

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 980 805**

51 Int. Cl.:

C07D 487/04 (2006.01)

A01N 43/54 (2006.01)

A01N 43/90 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **16.11.2020 PCT/EP2020/082186**

87 Fecha y número de publicación internacional: **27.05.2021 WO21099240**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **16.11.2020 E 20803868 (7)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **20.03.2024 EP 4061815**

54 Título: **Derivados de pirimidona que contienen dos anillos bicíclicos fusionados**

30 Prioridad:

22.11.2019 EP 19210836

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

03.10.2024

73 Titular/es:

**BASF SE (100.0%)
Carl-Bosch-Strasse 38
67056 Ludwigshafen am Rhein, DE**

72 Inventor/es:

**VON DEYN, WOLFGANG;
SHAIKH, RIZWAN SHABBIR y
ADISECHAN, ASHOKKUMAR**

74 Agente/Representante:

CARVAJAL Y URQUIJO, Isabel

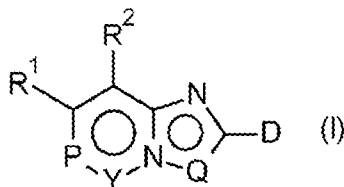
ES 2 980 805 T3

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 pirimidona que contienen dos anillos bicíclicos fusionados

- 5 La invención se refiere a compuestos de fórmula (I) o a una sal, estereoisómero, tautómero o N-óxido de los mismos agroquímica o veterinariamente aceptables.



- 10 en donde las variables son como se definen a continuación. La invención también se refiere al uso de compuestos de fórmula (I) como un pesticida agroquímico; a mezclas pesticidas que comprenden un compuesto de fórmula (I) y otro ingrediente pesticida; a un método no terapéutico para combatir o controlar plagas de invertebrados, en donde el método comprende poner en contacto dicha plaga o su suministro de alimentos, hábitat o lugares de cría con una cantidad pesticida eficaz de al menos un compuesto de fórmula (I) o la mezcla pesticida; a un método para proteger plantas en crecimiento del ataque o la infestación por plagas de invertebrados, en donde el método comprende poner en contacto una planta, o el suelo o el agua en que crece la planta, con una cantidad pesticida eficaz de al menos un compuesto de la fórmula (I) o la mezcla pesticida; y a semillas que comprenden un compuesto de la fórmula (I) o la composición pesticida en una cantidad de entre 0,1 g a 10 kg por 100 kg de semillas; a un uso de un compuesto de la fórmula (I) o de las composiciones pesticidas, para proteger plantas en crecimiento del ataque o infestación por plagas invertebradas; y a un método no terapéutico para tratar o proteger a un animal de la infestación o infección por plagas invertebradas que comprende poner al animal en contacto con una cantidad pesticida eficaz de un compuesto de la fórmula (I).

- 25 Las plagas de invertebrados y, en particular, los insectos, arácnidos y nematodos destruyen los cultivos en crecimiento y cosechados, y atacan las estructuras de viviendas y comerciales de madera, lo que causa grandes pérdidas económicas para el suministro de alimentos y la propiedad. Por consiguiente, existe una necesidad continua de nuevos agentes para combatir las plagas de invertebrados.

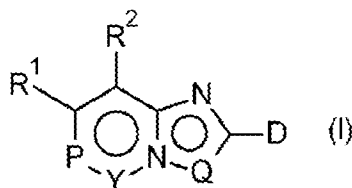
- 30 EP3257853A1 divulga compuestos heterocíclicos condensados y su uso como pesticidas, cuyos compuestos tienen dos moléculas bicíclicas fusionadas. WO2017/167832A1 divulga compuestos bicíclicos de pirimidona y su actividad pesticida. WO2018/206479 describe compuestos bicíclicos de imidazopirimidona sustituidos con un fenilo o un heteroarilo de 5 o 6 miembros y su actividad pesticida.

- 35 Debido a la capacidad de las plagas objetivo para desarrollar resistencia a los agentes pesticidas activos, existe una necesidad continua de identificar otros compuestos que son adecuados para combatir plagas de invertebrados, tales como insectos, arácnidos y nematodos. Además, se necesitan nuevos compuestos que tengan una alta actividad pesticida y que muestren un amplio espectro de actividad frente a un gran número de plagas de invertebrados diferentes, especialmente contra insectos, arácnidos y nematodos difíciles de controlar.

- 40 Por lo tanto, es objeto de la presente invención identificar y proporcionar compuestos, que exhiben una alta actividad pesticida y tienen un amplio espectro de actividad contra las plagas de invertebrados.

- 45 Se ha encontrado que estos objetos se pueden lograr mediante compuestos bicíclicos sustituidos de la fórmula (I), como se describe y define a continuación, incluyendo sus estereoisómeros, sus sales, en particular sus sales agrícola o veterinariamente aceptables, sus tautómeros y sus N-óxidos.

En un primer aspecto, la presente invención se refiere a un compuesto de fórmula (I),

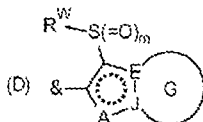


- 50 en donde el círculo en el anillo representa que el anillo está totalmente insaturado;

Y es C=X, en donde X es O o S;

ES 2 980 805 T3

P	es N(R ³) o C(R ⁴);
Q	es N(R ⁵) o C(R ⁶);
R ¹	es H, halógeno, alquilo de C ₁ -C ₆ , alqueno de C ₂ -C ₆ , alquino de C ₂ -C ₆ , alcoxi de C ₁ -C ₆ , alcoxi de C ₁ -C ₆ -alquilo de C ₁ -C ₆ , cicloalquilo de C ₃ -C ₆ , cicloalcoxi de C ₃ -C ₆ , sulfenilo de C ₁ -C ₆ , sulfinilo de C ₁ -C ₆ , o sulfonilo de C ₁ -C ₆ , cuyos grupos están no sustituidos o halogenados;
5 R ³ , R ⁵	son independientemente alquilo de C ₁ -C ₆ , alcoxi de C ₁ -C ₆ , alqueno de C ₂ -C ₆ , alquino de C ₂ -C ₆ , alcoxi de C ₁ -C ₆ -alquilo de C ₁ -C ₄ , alcoxi de C ₁ -C ₆ -alcoxi de C ₁ -C ₄ , cicloalquilo de C ₃ -C ₆ , cicloalquilo de C ₃ -C ₆ -alquilo de C ₁ -C ₄ , o cicloalcoxi de C ₃ -C ₆ -alquilo de C ₁ -C ₄ , que están no sustituidos o halogenados; C(=O)OR ^A , NR ^B R ^C , alqueno de C ₁ -C ₆ -NR ^B R ^C , O-alqueno de C ₁ -C ₆ -NR ^B R ^C , alqueno de C ₁ -C ₆ -CN, Nh-alqueno de C ₁ -C ₆ -NR ^B R ^C , C(=O)NR ^B R ^C , C(=O)R ^D , C(=S)R ^D , SO ₂ NR ^B R ^C , S(=O) _n R ^E ; fenilo o bencilo, en donde el anillo fenilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R ^F iguales o diferentes;
10 R ² , R ⁴ , R ⁶	son independientemente H, halógeno, N ₃ , CN, NO ₂ , SCN, SF ₅ ; alquilo de C ₁ -C ₆ , alcoxi de C ₁ -C ₆ , alqueno de C ₂ -C ₆ , tri-alquilsililo de C ₁ -C ₆ , alquino de C ₂ -C ₆ , alcoxi de C ₁ -C ₆ -alquilo de C ₁ -C ₄ , alcoxi de C ₁ -C ₆ -alcoxi de C ₁ -C ₄ , cicloalquilo de C ₃ -C ₆ , cicloalcoxi de C ₃ -C ₆ , cicloalquilo de C ₃ -C ₆ -alquilo de C ₁ -C ₄ , cicloalcoxi de C ₃ -C ₆ -alquilo de C ₁ -C ₄ , cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno, C(=O)OR ^A , NR ^B R ^C , NOR ^A , ONR ^B R ^C , alqueno de C ₁ -C ₆ -NR ^B R ^C , O-alqueno de C ₁ -C ₆ -NR ^B R ^C , alqueno de C ₁ -C ₆ -CN, NH-alqueno de C ₁ -C ₆ -NR ^B R ^C , C(=O)NR ^B R ^C , C(=O)R ^D , C(=S)R ^D , SO ₂ NR ^B R ^C , S(=O) _n R ^E ; fenilo o bencilo, en donde el anillo fenilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R ^F iguales o diferentes;
15 20 D	es un anillo bicíclico fusionado de la siguiente fórmula



25 en donde el símbolo “&” significa la conexión con el resto de la fórmula (I), en donde el círculo de puntos en el anillo de 5 miembros significa que el anillo de 5 miembros puede estar saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado; y en donde

30 A	es N, S, O, CR ⁷ , o NR ⁸ ;
E, J	son independientemente C o N, en donde al menos una de las variables seleccionadas entre E y J es C;
35 G	es un carbociclo o heterociclo saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado de 5 o 6 miembros, cuyo carbociclo o heterociclo incluye los átomos E y J como miembros del anillo y está no sustituido, o sustituido con uno o más sustituyentes R ⁹ iguales o diferentes, y en donde dicho heterociclo comprende ningún, uno o más heteroátomos O, N o S, iguales o diferentes, además de los que puedan estar presentes como miembros del anillo E y J; R ⁷ es H, halógeno, OH, CN, NC, NO ₂ , N ₃ , SCN, NCS, NCO, SF ₅ ; alquilo de C ₁ -C ₆ , cicloalquilo de C ₃ -C ₆ , alqueno de C ₂ -C ₆ , cicloalqueno de C ₃ -C ₆ , alquino de C ₂ -C ₆ , cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes R ^G iguales o diferentes;
40 45	un anillo o sistema de anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado de 3 a 12 miembros, en donde dicho anillo o sistema de anillo heterocíclico comprende uno o más heteroátomos iguales o diferentes O, N o S, y está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R ^H iguales o diferentes, y en donde dichos átomos N y S están independientemente oxidados o no oxidados; fenilo, que está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R ^J iguales o diferentes; OR ^K , SR ^K , OC(=O)R ^K , OC(=O)OR ^K , OC(=O)NR ^L R ^M , OC(=O)SR ^K , OC(=S)NR ^L R ^M , OC(=S)SR ^K , OS(=O) _m R ^K , OS(=O) _m NR ^L R ^M , ONR ^L R ^M , ON=CR ^N O, NR ^L R ^M , NOR ^K , ONR ^L R ^M , N=CR ^N O, NNR ^L , N(R ^L)C(=O)R ^K , N(R ^L)C(=O)OR ^K , S(=O) _n R ^V , SC(=O)SR ^K , SC(=O)NR ^L R ^M , S(=O) _m NR ^L R ^M , C(=O)R ^P , C(=S)R ^P , C(=O)NR ^L R ^M , C(=O)OR ^K , C(=S)NR ^L R ^M , C(=S)OR ^K , C(=S)SR ^K , C(=NR ^L)R ^M , C(=NR ^L)NR ^M R ^R , Si(R ^S) ₂ R ^T ;

R⁸ es H, halógeno, CN;

55 alquilo de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆, alqueno de C₂-C₆, cicloalqueno de C₃-C₆, alquino de C₂-C₆, cuyos grupos están no sustituidos, o sustituidos con uno o más sustituyentes R^G iguales o diferentes; un anillo o sistema de anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado de 3 a 12 miembros, en donde dicho anillo o sistema de anillo heterocíclico comprende uno o más heteroátomos O, N o S iguales o diferentes, y es

60 no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^H iguales o diferentes, y en donde dichos átomos N y S están independientemente oxidados o no oxidados; fenilo, que está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^J iguales o diferentes; OR^K, SR^K, OC(=O)R^K, OC(=O)OR^K, OC(=O)NR^LR^M,

- 5 OC(=O)SR^K, OC(=S)NR^LR^M, OC(=S)SR^K, OS(=O)_mR^K, OS(=O)_mNR^LR^M, ONR^LR^M, ON=CR^{NR}^O, NR^LR^M, NOR^K, ONR^LR^M, N=CR^{NR}^O, NNR^L, N(R^L)C(=O)R^K, N(R^L)C(=O)OR^K, S(=O)_nR^V, SC(=O)SR^K, SC(=O)NR^LR^M, S(=O)_mNR^LR^M, C(=O)R^P, C(=S)R^P, C(=O)NR^LR^M, C(=O)OR^K, C(=S)NR^LR^M, C(=S)OR^K, C(=S)SR^K, C(=NR^L)R^M, C(=NR^L)NR^MR^R, Si(R^S)₂R^T; cada R⁹ es independientemente H, halógeno, OH, CN, NC, NO₂, N₃, SCN, NCS, NCO, SF₅; alquilo de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆, alqueno de C₂-C₆, cicloalqueno de C₃-C₆, alquino de C₂-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₃, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes R^G iguales o diferentes; un anillo o sistema de anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado de
- 10 3 a 12 miembros, en donde dicho anillo o sistema de anillo heterocíclico comprende uno o más heteroátomos iguales o diferentes O, N o S, y está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^H iguales o diferentes, y en donde dichos átomos N y S están independientemente oxidados o no oxidados; fenilo, que está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^J iguales o diferentes;
- 15 OR^K, SR^K, OC(=O)R^K, OC(=O)OR^K, OC(=O)NR^LR^M, OC(=O)SR^K, OC(=S)NR^LR^M, OC(=S)SR^K, OS(=O)_mR^K, OS(=O)_mNR^LR^M, ONR^LR^M, ON=CR^{NR}^O, NR^LR^M, NOR^K, ONR^LR^M, N=CR^{NR}^O, NNR^L, N(R^L)C(=O)R^K, N(R^L)C(=O)OR^K, S(=O)_nR^V, SC(=O)SR^K, SC(=O)NR^LR^M, S(=O)_mNR^LR^M, C(=O)R^P, C(=S)R^P, C(=O)NR^LR^M, C(=O)OR^K, C(=S)NR^LR^M, C(=S)OR^K, C(=S)SR^K, C(=NR^L)R^M, C(=NR^L)NR^MR^R, Si(R^S)₂R^T;
- 20 o dos sustituyentes R⁹ forman, junto con los miembros del anillo G a los que están unidos, un carbociclo o heterociclo saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado de 5 o 6 miembros, cuyo carbociclo o heterociclo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^J iguales o diferentes, y en donde dicho heterociclo comprende uno o más heteroátomos O, N o S iguales o diferentes;
- 25 cada R^A es independientemente H; alquilo de C₁-C₆, alqueno de C₂-C₆, alquino de C₂-C₆, alcoxi de C₁-C₆-alquilo de C₁-C₄, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cicloalcoxi de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno; alqueno de C₁-C₆-NR^bR^O, alqueno de C₁-C₆-CN; o fenilo o bencilo, en donde el anillo fenilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^F iguales o diferentes;
- 30 cada R^B es independientemente H; alquilo de C₁-C₆, alqueno de C₂-C₆, alquino de C₂-C₆, alcoxi de C₁-C₆-alquilo de C₁-C₄, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cicloalcoxi de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno; alqueno de C₁-C₆-CN; fenilo y bencilo, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes R^F iguales o diferentes;
- 35 cada R^C es independientemente H; alquilo de C₁-C₆, alqueno de C₂-C₆, alquino de C₂-C₆, alcoxi de C₁-C₆-alquilo de C₁-C₄, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cicloalcoxi de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno; alqueno de C₁-C₆-CN; o fenilo o bencilo, en donde el anillo fenilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^F iguales o diferentes;
- 40 cada resto NR^BR^C también puede formar un heterociclo saturado de 5 a 8 miembros, unido a N, que además del átomo de nitrógeno puede tener 1 o 2 heteroátomos o restos de heteroátomos adicionales seleccionados de O, S(=O)_m y N-R', en donde R' es H o alquilo de C₁-C₆, y en donde el heterociclo unido a N está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados de halógeno, alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₄, alcoxi de C₁-C₄ y haloalcoxi de C₁-C₄;
- 45 cada R^B es independientemente H; alquilo de C₁-C₆, alqueno de C₂-C₆, alquino de C₂-C₆, alcoxi de C₁-C₆-alquilo de C₁-C₄, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cicloalcoxi de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno; fenilo o bencilo, en donde el anillo fenilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^F iguales o diferentes;
- 50 cada R^W es independientemente alquilo de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, que están no sustituidos o sustituidos con halógeno; o fenilo o bencilo, en donde el anillo fenilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^F iguales o diferentes;
- 55 cada R^F es independientemente halógeno, N₃, OH, CN, NO₂, SCN, SF₅; alquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₆, alqueno de C₂-C₆, alquino de C₂-C₆, alcoxi de C₁-C₆-alquilo de C₁-C₄, alcoxi de C₁-C₆-alcoxi de C₁-C₄, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalcoxi de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cicloalcoxi de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno;
- 60 Cada RG es independientemente halógeno, OH, CN, NC, NO₂; alquilo de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalqueno de C₃-C₆, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados entre halógeno, OH, CN, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, y alquilcarbonilo de C₁-C₃;
- 65

un anillo o sistema de anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado de

3 a 12 miembros, en donde dicho anillo o sistema de anillo heterocíclico comprende uno o varios heteroátomos O, N o S iguales o diferentes, y está no sustituido o sustituido por uno o varios sustituyentes iguales o diferentes seleccionados entre halógeno, OH, CN, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃ y alquilcarbonilo de C₁-C₃, y en donde dichos átomos N y S están independientemente oxidados o no oxidados;

fenilo, que está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de halógeno, OH, CN, NO₂, alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, y alquilo de C₁-C₃-carbonilo; OR^K, SR^K, OC(=O)R^K, OC(=O)OR^K, OC(=O)NR^LR^M, OC(=O)SR^K, OC(=S)NR^LR^M, OC(=S)SR^K, OS(=O)_mR^K, OS(=O)_mNR^LR^M, ONR^LR^M, ON=CR^NR^O, NR^LR^M, NOR^K, ONR^LR^M, N=CR^NR^O, NNR^L, N(R^L)C(=O)R^K, N(R^L)C(=O)OR^K, S(=O)_nR^V, SC(=O)SR^K, SC(=O)NR^LR^M, S(=O)_mNR^LR^M, C(=O)R^P, C(=S)R^P, C(=O)NR^LR^M, C(=O)OR^K, C(=S)NR^LR^M, C(=S)OR^K, C(=S)SR^K, C(=NR^L)R^M, C(=NR^L)NR^MR^R, Si(R^S)₂R^T;

cada R^H es independientemente halógeno, CN, NC, NO₂, SCN, NCS, NCO; alquilo de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalqueno de C₃-C₆, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados entre halógeno, OH, CN, alcoxi de C₁-C₁₀, haloalcoxi de C₁-C₃, y alquilcarbonilo de C₁-C₃; fenilo, que está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados entre halógeno, OH, CN, NO₂, alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, OR^K, SR^K, OC(=O)R^K, OC(=O)OR^K, OC(=O)NR^LR^M, OC(=O)SR^K, OC(=S)NR^LR^M, OC(=S)SR^K, OS(=O)_mR^K, OS(=O)_mNR^LR^M, ONR^LR^M, ON=CR^NR^O, NR^LR^M, NOR^K, ONR^LR^M, N=CR^NR^O, NNR^L, N(R^L)C(=O)R^K, N(R^L)C(=O)OR^K, S(=O)_nR^V, SC(=O)SR^K, SC(=O)NR^LR^M, S(=O)_mNR^LR^M, C(=O)R^P, C(=S)R^P, C(=O)NR^LR^M, C(=O)OR^K, C(=S)NR^LR^M, C(=S)OR^K, C(=S)SR^K, C(=NR^L)R^M, C(=NR^L)NR^MR^R, Si(R^S)₂R^T; o dos sustituyentes gemínicos R^H forman junto con el átomo al que están unidos un grupo =O, =S, o =NR^L.

cada R^J es independientemente halógeno, CN, NC, NO₂, SCN, NCS, NCO; alquilo de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalqueno de C₃-C₆, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados entre halógeno, OH, CN, alcoxi de C₁-C₁₀, haloalcoxi de C₁-C₃, y alquilcarbonilo de C₁-C₃; fenilo, que está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados entre halógeno, OH, CN, NO₂, alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, OR^K, SR^K, OC(=O)R^K, OC(=O)OR^K, OC(=O)NR^LR^M, OC(=O)SR^K, OC(=S)NR^LR^M, OC(=S)SR^K, OS(=O)_mR^K, OS(=O)_mNR^LR^M, ONR^LR^M, ON=CR^NR^O, NR^LR^M, NOR^K, ONR^LR^M, N=CR^NR^O, NNR^L, N(R^L)C(=O)R^K, N(R^L)C(=O)OR^K, S(=O)_nR^V, SC(=O)SR^K, SC(=O)NR^LR^M, S(=O)_mNR^LR^M, C(=O)R^P, C(=S)R^P, C(=O)NR^LR^M, C(=O)OR^K, C(=S)NR^LR^M, C(=S)OR^K, C(=S)SR^K, C(=NR^L)R^M, C(=NR^L)NR^MR^R, Si(R^S)₂R^T;

cada R^K es independientemente H;

alquilo de C₁-C₆, alqueno de C₂-C₆, alquino de C₂-C₆, alcoxi de C₁-C₆-alquilo de C₁-C₄, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cicloalcoxi de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados de halógeno, CN, NR^MR^N, C(=O)NR^MR^N, C(=O)R^T; o fenilo o bencilo, en donde el anillo fenilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^X iguales o diferentes; cada R^L es independientemente H;

alquilo de C₁-C₆, alqueno de C₂-C₆, alquino de C₂-C₆, alcoxi de C₁-C₆-alquilo de C₁-C₄, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cicloalcoxi de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno; alqueno de C₁-C₆-CN; fenilo y bencilo, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes R^X iguales o diferentes;

cada R^M, R^R es independientemente H;

alquilo de C₁-C₆, alqueno de C₂-C₆, alquino de C₂-C₆, alcoxi de C₁-C₆-alquilo de C₁-C₄, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cicloalcoxi de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno; alqueno de C₁-C₆-CN; o fenilo o bencilo, en donde el anillo fenilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^X iguales o diferentes;

cada resto NR^MR^R, NR^LR^M también puede formar un heterociclo saturado de 5 a 8 miembros, unido a N, que además del átomo de nitrógeno puede tener 1 o 2 heteroátomos o restos de heteroátomos adicionales seleccionados de O, S(=O)_m y N-R', en donde R' es H o alquilo de C₁-C₆, y en donde el heterociclo unido a N está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados de halógeno, alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₄, alcoxi de C₁-C₄ y haloalcoxi de C₁-C₄;

cada R^N es independientemente H, halógeno, CN, NO₂, SCN;

alquilo de C₁-C₁₀, cicloalquilo de C₃-C₈, alqueno de C₂-C₆, cicloalqueno de C₃-C₆, alquino de C₂-C₆, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados entre halógeno, alquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₆, haloalquilo de C₁-C₆ y haloalcoxi de C₁-C₆;

un anillo o sistema de anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado de 3 a 12 miembros, en donde dicho anillo o sistema de anillo heterocíclico comprende uno o varios

heteroátomos O, N o S iguales o diferentes, y está no sustituido o sustituido por uno o varios sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados entre halógeno, alquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃ y haloalcoxi de C₁-C₃, y en donde dichos átomos N y S están independientemente oxidados o no oxidados;

5 fenilo, que está no sustituido, o sustituido con uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de halógeno, alquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, y haloalcoxi de C₁-C₃;

10 cada R^O es independientemente H, alquilo de C₁-C₄, cicloalquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₂-alquilo de C₁-C₂, fenilo o bencilo;

cada R^P es independientemente H;

15 alquilo de C₁-C₆, alqueno de C₂-C₆, alquino de C₂-C₆, alcoxi de C₁-C₆-alquilo de C₁-C₄, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cicloalcoxi de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno; fenilo o bencilo, en donde el anillo fenilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^X iguales o diferentes;

20 cada R^S, R^T es independientemente H, alquilo de C₁-C₆, haloalquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₄-alquilo de C₁-C₄, cicloalquilo de C₃-C₆, halocicloalquilo de C₃-C₆, haloalcoxi de C₁-C₄-alquilo de C₁-C₄, o fenilo;

25 cada R^V es independientemente alquilo de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, que están no sustituidos o sustituidos con halógeno; o fenilo o bencilo, en donde el anillo fenilo está no sustituido o sustituido con R^X;

30 cada R^W es alquilo de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, que están no sustituidos o sustituidos con halógeno; o fenilo o bencilo, en donde el anillo fenilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^X iguales o diferentes;

35 cada R^X es independientemente halógeno, N₃, OH, CN, NO₂, SCN, SF₅;

alquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₆, alqueno de C₂-C₆, alquino de C₂-C₆, alcoxi de C₁-C₆-alquilo de C₁-C₄, alcoxi de C₁-C₆-alcoxi de C₁-C₄, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalcoxi de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cicloalcoxi de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno;

30 m es 0, 1 o 2;

n es 0, 1, 2, o 3 ;

y los N-óxidos, estereoisómeros, tautómeros y sales agrícola o veterinariamente aceptables de los mismos.

35 Los compuestos de la fórmula (I), y sus sales agrícolamente aceptables, son altamente activos contra plagas animales, es decir, artrópodos y nematodos dañinos, especialmente contra insectos y acáridos que son difíciles de controlar por otros medios.

Además, la presente invención se refiere e incluye las siguientes realizaciones:

40 - composiciones que comprenden al menos un compuesto de fórmula (I) según lo definido anteriormente y un portador líquido o sólido;

- composiciones agrícolas y veterinarias que comprendan una cantidad de al menos un compuesto de fórmula (I) o un enantiómero, diastereómero o sal de los mismos, según lo definido anteriormente;

45 - métodos no terapéuticos para combatir las plagas de invertebrados, la infestación o infección por plagas de invertebrados, cuyo método comprende poner en contacto dicha plaga o su suministro de alimentos, hábitat o zonas de reproducción con una cantidad pesticida eficaz de al menos un compuesto de fórmula (I) según lo definido anteriormente o una composición del mismo;

50 - métodos no terapéuticos para controlar plagas de invertebrados, infestación o infección por plagas de invertebrados, cuyo método comprende poner en contacto dicha plaga o su suministro de alimentos, hábitat o zonas de reproducción con una cantidad pesticida eficaz de al menos un compuesto de fórmula (I) según lo definido anteriormente o una composición que comprende al menos un compuesto de fórmula (I);

55 - métodos no terapéuticos para prevenir o proteger contra las plagas de invertebrados, que comprenden poner en contacto las plagas de invertebrados, o su suministro de alimentos, hábitat o zonas de reproducción con compuestos de imidazolio sustituido de la fórmula general (I) según lo definido anteriormente, o una composición que comprende al menos un compuesto de fórmula (I) según lo definido anteriormente, o una composición que comprende al menos un compuesto de fórmula (I);

60 - métodos para proteger cultivos, plantas, material de propagación de plantas y/o plantas en crecimiento de ataques o infestaciones por plagas de invertebrados que comprenden la puesta en contacto o el tratamiento de los cultivos, plantas, material de propagación de plantas y plantas en crecimiento, o suelo, material, superficie, espacio, área o agua en la que se almacenan los cultivos, plantas, material de propagación vegetal o planta en crecimiento, con una cantidad pesticida eficaz de al menos un compuesto de fórmula (I) según lo definido anteriormente o una composición que comprende al menos un compuesto de fórmula (I);

65 - métodos no terapéuticos para tratar a los animales infestados o infectados por parásitos o evitar que los animales se infecten o infesten por parásitos, o para proteger a los animales contra la infestación o infección por parásitos que comprende administrar o aplicar a los animales, por vía oral, tópica o parenteral, una cantidad parasiticida eficaz de un compuesto de fórmula (I) tal como se definió anteriormente o una composición que comprende al menos un compuesto

de fórmula (I);

- métodos no terapéuticos para tratar, controlar, prevenir o proteger a los animales contra la infestación o infección por parásitos administrando o aplicando a los animales por vía oral, tópica o parenteral un compuesto de la fórmula general (I) según lo definido anteriormente o una composición que incluye al menos un compuesto de fórmula (I);

- semilla que comprende un compuesto de fórmula (I) según lo definido anteriormente, en una cantidad de 0,1 g a 10 kg por 100 kg de semilla;

- el uso de los compuestos de fórmula (I) según lo definido anteriormente para proteger las plantas en crecimiento o el material de propagación de plantas contra ataques o infestaciones por plagas de invertebrados;

- el uso no terapéutico de compuestos de fórmula (I) o de los enantiómeros, diastereómeros o sales veterinariamente aceptables para combatir parásitos en y sobre animales;

- un proceso de preparación de una composición veterinaria para tratar, controlar, prevenir o proteger a los animales contra la infestación o infección por parásitos que comprende la adición de una cantidad parasiticida eficaz de un compuesto de fórmula (I) o de los enantiómeros, diastereómeros y/o sal veterinariamente aceptable para una composición portadora adecuada para uso veterinario;

- el uso de un compuesto de fórmula (I) o de los enantiómeros, diastereómeros y/o sal veterinariamente aceptable para la preparación de un medicamento para el tratamiento, control, prevención o protección de los animales contra la infestación o infección por parásitos.

