificación paralela de compuestos de fórmula (I), o de productos intermedios obtenidos durante la preparación, puede hacerse uso, entre otras cosas, de aparatos de cromatografía, por ejemplo, aquellos de ISCO, Inc., 4700 Superior Street, Lincoln, NE 68504, EE.UU.

Los aparatos mencionados conducen a un procedimiento modular en el que las etapas de procedimiento individuales están automatizadas, pero las operaciones manuales deben realizarse entre las etapas de procedimiento. Esto pueden prevenirse empleando sistemas de automatización semi-integrados o completamente integrados en los que los módulos de automatización en cuestión son manipulados, por ejemplo, por robots. Tales sistemas de automatización pueden obtenerse, por ejemplo, de Zymark Corporation, Zymark Center, Hopkinton, MA 01748, EE.UU.

Además de lo que se ha descrito aquí, los compuestos de fórmula (I) puede prepararse en parte o completamente mediante procedimientos soportados en fase sólida. Para este fin, las etapas intermedias individuales o todas las etapas intermedias de la síntesis o de una síntesis adaptada para adecuarse al procedimiento en cuestión están unidas a una resina sintética. Los procedimientos de síntesis soportados en fase sólida se describen exhaustivamente en la bibliografía especializada, por ejemplo, Barry A. Bunin en "The Combinatorial Index", Academic Press, 1998.

El uso de procedimientos de síntesis soportados en fase sólida permite una serie de protocolos que son conocidos de la bibliografía y que, a su vez, pueden realizarse manualmente o de una forma automatizada. Por ejemplo, puede semiautomatizarse el "procedimiento de la bolsa de té" (Houghten, documento US 4.631.211; Houghten y col., Proc. Natl. Acad. Sci, 1985, 82, 5131-5135) en el que se emplean productos de IRORI, 11149 North Torrey Pines Road, La Jolla, CA 92037, EE.UU. La automatización de síntesis en paralelo soportadas en fase sólida se realiza satisfactoriamente, por ejemplo, mediante aparatos de Argonaut Technologies, Inc., 887 Industrial Road, San Carlos, CA 94070, EE.UU. o MultiSynTech GmbH, Wullener Feld 4, 58454 Witten, Alemania.

La preparación de los procedimientos descritos en este documento da compuestos de fórmula (I) en forma de colecciones de sustancias que se llaman bibliotecas. La presente invención también se refiere a bibliotecas que comprenden al menos dos compuestos de fórmula (I).

ES 2 345 559 T3

Los compuestos de fórmula (II), (III), (IV), (V), (VI), (VII), (VIII), (IX), (X) y (XI) son conocidos o pueden prepararse mediante procedimientos conocidos.

Los siguientes ejemplos no limitantes ilustran la preparación de los compuestos de fórmula (I).

Ejemplos químicos

Los espectros de RMN se ejecutaron en deuterocloroformo a menos que se declare lo contrario.

En los ejemplos que siguen, las cantidades (también porcentajes) están basadas en peso, a menos que se declare lo contrario.

Ejemplo 1

5-[N-Metil-N-(ftalimidometil)amino]-1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-ciano-4-trifluorometilsulfinilpirazol (Compuesto número 1-53)

Se añadió N-bromometilftalimida (0,19 g, 0,80 mmoles) a una mezcla de 1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-ciano-5-metilamino-4-trifluorometilsulfinilpirazol (0,3 g, 0,67 mmoles) y fosfato de tripotasio (0,42 g, 2,0 mmoles) en acetonitrilo (10 ml) y la mezcla se calentó a reflujo durante 6 horas. Después del tratamiento final extractivo (heptano-acetato de etilo, agua) y cromatografía se obtuvo el producto del título (0,29 g); pf. 163°C; RMN ¹H: 2,99 (3H), 4,71 (2H), 7,77 y 7,87 (4H), 7,82 (2H); RMN ¹⁹F: -63,8; -72,2 ppm.

Ejemplo 2

1-(2,6-Dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-ciano-5-(2-dietilaminoetil)amino-4-trifluorometilsulfinilpirazol (Compuesto número 2-50)

Se añadió cloruro de 2-cloroetildietilamonio (0,19 g, 1,1 mmoles) a una mezcla de 5-amino-1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-ciano-4-trifluorometilsulfinilpirazol (0,4 g, 0,92 mmoles) y fosfato de tripotasio (0,77 g, 3,7 mmoles) en acetonitrilo (6 ml) y la mezcla se calentó a reflujo durante 6 horas. Después del tratamiento final extractivo (heptano-acetato de etilo, agua) y cromatografía se obtuvo el producto del título (0,15 g); RMN ¹H: 0,87 (3H), 2,40 (2H), 2,53 (2H), 2,98 (2H), 7,80 (2H); RMN ¹⁹F: -64,2; -74,5 ppm.

Ejemplo 3

1-(2,6-Dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-ciano-4-trifluorometiltio-5-[N-(3-dimetilaminopropil)-N-metilamino]pirazol (Compuesto número 5-46)

Se añadió disolución de dimetilamina al 60% (0,12 g, 1,6 mmoles) en tetrahidrofurano (4 ml) a una mezcla de 5-(3-cloropropil)metilamino-1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-ciano-4-trifluorometiltiopirazol (0,2 g, 0,39 mmoles) y yoduro de sodio (0,12 g, 0,8 mmoles) y la mezcla se calentó a 150°C durante 30 minutos en el horno microondas. Después del tratamiento final extractivo (heptano-acetato de etilo, agua) y cromatografía se obtuvo el producto del título (0,15 g); RMN ¹H: 1,51 (2H), 2,01 (2H), 2,11 (6H), 2,89 (3H), 3,06 (2H), 7,78 (2H); RMN ¹⁹F: -44,6; -63,7 ppm.

Ejemplo 4

5-(3-Aminopropil)amino-1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-ciano-4-trifluorometilsulfonylpirazol (Compuesto número 4-03)

Se añadió trietilamina (0,29 g, 2,9 mmoles) a una mezcla de 5-bromo-1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-ciano-4-trifluorometilsulfonylpirazol (1,0 g, 1,9 mmoles) y 1,3-diaminopropano (0,22 g, 2,9 mmoles) en tetrahidrofurano (10 ml). La mezcla se agitó a 20-40°C durante 18 horas. Después del tratamiento final extractivo (heptano-acetato de etilo, agua, disolución de hidróxido sódico) se obtuvo el producto del título (0,74 g); RMN ¹H: 1,56 (2H), 2,86 y 3,02 (2H), 7,78 (2H); RMN ¹⁹F: -63,7; -80,4 ppm.

El siguiente Ejemplo de producto intermedio ilustra la preparación de productos intermedios usados en la síntesis de los ejemplos anteriores.

ES 2 345 559 T3

Ejemplo de producto intermedio 1

5-[N-(3-Cloropropil)-N-metilamino]-1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-ciano-4-trifluorometiltiopirazol

Se añadió 1-bromo-3-cloropropano (1,62 g, 1,6 mmoles) a una mezcla de 1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-ciano-5-metilamino-4-trifluorometiltiopirazol (3,0 g, 6,9 mmoles) e hidruro de sodio (0,35 g, 8,9 mmoles) en tetrahidrofurano (45 ml) bajo una atmósfera de nitrógeno y la mezcla se calentó a reflujo durante 6 horas. Después del tratamiento final extractivo (heptano-acetato de etilo, agua) y cromatografía se obtuvo el producto del título como un sólido (1,83 g); RMN ¹H: 1,81 (2H), 2,88 (3H), 3,21 (2H), 3,37 (2H), 7,80 (2H); RMN ¹⁹F: -44,8; -64,2 ppm.

Los siguientes compuestos preferidos mostrados en las Tablas 1 a 10 también forman parte de la presente invención y fueron preparados o pueden prepararse según o análogamente a los Ejemplos 1 a 4 anteriormente mencionadas o los procedimientos generales anteriormente descritos. Cuando se omiten los subíndices pretenden, por ejemplo, CH₂ significa CH₂.

En las tablas, Me significa metilo, Et significa etilo, Pr significa propilo, Bu significa butilo, C₅H₁₁ significa n-pentilo, C₆H₁₃ significa n-hexilo, C₂H₄ significa etileno (-CH₂CH₂-), cC₃H₅ significa ciclopropilo, NHC₃H₆ significa propilenamino (-CH₂CH₂CH₂NH-) y Ph significa fenilo. En la Tabla 9, N(C₂H₄SM_e)C₂H₄ significa un resto -CH₂CH₂N(CH₂CH₂SCH₃)-.

Los valores de desplazamientos de espectros de RMN ¹⁹F se dan en ppm.

Los números de compuestos sólo se dan para fines de referencia.

TABLA 1

Compuestos de fórmula (I) en los que los sustituyentes tienen los siguientes significados

R ¹ es CN, W es C-Cl, R ² es Cl, R ³ es CF ₃ , R ⁵ es CF ₃ y A es CH ₂				
Compuesto número	R ⁴	NR ⁶ R ⁷	n	pf. °C, RMN (ppm)
1- 01	H	NMe ₂	0	
1- 02	H	NMe ₂	1	
1- 03	H	NMe ₂	2	
1- 04	H	NEt ₂	0	

ES 2 345 559 T3

R ¹ es CN, W es C-Cl, R ² es Cl, R ³ es CF ₃ , R ⁵ es CF ₃ y A es CH ₂				
Compuesto número	R ⁴	NR ⁶ R ⁷	n	pf. °C, RMN (ppm)
1- 05	H	NEt ₂	1	
1- 06	H	NEt ₂	2	
1- 07	H	NnPr ₂	0	
1- 09	H	NnPr ₂	1	
1- 09	H	NnPr ₂	2	
1- 10	H	NnBu ₂	0	
1- 11	H	NnBu ₂	1	
1- 12	H	NnBu ₂	2	
1- 13	H	Nn(C ₅ H ₁₁) ₂	0	
1- 14	H	Nn(C ₅ H ₁₁) ₂	1	
1- 15	H	Nn(C ₅ H ₁₁) ₂	2	
1- 16	H	Nn(C ₆ H ₁₃) ₂	0	
1- 17	H	Nn(C ₆ H ₁₃) ₂	1	
1- 18	H	Nn(C ₆ H ₁₃) ₂	2	
1- 19	H	Pirrolidinilo	0	
1- 20	H	Pirrolidinilo	1	
1- 21	H	Pirrolidinilo	2	
1- 22	H	Piperidinilo	0	
1- 23	H	Piperidinilo	1	
1- 24	H	Piperidinilo	2	
1- 25	H	N-ftalimido	0	
1- 26	H	N-ftalimido	1	19F:-63,8; -74,4
1- 27	H	N-ftalimido	2	
1- 28	Me	NMe ₂	0	
1- 29	Me	NMe ₂	1	
1- 30	Me	NMe ₂	2	
1- 31	Me	NEt ₂	0	
1- 32	Me	NEt ₂	1	
1- 33	Me	NEt ₂	2	
1- 34	Me	NnPr ₂	0	
1- 35	Me	NnPr ₂	1	
1- 36	Me	NnPr ₂	2	

ES 2 345 559 T3

R ¹ es CN, W es C-Cl, R ² es Cl, R ³ es CF ₃ , R ⁵ es CF ₃ y A es CH ₂				
Compuesto número	R ⁴	NR ⁶ R ⁷	n	pf. °C, RMN (ppm)
1- 37	Me	NnBu2	0	
1- 38	Me	NnBu2	1	
1- 39	Me	NnBu2	2	
1- 40	Me	Nn(C5H11)2	0	
1- 41	Me	Nn(C5H11)2	1	
1- 42	Me	Nn(C5H11)2	2	
1- 43	Me	Nn(C6H13)2	0	
1- 44	Me	Nn(C6H13)2	1	
1- 45	Me	Nn(C6H13)2	2	
1- 46	Me	Pirrolidinilo	0	
1- 47	Me	Pirrolidinilo	1	
1- 48	Me	Pirrolidinilo	2	
1- 49	Me	Piperidinilo	0	
1- 50	Me	Piperidinilo	1	
1- 51	Me	Piperidinilo	2	
1- 52	Me	N-ftalimido	0	
1- 53	Me	N-ftalimido	1	¹⁹ F: -63,8; -72,2
1- 54	Me	N-ftalimido	2	

TABLA 2

Compuestos de fórmula (I) en los que los sustituyentes tienen los siguientes significados

R ¹ es CN, W es C-Cl, R ² es Cl, R ³ es CF ₃ , R ⁵ es CF ₃ , R ⁴ es H y A es CH ₂ CH ₂			
Compuesto número	NR ⁶ R ⁷	n	pf. °C, RMN (ppm)
2- 01	NH2	0	
2- 02	NH2	1	
2- 03	NH2	2	
2- 04	NHMe	0	
2- 05	NHMe	1	
2- 06	NHMe	2	
2- 07	NHEt	0	
2- 09	NHEt	1	
2- 09	NHEt	2	

ES 2 345 559 T3

2- 10	NHnPr	0	
2- 11	NHnPr	1	
2- 12	NHnPr	2	
2- 13	NHnBu	0	
2- 14	NHnBu	1	
2- 15	NHnBu	2	
2- 16	NHnC5H11	0	
2- 17	NHnC5H11	1	
2- 18	NHnC5H11	2	
2- 19	NHnC6H13	0	
2- 20	NHnC6H13	1	
2- 21	NHnC6H13	2	
2- 22	NHcC3H5	0	
2- 23	NHcC3H5	1	
2- 24	NHcC3H5	2	
2- 25	NHcC4H7	0	
2- 26	NHcC4H7	1	
2- 27	NHcC4H7	2	
2- 28	NHcC5H9	0	
2- 29	NHcC5H9	1	
2- 30	NHcC5H9	2	
2- 31	NHcC6H11	0	
2- 32	NHcC6H11	1	
2- 33	NHcC6H11	2	
2- 34	NHCH2C6H5	0	
2- 35	NHCH2C6H5	1	
2- 36	NHCH2C6H5	2	
2- 37	NHC2H4C6H5	0	
2- 38	NHC2H4C6H5	1	
2- 39	NHC2H4C6H5	2	
2- 40	NHC6H5	0	
2- 41	NHC6H5	1	
2- 42	NHC6H5	2	
2- 43	NHCH2CH=CH2	0	

ES 2 345 559 T3

2- 44	NHCH ₂ CH=CH ₂	1	
2- 45	NHCH ₂ CH=CH ₂	2	
2- 46	NMe ₂	0	
2- 47	NMe ₂	1	
2- 48	NMe ₂	2	
2- 49	NEt ₂	0	
2- 50	NEt ₂	1	19F:-64,2; -74,5
2- 51	NEt ₂	2	19F:-64,2; -81,1
2- 52	NEtMe	0	
2- 53	NEtMe	1	
2- 54	NEtMe	2	
2- 55	NnPr ₂	0	
2- 56	NnPr ₂	1	
2- 57	NnPr ₂	2	
2- 58	NnBu ₂	0	
2- 59	NnBu ₂	1	
2- 60	NnBu ₂	2	
2- 61	Nn(C ₅ H ₁₁) ₂	0	
2- 62	Nn(C ₅ H ₁₁) ₂	1	
2- 63	Nn(C ₅ H ₁₁) ₂	2	
2- 64	Nn(C ₆ H ₁₃) ₂	0	
2- 65	Nn(C ₆ H ₁₃) ₂	1	
2- 66	Nn(C ₆ H ₁₃) ₂	2	
2- 67	Pirrolidinilo	0	
2- 68	Pirrolidinilo	1	
2- 69	Pirrolidinilo	2	
2- 70	Piperidinilo	0	
2- 71	Piperidinilo	1	
2- 72	Piperidinilo	2	
2- 73	NMeCH ₂ C ₆ H ₅	0	
2- 74	NMeCH ₂ C ₆ H ₅	1	
2- 75	NMeCH ₂ C ₆ H ₅	2	
2- 76	NMeC ₂ H ₄ C ₆ H ₅	0	
2- 77	NMeC ₂ H ₄ C ₆ H ₅	1	

ES 2 345 559 T3

2- 78	NMeC ₂ H ₄ C ₆ H ₅	2	
2- 79	Morfolinilo	0	
2- 80	Morfolinilo	1	
2- 81	Morfolinilo	2	
2- 82	(4-Metil-piperazin)-1-ilo	0	
2- 83	(4-Metil-piperazin)-1-ilo	1	
2- 84	(4-Metil-piperazin)-1-ilo	2	
2- 85	(4-Acetil-piperazin)-1-ilo	0	
2- 86	(4-Acetil-piperazin)-1-ilo	1	
2- 87	(4-Acetil-piperazin)-1-ilo	2	¹⁹ F: -64,1; -81,2
2- 88	(4-Bencil-piperazin)-1-ilo	0	
2- 89	(4-Bencil-piperazin)-1-ilo	1	
2- 90	(4-Bencil-piperazin)-1-ilo	2	

TABLA 3

Compuestos de fórmula (I) en los que los sustituyentes tienen los siguientes significados

R ¹ es CN, W es C-Cl, R ² es Cl, R ³ es CF ₃ , R ⁴ es Me, R ⁵ es CF ₃ y A es CH ₂ CH ₂			
Compuesto número	NR ⁶ R ⁷	n	pf. °C, RMN (ppm)
3- 01	NH ₂	0	
3- 02	NH ₂	1	
3- 03	NH ₂	2	
3- 04	NHMe	0	
3- 05	NHMe	1	
3- 06	NHMe	2	
3- 07	NHEt	0	
3- 09	NHEt	1	
3- 09	NHEt	2	
3- 10	NHnPr	0	
3- 11	NHnPr	1	
3- 12	NHnPr	2	
3- 13	NHnBu	0	
3- 14	NHnBu	1	
3- 15	NHnBu	2	
3- 16	NHnC ₅ H ₁₁	0	