Todos los compuestos de fórmula (I) y, en su caso, sus estereoisómeros, sus tautómeros, sus sales o sus N-óxidos, así como composiciones de los mismos son particularmente útiles para el control de plagas de invertebrados, en particular para el control de artrópodos y nematodos, y especialmente insectos. Por lo tanto, la invención se refiere al uso de un compuesto de fórmula (I) como un plaguicida agroquímico, preferiblemente para combatir o controlar plagas de invertebrados, en particular plagas de invertebrados del grupo de insectos, arácnidos o nematodos.

El término "compuesto(s) de acuerdo con la invención" o "compuesto(s) de fórmula (I)", como se utiliza en la presente invención, se refiere y comprende el (los) compuesto(s) según lo definido en la presente y/o estereoisómero(s), sal(es), tautómero(s) o N-óxido(s) de los mismos. El término "compuesto(s) de la presente invención" debe entenderse como equivalente al término "compuesto(s) de acuerdo con la invención", por lo tanto, también comprende estereoisómeros(s), sal(es), tautómero(s) u N-óxido(s) de compuestos de fórmula (I).

El término "composición(es) de acuerdo con la invención" o "composición(es) de la presente invención" abarca la(s) composición(es) que comprende(n) al menos un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con la invención según lo definido anteriormente, por lo tanto, incluye también un estereoisómero, una sal agrícola o veterinariamente aceptable, un tautómero o un N-óxido de los compuestos de fórmula (I).

Los compuestos de la presente invención pueden ser amorfos o pueden existir en uno o más estados cristalinos diferentes (polimorfos) o modificaciones que pueden tener diferentes propiedades macroscópicas, tal como estabilidad, o mostrar diferentes propiedades biológicas, tales como actividades. La presente invención incluye tanto compuestos amorfos como cristalinos de fórmula (I), mezclas de diferentes estados cristalinos o modificaciones del respectivo compuesto I, así como sales amorfas o cristalinas del mismo.

Los compuestos de fórmula (I) pueden tener uno o, dependiendo del patrón de sustitución, más centros de quiralidad, en cuyo caso están presentes como mezclas de enantiómeros o diastereómeros. La invención proporciona tanto los enantiómeros puros únicos o diastereómeros puros de los compuestos de fórmula (I), y sus mezclas, y el uso de acuerdo con la invención de los enantiómeros puros o diastereómeros puros del compuesto de fórmula (I) o sus mezclas. Los compuestos adecuados de fórmula (I) también incluyen todos los estereoisómeros geométricos posibles (isómeros cis/trans) y mezclas de los mismos. Los isómeros cis/trans pueden estar presentes con respecto a un alqueno, enlace doble carbono-nitrógeno o grupo amida. El término "estereoisómero(s)" abarca tanto a los isómeros ópticos, tales como enantiómeros o diastereómeros, estos últimos existentes debido a más de un centro de quiralidad en la molécula, así como isómeros geométricos (isómeros cis/trans). La presente invención se refiere a todos los posibles estereoisómeros de los compuestos de fórmula (I), es decir, a enantiómeros únicos o diastereómeros, así como a las mezclas de los mismos.

Dependiendo del patrón de sustitución, los compuestos de fórmula (I) pueden estar presentes en forma de sus tautómeros. Por lo tanto, la invención también se refiere a los tautómeros de fórmula (I) y los estereoisómeros, sales, tautómeros y N-óxidos de dichos tautómeros.

Las sales de los compuestos de fórmula (I) son preferiblemente sales agrícola y/o veterinariamente aceptables. Pueden formarse en un método habitual, por ejemplo, haciendo reaccionar el compuesto con un ácido del anión en cuestión si el compuesto de fórmula (I) tiene una funcionalidad básica o haciendo reaccionar un compuesto ácido de fórmula (I) con una base adecuada.

Las sales agrícola o veterinariamente útiles son especialmente las sales de esos cationes o las sales de adición ácida de aquellos ácidos cuyos cationes y aniones, respectivamente, no tienen ningún efecto adverso sobre la acción de los compuestos de acuerdo con la presente invención. Los cationes adecuados son, en particular, los iones de los metales alcalinos, preferiblemente litio, sodio y potasio, de los metales alcalinotérreos, preferiblemente calcio, magnesio y bario, y

de los metales de transición, preferiblemente manganeso, cobre, zinc y hierro, así como el amonio (NH_4^+) y el amonio sustituido en el que de uno a cuatro de los átomos de hidrógeno se sustituyen por alquilo de $\text{C}_1\text{-C}_4$, hidroxialquilo de $\text{C}_1\text{-C}_4$, alcoxi de $\text{C}_1\text{-C}_4$, alcoxi de $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alquilo de $\text{C}_1\text{-C}_4$, hidroxi-alcoxi de $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alquilo de $\text{C}_1\text{-C}_4$, fenilo o bencilo. Los ejemplos de iones de amonio sustituidos comprenden metilamonio, isopropilamonio, dimetilamonio, diisopropilamonio, trimetilamonio, tetrametilamonio, tetraetilamonio, tetrabutilamonio, 2-hidroxietilamonio, 2-(2-hidroxietoxi)etil-amonio, bis(2-hidroxietil)amonio, benciltrimetilamonio y benciltriethylamonio, además iones de fosfonio, iones de sulfonio, preferiblemente tri(alquilo de $\text{C}_1\text{-C}_4$)sulfonio, e iones de sulfoxonio, preferiblemente tri(alquilo de $\text{C}_1\text{-C}_4$)sulfoxonio.

Los aniones de las sales de adición de ácidos útiles son principalmente cloruro, bromuro, fluoruro, sulfato de hidrógeno, sulfato, fosfato de dihidrógeno, fosfato de hidrógeno, fosfato, nitrato, carbonato de hidrógeno, carbonato, hexafluorosilicato, hexafluorofosfato, benzoato, y los aniones de los ácidos alcanicos de $\text{C}_1\text{-C}_4$, preferiblemente formiato, acetato, propionato y butirato. Pueden formarse al hacer reaccionar los compuestos de la fórmula I con un ácido del anión correspondiente, preferiblemente de ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico o ácido nítrico.

El término "N-óxido" incluye cualquier compuesto de la presente invención que tenga al menos un átomo de nitrógeno terciario que se oxida a un resto de N-óxido.

Los grupos de restos orgánicos mencionados en las definiciones anteriores de las variables son, como el término halógeno, términos colectivos para las listas individuales de los miembros individuales del grupo. El prefijo $\text{C}_n\text{-C}_m$ indica en cada caso el número posible de átomos de carbono en el grupo. Se entenderá que "halógeno" significa F, Cl, Br e I, preferiblemente F.

El término "sustituido con", por ejemplo, como se utiliza en "parcialmente o totalmente sustituido con" significa que uno o más, por ejemplo, 1, 2, 3, 4 o 5, o todos los átomos de hidrógeno de un radical determinado, han sido sustituidos con uno o más sustituyentes iguales o diferentes, tal como un halógeno, en particular F. Por consiguiente, para los restos cíclicos sustituidos, por ejemplo, 1-cianociclopropil, uno o más de los átomos de hidrógeno del resto cíclico pueden sustituirse con uno o más sustituyentes iguales o diferentes.

El término "alquilo de $\text{C}_n\text{-C}_m$ ", como se utiliza en la presente (y también en alquilamino de $\text{C}_n\text{-C}_m$, di-alquilamino de $\text{C}_n\text{-C}_m$, alquilaminocarbonilo de $\text{C}_n\text{-C}_m$, di-(alquilamino de $\text{C}_n\text{-C}_m$)carbonilo, alquiltio de $\text{C}_n\text{-C}_m$, alquilsulfinilo de $\text{C}_n\text{-C}_m$ y alquilsulfonilo de $\text{C}_n\text{-C}_m$) se refiere a un grupo hidrocarburo saturado, ramificado o no ramificado, de n a m, por ejemplo, 1 a 10 átomos de carbono, preferiblemente 1 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, butilo, 1-metilpropilo, 2-metilpropilo, 1,1-dimetiletilo, pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-dimetilpropilo, 1-etilpropilo, hexilo, 1,1-dimetilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, 1-metilpentilo, 2-metilpentilo, 3-metilpentilo, 4-metilpentilo, 1,1-dimetilbutilo, 1,2-dimetilbutilo, 1,3-dimetilbutilo, 2,2-dimetilbutilo, 2,3-dimetilbutilo, 3,3-dimetilbutilo, 1-etilbutilo, 2-etilbutilo, 1,1,2-trimetilpropilo, 1,2,2-trimetilpropilo, 1-etil-1-metilpropilo, 1-etil-2-metilpropilo, heptilo, octilo, 2-etilhexilo, nonilo y decilo, y sus isómeros. Alquilo de $\text{C}_1\text{-C}_4$ significa, por ejemplo, metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, butilo, 1-metilpropilo, 2-metilpropilo o 1,1-dimetiletilo.

El término "haloalquilo de $\text{C}_n\text{-C}_m$ ", como se utiliza en la presente (y también en haloalquilsulfinilo de $\text{C}_n\text{-C}_m$ y haloalquilsulfonilo de $\text{C}_n\text{-C}_m$), se refiere a un grupo alquilo de cadena recta o ramificada que tiene de n a m átomos de carbono, por ejemplo, 1 a 10, en particular 1 a 6 átomos de carbono (como se mencionó anteriormente), en donde algunos o todos los átomos de hidrógeno de estos grupos pueden sustituirse con átomos de halógeno como se mencionó anteriormente, por ejemplo, haloalquilo de $\text{C}_1\text{-C}_4$, tal como clorometilo, bromometilo, diclorometilo, triclorometilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorofluorometilo, diclorofluorometilo, clorodifluorometilo, 1-cloroetilo, 1-bromoetilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2-cloro-2-fluoroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 2,2-dicloro-2-fluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, pentafluoroetilo, y similares. El término haloalquilo de $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ en particular comprende fluoroalquilo de $\text{C}_1\text{-C}_2$, que es sinónimo de metilo o etilo, en donde 1, 2, 3, 4 o 5 átomos de hidrógeno se sustituyen con átomos de flúor, tales como fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetil, 2,2-difluoroetil, 2,2,2-trifluoroetil y pentafluorometilo.

Del mismo modo, "alcoxi de $\text{C}_n\text{-C}_m$ " y "alquiltio de $\text{C}_n\text{-C}_m$ " (o alquilsulfenilo de $\text{C}_n\text{-C}_m$, respectivamente) se refieren a grupos alquilo ramificados de cadena recta que tienen de n a m átomos de carbono, por ejemplo, de 1 a 10, en particular 1 a 6 o 1 a 4 átomos de carbono (como se mencionó anteriormente) unidos a través de oxígeno (o enlaces de azufre, respectivamente) en cualquier unión del grupo alquilo. Los ejemplos incluyen alcoxi de $\text{C}_1\text{-C}_4$, tales como metoxi, etoxi, propoxi, isopropoxi, butoxi, sec-butoxi, isobutoxi y terc-butoxi, además alquiltio de $\text{C}_1\text{-C}_4$, tales como metiltio, etiltio, propiltio, isopropiltio y n-butiltio.

Por consiguiente, los términos "haloalcoxi de $\text{C}_n\text{-C}_m$ " y "haloalquiltio de $\text{C}_n\text{-C}_m$ " (o haloalquilsulfenilo de $\text{C}_n\text{-C}_m$, respectivamente) se refieren a grupos alquilo de cadena recta o ramificada que tienen de n a m átomos de carbono, por ejemplo, 1 a 10, en particular de 1 a 6 o de 1 a 4 átomos de carbono (como se ha mencionado anteriormente) unidos a través de enlaces de oxígeno o azufre, respectivamente, en cualquier enlace del grupo alquilo, en donde algunos o todos los átomos de hidrógeno de estos grupos pueden sustituirse con átomos de halógeno como se mencionó anteriormente, por ejemplo, $\text{C}_1\text{-C}_2$ -haloalcoxi, tal como clorometoxi, bromometoxi, diclorometoxi, triclorometoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, clorofluorometoxi, diclorofluorometoxi, clorodifluorometoxi, 1-cloroetoxi, 1-bromoetoxi, 1-fluoroetoxi, 2-fluoroetoxi, 2,2-difluoroetoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2-fluoroetoxi, 2-cloro-2,2-difluoroetoxi, 2,2-dicloro-

2-fluoroetoxi, 2,2,2-tricloroetoxi y pentafluoroetoxi, además haloalquiltio de C₁-C₂, tal como clorometiltio, bromometiltio, diclorometiltio, triclorometiltio, fluorometiltio, difluorometiltio, trifluorometiltio, clorofluorometiltio, diclorofluorometiltio, clorodifluorometiltio, 1-cloroetiltio, 1-bromoetiltio, 1-fluoroetiltio, 2-fluoroetiltio, 2,2-difluoroetiltio, 2,2,2-trifluoroetiltio, 2-cloro-2-fluoroetiltio, 2-cloro-2,2-difluoroetiltio, 2,2-dicloro-2-fluoroetiltio, 2,2,2-tricloroetiltio y pentafluoroetiltio, y similares. Del mismo modo, los términos fluoroalcoxi de C₁-C₂ y fluoroalquiltio de C₁-C₂ se refieren a fluoroalquilo de C₁-C₂ que se une al resto de la molécula mediante un átomo de oxígeno o átomo de azufre, respectivamente.

El término "alqueno de C₂-C_m", tal como se utiliza en la presente, designa un grupo hidrocarburo insaturado ramificado o no ramificado que tiene de 2 a m, por ejemplo, 2 a 10 o 2 a 6 átomos de carbono y un enlace doble en cualquier posición, tales como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-metil-etenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-1-propenilo, 2-metil-1-propenilo, 1-metil-2-propenilo, 2-metil-2-propenilo, 1-pentenilo, 2-pentenilo, 3-pentenilo, 4-pentenilo, 1-metil-1-butenilo, 2-metil-1-butenilo, 3-metil-1-butenilo, 1-metil-2-butenilo, 2-metil-2-butenilo, 3-metil-2-butenilo, 1-metil-3-butenilo, 2-metil-3-butenilo, 3-metil-3-butenilo, 1,1-dimetil-2-propenilo, 1,2-dimetil-1-propenilo, 1,2-dimetil-2-propenilo, 1-etil-1-propenilo, 1-etil-2-propenilo, 1-hexenilo, 2-hexenilo, 3-hexenilo, 4-hexenilo, 5-hexenilo, 1-metil-1-pentenilo, 2-metil-1-pentenilo, 3-metil-1-pentenilo, 4-metil-1-pentenilo, 1-metil-2-pentenilo, 2-metil-2-pentenilo, 3-metil-2-pentenilo, 4-metil-2-pentenilo, 1-metil-3-pentenilo, 2-metil-3-pentenilo, 3-metil-3-pentenilo, 4-metil-3-pentenilo, 1-metil-4-pentenilo, 2-metil-4-pentenilo, 3-metil-4-pentenilo, 4-metil-4-pentenilo, 1,1-dimetil-2-butenilo, 1,1-dimetil-3-butenilo, 1,2-dimetil-1-butenilo, 1,2-dimetil-2-butenilo, 1,2-dimetil-3-butenilo, 1,3-dimetil-1-butenilo, 1,3-dimetil-2-butenilo, 1,3-dimetil-3-butenilo, 2,2-dimetil-3-butenilo, 2,3-dimetil-1-butenilo, 2,3-dimetil-2-butenilo, 2,3-dimetil-3-butenilo, 3,3-dimetil-1-butenilo, 3,3-dimetil-2-butenilo, 1-etil-1-butenilo, 1-etil-2-butenilo, 1-etil-3-butenilo, 2-etil-1-butenilo, 2-etil-2-butenilo, 2-etil-3-butenilo, 1,1,2-trimetil-2-propenilo, 1-etil-1-metil-2-propenilo, 1-etil-2-metil-1-propenilo y 1-etil-2-metil-2-propenilo.

El término "alquino de C₂-C_m" como se usa en la presente se refiere a un grupo de hidrocarburos no saturados ramificado o no ramificados que tiene de 2 a m, por ejemplo, 2 a 10 o 2 a 6 átomos de carbono, y que contiene al menos un enlace triple, tal como etinilo, propinilo, 1-butinilo, 2-butinilo y similares.

El término "alcoxi de C_n-C_m-alquilo de C_n-C_m" como se utiliza en la presente se refiere al alquilo que tiene de n a m átomos de carbono, por ejemplo, como ejemplos específicos mencionados anteriormente, en donde un átomo de hidrógeno del radical alquilo es reemplazado por un grupo C_n-C_m-alcoxi; en donde el valor de n y m del grupo alquilo se elige independientemente del valor del grupo alquilo.

El sufijo "-carbonilo" en un grupo o "C(=O)" denota en cada caso que el grupo está unido al resto de la molécula a través de un grupo carbonilo C=O. Este es el caso, por ejemplo, en alquilcarbonilo, haloalquilcarbonilo, aminocarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, alcoxicarbonilo, haloalcoxicarbonilo.

El término "arilo" como se utiliza en la presente se refiere a un radical aromático de hidrocarburos mono-, bi- o tricíclico, tal como fenilo o naftilo, en particular fenilo (también denominado C₆H₅ como sustituyente).

El término "cicloalquilo de C₃-C_m" como se usa en la presente se refiere a un anillo monocíclico de radicales cicloalifáticos saturados de 3 a m-miembros, por ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo, ciclooctilo y ciclodecilo.

El término "alquilcicloalquilo" denota, así como el término "alquilo que puede estar sustituido con cicloalquilo", un grupo alquilo que está sustituido con un anillo de cicloalquilo, en donde alquilo y cicloalquilo son según lo definido en la presente.

El término "cicloalquilalquilo" denota, así como el término "cicloalquilo que puede estar sustituido con alquilo", un anillo de cicloalquilo que está sustituido con un grupo alquilo, en donde alquilo y cicloalquilo son según lo definido en la presente.

El término "alquilcicloalquilalquilo" denota, así como el término "alquilcicloalquilo que puede estar sustituido con alquilo", un grupo alquilcicloalquilo que está sustituido con un alquilo, en donde alquilo y alquilcicloalquilo son según lo definido en la presente.

El término "cicloalqueno de C₃-C_m" como se utiliza en la presente se refiere a un anillo monocíclico de radicales cicloalifáticos parcialmente insaturados de 3 a m-miembros.

El término "cicloalquilcicloalquilo" denota, así como el término "cicloalquilo que puede estar sustituido con cicloalquilo" una sustitución de cicloalquilo en otro anillo de cicloalquilo, en donde cada anillo de cicloalquilo tiene independientemente de 3 a 7 átomos de carbono miembros del anillo y los cicloalquilos están unidos mediante un enlace simple o tienen un átomo de carbono común. Ejemplos de cicloalquilcicloalquilo incluyen el ciclopropilciclopropilo (por ejemplo, 1,1'-ciclopropil-2-ilo), ciclohexilciclohexilo, en donde los dos anillos están unidos a través de un único átomo de carbono común (por ejemplo, 1,1'-biciclohexil-2-ilo), ciclohexilciclopentilo, en donde los dos anillos están unidos por un enlace simple (por ejemplo, 4-ciclopentilciclohexilo) y sus diferentes estereoisómeros, tales como (1R,2S)-1, 1'-biciclopropil-2-ilo y (1R,2R)-1,1'-biciclopropil-2-ilo. El término "carbociclo" o "carbocicli" incluye, a menos que se indique lo contrario, en general un anillo monocíclico de 3 a 12 miembros, preferiblemente de 3 a 8 miembros o de 5 a 8 miembros, más preferiblemente de 5 o 6 miembros, que comprende de 3 a 12, preferiblemente de 3 a 8 o de 5 a 8, más preferiblemente 5 o 6 átomos de carbono.

Los radicales carbocíclicos pueden estar saturados, parcialmente insaturados o totalmente insaturados. Preferiblemente, el término "carbociclo" abarca los grupos cicloalquilo y cicloalqueno según lo definido anteriormente, por ejemplo, anillos de ciclopropano, ciclobutano, ciclopentano y ciclohexano. Cuando se hace referencia a carbociclos "totalmente insaturados", este término también incluye carbociclos "aromáticos". En ciertas realizaciones preferidas, un carbociclo totalmente insaturado es un carbociclo aromático como se define a continuación, preferiblemente un carbociclo aromático de 6 miembros.

Los términos "hetarilo", "heterociclo aromático" o "anillo heterocíclico aromático" incluyen radicales heteroaromáticos monocíclicos de 5 o 6 miembros que comprenden como miembros del anillo 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados de N, O y S. Algunos ejemplos de radicales heteroaromáticos de 5 o 6 miembros son piridilo, es decir, 2-, 3-, o 4-piridilo, pirimidinilo, es decir, 2-, 4- o 5-pirimidinilo, pirazinilo, piridazinilo, es decir, 3- o 4-piridazinilo, tienilo, es decir, 2- o 3-tienilo, furilo, es decir, 2- o 3-furilo, pirrolilo, es decir, 2- o 3-pirrolilo, oxazolilo, es decir, 2-, 3- o 5-oxazolilo, isoxazolilo, es decir, 3-, 4- o 5-isoxazolilo, tiazolilo, es decir, 2-, 3- o 5-tiazolilo, isotiazolilo, es decir, 3-, 4- o 5-isotiazolilo, pirazolilo, es decir, 1-, 3-, 4- o 5-pirazolilo, es decir, 1-, 2-, 4- o 5-imidazolilo, oxadiazolilo, por ejemplo, 2- o 5-[1,3,4]oxadiazolilo, 4- o 5-(1,2,3-oxadiazolilo), 3- o 5-(1,2,4-oxadiazolilo), 2- o 5-(1,3,4-tiadiazolilo), tiadiazolilo, por ejemplo, 2- o 5-(1,3,4-tiadiazolilo), 4- o 5-(1,2,3-tiadiazolilo), 3- o 5-(1,2,4-tiadiazolilo), triazolilo, por ejemplo, 1H-, 2H- o 3H-1,2,3-triazol-4-ilo, 2H-triazol-3-ilo, 1H-, 2H-, o 4H-1,2,4-triazolilo y tetrazolilo, es decir, 1H- o 2H-tetrazolilo. El término "hetarilo" también incluye radicales heteroaromáticos cíclicos de 8 a 10 miembros que comprenden como miembros de anillo 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de N, O y S, en donde un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros se fusiona con un anillo fenilo o con un radical heteroaromático de 5 o 6 miembros. Los ejemplos de un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros fusionado a un anillo fenilo o a un radical heteroaromático de 5 o 6 miembros incluyen benzofuranilo, benzotienilo, indolilo, indazolilo, bencimidazolilo, benzoxatiazolilo, benzoxadiazolilo, benzotiadiazolilo, benzoxazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, purinilo, 1,8-naftiridilo, pteridilo, pirido[3,2-d]pirimidilo o piridoimidazolilo, y similares. Estos radicales hetarilo fusionados pueden unirse al resto de la molécula mediante cualquier átomo de anillo de un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros o mediante un átomo de carbono del resto de fenilo fusionado.

Los términos "heterociclo", "heterociclilo" o "anillo heterocíclico" incluyen, a menos que se indique lo contrario, en general de 3 a 12 miembros, preferiblemente de 3 a 8 miembros, de 3 a 7 miembros o de 5 a 8 miembros, más preferiblemente de 5 o 6 miembros, en particular los radicales heterocíclicos monocíclicos de 6 miembros. Los radicales heterocíclicos pueden estar saturados, parcialmente insaturados o totalmente insaturados. Como se utiliza en este contexto, el término "totalmente insaturado" también incluye "aromático". En una realizaciones preferida, un heterociclo totalmente insaturado es, por lo tanto, un heterociclo aromático, preferiblemente un heterociclo aromático de 5 o 6 miembros que comprende uno o más, por ejemplo, 1, 2, 3 o 4, preferiblemente 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de N, O y S como miembros del anillo. Ejemplos de heterociclos aromáticos se proporcionaron anteriormente en relación con la definición de "hetarilo". A menos que se indique lo contrario, los "hetarilos" están cubiertos por el término "heterociclos". Los radicales heterocíclicos no aromáticos generalmente comprenden 1, 2, 3, 4 o 5, preferiblemente 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de N, O y S como miembros del anillo, en donde los átomos S como miembros del anillo pueden estar presentes como S, SO o SO₂. Los ejemplos de radicales heterocíclicos de 5 o 6 miembros comprenden anillos heterocíclicos no aromáticos saturados o insaturados, tal como oxiranilo, oxetanilo, tietanilo, tietanilo-S-óxido (S-oxotietanilo), tietanilo-S-dióxido (S-dioxotietanilo), pirrolidinilo, pirrolinilo, pirazolinilo, tetrahidrofurano, dihidrofurano, 1,3-dioxolanilo, tiolanilo, S-oxotiolanilo, S-dioxotiolanilo, dihidrotienilo, S-oxodihidrotienilo, S-dioxodihidrotienilo, oxazolidinilo, oxazolinilo, tiazolinilo, oxatiolanilo, piperidinilo, piperazinilo, piranilo, dihidropiranilo, tetrahidropiranilo, 1,3- y 1,4-dioxanilo, tiopiranilo, S-oxotiopiranilo, S-dioxotiopiranilo, dihidrotiopiranilo, S-oxodihidrotiopiranilo, S-dioxodihidrotiopiranilo, tetrahidrotiopiranilo, S-oxotetrahidrotiopiranilo, S-dioxotetrahidrotiopiranilo, morfolinilo, tiomorfolinilo, S-oxotiomorfolinilo, S-dioxotiomorfolinilo, tiazinilo, y similares. Los ejemplos de anillos heterocíclicos que también comprenden 1 o 2 grupos carbonilos como miembros del anillo comprenden pirrolidin-2-onilo, pirrolidin-2,5-dionilo, imidazolidin-2-onilo, oxazolidin-2-onilo, tiazolidin-2-onilo y similares. Los términos "alquilenilo", "alquilenilo" y "alquinileno" se refieren a alquilo, alqueno y alquino definidos anteriormente, respectivamente, que están unidos al resto de la molécula mediante dos átomos, preferiblemente mediante dos átomos de carbono, del grupo respectivo, de modo que representen un enlazador entre dos restos de la molécula. En particular, el término "alquilenilo" puede referirse a cadenas de alquilo, tales como CH₂CH₂, -CH(CH₃)-, CH₂CH₂CH₂, CH(CH₃)CH₂, CH₂CH(CH₃), CH₂CH₂CH₂CH₂, CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂, CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂, y CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂. Del mismo modo, "alquilenilo" y "alquinileno" pueden referirse a cadenas de alqueno y alquino, respectivamente.

El término "anillo carbocíclico de 5 a 6 miembros" como se utiliza en la presente se refiere a los anillos de ciclopentano y ciclohexano.

Algunos ejemplos de anillos heterocíclicos saturados de 5 o 6 miembros son: 2-tetrahidrofurano, 3-tetrahidrofurano, 2-tetrahidrotienilo, 3-tetrahidrotienilo, 2-pirrolidinilo, 3-pirrolidinilo, 3-pirazolidinilo, 4-pirazolidinilo, 5-pirazolidinilo, 2-imidazolidinilo, 4-imidazolidinilo, 2-oxazolidinilo, 4-oxazolidinilo, 5-oxazolidinilo, 3-isoxazolidinilo, 4-isoxazolidinilo, 5-isoxazolidinilo, 2-tiazolidinilo, 4-tiazolidinilo, 5-tiazolidinilo, 3-isotiazolidinilo, 4-isotiazolidinilo, 5-isotiazolidinilo, 1,2,4-oxadiazolidin-3-ilo, 1,2,4-oxadiazolidin-5-ilo, 1,2,4-tiadiazolidin-3-ilo, 1,2,4-tiadiazolidin-5-ilo, 1,2,4-triazolidin-3-ilo, 1,3,4-oxadiazolidin-2-ilo, 1,3,4-tiadiazolidin-2-ilo, 1,3,4-triazolidin-2-ilo, 2-tetrahidropiranilo, 4-tetrahidropiranilo, 1,3-dioxan-5-ilo, 1,4-dioxan-2-ilo, 2-piperidinilo, 3-piperidinilo, 4-piperidinilo, 3-hexahidropiridazinilo, 4-hexahidropiridazinilo, 2-hexahidropirimidinilo, 4-hexahidropirimidinilo, 5-hexahidropirimidinilo, 2-piperazinilo, 1,3,5-hexahidrotiazin-2-ilo y 1,2,4-hexahidrotiazin-3-ilo, 2-morfolinilo, 3-morfolinilo, 2-tiomorfolinilo, 3-tiomorfolinilo, 1-oxotiomorfolin-2-ilo, 1-oxotiomorfolin-

3-ilo, 1,1-dioxotiomorfolin-2-ilo, 1,1-dioxotiomorfolin-3-ilo.