ES 2 345 559 T3

R ¹ es CN, W es C-Cl, R ² es Cl, R ³ es CF ₃ , R ⁴ es Me, R ⁵ es CF ₃ y A es CH ₂ CH ₂			
Compuesto número	NR ⁶ R ⁷	n	pf. °C, RMN (ppm)
3- 17	NHnC5H11	1	
3- 18	NHnC5H11	2	
3- 19	NHnC6H13	0	
3- 20	NHnC6H13	1	
3- 21	NHnC6H13	2	
3- 22	NHcC3H5	0	
3- 23	NHcC3H5	1	
3- 24	NHcC3H5	2	
3- 25	NHcC4H7	0	
3- 26	NHcC4H7	1	
3- 27	NHcC4H7	2	
3- 28	NHcC5H9	0	
3- 29	NHcC5H9	1	
3- 30	NHcC5H9	2	
3- 31	NHcC6H11	0	
3- 32	NHcC6H11	1	
3- 33	NHcC6H11	2	
3- 34	NHCH2C6H5	0	
3- 35	NHCH2C6H5	1	
3- 36	NHCH2C6H5	2	
3- 37	NHC2H4C6H5	0	
3- 38	NHC2H4C6H5	1	
3- 39	NHC2H4C6H5	2	
3- 40	NHC6H5	0	
3- 41	NHC6H5	1	
3- 42	NHC6H5	2	
3- 43	NHCH2CH=CH2	0	
3- 44	NHCH2CH=CH2	1	
3- 45	NHCH2CH=CH2	2	
3- 46	NMe2	0	
3- 47	NMe2	1	

ES 2 345 559 T3

R ¹ es CN, W es C-Cl, R ² es Cl, R ³ es CF ₃ , R ⁴ es Me, R ⁵ es CF ₃ y A es CH ₂ CH ₂			
Compuesto número	NR ⁶ R ⁷	n	pf. °C, RMN (ppm)
3- 48	NMe ₂	2	19F: -64,2; -79,2
3- 49	NEt ₂	0	
3- 50	NEt ₂	1	19F: -64,2; -73,0
3- 51	NEt ₂	2	
3- 52	NEtMe	0	
3- 53	NEtMe	1	
3- 54	NEtMe	2	
3- 55	NnPr ₂	0	
3- 56	NnPr ₂	1	
3- 57	NnPr ₂	2	
3- 58	NnBu ₂	0	
3- 59	NnBu ₂	1	
3- 60	NnBu ₂	2	
3- 61	Nn(C ₅ H ₁₁) ₂	0	
3- 62	Nn(C ₅ H ₁₁) ₂	1	
3- 63	Nn(C ₅ H ₁₁) ₂	2	
3- 64	Nn(C ₆ H ₁₃) ₂	0	
3- 65	Nn(C ₆ H ₁₃) ₂	1	
3- 66	Nn(C ₆ H ₁₃) ₂	2	
3- 67	Pirrolidinilo	0	
3- 68	Pirrolidinilo	1	
3- 69	Pirrolidinilo	2	
3- 70	Piperidinilo	0	
3- 71	Piperidinilo	1	
3- 72	Piperidinilo	2	
3- 73	NMeCH ₂ C ₆ H ₅	0	
3- 74	NMeCH ₂ C ₆ H ₅	1	
3- 75	NMeCH ₂ C ₆ H ₅	2	
3- 76	NMeC ₂ H ₄ C ₆ H ₅	0	
3- 77	NMeC ₂ H ₄ C ₆ H ₅	1	
3- 78	NMeC ₂ H ₄ C ₆ H ₅	2	

ES 2 345 559 T3

R ¹ es CN, W es C-Cl, R ² es Cl, R ³ es CF ₃ , R ⁴ es Me, R ⁵ es CF ₃ y A es CH ₂ CH ₂			
Compuesto número	NR ⁶ R ⁷	n	pf. °C, RMN (ppm)
3- 79	Morfolinilo	0	
3- 80	Morfolinilo	1	
3- 81	Morfolinilo	2	
3- 82	(4-Metil-piperazin)-1-ilo	0	
3- 83	(4-Metil-piperazin)-1-ilo	1	
3- 84	(4-Metil-piperazin)-1-ilo	2	
3- 85	(4-Acetil-piperazin)-1-il	0	
3- 86	(4-Acetil-piperazin)-1-ilo	1	
3- 87	(4-Acetil-piperazin)-1-ilo	2	
3- 88	(4-Bencil-piperazin)-1-ilo	0	
3- 89	(4-Bencil-piperazin)-1-ilo	1	
3- 90	(4-Bencil-piperazin)-1-ilo	2	

TABLA 4

Compuestos de fórmula (I) en los que los sustituyentes tienen los siguientes significados

R ¹ es CN, W es C-Cl, R ² es Cl, R ³ es CF ₃ , R ⁴ es H, R ⁵ es CF ₃ y A es CH ₂ CH ₂ CH ₂			
Compuesto número	NR ⁶ R ⁷	n	pf. °C, RMN (ppm)
4- 01	NH ₂	0	
4- 02	NH ₂	1	
4- 03	NH ₂	2	19F: -63,7; -80,4
4- 04	NHMe	0	
4- 05	NHMe	1	
4- 06	NHMe	2	
4- 07	NHEt	0	
4- 09	NHEt	1	
4- 09	NHEt	2	
4- 10	NHnPr	0	
4- 11	NHnPr	1	
4- 12	NHnPr	2	
4- 13	NHnBu	0	
4- 14	NHnBu	1	

ES 2 345 559 T3

R ¹ es CN, W es C-Cl, R ² es Cl, R ³ es CF ₃ , R ⁴ es H, R ⁵ es CF ₃ y A es CH ₂ CH ₂ CH ₂			
Compuesto número	NR ⁶ R ⁷	n	pf. °C, RMN (ppm)
4- 15	NHnBu	2	
4- 16	NHnC5H11	0	
4- 17	NHnC5H11	1	
4- 18	NHnC5H11	2	
4- 19	NHnC6H13	0	
4- 20	NHnC6H13	1	
4- 21	NHnC6H13	2	
4- 22	NHcC3H5	0	
4- 23	NHcC3H5	1	
4- 24	NHcC3H5	2	
4- 25	NHcC4H7	0	
4- 26	NHcC4H7	1	
4- 27	NHcC4H7	2	
4- 28	NHcC5H9	0	
4- 29	NHcC5H9	1	
4- 30	NHcC5H9	2	
4- 31	NHcC6H11	0	
4- 32	NHcC6H11	1	
4- 33	NHcC6H11	2	
4- 34	NHCH2C6H5	0	
4- 35	NHCH2C6H5	1	
4- 36	NHCH2C6H5	2	
4- 37	NHC2H4C6H5	0	
4- 38	NHC2H4C6H5	1	
4- 39	NHC2H4C6H5	2	
4- 40	NHC6H5	0	
4- 41	NHC6H5	1	
4- 42	NHC6H5	2	
4- 43	NHCH2CH=CH2	0	
4- 44	NHCH2CH=CH2	1	
4- 45	NHCH2CH=CH2	2	

ES 2 345 559 T3

R ¹ es CN, W es C-Cl, R ² es Cl, R ³ es CF ₃ , R ⁴ es H, R ⁵ es CF ₃ y A es CH ₂ CH ₂ CH ₂			
Compuesto número	NR ⁶ R ⁷	n	pf. °C, RMN (ppm)
4- 46	NMe ₂	0	
4- 47	NMe ₂	1	
4- 48	NMe ₂	2	
4- 49	NEt ₂	0	
4- 50	NEt ₂	1	
4- 51	NEt ₂	2	19F: -64,2; -80,9
4- 52	NEtMe	0	
4- 53	NEtMe	1	
4- 54	N EtMe	2	
4- 55	NnPr ₂	0	
4- 56	NnPr ₂	1	
4- 57	NnPr ₂	2	
4- 58	NnBu ₂	0	
4- 59	NnBu ₂	1	
4- 60	NnBu ₂	2	
4- 61	Nn(C ₅ H ₁₁) ₂	0	
4- 62	Nn(C ₅ H ₁₁) ₂	1	
4--63	Nn(C ₅ H ₁₁) ₂	2	
4- 64	Nn(C ₆ H ₁₃) ₂	0	
4- 65	Nn(C ₆ H ₁₃) ₂	1	
4- 66	Nn(C ₆ H ₁₃) ₂	2	
4- 67	Pirrolidinilo	0	
4- 68	Pirrolidinilo	1	
4- 69	Pirrolidinilo	2	
4- 70	Piperidinilo	0	
4- 71	Piperidinilo	1	
4- 72	Piperidinilo	2	
4- 73	NMeCH ₂ C ₆ H ₅	0	
4- 74	NMeCH ₂ C ₆ H ₅	1	
4- 75	NMeCH ₂ C ₆ H ₅	2	
4- 76	NMeC ₂ H ₄ C ₆ H ₅	0	

ES 2 345 559 T3

R ¹ es CN, W es C-Cl, R ² es Cl, R ³ es CF ₃ , R ⁴ es H, R ⁵ es CF ₃ y A es CH ₂ CH ₂ CH ₂			
Compuesto número	NR ⁶ R ⁷	n	pf. °C, RMN (ppm)
4- 77	NMeC ₂ H ₄ C ₆ H ₅	1	
4- 78	NMeC ₂ H ₄ C ₆ H ₅	2	
4- 79	Morfolinilo	0	
4- 80	Morfolinilo	1	
4- 81	Morfolinilo	2	
4- 82	(4-Metil-piperazin)-1-ilo	0	
4- 83	(4-Metil-piperazin)-1-ilo	1	
4- 84	(4-Metil-piperazin)-1-ilo	2	
4- 85	(4-Acetil-piperazin)-1-ilo	0	
4- 86	(4-Acetil-piperazin)-1-ilo	1	
4- 87	(4-Acetil-piperazin)-1-ilo	2	
4- 88	(4-Bencil-piperazin)-1-ilo	0	
4- 89	(4-Bencil-piperazin)-1-ilo	1	
4- 90	(4-Bencil-piperazin)-1-ilo	2	

TABLA 5

Compuestos de fórmula (I) en los que los sustituyentes tienen los siguientes significados

R ¹ es CN, W es C-Cl, R ² es Cl, R ³ es CF ₃ , R ⁴ es Me, R ⁵ es CF ₃ y A es CH ₂ CH ₂ CH ₂			
Compuesto número	NR ⁶ R ⁷	n	pf. °C, RMN (ppm)
5- 01	NH ₂	0	
5- 02	NH ₂	1	
5- 03	NH ₂	2	
5- 04	NHMe	0	
5- 05	NHMe	1	
5- 06	NHMe	2	
5- 07	NHEt	0	
5- 09	NHEt	1	
5- 09	NHEt	2	
5- 10	NHnPr	0	
5- 11	NHnPr	1	
5- 12	NHnPr	2	

ES 2 345 559 T3

R ¹ es CN, W es C-Cl, R ² es Cl, R ³ es CF ₃ , R ⁴ es Me, R ⁵ es CF ₃ y A es CH ₂ CH ₂ CH ₂			
Compuesto número	NR ⁶ R ⁷	n	pf. °C, RMN (ppm)
5- 13	NHnBu	0	19F:-44,9; -64,1
5- 14	NHnBu	1	
5- 15	NHnBu	2	
5- 16	NHnC ₅ H ₁₁	0	
5- 17	NHnC ₅ H ₁₁	1	
5- 18	NHnC ₅ H ₁₁	2	
5- 19	NHnC ₆ H ₁₃	0	
5- 20	NHnC ₆ H ₁₃	1	
5- 21	NHnC ₆ H ₁₃	2	
5- 22	NHcC ₃ H ₅	0	
5- 23	NHcC ₃ H ₅	1	
5- 24	NHcC ₃ H ₅	2	
5- 25	NHcC ₄ H ₇	0	
5- 26	NHcC ₄ H ₇	1	
5- 27	NHcC ₄ H ₇	2	
5- 28	NHcC ₅ H ₉	0	
5- 29	NHcC ₅ H ₉	1	
5- 30	NHcC ₅ H ₉	2	
5- 31	NHcC ₆ H ₁₁	0	
5- 32	NHcC ₆ H ₁₁	1	
5- 33	NHcC ₆ H ₁₁	2	
5- 34	NHCH ₂ C ₆ H ₅	0	
5- 35	NHCH ₂ C ₆ H ₅	1	
5- 36	NHCH ₂ C ₆ H ₅	2	
5- 37	NHC ₂ H ₄ C ₆ H ₅	0	
5- 38	NHC ₂ H ₄ C ₆ H ₅	1	
5- 39	NHC ₂ H ₄ C ₆ H ₅	2	
5- 40	NHC ₆ H ₅	0	
5- 41	NHC ₆ H ₅	1	
5- 42	NHC ₆ H ₅	2	
5- 43	NHCH ₂ CH=CH ₂	0	

ES 2 345 559 T3

R ¹ es CN, W es C-Cl, R ² es Cl, R ³ es CF ₃ , R ⁴ es Me, R ⁵ es CF ₃ y A es CH ₂ CH ₂ CH ₂			
Compuesto número	NR ⁶ R ⁷	n	pf. °C, RMN (ppm)
5- 44	NHCH ₂ CH=CH ₂	1	
5- 45	NHCH ₂ CH=CH ₂	2	
5- 46	NMe ₂	0	19F:-44,6; -63,7
5- 47	NMe ₂	1	
5- 48	NMe ₂	2	
5- 49	NEt ₂	0	19F:-44,7; -63,7
5- 50	NEt ₂	1	19F:-64,2; -73,2
5- 51	NEt ₂	2	(a)
5- 52	NEtMe	0	pf. 70
5- 53	NEtMe	1	
5- 54	NEtMe	2	
5- 55	NnPr ₂	0	19F:-45,9; -64,1
5- 56	NnPr ₂	1	
5- 57	NnPr ₂	2	
5- 58	NnBu ₂	0	
5- 59	NnBu ₂	1	
5- 60	NnBu ₂	2	
5- 61	Nn(C ₅ H ₁₁) ₂	0	
5- 62	Nn(C ₅ H ₁₁) ₂	1	
5- 63	Nn(C ₅ H ₁₁) ₂	2	
5- 64	Nn(C ₆ H ₁₃) ₂	0	
5- 65	Nn(C ₆ H ₁₃) ₂	1	
5- 66	Nn(C ₆ H ₁₃) ₂	2	
5- 67	Pirrolidinilo	0	19F:-44,6; -63,7
5- 68	Pirrolidinilo	1	
5- 69	Pirrolidinilo	2	
5- 70	Piperidinilo	0	19F:-44,9; -64,1
5- 71	Piperidinilo	1	
5- 72	Piperidinilo	2	
5- 73	NMeCH ₂ C ₆ H ₅	0	19F:-44,7; -63,7
5- 74	NMeCH ₂ C ₆ H ₅	1	

ES 2 345 559 T3

R ¹ es CN, W es C-Cl, R ² es Cl, R ³ es CF ₃ , R ⁴ es Me, R ⁵ es CF ₃ y A es CH ₂ CH ₂ CH ₂			
Compuesto número	NR ⁶ R ⁷	n	pf. °C, RMN (ppm)
5- 75	NMeCH ₂ C ₆ H ₅	2	
5- 76	NMeC ₂ H ₄ C ₆ H ₅	0	
5- 77	NMeC ₂ H ₄ C ₆ H ₅	1	
5- 78	NMeC ₂ H ₄ C ₆ H ₅	2	
5- 79	Morfolinilo	0	19F: -44,9; -64,1
5- 80	Morfolinilo	1	
5- 81	Morfolinilo	2	
5- 82	(4-Metil-piperazin)-1-ilo	0	
5- 83	(4-Metil-piperazin)-1-ilo	1	
5- 84	(4-Metil-piperazin)-1-ilo	2	
5- 85	(4-Acetil-piperazin)-1-ilo	0	
5- 86	(4-Acetil-piperazin)-1-ilo	1	
5- 87	(4-Acetil-piperazin)-1-ilo	2	
5- 88	(4-Bencil-piperazin)-1-ilo	0	
5- 89	(4-Bencil-piperazin)-1-ilo	1	
5- 90	(4-Bencil-piperazin)-1-ilo	2	
Nota: (a) sal de ácido trifluoroacético			

ES 2 345 559 T3

TABLA 6

Compuestos de fórmula (I) en los que los sustituyentes tienen los siguientes significados

R ¹ es CN, W es C-Cl, R ² es Cl, R ³ es CF ₃ , R ⁴ es H, R ⁵ es CF ₃ y A es CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂			
Compuesto número	NR ⁶ R ⁷	n	pf. °C, RMN (ppm)
6- 01	NH ₂	0	
6- 02	NH ₂	1	
6- 03	NH ₂	2	19F: -63,7; -80,4
6- 04	NHMe	0	
6- 05	NHMe	1	
6- 06	NHMe	2	
6- 07	NHEt	0	
6- 09	NHEt	1	
6- 09	NHEt	2	
6- 10	NHnPr	0	
6- 11	NHnPr	1	
6- 12	NHnPr	2	
6- 13	NHnBu	0	
6- 14	NHnBu	1	
6- 15	NHnBu	2	
6- 16	NHnC ₅ H ₁₁	0	
6- 17	NHnC ₅ H ₁₁	1	
6- 18	NHnC ₅ H ₁₁	2	
6- 19	NHnC ₆ H ₁₃	0	
6- 20	NHnC ₆ H ₁₃	1	
6- 21	NHnC ₆ H ₁₃	2	
6- 22	NHcC ₃ H ₅	0	
6- 23	NHcC ₃ H ₅	1	
6- 24	NHcC ₃ H ₅	2	
6- 25	NHcC ₄ H ₇	0	
6- 26	NHcC ₄ H ₇	1	
6- 27	NHcC ₄ H ₇	2	
6- 28	NHcC ₅ H ₉	0	

ES 2 345 559 T3

R ¹ es CN, W es C-Cl, R ² es Cl, R ³ es CF ₃ , R ⁴ es H, R ⁵ es CF ₃ y A es CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂			
Compuesto número	NR ⁶ R ⁷	n	pf. °C, RMN (ppm)
6- 29	NHcC5H9	1	
6- 30	NHcC5H9	2	
6- 31	NHcC6H11	0	
6- 32	NHcC6H11	1	
6- 33	NHcC6H11	2	
6- 34	NHCH2C6H5	0	
6- 35	NHCH2C6H5	1	
6- 36	NHCH2C6H5	2	
6- 37	NHC2H4C6H5	0	
6- 38	NHC2H4C6H5	1	
6- 39	NHC2H4C6H5	2	
6- 40	NHC6H5	0	
6- 41	NHC6H5	1	
6- 42	NHC6H5	2	
6- 43	NHCH2CH=CH2	0	
6- 44	NHCH2CH=CH2	1	
6- 45	NHCH2CH=CH2	2	
6- 46	NMe2	0	
6- 47	NMe2	1	
6- 48	NMe2	2	
6- 49	NEt2	0	
6- 50	NEt2	1	
6- 51	NEt2	2	
6- 52	NEtMe	0	
6- 53	NEtMe	1	
6- 54	NEtMe	2	
6- 55	NnPr2	0	
6- 56	NnPr2	1	
6- 57	NnPr2	2	
6- 58	NnBu2	0	