Algunos ejemplos de anillos heterocíclico o heterocíclicos parcialmente insaturados de 5 o 6 miembros incluyen: 2,3-dihidrofur-2-ilo, 2,3-dihidrofur-3-ilo, 2,4-dihidrofur-2-ilo, 2,4-dihidrofur-3-ilo, 2,3-dihidrotien-2-ilo, 2,3-dihidrotien-3-ilo, 2,4-dihidrotien-2-ilo, 2,4-dihidrotien-3-ilo, 2-pirrolin-2-ilo, 2-pirrolin-3-ilo, 3-pirrolin-2-ilo, 3-pirrolin-3-ilo, 2-isoxazolin-3-ilo, 3-isoxazolin-3-ilo, 4-isoxazolin-3-ilo, 2-isoxazolin-4-ilo, 3-isoxazolin-4-ilo, 4-isoxazolin-4-ilo, 2-isoxazolin-5-ilo, 3-isoxazolin-5-ilo, 4-isoxazolin-5-ilo, 2-isotiazolin-3-ilo, 3-isotiazolin-3-ilo, 4-isotiazolin-3-ilo, 2-isotiazolin-4-ilo, 3-isotiazolin-4-ilo, 4-isotiazolin-4-ilo, 2-isotiazolin-5-ilo, 3-isotiazolin-5-ilo, 4-isotiazolin-5-ilo, 2,3-dihidropirazol-1-ilo, 2,3-dihidropirazol-2-ilo, 2,3-dihidropirazol-3-ilo, 2,3-dihidropirazol-4-ilo, 2,3-dihidropirazol-5-ilo, 3,4-dihidropirazol-1-ilo, 3,4-dihidropirazol-3-ilo, 3,4-dihidropirazol-4-ilo, 3,4-dihidropirazol-5-ilo, 4,5-dihidropirazol-1-ilo, 4,5-dihidropirazol-3-ilo, 4,5-dihidropirazol-4-ilo, 4,5-dihidropirazol-5-ilo, 2,3-dihidrooxazol-2-ilo, 2,3-dihidrooxazol-3-ilo, 2,3-dihidrooxazol-4-ilo, 2,3-dihidrooxazol-5-ilo, 3,4-dihidrooxazol-2-ilo, 3,4-dihidrooxazol-3-ilo, 3,4-dihidrooxazol-4-ilo, 3,4-dihidrooxazol-5-ilo, 3,4-dihidrooxazol-2-ilo, 3,4-dihidrooxazol-3-ilo, 3,4-dihidrooxazol-4-ilo, 2-, 3-, 4-, 5- o 6-di- o tetrahidropiridinilo, 3-di- o tetrahidropiridazinilo, 4-di- o tetrahidropiridazinilo, 2-di- o tetrahidropirimidinilo, 4-di- o tetrahidropirimidinilo, 5-di- o tetrahidropirimidinilo, di- o tetrahidropirazinilo, 1,3,5-di- o tetrahidrotriazin-2-ilo.

Ejemplos de anillos heterocíclicos (hetero) o heteroaromáticos totalmente insaturados de 5 o 6 miembros son: 2-furilo, 3-furilo, 2-tienilo, 3-tienilo, 2-pirrolilo, 3-pirrolilo, 3-pirazolilo, 4-pirazolilo, 5-pirazolilo, 2-oxazolilo, 4-oxazolilo, 5-oxazolilo, 2-tiazolilo, 4-tiazolilo, 5-tiazolilo, 2-imidazolilo, 4-imidazolilo, 1,3,4-triazol-2-ilo, 2-piridinilo, 3-piridinilo, 4-piridinilo, 3-piridazinilo, 4-piridazinilo, 2-pirimidinilo, 4-pirimidinilo, 5-pirimidinilo y 2-pirazinilo.

Un "alquileo de C₂-C_m" es una cadena alifática saturada ramificada divalente o preferiblemente no ramificada que tiene de 2 a m, por ejemplo, de 2 a 7 átomos de carbono, por ejemplo, CH₂CH₂, -CH(CH₃)-, CH₂CH₂CH₂, CH(CH₃)CH₂, CH₂CH(CH₃), CH₂CH₂CH₂CH₂, CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂, CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂, y CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂.

El término "alquilamina" como se usa en la presente se refiere a un grupo alquilo saturado de cadena recta o ramificado que tiene de 1 a 10 átomos de carbono, preferiblemente de 1 a 4 átomos de carbono, más preferiblemente de 1 a 3 átomos de carbono, que se une mediante un átomo de nitrógeno, por ejemplo, un grupo -NH-.

El término "dialquilamino" como se usa en la presente se refiere a un grupo de alquilo saturado de cadena recta o ramificado que tiene de 1 a 10 átomos de carbono, preferiblemente de 1 a 4 átomos de carbono, más preferiblemente de 1 a 3 átomos de carbono, que se une mediante un átomo de nitrógeno, que está sustituido con otro grupo de alquilo saturado de cadena recta o ramificado que tiene de 1 a 10 átomos de carbono, preferiblemente de 1 a 4 átomos de carbono, más preferiblemente de 1 a 3 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo metilamino o etilamino.

El término "alquiltio" (alquiltio: alquilo-S-) como se usa en la presente se refiere a un grupo alquilo saturado de cadena recta o ramificado que tiene de 1 a 10 átomos de carbono, preferiblemente de 1 a 4 átomos de carbono (= alquiltio de C₁-C₄), más preferiblemente de 1 a 3 átomos de carbono, que se une mediante un átomo de azufre. Los ejemplos incluyen metiltio, etiltio, propiltio, isopropiltio y n-butiltio.

El término "haloalquiltio" como se usa en la presente se refiere a un grupo de alquiltio como se mencionó anteriormente, en donde los átomos de hidrógeno son parcialmente o totalmente sustituidos con flúor, cloro, bromo y/o yodo. Los ejemplos incluyen clorometiltio, bromometiltio, diclorometiltio, triclorometiltio, fluorometiltio, difluorometiltio, trifluorometiltio, clorofluorometiltio, diclorofluorometiltio, clorodifluorometiltio, 1-cloroetiltio, 1-bromoetiltio, 1-fluoroetiltio, 2-fluoroetiltio, 2,2-difluoroetiltio, 2,2,2-trifluoroetiltio, 2-cloro-2-fluoroetiltio, 2-cloro-2,2-difluoroetiltio, 2,2-dicloro-2-fluoroetiltio, 2,2,2-tricloroetiltio y pentafluoroetiltio, y similares.

El término "alquilsulfinilo" (alquilsulfoxilo: Alquilo de C₁-C₆-S(=O)-), como se utiliza en la presente se refiere a un grupo de alquilo saturado de cadena recta o ramificado (como se mencionó anteriormente) que tiene de 1 a 10 átomos de carbono, preferiblemente de 1 a 4 átomos de carbono (= alquilsulfinilo de C₁-C₄), más preferiblemente 1 a 3 átomos de carbono unidos mediante el átomo de azufre del grupo sulfinilo en cualquier posición del grupo alquilo.

El término "alquilsulfonilo" (alquilo-S(=O)₂-) como se usa en la presente se refiere a un grupo alquilo saturado de cadena recta o ramificado que tiene de 1 a 10 átomos de carbono, preferiblemente 1 a 4 átomos de carbono (= alquilsulfonilo de C₁-C₄), preferiblemente 1 a 3 átomos de carbono, que se unen mediante el átomo de azufre del grupo sulfonilo en cualquier posición del grupo alquilo.

El término alquilcarbonilo (C₁-C₆-C(=O)-) se refiere a un grupo alquilo de cadena recta o ramificado según lo definido anteriormente, que se une mediante el átomo de carbono de un grupo carbonilo (C=O) al resto de la molécula.

El término "alcoxycarbonilo" se refiere a un grupo alcoxi tal como se definió anteriormente, que se une mediante el átomo de carbono de un grupo carbonilo (C=O) al resto de la molécula.

El término "alquilaminocarbonilo" (C₁-C₆-NH-C(=O)-) se refiere a un grupo alquilamino de cadena recta o ramificado según lo definido anteriormente, que se une mediante el átomo de carbono de un grupo carbonilo (C=O) al resto de la molécula. Del mismo modo, el término "dialquilaminocarbonilo" se refiere a un grupo alquilo saturado de cadena recta o ramificado

según lo definido anteriormente, que está unido a un átomo de nitrógeno, que está sustituido con otro grupo alquilo saturado de cadena recta o ramificado según lo definido anteriormente, cuyo átomo de nitrógeno a su vez está unido mediante un grupo carbonilo (C=O) al resto de la molécula.

5 Métodos de preparación

Los compuestos de fórmula (I) pueden prepararse mediante métodos estándar de química orgánica. Si ciertos derivados no pueden ser preparados por los procesos descritos a continuación, se pueden obtener mediante la derivatización de otros compuestos de fórmula (I) que son accesibles por estos métodos.

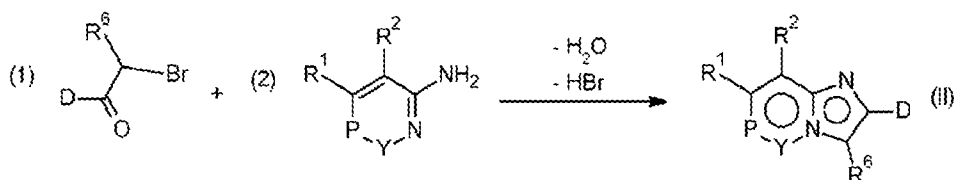
10

Los métodos de preparación que son generalmente útiles para la preparación de compuestos de fórmula (I) se han divulgado en EP3257853A1, especialmente en las p. 33-57 y en la sección experimental, así como en WO2017/167832A1, especialmente en las p. 4-6 y en la sección experimental.

15

Los compuestos de fórmula (II), correspondientes a los compuestos de fórmula (I) en donde Q es C(R⁶), pueden prepararse por reacción de compuestos de fórmula (1) con compuestos de fórmula (2), como se muestra en el Proceso 1.

Proceso 1:



20

Todas las variables en las fórmulas (1), (2) y (II) tienen un significado según lo definido para la fórmula (I). Los compuestos de fórmula (1) y los compuestos de fórmula (2) suelen reaccionar entre sí en cantidades equimolares. En términos de rendimiento, puede ser ventajoso emplear un exceso de compuestos de fórmula (2). Las reacciones de este tipo se han descrito en EP3257853A1, p. 33-34. La reacción suele llevarse a cabo a temperaturas elevadas de 50-160 °C en un disolvente inerte. Los disolventes adecuados son hidrocarburos alifáticos, tales como pentano, hexano, ciclohexano o éter de petróleo; hidrocarburos aromáticos, tales como benceno, tolueno, o-, m- y p-xileno; hidrocarburos halogenados o hidrocarburos aromáticos halogenados de C₆-C₁₀, tales como CH₂Cl₂, CHCl₃, CCl₄, CH₂ClCH₂Cl, CCl₃CH₃, CHCl₂CH₂Cl, CCl₂CCl₂, o clorobenceno; éteres, tales como CH₃CH₂OCH₂CH₃, (CH₃)₂CHOCH(CH₃)₂, CH₃OC(CH₃)₃ (MTBE), CH₃OCH₃ (DME), CH₃OCH₂CH₂OCH₃, CH₃OC(CH₃)₂CH₂CH₃, dioxano, anisol, 2-metil-tetrahydrofurano, tetrahydrofurano (THF) y dietilenglicol; nitrilos, tales como CH₃CN, y CH₃CH₂CN; alcoholes, tales como CH₃OH, CH₃CH₂OH, CH₃CH₂CH₂OH, CH₃CH(OH)CH₃, CH₃(CH₂)₃OH, and C(CH₃)₃OH, CH₂(OH)CH₂(OH), CH₃CH(OH)CH₂OH; amidas y derivados de urea, tales como dimetilformamida (DMF), N-metil-2-pirrolidona (NMP), dimetilacetamida (DMA), 1,3-dimetil-2-imidazolidinona (DMI), 1,3-dimetil-3,4,5,6-tetrahydro-2(1H)-pirimidinona (DMPU), hexametilfosfamida (HMPA); además dimetilsulfóxido (DMSO), sulfolano y agua. También son posibles mezclas de los disolventes anteriores. La reacción puede llevarse a cabo en presencia de un catalizador, tal como un ácido o una base, preferiblemente una base. Las bases adecuadas son, en general, bases inorgánicas, tales como LiOH, NaOH, KOH, y Ca(OH)₂; óxidos de metales alcalinos y alcalinotérreos, tales como Li₂O, Na₂O, CaO, y MgO; hidruros de metales alcalinos y alcalinotérreos, tales como LiH, NaH, KH y CaH₂; carbonatos de metales alcalinos y alcalinotérreos, tales como Li₂CO₃, K₂CO₃ y CaCO₃; bicarbonatos de metales alcalinos, tales como NaHCO₃; bases orgánicas, tales como pirrolidina; aminas terciarias, tales como diisopropilamina, trimetilamina, trietilamina, triisopropilamina y N-metilpiperidina, imidazol, piridina; piridinas sustituidas, tales como colidina, lutidina y 4-dimetilaminopiridina, y amidas y amidinas policíclicas, tales como el 1,8-diazabicyclo[7.1.1]undec-7-eno (DBU), 1,4-diazabicyclo[2.2.2]octano (DABCO); sales metálicas alcalinas de aminas secundarias, tales como diisopropilamida alcalina, bis(trimetilsilil)amida alcalina, tetrametilpiperideno alcalino; alcoholatos, tales como metanolato alcalino, etanolato alcalino, isopropanolato alcalino, terc-butanolato alcalino; sales de metal alcalino - alquilo, y de metal alcalino - arilo, tales como n-butil-litio, terc-butil-litio, fenil-litio. También son posibles mezclas de las bases anteriormente mencionadas. Las bases se emplean generalmente en cantidades catalíticas; sin embargo, también pueden utilizarse en cantidades equimolares, en exceso o, en su caso, como disolvente.

35

40

45

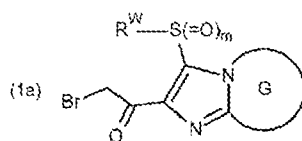
50

Los compuestos de fórmula (2) pueden prepararse como se describe en WO2017/167832A1, por ejemplo, en el Ejemplo C-1.

Los compuestos de fórmula (1) están disponibles comercialmente o pueden prepararse como se describe en EP3257853A1, p. 51, Esquema de reacción 1.

55

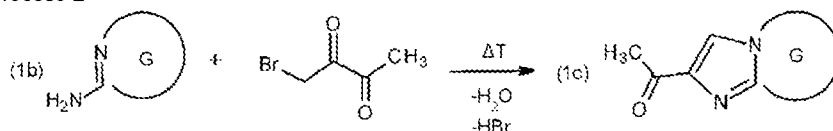
En consecuencia, los compuestos de fórmula (1a), en donde todas las variables tienen una definición como en la fórmula (I), y que se ajustan a la definición de la fórmula (1), pueden prepararse, por ejemplo, de la siguiente manera.



En un primer paso representado en el Proceso 2, el compuesto 1-bromobutano-2,3-diona se hace reaccionar con un compuesto de fórmula (1b) a temperaturas elevadas para producir derivados de imidazol de fórmula (1c)

5

Proceso 2



en donde todas las variables tienen el significado definido para la fórmula (I), y en donde ΔT significa temperatura elevada. Esta transformación suele llevarse a cabo a temperaturas de 40 °C a 100 °C, preferiblemente de 45 °C a 60 °C, en un disolvente inerte. Los disolventes inertes adecuados son hidrocarburos alifáticos, preferiblemente un hidrocarburo alifático de C₅-C₁₆, más preferiblemente un alcano de C₅-C₁₆, o un cicloalcano de C₅-C₁₆, tal como pentano, hexano, ciclohexano o éter de petróleo; hidrocarburos aromáticos, preferiblemente un hidrocarburo aromático de C₆-C₁₀, tal como benceno, tolueno, o-, m- y p-xileno; hidrocarburos halogenados, preferiblemente alcanos de C₁-C₆ alifáticos halogenados, o hidrocarburos de C₆-C₁₀ aromáticos halogenados, tales como CH₂Cl₂, CHCl₃, CCl₄, CH₂ClCH₂Cl, CCl₃CH₃, CHCl₂CH₂Cl, CCl₂CCl₂, o clorobenceno; éteres, preferiblemente éteres de cicloalquilo de C₁-C₆, éteres de alquilo de C₁-C₆-alquilo de C₁-C₆ y éteres de alquilo de C₁-C₆-arilo de C₆-C₁₀, tales como CH₃CH₂OCH₂CH₃, (CH₃)₂CHOCH(CH₃)₂, CH₃OC(CH₃)₃ (MTBE), CH₃OCH₃ (DME), CH₃OCH₂CH₂OCH₃, dioxano, anisol y tetrahidrofurano (THF); ésteres, preferiblemente ésteres de alcoholes de C₁-C₆ alifáticos con ácidos carboxílicos de C₁-C₆ alifáticos, ésteres de alcoholes de C₆-C₁₀ aromáticos con ácidos carboxílicos de C₆-C₁₀ aromáticos, ésteres cíclicos de ácidos ω-hidroxi-carboxílicos de C₁-C₆, tales como CH₃C(O)OCH₂CH₃, CH₃C(O)OCH₃, CH₃C(O)OCH₂CH₂CH₂CH₃, CH₃C(O)OCH(CH₃)CH₂CH₃, CH₃C(O)OC(CH₃)₃, CH₃CH₂CH₂C(O)OCH₂CH₃, CH₃CH(OH)C(O)OCH₂CH₃, CH₃CH(OH)C(O)OCH₃, CH₃C(O)OCH₂CH(CH₃)₂, CH₃C(O)OCH(CH₃)₂, CH₃CH₂C(O)OCH₃, benzoato de bencilo y γ-butirolactona; carbonatos, tales como carbonato de etileno, carbonato de propileno, CH₃CH₂OC(O)OCH₂CH₃, y CH₃OC(O)OCH₃; nitrilos, preferiblemente nitrilos de C₁-C₆, tales como CH₃CN, y CH₃CH₂CN; cetonas, preferiblemente cetonas de alquilo de C₁-C₆-alquilo de C₁-C₆, tales como CH₃C(O)CH₃, CH₃C(O)CH₂CH₃, CH₃CH₂C(O)CH₂CH₃, y CH₃C(O)C(CH₃)₃ (MTBK); alcoholes, preferiblemente alcoholes de C₁-C₄, tales como CH₃OH, CH₃CH₂OH, CH₃CH₂CH₂OH, CH₃CH(OH)CH₃, CH₃(CH₂)₃OH, y C(CH₃)₃OH; amidas y derivados de urea, preferiblemente dimetilformamida (DMF), N-metil-2-pirrolidona (NMP), dimetilacetamida (DMA), 1,3-dimetil-2-imidazolidinona (DMI), 1,3-dimetil-3,4,5,6-tetrahidro-2(1H)-pirimidinona (DMPU), hexametilfosfamida (HMPA); además, dimetilsulfóxido (DMSO), sulfolano y mezclas de los mismos. Los reactivos típicamente se aplican en cantidades equimolares. Sin embargo, la proporción molar de 1-bromobutano-2,3-diona respecto al compuesto de fórmula (1b) también puede ser superior a 1:1, por ejemplo, 2:1 o 3:1.

30

En un Proceso 3 posterior, los compuestos de fórmula (1c) pueden halogenarse para obtener compuestos de fórmula (1d)

Proceso 3



35

en donde la variable Hal significa un átomo de halógeno, por ejemplo, Cl, y en donde todas las demás variables tienen un significado según lo definido para la fórmula (I). Esta transformación suele llevarse a cabo a temperaturas de entre 10 °C y 40 °C en un disolvente inerte. Los disolventes inertes adecuados son, por ejemplo, hidrocarburos alifáticos, preferiblemente un hidrocarburo de C₅-C₁₆ alifático, más preferiblemente un alcano de C₅-C₁₆, o un cicloalcano de C₅-C₁₆, tal como pentano, hexano, ciclohexano o éter de petróleo; hidrocarburos halogenados, preferiblemente alcanos de C₁-C₆ alifáticos halogenados, o hidrocarburos de C₆-C₁₀ aromáticos halogenados, tales como CH₂Cl₂, CHCl₃, CCl₄, CH₂ClCH₂Cl, CCl₃CH₃, CHCl₂CH₂Cl, CCl₂CCl₂, o clorobenceno.

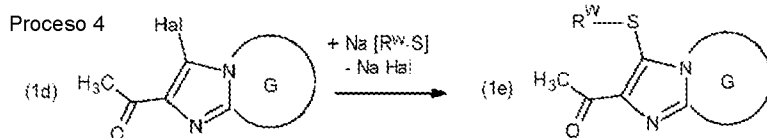
40

Los agentes halogenantes son bien conocidos por el experto en la técnica. Algunos ejemplos típicos son 2-cloro-1,3-bis(metoxicarbonil)guanidina, N-yodosuccinimida, N-bromosuccinimida y N-clorosuccinimida. Los reactivos típicamente se aplican en cantidades equimolares. Sin embargo, la relación molar del agente halogenante respecto a los compuestos de fórmula (1c) también puede ser superior a 1:1, por ejemplo, 2:1 o 3:1.

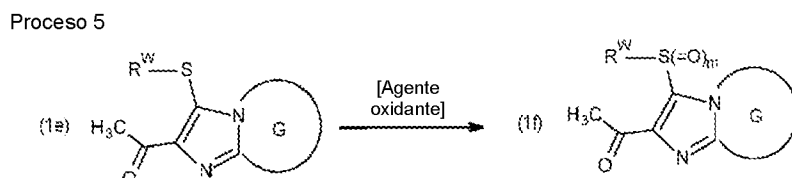
45

Posteriormente, los compuestos de fórmula (1d) pueden hacerse reaccionar en el proceso 4 con un agente de tiolato R^W-S-, que puede aplicarse en forma de su sal de sodio Na [R^W-S], para obtener compuestos de fórmula (1e)

50



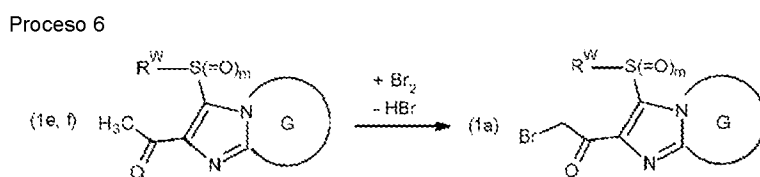
- 5 en donde Hal significa halógeno, y en donde todas las demás variables tienen el significado definido para la fórmula (I). Esta transformación suele llevarse a cabo a temperaturas de entre $-10\text{ }^{\circ}\text{C}$ y $20\text{ }^{\circ}\text{C}$, en un disolvente inerte. Los disolventes inertes adecuados son hidrocarburos alifáticos, preferiblemente un hidrocarburo de C_5 - C_{16} alifático, más preferiblemente un alcano de C_5 - C_{16} , o cicloalcano de C_5 - C_{16} , tal como pentano, hexano, ciclohexano, o éter de petróleo; hidrocarburos aromáticos, preferiblemente un hidrocarburo de C_6 - C_{10} aromático, tal como benceno, tolueno, o-, m-, y p-xileno; éteres, preferiblemente éteres de cicloalquilo de C_1 - C_6 , éteres de alquilo de C_1 - C_6 -alquilo de C_1 - C_6 y éteres de alquilo de C_1 - C_6 -arilo de C_6 - C_{10} , tales como $CH_3CH_2OCH_2CH_3$, $(CH_3)_2CHOCH(CH_3)_2$, $CH_3OC(CH_3)_3$ (MTBE), CH_3OCH_3 (DME), $CH_3OCH_2CH_2OCH_3$, dioxano, anisol y tetrahidrofurano (THF). Los reactivos típicamente se aplican en cantidades equimolares. Sin embargo, la relación molar del tiolato con los compuestos de fórmula (1d) también puede ser superior a 1:1, por ejemplo, 2:1 o 3:1.
- 10 En caso de que $m > 0$, los compuestos de fórmula (1e) pueden oxidarse mediante la adición de un agente oxidante como se describe en el Proceso 5 para dar lugar a compuestos de fórmula (1f),
- 15



- 20 en donde m es 1 o 2, y en donde todas las variables tienen el mismo significado que el definido para la fórmula (I). Esta transformación suele llevarse a cabo a temperaturas de $-10\text{ }^{\circ}\text{C}$ a $50\text{ }^{\circ}\text{C}$, preferiblemente de $-5\text{ }^{\circ}\text{C}$ a $30\text{ }^{\circ}\text{C}$, en un disolvente inerte. Los agentes oxidantes típicos incluyen el ácido metacloroperoxibenzoico y H_2O_2 . Como alternativa, puede utilizarse O_2 en presencia de un catalizador, tal como describen Wei, Lian-Qiang; Ye, Bao-Hui, ACS Applied Materials & Interfaces, volumen 11, número 44, páginas 41448-41457, DOI 10.1021/acsami.9b115646.

- 25 Los disolventes inertes adecuados son hidrocarburos alifáticos, preferiblemente un hidrocarburo alifático de C_5 - C_{16} , más preferiblemente un alcano de C_5 - C_{16} , o un cicloalcano de C_5 - C_{16} , tal como pentano, hexano, ciclohexano o éter de petróleo; hidrocarburos aromáticos, preferiblemente un hidrocarburo aromático de C_6 - C_{10} , tal como benceno, tolueno, o-, m- y p-xileno; hidrocarburos halogenados, preferiblemente alcanos de C_1 - C_6 alifáticos halogenados, o hidrocarburos de C_6 - C_{10} aromáticos halogenados, tales como CH_2Cl_2 , $CHCl_3$, CCl_4 , CH_2ClCH_2Cl , CCl_3CH_3 , $CHCl_2CH_2Cl$, CCl_2CCl_2 , o clorobenceno; éteres, preferiblemente éteres de cicloalquilo de C_1 - C_6 , éteres de alquilo de C_1 - C_6 -alquilo de C_1 - C_6 y éteres de alquilo de C_1 - C_6 -arilo de C_6 - C_{10} , tales como $CH_3CH_2OCH_2CH_3$, $(CH_3)_2CHOCH(CH_3)_2$, $CH_3OC(CH_3)_3$ (MTBE), CH_3OCH_3 (DME), $CH_3OCH_2CH_2OCH_3$, dioxano, anisol y tetrahidrofurano (THF); ésteres, preferiblemente ésteres de alcoholes de C_1 - C_6 alifáticos con ácidos carboxílicos de C_1 - C_6 alifáticos, ésteres de alcoholes de C_6 - C_{10} aromáticos con ácidos carboxílicos de C_6 - C_{10} aromáticos, ésteres cíclicos de ácidos ω -hidroxi-carboxílicos de C_1 - C_6 , tales como $CH_3C(O)OCH_2CH_3$, $CH_3C(O)OCH_3$, $CH_3C(O)OCH_2CH_2CH_2CH_3$, $CH_3C(O)OCH(CH_3)CH_2CH_3$, $CH_3C(O)OC(CH_3)_2$, $CH_3CH_2CH_2C(O)OCH_2CH_3$, $CH_3CH(OH)C(O)OCH_2CH_3$, $CH_3CH(OH)C(O)OCH_3$, $CH_3C(O)OCH_2CH(CH_3)_2$, $CH_3C(O)OCH(CH_3)_2$, $CH_3CH_2C(O)OCH_3$, benzoato de bencilo y γ -butirolactona; carbonatos, tales como carbonato de etileno, carbonato de propileno, $CH_3CH_2OC(O)OCH_2CH_3$, y $CH_3OC(O)OCH_3$; nitrilos, preferiblemente nitrilos de C_1 - C_6 , tales como CH_3CN , y CH_3CH_2CN ; cetonas, preferiblemente cetonas de alquilo de C_1 - C_6 -alquilo de C_1 - C_6 , tales como $CH_3C(O)CH_3$, $CH_3C(O)CH_2CH_3$, $CH_3CH_2C(O)CH_2CH_3$, y $CH_3C(O)C(CH_3)_3$ (MTBK). Típicamente, el agente oxidante se utiliza en exceso con respecto a los compuestos de fórmula (1e), por ejemplo, en una relación superior a 2, como superior a 3.

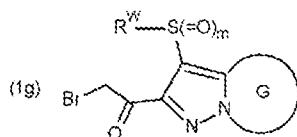
- 45 A continuación, los compuestos de fórmula (1f) o los compuestos de fórmula (1e) pueden bromarse para producir compuestos de fórmula (1a) como se representa en el Proceso 6



en donde todas las variables tienen un significado según lo definido para la fórmula (I). Esta transformación suele llevarse

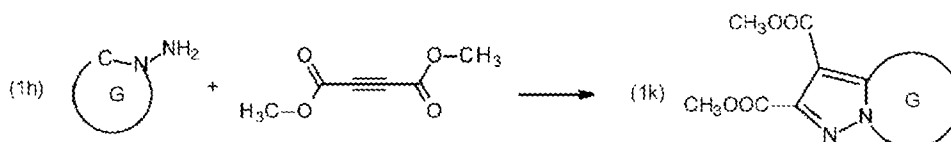
a cabo a temperaturas de -10 °C a 50 °C, preferiblemente de 0 °C a 30 °C, opcionalmente en un disolvente inerte, en presencia de un ácido. Normalmente, el ácido se utiliza como disolvente para la reacción. Los disolventes adecuados son los hidrocarburos alifáticos, tales como pentano, hexano, ciclohexano o éter de petróleo; éteres, tales como CH₃CH₂OCH₂CH₃, (CH₃)₂CHOCH(CH₃)₂, CH₃OC(CH₃)₃ (MTBE), CH₃OCH₃ (DME), CH₃OCH₂CH₂OCH₃, CH₃OC(CH₃)₂CH₂CH₃, dioxano, anisol, 2-metil-tetrahidrofurano, tetrahidrofurano (THF) y dietilenglicol. También son posibles mezclas de los disolventes anteriores. Los ácidos adecuados son HBr, HCl o CH₃COOH, que actúan como catalizadores en la reacción de bromación.