ES 2 345 559 T3

R ¹ es CN, W es C-Cl, R ² es Cl, R ³ es CF ₃ , R ⁴ es H, R ⁵ es CF ₃ y A es CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂			
Compuesto número	NR ⁶ R ⁷	n	pf. °C, RMN (ppm)
6- 59	NnBu2	1	
6- 60	NnBu2	2	
6- 61	Nn(C5H11)2	0	
6- 62	Nn(C5H11)2	1	
6- 63	Nn(C5H11)2	2	
6- 64	Nn(C6H13)2	0	
6- 65	Nn(C6H13)2	1	
6- 66	Nn(C6H13)2	2	
6- 67	Pirrolidinilo	0	
6- 68	Pirrolidinilo	1	
6- 69	Pirrolidinilo	2	
6- 70	Piperidinilo	0	
6- 71	Piperidinilo	1	
6- 72	Piperidinilo	2	
6- 73	NMeCH2C6H5	0	
6- 74	NMeCH2C6H5	1	
6- 75	NMeCH2C6H5	2	
6- 76	NMeC2H4C6H5	0	
6- 77	NMeC2H4C6H5	1	
6- 78	NMeC2H4C6H5	2	
6- 79	Morfolinilo	0	
6- 80	Morfolinilo	1	
6- 81	Morfolinilo	2	
6- 82	(4-Metil-piperazin)-1-ilo	0	
6- 83	(4-Metil-piperazin)-1-ilo	1	
6- 84	(4-Metil-piperazin)-1-ilo	2	
6- 85	(4-Acetil-piperazin)-1-ilo	0	
6- 86	(4-Acetil-piperazin)-1-ilo	1	
6- 87	(4-Acetil-piperazin)-1-ilo	2	
6- 88	(4-Bencil-piperazin)-1-ilo	0	

ES 2 345 559 T3

R ¹ es CN, W es C-Cl, R ² es Cl, R ³ es CF ₃ , R ⁴ es H, R ⁵ es CF ₃ y A es CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂			
Compuesto número	NR ⁶ R ⁷	n	pf. °C, RMN (ppm)
6- 89	(4-Bencil-piperazin)-1-ilo	1	
6- 90	(4-Bencil-piperazin)-1-ilo	2	

TABLA 7

Compuestos de fórmula (I) en los que los sustituyentes tienen los siguientes significados

R ¹ es CN, W es C-Cl, R ² es Cl, R ³ es CF ₃ , R ⁴ es Me, R ⁵ es CF ₃ y A es CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂			
Compuesto número	NR ⁶ R ⁷	n	pf. °C, RMN (ppm)
7- 01	NH ₂	0	
7- 02	NH ₂	1	
7- 03	NH ₂	2	
7- 04	NHMe	0	
7- 05	NHMe	1	
7- 06	NHMe	2	
7- 07	NHEt	0	
7- 09	NHEt	1	
7- 09	NHEt	2	
7- 10	NHnPr	0	
7- 11	NHnPr	1	
7- 12	NHnPr	2	
7- 13	NHnBu	0	
7- 14	NHnBu	1	
7- 15	NHnBu	2	
7- 16	NHnC ₅ H ₁₁	0	
7- 17	NHnC ₅ H ₁₁	1	
7- 18	NHnC ₅ H ₁₁	2	
7- 19	NHnC ₆ H ₁₃	0	
7- 20	NHnC ₆ H ₁₃	1	
7- 21	NHnC ₆ H ₁₃	2	
7- 22	NHcC ₃ H ₅	0	

ES 2 345 559 T3

R ¹ es CN, W es C-Cl, R ² es Cl, R ³ es CF ₃ , R ⁴ es Me, R ⁵ es CF ₃ y A es CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂			
5	7- 23	NHcC3H5	1
	7- 24	NHcC3H5	2
10	7- 25	NHcC4H7	0
	7- 26	NHcC4H7	1
	7- 27	NHcC4H7	2
15	7- 28	NHcC5H9	0
	7- 29	NHcC5H9	1
	7- 30	NHcC5H9	2
20	7- 31	NHcC6H11	0
	7- 32	NHcC6H11	1
	7- 33	NHcC6H11	2
25	7- 34	NHCH2C6H5	0
	7- 35	NHCH2C6H5	1
	7- 36	NHCH2C6H5	2
30	7- 37	NHC2H4C6H5	0
	7- 38	NHC2H4C6H5	1
35	7- 39	NHC2H4C6H5	2
	7- 40	NHC6H5	0
	7- 41	NHC6H5	1
40	7- 42	NHC6H5	2
	7- 43	NHCH2CH=CH2	0
	7- 44	NHCH2CH=CH2	1
45	7- 45	NHCH2CH=CH2	2
	7- 46	NMe2	0
	7- 47	NMe2	1
50	7- 48	NMe2	2
	7- 49	NEt2	0
55	7- 50	NEt2	1
	7- 51	NEt2	2
	7- 52	NEtMe	0
60	7- 53	NEtMe	1
	7- 54	NEtMe	2

65

ES 2 345 559 T3

R ¹ es CN, W es C-Cl, R ² es Cl, R ³ es CF ₃ , R ⁴ es Me, R ⁵ es CF ₃ y A es CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂			
7- 55	NnPr2	0	
7- 56	NnPr2	1	
7- 57	NnPr2	2	
7- 58	NnBu2	0	
7- 59	NnBu2	1	
7- 60	NnBu2	2	
7- 61	Nn(C5H11)2	0	
7- 62	Nn(C5H11)2	1	
7- 63	Nn(C5H11)2	2	
7- 64	Nn(C6H13)2	0	
7- 65	Nn(C6H13)2	1	
7- 66	Nn(C6H13)2	2	
7- 67	Pirrolidinilo	0	
7- 68	Pirrolidinilo	1	
7- 69	Pirrolidinilo	2	
7- 70	Piperidinilo	0	
7- 71	Piperidinilo	1	
7- 72	Piperidinilo	2	
7- 73	NMeCH2C6H5	0	
7- 74	NMeCH2C6H5	1	
7- 75	NMeCH2C6H5	2	
7- 76	NMeC2H4C6H5	0	
7- 77	NMeC2H4C6H5	1	
7- 78	NMeC2H4C6H5	2	
7- 79	Morfolinilo	0	
7- 80	Morfolinilo	1	
7- 81	Morfolinilo	2	
7- 82	(4-Metil-piperazin)-1-ilo	0	
7- 83	(4-Metil-piperazin)-1-ilo	1	
7- 84	(4-Metil-piperazin)-1-ilo	2	
7- 85	(4-Acetil-piperazin)-1-ilo	1	
7- 86	(4-Acetil-piperazin)-1-ilo	1	

ES 2 345 559 T3

R ¹ es CN, W es C-Cl, R ² es Cl, R ³ es CF ₃ , R ⁴ es Me, R ⁵ es CF ₃ y A es CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂			
7- 87	(4-Acetil-piperazin)-1-ilo	2	
7- 88	(4-Bencil-piperazin)-1-ilo	0	
7- 89	(4-Bencil-piperazin)-1-ilo	1	
7- 90	(4-Bencil-piperazin)-1-ilo	2	

TABLA 8

Compuestos de fórmula (I) en los que los sustituyentes tienen los siguientes significados

R ¹ es CN, W es C-Cl, R ² es Cl, R ³ es CF ₃ y R ⁵ es CF ₃				
Compuesto número	NR ⁴ -A	NR ⁶ R ⁷	n	pf. °C, RMN (ppm)
8- 01	NHC2H4	NH-COCH3	0	
8- 02	NHC2H4	NH-COCH3	1	
8- 03	NHC2H4	NH-COCH3	2	
8- 04	NMeC2H4	NH-COCH3	0	
8- 05	NMeC2H4	NH-COCH3	1	
8- 06	NMeC2H4	NH-COCH3	2	
8- 07	NHC3H6	NH-COCH3	0	
8- 09	NHC3H6	NH-COCH3	1	
8- 09	NHC3H6	NH-COCH3	2	
8- 10	NMeC3H6	NH-COCH3	0	
8- 11	NMeC3H6	NH-COCH3	1	
8- 12	NMeC3H6	NH-COCH3	2	
8- 13	NHC4H8	NH-COCH3	0	
8- 14	NHC4H8	NH-COCH3	1	
8- 15	NHC4H8	NH-COCH3	2	19F: -64,2; -81,0
8- 16	NMeC4H8	NH-COCH3	0	
8- 17	NMeC4H8	NH-COCH3	1	
8- 18	NMeC4H8	NH-COCH3	2	
8- 19	NHC2H4	NMe-COCH3	0	
8- 20	NHC2H4	NMe-COCH3	1	
8- 21	NHC2H4	NMe-COCH3	2	
8- 22	NMeC2H4	NMe-COCH3	0	
8- 23	NMeC2H4	NMe-COCH3	1	

ES 2 345 559 T3

R ¹ es CN, W es C-Cl, R ² es Cl, R ³ es CF ₃ y R ⁵ es CF ₃				
Compuesto número	NR ⁴ -A	NR ⁶ R ⁷	n	pf. °C, RMN (ppm)
8- 24	NMeC2H4	NMe-COCH3	2	
8- 25	NHC3H6	NMe-COCH3	0	
8- 26	NHC3H6	NMe-COCH3	1	
8- 27	NHC3H6	NMe-COCH3	2	
8- 28	NMeC3H6	NMe-COCH3	0	
8- 29	NMeC3H6	NMe-COCH3	1	
8- 30	NMeC3H6	NMe-COCH3	2	
8- 31	NHC4H8	NMe-COCH3	0	
8- 32	NHC4H8	NMe-COCH3	1	
8- 33	NHC4H8	NMe-COCH3	2	
8- 34	NMeC4H8	NMe-COCH3	0	
8- 35	NMeC4H8	NMe-COCH3	1	
8- 36	NMeC4H8	NMe-COCH3	2	
8- 37	NHC2H4	N-ftalimido	0	
8- 38	NHC2H4	N-ftalimido	1	
8- 39	NHC2H4	N-ftalimido	2	
8- 40	NMeC2H4	N-ftalimido	0	
8- 41	NMeC2H4	N-ftalimido	1	
8- 42	NMeC2H4	N-ftalimido	2	
8- 43	NHC3H6	N-ftalimido	0	
8- 44	NHC3H6	N-ftalimido	1	
8- 45	NHC3H6	N-ftalimido	2	
8- 46	NMeC3H6	N-ftalimido	0	
8- 47	NMeC3H6	N-ftalimido	1	19F: -64,1; -73,2
8- 48	NMeC3H6	N-ftalimido	2	
8- 49	NHC4H8	N-ftalimido	0	
8- 50	NHC4H8	N-ftalimido	1	
8- 51	NHC4H8	N-ftalimido	2	
8- 52	NMeC4H8	N-ftalimido	0	
8- 53	NMeC4H8	N-ftalimido	1	
8- 54	NMeC4H8	N-ftalimido	2	

ES 2 345 559 T3

R ¹ es CN, W es C-Cl, R ² es Cl, R ³ es CF ₃ y R ⁵ es CF ₃				
Compuesto número	NR ⁴ -A	NR ⁶ R ⁷	n	pf. °C, RMN (ppm)
8- 55	NHC2H4	2-Oxopirrolidinilo	0	
8- 56	NHC2H4	2-Oxopirrolidinilo	1	
8- 57	NHC2H4	2-Oxopirrolidinilo	2	
8- 58	NMeC2H4	2-Oxopirrolidinilo	0	
8- 59	NMeC2H4	2-Oxopirrolidinilo	1	
8- 60	NMeC2H4	2-Oxopirrolidinilo	2	
8- 61	NHC3H6	2-Oxopirrolidinilo	0	
8- 62	NHC3H6	2-Oxopirrolidinilo	1	
8- 63	NHC3H6	2-Oxopirrolidinilo	2	19F: -63,8; -80,1
8- 64	NMeC3H6	2-Oxopirrolidinilo	0	
8- 65	NMeC3H6	2-Oxopirrolidinilo	1	
8- 66	NMeC3H6	2-Oxopirrolidinilo	2	
8- 67	NHC4H8	2-Oxopirrolidinilo	0	
8- 68	NHC4H8	2-Oxopirrolidinilo	1	
8- 69	NHC4H8	2-Oxopirrolidinilo	2	
8- 70	NMeC4H8	2-Oxopirrolidinilo	0	
8- 71	NMeC4H8	2-Oxopirrolidinilo	1	
8- 72	NMeC4H8	2-Oxopirrolidinilo	2	
8- 73	NHC2H4	2-Oxopiperidinilo	0	
8- 74	NHC2H4	2-Oxopiperidinilo	1	
8- 75	NHC2H4	2-Oxopiperidinilo	2	
8- 76	NMeC2H4	2-Oxopiperidinilo	0	
8- 77	NMeC2H4	2-Oxopiperidinilo	1	
8- 78	NMeC2H4	2-Oxopiperidinilo	2	
8- 79	NHC3H6	2-Oxopiperidinilo	0	
8- 80	NHC3H6	2-Oxopiperidinilo	1	
8- 81	NHC3H6	2-Oxopiperidinilo	2	
8- 82	NMeC3H6	2-Oxopiperidinilo	0	
8- 83	NMeC3H6	2-Oxopiperidinilo	1	
8- 84	NMeC3H6	2-Oxopiperidinilo	2	
8- 85	NHC4H8	2-Oxopiperidinilo	0	

ES 2 345 559 T3

R ¹ es CN, W es C-Cl, R ² es Cl, R ³ es CF ₃ y R ⁵ es CF ₃				
Compuesto número	NR ⁴ -A	NR ⁶ R ⁷	n	pf. °C, RMN (ppm)
8- 86	NHC ₄ H ₈	2-Oxopiperidinilo	1	
8- 87	NHC ₄ H ₈	2-Oxopiperidinilo	2	
8- 88	NMeC ₄ H ₈	2-Oxopiperidinilo	0	
8- 89	NMeC ₄ H ₈	2-Oxopiperidinilo	1	
8- 90	NMeC ₄ H ₈	2-Oxopiperidinilo	2	

TABLA 9

Compuestos de fórmula (I) en los que los sustituyentes tienen los siguientes significados

R ¹ es CN, W es C-Cl, R ² es Cl, R ³ es CF ₃ y R ⁵ es CF ₃				
Compuesto número	NR ⁴ -A	NR ⁶ R ⁷	n	pf. °C, RMN (ppm)
9- 01	N(COCH ₃)C ₂ H ₄	NMe ₂	0	
9- 02	N(COCH ₃)C ₂ H ₄	NMe ₂	1	
9- 03	N(COCH ₃)C ₂ H ₄	NMe ₂	2	
9- 04	N(COCH ₃)C ₂ H ₄	NEt ₂	0	
9- 05	N(COCH ₃)C ₂ H ₄	NEt ₂	1	
9- 06	N(COCH ₃)C ₂ H ₄	NEt ₂	2	
9- 07	N(COCH ₃)C ₂ H ₄	NEtMe	0	
9- 09	N(COCH ₃)C ₂ H ₄	NEtMe	1	
9- 09	N(COCH ₃)C ₂ H ₄	NEtMe	2	
9- 10	N(COCH ₃)C ₃ H ₆	NMe ₂	0	
9- 11	N(COCH ₃)C ₃ H ₆	NMe ₂	1	
9- 12	N(COCH ₃)C ₃ H ₆	NMe ₂	2	
9- 13	N(COCH ₃)C ₃ H ₆	NEt ₂	0	
9- 14	N(COCH ₃)C ₃ H ₆	NEt ₂	1	
9- 15	N(COCH ₃)C ₃ H ₆	NEt ₂	2	
9- 16	N(COCH ₃)C ₃ H ₆	NEtMe	0	
9- 17	N(COCH ₃)C ₃ H ₆	NEtMe	1	
9- 18	N(COCH ₃)C ₃ H ₆	NEtMe	2	
9- 19	N(COOMe)C ₂ H ₄	NMe ₂	0	
9- 20	N(COOMe)C ₂ H ₄	NMe ₂	1	
9- 21	N(COOMe)C ₂ H ₄	NMe ₂	2	
9- 22	N(COOMe)C ₂ H ₄	NEt ₂	0	

ES 2 345 559 T3

R ¹ es CN, W es C-Cl, R ² es Cl, R ³ es CF ₃ y R ⁵ es CF ₃				
Compuesto número	NR ⁴ -A	NR ⁶ R ⁷	n	pf. °C, RMN (ppm)
9- 23	N(COOMe)C ₂ H ₄	NEt ₂	1	
9- 24	N(COOMe)C ₂ H ₄	NEt ₂	2	
9- 25	N(COOMe)C ₂ H ₄	NEtMe	0	
9- 26	N(COOMe)C ₂ H ₄	NEtMe	1	
9- 27	N(COOMe)C ₂ H ₄	NEtMe	2	
9- 28	N(COOMe)C ₃ H ₆	NMe ₂	0	
9- 29	N(COOMe)C ₃ H ₆	NMe ₂	1	
9- 30	N(COOMe)C ₃ H ₆	NMe ₂	2	
9- 31	N(COOMe)C ₃ H ₆	NEt ₂	0	
9- 32	N(COOMe)C ₃ H ₆	NEt ₂	1	
9- 33	N(COOMe)C ₃ H ₆	NEt ₂	2	
9- 34	N(COOMe)C ₃ H ₆	NEtMe	0	
9- 35	N(COOMe)C ₃ H ₆	NEtMe	1	
9- 36	N(COOMe)C ₃ H ₆	NEtMe	2	
9- 37	N(COOEt)C ₂ H ₄	NMe ₂	0	
9- 38	N(COOEt)C ₂ H ₄	NMe ₂	1	
9- 39	N(COOEt)C ₂ H ₄	NMe ₂	2	
9- 40	N(COOEt)C ₂ H ₄	NEt ₂	0	
9- 41	N(COOEt)C ₂ H ₄	NEt ₂	1	
9- 42	N(COOEt)C ₂ H ₄	NEt ₂	2	¹⁹ F: -64,0; -77,6; (a)
9- 43	N(COOEt)C ₂ H ₄	NEtMe	0	
9- 44	N(COOEt)C ₂ H ₄	NEtMe	1	
9- 45	N(COOEt)C ₂ H ₄	NEtMe	2	
9- 46	N(COOEt)C ₃ H ₆	NMe ₂	0	
9- 47	N(COOEt)C ₃ H ₆	NMe ₂	1	
9- 48	N(COOEt)C ₃ H ₆	NMe ₂	2	
9- 49	N(COOEt)C ₃ H ₆	NEt ₂	0	
9- 50	N(COOEt)C ₃ H ₆	NEt ₂	1	
9- 51	N(COOEt)C ₃ H ₆	NEt ₂	2	
9- 52	N(COOEt)C ₃ H ₆	NEtMe	0	
9- 53	N(COOEt)C ₃ H ₆	NEtMe	1	
9- 54	N(COOEt)C ₃ H ₆	NEtMe	2	