A modo de ejemplo, los compuestos de fórmula (1g), que se ajustan a la definición de la fórmula (1), pueden prepararse, por ejemplo, como se indica a continuación.



En un primer paso descrito en el Proceso 7, el compuesto bu-2-indioato de dimetilo se hace reaccionar con un compuesto de fórmula (1h) para obtener derivados de imidazol de fórmula (1k)

Proceso 7:



en donde todas las variables tienen un significado según lo definido para la fórmula (1). Esta transformación suele llevarse a cabo a temperaturas entre -10 °C y 40 °C, preferiblemente en presencia de una base, en un disolvente inerte.

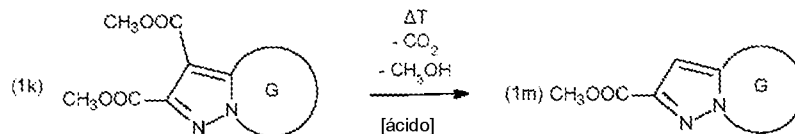
Los disolventes adecuados son hidrocarburos alifáticos, preferiblemente un hidrocarburo alifático de C₅-C₁₆, más preferiblemente un alcano de C₅-C₁₆, o un cicloalcano de C₅-C₁₆, tal como pentano, hexano, ciclohexano o éter de petróleo; hidrocarburos aromáticos, preferiblemente un hidrocarburo aromático de C₆-C₁₀, tal como benceno, tolueno, o-, m- y p-xileno; hidrocarburos halogenados, preferiblemente alcanos de C₁-C₆ alifáticos halogenados, o hidrocarburos de C₆-C₁₀ aromáticos halogenados, tales como CH₂Cl₂, CHCl₃, CCl₄, CH₂ClCH₂Cl, CCl₃CH₃, CHCl₂CH₂Cl, CCl₂CCl₂, o clorobenceno; éteres, preferiblemente éteres de cicloalquilo de C₁-C₆, éteres de alquilo de C₁-C₆-alquilo de C₁-C₆ y éteres de alquilo de C₁-C₆-arilo de C₆-C₁₀, tales como CH₃CH₂OCH₂CH₃, (CH₃)₂CHOCH(CH₃)₂, CH₃OC(CH₃)₃ (MTBE), CH₃OCH₃ (DME), CH₃OCH₂CH₂OCH₃, dioxano, anisol y tetrahidrofurano (THF); ésteres, preferiblemente ésteres de alcoholes de C₁-C₆ alifáticos con ácidos carboxílicos de C₁-C₆ alifáticos, ésteres de alcoholes de C₆-C₁₀ aromáticos con ácidos carboxílicos de C₆-C₁₀ aromáticos, ésteres cíclicos de ácidos ω-hidroxi-carboxílicos de C₁-C₆, tales como CH₃C(O)OCH₂CH₃, CH₃C(O)OCH₃, CH₃C(O)OCH₂CH₂CH₂CH₃, CH₃C(O)OCH(CH₃)CH₂CH₃, CH₃C(O)OC(CH₃)₂CH₂CH₃, CH₃CH₂CH₂C(O)OCH₂CH₃, CH₃CH(OH)C(O)OCH₂CH₃, CH₃CH(OH)C(O)OCH₃, CH₃C(O)OCH₂CH(CH₃)₂, CH₃C(O)OCH(CH₃)₂, CH₃CH₂C(O)OCH₃, benzoato de bencilo y γ-butirolactona; carbonatos, tales como carbonato de etileno, carbonato de propileno, CH₃CH₂OC(O)OCH₂CH₃, y CH₃OC(O)OCH₃; nitrilos, preferiblemente nitrilos de C₁-C₆, tales como CH₃CN, y CH₃CH₂CN; cetonas, preferiblemente cetonas de alquilo de C₁-C₆-alquilo de C₁-C₆, tales como CH₃C(O)CH₃, CH₃C(O)CH₂CH₃, CH₃CH₂C(O)CH₂CH₃, y CH₃C(O)C(CH₃)₃ (MTBK); alcoholes, preferiblemente alcoholes de C₁-C₄, tales como CH₃OH, CH₃CH₂OH, CH₃CH₂CH₂OH, CH₃CH(OH)CH₃, CH₃(CH₂)₃OH, y C(CH₃)₃OH; amidas y derivados de urea, preferiblemente dimetilformamida (DMF), N-metil-2-pirrolidona (NMP), dimetilacetamida (DMA), 1,3-dimetil-2-imidazolidinona (DMI), 1,3-dimetil-3,4,5,6-tetrahidro-2(1H)-pirimidinona (DMPU), hexametilfosfamida (HMPA); además, dimetilsulfóxido (DMSO), sulfolano y mezclas de los mismos. Las bases adecuadas son, en general, bases inorgánicas, tales como hidróxidos de metales alcalinos y alcalinotérreos, tales como LiOH, NaOH, KOH, y Ca(OH)₂; óxidos de metales alcalinos y alcalinotérreos, tales como Li₂O, Na₂O, CaO, y MgO; hidruros de metales alcalinos y alcalinotérreos, tales como LiH, NaH, KH y CaH₂; carbonatos de metales alcalinos y alcalinotérreos, tales como Li₂CO₃, K₂CO₃ y CaCO₃; y bicarbonatos de metales alcalinos, tal como NaHCO₃.

El compuesto de fórmula (1h) y el bu-2-indioato de dimetilo pueden aplicarse normalmente en cantidades equimolares, es decir, en una relación molar de aproximadamente 1:1. Sin embargo, para optimizar los rendimientos, puede emplearse un exceso de uno de los dos compuestos.

A continuación, los compuestos de fórmula (1k) pueden transformarse en compuestos de fórmula (1m) como se representa en el Proceso 8

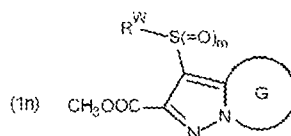
55

Proceso 8:



5 en donde todas las variables tienen un significado según lo definido para la fórmula (I). Esta transformación suele llevarse a cabo a temperaturas elevadas de 50 °C a 150 °C, preferiblemente de 100 °C a 120 °C, en un disolvente inerte, en presencia de un ácido como un catalizador. Los disolventes adecuados son hidrocarburos alifáticos, preferiblemente un hidrocarburo de C₅-C₁₆ alifático, más preferiblemente un alcano de C₅-C₁₆, o cicloalcano de C₅-C₁₆, tal como pentano, hexano, ciclohexano, o éter de petróleo; hidrocarburos aromáticos, preferiblemente un hidrocarburo de C₆-C₁₀ aromático, tal como benceno, tolueno, o-, m-, y p-xileno; hidrocarburos halogenados, preferiblemente alcanos de C₁-C₆ alifáticos halogenados, o hidrocarburos de C₆-C₁₀ aromáticos halogenados, tales como CH_2Cl_2 , CHCl_3 , CCl_4 , $\text{CH}_2\text{ClCH}_2\text{Cl}$, CCl_3CH_3 , $\text{CHCl}_2\text{CH}_2\text{Cl}$, CCl_2CCl_2 , o clorobenceno; éteres, preferiblemente éteres de cicloalquilo de C₁-C₆, éteres de alquilo de C₁-C₆-alquilo de C₁-C₆ y éteres de alquilo de C₁-C₆-arilo de C₆-C₁₀, tales como $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHOCH}(\text{CH}_3)_2$, $\text{CH}_3\text{OC}(\text{CH}_3)_3$ (MTBE), CH_3OCH_3 (DME), $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$, dioxano, anisol y tetrahidrofurano (THF); y agua. Los ácidos adecuados son en general ácidos anorgánicos, tales como HF, HCl, Hbr, H_2SO_4 , además de ácidos orgánicos, tales como ácido fórmico, ácido acético, ácido propiónico, ácido oxálico, ácido tolueno sulfónico, ácido benceno sulfónico, ácido alcanfor sulfónico, ácido cítrico y ácido trifluoro acético.

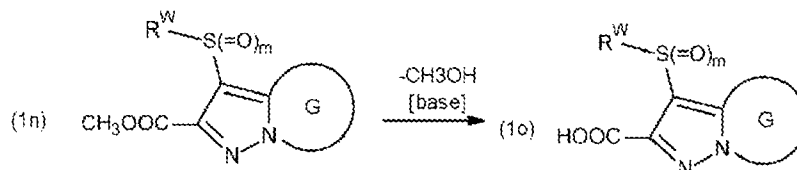
Los compuestos de fórmula (1m) pueden entonces halogenarse y hacerse reaccionar con un agente tiolato como se describe análogamente en los Procesos 3, 4 y opcionalmente 5 anteriores si $m > 0$ para proporcionar compuestos de fórmula (1n)



25 en donde todas las variables son según lo definido para la fórmula (I).

A continuación, los compuestos de fórmula (1n) pueden convertirse en compuestos de fórmula (1g) mediante una serie de pasos que son operaciones estándar en química orgánica. En primer lugar, los compuestos de fórmula (1n) se saponifican bajo la catálisis de una base para producir compuestos de fórmula (1o) como se representa en el Proceso 9

Proceso 9:

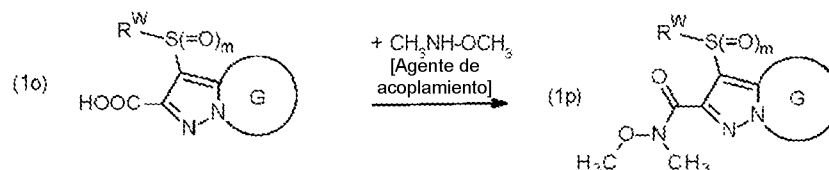


30 en donde todas las variables tienen un significado según lo definido para la fórmula (I).

Las bases típicas que pueden emplearse son las bases inorgánicas descritas en el Proceso 1. Los disolventes típicos son el agua y las composiciones acuosas que comprenden agua y un disolvente inerte adicional. La reacción se lleva a cabo normalmente a temperaturas de 0 a 150 °C, preferiblemente de 60 a 120 °C.

Posteriormente, los compuestos de ácido carboxílico de fórmula (1o) se convierten en sus correspondientes amidas de Weinreb de fórmula (1p) como se representa en el Proceso 10

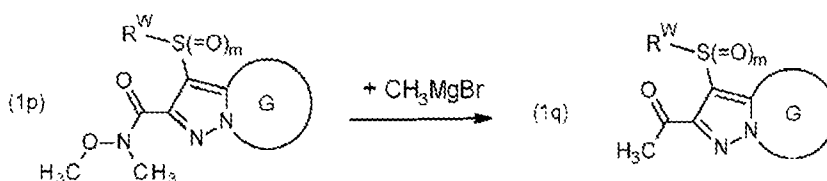
Proceso 10:



en donde todas las variables tienen un significado según lo definido para la fórmula (I). La reacción suele llevarse a cabo a una temperatura de entre -5 y 30 °C en un disolvente inerte en presencia de un agente de acoplamiento y una base. Los agentes de acoplamiento típicos son el hexafluorofosfato de azabenzotriazol tetrametil uronio (HATU), hexafluorofosfato de 3-[Bis(dimetilamino)metiliumil]-3*H*-benzotriazol-1-óxido (HBTU), hexafluorofosfato de *O*-(1*H*-6-clorobenzotriazol-1-il)-1,1,3,3-tetrametiluronio (HCTU), y anhídrido de ácido propanofosfónico. Las bases típicas son las bases orgánicas descritas en el Proceso 1. Los disolventes inertes adecuados son hidrocarburos alifáticos, preferiblemente un hidrocarburo alifático de C₅-C₁₆, más preferiblemente un alcano de C₅-C₁₆, o un cicloalcano de C₅-C₁₆, tal como pentano, hexano, ciclohexano o éter de petróleo; hidrocarburos aromáticos, preferiblemente un hidrocarburo aromático de C₆-C₁₀, tal como benceno, tolueno, *o*-, *m*- y *p*-xileno; hidrocarburos halogenados, preferiblemente alcanos de C₁-C₆ alifáticos halogenados, o hidrocarburos de C₆-C₁₀ aromáticos halogenados, tales como CH₂Cl₂, CHCl₃, CCl₄, CH₂ClCH₂Cl, CCl₃CH₃, CHCl₂CH₂Cl, CCl₂CCl₂, o clorobenceno; éteres, preferiblemente éteres de cicloalquilo de C₁-C₆, éteres de alquilo de C₁-C₆-alquilo de C₁-C₆ y éteres de alquilo de C₁-C₆-arilo de C₆-C₁₀, tales como CH₃CH₂OCH₂CH₃, (CH₃)₂CHOCH(CH₃)₂, CH₃OC(CH₃)₃ (MTBE), CH₃OCH₃ (DME), CH₃OCH₂CH₂OCH₃, dioxano, anisol y tetrahidrofurano (THF); ésteres, preferiblemente ésteres de alcoholes de C₁-C₆ alifáticos con ácidos carboxílicos de C₁-C₆ alifáticos, ésteres de alcoholes de C₆-C₁₀ aromáticos con ácidos carboxílicos de C₆-C₁₀ aromáticos, ésteres cíclicos de ácidos ω-hidroxi-carboxílicos de C₁-C₆, tales como CH₃C(O)OCH₂CH₃, CH₃C(O)OCH₃, CH₃C(O)OCH₂CH₂CH₂CH₃, CH₃C(O)OCH(CH₃)CH₂CH₃, CH₃C(O)OC(CH₃)₃, CH₃CH₂CH₂C(O)OCH₂CH₃, CH₃CH(OH)C(O)OCH₂CH₃, CH₃CH(OH)C(O)OCH₃, CH₃C(O)OCH₂CH(CH₃)₂, CH₃C(O)OCH(CH₃)₂, CH₃CH₂C(O)OCH₃, benzoato de bencilo y γ-butirolactona; carbonatos, tales como carbonato de etileno, carbonato de propileno, CH₃CH₂OC(O)OCH₂CH₃, y CH₃OC(O)OCH₃; nitrilos, preferiblemente nitrilos de C₁-C₆, tales como CH₃CN, y CH₃CH₂CN; cetonas, preferiblemente cetonas de alquilo de C₁-C₆-alquilo de C₁-C₆, tales como CH₃C(O)CH₃, CH₃C(O)CH₂CH₃, CH₃CH₂C(O)CH₂CH₃, y CH₃C(O)C(CH₃)₃ (MTBK); alcoholes, preferiblemente alcoholes de C₁-C₄, tales como CH₃OH, CH₃CH₂OH, CH₃CH₂CH₂OH, CH₃CH(OH)CH₃, CH₃(CH₂)₃OH, y C(CH₃)₃OH; amidas y derivados de urea, preferiblemente dimetilformamida (DMF), *N*-metil-2-pirrolidona (NMP), dimetilacetamida (DMA), 1,3-dimetil-2-imidazolidinona (DMI), 1,3-dimetil-3,4,5,6-tetrahidro-2(1*H*)-pirimidinona (DMPU), hexametilfosfamida (HMPA); además, dimetilsulfóxido (DMSO), sulfolano y mezclas de los mismos. Normalmente, se aplica un exceso del agente de acoplamiento y de la amina de Weinreb CH₃NH-OCH₃.

A continuación, las amidas de Weinreb de fórmula (1p) se hacen reaccionar con un reactivo de Grignard para obtener cetonas de fórmula (1q) como se describe en el Proceso 11

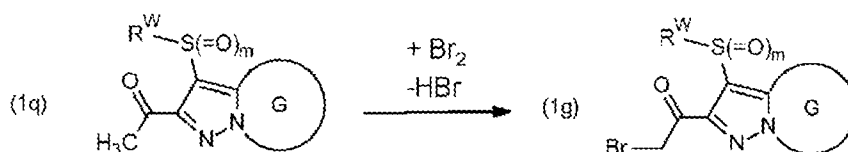
Proceso 11:



en donde todas las variables tienen un significado según lo definido para la fórmula (I). Dichas reacciones se llevan a cabo a temperaturas de entre -10 y 30 °C en un disolvente inerte, normalmente un disolvente polar. Los disolventes típicos incluyen hidrocarburos alifáticos, preferiblemente un hidrocarburo de C₅-C₁₆ alifático, más preferiblemente un alcano de C₅-C₁₆, o cicloalcano de C₅-C₁₆, tal como pentano, hexano, ciclohexano, o éter de petróleo; hidrocarburos aromáticos, preferiblemente un hidrocarburo de C₆-C₁₀ aromático, tal como benceno, tolueno, *o*-, *m*- y *p*-xileno; éteres, preferiblemente éteres de cicloalquilo de C₁-C₆, éteres de alquilo de C₁-C₆-alquilo de C₁-C₆ y éteres de alquilo de C₁-C₆-arilo de C₆-C₁₀, tales como CH₃CH₂OCH₂CH₃, (CH₃)₂CHOCH(CH₃)₂, CH₃OC(CH₃)₃ (MTBE), CH₃OCH₃ (DME), CH₃OCH₂CH₂OCH₃, dioxano, anisol y tetrahidrofurano (THF).

Por último, los compuestos de fórmula 1q pueden bromarse en el Proceso 12 para producir los compuestos de fórmula (1g)

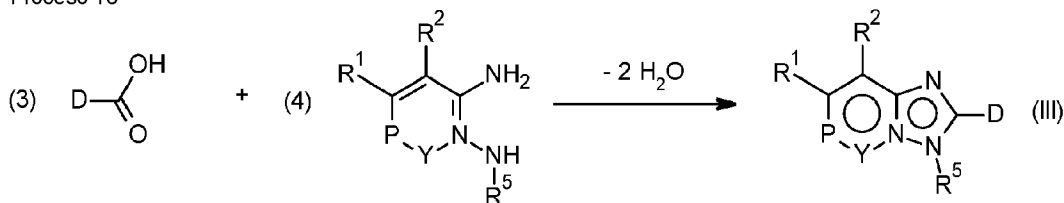
Proceso 12:



en donde todas las variables tienen un significado según lo definido para la fórmula (I). Las condiciones de reacción para este tipo de transformación se han descrito anteriormente para el Proceso 6.

Los compuestos de fórmula (III), correspondientes a los compuestos de fórmula (I) en donde Q es N(R⁵) pueden prepararse por reacción de compuestos de fórmula (3) con compuestos de fórmula (4), como se muestra en el Proceso 13 a continuación.

Proceso 13



5

en donde todas las variables en las fórmulas (3), (4) y (III) tienen un significado según lo definido para la fórmula (I).

10

15

20

25

30

Reacciones de este tipo se han descrito en EP3257853A1, por ejemplo, p. 33-34, y en WO2016162318A1, p. 90, cuyo pasaje se incorpora en la presente por referencia. La reacción suele llevarse a cabo a temperaturas elevadas, por ejemplo, de 60 a 160 °C, en un disolvente inerte, opcionalmente en presencia de un ácido, o de un agente de acoplamiento y una base. Los disolventes adecuados son hidrocarburos alifáticos, tales como pentano, hexano, ciclohexano o éter de petróleo; hidrocarburos aromáticos, tales como benceno, tolueno, o-, m- y p-xileno; hidrocarburos halogenados o hidrocarburos aromáticos halogenados de C₆-C₁₀, tales como CH₂Cl₂, CHCl₃, CCl₄, CH₂ClCH₂Cl, CCl₃CH₃, CHCl₂CH₂Cl, CCl₂CCl₂, o clorobenceno; éteres, tales como CH₃CH₂OCH₂CH₃, (CH₃)₂CHOCH(CH₃)₂, CH₃OC(CH₃)₃ (MTBE), CH₃OCH₃ (DME), CH₃OCH₂CH₂OCH₃, CH₃OC(CH₃)₂CH₂CH₃, dioxano, anisol, 2-metiltetrahydrofurano, tetrahydrofurano (THF) y dietilenglicol; nitrilos, tales como CH₃CN, y CH₃CH₂CN; alcoholes, tales como CH₃OH, CH₃CH₂OH, CH₃CH₂CH₂OH, CH₃CH(OH)CH₃, CH₃(CH₂)₃OH, and C(CH₃)₃OH, CH₂(OH)CH₂(OH), y CH₃CH(OH)CH₂OH. También son posibles mezclas de los disolventes anteriores.

Los ácidos adecuados son, en general, ácidos inorgánicos, tales como HF, HCl, HBr, H₂SO₄ y HClO₄; ácidos de Lewis, tales como BF₃, AlCl₃, FeCl₃, SnCl₄, TiCl₄ y ZnCl₂, además de ácidos orgánicos, tales como HCOOH, CH₃COOH, CH₃CH₂COOH, ácido oxálico, ácido tolueno sulfónico, ácido benceno sulfónico, ácido alcanfor sulfónico, ácido cítrico y CF₃COOH.

Los agentes de acoplamiento adecuados se seleccionan entre carbodiimidas, tales como DCC (diciclohexilcarbodiimida) y DIC (diisopropilcarbodiimida), derivados de benzotriazol, tales como HATU (O-(7-azabenzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-tetrametiluronio hexafluorofosfato), HBTU ((Obenzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-tetrametiluronio hexafluorofosfato) y HCTU (1H-benzotriazol-1-[bis(dimetilamino)metileno]-5-cloro tetrafluoroborato) y activadores derivados del fosfonio, tales como BOP (hexafluorofosfato de (benzotriazol-1-iloxi)-tris(dimetilamino)fosfonio), PyBOP (hexafluorofosfato de (benzotriazol-1-iloxi)-tripirrolidinofosfonio) y PyBrOP (hexafluorofosfato de bromotripirrolidinofosfonio).

35

Alternativamente, los compuestos de fórmula (3) pueden sustituirse por sus correspondientes halogenuros de ácido carbónico, por ejemplo, cloruros de ácido. En este caso, la reacción suele llevarse a cabo en presencia de una base. Las bases adecuadas son las enumeradas anteriormente para el Proceso 1.

40

Los compuestos de fórmula (3) y los compuestos de fórmula (4) suelen reaccionar entre sí en cantidades equimolares. En términos de rendimiento, puede ser ventajoso emplear un exceso de compuestos de fórmula (3).

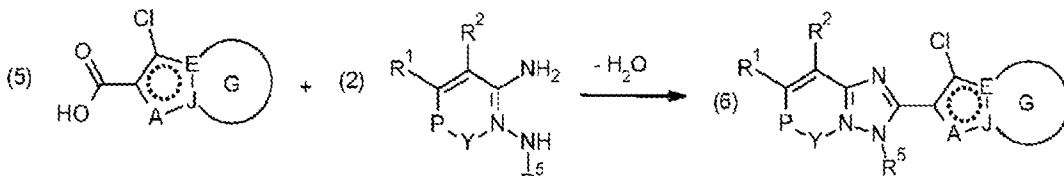
Los compuestos de la fórmula (3) se pueden preparar como se describe en EP3257853A1, p. 51-53. Los compuestos de fórmula (4) pueden prepararse como se describe en WO2017/167832A1, Ejemplo C-4, o Bashandy et al. Journal of Enzyme Inhibition and Medicinal Chemistry, 29(5), 619-627, 2014.

45

Otros compuestos de las fórmulas (1) y (3) distintos de los descritos en EP3257853A1 pueden obtenerse mediante métodos rutinarios de química orgánica o están disponibles comercialmente.

50

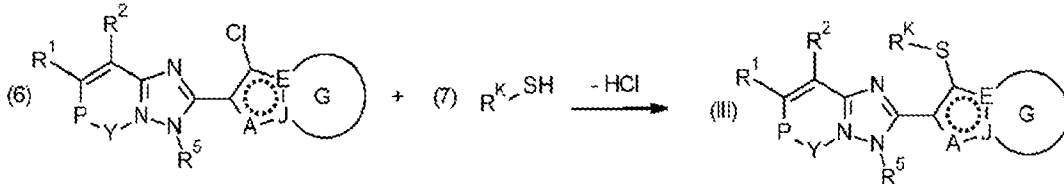
Proceso 14:



Todas las variables en las fórmulas (2), (5) y (6) tienen un significado según lo definido para la fórmula (I). Esta reacción puede llevarse a cabo en las mismas condiciones que las descritas anteriormente para el Proceso 13 anterior. Los compuestos de fórmula (5) están disponibles comercialmente o pueden prepararse como se describe en EP3257853A1, [0247] - [0266]

En un segundo paso, los compuestos de fórmula (6) se hacen reaccionar con un compuesto de fórmula (7) para producir compuestos de fórmula (III) incluidos en la definición de compuestos de fórmula (I), como se muestra en el Proceso 15:

Proceso 15:



Todas las variables en las fórmulas (6), (7) y (III) tienen un significado según lo definido para la fórmula (I). Las reacciones de este tipo se han descrito en WO2016162318A1, p. 89. La reacción suele llevarse a cabo a una temperatura de entre 15 y 60 °C en un disolvente inerte y en presencia de una base. Los disolventes adecuados son hidrocarburos alifáticos, tales como pentano, hexano, ciclohexano o éter de petróleo; o hidrocarburos aromáticos, tales como benceno, tolueno, o-, m- y p-xileno; También son posibles mezclas de los disolventes anteriores. Las bases adecuadas son, en general, bases inorgánicas, preferiblemente hidruros de metales alcalinos y alcalinotérreos, tales como LiH, NaH, KH y CaH₂; bases orgánicas, preferiblemente aminas secundarias, tales como pirrolidina o aminas terciarias, tales como diisopropiletilamina, trimetilamina, trietilamina, triisopropilamina y N-metilpiperidina, imidazol, piridina; piridinas sustituidas, tales como colidina, lutidina y 4-dimetilaminopiridina, y amidas y amidinas policíclicas, tales como 1,8-diazabicycloundec-7-eno (DBU), 1,4-diazabicyclo[2,2,2]octano (DABCO); o sales de metales alcalinos de aminas secundarias, tales como diisopropilamida alcalina, bis(trimetilsilil)amida alcalina, tetrametilpiperideno alcalino; alcoholatos, tales como metanolato alcalino, etanolato alcalino, isopropanolato alcalino, terc-butanolato alcalino; sales de metal alcalino - alquilo, y de metal alcalino - arilo, tales como n-butil-litio, terc-butil-litio, fenil-litio. La base se suele reaccionar con compuestos de fórmula (7) antes de añadir compuestos de fórmula (6) para formar el anión de tiolato.

Las bases se emplean generalmente en cantidades catalíticas; sin embargo, también pueden utilizarse en cantidades equimolares, en exceso o, en su caso, como disolvente.

Alternativamente, los compuestos de fórmula (III) también pueden prepararse en un reordenamiento tipo Dimroth de compuestos de fórmula (8), como se muestra en el Proceso 16,

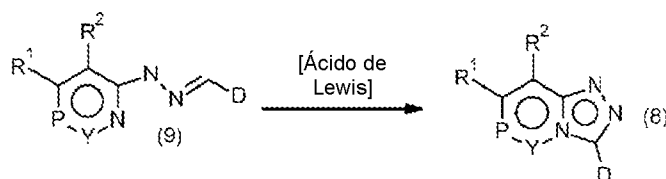
Proceso 16



en donde todas las variables en las fórmulas (8) y (III) tienen un significado según lo definido para la fórmula (I). Las reacciones de este tipo se han descrito en Potts K.T., Surapaneni C.R., 1970, Journal of Heterocyclic Chemistry, o Nagamatsu T., Fujita T., 2002, Heterocycles, 57(4), 631-636. La reacción suele llevarse a cabo en presencia de un catalizador, normalmente un ácido o una base, tal como NaOH o ácido fórmico, en un disolvente orgánico inerte o agua a una temperatura de 0 a 80 °C. Si no se utiliza catalizador, la reacción puede llevarse a cabo a temperaturas elevadas, por ejemplo, de 30 a 100 °C.

Los compuestos de fórmula (8) pueden prepararse por reacción de compuestos de hidracina de fórmula (9) con ortoésteres, como se muestra en el Proceso 17,

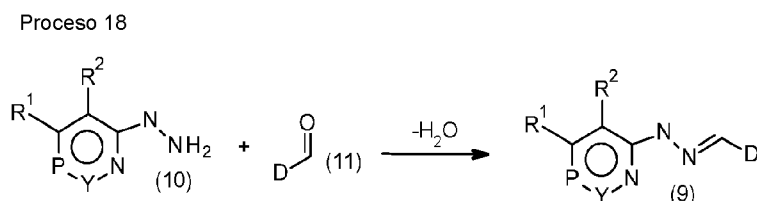
Proceso 17



en donde todas las variables en las fórmulas (8) y (9) tienen un significado según lo definido para la fórmula (I). Las reacciones de este tipo se han descrito por Glushkov V.A. et al., 1998, *Pharmaceutical Chemistry Journal*, vol.32(5), p.29-32, o WO2012148808, p.143. La reacción se realiza normalmente en presencia de un ácido de Lewis, tal como FeCl₃ o AlCl₃, a temperaturas elevadas de 50 a 150 °C en un disolvente orgánico inerte. La reacción puede llevarse a cabo en presencia de un agente oxidante, por ejemplo, H₂O₂ o CuCl₂.