ES 2 345 559 T3

R ¹ es CN, W es C-Cl, R ² es Cl, R ³ es CF ₃ y R ⁵ es CF ₃				
Compuesto número	NR ⁴ -A	NR ⁶ R ⁷	n	pf. °C, RMN (ppm)
9- 55	N(C ₂ H ₄ SM _e)C ₂ H ₄	NMe ₂	0	
9- 56	N(C ₂ H ₄ SM _e)C ₂ H ₄	NMe ₂	1	
9- 57	N(C ₂ H ₄ SM _e)C ₂ H ₄	NMe ₂	2	
9- 58	N(C ₂ H ₄ SM _e)C ₂ H ₄	NEt ₂	0	
9- 59	N(C ₂ H ₄ SM _e)C ₂ H ₄	NEt ₂	1	
9- 60	N(C ₂ H ₄ SM _e)C ₂ H ₄	NEt ₂	2	¹⁹ F:-63,7; -78,3
9- 61	N(C ₂ H ₄ SM _e)C ₂ H ₄	NEtMe	0	
9- 62	N(C ₂ H ₄ SM _e)C ₂ H ₄	NEtMe	1	
9- 63	N(C ₂ H ₄ SM _e)C ₂ H ₄	NEtMe	2	
9- 64	N(C ₂ H ₄ SM _e)C ₃ H ₆	NMe ₂	0	
9- 65	N(C ₂ H ₄ SM _e)C ₃ H ₆	NMe ₂	1	
9- 66	N(C ₂ H ₄ SM _e)C ₃ H ₆	NMe ₂	2	
9- 67	N(C ₂ H ₄ SM _e)C ₃ H ₆	NEt ₂	0	
9- 68	N(C ₂ H ₄ SM _e)C ₃ H ₆	NEt ₂	1	
9- 69	N(C ₂ H ₄ SM _e)C ₃ H ₆	NEt ₂	2	¹⁹ F:-63,7; -78,3
9- 70	N(C ₂ H ₄ SM _e)C ₃ H ₆	NEtMe	0	
9- 71	N(C ₂ H ₄ SM _e)C ₃ H ₆	NEtMe	1	
9- 72	N(C ₂ H ₄ SM _e)C ₃ H ₆	NEtMe	2	
Note (a) sal de ácido trifluoroacético				

ES 2 345 559 T3

TABLA 10

Compuestos de fórmula (I) en los que los sustituyentes tienen los siguientes significados

R ¹ es CN, W es C-Cl, R ² es Cl, R ³ es CF ₃ y R ⁵ es CF ₃			
Compuesto número	N(R ⁴)-A-NR ⁶ R	n	pf. °C, RMN (ppm)
10- 01	(2,2,6,6-Tetrametilpiperidin-4-il)amino	0	
10- 02	(2,2,6,6-Tetrametilpiperidin-4-il)amino	1	
10- 03	(2,2,6,6-Tetrametilpiperidin-4-il)amino	2	19F:- 64,0; - 80,4
10- 04	Piperidin-4-ilamino	0	
10- 05	Piperidin-4-ilamino	1	
10- 06	Piperidin-4-ilamino	2	
10- 07	(1-Bencilpiperidin-4-il)amino	0	
10- 09	(1-Bencilpiperidin-4-il)amino	1	
10- 09	(1-Bencilpiperidin-4-il)amino	2	
10- 10	(1-Metilpiperidin-4-il)amino	0	
10- 11	(1-Metilpiperidin-4-il)amino	1	
10- 12	(1-Metilpiperidin-4-il)amino	2	
10- 13	(1-Bencilpiperidin-3-il)amino	0	
10- 14	(1-Bencilpiperidin-3-il)amino	1	
10- 15	(1-Bencilpiperidin-3-il)amino	2	
10- 16	Pirrolidin-3-ilamino	0	
10- 17	Pirrolidin-3-ilamino	1	
10- 18	Pirrolidin-3-ilamino	2	
10- 19	(1-Acetil-piperidin-4-il)amino	0	
10- 20	(1-Acetil-piperidin-4-il)amino	1	
10- 21	(1-Acetil-piperidin-4-il)amino	2	
10- 22	(1-Metoxycarbonil-piperidin-4-il)amino	0	
10- 23	(1-Metoxycarbonil-piperidin-4-il)amino	1	
10- 24	(1-Metoxycarbonil-piperidin-4-il)amino	2	
10- 25	(1-Etoxicarbonil-piperidin-4-il)amino	0	
10- 26	(1-Etoxicarbonil-piperidin-4-il)amino	1	

ES 2 345 559 T3

R ¹ es CN, W es C-Cl, R ² es Cl, R ³ es CF ₃ y R ⁵ es CF ₃			
Compuesto número	N(R ⁴)-A-NR ⁶ R	n	pf. °C, RMN (ppm)
10- 27	(1-Etoxicarbonil-piperidin-4-il)amino	2	
10- 28	N-(1-Bencilpiperidin-4-il)-N-metilamino	0	
10- 29	N-(1-Bencilpiperidin-4-il)-N-metilamino	1	
10- 30	N-(1-Bencilpiperidin-4-il)-N-metilamino	2	
10- 31	N-(1-Metilpiperidin-4-il)-N-metilamino	0	
10- 32	N-(1-Metilpiperidin-4-il)-N-metilamino	1	
10- 33	N-(1-Metilpiperidin-4-il)-N-metilamino	2	
10- 34	N-(1-Bencilpiperidin-3-il)-N-metilamino	0	
10- 35	N-(1-Bencilpiperidin-3-il)-N-metilamino	1	
10- 36	N-(1-Bencilpiperidin-3-il)-N-metilamino	2	

Según una característica adicional de la presente invención se proporciona un procedimiento para el control de plagas en un lugar que comprende aplicar al mismo una cantidad eficaz de un compuesto de fórmula (I) o una sal del mismo. Para este fin, dicho compuesto se usa normalmente en forma de una composición pesticida (es decir, en asociación con diluyentes o soportes compatibles y/o agentes tensioactivos adecuados para uso en composiciones pesticidas), por ejemplo, como se describe en lo sucesivo.

El término “compuesto de la invención” como se usa en lo sucesivo engloba un derivado de 5-aminoalquilamino-pirazol de fórmula (I) como se define anteriormente y una sal pesticidamente aceptable del mismo.

Un aspecto de la presente invención como se define anteriormente es un procedimiento para el control de plagas en un lugar. El lugar incluye, por ejemplo, la propia plaga, el sitio (planta, campo, bosque, huerto, vía fluvial, tierra, producto vegetal o similares) en el que reside o se alimenta la plaga o un sitio susceptible a la futura infestación por la plaga. Por tanto, el compuesto de la invención puede aplicarse directamente a la plaga, al sitio en el que la plaga reside o se alimenta o al sitio susceptible a la futura infestación por la plaga.

Como es evidente de los anteriores usos pesticidas, la presente invención proporciona compuestos pesticidamente activos y procedimientos de uso de dichos compuestos para el control de varias especies de plagas que incluyen: artrópodos, especialmente insectos o ácaros, o nematodos de las plantas. Por tanto, el compuesto de la invención puede emplearse ventajosamente en usos prácticos, por ejemplo, en cultivos agrícolas u hortícolas, en silvicultura, en veterinaria o cría de ganado, o en salud pública.

Los compuestos de la invención pueden usarse, por ejemplo, en las siguientes aplicaciones en las siguientes plagas:

Para el control de insectos de la tierra tales como gusano de la raíz del maíz, termitas (especialmente para la protección de estructuras), gusanos de mosca de la raíz, gusanos de alambre, gorgojos de la raíz, barrenadores del tallo, gusanos cortadores, áfidos de la raíz o larvas. También pueden usarse para proporcionar actividad contra nematodos patógenos de las plantas tales como nematodos de los nodos de la raíz, de quistes, daga, de lesión o de tallos o bulbos, o contra ácaros. Para el control de plagas de la tierra, por ejemplo, gusano de la raíz del maíz, los compuestos se aplican ventajosamente a o se incorporan a una tasa eficaz en la tierra en la que se plantan o van a plantarse las cosechas o a las semillas o las raíces de plantas en crecimiento.

En el área de la salud pública, los compuestos son especialmente útiles en el control de muchos insectos, especialmente moscas de la inmundicia u otras plagas de dípteros tales como moscas domésticas, moscas de establo, moscas soldado, moscas de los cuernos, moscas de ciervo, moscas de caballo, mosquillas, chinches chupadoras, moscas negras o mosquitos.

En la protección de productos almacenados, por ejemplo cereales, incluyendo grano o harina, cacahuets, piensos animales, madera o enseres domésticos, por ejemplo alfombras y textiles, los compuestos de la invención son útiles contra el ataque de artrópodos, más especialmente escarabajos que incluyen gorgojos, palomillas o ácaros, por ejemplo *Ephesia spp.* (palomillas de la harina), *Anthrenus spp.* (escarabajos de las alfombras), *Tribolium spp.* (escarabajos de la harina), *Sitophilus spp.* (gorgojos del grano) o *Acarus spp.* (ácaros).

ES 2 345 559 T3

En el control de cucarachas, hormigas o termitas o plagas de artrópodos similares en locales domésticos o industriales infestados o en el control de larvas de mosquitos en vías fluviales, pozos, depósitos u otra agua corriente o estancada.

- 5 Para el tratamiento de cimientos, estructuras o tierra en la prevención del ataque durante la construcción por termitas, por ejemplo, *Reticulitermes spp.*, *Heterotermes spp.*, *Coptotermes spp.*

En la agricultura contra adultos, larvas y huevos de lepidópteros (mariposas y palomillas), por ejemplo, *Heliothis spp.* tal como *Heliothis virescens* (gusano de la yema del tabaco), *Heliothis armigera* y *Heliothis zea*. Contra adultos y larvas de coleópteros (escarabajos), por ejemplo, *Anthonomus spp.*, por ejemplo, *grandis* (picudo del algodón), *Leptinotarsa decemlineata* (escarabajo de la patata del Colorado), *Diabrotica spp.* (gusanos de la raíz del maíz). Contra heterópteros (hemípteros y homópteros), por ejemplo, *Psylla spp.*, *Bemisia spp.*, *Trialeurodes spp.*, *Aphis spp.*, *Myzus spp.*, *Megoura viciae*, *Phylloxera spp.*, *Nephotettix spp.* (saltahojas del arroz), *Nilaparvata spp.*

15 Contra dípteros, por ejemplo, *Musca spp.* Contra tisanópteros tales como *Thrips tabaci*. Contra ortópteros tales como *Locusta* y *Schistocerca spp.*, (langostas y grillos), por ejemplo, *Gryllus spp.*, y *Acheta spp.*, por ejemplo, *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Blatella germanica*, *Locusta migratoria migratorioides* y *Schistocerca gregaria*. Contra colémbolos, por ejemplo, *Periplaneta spp.* y *Blatella spp.* (cucarachas).

20 Contra artrópodos de importancia agrícola tales como ácaros, por ejemplo, *Tetranychus spp.* y *Panonychus spp.*

Contra nematodos que atacan plantas o árboles de importancia para la agricultura, silvicultura u horticultura tanto directamente como por enfermedades bacterianas, virales, por micoplasmas o fúngicas que se propagan de las plantas. Por ejemplo, como nematodos de los nodos de la raíz tales como *Meloidogyne spp.* (por ejemplo, *M. incognita*).

25 En el campo de la veterinaria o la cría de ganado o en el mantenimiento de la salud pública contra artrópodos que son parásitos interna o externamente para los vertebrados, particularmente vertebrados de sangre caliente, por ejemplo animales domésticos, por ejemplo, ganado, ovejas, cabras, equinos, cerdos, aves de corral, perros o gatos, por ejemplo, ácaros que incluyen garrapatas (por ejemplo, garrapatas de cuerpo blando que incluyen *Argasidae spp.*, por ejemplo, *Argas spp.* y *Ornithodoros spp.* (por ejemplo, *Ornithodoros moubata*); garrapatas de cuerpo duro que incluyen *Ixodidae spp.*, por ejemplo, *Boophilus spp.*, por ejemplo, *Boophilus microplus*, *Rhipicephalus spp.*, por ejemplo, *Rhipicephalus appendiculatus* y *Rhipicephalus sanguineus*; ácaros (por ejemplo, *Damalinia spp.*); pulgas (por ejemplo, *Ctenocephalides spp.*, por ejemplo, *Ctenocephalides felis* (pulgas de los gatos) y *Ctenocephalides canis* (pulgas de los perros)); piojos, por ejemplo, *Menopon spp.*; dípteros (por ejemplo, *Aedes spp.*, *Anopheles spp.*, *Musca spp.*, *Hypoderma spp.*); hemípteros; dictiópteros (por ejemplo, *Periplaneta spp.*, *Blatella spp.*); himenópteros; por ejemplo, contra infecciones del tracto gastrointestinal producidas por gusanos nematodos parásitos, por ejemplo, miembros de la familia *Trichostrongylidae*.

40 Los compuestos de fórmula (I) pueden usarse para el control de parásitos de animales. Preferentemente, el animal que va a tratarse es un animal de compañía doméstico tal como un perro o un gato.

En otro aspecto de la invención, los compuestos de fórmula (I) o las sales o composiciones de los mismos se usan para la preparación de un medicamento veterinario.

45 Por tanto, una característica adicional de la invención se refiere al uso de un compuesto de fórmula (I) o una sal del mismo, o de una composición del mismo, para el control de plagas.

En el uso práctico para el control de artrópodos, especialmente insectos o ácaros, o helmintos, especialmente plagas de nematodos de las plantas, un procedimiento comprende, por ejemplo, aplicar a las plantas o al medio en el que crecen una cantidad eficaz de un compuesto de la invención. Para un procedimiento tal, el compuesto de la invención se aplica generalmente al lugar en el que va a controlarse la infestación por artrópodos o nematodos a una tasa eficaz en el intervalo de aproximadamente 2 g a aproximadamente 1 kg del compuesto activo por hectárea de lugar tratado. Bajo condiciones ideales, dependiendo de la plaga que va a controlarse, una tasa inferior puede ofrecer una protección adecuada. Por otra parte, condiciones meteorológicas adversas, resistencia de la plaga u otros factores pueden requerir que el principio activo se use a tasas mayores. La tasa óptima depende normalmente de varios factores, por ejemplo, el tipo de plaga que va a controlarse, el tipo o la fase de crecimiento de la planta infestada, la separación entre filas o también el procedimiento de aplicación. Preferentemente, una tasa eficaz del compuesto activo es de aproximadamente 10 g/ha a aproximadamente 400 g/ha, más preferentemente de aproximadamente 50 g/ha a aproximadamente 200 g/ha. Si una plaga se transmite por la tierra, el compuesto activo generalmente en una composición formulada se distribuye uniformemente sobre el área que va a tratarse (es decir, por ejemplo, tratamiento por empolvado o bandas) en cualquier modo conveniente y se aplica a tasas de aproximadamente 10 g/ha a aproximadamente 400 g de pa/ha, preferentemente de aproximadamente 50 g/ha a aproximadamente 200 g de pa/ha. Cuando se aplica como una inmersión de raíces a plantas de semillero o irrigación por inmersión a plantas, la disolución o suspensión líquida contiene de aproximadamente 0,075 a aproximadamente 1000 mg de pa/l, preferentemente de aproximadamente 25 a aproximadamente 200 mg de pa/l. La aplicación puede hacerse, si se desea, al campo o al área de crecimiento de cultivos generalmente o en una proximidad cercana a la semilla o planta que va a protegerse del ataque. El compuesto de la invención puede lavarse en la tierra pulverizando con agua sobre el área o puede dejarse a la acción natural de la lluvia. Durante o después de la aplicación, el compuesto formulado, si se desea, puede distribuirse mecánicamente en

ES 2 345 559 T3

la tierra, por ejemplo, mediante arado, rastreo con discos, o uso de cadenas de arrastre. La aplicación puede ser antes de plantar, durante la plantación, después de plantar, pero antes de que brote la planta, o después de brotar.

El compuesto de la invención y los procedimientos de control de plagas con los mismos son de valor particular en la protección de cultivos de campo, forrajeros, de plantación, de invernadero, de huerto o de viñedo, de plantas ornamentales, o de árboles de plantación o de bosques, por ejemplo: cereales (tales como trigo o arroz), algodón, verduras (tales como pimientos), cultivos de campo (tales como remolachas azucareras, soja o colza oleaginosa), praderas o cultivos forrajeros (tales como maíz o sorgo), huertos o arboledas (tales como fruta de hueso o pepitas o cítricos), plantas ornamentales, flores o verduras o arbustos bajo cristal o en jardines o parques, o árboles de bosque (tanto caducos como perennes) en bosques, plantaciones o viveros.

También son valiosos en la protección de madera (en pie, de tala, convertida, almacenada o estructural) del ataque, por ejemplo, de moscas de sierra o escarabajos o termitas.

Tienen aplicaciones en la protección de productos almacenados tales como granos, frutas, frutos secos, especias o tabaco, tanto enteros, molidos como combinados en productos, del ataque de palomillas, escarabajos, ácaros o gorgojos del grano. También se protegen productos de animales almacenados tales como pieles, pelo, lana o plumas en forma natural o convertida (por ejemplo, como alfombras o textiles) del ataque de palomillas o escarabajos, además de carne, pescado o granos almacenados del ataque de escarabajos, ácaros o moscas.

Adicionalmente, el compuesto de la invención y los procedimientos de uso de los mismos son de valor particular en el control de artrópodos o helmintos que son perjudiciales para, o se propagan o actúan de vectores de enfermedades de animales domésticos, por ejemplo, aquellos anteriormente mencionados en este documento, y más especialmente en el control de garrapatas, ácaros, piojos, pulgas, mosquillas o moscas mordedoras, molestas o de la miasis. Los compuestos de la invención son particularmente útiles en controlar artrópodos o helmintos que están presentes dentro de animales huésped domésticos o que se alimentan en o sobre la piel o succionan la sangre del animal, para cuyo fin pueden administrarse por vía oral, parenteralmente, percutáneamente o tópicamente.

Las composiciones denominadas en lo sucesivo descritas para la aplicación a cultivos en crecimiento o lugares de crecimiento de cultivos o como un revestimiento de semillas pueden emplearse, en general, alternativamente en la protección de productos almacenados, enseres domésticos, propiedades o áreas del entorno general. Medios adecuados de aplicación de los compuestos de la invención incluyen: a cultivos en crecimiento como sprays foliares (por ejemplo, como un spray en surco), polvos, gránulos, nieblas o espumas o también como suspensiones de composiciones finamente divididas o encapsuladas como tratamiento a la tierra o las raíces por pociones líquidas, polvos, gránulos, humos o espumas; a semillas de cultivos mediante la aplicación como revestimientos de semillas, por ejemplo, por suspensiones líquidas o polvos;

a animales infestados por o expuestos a la infestación por artrópodos o helmintos, por administración parenteral, oral o tópica de composiciones en las que el principio activo presenta una acción inmediata y/o prolongada durante un periodo de tiempo contra los artrópodos o helmintos, por ejemplo, por incorporación en alimentos o formulaciones farmacéuticas adecuadas ingeribles por vía oral, cebos comestibles, piedras de sal, complementos alimenticios, formulaciones de aplicación epicutánea, sprays, baños, inmersiones, duchas, chorros, polvos, grasas, champús, cremas, láminas de cera o sistemas de autotratamiento de ganado;

al entorno en general o a localizaciones específicas en las que las plagas pueden acechar que incluyen productos almacenados, madera, enseres domésticos o locales domésticos o industriales como sprays, nieblas, polvos, humos, láminas de cera, lacas, gránulos o cebos, o en alimentos por goteo a vías fluviales, pozos, depósitos u otra agua corriente o estancada.

Los compuestos de fórmula (I) son particularmente útiles para el control de parásitos de animales cuando se administran por vía oral, y en un aspecto adicionalmente preferido de la invención los compuestos de fórmula (I) se usan para el control de parásitos de animales por administración por vía oral. Los compuestos de fórmula (I) o las sales de los mismos pueden administrarse antes, durante o después de las comidas. Los compuestos de fórmula (I) o las sales de los mismos pueden mezclarse con un soporte y/o producto alimenticio.

El compuesto de fórmula (I) o la sal del mismo se administran por vía oral en una dosis al animal en un intervalo de dosis generalmente de 0,1 a 500 mg/kg del compuesto de fórmula (I) o la sal del mismo por kilogramo de peso corporal del animal (mg/kg).

La frecuencia de tratamiento del animal, preferentemente el animal doméstico que va a tratarse mediante el compuesto de fórmula (I) o la sal del mismo, es generalmente de aproximadamente una vez por semana a aproximadamente una vez por año, preferentemente de aproximadamente una cada dos semanas a una vez cada tres meses.

Los compuestos de la invención pueden administrarse lo más ventajosamente con otro material parasíticamente eficaz tal como un endoparasitícida y/o un ectoparasitícida y/o un endectoparasitícida. Por ejemplo, tales compuestos incluyen lactonas macrocíclicas tales como avermectinas o milbemicinas, por ejemplo, ivermectina, pirantel o un regulador de crecimiento de insectos tal como lufenuron o metopreno.

Los compuestos de fórmula (I) también pueden emplearse para controlar organismos nocivos en cultivos de plantas genéticamente manipuladas conocidas o plantas genéticamente manipuladas que todavía van a desarrollarse. Como regla, las plantas transgénicas se distinguen por propiedades especialmente ventajosas, por ejemplo, por resistencias a agentes de protección de cultivos particulares, resistencias a enfermedades de las plantas o patógenos de enfermedades de las plantas tales como insectos o microorganismos particulares tales como hongos, bacterias o virus. Otras propiedades particulares conciernen, por ejemplo, al material cosechado con respecto a la cantidad, calidad, propiedades de almacenamiento, composición y constituyentes específicos. Por tanto, se conocen plantas transgénicas en las que se aumenta el contenido de almidón o se altera la calidad de almidón, o en las que el material cosechado tiene una composición de ácidos grasos diferente.

Se prefiere el uso en cultivos transgénicos económicamente importantes de plantas útiles y plantas ornamentales, por ejemplo, de cereales tales como trigo, cebada, centeno, avena, mijo, arroz, mandioca y maíz o demás cultivos de remolacha azucarera, algodón, soja, colza oleaginosa, patatas, tomates, guisantes y otros tipos de verduras.

Cuando se usan en cultivos transgénicos, en particular aquellos que tienen resistencias a insectos, frecuentemente se observan efectos, además de los efectos contra organismos nocivos que van a observarse en otros cultivos, que son específicos para la aplicación en el cultivo transgénico en cuestión, por ejemplo, un espectro alterado o específicamente ensanchado de plagas que pueden controlarse, o tasas de aplicación alteradas que pueden emplearse para la aplicación.

Por tanto, la invención también se refiere al uso de compuestos de fórmula (I) para controlar organismos nocivos en plantas de cultivo transgénicas.

Según una característica adicional de la presente invención se proporciona una composición pesticida que comprende uno o más compuestos de la invención como se definen anteriormente en asociación con y preferentemente homogéneamente dispersos en uno o más diluyentes o soportes compatibles pesticidamente aceptables y/o agentes tensioactivos [es decir, diluyentes o soportes y/o agentes tensioactivos del tipo generalmente aceptado en la técnica como que son adecuados para uso en composiciones pesticidas y que son compatibles con compuestos de la invención].

En la práctica, los compuestos de la invención forman lo más frecuentemente partes de composiciones. Estas composiciones pueden emplearse para controlar artrópodos, especialmente insectos, o nematodos de las plantas o ácaros. Las composiciones pueden ser de cualquier tipo conocido en la técnica adecuado para la aplicación a la plaga deseada en cualquier local o área interior o exterior. Estas composiciones contienen al menos un compuesto de la invención como principio activo en combinación o asociación con uno o varios componentes compatibles que son, por ejemplo, soportes o diluyentes sólidos o líquidos, adyuvantes, agentes tensioactivos o similares apropiados para el uso previsto y que son agronómicamente o médicamente aceptables. Estas composiciones, que pueden prepararse por cualquier modo conocido en la técnica, forman asimismo una parte de esta invención.

Los compuestos de la invención, en sus formulaciones comercialmente disponibles y en las formas de uso preparadas a partir de estas formulaciones, pueden estar presentes en mezclas con otras sustancias activas tales como insecticidas, atrayentes, esterilizantes, acaricidas, nematicidas, fungicidas, sustancias reguladoras del crecimiento o herbicidas.

Los pesticidas incluyen, por ejemplo, ésteres fosfóricos, carbamatos, ésteres carboxílicos, formamidinas, compuestos de estaño y materiales producidos por microorganismos.

Los componentes preferidos en mezclas son:

1. del grupo de los compuestos del fósforo

acefato, azametifos, azinfos-etilo, azinfos-metilo, bromofos, bromofosetilo, cadusafos (F-67825), clorotifos, clorfenvinfos, clormefos, clorpirifos, clorpirifos-metilo, demeton, demeton-S-metilo, demeton-S-metilsulfona, dialifos, diazinon, diclorvos, dicrotofos, dimetoato, disulfoton, EPN, etion, etoprofos, etrimfos, famfur, fenamifos, fenitrotion, fensulfotión, fention, flupirazofos, fonofos, formotion, fostiazato, heptenofos, isazofos, isotioato, isoxation, malation, metacrifos, metamidofos, metidation, salition, mevinfos, monocrotofos, naled, ometoato, oxidemeton-metilo, paration, paration-metilo, fentoato, forato, fosalona, fosfolan, fosfocarb (BAS-301), fosmet, fosfamidon, foxim, pirimifos, pirimifos-etilo, pirimifos-metilo, profenofos, propafos, proetamfos, protiofos, piraclofos, piridafention, quinalfos, sulprofos, temefos, terbufos, tebutirimfos, tetraclovinfos, tiometon, triazofos, triclorfon, vamidotion;

2. del grupo de los carbamatos

alanicarb (OK-135), aldicarb, 2-sec-butilfenilmetilcarbamato (BPMC), carbarilo, carbofurano, carbosulfan, cloetocarb, benfuracarb, etiofencarb, furatiocarb, HCN-801, isoprocarb, metomilo, 5-metil-m-cumenilbutiril(metil)carbamato, oxamilo, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, 1-metiltio(etilidenamino)-N-metil-N-(morfolinotio)carbamato (UC 51717), triazamato;

ES 2 345 559 T3

3. del grupo de los ésteres carboxílicos

acrinatrina, aletrina, alfametrina, (E)-(1R)-cis-2,2-dimetil-3-(2-oxotiolan-3-ilidenmetil)ciclopropanocarboxilato de 5-bencil-3-furilmetilo, beta-ciflutrina, alfa-cipermetrina, beta-cipermetrina, bioaletrina, (isómero (S)-ciclopentilo de) bioaletrina, bioresmetrina, bifentrina, (1RS)-trans-3-(4-terc-butilfenil)-2,2-dimetilciclopropanocarboxilato de (RS)-1-ciano-1-(6-fenoxi-2-piridil)metilo (NCI 85193), cicloprotrina, ciflutrina, cihalotrina, cititrina, cipermetrina, cifenotrina, deltametrina, empentrina, esfenvalerato, fenflutrina, fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flumetrina, fluvalinato (isómero D), imiprotrina (S-41311), lambda-cihalotrina, permetrina, fenotrina (isómero [®]), praletrina, piretrinas (productos naturales), resmetrina, teflutrina, tetrametrina, teta-cipermetrina, tralometrina, transflutrina, zeta-cipermetrina (F-56701);

4. del grupo de las amidinas

amitraz, clordimeform;

5. del grupo de los compuestos de estaño

cihexatina, óxido de fenbutatina;

6. otros

abamectina, ABG-9008, acetamiprid, acequinocilo, Anagrapha falcitera, AKD-1022, AKD-3059, ANS-118, azadiractina, Bacillus thuringiensis, Beauveria bassiana, bensultap, bifenazato, binapacril, BJI-932, bromopropilato, BTG-504, BTG-505, buprofezina, camfecloro, cartap, clorobencilato, clorfenapir, clorflua-zuron, 2-(4-clorofenil)-4,5-difeniltiofeno (UBI-T 930), clorfentezina, clorproxifeno, cromafenozida, clotia-nidina, ciclopropanocarboxilato de 2-naftilmetilo (Ro12-0470), ciromazina, diaclofen (tiametoxam), dia-fentiuron, DBI-3204, 2-cloro-N-(3,5-dicloro-4-(1,1,2,3,3,3-hexafluoro-1-propiloxi)fenil)carbamoil)-2-car-boximidato de etilo, DDT, dicofol, diflubenzuron, N-(2,3-dihidro-3-metil-1,3-tiazol-2-ilidene)-2,4-xilidina, dihidroximetildihidroxipirrolidina, dinobuton, dinocap, diofenolan, benzoato de emamectina, endosulfan, etiprol (sulfetiprol), etofenprox, etoxazol, fenazaquin, fenoxicarb, fipronilo, flonicamid (IKI-220), fluazu-ron, flumita (flufenzina, SZI-121), éter 2-fluoro-5-(4-(4-etoxifenil)-4-metil-1-pentil)difenílico (MTI 800), virus de la granulosis y poliedrosis nuclear, fenpiroximato, fentiocarb, fluacripirim, flubencimina, flubro-citrinato, flucicloxuron, flufenoxuron, flufenzina, flufenprox, fluproxifeno, gamma-HCH, halfenozida, ha-lofenprox, hexaflumuron (DE_473), hexitiazox, HOI-9004, hidrametilnona (AC 217300), indoxacarb, iver-mectina, L-14165, imidacloprid, indoxacarb (DPX-MP062), kanemita (AKD-2023), lufenuron, M-020, M-020, metoxifenozida, milbemectina, NC-196, neemgard, nidinoterfuran, nitenpiram, 2-nitrometil-4,5-dihi-dro-6H-tiazina (DS 52618), 2-nitrometil-3,4-dihidrotiazol (SD 35651), 2-nitrometilen-1,2-tiazinan-3-ilcar-bamalaldehído (WL 108477), novaluron, piridarilo, propargita, protirifenbuto, pimetrozina, piridaben, piri-midifeno, piriproxifeno, NC-196, NC-1111, NNI-9768, novaluron (MCW-275), OK-9701, OK-9601, OK-9602, OK-9802, R-195, RH-0345, RH-2485, RYI-210, S-1283, S-1833, SI-8601, silafluofen, silomadina (CG-177), espinosad, espirodiclofeno, espiromesifeno, SU-9118, tebufenozida, tebufenpirad, teflubenzu-ron, tetradifon, tetrasul, tiacloprid, tiociclam, tiametoxam, tolfenpirad, triazamato, trietoxiespinosina A, triflumuron, verbutina, vertalec (mycotol), YI-5301.

Ejemplos de asociados de mezcla fungicidas adecuados pueden seleccionarse en la siguiente lista: aldimorf, ami-bromdol, ampropilfos-potasio, andoprim, anilazina, azaconazol, azoxistrobina, benalaxilo, benodanilo, benomilo, ben-tiavalicarb, benzamacrilo, benzamacrilo-isobutilo, bialafos, binapacril, bifenilo, bitertanol, blasticidina-S, boscalid, bromuconazol, bupirimato, butiobato, polisulfuro de calcio, capsimicina, captafol, captan, carbendazim, carboxina, carpropamida, carvona, quinometionato, clobentiazona, clorfenazol, cloroneb, cloropicrina, clorotalonilo, clozolina-to, clozilacón, cufraneb, ciazofamida, ciflufenamida, cimoxanilo, ciproconazol, ciprodinilo, ciprofuram, debacarb, diclorofeno, diclobutrazol, diclocimet, diclofluanida, diclomezina, dicloran, dietofencarb, difenoconazol, diflume-to-rim, dimetirimol, dimetomorf, dimoxistrobina, diniconazol, diniconazol-M, dinocap, difenilamina, dipirition, dita-limfos, ditianon, dodemorf, dodina, drazoxolon, edifenfos, epoxiconazol, etaconazol, etaboxam, etirimol, etridiazol, famoxadona, fenamidona, fenapanilo, fenarimol, fenbuconazol, fenfuram, fenhexamida, fenitropan, fenoxanilo; fen-piclonilo, fenpropidina, fenpropimorf, acetato de fentina, hidróxido de fentina, ferbam, ferimzona, fluazinam, flu-dioxonilo, flumetover, flumorf; fluoromida, fluopicolida, fluorofolpet, fluoxastrobina, fluquinconazol, flurprimidol, flusilazol, flusulfamida, flutolanilo, flutriafol, folpet, fosetil-aluminio, fosetil-sodio, ftalida, fuberidazol, furalaxilo, furametpir, furcarbonilo, furconazol, furconazol-cis, furmeciclox, guazatina, hexaclorobenceno, hexaconazol, hime-xazol, imazalilo, imibenconazol, iminocadina, albesilato de iminocadina, triacetato de iminocadina, yodocarb, ip-conazol, iprobenfos (IBP), iprodiona, iprovalicarb, irumamicina, isoprotiolano, isovalediona, kasugamicina, kreso-xim-metilo, preparaciones de cobre tales como: hidróxido de cobre, naftenato de cobre, oxiclورو de cobre, sul-fato de cobre, óxido de cobre, oxina-cobre y mezcla de Burdeos, mancozeb, maneb, meferimzona, me-panipirim, mepronilo, metalaxilo-M, metconazol, metasulfocarb, metfuroxam, metiram, metomeclam, metominos-trobina, metrafenona, metsulfovax, mildiomicina, miclobutanilo, miclozolin, dimetilditiocarbamato de níquel, ni-trotal-isopropilo, nuarimol, ofurace, orisastrobina; oxadixilo, oxamocarb, ácido oxolínico, oxpoconazol, oxicarbo-xina, oxifentina, paclobutrazol, pefurazoato, penconazol, pencicuron, fosdifeno, ftalida, pimaricina, piperalina, pi-coxistrobina, polioxina, polioxorim, probenazol, procloraz, procimidona, propamocarb, propanosina-sodio, propi-conazol, propineb, proquinazid, protioconazol, piraclostrobina, pirazofos, pirifenox, pirimetanilo, piroquilon, piro-xifur, quinconazol, quinoxifeno; quintozeno (PCNB), siltiofam, simeconazol, espiroxamina, azufre y preparacio-

nes de azufre, tebuconazol, tecloftalam, tecnazeno, tetciclacis, tetraconazol, tiabendazol, ticiofeno, tifulzamida, tiofanato-metilo, tiram, tiadinilo, tioximid, tolclifos-metilo, tolilfluanida, triadimefon, triadimenol, triazbutilo, triazóxido, triclámida, triciclazol, tridemorf, trifloxistrobina, triflumizol, triforina, triticonazol, uniconazol, validamicina A, vinclozolina, viniconazol, zarilamida, zineb, ziram, zoxamida y también Dagger G, OK-8705, OK-8801, N-(3-etil-3,5,5-trimetil-ciclohexil)-3-formilamino-2-hidroxi-benzamida; N-(6-metoxi-3-piridinil)-ciclopropanocarboxamida; 1-(1-naftalenil)-1H-pirrol-2,5-diona; 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)-piridina; 2-amino-4-metil-N-fenil-5-tiazolcarboxamida; 2-cloro-N-(2,3-dihidro-1,1,3-trimetil-1H-inden-4-il)-3-piridincarboxamida, N-(4-clorofenil)-N-etil-4-metil-2-nitrobenzenosulfonamida, N-{2-[3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il]etil}-2-(trifluorometil)benzamida; N-(3',4'-dicloro-5-fluorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida; 1-metil-N-[3-(4-metilfenil)-2-tienil]-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-carboxamida; 3,4-dicloro-N-(2-cianofenil)isotiazol-5-carboxamida; 4-cloro-alfa-propinilo-N-[2-[3-metoxi-4-(2-propinilo)fenil]etil]-bencenoacetamida; 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina.