Los compuestos de fórmula (9) son accesibles mediante la reacción de compuestos de hidracina de fórmula (10) con compuestos de aldehído de fórmula (11), como se muestra en el Proceso 18

10

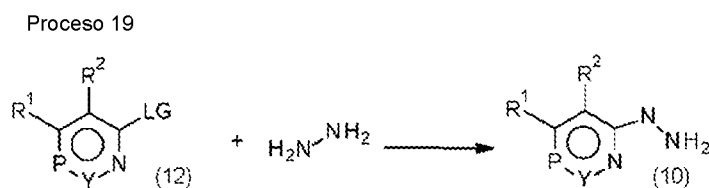


en donde las variables en las fórmulas (9), (10) y (11) tienen un significado según lo definido para la fórmula (I). La reacción suele llevarse a cabo en presencia de un catalizador ácido, tal como el ácido tolueno sulfónico, en un disolvente orgánico inerte. Los disolventes adecuados son hidrocarburos alifáticos, tales como pentano, hexano, ciclohexano o éter de petróleo; o hidrocarburos aromáticos, tales como benceno, tolueno, o-, m- y p-xileno; También son posibles mezclas de los disolventes anteriores.

15

Los derivados de hidracina de fórmula (10) están disponibles comercialmente o pueden derivarse de compuestos disponibles comercialmente. Alternativamente, los compuestos de fórmula (10) también pueden prepararse mediante reacción de la hidracina con el compuesto de fórmula (12), como se muestra en el Proceso 19

20



en donde LG es un grupo saliente, y en donde todas las demás variables tienen el significado definido para la fórmula (I). Los grupos salientes típicos son el triflato, el yoduro y el cloruro. Las reacciones de este tipo se han descrito en Mao, Y. et al, 2014, *Journal of Heterocyclic Chemistry*, 51(3), p.594-597. La reacción se lleva a cabo típicamente en un disolvente polar, como CH₃CH₂OH, a temperaturas elevadas, como de 50 a 100 °C. Los compuestos de fórmula (12) están disponibles comercialmente o pueden prepararse mediante métodos estándar de química orgánica.

25

Las mezclas de reacción se elaboran de la forma habitual, por ejemplo, mezclándolas con agua, separando las fases y, en su caso, purificando cromatográficamente los productos brutos. Algunos de los productos intermedios y finales se obtienen en forma de aceites viscosos incoloros o ligeramente parduscos que se purifican o liberan de componentes volátiles a presión reducida y a temperatura moderadamente elevada. Si los productos intermedios y finales se obtienen como sólidos, la purificación también puede realizarse mediante recristalización o digestión.

30

Los N-óxidos pueden prepararse a partir de los compuestos inventivos de acuerdo con los métodos de oxidación convencionales, por ejemplo, tratando los compuestos I con un perácido orgánico, tal como el ácido metacloroperbenzoico (cfr. WO 03/64572 o *J. Med. Chem.* 38(11), 1892-903, 1995); o con agentes oxidantes inorgánicos, tal como el peróxido de hidrógeno (cf. *J. Heterocyc. Chem.* 18(7), 1305-8, 1981) o la oxona (cf. *J. Am. Chem. Soc.* 123(25), 5962-5973, 2001). La oxidación puede dar lugar a mono-N-óxidos puros o a una mezcla de diferentes N-óxidos, que pueden separarse por métodos convencionales, tal como la cromatografía.

35

Si la síntesis da lugar a mezclas de isómeros, por lo general no se requiere necesariamente una separación, ya que en algunos casos los isómeros individuales pueden interconvertirse durante el procesamiento para su uso o durante la aplicación (por ejemplo, bajo la acción de la luz, ácidos o bases). Dichas conversiones también pueden tener lugar después de su uso, por ejemplo, en el tratamiento de las plantas en la planta tratada, o en el hongo nocivo que se desea controlar.

40

Un experto comprenderá fácilmente que las preferencias para los sustituyentes, también en particular las dadas en las tablas siguientes para los respectivos sustituyentes, dadas en la presente en relación con los compuestos I se aplican para los intermedios en consecuencia. De este modo, los sustituyentes tienen en cada caso, independientemente unos de otros o más preferiblemente en combinación, los medios definidos en la presente.

45

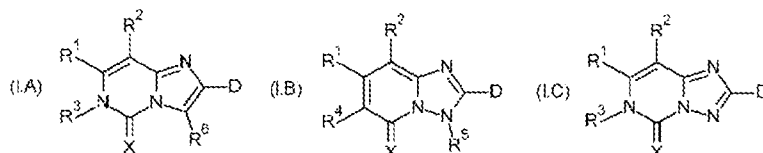
50

Preferencias

5 Las variables tienen, cada una por separado y en combinación, los siguientes significados preferentes. En una realización, X es O. En otra realización de compuestos de fórmula (I), X es S.

En una realización de compuestos de fórmula (I), P es NR³ y Q es CR⁶. En otra realización de compuestos de fórmula (I), P es CR⁴ y Q es NR⁵.

10 En una realización de la presente invención, el compuesto de fórmula (I) es un compuesto de fórmula (I.A), un compuesto (I.B) o un compuesto de fórmula (I.C).



15 En una realización, los compuestos de fórmula (I) son compuestos de fórmula (I.A). En otra realización, los compuestos de fórmula (I) son compuestos de fórmula (I.B). En otra realización, los compuestos de fórmula (I) son compuestos de fórmula (I.C).

20 R¹ es H, halógeno, alquilo de C₁-C₆, alqueno de C₂-C₆, alquino de C₂-C₆, alcoxi de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₆-alquilo de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalcoxi de C₃-C₆, sulfenilo de C₁-C₆, sulfinilo de C₁-C₆, o sulfonilo de C₁-C₆, cuyos grupos están no sustituidos o halogenados. En una realización, R¹ es H, alquilo de C₁-C₃, alqueno de C₂-C₃, alquino de C₂-C₃, alcoxi de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃-alquilo de C₁-C₃, cicloalquilo de C₃-C₅, cicloalcoxi de C₃-C₅, cuyos grupos están no sustituidos o halogenados. En una realización, R¹ es H, alquilo de C₁-C₃, oalcoxi de C₁-C₃, cuyos grupos están no sustituidos o halogenados. En otra realización, R¹ es H; alquilo de C₁-C₃, alqueno de C₂-C₃, alquino de C₂-C₃, alcoxi de C₁-C₃, cuyos grupos son no sustituidos o halogenados. En otra realización, R¹ es alquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, cuyos grupos están no sustituidos o halogenados. En otra realización, R¹ es haloalquilo de C₁-C₃, preferiblemente CF₃.

30 R², R⁴, R⁶ son independientemente H, halógeno, N₃, CN, NO₂, SCN, SF₅; alquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₆, alqueno de C₂-C₆, tri-alquilsililo de C₁-C₆, alquino de C₂-C₆, alcoxi de C₁-C₆-alquilo de C₁-C₄, alcoxi de C₁-C₆-alcoxi de C₁-C₄, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalcoxi de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cicloalcoxi de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno, C(=O)OR^A, NR^BR^C, NOR^A, ONR^BR^C, alqueno de C₁-C₆-NR^BR^C, O-alqueno de C₁-C₆-NR^BR^C, alqueno de C₁-C₆-CN, NH-alqueno de C₁-C₆-NR^BR^C, C(=O)NR^BR^C, C(=O)R^D, C(=S)R^D, SO₂NR^BR^C, S(=O)_nR^E; fenilo o bencilo, en donde el anillo fenilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^F iguales o diferentes.

35 En una realización, R² es H, halógeno; alquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, alqueno de C₂-C₃, tri-alquilsililo de C₁-C₆, alquino de C₂-C₆, alcoxi de C₁-C₃-alquilo de C₁-C₂, alcoxi de C₁-C₃-alcoxi de C₁-C₂, cicloalquilo de C₃-C₅, cicloalcoxi de C₃-C₅, cicloalquilo de C₃-C₅-alquilo de C₁-C₂, cicloalcoxi de C₃-C₅-alquilo de C₁-C₂, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno. En otra realización, R² es H, halógeno, alquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, alqueno de C₂-C₃, alquino de C₂-C₆, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno. En otra realización, R² es H, halógeno; alquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno. En otra realización, R² es H o alquilo de C₁-C₃.

45 En una realización, R⁴ es H, halógeno; alquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, alqueno de C₂-C₃, tri-alquilsililo de C₁-C₆, alquino de C₂-C₆, alcoxi de C₂-C₃-alquilo de C₁-C₂, alcoxi de C₁-C₃-alcoxi de C₁-C₂, cicloalquilo de C₃-C₅, cicloalcoxi de C₃-C₅, cicloalquilo de C₃-C₅-alquilo de C₁-C₂, cicloalcoxi de C₃-C₅-alquilo de C₁-C₂, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno. En otra realización, R⁴ es H, halógeno; alquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, alqueno de C₂-C₃, alquino de C₂-C₆, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno. En otra realización, R⁴ es H, halógeno; alquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno. En otra realización, R⁴ es H; alquilo de C₁-C₃ o haloalquilo de C₁-C₃. En otra realización, R⁴ es H o alquilo de C₁-C₃. En otra realización, R⁴ es H.

50 En una realización, R⁶ es H, halógeno; alquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, alqueno de C₂-C₃, tri-alquilsililo de C₁-C₆, alquino de C₂-C₆, alcoxi de C₂-C₃-alquilo de C₁-C₂, alcoxi de C₁-C₃-alcoxi de C₁-C₂, cicloalquilo de C₃-C₅, cicloalcoxi de C₃-C₅, cicloalquilo de C₃-C₅-alquilo de C₁-C₂, cicloalcoxi de C₃-C₅-alquilo de C₁-C₂, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno. En otra realización, R⁶ es H, halógeno; alquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, alqueno de C₂-C₃, alquino de C₂-C₆, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno. En otra realización, R⁶ es H, halógeno; alquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno. En otra realización, R⁶ es H, halógeno; alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃. En otra realización, R⁶ es H o alquilo de C₁-C₃.

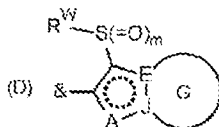
60 R³, R⁵ son independientemente alquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₆, alqueno de C₂-C₆, alquino de C₂-C₆, alcoxi de C₁-C₆-alquilo de C₁-C₄, alcoxi de C₁-C₆-alcoxi de C₁-C₄, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, o cicloalcoxi

de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, que están no sustituidos o halogenados; C(=O)OR^A, NR^BR^C, alquileo de C₁-C₆-NR^BR^C, O-alquileo de C₁-C₆-NR^BR^C, alquileo de C₁-C₆-CN, Nh-alquileo de C₁-C₆-NR^BR^C, C(=O)NR^BR^C, C(=O)R^D, C(=S)R^D, SO₂NR^BR^C, S(=O)_nR^E; fenilo o bencilo, en donde el anillo fenilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^F iguales o diferentes.

5 En una realización, R³ es alquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₆, alquenido de C₂-C₆, alquinilo de C₂-C₆, alcoxi de C₁-C₆-alquilo de C₁-C₄, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cicloalcoxi de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄ o alcoxi de C₁-C₃-alquilo de C₁-C₃ no sustituido o halogenado; fenilo o bencilo, en donde el anillo de fenilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^F iguales o diferentes. En otra realización, R³ es alquilo de C₁-C₄, alquenido de C₂-C₄, alquinilo de C₂-C₄, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₂, o alcoxi de C₁-C₃-alquilo de C₁-C₃, que están no sustituidos o halogenados; fenilo o bencilo, en donde el anillo fenilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^F iguales o diferentes. En otra realización, R³ es alquilo de C₁-C₄, alquenido de C₂-C₄, alquinilo de C₂-C₄, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₂, que están no sustituidos o halogenados; fenilo o bencilo, en donde el anillo fenilo está no sustituido o halogenado. En otra realización, R³ es alquilo de C₁-C₃, alquenido de C₂-C₃, alquinilo de C₂-C₃, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₂, que están no sustituidos o halogenados. En otra realización, R³ es alquilo de C₁-C₃, preferiblemente metilo, que están no sustituidos o halogenados.

20 En una realización, R⁵ es alquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₆, alquenido de C₂-C₆, alquinilo de C₂-C₆, alcoxi de C₁-C₆-alquilo de C₁-C₄, alcoxi de C₁-C₆-alcoxi de C₁-C₄, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, o cicloalcoxi de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, no sustituidos o halogenados. En otra realización, R⁵ es alquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, alquenido de C₂-C₃, alquilo de C₂-C₃, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₂, que están no sustituidos o halogenados. En otra realización, R⁵ es alquilo de C₁-C₃, alquenido de C₂-C₃, alquinilo de C₂-C₃, que están no sustituidos o halogenados. En otra realización, R⁵ es alquilo de C₁-C₃ o haloalquilo de C₁-C₃. En otra realización, R⁵ es alquilo de C₁-C₃, preferiblemente metilo, que están no sustituidos o halogenados.

La variable D es un anillo bicíclico fusionado de la siguiente fórmula



en donde el símbolo “&” significa la conexión con el resto de la fórmula (I), en donde el círculo de puntos en el anillo de 5 miembros significa que el anillo de 5 miembros puede estar saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado, y en donde las variables tienen el significado según lo definido en la presente.

35 La variable A es N, S, O, CR⁷ o NR⁸. En una realización, A es N, S o NR⁸. En otra realización, A es N. En otra realización, A es S. En otra realización, A es NR⁸. En otra realización, A es O.

40 Las variables E, J son independientemente C o N, en donde al menos una de las variables seleccionadas de E y J es C. En una realización, E es N y J es C. En otra realización, E es C y J es N. Por consiguiente, en una realización, E y A son N y J es C. En otra realización, J y A son N y E es C.

45 R⁷ es H, halógeno, OH, CN, NC, NO₂, N₃, SCN, NCS, NCO, SF₅; alquilo de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆, alquenido de C₂-C₆, cicloalquenido de C₃-C₆, alquinilo de C₂-C₆, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes R⁶ iguales o diferentes; un anillo o sistema de anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado de 3 a 12 miembros, en donde dicho anillo o sistema de anillo heterocíclico comprenden uno o más heteroátomos O, N o S iguales o diferentes, y están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes R^H iguales o diferentes, y en donde dichos átomos N y S están independientemente oxidados o no oxidados; fenilo, que está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^J iguales o diferentes; OR^K, SR^K, OC(=O)R^K, OC(=O)OR^K, OC(=O)NR^LR^M, OC(=O)SR^K, OC(=S)NR^LR^M, OC(=S)SR^K, OS(=O)_mR^K, OS(=O)_mNR^LR^M, ONR^LR^M, ON=CR^NR^O, NR^LR^M, NOR^K, ONR^LR^M, N=CR^NR^O, NNR^L, N(R^L)C(=O)R^K, N(R^L)C(=O)OR^K, S(=O)_nR^V, SC(=O)SR^K, SC(=O)NR^LR^M, S(=O)_mNR^LR^M, C(=O)R^P, C(=S)R^P, C(=O)NR^LR^M, C(=O)OR^K, C(=S)NR^LR^M, C(=S)OR^K, C(=S)SR^K, C(=NR^L)R^M, C(=NR^L)NR^MR^R, o Si(R^S)₂R^T.

55 En una realización, R⁷ es H, halógeno, OH, CN, NC, NO₂, N₃, SF₅; alquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, cicloalquilo de C₃-C₆, alquenido de C₂-C₃, cicloalquenido de C₃-C₆, alquinilo de C₂-C₃, cuyos grupos están no sustituidos o halogenados. En otra realización, R⁷ es H, halógeno; alquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, cuyos grupos están no sustituidos o halogenados.

60 R⁸ es H, halógeno, CN; alquilo de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆, alquenido de C₂-C₆, cicloalquenido de C₃-C₆, alquinilo de C₂-C₆, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes R^G iguales o diferentes; un anillo o sistema de anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado de 3 a 12 miembros, en donde dicho anillo o sistema de anillo heterocíclico comprenden uno o más heteroátomos O, N o S iguales o diferentes, y están

no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes R^H iguales o diferentes, y en donde dichos átomos N y S están independientemente oxidados o no oxidados; fenilo, que está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^J iguales o diferentes; OR^K , SR^K , $OC(=O)R^K$, $OC(=O)OR^K$, $OC(=O)NR^L R^M$, $OC(=O)SR^K$, $OC(=S)NR^L R^M$, $OC(=S)SR^K$, $OS(=O)_m R^K$, $OS(=O)_m NR^L R^M$, $ONR^L R^M$, $ON=CR^N R^O$, $NR^L R^M$, NOR^K , $ONR^L R^M$, $N=CR^N R^O$, NNR^L , $N(R^L)C(=O)R^K$, $N(R^L)C(=O)OR^K$, $S(=O)_n R^V$, $SC(=O)SR^K$, $SC(=O)NR^L R^M$, $S(=O)_m NR^L R^M$, $C(=O)R^P$, $C(=S)R^P$, $C(=O)NR^L R^M$, $C(=O)OR^K$, $C(=S)NR^L R^M$, $C(=S)OR^K$, $C(=S)SR^K$, $C(=NR^L)R^M$, $C(=NR^L)NR^M R^R$, o $Si(R^S)_2 R^T$.

En una realización, R^8 es H, halógeno, OH, CN, NC, NO_2 , N_3 , SF_5 ; alquilo de C_1 - C_3 , alcoxi de C_1 - C_3 , cicloalquilo de C_3 - C_6 , alqueno de C_2 - C_3 , cicloalqueno de C_3 - C_6 , alquino de C_2 - C_3 , cuyos grupos están no sustituidos o halogenados. En otra realización, R^8 es H, halógeno; alquilo de C_1 - C_3 , alcoxi de C_1 - C_3 , cuyos grupos están no sustituidos o halogenados.

Cada R^9 es independientemente H, halógeno, OH, CN, NC, NO_2 , N_3 , SCN, NCS, NCO, SF_5 ; alquilo de C_1 - C_6 , cicloalquilo de C_3 - C_6 , alqueno de C_2 - C_6 , cicloalqueno de C_3 - C_6 , alquino de C_2 - C_6 , cicloalquilo de C_3 - C_6 , cicloalquilo de C_3 - C_6 -alquilo de C_1 - C_3 , cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes R^G iguales o diferentes; un anillo o sistema de anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado de 3 a 12 miembros, en donde dicho anillo o sistema de anillo heterocíclico comprenden uno o más heteroátomos O, N o S iguales o diferentes, y están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes R^H iguales o diferentes, y en donde dichos átomos N y S están independientemente oxidados o no oxidados; fenilo, que está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^J iguales o diferentes; OR^K , SR^K , $OC(=O)R^K$, $OC(=O)OR^K$, $OC(=O)NR^L R^M$, $OC(=O)SR^K$, $OC(=S)NR^L R^M$, $OC(=S)SR^K$, $OS(=O)_m R^K$, $OS(=O)_m NR^L R^M$, $ONR^L R^M$, $ON=CR^N R^O$, $NR^L R^M$, NOR^K , $ONR^L R^M$, $N=CR^N R^O$, NNR^L , $N(R^L)C(=O)R^K$, $N(R^L)C(=O)OR^K$, $S(=O)_n R^V$, $SC(=O)SR^K$, $SC(=O)NR^L R^M$, $S(=O)_m NR^L R^M$, $C(=O)R^P$, $C(=S)R^P$, $C(=O)NR^L R^M$, $C(=O)OR^K$, $C(=S)NR^L R^M$, $C(=S)OR^K$, $C(=S)SR^K$, $C(=NR^L)R^M$, $C(=NR^L)NR^M R^R$, $Si(R^S)_2 R^T$; o dos sustituyentes R^9 forman, junto con los miembros del anillo G a los que están unidos, un carbociclo o heterociclo saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado de 5 o 6 miembros, cuyo carbociclo o heterociclo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^J iguales o diferentes, y en donde dicho heterociclo comprende uno o más heteroátomos O, N o S iguales o diferentes.

En una realización, cada R^9 es independientemente H, halógeno, OH, CN, NO_2 , SF_5 ; alquilo de C_1 - C_3 , cicloalquilo de C_3 - C_6 , alqueno de C_2 - C_3 , cicloalqueno de C_3 - C_6 , alquino de C_2 - C_3 , cicloalquilo de C_3 - C_6 -alquilo de C_1 - C_2 , cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes R^G iguales o diferentes; un anillo o sistema de anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturados de 5 a 6 miembros, en donde dicho anillo o sistema de anillo heterocíclico comprenden uno o más heteroátomos O, N o S iguales o diferentes, y están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes R^H iguales o diferentes, y en donde dichos átomos N y S están independientemente oxidados o no oxidados; fenilo, que está no sustituido, o sustituido con uno o más sustituyentes R^J iguales o diferentes; OR^K , SR^K , $OC(=O)R^K$, $OC(=O)OR^K$, $OC(=O)NR^L R^M$, $ONR^L R^M$, $ON=CR^N R^O$, $NR^L R^M$, NOR^K , $ONR^L R^M$, $N=CR^N R^O$, NNR^L , $N(R^L)C(=O)R^K$, $N(R^L)C(=O)OR^K$, $S(=O)_n R^V$, $C(=O)R^P$, $C(=O)NR^L R^M$, $C(=O)OR^K$; o dos sustituyentes R^9 forman, junto con los miembros del anillo G a los que están unidos, un carbociclo o heterociclo saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado de 5 o 6 miembros, cuyo carbociclo o heterociclo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^J iguales o diferentes, y en donde dicho heterociclo comprende uno o más heteroátomos O, N o S iguales o diferentes.

En otra realización, cada R^9 es independientemente H, halógeno, OH, CN; alquilo de C_1 - C_3 , cicloalquilo de C_3 - C_6 , alqueno de C_2 - C_3 , cicloalqueno de C_3 - C_6 , alquino de C_2 - C_3 , cicloalquilo de C_3 - C_6 -alquilo de C_1 - C_2 , cuyos grupos están no sustituido, o sustituido con uno o más sustituyentes R^G iguales o diferentes; fenilo, que está no sustituido, o sustituido con uno o más sustituyentes R^J iguales o diferentes; OR^K , SR^K , $OC(=O)R^K$, $OC(=O)OR^K$, $OC(=O)NR^L R^M$, $ONR^L R^M$, $ON=CR^N R^O$, $NR^L R^M$, NOR^K , $ONR^L R^M$, $N=CR^N R^O$, NNR^L , $N(R^L)C(=O)R^K$, $N(R^L)C(=O)OR^K$, $S(=O)_n R^V$, $C(=O)R^P$, $C(=O)NR^L R^M$, o $C(=O)OR^K$.

En otra realización, cada R^9 es independientemente H, halógeno, OH, CN; alquilo de C_1 - C_3 , alcoxi de C_1 - C_3 , alqueno de C_2 - C_3 , o alquino de C_2 - C_3 , cuyos grupos están no sustituidos o halogenados.

En otra realización, cada R^9 es independientemente H, halógeno, OH, CN; alquilo de C_1 - C_3 , alcoxi de C_1 - C_3 , alqueno de C_2 - C_3 , o alquino de C_2 - C_3 , cuyos grupos están no sustituidos o halogenados, en donde al menos un sustituyente R^9 es alquilo de C_1 - C_3 , o cicloalquilo de C_3 - C_6 , cuyos grupos están sustituidos con CN, por ejemplo, 1-ciano-ciclopropilo y 1-cianoisopropilo. En otra realización, R^9 es H, alquilo de C_1 - C_3 o haloalquilo de C_1 - C_3 .

En otra realización, cada R^9 es independientemente H, halógeno, OH, CN; alquilo de C_1 - C_3 , alcoxi de C_1 - C_3 , alqueno de C_2 - C_3 , o alquino de C_2 - C_3 , cuyos grupos están no sustituidos o halogenados, en donde al menos un sustituyente R^9 es $-C(CN)R^{91} R^{92}$; o cicloalquilo de C_3 - C_6 , que está sustituido con CN y que o bien no tiene más sustituyentes, o bien está más sustituido con uno o más sustituyentes R^{93} iguales o diferentes.

En otra realización, al menos un R^9 es $-C(CN)R^{91} R^{92}$; o cicloalquilo de C_3 - C_6 , que está sustituido con CN y que o bien no tiene más sustituyentes, o que está además sustituido con uno o más sustituyentes R^{93} iguales o diferentes.

Cada uno de R^{91} , R^{92} son independientemente halógeno, CN, alquilo de C_1 - C_6 , haloalquilo de C_1 - C_6 , cicloalquilo de C_3 - C_6 , alcoxi de C_1 - C_3 , alcoxi de C_1 - C_4 -alquilo de C_1 - C_4 , alquilsulfanilo de C_1 - C_4 o alcoxycarbonilo de C_1 - C_4 . En una realización, cada uno de R^{91} y R^{92} son independientemente halógeno, CN, alquilo de C_1 - C_6 o haloalquilo de C_1 - C_6 .

Típicamente, R⁹¹ y R⁹² no son H. Preferiblemente, R⁹¹ y R⁹² se seleccionan independientemente entre alquilo de C₁-C₆, haloalquilo de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆, alcoxi de C₁-C₄ y alcoxi de C₁-C₄-alquilo de C₁-C₄, más preferiblemente entre alquilo de C₁-C₆, haloalquilo de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆ y alcoxi de C₁-C₄, de manera especialmente preferible entre alquilo de C₁-C₆ y haloalquilo de C₁-C₆, en particular entre alquilo de C₁-C₃ y haloalquilo de C₁-C₃, tal como, por ejemplo, de alquilo de C₁-C₃. En una realización particularmente preferida, tanto R⁹¹ como R⁹² son CH₃.

Cada R⁹³ es independientemente halógeno, CN, C(=O)H, OH, cicloalquilo de C₃-C₆, C(=O)OH, C(=O)NH₂, haloalcoxi de C₁-C₄, alcoxi de C₁-C₄, haloalquilsulfanilo de C₁-C₄, haloalquilsulfinilo de C₁-C₄, haloalquilsulfonilo de C₁-C₄, alcoxycarbonilo de C₁-C₄, haloalcoxycarbonilo de C₁-C₄, alquilcarbonilo de C₁-C₄, haloalquilcarbonilo de C₁-C₄, di-alquilaminocarbonilo(C₁-C₄), alquilaminocarbonilo de C₁-C₄, alquilcarbonilamino C₁-C₄, di-alquilcarbonilamino(C₁-C₄), alcoxycarbonilamino de C₁-C₄, alquilo de C₁-C₄ que está no sustituido o halogenado. En una realización, R⁹³ es halógeno; CN, alquilo de C₁-C₃, o cianoalquilo de C₁-C₃.

En otra realización, dos sustituyentes R⁹ forman, junto con los miembros del anillo G a los que están unidos, un carbociclo o heterociclo saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado de 5 o 6 miembros, cuyo carbociclo o heterociclo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^J iguales o diferentes, y en donde dicho heterociclo comprende uno o más heteroátomos O, N o S iguales o diferentes.

Cada R^A es independientemente H; alquilo de C₁-C₆, alquenilo de C₂-C₆, alquinilo de C₂-C₆, alcoxi de C₁-C₆-alquilo de C₁-C₄, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cicloalcoxi de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno; alquilenilo de C₁-C₆-NR^bR^c, alquilenilo de C₁-C₆-CN; o fenilo o bencilo, en donde el anillo fenilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^F iguales o diferentes.

En una realización, cada R^A es independientemente H; alquilo de C₁-C₃, alquenilo de C₂-C₃, alquinilo de C₂-C₃, alcoxi de C₁-C₃-alquilo de C₁-C₂, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₂, cicloalcoxi de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₂, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno; o fenilo o bencilo, en donde el anillo fenilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^F iguales o diferentes;

En una realización, cada R^A es independientemente H; alquilo de C₁-C₃, alquenilo de C₂-C₃, alquinilo de C₂-C₃, cicloalquilo de C₃-C₆, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno; fenilo o bencilo, en donde el anillo fenilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados entre halógeno, alquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃ y haloalquilo de C₁-C₃.

Cada R^B es independientemente H; alquilo de C₁-C₆, alquenilo de C₂-C₆, alquinilo de C₂-C₆, alcoxi de C₁-C₆-alquilo de C₁-C₄, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cicloalcoxi de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno; alquilenilo de C₁-C₆-CN; o fenilo y bencilo, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes R^F iguales o diferentes;

En una realización, cada R^B es independientemente H; alquilo de C₁-C₃, alquenilo de C₂-C₃, alquinilo de C₂-C₃, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno; fenilo o bencilo, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes R^F iguales o diferentes.

En otra realización, cada R^B es independientemente H; alquilo de C₁-C₃, alquenilo de C₂-C₃, alquinilo de C₂-C₃, cicloalquilo de C₃-C₆, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno; fenilo o bencilo, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados entre halógeno, alquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃ y haloalquilo de C₁-C₃.

Cada R^C es independientemente H; alquilo de C₁-C₆, alquenilo de C₂-C₆, alquinilo de C₂-C₆, alcoxi de C₁-C₆-alquilo de C₁-C₄, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cicloalcoxi de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno; alquilenilo de C₁-C₆-CN; o fenilo o bencilo, en donde el anillo fenilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^F iguales o diferentes;

En una realización, cada R^C es independientemente H; alquilo de C₁-C₃, alquenilo de C₂-C₃, alquinilo de C₂-C₃, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno; fenilo o bencilo, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes R^F iguales o diferentes.

En otra realización, cada R^C es independientemente H; alquilo de C₁-C₃, alquenilo de C₂-C₃, alquinilo de C₂-C₃, cicloalquilo de C₃-C₆, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno; fenilo o bencilo, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados entre halógeno, alquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃ y haloalquilo de C₁-C₃.

Alternativamente, cada resto NR^BR^C también puede formar un heterociclo saturado de 5 a 8 miembros, unido a N, que además del átomo de nitrógeno puede tener 1 o 2 heteroátomos o restos de heteroátomos adicionales seleccionados de O, S(=O)_m y N-R', en donde R' es H o alquilo de C₁-C₆, y en donde el heterociclo unido a N está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados de halógeno, alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₄, alcoxi de C₁-C₄ y haloalcoxi de C₁-C₄. En una realización, cada fracción NR^BR^C también puede formar un heterociclo

saturado de 5 a 6 miembros unido a N, en el que el heterociclo unido a N está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados entre halógeno, alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃ y haloalcoxi de C₁-C₃.

5 Cada R^D es independientemente H; alquilo de C₁-C₆, alqueno de C₂-C₆, alquino de C₂-C₆, alcoxi de C₁-C₆-alquilo de C₁-C₄, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cicloalcoxi de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno; fenilo o bencilo, en donde el anillo fenilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^F iguales o diferentes.

10 En una realización, cada R^D es independientemente alquilo de C₁-C₃, alqueno de C₂-C₃, alquino de C₂-C₃, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno; fenilo o bencilo, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes R^F iguales o diferentes. En otra realización, cada R^D es independientemente alquilo de C₁-C₃, alqueno de C₂-C₃, alquino de C₂-C₃, cicloalquilo de C₃-C₆, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno; fenilo o bencilo, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados entre halógeno, alquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃ y haloalquilo de C₁-C₃.

20 Cada R^E es independientemente alquilo de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, que están no sustituidos o sustituidos con halógeno; o fenilo o bencilo, en donde el anillo fenilo está no sustituido o sustituido con R^F.

25 En una realización, cada R^E es independientemente alquilo de C₁-C₃, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₂, que están no sustituidos o sustituidos con halógeno; fenilo o bencilo, en donde el anillo fenilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados entre halógeno, alquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃ y haloalquilo de C₁-C₃. En una realización, cada R^E es independientemente alquilo de C₁-C₃, o haloalquilo de C₁-C₃.

30 Cada R^F es independientemente halógeno, N₃, OH, CN, NO₂, SCN, SF₅; alquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₆, alqueno de C₂-C₆, alquino de C₂-C₆, alcoxi de C₁-C₆-alquilo de C₁-C₄, alcoxi de C₁-C₆-alcoxi de C₁-C₄, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalcoxi de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cicloalcoxi de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno. En una realización, cada R^F es independientemente halógeno, OH, CN, NO₂; alquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, alqueno de C₂-C₃, alquino de C₂-C₃, cicloalquilo de C₃-C₆, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno. En otra realización, cada R^F es independientemente halógeno; alquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, alqueno de C₂-C₃, alquino de C₂-C₃, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno. En otra realización, cada R^F es independientemente halógeno; alquilo de C₁-C₃, o haloalquilo de C₁-C₃.

40 Cada R^G es independientemente halógeno, OH, CN, NC, NO₂; alquilo de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalqueno de C₃-C₆, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados entre halógeno, OH, CN, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, y alquilcarbonilo de C₁-C₃; un anillo o sistema de anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado de 3 a 12 miembros, en donde dicho anillo o sistema de anillo heterocíclico comprenden uno o varios heteroátomos O, N o S iguales o diferentes, y están no sustituidos o sustituidos por uno o varios sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados entre halógeno, OH, CN, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃ y alquilcarbonilo de C₁-C₃, y en donde dichos átomos N y S están independientemente oxidados o no oxidados; fenilo, que está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados entre halógeno, OH, CN, NO₂, alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, y alquilcarbonilo de C₁-C₃; OR^K, SR^K, OC(=O)R^K, OC(=O)OR^K, OC(=O)NR^LR^M, OC(=O)SR^K, OC(=S)NR^LR^M, OC(=S)SR^K, OS(=O)_mR^K, OS(=O)_mNR^LR^M, ONR^LR^M, ON=CR^NR^O, NR^LR^M, NOR^K, ONR^LR^M, N=CR^NR^O, NNR^L, N(R^L)C(=O)R^K, N(R^L)C(=O)OR^K, S(=O)_nR^V, SC(=O)SR^K, SC(=O)NR^LR^M, S(=O)_mNR^LR^M, C(=O)R^P, C(=S)R^P, C(=O)NR^LR^M, C(=O)OR^K, C(=S)NR^LR^M, C(=S)OR^K, C(=S)SR^K, C(=NR^L)R^M, C(=NR^L)NR^MR^R, Si(R^S)₂R^T.

50 En una realización, cada R^G es independientemente halógeno, OH, CN; alquilo de C₁-C₃, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalqueno de C₃-C₆, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados entre halógeno, OH, CN, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, y alquilcarbonilo de C₁-C₃; un anillo o sistema de anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado de 5 a 6 miembros, en donde dicho anillo o sistema de anillo heterocíclico comprenden uno o varios heteroátomos O, N o S iguales o diferentes, y están no sustituidos o sustituidos por uno o varios sustituyentes iguales o diferentes seleccionados entre halógeno, OH, CN, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃ y alquilcarbonilo de C₁-C₃, y en donde dichos átomos N y S están independientemente oxidados o no oxidados; fenilo, que está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados entre halógeno, OH, CN, NO₂, alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, y alquilcarbonilo de C₁-C₃; OR^K, SR^K, OC(=O)R^K, OC(=O)OR^K, OC(=O)NR^LR^M, ONR^LR^M, ON=CR^NR^O, NR^LR^M, NOR^K, ONR^LR^M, NNR^L, N(R^L)C(=O)R^K, N(R^L)C(=O)OR^K, C(=O)R^P, C(=S)R^P, C(=O)NR^LR^M, C(=O)OR^K. En una realización, R^G es independientemente halógeno, CN; alquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, o fenilo. En otra realización, cada R^G es independientemente halógeno, alquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃ o haloalcoxi de C₁-C₃. En otra realización, cada R^G es independientemente halógeno.

65 Cada R^H es independientemente halógeno, CN, NC, NO₂, SCN, NCS, NCO; alquilo de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆,

5 cicloalqueno de C₃-C₆, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados entre halógeno, OH, CN, alcoxi de C₁-C₁₀, haloalcoxi de C₁-C₃, y alquilcarbonilo de C₁-C₃; fenilo, que está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados entre halógeno, OH, CN, NO₂, alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, OR^K, SR^K, OC(=O)R^K, OC(=O)OR^K, OC(=O)NR^LR^M, OC(=O)SR^K, OC(=S)NR^LR^M, OC(=S)SR^K, OS(=O)_mR^K, OS(=O)_mNR^LR^M, ONR^LR^M, ON=CR^NR^O, NR^LR^M, NOR^K, ONR^LR^M, N=CR^NR^O, NNR^L, N(R^L)C(=O)R^K, N(R^L)C(=O)OR^K, S(=O)_nR^V, SC(=O)SR^K, SC(=O)NR^LR^M, S(=O)_mNR^LR^M, C(=O)R^P, C(=S)R^P, C(=O)NR^LR^M, C(=O)OR^K, C(=S)NR^LR^M, C(=S)OR^K, C(=S)SR^K, C(=NR^L)R^M, C(=NR^L)NR^MR^R, Si(R^S)₂R^T; o dos sustituyentes gemínicos R^H forman junto con el átomo al que están unidos un grupo =O, =S, o =NR^L. En una realización, cada R^H es independientemente halógeno, CN; alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃ o haloalcoxi de C₁-C₃.

15 Cada R^J es independientemente halógeno, CN, NC, NO₂, SCN, NCS, NCO; alquilo de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalqueno de C₃-C₆, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados entre halógeno, OH, CN, alcoxi de C₁-C₁₀, haloalcoxi de C₁-C₃, y alquilcarbonilo de C₁-C₃; fenilo, que está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados entre halógeno, OH, CN, NO₂, alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, OR^K, SR^K, OC(=O)R^K, OC(=O)OR^K, OC(=O)NR^LR^M, OC(=O)SR^K, OC(=S)NR^LR^M, OC(=S)SR^K, OS(=O)_mR^K, OS(=O)_mNR^LR^M, ONR^LR^M, ON=CR^NR^O, NR^LR^M, NOR^K, ONR^LR^M, N=CR^NR^O, NNR^L, N(R^L)C(=O)R^K, N(R^L)C(=O)OR^K, S(=O)_nR^V, SC(=O)SR^K, SC(=O)NR^LR^M, S(=O)_mNR^LR^M, C(=O)R^P, C(=S)R^P, C(=O)NR^LR^M, C(=O)OR^K, C(=S)NR^LR^M, C(=S)OR^K, C(=S)SR^K, C(=NR^L)R^M, C(=NR^L)NR^MR^R, o Si(R^S)₂R^T. En una realización, cada R^J es independientemente halógeno, CN; alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃ o haloalcoxi de C₁-C₃.

25 Cada R^K es independientemente H; alquilo de C₁-C₆, alqueno de C₂-C₆, alquino de C₂-C₆, alcoxi de C₁-C₆-alquilo de C₁-C₄, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cicloalcoxi de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados de halógeno, CN, NR^MR^N, C(=O)NR^MR^N, C(=O)R^T; o fenilo o bencilo, en donde el anillo fenilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^X iguales o diferentes.

30 En una realización, cada R^K es independientemente alquilo de C₁-C₃, alqueno de C₂-C₃, alquino de C₂-C₃, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno; fenilo o bencilo, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes R^X iguales o diferentes. En otra realización, cada R^K es independientemente alquilo de C₁-C₃, alqueno de C₂-C₃, alquino de C₂-C₃, cicloalquilo de C₃-C₆, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno; fenilo o bencilo, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados entre halógeno, alquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃ y haloalquilo de C₁-C₃.

40 Cada R^L es independientemente H; alquilo de C₁-C₆, alqueno de C₂-C₆, alquino de C₂-C₆, alcoxi de C₁-C₆-alquilo de C₁-C₄, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cicloalcoxi de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno; alqueno de C₁-C₆-CN; fenilo y bencilo, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes R^X iguales o diferentes.

45 En una realización, cada R^L es independientemente H; alquilo de C₁-C₃, alqueno de C₂-C₃, alquino de C₂-C₃, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno; fenilo o bencilo, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes R^X iguales o diferentes. En otra realización, cada R^L es independientemente H; alquilo de C₁-C₃, alqueno de C₂-C₃, alquino de C₂-C₃, cicloalquilo de C₃-C₆, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno; fenilo o bencilo, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados entre halógeno, alquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃ y haloalquilo de C₁-C₃.

50 Cada R^M, R^R es independientemente H; alquilo de C₁-C₆, alqueno de C₂-C₆, alquino de C₂-C₆, alcoxi de C₁-C₆-alquilo de C₁-C₄, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cicloalcoxi de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno; alqueno de C₁-C₆-CN; o fenilo o bencilo, en donde el anillo fenilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^X iguales o diferentes.

55 En una realización, cada R^M, R^R es independientemente H; alquilo de C₁-C₃, alqueno de C₂-C₃, alquino de C₂-C₃, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno; fenilo o bencilo, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes R^X iguales o diferentes. En otra realización, cada R^M, R^R es independientemente H; alquilo de C₁-C₃, alqueno de C₂-C₃, alquino de C₂-C₃, cicloalquilo de C₃-C₆, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno; fenilo o bencilo, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados entre halógeno, alquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃ y haloalquilo de C₁-C₃.

65 Alternativamente, cada resto NR^MR^R o NR^LR^M también puede formar un heterociclo saturado de 5 a 8 miembros, unido a N, que además del átomo de nitrógeno puede tener 1 o 2 heteroátomos o restos de heteroátomos adicionales seleccionados de O, S(=O)_m y N-R', en donde R' es H o alquilo de C₁-C₆, y en donde el heterociclo unido a N está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados de halógeno, alquilo de C₁-C₄,

haloalquilo de C₁-C₄, alcoxi de C₁-C₄ y haloalcoxi de C₁-C₄. En una realización, cada fracción NR^{MR}, o NR^LR también puede formar un heterociclo saturado de 5 a 6 miembros unido a N, en el que el heterociclo unido a N está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados entre halógeno, alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃ y haloalcoxi de C₁-C₃.

5 Cada R^N es independientemente H, halógeno, CN, NO₂, SCN; alquilo de C₁-C₁₀, cicloalquilo de C₃-C₆, alqueno de C₂-C₁₀, cicloalqueno de C₃-C₆, alquino de C₂-C₁₀, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados entre halógeno, alquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₆, haloalquilo de C₁-C₆ y haloalcoxi C₁-C₆; un anillo o sistema de anillos heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado
10 de 3 a 12 miembros, en donde dicho anillo o sistema de anillos heterocíclico comprende uno o varios heteroátomos iguales o diferentes O, N o S, y está no sustituido o sustituido por uno o varios sustituyentes iguales o diferentes seleccionados entre halógeno, alquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃ y haloalcoxi de C₁-C₃, y en donde dichos átomos N y S están independientemente oxidados o no oxidados; fenilo, que está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados entre halógeno, alquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃
15 y haloalcoxi de C₁-C₃.

En una realización, cada R^N es independientemente alquilo de C₁-C₃, alqueno de C₂-C₃, alquino de C₂-C₃, cicloalquilo de C₃-C₆, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno; fenilo, que está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados entre halógeno, alquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃ y haloalcoxi de C₁-C₃. En otra realización, cada R^N es independientemente alquilo de C₁-C₃, alqueno de C₂-C₃, alquino de C₂-C₃, cicloalquilo de C₃-C₆, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno; fenilo, que está
20 no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados entre halógeno, alquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃ y haloalcoxi de C₁-C₃.

25 Cada R^O es independientemente H, alquilo de C₁-C₄, cicloalquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₂-alquilo de C₁-C₂, fenilo o bencilo; En una realización, cada R^O es independientemente H, o alquilo de C₁-C₃.

30 Cada R^P es independientemente H; alquilo de C₁-C₆, alqueno de C₂-C₆, alquino de C₂-C₆, alcoxi de C₁-C₆-alquilo de C₁-C₄, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cicloalcoxi de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno; fenilo o bencilo, en donde el anillo fenilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^X iguales o diferentes.

35 En una realización, cada R^P es independientemente alquilo de C₁-C₃, alqueno de C₂-C₃, alquino de C₂-C₃, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno; fenilo o bencilo, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes R^X iguales o diferentes. En otra realización, cada R^P es independientemente alquilo de C₁-C₃, alqueno de C₂-C₃, alquino de C₂-C₃, cicloalquilo de C₃-C₆, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno; fenilo o bencilo, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados entre halógeno, alquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃ y haloalquilo de C₁-C₃.

40 Cada R^S, R^T es independientemente H, alquilo de C₁-C₁₀, haloalquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₁₀, alcoxi de C₁-C₄-alquilo de C₁-C₄, cicloalquilo de C₃-C₆, halocicloalquilo de C₃-C₆, haloalcoxi de C₁-C₄-alquilo de C₁-C₄, o fenilo. En una realización, cada R^S, R^T es independientemente H, alquilo de C₁-C₃, o haloalquilo de C₁-C₃.

45 Cada R^V es independientemente alquilo de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, que están no sustituidos o sustituidos con halógeno; o fenilo o bencilo, en donde el anillo fenilo está no sustituido o sustituido con R^X. En una realización, cada R^V es independientemente alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃; o fenilo o bencilo, en donde el anillo fenilo está no sustituido o halogenado.

50 R^W es independientemente alquilo de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, que están no sustituidos o sustituidos con halógeno; o fenilo o bencilo, en donde el anillo fenilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^X iguales o diferentes. En una realización, cada R^W es independientemente alquilo de C₁-C₃, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₂, que están no sustituidos o sustituidos con halógeno; fenilo o bencilo, en donde el anillo fenilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes, iguales o diferentes,
55 seleccionados entre halógeno, alquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃ y haloalquilo de C₁-C₃. En una realización, cada R^W es independientemente alquilo de C₁-C₃, o haloalquilo de C₁-C₃.

60 Cada R^X es independientemente halógeno, N₃, OH, CN, NO₂, SCN, SF₅; alquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₆, alqueno de C₂-C₆, alquino de C₂-C₆, alcoxi de C₁-C₆-alquilo de C₁-C₄, alcoxi de C₁-C₆-alcoxi de C₁-C₄, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalcoxi de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cicloalcoxi de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno. En una realización, cada R^X es independientemente halógeno, OH, CN, NO₂; alquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, alqueno de C₂-C₃, alquino de C₂-C₃, cicloalquilo de C₃-C₆, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno. En otra realización, cada R^X es independientemente halógeno; alquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, alqueno de C₂-C₃, alquino de C₂-C₃, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno. En
65 otra realización, R^X es independientemente halógeno; alquilo de C₁-C₃, o haloalquilo de C₁-C₃.

ES 2 980 805 T3

El índice m es 0, 1 o 2. En una realización, el índice m es 2. En otra realización, el índice m es 0. El índice n es 0, 1, 2 o 3. En una realización, el índice n es 2. En otra realización, el índice n es 3.

5 La variable G representa que G es un carbociclo o heterociclo saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado de 5 o 6 miembros, cuyo carbociclo o heterociclo incluye los átomos E y J como miembros del anillo y está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^9 iguales o diferentes, y en donde dicho heterociclo comprende ningún, uno o más heteroátomos O, N, o S, iguales o diferentes, como miembros del anillo, además de los que puedan estar presentes como miembros del anillo E y J.

10 En una realización, la variable G representa un carbociclo o heterociclo de 6 miembros saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado, cuyo carbociclo o heterociclo incluye los átomos E y J como miembros del anillo y está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^9 iguales o diferentes, y en donde dicho heterociclo comprende ningún, uno o más heteroátomos O, N, o S, iguales o diferentes, como miembros del anillo, además de los que puedan estar presentes como miembros del anillo E y J.

15 En una realización, la variable G representa un carbociclo o heterociclo de 6 miembros saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado, cuyo carbociclo o heterociclo incluye los átomos E y J como miembros del anillo y está no sustituido o sustituido con ningún, uno o más sustituyentes R^9 iguales o diferentes, y en donde dicho heterociclo comprende ningún, uno o más átomos N como miembros del anillo, además de los que puedan estar presentes como miembros del anillo E y J.

20 En una realización, la variable G representa un carbociclo o heterociclo de 6 miembros saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado, cuyo carbociclo o heterociclo incluye los átomos E y J como miembros del anillo y está no sustituido o sustituido con ningún, uno o más sustituyentes R^9 iguales o diferentes, y en donde dicho heterociclo no comprende ningún, uno o más átomos N como miembros del anillo, además de los que puedan estar presentes como miembros del anillo E y J.

25 En otra realización, la variable G representa un carbociclo parcial o totalmente insaturado de 6 miembros, cuyo carbociclo incluye los átomos E y J como miembros del anillo y está no sustituido, o sustituido con uno o más sustituyentes R^9 iguales o diferentes.

30 En otra realización, la variable G representa un heterociclo parcial o totalmente insaturado de 6 miembros, cuyo heterociclo incluye los átomos E y J como miembros del anillo y está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^9 iguales o diferentes, y en donde dicho heterociclo comprende ningún, uno o más heteroátomos O, N, o S, iguales o diferentes, como miembros del anillo además de los que puedan estar presentes como miembros del anillo E y J.

35 En una realización, la variable G representa un carbociclo o heterociclo de 5 miembros saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado, cuyo carbociclo o heterociclo incluye los átomos E y J como miembros del anillo y está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^9 iguales o diferentes, y en donde dicho heterociclo comprende ningún, uno o más heteroátomos O, N, o S, iguales o diferentes, además de los que puedan estar presentes como miembros del anillo E y J.

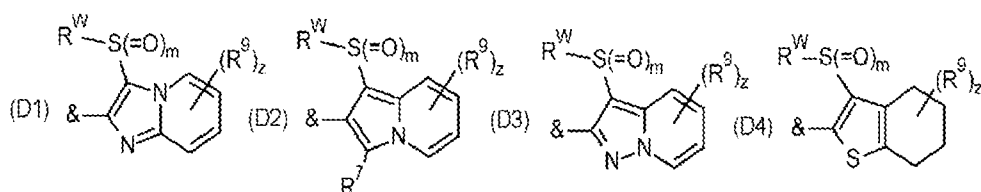
40 En otra realización, la variable G representa un carbociclo parcial o totalmente insaturado de 5 miembros, cuyo carbociclo incluye los átomos E y J como miembros del anillo y está no sustituido, o sustituido con uno o más sustituyentes R^9 iguales o diferentes. En otra realización, la variable G representa un heterociclo parcial o totalmente insaturado de 5 miembros, cuyo heterociclo incluye los átomos E y J como miembros del anillo y está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^9 iguales o diferentes, y en donde dicho heterociclo comprende ningún, uno o más heteroátomos O, N, o S, iguales o diferentes, además de los que puedan estar presentes como miembros del anillo E y J.

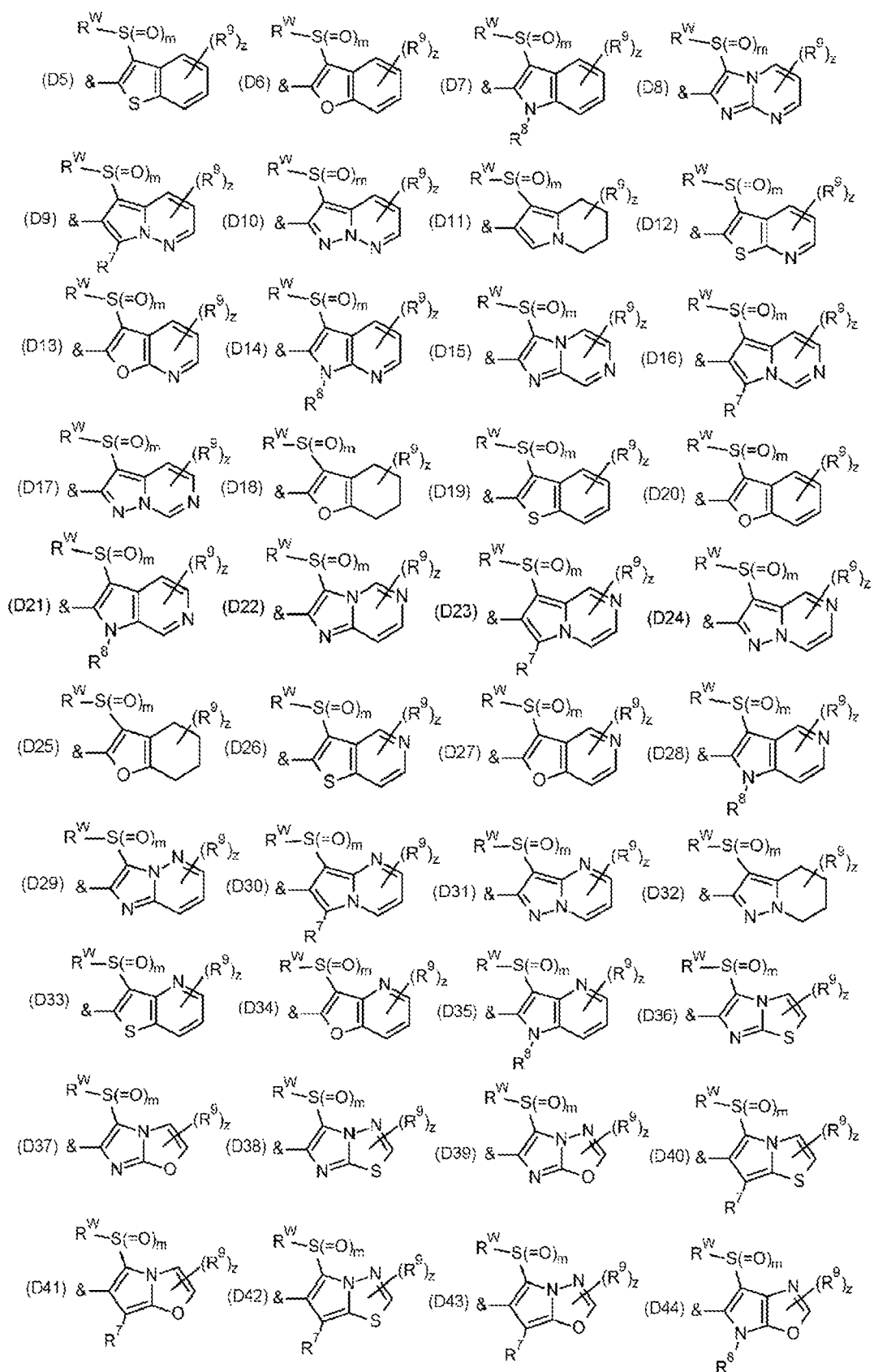
45 La variable A es N, S, O, CR^7 o NR^8 . En una realización, la variable A es N. En otra realización, la variable A es NR^8 . En otra realización, la variable A es O. En otra realización, la variable A es S.

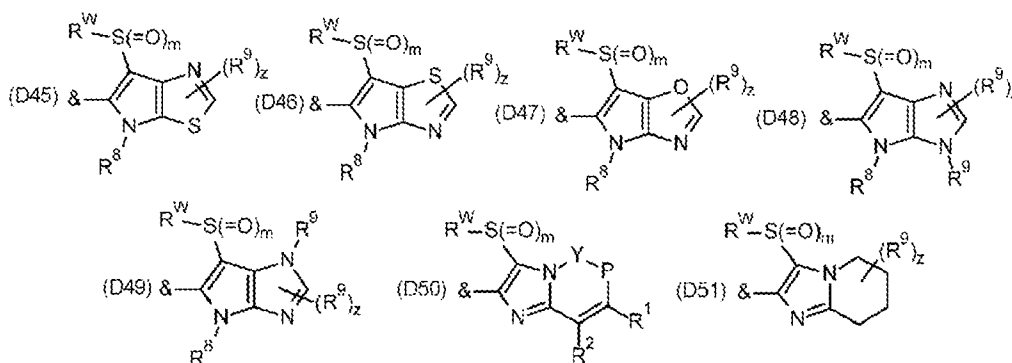
50 Las variables E, J son independientemente C o N, en donde al menos una de las variables seleccionadas de E y J es C. En una realización, E es N y J es C. En otra realización, J es N y E es C.

En otra realización, A y E son N, y J es C. En otra realización, A y J son N, y E es C.

55 En consecuencia, el anillo bicíclico fusionado D puede presentarse mediante una fórmula D1 a D51

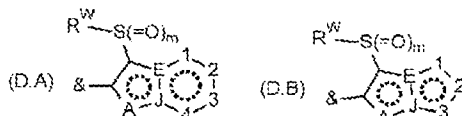






5 en donde el índice z es 0, 1, 2, 3 o 4, preferiblemente 1, y en el que todas las demás variables tienen un significado como el definido para la fórmula (I). Para evitar dudas: el sustituyente o sustituyentes R^9 están unidos a un miembro del anillo G. En una realización, D se selecciona entre D1, D3, D8 y D51. En otra realización, D es D1. En otra realización, D es D3. En otra realización, D es D8. En otra realización, D es D51.

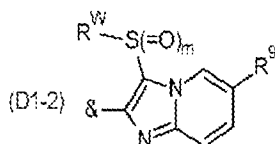
10 La posición de R^9 puede describirse mediante el siguiente esquema: Las fórmulas (D.A) y (D.B) muestran las alternativas de que el anillo G sea un anillo de 6 o 5 miembros, respectivamente



15 en donde los números 1, 2, 3 y 4 denominan cada uno independientemente la posición de un miembro anular específico, en donde la identidad de dichos miembros anulares es la descrita en la presente para la fórmula (I), en donde el símbolo "&" significa la conexión con el resto de la fórmula (I), en donde los círculos punteados en los anillos fusionados significan que los anillos fusionados pueden ser saturados, parcialmente insaturados o totalmente insaturados; y en donde las demás variables son según lo definido para la fórmula (I).

20 En consecuencia, la posición x de un sustituyente R^9 de un anillo D1 a D51 se indicará mediante el sufijo ".x" respectivo, tal como D1,1, D1,2, D1,3 o D1,4.

Por ejemplo, un anillo bicíclico fusionado D1 que tenga un sustituyente R^9 en la posición 2 correspondería al anillo (D1,2)



25 en donde todas las variables tienen un significado según lo definido para la fórmula (I).