Los componentes anteriormente mencionados para combinaciones son sustancias activas conocidas muchas de las cuales se describen en Ch. R Worthing, S.B. Walker, The Pesticide Manual, 12ª edición, British Crop Protection Council, Famham 2000.

Las dosis de uso eficaces de los compuestos empleados en la invención pueden variar dentro de amplios límites, particularmente dependiendo de la naturaleza de la plaga que va a eliminarse o el grado de infestación, por ejemplo, de cultivos con estas plagas. En general, las composiciones según la invención contienen normalmente aproximadamente del 0,05 a aproximadamente el 95% (en peso) de uno o más principios activos según la invención, aproximadamente del 1 a aproximadamente el 95% de uno o más soportes sólidos o líquidos y, opcionalmente, aproximadamente del 0,1 a aproximadamente el 50% de uno o varios componentes compatibles tales como agentes tensioactivos o similares. En la presente versión, el término “soporte” denota un componente orgánico o inorgánico, natural o sintético, con el que el principio activo se combina para facilitar su aplicación, por ejemplo, a la planta, a semillas o a la tierra. Este soporte es, por tanto, generalmente inerte y debe ser aceptable (por ejemplo, agronómicamente aceptable, particularmente para la planta tratada).

El soporte puede ser un sólido, por ejemplo, arcillas, silicatos naturales o sintéticos, sílices, resinas, ceras, fertilizantes sólidos (por ejemplo, sales de amonio), minerales naturales molidos tales como caolines, arcillas, talco, tiza, cuarzo, atapulgita, montmorillonita, bentonita o tierra de diatomeas, o minerales sintéticos molidos tales como sílices, alúmina o silicatos, especialmente silicatos de aluminio o de magnesio. Como soportes sólidos para gránulos son adecuados los siguientes: rocas naturales machacadas o fraccionadas tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita y dolomita; gránulos sintéticos de harinas inorgánicas u orgánicas; gránulos de material orgánico tales como serrín, cáscaras de coco, mazorcas de maíz, cascarrillas de maíz o tallos de tabaco; tierra de infusorios, trifosfato de calcio, corcho en polvo o negro de carbón absorbente; polímeros solubles en agua, resinas, ceras; o fertilizantes sólidos. Tales composiciones sólidas pueden contener, si se desea, uno o más agentes humectantes, dispersantes, emulsionantes o colorantes compatibles que, cuando son sólidos, también pueden servir de diluyente.

El soporte también puede ser líquido, por ejemplo: agua; alcoholes, particularmente butanol o glicol, además de sus éteres o ésteres, particularmente acetato de metilglicol; cetonas, particularmente acetona, ciclohexanona, metiletilcetona, metilisobutilcetona o isoforona; fracciones de petróleo tales como hidrocarburos parafínicos o aromáticos, particularmente xilenos o alquilnaftalenos; aceites minerales o vegetales; hidrocarburos clorados alifáticos, particularmente tricloroetano o cloruro de metileno; hidrocarburos clorados aromáticos, particularmente clorobencenos; disolventes solubles en agua o fuertemente polares tales como dimetilformamida, dimetilsulfóxido o N-metilpirrolidona; gases licuados; o similares o una mezcla de los mismos.

El agente tensioactivo puede ser un agente emulsionante, agente dispersante o agente humectante del tipo iónico o no iónico o una mezcla de tales agentes tensioactivos. Entre éstos están, por ejemplo, sales de ácidos poliacrílicos, sales de ácidos lignosulfónicos, sales de ácidos fenolsulfónicos o naftalenosulfónicos, policondensados de óxido de etileno con alcoholes grasos o ácidos grasos o ésteres grasos o aminas grasas, fenoles sustituidos (particularmente alquilfenoles o arilfenoles), sales de ésteres de ácido sulfosuccínico, derivados de taurina (particularmente alquiltauratos), ésteres fosfóricos de alcoholes o de policondensados de óxido de etileno con fenoles, ésteres de ácidos grasos con polioles, o derivados funcionales de sulfato, sulfonato o fosfato de los compuestos anteriores. La presencia de al menos un agente tensioactivo es generalmente esencial cuando el principio activo y/o el soporte inerte son sólo ligeramente solubles en agua o no son solubles en agua y el agente de soporte de la composición para la aplicación es agua. Las composiciones de la invención pueden contener adicionalmente otros aditivos tales como adhesivos o colorantes. En las formulaciones pueden usarse adhesivos tales como carboximetilcelulosa o polímeros naturales o sintéticos en forma de polvos, gránulos o látex tales como goma arábiga, poli(alcohol vinílico) o poli(acetato de vinilo), fosfolípidos naturales tales como cefalinas o lecitinas, o fosfolípidos sintéticos. Es posible usar colorantes tales como pigmentos inorgánicos, por ejemplo: óxidos de hierro, óxidos de titanio o azul de Prusia; colorantes orgánicos tales como colorantes de alizarina, colorantes azoicos o colorantes de ftalocianina metálica; u oligoelementos tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno o cinc.

Por tanto, para su aplicación agrícola, los compuestos de la invención están generalmente en forma de composiciones que están en diversas formas sólidas o líquidas. Las formas sólidas de las composiciones que pueden usarse son polvos para extender (con un contenido del compuesto de la invención que oscila hasta el 80%), polvos o gránulos

humectables (incluyendo gránulos dispersables en agua), particularmente aquellos obtenidos por extrusión, compactación, impregnación de un soporte granular o granulación a partir de un polvo (estando el contenido del compuesto de la invención en estos polvos o gránulos humectables entre aproximadamente el 0,5 y aproximadamente el 80%). Las composiciones homogéneas o heterogéneas sólidas que contienen uno o más compuestos de la invención, por ejemplo, gránulos, pellets, briquetas o cápsulas pueden usarse para tratar agua estancada o corriente durante un periodo de tiempo. Puede lograrse un efecto similar usando alimentos por goteo o intermitentes de concentrados dispersables en agua como se describen en este documento.

Las composiciones líquidas incluyen, por ejemplo, disoluciones o suspensiones acuosas o no acuosas (tales como concentrados emulsionables, emulsiones, fluidos, dispersiones o disoluciones) o aerosoles. Las composiciones líquidas también incluyen, en particular, concentrados emulsionables, dispersiones, emulsiones, fluidos, aerosoles, polvos humectables (o polvo para pulverizar), fluidos secos o pastas como formas de composiciones que son líquidas o previstas para formar composiciones líquidas cuando se aplican, por ejemplo, como sprays acuosos (incluyendo volumen bajo y ultra-bajo) o como nieblas o aerosoles.

Las composiciones líquidas, por ejemplo, en forma de concentrados emulsionables o solubles comprenden lo más frecuentemente de aproximadamente el 5 a aproximadamente el 80% en peso del principio activo, mientras que las emulsiones o disoluciones que están listas para aplicación contienen, en su caso, de aproximadamente el 0,01 a aproximadamente el 20% del principio activo. Además del disolvente, los concentrados emulsionables o solubles pueden contener, según se requiera, aproximadamente del 2 a aproximadamente el 50% de aditivos adecuados tales como estabilizadores, agentes tensioactivos, agentes penetrantes, inhibidores de la corrosión, colorantes o adhesivos. Las emulsiones de cualquier concentración requerida, que son particularmente adecuadas para aplicación, por ejemplo, a las plantas, pueden obtenerse a partir de estos concentrados mediante dilución con agua. Estas composiciones están incluidas dentro del alcance de las composiciones que pueden emplearse en la presente invención. Las emulsiones pueden estar en forma del tipo agua en aceite o aceite en agua y pueden tener una consistencia espesa.

Las composiciones líquidas de esta invención pueden usarse, además de en aplicaciones de uso agrícola normal, por ejemplo, para tratar sustratos o sitios infestados o que es probable que se infesten por artrópodos (u otras plagas controladas por compuestos de esta invención) que incluyen locales, áreas de almacenamiento o procesamiento interiores o exteriores, recipientes o equipos o agua estancada o corriente.

Todas estas dispersiones acuosas o emulsiones o mezclas de pulverización pueden aplicarse, por ejemplo, a cultivos mediante cualquier medio adecuado, principalmente por pulverización, a tasas que son generalmente del orden de aproximadamente 100 a aproximadamente 1.200 litros de mezcla de pulverización por hectárea, pero pueden ser superiores o inferiores (por ejemplo, volumen bajo o ultra-bajo) dependiendo de la necesidad o técnica de aplicación. El compuesto o las composiciones según la invención se aplican convenientemente a la vegetación y en particular a raíces u hojas que tienen plagas que van a eliminarse. Otro procedimiento de aplicación de los compuestos o las composiciones según la invención es por quimigación, es decir, la adición de una formulación que contiene el principio activo al agua de irrigación. Esta irrigación puede ser irrigación por aspersores para pesticidas foliares o puede ser irrigación a la tierra o irrigación subterránea para tierra o para pesticidas sistémicos.

Las suspensiones concentradas que pueden aplicarse por pulverización se preparan de manera que se produzca un producto fluido estable que no precipita (molienda fina) y normalmente contienen de aproximadamente el 10 a aproximadamente el 75% en peso de principio activo, de aproximadamente el 0,5 a aproximadamente el 30% de agentes tensioactivos, de aproximadamente el 0,1 a aproximadamente el 10% de agentes tixotrópicos, de aproximadamente el 0 a aproximadamente el 30% de aditivos adecuados tales como agentes antiespumantes, inhibidores de la corrosión, estabilizadores, agentes penetrantes, adhesivos y, como soporte, agua o un líquido orgánico en el que el principio activo es escasamente soluble o insoluble. Algunos sólidos orgánicos o sales inorgánicas pueden disolverse en el soporte para ayudar a prevenir la precipitación o como anticongelante para el agua.

Los polvos humectables (o polvo para pulverización) se preparan normalmente de manera que contengan de aproximadamente el 10 a aproximadamente el 80% en peso de principio activo, de aproximadamente el 20 a aproximadamente el 90% de un soporte sólido, de aproximadamente el 0 a aproximadamente el 5% de un agente humectante, de aproximadamente el 3 a aproximadamente el 10% de un agente dispersante y, cuando sea necesario, de aproximadamente el 0 a aproximadamente el 80% de uno o más estabilizadores y/u otros aditivos tales como agentes penetrantes, adhesivos, agentes antiaglomerantes, colorantes o similares. Para obtener estos polvos humectables, el principio activo se mezcla meticulosamente en una mezcladora adecuada con sustancias adicionales que pueden impregnarse en la carga porosa y se muele usando un molino u otro molinillo adecuado. Esto produce polvos humectables cuya humectabilidad y suspensibilidad son ventajosas. Pueden suspenderse en agua para dar cualquier concentración deseada y esta suspensión puede emplearse muy ventajosamente en particular para la aplicación al follaje de plantas.

Los "gránulos dispersables en agua (GDA)" (gránulos que son fácilmente dispersables en agua) tienen composiciones que son sustancialmente próximas a las de los polvos humectables. Pueden prepararse mediante granulación de las formulaciones descritas para los polvos humectables, tanto por una vía húmeda (poniendo en contacto el principio activo finamente dividido con la carga inerte y un poco de agua, por ejemplo del 1 al 20% en peso, o con una disolución acuosa de un agente dispersante o aglutinante, seguido de secado y cribado) como por una vía seca (compactación seguida de molienda y cribado).

ES 2 345 559 T3

Las tasas y concentraciones de composiciones formuladas pueden variar según el procedimiento de aplicación o la naturaleza de las composiciones o uso de las mismas. En términos generales, las composiciones para aplicación para controlar plagas de artrópodos o de nematodos de las plantas contienen normalmente de aproximadamente el 0,00001% a aproximadamente el 95%, más particularmente de aproximadamente el 0,0005% a aproximadamente el 50% en peso de uno o más compuestos de la invención, o de principios activos totales (es decir, los compuestos de la invención, junto con otras sustancias tóxicas para artrópodos o nematodos de las plantas, sinergistas, oligoelementos o estabilizadores). Las composiciones reales empleadas y su tasa de aplicación se seleccionará para lograr el (los) efecto(s) deseado(s) por el granjero, productor de ganado, médico o veterinario, operario de control de plagas u otra persona experta en la técnica.

Las composiciones sólidas o líquidas para aplicación tópica a animales, madera, productos almacenados o enseres domésticos normalmente contienen de aproximadamente el 0,00005% a aproximadamente el 90%, más particularmente de aproximadamente el 0,001% a aproximadamente el 10% en peso de uno o más compuestos de la invención. Para administración a animales por vía oral o parenteralmente, que incluye composiciones percutáneamente sólidas o líquidas, éstos contienen normalmente de aproximadamente el 0,1% a aproximadamente el 90% en peso de uno o más compuestos de la invención. Los piensos medicados contienen normalmente de aproximadamente el 0,001% a aproximadamente el 3% en peso de uno o más compuestos de la invención. Los concentrados o complementos para mezclar con piensos normalmente contienen de aproximadamente el 5% a aproximadamente el 90%, preferentemente de aproximadamente el 5% a aproximadamente el 50% en peso de uno o más compuestos de la invención. Las piedras de sal minerales normalmente contienen de aproximadamente el 0,1% a aproximadamente el 10% en peso de uno o más compuestos de fórmula (I) o sales pesticidamente aceptables de los mismos.

Los polvos o composiciones líquidas para aplicación a ganado, enseres, locales o áreas exteriores pueden contener de aproximadamente el 0,0001% a aproximadamente el 15%, más especialmente de aproximadamente el 0,005% a aproximadamente el 2,0%, en peso de uno o más compuestos de la invención. Las concentraciones adecuadas en aguas tratadas están entre aproximadamente 0,0001 ppm y aproximadamente 20 ppm, más particularmente de aproximadamente 0,001 ppm a aproximadamente 5,0 ppm de uno o más compuestos de la invención y pueden usarse terapéuticamente en piscicultura con tiempos de exposición apropiados. Los cebos comestibles pueden contener de aproximadamente el 0,01% a aproximadamente el 5%, preferentemente de aproximadamente el 0,01% a aproximadamente el 1,0% en peso, de uno o más compuestos de la invención.

Cuando se administran a vertebrados parenteralmente, por vía oral o percutánea u otros medios, la dosificación de los compuestos de la invención dependerá de la especie, edad o salud del vertebrado y de la naturaleza y grado de su infestación real o potencial por plagas de artrópodos o helmintos. Una dosis única de aproximadamente 0,1 a aproximadamente 100 mg, preferentemente de aproximadamente 2,0 a aproximadamente 20,0 mg por kg de peso corporal del animal o dosis de aproximadamente 0,01 a aproximadamente 20,0 mg, preferentemente de aproximadamente 0,1 a aproximadamente 5,0 mg por kg peso corporal del animal por día, para medicación sostenida, son generalmente adecuadas para administración por vía oral o parenteral. Usando formulaciones o dispositivos de liberación sostenida, las dosis diarias requeridas durante un periodo de meses pueden combinarse y administrarse a animales en una única ocasión.

Los siguientes Ejemplos 2A-2M de composición ilustran composiciones para uso contra artrópodos, especialmente ácaros o insectos, o nematodos de las plantas, que comprenden como principio activo compuestos de la invención tales como aquellos descritos en los ejemplos preparativos. Las composiciones descritas en los ejemplos 2A-2M pueden diluirse cada una para dar una composición pulverizable a concentraciones adecuadas para uso en el campo. Las descripciones químicas genéricas de los componentes (para los cuales todos los siguientes porcentajes son en porcentaje en peso) usados en los Ejemplos 2A-2M de composición ejemplificados más adelante son del siguiente modo:

Nombre comercial	Descripción química
Ethylan BCP	Condensados de nonilfenol-óxido de etileno
Soprophor BSU	Condensados de triestirilfenol-óxido de etileno
Arylan CA	Disolución al 70% en p/v de dodecilbencenosulfonato de calcio
Solvesso 150	Disolvente aromático C ₁₀ ligero
Arylan S	Dodecilbencenosulfonato de sodio
Darvan NO ₂	Lignosulfonato de sodio
Celite PF	Soporte de silicato de magnesio sintético
Sopropon T36	Sales de sodio de ácidos policarboxílicos
Rhodigel 23	Polisacárido goma xantana
Bentone 38	Derivado orgánico de montmorillonita de magnesio
Aerosil	Dióxido de silicio microfino

ES 2 345 559 T3

Ejemplo 2A

Un concentrado soluble en agua se prepara con la composición del siguiente modo:

5	Principio activo	7%
	Ethylan BCP	10%
10	N-metilpirrolidona	83%

A una disolución de Ethylan BCP disuelta en una parte de N-metilpirrolidona se añade el principio activo con calentamiento y agitación hasta que se disuelva. La disolución resultante se enrasa con el resto del disolvente.

15 Ejemplo 2B

Un concentrado emulsionable (CE) se prepara con la composición del siguiente modo:

20	Principio activo	25%(máx)
	Soprophor BSU	10%
	Arylan CA	5%
25	N-metilpirrolidona	50%
	Solvesso 150	10%

30 Los tres primeros componentes se disuelven en N-metilpirrolidona y a ésta se añade entonces Solvesso 150 para dar el volumen final.

Ejemplo 2C

35 Un polvo humectable (PH) se prepara con la composición del siguiente modo:

	Principio activo	40%
40	Arylan S	2%
	Darvan NO ₂	5%
	Celite PF	53%

45 Los componentes se mezclan y se muelen en un molino de martillos para dar un polvo con un tamaño de partícula inferior a 50 micrómetros.

50 Ejemplo 2D

Una formulación fluida acuosa se prepara con la composición del siguiente modo:

55	Principio activo	40,00%
	Ethylan BCP	1,00%
	Sopropon T360	0,20%
60	Etilenglicol	5,00%
	Rhodigel 230	0,15%
	Agua	53,65%

65 Los componentes se mezclan íntimamente y se muelen en un molino de perlas hasta que se obtiene un tamaño medio de partícula inferior a 3 micrómetros.

ES 2 345 559 T3

Ejemplo 2E

Un concentrado en suspensión emulsionable se prepara con la composición del siguiente modo:

5	Principio activo	30,0%
	Ethylan BCP	10,0%
	Bentone 38	0,5%
10	Solvesso 150	59,5%

15 Los componentes se mezclan íntimamente y se muelen en un molino de perlas hasta que se obtiene un tamaño medio de partícula inferior a 3 micrómetros.

Ejemplo 2F

20 Un gránulo dispersable en agua se prepara con la composición del siguiente modo:

	Principio activo	30%
	Darvan No 2	15%
25	Arylan S	8%
	Celite PF	47%

30 Los componentes se mezclan, se micronizan en un molino de energía fluida y luego se granulan en un peletizador giratorio pulverizando con agua (hasta el 10%). Los gránulos resultantes se secan en un secador de lecho fluidizado para eliminar el agua en exceso.

35 Ejemplo 2G

Un polvo para extender se prepara con la composición del siguiente modo:

40	Principio activo	1 al 10%
	Polvo de talco superfino	99 al 90%

45 Los componentes se mezclan íntimamente y adicionalmente se muelen según sea necesario para lograr un polvo fino. Este polvo puede aplicarse a un lugar de infestación por artrópodos, por ejemplo vertederos, productos almacenados o enseres domésticos o animales infestados por o en riesgo de infestación por artrópodos para controlar los artrópodos por ingestión oral. Medios adecuados para distribuir el polvo para extender al lugar de infestación por artrópodos incluyen calefactores mecánicos, agitadores manuales o dispositivos de autotratamiento de ganado.

50

Ejemplo 2H

Un cebo comestible se prepara con la composición del siguiente modo:

55	Principio activo	0,1 al 1,0%
	Harina de trigo	80%
60	Melaza	19,9 al 19%

Los componentes se mezclan íntimamente y se forman según se requiera en una forma de cebo. Este cebo comestible puede distribuirse en un lugar, por ejemplo, locales domésticos o industriales, por ejemplo cocinas, hospitales o tiendas, o áreas exteriores infestadas por artrópodos, por ejemplo hormigas, langostas, cucarachas o moscas, para controlar los artrópodos por ingestión por vía oral.

65

ES 2 345 559 T3

Ejemplo 2I

Una formulación en disolución se prepara con una composición del siguiente modo:

5	Principio activo	15%
	Dimetilsulfóxido	85%

10 El principio activo se disuelve en dimetilsulfóxido con mezclado y o calentamiento según se requiera. Esta disolución puede aplicarse percutáneamente como una aplicación epicutánea a animales domésticos infestados por artrópodos o, después de esterilización, por filtración a través de una membrana de politetrafluoroetileno (tamaño de poro de 0,22 micrómetros), por inyección parenteral a una tasa de aplicación de 1,2 a 12 ml de disolución por 100 kg de peso corporal del animal.

15

Ejemplo 2J

Un polvo humectable se prepara con la composición del siguiente modo:

20	Principio activo	50%
	Ethylan BCP	5%
25	Aerosil	5%
	Celite PF	40%

30 El Ethylan BCP se absorbe sobre el Aerosil que entonces se mezcla con los otros componentes y se muele en un molino de martillos para dar un polvo humectable que puede diluirse con agua a una concentración del 0,001% al 2% en peso del compuesto activo y aplicarse a un lugar de infestación por artrópodos, por ejemplo, larvas dípteras o nematodos de las plantas, por pulverización o a animales domésticos infestados por o en riesgo de infección por artrópodos, por pulverización o inmersión, o por administración por vía oral en agua potable para controlar los artrópodos.

35

Ejemplo 2K

Una composición en bolo de liberación lenta se forma a partir de gránulos que contienen los siguientes componentes en porcentajes variables (similares a los descritos para las composiciones previas) dependiendo de la necesidad:

40	Principio activo
	Agente de densidad
	Agente de liberación lenta
45	Aglutinante

50 Los componentes íntimamente mezclados se forman en gránulos que se comprimen en un bolo con una gravedad específica de 2 o más. Éste puede administrarse por vía oral a animales domésticos rumiantes para la retención dentro del retículo-rumen para dar una liberación lenta continua del compuesto activo durante un periodo de tiempo prolongado para controlar la infestación de los animales domésticos rumiantes por artrópodos.

Ejemplo 2L

55

Una composición de liberación lenta en forma de gránulos, pellets, briquetas o similares puede prepararse con composiciones del siguiente modo:

60	Principio activo	0,5 al 25%
	Poli(cloruro de vinilo)	75 al 99,5%
	ftalato de dioctilo (plastificante)	

65

Los componentes se mezclan y luego se forman en formas adecuadas por extrusión por fusión o moldeo. Estas composiciones son útiles, por ejemplo, para la adición a agua estancada o para la fabricación en collares o marcas de orejas para la unión a animales domésticos para controlar plagas por liberación lenta.

ES 2 345 559 T3

Ejemplo 2M

Un gránulo dispersable en agua se prepara con la composición del siguiente modo:

5	Principio activo	85%(máx)
	Polivinilpirrolidona	5%
10	Arcilla de atapulgita	6%
	Laurilsulfato de sodio	2%
	Glicerina	2%

15 Los componentes se mezclan como una suspensión al 45% con agua y se muelen en húmedo hasta un tamaño de partícula de 4 micrómetros, luego se secan por pulverización para eliminar el agua.

20 Procedimientos de uso pesticida

El siguiente procedimiento de prueba representativo, usando compuestos de la invención, se realizó para determinar la actividad parasítica de los compuestos de la invención.

25 Ejemplos biológicos

Procedimiento A

30 *Procedimiento de cribado para probar la sistemicidad de compuestos contra Ctenocephalides felis (pulgas de los gatos)*

Un recipiente de prueba se llenó con 10 adultos de *Ctenocephalides felis*. Un cilindro de vidrio se cerró en un extremo con parafilm y se colocó sobre la parte superior del recipiente de prueba. Entonces, la disolución del compuesto de prueba se pipeteó en sangre bovina y se añadió al cilindro de vidrio. Las *Ctenocephalides felis* tratadas se mantuvieron en este ensayo de perro artificial (sangre a 37°C, 40-60% de humedad relativa; *Ctenocephalides felis* 20-22°C, 40-60% de humedad relativa) y la evaluación se realizó a 24 y 48 horas después de la aplicación. El compuesto 1-26, 2-50, 2-81, 2-87, 3-50, 4-03, 4-51, 5-13, 5-46, 5-49, 5-52, 5-55, 5-67, 5-70, 5-73, 5-79, 8-15, 8-63, 9-42, 10-03 dio al menos el 90% de control de *Ctenocephalides felis* a una concentración de prueba de 5 ppm o menos.

40 Procedimiento B

45 *Procedimiento de cribado para probar la actividad de contacto de compuestos contra Ctenocephalides felis (pulgas de los gatos)*

Las disoluciones de los compuestos de prueba se añadieron gota a gota sobre papel de filtro, se secaron y el papel de filtro se colocó en tubos de ensayo y se infestó con 10 adultos de *Ctenocephalides felis*. Las *Ctenocephalides felis* tratadas se mantuvieron en una cámara climática (26°C, 80% de HR) y la eficacia en porcentaje se evaluó 24 horas y 48 horas después de la aplicación en comparación con el control sin tratar.

50 Los compuestos de la invención dieron un control de contacto útil de *Ctenocephalides felis* a una concentración de prueba de 1000 ppm.

55 Procedimiento C

Procedimiento de cribado para probar la actividad de contacto contra Rhipicephalus sanguineus (garrapata marrón de perro)

60 Las disoluciones de los compuestos de prueba se añadieron gota a gota sobre papel de filtro, se secaron y el papel de filtro se colocó en tubos de ensayo y se infestó con 20-30 larvas (L1) de *Rhipicephalus sanguineus* y los tubos se cerraron con un clip. La *Rhipicephalus sanguineus* tratada se mantuvo en una cámara climática (25°C, 90% de HR) y la eficacia en porcentaje se evaluó 24 horas después de la aplicación en comparación con el control sin tratar. Los números de compuesto 1-26, 4-03, 5-49 dieron al menos el 70% de control de contacto de *Rhipicephalus sanguineus* a una concentración de prueba de 100 ppm.

Procedimiento D

Cribado de *Diabrotica undecimpunctata* (gusano de las raíz del maíz del sur)

5 Dos días antes de la aplicación, las semillas de maíz se empaparon en agua bajo condiciones cálidas para provocar una rápida germinación. Un día antes de la aplicación, los huevos de *Diabrotica undecimpunctata* se transfirieron a una mitad de un papel de filtro japonés colocado en una placa de Petri de plástico. Después, una semilla de maíz germinada se colocó sobre una almohadilla humedecida junto al papel de filtro. Se pipetearon cuidadosamente tres gotas de 200 microlitros de disolución de compuesto de prueba sobre el huevo. El resto de la disolución se colocó
10 sobre el maíz y entonces se cerró la placa de Petri. Los huevos tratados en las placas de Petri se mantuvieron en una cámara climática durante 6 días. La eficacia del compuesto (porcentaje de huevos muertos y/o larvas en comparación con control sin tratar) se evaluó 6 días después de la aplicación usando un microscopio binocular.

15 Los números de compuesto 3-81 dieron al menos el 90% de control de *Diabrotica undecimpunctata* a una concentración de prueba de 10 ppm.

Procedimiento E

20 Cribado de *Nilaparvata lugens* (saltahojas marrón del arroz)

Las hojas de plantas de arroz se sumergieron durante 5 segundos en una disolución acuosa de la preparación formulada que iba a examinarse. Después de escurrirse la disolución, las plantas de arroz se colocaron en una placa de Petri y se poblaron con aproximadamente 20 larvas (estadio L3) de especies de saltahojas del arroz *Nilaparvata*
25 *lugens*. La placa de Petri se cerró y luego se guardó en una cámara climatizada (16 horas de luz/día, 25°C, 40-60% de humedad atmosférica relativa). Después de 6 días de almacenamiento se determinó la mortalidad entre larvas de saltahojas.

30 Los compuestos de la invención dieron un control útil de *Nilaparvata lugens* a una concentración de prueba de 10 ppm.

Procedimiento F

35 Cribado de *Aphis fabae* (áfido negro de la judía)

Se transfirieron semillas de judía en campo germinadas (*Vicia faba*) con raíces a botellas llenas de agua de grifo. Las disoluciones acuosas (4 ml) de preparación preparada que iban a examinarse se añadieron gota a gota en la botella. Entonces, las plantas se infestaron con aproximadamente 100 áfidos negros de la judía (*Aphis fabae*) y se guardaron
40 en una vitrina de entorno controlado a aproximadamente 25°C. Después de 3 y 6 días de almacenamiento se determinó el efecto de la preparación sobre los áfidos.

Los compuestos de la invención dieron un control útil de *Aphis fabae* a una concentración de ensayo de 10 ppm.

45

Referencias citadas en la descripción

Esta lista de referencias citadas por el solicitante está prevista únicamente para ayudar al lector y no forma parte del documento de patente europea. Aunque se ha puesto el máximo cuidado en su realización, no se pueden excluir
50 errores u omisiones y la OEP declina cualquier responsabilidad al respecto.

Documentos de patente citados en la descripción

- WO 8703781 A [0001]
- EP 0295117 A [0001]
- US 4695308 A [0001]
- WO 03074493 A [0001]
- US 4631211 A [0040]

Documentos no procedentes de patentes citados en la descripción

- *Tet. Lett.*, 1983, vol. 24 (20), 2059 [0032]

ES 2 345 559 T3

• S.H. **DeWitt**. Annual Reports in Combinatorial Chemistry and Molecular Diversity: Automated Synthesis. *Verlag Escom*, 1997, vol. 1, 69-77 [0037]

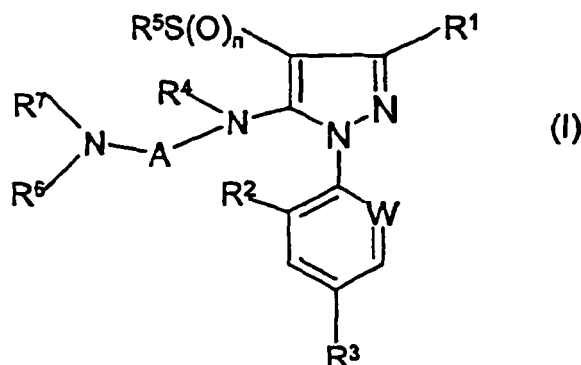
• **Barry** A. Bunin. The Combinatorial Index. *Academic Press*, 1998 [0040]

• **Houghten** *et al.* *Proc. Natl. Acad. Sci.*, 1985, vol. 82, 5131-5135 [0040]

• Ch.R **Worthing**; S.B. **Walker**. The Pesticide Manual. *British Crop Protection Council*, 2000 [0069]

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula (I):



en la que:

R^1 es CN, CH_3 , CF_3 , $CSNH_2$ o $C(=N-Z)-S(O)_r-Q$;

W es C- R^8 ;

R^2 y R^8 son cada uno independientemente halógeno, CH_3 o NR^9R^{10} ;

R^3 es haloalquilo (C_1-C_3), haloalcoxi (C_1-C_3) o SF_5 ;

R^4 es hidrógeno, alqueno (C_2-C_6), haloalqueno (C_2-C_6), alquino (C_2-C_6), haloalquino (C_2-C_6), cicloalquilo (C_3-C_7), CO_2 -alquilo (C_1-C_6), CO_2 -alqueno (C_3-C_6), CO_2 -alquino (C_2-C_6), $CO_2-(CH_2)R^{11}$, $CO_2-(CH_2)_mR^{12}$, CHO, CO-cicloalquilo (C_3-C_7), COR^{11} , COR^{12} , SO_2R^{13} , alquilo (C_1-C_6) o CO-alquilo (C_1-C_6), cuyos dos últimos grupos mencionados están sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales R^{14} ;

R^5 es alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), alqueno (C_2-C_6), haloalqueno (C_2-C_6), alquino (C_2-C_6) o haloalquino (C_2-C_6);

A es alqueno (C_1-C_6) o alqueno (C_2-C_6) cuyos grupos están sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales R^{16} ; o es alqueno (C_2-C_6) en el que 2, 3 ó 4 átomos de carbono adyacentes forman un anillo de cicloalquilo (C_3-C_7), estando el alqueno (C_2-C_6) o los átomos de anillo de cicloalquilo (C_3-C_7) sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por alquilo (C_1-C_6) y halógeno;

R^6 y R^7 son cada uno independientemente H, R^{11} , R^{12} , alquilo (C_1-C_6), alqueno (C_2-C_6) o alquino (C_2-C_6), cuyos tres últimos grupos mencionados están sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, cicloalquilo (C_3-C_7), R^{11} , R^{12} , alcoxi (C_1-C_6), haloalcoxi (C_1-C_6), OR^{11} y OR^{12} ; o son cada uno un radical acilo; o

R^6 y R^7 junto con el átomo de N unido forman un anillo saturado de cuatro a siete miembros o un anillo insaturado de cinco a siete miembros cuyo anillo contiene opcionalmente uno o más heteroátomos adicionales en el anillo que se seleccionan de O, S y N, estando el anillo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6) y oxo, y cuando está presente cualquier átomo de N adicional está sin sustituir o sustituido con un alquilo (C_1-C_6), CO-alquilo (C_1-C_6) o radical CH_2R^{11} ; o

R^6 y R^7 junto con el átomo de N unido forman un radical ftalimido que está sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, alquilo (C_1-C_6) y haloalquilo (C_1-C_6); o

si A es alqueno (C_1-C_6), R^7 junto con el átomo de N unido y el resto A forman un anillo saturado de cuatro a siete miembros que está sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6) y oxo, y R^6 es H, alquilo (C_1-C_6), CH_2R^{11} , CO-alquilo (C_1-C_6) o CO_2 -alquilo (C_1-C_6);

R^9 y R^{10} son cada uno independientemente H, alquilo (C_1-C_6), alqueno (C_2-C_6) o alquino (C_2-C_6), cuyos tres últimos grupos mencionados están sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, cicloalquilo (C_3-C_7), R^{11} , R^{12} , alcoxi (C_1-C_6), haloalcoxi (C_1-C_6), OR^{11} y OR^{12} ;

ES 2 345 559 T3

R^{11} es fenilo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), haloalcoxi (C_1-C_6), CN, NO_2 , $S(O)_p R^{17}$ y $NR^{18} R^{19}$;

R^{12} es heterociclilo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, alquilo (C_1-C_4), haloalquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), haloalcoxi (C_1-C_4), NO_2 , CN, CO_2 -alquilo (C_1-C_6), $S(O)_p R^{17}$, OH y oxo;

R^{13} es cicloalquilo (C_3-C_7), alqueno (C_2-C_6), haloalqueno (C_2-C_6), alquino (C_2-C_6), haloalquino (C_2-C_6), R^{11} o R^{12} ; o es alquilo (C_1-C_6) sin sustituir o sustituido con uno o más radicales R^{14} ;

R^{14} es halógeno, alcoxi (C_1-C_6), haloalcoxi (C_1-C_6), alquenoilo (C_3-C_6), haloalquenoilo (C_3-C_6), alquinoilo (C_3-C_6), haloalquinoilo (C_3-C_6), cicloalquilo (C_3-C_7), $S(O)_p R^{16}$, CN, NO_2 , OH, R^{11} , R^{12} , COR^{16} , $NR^9 R^{18}$, OR^{16} o $CO_2 R^{16}$;

R^{15} es cicloalquilo (C_3-C_7), alqueno (C_2-C_6), haloalqueno (C_2-C_6), alquino (C_2-C_6), haloalquino (C_2-C_6), R^{11} o R^{12} ; o es alquilo (C_1-C_6) sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, cicloalquilo (C_3-C_7), R^{11} y R^{12} ;

R^{16} es alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), alqueno (C_2-C_6), haloalqueno (C_2-C_6), alquino (C_2-C_6), haloalquino (C_2-C_6), cicloalquilo (C_3-C_7), cicloalquil (C_3-C_7)-alquilo (C_1-C_4), $(CH_2)_q R^{11}$ o $(CH_2)_q R^{12}$;

R^{17} es alquilo (C_1-C_6) o haloalquilo (C_1-C_6);

R^{18} y R^{19} son cada uno independientemente H, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), alqueno (C_3-C_6), haloalqueno (C_3-C_6), alquino (C_3-C_6), cicloalquilo (C_3-C_7) o cicloalquil (C_3-C_7)-alquilo (C_1-C_6); o

R^{18} y R^{19} junto con el átomo de N unido forman un anillo saturado de cinco o seis miembros que opcionalmente contiene un heteroátomo adicional en el anillo que se selecciona de O, S y N, estando el anillo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, alquilo (C_1-C_6) y haloalquilo (C_1-C_6);

Z es H, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), alqueno (C_3-C_6), alquino (C_3-C_6), $(CH_2)_q R^{11}$, COR^{17} , CO_2 -alquilo (C_1-C_6) o $S(O)_p R^{17}$;

Q es alquilo (C_1-C_6) o $CH_2 R^{11}$;

n, p y r son cada uno independientemente cero, uno o dos;

m y q son cada uno independientemente cero o uno; y

cada heterociclilo en los radicales anteriormente mencionados es independientemente un radical heterocíclico que tiene 3 a 7 átomos de anillo y 1, 2 ó 3 heteroátomos en el anillo seleccionados del grupo que está constituido por N, O y S;

o una sal pesticidamente aceptable del mismo.