30 Las siguientes Tablas 1 a 266 corresponden a sistemas de anillos específicos como combinaciones de anillos bicíclicos fusionados D con anillos bicíclicos fusionados (I-A) o (I-B):

- Tabla 1: los compuesto de la fórmula (I.A), en donde la variable D es de fórmula (D1,1).
- Tabla 2: los compuesto de la fórmula (I.A), en donde la variable D es de fórmula (D1,2).
- Tabla 3: los compuesto de la fórmula (I.A), en donde la variable D es de fórmula (D1,3).
- 35 Tabla 4: los compuesto de la fórmula (I.A), en donde la variable D es de fórmula (D1,4).
- Tabla 5: los compuesto de la fórmula (I.A), en donde la variable D es de fórmula (D2,1).
- Tabla 6: los compuesto de la fórmula (I.A), en donde la variable D es de fórmula (D2,2).
- Tabla 7: los compuesto de la fórmula (I.A), en donde la variable D es de fórmula (D2,3).
- Tabla 8: los compuesto de la fórmula (I.A), en donde la variable D es de fórmula (D2,4).
- 40 Tabla 9: los compuesto de la fórmula (I.A), en donde la variable D es de fórmula (D3,1).
- Tabla 10: los compuesto de la fórmula (I.A), en donde la variable D es de fórmula (D3,2).
- Tabla 11: los compuesto de la fórmula (I.A), en donde la variable D es de fórmula (D3,3).
- Tabla 12: los compuesto de la fórmula (I.A), en donde la variable D es de fórmula (D3,4).
- Tabla 13: los compuesto de la fórmula (I.A), en donde la variable D es de fórmula (D4,1).
- 45 Tabla 14: los compuesto de la fórmula (I.A), en donde la variable D es de fórmula (D4,2).
- Tabla 15: los compuesto de la fórmula (I.A), en donde la variable D es de fórmula (D4,3).

ES 2 980 805 T3

- 5
10
- Tabla 412: los compuesto de la fórmula (I.C), en donde la variable D es de fórmula (D43,2).
 Tabla 413: los compuesto de la fórmula (I.C), en donde la variable D es de fórmula (D44,2).
 Tabla 414: los compuesto de la fórmula (I.C), en donde la variable D es de fórmula (D45,2).
 Tabla 415: los compuesto de la fórmula (I.C), en donde la variable D es de fórmula (D46,2).
 Tabla 416: los compuesto de la fórmula (I.C), en donde la variable D es de fórmula (D47,2).
 Tabla 417: los compuesto de la fórmula (I.C), en donde la variable D es de fórmula (D48,2).
 Tabla 418: los compuesto de la fórmula (I.C), en donde la variable D es de fórmula (D49,2).
 Tabla 419: los compuesto de la fórmula (I.C), en donde la variable D es de fórmula (D50).
 Tabla 420: los compuesto de la fórmula (I.C), en donde la variable D es de fórmula (D50,1).
 Tabla 421: los compuesto de la fórmula (I.C), en donde la variable D es de fórmula (D50,2).
 Tabla 422: los compuesto de la fórmula (I.C), en donde la variable D es de fórmula (D50,3).
 Tabla 423: los compuesto de la fórmula (I.C), en donde la variable D es de fórmula (D50,4).

15 La siguiente Tabla A representa combinaciones específicas de definiciones para los sustituyentes X, R², R³ y R⁹ en las líneas A1 a A480. Cada combinación individualmente y todas las combinaciones colectivamente representan realizaciones preferidas.

20 Tabla A: las líneas A1 a A480 representan definiciones para combinaciones de las variables R¹, R², R³, R⁹, y X. "cPr" es ciclopropilo; "1-CN-cPr" es 1-ciano-ciclopropilo; "1-CN-iPr" es 1-ciano-isopropilo; "Bn" es bencilo; "Cy" es ciclohexilo; "cBu" es ciclobutilo.

Línea	X	R ²	R ³	R ⁹
A1	O	H	CH ₃	CH ₃
A2	O	H	CH ₃	CF ₃
A3	O	H	CH ₃	OCH ₃
A4	O	H	CH ₃	OCF ₃
A5	O	H	CH ₃	F
A6	O	H	CH ₃	Cl
A7	O	H	CH ₃	Br
A8	O	H	CH ₃	1-CN-cPr
A9	O	H	CH ₃	1-CN-iPr
A10	O	H	CH ₃	H
A11	O	H	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A12	O	H	CH ₂ CH ₃	CF ₃
A13	O	H	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
A14	O	H	CH ₂ CH ₃	OCF ₃
A15	O	H	CH ₂ CH ₃	F
A16	O	H	CH ₂ CH ₃	Br
A17	O	H	CH ₂ CH ₃	1-CN-cPr
A18	O	H	CH ₂ CH ₃	1-CN-iPr
A19	O	H	CH ₂ CH ₃	Cl
A20	O	H	CH ₂ CH ₃	H
A21	O	H	cPr	CH ₃
A22	O	H	cPr	CF ₃
A23	O	H	cPr	OCH ₃
A24	O	H	cPr	OCF ₃
A25	O	H	cPr	F
A26	O	H	cPr	Cl
A27	O	H	cPr	Br
A28	O	H	cPr	1-CN-cPr

ES 2 980 805 T3

Línea	X	R ²	R ³	R ⁹
A29	O	H	cPr	1-CN-iPr
A30	O	H	cPr	H
A31	O	H	Bn	CH ₃
A32	O	H	Bn	CF ₃
A33	O	H	Bn	OCH ₃
A34	O	H	Bn	OCF ₃
A35	O	H	Bn	F
A36	O	H	Bn	Cl
A37	O	H	Bn	Br
A38	O	H	Bn	1-CN-cPr
A39	O	H	Bn	1-CN-iPr
A40	O	H	Bn	H
A41	O	H	-CH ₂ -cPr	CH ₃
A42	O	H	-CH ₂ -cPr	CF ₃
A43	O	H	-CH ₂ -cPr	OCH ₃
A44	O	H	-CH ₂ -cPr	OCF ₃
A45	O	H	-CH ₂ -cPr	F
A46	O	H	-CH ₂ -cPr	Cl
A47	O	H	-CH ₂ -cPr	Br
A48	O	H	-CH ₂ -cPr	1-CN-cPr
A49	O	H	-CH ₂ -cPr	1-CN-iPr
A50	O	H	-CH ₂ -cPr	H
A51	O	H	-CH ₂ CHCH ₂	CH ₃
A52	O	H	-CH ₂ CHCH ₂	CF ₃
A53	O	H	-CH ₂ CHCH ₂	OCH ₃
A54	O	H	-CH ₂ CHCH ₂	OCF ₃
A55	O	H	-CH ₂ CHCH ₂	F
A56	O	H	-CH ₂ CHCH ₂	Cl
A57	O	H	-CH ₂ CHCH ₂	Br
A58	O	H	-CH ₂ CHCH ₂	1-CN-cPr
A59	O	H	-CH ₂ CHCH ₂	1-CN-iPr
A60	O	H	-CH ₂ CHCH ₂	H
A61	O	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A62	O	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CF ₃
A63	O	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	OCH ₃
A64	O	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	OCF ₃
A65	O	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	F
A66	O	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	Cl
A67	O	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	Br
A68	O	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	1-CN-cPr

ES 2 980 805 T3

Línea	X	R ²	R ³	R ⁹
A69	O	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	1-CN-iPr
A70	O	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H
A71	O	H	-CH ₂ -Cy	CH ₃
A72	O	H	-CH ₂ -Cy	CF ₃
A73	O	H	-CH ₂ -Cy	OCH ₃
A74	O	H	-CH ₂ -Cy	OCF ₃
A75	O	H	-CH ₂ -Cy	F
A76	O	H	-CH ₂ -Cy	Cl
A77	O	H	-CH ₂ -Cy	Br
A78	O	H	-CH ₂ -Cy	1-CN-cPr
A79	O	H	-CH ₂ -Cy	1-CN-iPr
A80	O	H	-CH ₂ -Cy	H
A81	O	H	-CH ₂ CCH	CH ₃
A82	O	H	-CH ₂ CCH	CF ₃
A83	O	H	-CH ₂ CCH	OCH ₃
A84	O	H	-CH ₂ CCH	OCF ₃
A85	O	H	-CH ₂ CCH	F
A86	O	H	-CH ₂ CCH	Cl
A87	O	H	-CH ₂ CCH	Br
A88	O	H	-CH ₂ CCH	1-CN-cPr
A89	O	H	-CH ₂ CCH	1-CN-iPr
A90	O	H	-CH ₂ CCH	H
A91	O	H	-CH ₂ CF ₃	CH ₃
A92	O	H	-CH ₂ CF ₃	CF ₃
A93	O	H	-CH ₂ CF ₃	OCH ₃
A94	O	H	-CH ₂ CF ₃	OCF ₃
A95	O	H	-CH ₂ CF ₃	F
A96	O	H	-CH ₂ CF ₃	Cl
A97	O	H	-CH ₂ CF ₃	Br
A98	O	H	-CH ₂ CF ₃	1-CN-cPr
A99	O	H	-CH ₂ CF ₃	1-CN-iPr
A100	O	H	-CH ₂ CF ₃	H
A101	O	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃
A102	O	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CF ₃
A103	O	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₃
A104	O	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCF ₃
A105	O	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	F
A106	O	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Cl
A107	O	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Br
A108	O	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	1-CN-cPr

ES 2 980 805 T3

Línea	X	R ²	R ³	R ⁹
A109	O	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	1-CN-iPr
A110	O	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H
A111	O	H	-CH ₂ -cBu	CH ₃
A112	O	H	-CH ₂ -cBu	CF ₃
A113	O	H	-CH ₂ -cBu	OCH ₃
A114	O	H	-CH ₂ -cBu	OCF ₃
A115	O	H	-CH ₂ -cBu	F
A116	O	H	-CH ₂ -cBu	Cl
A117	O	H	-CH ₂ -cBu	Br
A118	O	H	-CH ₂ -cBu	1-CN-cPr
A119	O	H	-CH ₂ -cBu	1-CN-iPr
A120	O	H	-CH ₂ -cBu	H
A121	S	H	CH ₃	CH ₃
A122	S	H	CH ₃	CF ₃
A123	S	H	CH ₃	OCH ₃
A124	S	H	CH ₃	OCF ₃
A125	S	H	CH ₃	F
A126	S	H	CH ₃	Cl
A127	S	H	CH ₃	Br
A128	S	H	CH ₃	1-CN-cPr
A129	S	H	CH ₃	1-CN-iPr
A130	S	H	CH ₃	H
A131	S	H	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A132	S	H	CH ₂ CH ₃	CF ₃
A133	S	H	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
A134	S	H	CH ₂ CH ₃	OCF ₃
A135	S	H	CH ₂ CH ₃	F
A136	S	H	CH ₂ CH ₃	Cl
A137	S	H	CH ₂ CH ₃	Br
A138	S	H	CH ₂ CH ₃	1-CN-cPr
A139	S	H	CH ₂ CH ₃	1-CN-iPr
A140	S	H	CH ₂ CH ₃	H
A141	S	H	cPr	CH ₃
A142	S	H	cPr	CF ₃
A143	S	H	cPr	OCH ₃
A144	S	H	cPr	OCF ₃
A145	S	H	cPr	F
A146	S	H	cPr	Cl
A147	S	H	cPr	Br
A148	S	H	cPr	1-CN-cPr

ES 2 980 805 T3

Línea	X	R ²	R ³	R ⁹
A149	S	H	cPr	1-CN-iPr
A150	S	H	cPr	H
A151	S	H	Bn	CH ₃
A152	S	H	Bn	CF ₃
A153	S	H	Bn	OCH ₃
A154	S	H	Bn	OCF ₃
A155	S	H	Bn	F
A156	S	H	Bn	Cl
A157	S	H	Bn	Br
A158	S	H	Bn	1-CN-cPr
A159	S	H	Bn	1-CN-iPr
A160	S	H	Bn	H
A161	S	H	-CH ₂ -cPr	CH ₃
A162	S	H	-CH ₂ -cPr	CF ₃
A163	S	H	-CH ₂ -cPr	OCH ₃
A164	S	H	-CH ₂ -cPr	OCF ₃
A165	S	H	-CH ₂ -cPr	F
A166	S	H	-CH ₂ -cPr	Cl
A167	S	H	-CH ₂ -cPr	Br
A168	S	H	-CH ₂ -cPr	1-CN-cPr
A169	S	H	-CH ₂ -cPr	1-CN-iPr
A170	S	H	-CH ₂ -cPr	H
A171	S	H	-CH ₂ CHCH ₂	CH ₃
A172	S	H	-CH ₂ CHCH ₂	CF ₃
A173	S	H	-CH ₂ CHCH ₂	OCH ₃
A174	S	H	-CH ₂ CHCH ₂	OCF ₃
A175	S	H	-CH ₂ CHCH ₂	F
A176	S	H	-CH ₂ CHCH ₂	Cl
A177	S	H	-CH ₂ CHCH ₂	Br
A178	S	H	-CH ₂ CHCH ₂	1-CN-cPr
A179	S	H	-CH ₂ CHCH ₂	1-CN-iPr
A180	S	H	-CH ₂ CHCH ₂	H
A181	S	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A182	S	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CF ₃
A183	S	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	OCH ₃
A184	S	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	OCF ₃
A185	S	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	F
A186	S	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	Cl
A187	S	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	Br
A188	S	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	1-CN-cPr

ES 2 980 805 T3

Línea	X	R ²	R ³	R ⁹
A189	S	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	1-CN-iPr
A190	S	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H
A191	S	H	-CH ₂ -Cy	CH ₃
A192	S	H	-CH ₂ -Cy	CF ₃
A193	S	H	-CH ₂ -Cy	OCH ₃
A194	S	H	-CH ₂ -Cy	OCF ₃
A195	S	H	-CH ₂ -Cy	F
A196	S	H	-CH ₂ -Cy	Cl
A197	S	H	-CH ₂ -Cy	Br
A198	S	H	-CH ₂ -Cy	1-CN-cPr
A199	S	H	-CH ₂ -Cy	1-CN-iPr
A200	S	H	-CH ₂ -Cy	H
A201	S	H	-CH ₂ CCH	CH ₃
A202	S	H	-CH ₂ CCH	CF ₃
A203	S	H	-CH ₂ CCH	OCH ₃
A204	S	H	-CH ₂ CCH	OCF ₃
A205	S	H	-CH ₂ CCH	F
A206	S	H	-CH ₂ CCH	Cl
A207	S	H	-CH ₂ CCH	Br
A208	S	H	-CH ₂ CCH	1-CN-cPr
A209	S	H	-CH ₂ CCH	1-CN-iPr
A210	S	H	-CH ₂ CCH	H
A211	S	H	-CH ₂ CF ₃	CH ₃
A212	S	H	-CH ₂ CF ₃	CF ₃
A213	S	H	-CH ₂ CF ₃	OCH ₃
A214	S	H	-CH ₂ CF ₃	OCF ₃
A215	S	H	-CH ₂ CF ₃	F
A216	S	H	-CH ₂ CF ₃	Cl
A217	S	H	-CH ₂ CF ₃	Br
A218	S	H	-CH ₂ CF ₃	1-CN-cPr
A219	S	H	-CH ₂ CF ₃	1-CN-iPr
A220	S	H	-CH ₂ CF ₃	H
A221	S	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃
A222	S	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CF ₃
A223	S	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₃
A224	S	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCF ₃
A225	S	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	F
A226	S	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Cl
A227	S	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Br
A228	S	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	1-CN-cPr

ES 2 980 805 T3

Línea	X	R ²	R ³	R ⁹
A229	S	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	1-CN-iPr
A230	S	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H
A231	S	H	-CH ₂ -cBu	CH ₃
A232	S	H	-CH ₂ -cBu	CF ₃
A233	S	H	-CH ₂ -cBu	OCH ₃
A234	S	H	-CH ₂ -cBu	OCF ₃
A235	S	H	-CH ₂ -cBu	F
A236	S	H	-CH ₂ -cBu	Cl
A237	S	H	-CH ₂ -cBu	Br
A238	S	H	-CH ₂ -cBu	1-CN-cPr
A239	S	H	-CH ₂ -cBu	1-CN-iPr
A240	S	H	-CH ₂ -cBu	H
A241	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃
A242	O	CH ₃	CH ₃	CF ₃
A243	O	CH ₃	CH ₃	OCH ₃
A244	O	CH ₃	CH ₃	OCF ₃
A245	O	CH ₃	CH ₃	F
A246	O	CH ₃	CH ₃	Cl
A247	O	CH ₃	CH ₃	Br
A248	O	CH ₃	CH ₃	1-CN-cPr
A249	O	CH ₃	CH ₃	1-CN-iPr
A250	O	CH ₃	CH ₃	H
A251	O	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A252	O	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CF ₃
A253	O	CH ₃	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
A254	O	CH ₃	CH ₂ CH ₃	OCF ₃
A255	O	CH ₃	CH ₂ CH ₃	F
A256	O	CH ₃	CH ₂ CH ₃	Cl
A257	O	CH ₃	CH ₂ CH ₃	Br
A258	O	CH ₃	CH ₂ CH ₃	1-CN-cPr
A259	O	CH ₃	CH ₂ CH ₃	1-CN-iPr
A260	O	CH ₃	CH ₂ CH ₃	H
A261	O	CH ₃	cPr	CH ₃
A262	O	CH ₃	cPr	CF ₃
A263	O	CH ₃	cPr	OCH ₃
A264	O	CH ₃	cPr	OCF ₃
A265	O	CH ₃	cPr	F
A266	O	CH ₃	cPr	Cl
A267	O	CH ₃	cPr	Br
A268	O	CH ₃	cPr	1-CN-cPr

ES 2 980 805 T3

Línea	X	R ²	R ³	R ⁹
A269	O	CH ₃	cPr	1-CN-iPr
A270	O	CH ₃	cPr	H
A271	O	CH ₃	Bn	CH ₃
A272	O	CH ₃	Bn	CF ₃
A273	O	CH ₃	Bn	OCH ₃
A274	O	CH ₃	Bn	OCF ₃
A275	O	CH ₃	Bn	F
A276	O	CH ₃	Bn	Cl
A277	O	CH ₃	Bn	Br
A278	O	CH ₃	Bn	1-CN-cPr
A279	O	CH ₃	Bn	1-CN-iPr
A280	O	CH ₃	Bn	H
A281	O	CH ₃	-CH ₂ -cPr	CH ₃
A282	O	CH ₃	-CH ₂ -cPr	CF ₃
A283	O	CH ₃	-CH ₂ -cPr	OCH ₃
A284	O	CH ₃	-CH ₂ -cPr	OCF ₃
A285	O	CH ₃	-CH ₂ -cPr	F
A286	O	CH ₃	-CH ₂ -cPr	Cl
A287	O	CH ₃	-CH ₂ -cPr	Br
A288	O	CH ₃	-CH ₂ -cPr	1-CN-cPr
A289	O	CH ₃	-CH ₂ -cPr	1-CN-iPr
A290	O	CH ₃	-CH ₂ -cPr	H
A291	O	CH ₃	-CH ₂ CHCH ₂	CH ₃
A292	O	CH ₃	-CH ₂ CHCH ₂	CF ₃
A293	O	CH ₃	-CH ₂ CHCH ₂	OCH ₃
A294	O	CH ₃	-CH ₂ CHCH ₂	OCF ₃
A295	O	CH ₃	-CH ₂ CHCH ₂	F
A296	O	CH ₃	-CH ₂ CHCH ₂	Cl
A297	O	CH ₃	-CH ₂ CHCH ₂	Br
A298	O	CH ₃	-CH ₂ CHCH ₂	1-CN-cPr
A299	O	CH ₃	-CH ₂ CHCH ₂	1-CN-iPr
A300	O	CH ₃	-CH ₂ CHCH ₂	H
A301	O	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A302	O	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CF ₃
A303	O	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	OCH ₃
A304	O	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	OCF ₃
A305	O	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	F
A306	O	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	Cl
A307	O	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	Br
A308	O	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	1-CN-cPr

ES 2 980 805 T3

Línea	X	R ²	R ³	R ⁹
A309	O	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	1-CN-iPr
A310	O	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H
A311	O	CH ₃	-CH ₂ -Cy	CH ₃
A312	O	CH ₃	-CH ₂ -Cy	CF ₃
A313	O	CH ₃	-CH ₂ -Cy	OCH ₃
A314	O	CH ₃	-CH ₂ -Cy	OCF ₃
A315	O	CH ₃	-CH ₂ -Cy	F
A316	O	CH ₃	-CH ₂ -Cy	Cl
A317	O	CH ₃	-CH ₂ -Cy	Br
A318	O	CH ₃	-CH ₂ -Cy	1-CN-cPr
A319	O	CH ₃	-CH ₂ -Cy	1-CN-iPr
A320	O	CH ₃	-CH ₂ -Cy	H
A321	O	CH ₃	-CH ₂ CCH	CH ₃
A322	O	CH ₃	-CH ₂ CCH	CF ₃
A323	O	CH ₃	-CH ₂ CCH	OCH ₃
A324	O	CH ₃	-CH ₂ CCH	OCF ₃
A325	O	CH ₃	-CH ₂ CCH	F
A326	O	CH ₃	-CH ₂ CCH	Cl
A327	O	CH ₃	-CH ₂ CCH	Br
A328	O	CH ₃	-CH ₂ CCH	1-CN-cPr
A329	O	CH ₃	-CH ₂ CCH	1-CN-iPr
A330	O	CH ₃	-CH ₂ CCH	H
A331	O	CH ₃	-CH ₂ CF ₃	CH ₃
A332	O	CH ₃	-CH ₂ CF ₃	CF ₃
A333	O	CH ₃	-CH ₂ CF ₃	OCH ₃
A334	O	CH ₃	-CH ₂ CF ₃	OCF ₃
A335	O	CH ₃	-CH ₂ CF ₃	F
A336	O	CH ₃	-CH ₂ CF ₃	Cl
A337	O	CH ₃	-CH ₂ CF ₃	Br
A338	O	CH ₃	-CH ₂ CF ₃	1-CN-cPr
A339	O	CH ₃	-CH ₂ CF ₃	1-CN-iPr
A340	O	CH ₃	-CH ₂ CF ₃	H
A341	O	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃
A342	O	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CF ₃
A343	O	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₃
A344	O	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCF ₃
A345	O	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	F
A346	O	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Cl
A347	O	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Br
A348	O	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	1-CN-cPr

ES 2 980 805 T3

Línea	X	R ²	R ³	R ⁹
A349	O	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	1-CN-iPr
A350	O	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H
A351	O	CH ₃	-CH ₂ -cBu	CH ₃
A352	O	CH ₃	-CH ₂ -cBu	CF ₃
A353	O	CH ₃	-CH ₂ -cBu	OCH ₃
A354	O	CH ₃	-CH ₂ -cBu	OCF ₃
A355	O	CH ₃	-CH ₂ -cBu	F
A356	O	CH ₃	-CH ₂ -cBu	Cl
A357	O	CH ₃	-CH ₂ -cBu	Br
A358	O	CH ₃	-CH ₂ -cBu	1-CN-cPr
A359	O	CH ₃	-CH ₂ -cBu	1-CN-iPr
A360	O	CH ₃	-CH ₂ -cBu	H
A361	S	CH ₃	CH ₃	CH ₃
A362	S	CH ₃	CH ₃	CF ₃
A363	S	CH ₃	CH ₃	OCH ₃
A364	S	CH ₃	CH ₃	OCF ₃
A365	S	CH ₃	CH ₃	F
A366	S	CH ₃	CH ₃	Cl
A367	S	CH ₃	CH ₃	Br
A368	S	CH ₃	CH ₃	1-CN-cPr
A369	S	CH ₃	CH ₃	1-CN-iPr
A370	S	CH ₃	CH ₃	H
A371	S	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A372	S	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CF ₃
A373	S	CH ₃	CH ₂ CH ₃	OCH ₃
A374	S	CH ₃	CH ₂ CH ₃	OCF ₃
A375	S	CH ₃	CH ₂ CH ₃	F
A376	S	CH ₃	CH ₂ CH ₃	Cl
A377	S	CH ₃	CH ₂ CH ₃	Br
A378	S	CH ₃	CH ₂ CH ₃	1-CN-cPr
A379	S	CH ₃	CH ₂ CH ₃	1-CN-iPr
A380	S	CH ₃	CH ₂ CH ₃	H
A381	S	CH ₃	cPr	CH ₃
A382	S	CH ₃	cPr	CF ₃
A383	S	CH ₃	cPr	OCH ₃
A384	S	CH ₃	cPr	OCF ₃
A385	S	CH ₃	cPr	F
A386	S	CH ₃	cPr	Cl
A387	S	CH ₃	cPr	Br
A388	S	CH ₃	cPr	1-CN-cPr

ES 2 980 805 T3

Línea	X	R ²	R ³	R ⁹
A389	S	CH ₃	cPr	1-CN-iPr
A390	S	CH ₃	cPr	H
A391	S	CH ₃	Bn	CH ₃
A392	S	CH ₃	Bn	CF ₃
A393	S	CH ₃	Bn	OCH ₃
A394	S	CH ₃	Bn	OCF ₃
A395	S	CH ₃	Bn	F
A396	S	CH ₃	Bn	Cl
A397	S	CH ₃	Bn	Br
A398	S	CH ₃	Bn	1-CN-cPr
A399	S	CH ₃	Bn	1-CN-iPr
A400	S	CH ₃	Bn	H
A401	S	CH ₃	-CH ₂ -cPr	CH ₃
A402	S	CH ₃	-CH ₂ -cPr	CF ₃
A403	S	CH ₃	-CH ₂ -cPr	OCH ₃
A404	S	CH ₃	-CH ₂ -cPr	OCF ₃
A405	S	CH ₃	-CH ₂ -cPr	F
A406	S	CH ₃	-CH ₂ -cPr	Cl
A407	S	CH ₃	-CH ₂ -cPr	Br
A408	S	CH ₃	-CH ₂ -cPr	1-CN-cPr
A409	S	CH ₃	-CH ₂ -cPr	1-CN-iPr
A410	S	CH ₃	-CH ₂ -cPr	H
A411	S	CH ₃	-CH ₂ CHCH ₂	CH ₃
A412	S	CH ₃	-CH ₂ CHCH ₂	CF ₃
A413	S	CH ₃	-CH ₂ CHCH ₂	OCH ₃
A414	S	CH ₃	-CH ₂ CHCH ₂	OCF ₃
A415	S	CH ₃	-CH ₂ CHCH ₂	F
A416	S	CH ₃	-CH ₂ CHCH ₂	Cl
A417	S	CH ₃	-CH ₂ CHCH ₂	Br
A418	S	CH ₃	-CH ₂ CHCH ₂	1-CN-cPr
A419	S	CH ₃	-CH ₂ CHCH ₂	1-CN-iPr
A420	S	CH ₃	-CH ₂ CHCH ₂	H
A421	S	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A422	S	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CF ₃
A423	S	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	OCH ₃
A424	S	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	OCF ₃
A425	S	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	F
A426	S	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	Cl
A427	S	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	Br
A428	S	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	1-CN-cPr

ES 2 980 805 T3

Línea	X	R ²	R ³	R ⁹
A429	S	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	1-CN-iPr
A430	S	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H
A431	S	CH ₃	-CH ₂ -Cy	CH ₃
A432	S	CH ₃	-CH ₂ -Cy	CF ₃
A433	S	CH ₃	-CH ₂ -Cy	OCH ₃
A434	S	CH ₃	-CH ₂ -Cy	OCF ₃
A435	S	CH ₃	-CH ₂ -Cy	F
A436	S	CH ₃	-CH ₂ -Cy	Cl
A437	S	CH ₃	-CH ₂ -Cy	Br
A438	S	CH ₃	-CH ₂ -Cy	1-CN-cPr
A439	S	CH ₃	-CH ₂ -Cy	1-CN-iPr
A440	S	CH ₃	-CH ₂ -Cy	H
A441	S	CH ₃	-CH ₂ CCH	CH ₃
A442	S	CH ₃	-CH ₂ CCH	CF ₃
A443	S	CH ₃	-CH ₂ CCH	OCH ₃
A444	S	CH ₃	-CH ₂ CCH	OCF ₃
A445	S	CH ₃	-CH ₂ CCH	F
A446	S	CH ₃	-CH ₂ CCH	Cl
A447	S	CH ₃	-CH ₂ CCH	Br
A448	S	CH ₃	-CH ₂ CCH	1-CN-cPr
A449	S	CH ₃	-CH ₂ CCH	1-CN-iPr
A450	S	CH ₃	-CH ₂ CCH	H
A451	S	CH ₃	-CH ₂ CF ₃	CH ₃
A452	S	CH ₃	-CH ₂ CF ₃	CF ₃
A453	S	CH ₃	-CH ₂ CF ₃	OCH ₃
A454	S	CH ₃	-CH ₂ CF ₃	OCF ₃
A455	S	CH ₃	-CH ₂ CF ₃	F
A456	S	CH ₃	-CH ₂ CF ₃	Cl
A457	S	CH ₃	-CH ₂ CF ₃	Br
A458	S	CH ₃	-CH ₂ CF ₃	1-CN-cPr
A459	S	CH ₃	-CH ₂ CF ₃	1-CN-iPr
A460	S	CH ₃	-CH ₂ CF ₃	H
A461	S	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃
A462	S	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CF ₃
A463	S	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCH ₃
A464	S	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	OCF ₃
A465	S	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	F
A466	S	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Cl
A467	S	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	Br
A468	S	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	1-CN-cPr

ES 2 980 805 T3

Línea	X	R ²	R ³	R ⁹
A469	S	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	1-CN-iPr
A470	S	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H
A471	S	CH ₃	-CH ₂ -cBu	CH ₃
A472	S	CH ₃	-CH ₂ -cBu	CF ₃
A473	S	CH ₃	-CH ₂ -cBu	OCH ₃
A474	S	CH ₃	-CH ₂ -cBu	OCF ₃
A475	S	CH ₃	-CH ₂ -cBu	F
A476	S	CH ₃	-CH ₂ -cBu	Cl
A477	S	CH ₃	-CH ₂ -cBu	Br
A478	S	CH ₃	-CH ₂ -cBu	1-CN-cPr
A479	S	CH ₃	-CH ₂ -cBu	1-CN-iPr
A480	S	CH ₃	-CH ₂ -cBu	H

Las siguientes Realizaciones 1 a 574 representan combinaciones específicas de definiciones para todos los sustituyentes y Tablas. Cada combinación individualmente y todas las combinaciones colectivamente representan realizaciones preferidas.