2. Un compuesto o una sal del mismo según la reivindicación 1 en el que R^1 es CN.

3. Un compuesto o una sal del mismo según la reivindicación 1 ó 2 en el que A es alqueno (C_1-C_6).

4. Un compuesto o una sal del mismo según la reivindicación 1, 2 ó 3 en el que:

R^1 es CN;

W es C-halógeno;

R^2 es halógeno;

R^3 es CF_3 , OCF_3 o SF_5 ;

R^4 es hidrógeno, alqueno (C_2-C_6), haloalqueno (C_2-C_6), alquino (C_2-C_6), haloalquino (C_2-C_6), cicloalquilo (C_3-C_7), CO_2 -alquilo (C_1-C_6), CO_2 -alqueno (C_3-C_6), CO_2 -alquino (C_2-C_6), $CO_2-(CH_2)_m R^{11}$, CHO, CO-cicloalquilo (C_3-C_7), COR^{11} , $SO_2 R^{13}$, alquilo (C_1-C_6) o CO-alquilo (C_1-C_6), cuyos dos últimos grupos mencionados están sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales R^{14} ;

R^5 es CF_3 ;

ES 2 345 559 T3

A es alquileo (C₁-C₆) sin sustituir o sustituido con uno o más radicales R¹⁶, o alquienilo (C₂-C₆) sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por alquilo (C₁-C₃), haloalquilo (C₁-C₃), alqueno (C₂-C₃), alquino (C₂-C₃), cicloalquilo (C₃-C₇), cicloalquil (C₃-C₇)-alquilo (C₁-C₃) y (CH₂)_q R¹¹;

R⁶ y R⁷ son cada uno independientemente H, R¹¹, alquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆) o alquino (C₂-C₆), cuyos tres últimos grupos mencionados están sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, cicloalquilo (C₃-C₇), R¹¹, R¹², alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), OR¹¹ y OR¹²; o son SO₂R¹⁵, CO₂-alqueno (C₃-C₆), CO₂-alquino (C₂-C₆), CHO, CO-cicloalquilo (C₃-C₇), COR¹¹, COR¹², CO-alquilo (C₁-C₆) o CO₂-alquilo (C₁-C₆), cuyos dos últimos grupos mencionados están sin sustituir o sustituidos con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, cicloalquilo (C₃-C₇), R¹¹ y R¹²; o

R⁶ y R⁷ junto con el átomo de N unido forman un anillo saturado de cuatro a siete miembros o un anillo insaturado de cinco a siete miembros cuyo anillo contiene opcionalmente uno o más heteroátomos adicionales en el anillo que se seleccionan de O, S y N, estando el anillo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₃), haloalquilo (C₁-C₃) y oxo, y cuando está presente cualquier átomo de N adicional está sin sustituir o sustituido con un alquilo (C₁-C₆), CO-alquilo (C₁-C₆) o radical CH₂R¹¹; o

R⁶ y R⁷ junto con el átomo de N unido forman un radical ftalimido que está sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₆) y haloalquilo (C₁-C₆); o

si A es alquileo (C₁-C₆), R⁷ junto con el átomo de N unido y el resto A forman un anillo saturado de cuatro a siete miembros que está sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆) y oxo, y R⁶ es H, alquilo (C₁-C₆), CH₂R¹¹, CO-alquilo (C₁-C₆) o CO₂-alquilo (C₁-C₆);

R⁹ es H, alqueno (C₂-C₃), alquino (C₂-C₃) o alquilo (C₁-C₃), cuyo último grupo mencionado está sin sustituir o sustituido con un radical R¹¹;

R¹¹ es fenilo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₃), haloalquilo (C₁-C₃), alcoxi (C₁-C₃), haloalcoxi (C₁-C₃), CN, NO₂, S(O)_pR¹⁷ y NR¹⁸R¹⁹;

R¹² es heterociclilo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₃), haloalquilo (C₁-C₃), alcoxi (C₁-C₃), haloalcoxi (C₁-C₃), NO₂, CN, CO₂-alquilo (C₁-C₃), S(O)_pR¹⁷, OH y oxo;

R¹³ es cicloalquilo (C₃-C₇), alqueno (C₂-C₃), haloalqueno (C₂-C₃), alquino (C₂-C₃), haloalquino (C₂-C₃), R¹¹ o R¹²; o es alquilo (C₁-C₃) sin sustituir o sustituido con uno o más radicales R¹⁴;

R¹⁴ es halógeno, alcoxi (C₁-C₃), haloalcoxi (C₁-C₃), alquenoiloxi (C₃-C₄), haloalquenoiloxi (C₃-C₄), alquinoiloxi (C₃-C₄), haloalquinoiloxi (C₃-C₄), cicloalquilo (C₃-C₇), S(O)_pR¹⁶, CN, NO₂, OH, R¹¹, R¹², COR¹⁶, NR⁹R¹⁸, OR¹⁶ o CO₂R¹⁶;

R¹⁵ es cicloalquilo (C₃-C₇), alqueno (C₂-C₃), haloalqueno (C₂-C₃), alquino (C₂-C₃), haloalquino (C₂-C₃), R¹¹ o R¹²; o es alquilo (C₁-C₃) sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionado del grupo que está constituido por halógeno, cicloalquilo (C₃-C₇), R¹¹ y R¹²;

R¹⁶ es alquilo (C₁-C₃), haloalquilo (C₁-C₃), alqueno (C₂-C₄), haloalqueno (C₂-C₄), alquino (C₂-C₄), haloalquino (C₂-C₄), cicloalquilo (C₃-C₇), cicloalquil (C₃-C₇)-alquilo (C₁-C₃), (CH₂)_qR¹¹ o (CH₂)_qR¹²;

R¹⁷ es alquilo (C₁-C₃) o haloalquilo (C₁-C₃);

R¹⁸ y R¹⁹ son cada uno independientemente H, alquilo (C₁-C₃), haloalquilo (C₁-C₃), alqueno (C₃-C₄), haloalqueno (C₃-C₄), alquino (C₃-C₄), cicloalquilo (C₃-C₇) o cicloalquil (C₃-C₇)-alquilo (C₁-C₃); o

R¹⁸ y R¹⁹ junto con el átomo de N unido forman un anillo saturado de cinco o seis miembros que opcionalmente contiene un heteroátomo adicional en el anillo que se selecciona de O, S y N, estando el anillo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₃) y haloalquilo (C₁-C₃);

n y p son cada uno independientemente cero, uno o dos;

m y q son cada uno independientemente cero o uno; y

ES 2 345 559 T3

cada heterociclilo en los radicales anteriormente mencionados es independientemente un radical heterocíclico que tiene 3 a 7 átomos de anillo y 1, 2 ó 3 heteroátomos en el anillo seleccionados del grupo que está constituido por N, O y S.

5. Un compuesto o una sal del mismo según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4 en el que:

R^1 es CN;

W es C-Cl;

R^2 es Cl;

R^3 es CF_3 ;

R^4 es hidrógeno, alqueno (C_2-C_6), alquino (C_2-C_6), CO_2 -alquilo (C_1-C_6), $CO_2-(CH_2)_m R^{11}$, $SO_2 R^{13}$, CO-alquilo (C_1-C_6), CO-haloalquilo (C_1-C_6) o alquilo (C_1-C_6), cuyo último grupo mencionado está sin sustituir o sustituido con uno o más radicales R^{14} ;

R^5 es CF_3 ;

A es alqueno (C_1-C_5);

R^6 y R^7 son cada uno independientemente H, R^{11} , alqueno (C_2-C_6), alquino (C_2-C_6) o alquilo (C_1-C_6), cuyo último grupo mencionado está sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, cicloalquilo (C_3-C_6), R^{11} , R^{12} , alcoxi (C_1-C_6) y OR^{11} ; o son $SO_2 R^{15}$, CO-cicloalquilo (C_3-C_6), COR^{11} , CO_2 -alquilo (C_1-C_6) o CO-alquilo (C_1-C_6), cuyo último grupo mencionado está sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, cicloalquilo (C_3-C_6), R^{11} y R^{12} ; o

R^6 y R^7 junto con el átomo de N unido forman un anillo saturado de cinco a siete miembros o un anillo insaturado de cinco a siete miembros cuyo anillo contiene opcionalmente uno o más heteroátomos adicionales en el anillo que se seleccionan de O, S y N, estando el anillo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por alquilo (C_1-C_6) y oxo, y cuando está presente cualquier átomo de N adicional está sin sustituir o sustituido con un alquilo (C_1-C_6), CO-alquilo (C_1-C_6) o radical bencilo; o

R^6 y R^7 junto con el átomo de N unido forman un radical ftalimido que está sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, alquilo (C_1-C_3) y haloalquilo (C_1-C_3); o

si A es alqueno (C_1-C_5), R^7 junto con el átomo de N unido y el resto A forman un anillo saturado de cinco a siete miembros que está sin sustituir o sustituido con uno o más radicales alquilo (C_1-C_6), y R^6 es H, alquilo (C_1-C_6), $CH_2 R^{11}$, CO-alquilo (C_1-C_6) o CO_2 -alquilo (C_1-C_6);

R^9 es H, alqueno (C_2-C_3), alquino (C_2-C_3) o alquilo (C_1-C_3), cuyo último grupo mencionado está sin sustituir o sustituido con un radical R^{11} ;

R^{11} es fenilo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, alquilo (C_1-C_3), haloalquilo (C_1-C_3), alcoxi (C_1-C_3), haloalcoxi (C_1-C_3), CN, NO_2 , $S(O)_p R^{17}$ y $NR^{18} R^{19}$;

R^{12} es heterociclilo sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, alquilo (C_1-C_3), haloalquilo (C_1-C_3), alcoxi (C_1-C_3), haloalcoxi (C_1-C_3), NO_2 , CN, CO_2 -alquilo (C_1-C_3), $S(O)_p R^{17}$, OH y oxo;

R^{13} es R^{11} o R^{12} ; o es alquilo (C_1-C_3) sin sustituir o sustituido con uno o más radicales R^{14} ;

R^{14} es halógeno, alcoxi (C_1-C_3), haloalcoxi (C_1-C_3), cicloalquilo (C_3-C_6), $S(O)_p R^{16}$, CN, NO_2 , OH, R^{11} , R^{12} , COR^{16} , $NR^9 R^{18}$, OR^{16} o $CO_2 R^{16}$;

R^{15} es cicloalquilo (C_3-C_6), alqueno (C_2-C_3), alquino (C_2-C_3) o R^{11} ; o es alquilo (C_1-C_3) sin sustituir o sustituido con uno o más radicales seleccionados del grupo que está constituido por halógeno, cicloalquilo (C_3-C_6) y R^{11} ;

R^{16} y R^{17} son cada uno independientemente alquilo (C_1-C_3) o haloalquilo (C_1-C_3);

R^{18} y R^{19} son cada uno independientemente H o alquilo (C_1-C_3);

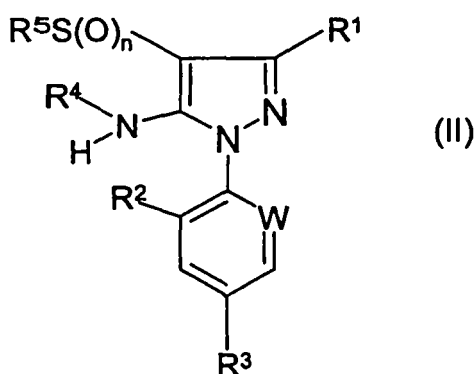
n y p son cada uno independientemente cero, uno o dos;

m es cero o uno; y

cada heterociclilo en los radicales anteriormente mencionados es independientemente un radical heterocíclico que tiene 3 a 7 átomos de anillo y 1, 2 ó 3 heteroátomos en el anillo seleccionados del grupo que está constituido por N, O y S.

6. Un procedimiento para la preparación de un compuesto de fórmula (I) o una sal del mismo como se define en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, procedimiento que comprende:

a) en la que R^1 es CN, CH_3 o CF_3 , y R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , W, A y n son como se definen en la reivindicación 1, alquilar un compuesto de fórmula (II):

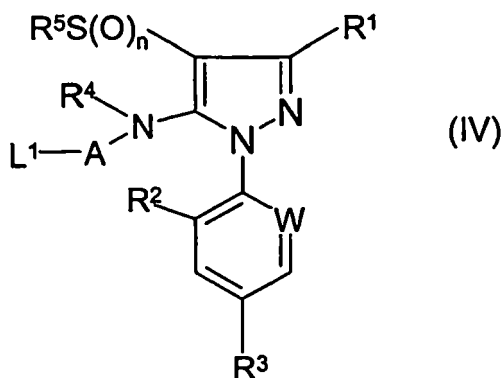


en la que R^1 es CN, CH_3 o CF_3 y los otros valores son como se definen en la reivindicación 1, con un compuesto de fórmula (III):



en la que R^6 , R^7 y A son como se definen en la reivindicación 1, y L es un grupo saliente; o

b) en la que R^1 es CN, CH_3 o CF_3 , y R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , W, A y n son como se definen en la reivindicación 1, hacer reaccionar un compuesto de fórmula (IV):

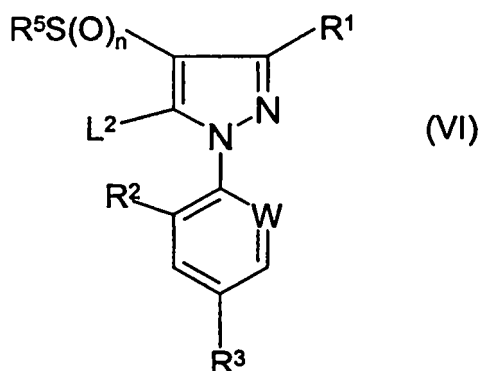


en la que L^1 es un grupo saliente y los otros valores son como se definen en la reivindicación 1, con un compuesto de fórmula (V):



en la que R^6 y R^7 son como se definen en la reivindicación 1; o

- c) en la que R^1 es CN, CH_3 o CF_3 , y R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , W, A y n son como se definen en la reivindicación 1, hacer reaccionar un compuesto de fórmula (VI):



en la que L^2 es un grupo saliente y los otros valores son como se definen en la reivindicación 1, con un compuesto de fórmula (VII):



en la que R^4 , R^6 , R^7 y A son como se definen en la reivindicación 1; o

- d) en la que R^1 es $CSNH_2$, y R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , W, A y n son como se definen en la reivindicación 1, hacer reaccionar el compuesto de fórmula (I) correspondiente en la que R^1 es CN con un hidrosulfuro de metal alcalino o alcalinotérreo, o con H_2S en presencia de una base orgánica, o con el reactivo Ph_2PS_2 ; o
- e) en la que R^1 es $CSNH_2$, y R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , W, A y n son como se definen en la reivindicación 1, hacer reaccionar el compuesto de fórmula (I) correspondiente en la que R^1 es CN con un sulfuro de bis (trialquilsililo) en presencia de una base; o
- f) en la que R^1 es $C(=N-H)-S-Q$, y Q, R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , W, A y n son como se definen en la reivindicación 1, hacer reaccionar el compuesto de fórmula (I) correspondiente en la que R^1 es $CSNH_2$ con un agente alquilante de fórmula (VIII) o (IX):



en las que Q es como se define en la reivindicación 1 y L^3 es un grupo saliente; o

- g) en la que R^1 es $C(=N-Z)-S-Q$, Z es como se define en la reivindicación 1 con la exclusión de H, y Q, R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , W, A y n son como se definen en la reivindicación 1, alquilar, acilar o sulfonilar el compuesto de fórmula (I) correspondiente en la que R^1 es $C(=NH)-S-Q$, con un compuesto de fórmula (X):



en la que Z es como se define en la reivindicación 1 con la exclusión de H, y L^4 es un grupo saliente; o

- h) en la que R^1 es CN, CH_3 o CF_3 , n es 1 ó 2, y R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , W y A son como se definen en la reivindicación 1, oxidar el compuesto correspondiente en el que n es 0 ó 1; y
- i) si se desea, convertir un compuesto resultante de fórmula (I) en una sal pesticidamente aceptable del mismo.

7. Una composición pesticida que comprende un compuesto de fórmula (I) o una sal pesticidamente aceptable del mismo como se define en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5 en asociación con un diluyente o soporte pesticidamente aceptable y/o agente tensioactivo.

ES 2 345 559 T3

8. El uso de un compuesto de fórmula (I) o una sal del mismo según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5 o de una composición según la reivindicación 7 para la preparación de un medicamento veterinario.

5 9. El uso de un compuesto de fórmula (I) o una sal del mismo según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5 o de una composición según la reivindicación 7 en la preparación de un medicamento para el control de plagas.

10

15

20

25

30

35

40

45

50

55

60

65