5

Realización 1: R¹ es CF₃, R⁶ es CH₃; R^W es CH₂CH₃, el índice m es 2, R⁷ y R⁸, si están presentes, son H, el sistema de anillo está representado por la Tabla 1 y R², R³, X y R⁹ tienen el significado según lo definido en una línea A1 a A480 de la Tabla A.

10

Realización 2: R¹ es CF₃, R⁶ es CH₃; R^W es CH₂CH₃, el índice m es 2, R⁷ y R⁸, si están presentes, son H, el sistema de anillo está representado por la Tabla 2 y R², R³, X y R⁹ tienen el significado definido en una línea A1 a A480 de la Tabla A.

15

Realización 3: R¹ es CF₃, R⁶ es CH₃; R^W es CH₂CH₃, el índice m es 2, R⁷ y R⁸, si están presentes, son H, el sistema de anillos está representado por la Tabla 3 y R², R³, X y R⁹ tienen el significado definido en una línea A1 a A480 de la Tabla A.

20

Realización 4: R¹ es CF₃, R⁶ es CH₃; R^W es CH₂CH₃, el índice m es 2, R⁷ y R⁸, si están presentes, son H, el sistema de anillo está representado por la Tabla 4 y R², R³, X y R⁹ tienen el significado según lo definido en una línea A1 a A480 de la Tabla A.

25

Realización 5: R¹ es CF₃, R⁶ es CH₃; R^W es CH₂CH₃, el índice m es 2, R⁷ y R⁸, si están presentes, son H, el sistema de anillo está representado por la Tabla 5 y R², R³, X y R⁹ tienen el significado según lo definido en una línea A1 a A480 de la Tabla A.

30

Realización 6: R¹ es CF₃, R⁶ es CH₃; R^W es CH₂CH₃, el índice m es 2, R⁷ y R⁸, si están presentes, son H, el sistema de anillo está representado por la Tabla 6 y R², R³, X y R⁹ tienen el significado según lo definido en una línea A1 a A480 de la Tabla A.

35

Realización 7: R¹ es CF₃, R⁶ es CH₃; R^W es CH₂CH₃, el índice m es 2, R⁷ y R⁸, si están presentes, son H, el sistema de anillo está representado por la Tabla 7 y R², R³, X y R⁹ tienen el significado según lo definido en una línea A1 a A480 de la Tabla A.

40

Realización 8: R¹ es CF₃, R⁶ es CH₃; R^W es CH₂CH₃, el índice m es 2, R⁷ y R⁸, si están presentes, son H, el sistema de anillo está representado por la Tabla 8 y R², R³, X y R⁹ tienen el significado según lo definido en una línea A1 a A480 de la Tabla A.

45

Realización 9: R¹ es CF₃, R⁶ es CH₃; R^W es CH₂CH₃, el índice m es 2, R⁷ y R⁸, si están presentes, son H, el sistema de anillo está representado por la Tabla 9 y R², R³, X y R⁹ tienen el significado según lo definido en una línea A1 a A480 de la Tabla A.

Realización 10: R¹ es CF₃, R⁶ es CH₃; R^W es CH₂CH₃, el índice m es 2, R⁷ y R⁸, si están presentes, son H, el sistema de anillo está representado por la Tabla 10 y R², R³, X y R⁹ tienen el significado según lo definido en una línea A1 a A480 de la Tabla A.

Realización 11: R¹ es CF₃, R⁶ es CH₃; R^W es CH₂CH₃, el índice m es 2, R⁷ y R⁸, si están presentes, son H, el sistema de

ES 2 980 805 T3

- Realización 561: R¹ es CF₃, R^W es CH₂CH₃, el índice m es 2, R⁷ y R⁸, si están presentes, son H, el sistema de anillo está representado por la Tabla 410 y R², R³, X y R⁹ tienen el significado según lo definido en una línea A1 a A480 de la Tabla A.
- 5 Realización 562: R¹ es CF₃, R^W es CH₂CH₃, el índice m es 2, R⁷ y R⁸, si están presentes, son H, el sistema de anillo está representado por la Tabla 411 y R², R³, X y R⁹ tienen el significado según lo definido en una línea A1 a A480 de la Tabla A.
- 10 Realización 563: R¹ es CF₃, R^W es CH₂CH₃, el índice m es 2, R⁷ y R⁸, si están presentes, son H, el sistema de anillo está representado por la Tabla 412 y R², R³, X y R⁹ tienen el significado según lo definido en una línea A1 a A480 de la Tabla A.
- 15 Realización 564: R¹ es CF₃, R^W es CH₂CH₃, el índice m es 2, R⁷ y R⁸, si están presentes, son H, el sistema de anillo está representado por la Tabla 413 y R², R³, X y R⁹ tienen el significado según lo definido en una línea A1 a A480 de la Tabla A.
- 20 Realización 565: R¹ es CF₃, R^W es CH₂CH₃, el índice m es 2, R⁷ y R⁸, si están presentes, son H, el sistema de anillo está representado por la Tabla 414 y R², R³, X y R⁹ tienen el significado según lo definido en una línea A1 a A480 de la Tabla A.
- 25 Realización 566: R¹ es CF₃, R^W es CH₂CH₃, el índice m es 2, R⁷ y R⁸, si están presentes, son H, el sistema de anillo está representado por la Tabla 415 y R², R³, X y R⁹ tienen el significado según lo definido en una línea A1 a A480 de la Tabla A.
- 30 Realización 567: R¹ es CF₃, R^W es CH₂CH₃, el índice m es 2, R⁷ y R⁸, si están presentes, son H, el sistema de anillo está representado por la Tabla 416 y R², R³, X y R⁹ tienen el significado según lo definido en una línea A1 a A480 de la Tabla A.
- 35 Realización 568: R¹ es CF₃, R^W es CH₂CH₃, el índice m es 2, R⁷ y R⁸, si están presentes, son H, el sistema de anillo está representado por la Tabla 417 y R², R³, X y R⁹ tienen el significado según lo definido en una línea A1 a A480 de la Tabla A.
- 40 Realización 569: R¹ es CF₃, R^W es CH₂CH₃, el índice m es 2, R⁷ y R⁸, si están presentes, son H, el sistema de anillo está representado por la Tabla 418 y R², R³, X y R⁹ tienen el significado según lo definido en una línea A1 a A480 de la Tabla A.
- 45 Realización 570: R¹ es CF₃, R^W es CH₂CH₃, el índice m es 2, R⁷ y R⁸, si están presentes, son H, el sistema de anillo está representado por la Tabla 419 y R², R³, X y R⁹ tienen el significado según lo definido en una línea A1 a A480 de la Tabla A.
- 50 Realización 571: R¹ es CF₃, R^W es CH₂CH₃, el índice m es 2, R⁷ y R⁸, si están presentes, son H, el sistema de anillo está representado por la Tabla 420 y R², R³, X y R⁹ tienen el significado según lo definido en una línea A1 a A480 de la Tabla A.
- 55 Realización 572: R¹ es CF₃, R^W es CH₂CH₃, el índice m es 2, R⁷ y R⁸, si están presentes, son H, el sistema de anillo está representado por la Tabla 421 y R², R³, X y R⁹ tienen el significado según lo definido en una línea A1 a A480 de la Tabla A.
- Realización 573: R¹ es CF₃, R^W es CH₂CH₃, el índice m es 2, R⁷ y R⁸, si están presentes, son H, el sistema de anillo está representado por la Tabla 422 y R², R³, X y R⁹ tienen el significado según lo definido en una línea A1 a A480 de la Tabla A.
- Realización 574: R¹ es CF₃, R^W es CH₂CH₃, el índice m es 2, R⁷ y R⁸, si están presentes, son H, el sistema de anillo está representado por la Tabla 423 y R², R³, X y R⁹ tienen el significado según lo definido en una línea A1 a A480 de la Tabla A.
- En una realización preferida, el compuesto de fórmula (I) es un compuesto de fórmula (I.A) o (I.B), en donde el anillo bicíclico fusionado D es un anillo seleccionado entre D1 y D51, y en donde
- 60 R¹ es haloalquilo de C₁-C₃;
R² es H, o alquilo de C₁-C₃;
R³ es alquilo de C₁-C₃, alquenoilo de C₂-C₃, alquinoilo de C₂-C₃, alcoxi de C₁-C₃-alquilo de C₁-C₃, cicloalquilo de C₃-C₅, fenilo, bencilo, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₃, cuyos grupos están no sustituidos o halogenados;
- 65 R⁴ es alquilo de C₁-C₃ o H;
R⁵ es alquilo de C₁-C₃;

ES 2 980 805 T3

- 5
 R⁶ es H, o alquilo de C₁-C₃;
 R⁷ es H, o alquilo de C₁-C₃;
 R⁸ es H, o alquilo de C₁-C₃;
 R⁹ es alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno; o cicloalquilo de C₃-C₄, o alquilo de C₁-C₃, cuyos grupos están sustituidos con CN, preferiblemente 1-cianociclopropilo o 1-cianoisopropilo;
 X es O o S;
 m es 0 o 2;
 R^w es CH₂CH₃
- 10
 En otra realización preferida, el compuesto de fórmula (I) es un compuesto de fórmula (LA), (I.B) o (I.C) en donde el anillo bicíclico fusionado D es un anillo seleccionado entre D1 y D51, y en donde
- 15
 R¹ es haloalquilo de C₁-C₃;
 R² es H, o alquilo de C₁-C₃;
 R³ es alquilo de C₁-C₃, alqueno de C₂-C₃, alquino de C₂-C₃, alcoxi de C₁-C₃-alquilo de C₁-C₃, cicloalquilo de C₃-C₅, fenilo, bencilo, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₃, cuyos grupos están no sustituidos o halogenados;
- 20
 R⁴ es alquilo de C₁-C₃ o H;
 R⁵ es alquilo de C₁-C₃;
 R⁶ es H, o alquilo de C₁-C₃;
 R⁷ es H, o alquilo de C₁-C₃;
 R⁸ es H, o alquilo de C₁-C₃;
 R⁹ es alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno;
- 25
 X es O o S;
 m es 0 o 2;
 R^w es CH₂CH₃
- 30
 En otra realización preferida, el compuesto de fórmula (I) es un compuesto de fórmula (LA), en donde el anillo bicíclico fusionado D es un anillo seleccionado de D1 a D51, y en donde
- 35
 R¹ es haloalquilo de C₁-C₃;
 R² es H, o alquilo de C₁-C₃;
 R³ es alquilo de C₁-C₃, alqueno de C₂-C₃, alquino de C₂-C₃, alcoxi de C₁-C₃-alquilo de C₁-C₃, cicloalquilo de C₃-C₅, fenilo, bencilo, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₃, cuyos grupos están no sustituidos o halogenados;
- 40
 R⁶ es H, o alquilo de C₁-C₃;
 R⁷ es H, o alquilo de C₁-C₃;
 R⁸ es H, o alquilo de C₁-C₃;
 R⁹ es alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno;
 X es O o S;
 m es 0 o 2;
 R^w es CH₂CH₃
- 45
 En otra realización preferida, el compuesto de fórmula (I) es un compuesto de fórmula (LA), en donde el anillo bicíclico fusionado D es un anillo seleccionado de D1, D3, D8 y D51, y en donde
- 50
 R¹ es haloalquilo de C₁-C₃;
 R² es H;
 R³ es alquilo de C₁-C₃, alqueno de C₂-C₃, alquino de C₂-C₃, cicloalquilo de C₃-C₅, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₃, cuyos grupos están no sustituidos o halogenados;
- 55
 R⁶ es H, o alquilo de C₁-C₃;
 R⁷ es H, o alquilo de C₁-C₃;
 R⁸ es H, o alquilo de C₁-C₃;
 R⁹ es alquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, cicloalquilo de C₃-C₆, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno o CN;
 X es O o S;
 m es 0 o 2;
 R^w es CH₂CH₃
- 60
 En otra realización preferida, el compuesto de fórmula (I) es un compuesto de fórmula (LA), en donde el anillo bicíclico fusionado D es un anillo seleccionado de D1, D3, D8 y D51, y en donde
- 65
 R¹ es haloalquilo de C₁-C₃;
 R² es H;
 R³ es alquilo de C₁-C₃, alqueno de C₂-C₃, alquino de C₂-C₃, cicloalquilo de C₃-C₅, cicloalquilo de C₃-C₆-

alquilo de C₁-C₃, cuyos grupos están no sustituidos o halogenados;
 5 R⁶ es H, o alquilo de C₁-C₃;
 R⁷ es H, o alquilo de C₁-C₃;
 R⁸ es H, o alquilo de C₁-C₃;
 R⁹ es alquilo de C₁-C₃, que está no sustituido o sustituido con halógeno o CN;
 X es O o S;
 m es 0 o 2;
 R^W es CH₂CH₃

10 En otra realización preferida, el compuesto de fórmula (I) es un compuesto de fórmula (LA), en donde el anillo bicíclico fusionado D es un anillo seleccionado de D1, D3, D8 y D51, y en donde

R¹ es haloalquilo de C₁-C₃;
 R² es H;
 15 R³ es alquilo de C₁-C₃, alqueno de C₂-C₃, alquino de C₂-C₃, cicloalquilo de C₃-C₅, cicloalquilo de C₃-C₆-
 alquilo de C₁-C₃, cuyos grupos están no sustituidos o halogenados;
 R⁶ es H, o alquilo de C₁-C₃;
 R⁷ es H, o alquilo de C₁-C₃;
 R⁸ es H, o alquilo de C₁-C₃;
 20 R⁹ es alquilo de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalcoxi de C₁-C₃, halógeno;
 X es O o S;
 m es 0 o 2;
 R^W es CH₂CH₃

25 En otra realización preferida, el compuesto de fórmula (I) es un compuesto de fórmula (LA), en donde el anillo bicíclico fusionado D es un anillo D1, y en donde

R¹ es haloalquilo de C₁-C₃;
 R² es H;
 30 R³ es alquilo de C₁-C₃, alqueno de C₂-C₃, alquino de C₂-C₃, cicloalquilo de C₃-C₅, cicloalquilo de C₃-C₆-
 alquilo de C₁-C₃, cuyos grupos están no sustituidos o halogenados;
 R⁶ es H, o alquilo de C₁-C₃;
 R⁷ es H, o alquilo de C₁-C₃;
 R⁸ es H, o alquilo de C₁-C₃;
 35 R⁹ es alquilo de C₁-C₃, o haloalquilo de C₁-C₃;
 X es O o S;
 m es 0 o 2;
 R^W es CH₂CH₃

40 Mezclas

La presente invención también se refiere a un mezcla de al menos un compuesto de la invención con al menos un
 mezclador según lo definido en la presente. Se prefieren mezclas binarias de un compuesto de la invención como
 45 componente I con un mezclador según lo definido en la presente como componente II. Las relaciones en peso preferidas
 para tales mezclas binarias son de 5000:1 a 1:5000, preferiblemente de 1000:1 a 1:1000, más preferiblemente de 100:1
 a 1:100, particularmente de 10:1 a 1:10. En dichas mezclas binarias, los componentes I y II pueden utilizarse en cantidades
 iguales, o puede utilizarse un exceso del componente I, o un exceso del componente II.

50 Los mezcladores pueden seleccionarse de pesticidas, en particular insecticidas, nematocidas y acaricidas, fungicidas,
 herbicidas, reguladores del crecimiento vegetal, fertilizantes. Los mezcladores preferidos son los insecticidas, nematocidas
 y fungicidas.

Formulaciones

55 La invención también se refiere a las composiciones agroquímicas que comprenden un auxiliar y al menos un compuesto
 de la presente invención o una mezcla de los mismos.

Una composición agroquímica comprende un cantidad pesticida eficaz de un compuesto de la presente invención o un
 60 mezcla del mismo. El término "cantidad pesticida eficaz" se define a continuación.

Los compuestos de la presente invención o las mezclas de los mismos pueden convertirse en tipos habituales de
 composiciones agroquímicas, por ejemplo, disoluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, pastas, gránulos, prensados,
 cápsulas, y mezclas de los mismos. Ejemplos de tipos de composición son las suspensiones (por ejemplo, SC, OD, FS),
 65 concentrados emulsionables (por ejemplo, EC), emulsiones (por ejemplo, EW, EO, ES, ME), cápsulas (por ejemplo, CS,
 ZC), pastas, pastillas, polvos humectables o polvos (por ejemplo, WP, SP, WS, DP, DS), prensados (por ejemplo, BR, TB,
 DT), gránulos (por ejemplo, WG, SG, GR, FG, GG, MG), artículos insecticidas (por ejemplo, LN), así como formulaciones

en gel para el tratamiento de materiales de propagación de plantas, tales como semillas (por ejemplo, GF). Estos y otros tipos de composiciones se definen en "Catalogue of pesticide formulation types and international coding system", Monografía técnica No. 2, 6a Ed. Mayo de 2008, CropLife International.

5 Las composiciones se preparan de una manera conocida, tal como se describe por Mollet y Grubemann, Formulation technology, Wiley VCH, Weinheim, 2001; o Knowles, New developments in crop protection product formulation, Agrow Reports DS243, T&F Informa, Londres, 2005.

10 Los auxiliares adecuados son los disolventes, portadores líquidos, portadores sólidos o materiales de relleno, tensoactivos, dispersantes, emulsionantes, humectantes, adyuvantes, solubilizantes, potenciadores de la penetración, coloides protectores, agentes de adhesión, espesantes, agentes retenedores de humedad, repelentes, atrayentes, estimulantes de la alimentación, compatibilizantes, bactericidas, agentes anticongelantes, agentes antiespumantes, colorantes, adhesivos y aglutinantes.

15 Los disolventes y portadores líquidos adecuados son el agua y los disolventes orgánicos. Los portadores sólidos o materiales de relleno adecuados son las tierras minerales.

20 Los tensoactivos adecuados son compuestos activos superficiales, por ejemplo, tensoactivos aniónicos, catiónicos, no iónicos y anfotéricos, polímeros en bloque, polielectrolitos. Tales tensoactivos se pueden utilizar como emulsificador, dispersante, solubilizante, humectante, potenciador de la penetración, coloide protector o adyuvante. Los tensoactivos se enumeran en McCutcheon's, Vol.1: Emulsifiers & Detergents, McCutcheon's Directories, Glen Rock, EE. UU., 2008 (International or North American Ed.). Los tensoactivos aniónicos adecuados son sales alcalinas, alcalinotérricas o amónicas de sulfonatos, sulfatos, fosfatos, carboxilatos. Los tensoactivos no iónicos adecuados son alcoxilatos, amidas de ácidos grasos sustituidos en N, óxidos de amina, ésteres, tensoactivos a base de azúcar, tensoactivos poliméricos.

25 Los tensoactivos catiónicos adecuados son los tensoactivos cuaternarios. Las composiciones agroquímicas generalmente comprenden entre 0,01 y 95 %, preferiblemente entre 0,1 y 90 %, y más preferiblemente entre 0,5 y 75 %, en peso de principio activo. Los principios activos se emplean en una pureza de 90 % a 100 %, preferiblemente de 95 % a 100 %.

30 Varios tipos de aceites, humectantes, adyuvantes, o fertilizante, podrán añadirse a las sustancias activas o a las composiciones que las componen como una premezcla o, en su caso, hasta inmediatamente antes de su uso (mezcla en tanque). Estos agentes pueden mezclarse con las composiciones de acuerdo con la invención en una relación en peso de 1:100 a 100:1.

35 El usuario aplica la composición de acuerdo con la invención generalmente de un dispositivo de predosificación, un pulverizador de mochila, un tanque de pulverización, un avión de pulverización o un sistema de irrigación. Por lo general, la composición agroquímica se compone de agua, disolución amortiguadora y/o auxiliares adicionales a la concentración de aplicación deseada y se obtiene el líquido de pulverización listo para usar o la composición agroquímica de acuerdo con la invención. Por lo general, se aplican de 20 a 2000 litros del líquido de pulverización listo para usar por hectárea de área útil agrícola.

40 Los compuestos de fórmula (I) son adecuados para su uso en la protección contra ataques o infestaciones por plagas animales de cultivos, plantas, materiales de propagación de plantas, por ejemplo, semillas, o suelo o agua, en los que las plantas crecen. Por lo tanto, la invención también se refiere a un método de protección de plantas, que comprende poner en contacto los cultivos, plantas, materiales de propagación de plantas, por ejemplo, semillas, o suelo o agua, en los que crecen las plantas, a proteger de ataques o infestaciones por plagas animales, con un cantidad pesticida eficaz de un compuesto de fórmula (I).

45

50 Los compuestos I también son adecuados para combatir o controlar las plagas animales. Por lo tanto, la invención también se refiere a un método para combatir o controlar las plagas animales, que comprende poner en contacto las plagas animales, su hábitat, zona de reproducción o suministro de alimentos, o los cultivos, plantas, materiales de propagación de plantas, por ejemplo, semillas, o suelo, o el área, material o entorno en el que las plagas animales están creciendo o pueden crecer, con un cantidad pesticida eficaz de un compuesto I.

55 Los compuestos I son eficaces tanto por contacto como por ingestión para todas y cada una de las etapas de desarrollo, tales como huevo, larva, pupa y adulto.

Los compuestos I pueden aplicarse como tales o en forma de composiciones que los comprenden.

60 La aplicación se puede llevar a cabo tanto antes como después de la infestación de los cultivos, plantas, materiales de propagación de plantas por las plagas.

El término "poner en contacto" incluye tanto el contacto directo (aplicación de los compuestos/composiciones directamente sobre la plaga animal o la planta) como el contacto indirecto (aplicación de los compuestos/composiciones al locus).

65 El término "plaga animal" incluye artrópodos, gasterópodos y nematodos. Las plagas animales preferidas de acuerdo con la invención son los artrópodos, preferiblemente insectos y arácnidos, en particular insectos. El término "planta" incluye

5 cereales, por ejemplo, trigo duro y otros trigos, centeno, cebada, triticale, avena, arroz o maíz (maíz forrajero y maíz azucarero / maíz dulce y de campo); remolacha, por ejemplo, remolacha azucarera o remolacha forrajera; frutas, por ejemplo, pomáceas, frutas de hueso o frutos de baya, por ejemplo, manzanas, peras, ciruelas, duraznos, nectarinas, almendras, cerezas, papayas, fresas, frambuesas, moras o grosellas; leguminosas, por ejemplo, frijoles, lentejas, guisantes, alfalfa o soya; plantas oleaginosas, por ejemplo, colza (colza oleaginosa), nabina, mostaza, aceitunas, girasol, coco, cacao en grano, plantas de ricino, palma aceitera, cacahuates o soya; cucurbitáceas, por ejemplo, calabacines, calabazas, pepinos o melones; plantas de fibra, por ejemplo, algodón, lino, cáñamo o yute; cítricos, por ejemplo, naranjas, limones, uvas o mandarinas; hortalizas, por ejemplo, berenjenas, espinacas, lechugas (por ejemplo, lechuga iceberg), achicoria, coles, espárragos, coles, zanahorias, cebollas, ajos, puerros, jitomates, papas, cucurbitáceas o pimientos dulces; plantas lauráceas, por ejemplo, aguacates, canela o alcanfor; plantas energéticas y de materias primas, por ejemplo, maíz, soya, colza, caña de azúcar o palma aceitera; tabaco; frutos secos, por ejemplo, nueces; pistaches; café; té; plátanos; vides; lúpulo; hoja dulce (Stevia); plantas de caucho natural o plantas ornamentales y forestales, arbustos, árboles de hoja ancha o perenne, eucalipto; césped; pasto; grama. Las plantas preferidas incluyen papas, remolacha azucarera, tabaco, trigo, centeno, cebada, avena, arroz, maíz, algodón, soya, colza, legumbres, girasoles, café o caña de 15 azúcar; frutas; vides; plantas ornamentales; o vegetales, por ejemplo, pepinos, jitomates, frijoles o calabazas.

El término "semilla" abarca semillas y propágulos de plantas, incluyendo semillas verdaderas, piezas de semillas, retoños, cormos, bulbos, fruta, tubérculos, granos, esquejes, brotes cortados, y preferiblemente significa semillas verdaderas. "Cantidad pesticida eficaz" significa la cantidad de principio activo necesaria para lograr un efecto observable en el 20 crecimiento, incluyendo los efectos de necrosis, muerte, retraso, prevención y eliminación, destrucción, o de otra manera disminuir la ocurrencia y actividad del organismo objetivo. La cantidad pesticida eficaz puede variar para los diversos compuestos/composiciones utilizados en la invención. Una cantidad pesticida eficaz de las composiciones también variará de acuerdo con las condiciones prevalecientes, por ejemplo, el efecto pesticida deseado y la duración, el clima, la especie objetivo, el locus, el modo de aplicación.

25 Para su uso en el tratamiento de plantas de cultivo, por ejemplo, mediante aplicación foliar, la tasa de aplicación de los ingredientes activos de esta invención puede estar en el rango de 0,0001 g a 4000 g por hectárea, por ejemplo, de 1 g a 2 kg por hectárea o de 1 g a 750 g por hectárea, deseablemente de 1 g a 100 g por hectárea.

30 Los compuestos I también son adecuados para su uso contra plagas de insectos no agrícolas. Para su uso contra dichas plagas no agrícolas, los compuestos I pueden utilizarse como una composición de cebo, gel, aerosol para insectos en general, como aplicación de volumen ultra bajo y malla de cama (impregnado o aplicado en la superficie).

35 El término "plaga de insectos no agrícolas" se refiere a las plagas, que son particularmente relevantes para los objetivos no agrícolas, por ejemplo, hormigas, termitas, avispas, moscas, garrapatas, mosquitos, chinches, grillos o cucarachas, tales como: *Aedes aegypti*, *Musca domestica*, *Tribolium* spp.; termitas, tales como *Reticulitermes flavipes*, *Coptotermes formosanus*; cucarachas, tales como *Blatella germanica*, *Periplaneta Americana*; hormigas, tales como *Solenopsis invicta*, *Linepithema humile*, y *Camponotus pennsylvanicus*.

40 El cebo puede ser un líquido, un sólido o una preparación semisólida (por ejemplo, un gel). Para su uso en composiciones de cebos, el contenido típico de principio activo es de 0,001 % en peso a 15 % en peso, deseablemente de 0,001 % en peso a 5 % en peso de compuesto activo.

45 Los compuestos I y sus composiciones pueden utilizarse para proteger materiales de madera, tales como árboles, vallas de tablas, durmientes, marcos, artefactos artísticos, etc., y edificios, pero también materiales de construcción, muebles, cueros, fibras, artículos de vinilo, cables eléctricos y cables, etc., de hormigas, termitas y/o escarabajos destructores de madera o textiles, y para evitar que las hormigas y las termitas dañen los cultivos o a las personas (por ejemplo, cuando las plagas invaden casas e instalaciones públicas o anidan en patios, huertos o parques).

50 Las tasas de aplicación habituales en la protección de materiales son, por ejemplo, de 0,001 g a 2000 g o de 0,01 g a 1000 g de compuesto activo por m² de material tratado, deseablemente de 0,1 g a 50 g por m². Las composiciones insecticidas para su uso en la impregnación de materiales suelen contener de 0,001 al 95 % en peso, preferiblemente de 0,1 a 45 % en peso, y más preferiblemente de 1 a 25 % en peso de al menos un repelente y/o insecticida.

55 Plagas

Los compuestos de la invención son especialmente adecuados para combatir eficazmente las plagas animales, por ejemplo, los artrópodos, y los nematodos, incluyendo:

60 insectos del orden de **Lepidoptera**, por ejemplo *Achroia grisella*, *Acleris* spp. tal como *A. fimbriana*, *A. gloverana*, *A. variana*; *Acrolepiopsis assectella*, *Acronicta major*, *Adoxophyes* spp. tal como *A. cyrtosema*, *A. orana*; *Aedia leucomelas*, *Agrotis* spp. tal como *A. exclamationis*, *A. fucosa*, *A. ipsilon*, *A. orthogoma*, *A. segetum*, *A. subterranea*; *Alabama argillacea*, *Aleurodicus dispersus*, *Alsophila pometaria*, *Ampelophaga rubiginosa*, *Amyelois transitella*, *Anacampsis sarcitella*, *Anagasta kuehniella*, *Anarsia lineatella*, *Anisota senatoria*, *Antheraea pernyi*, *Anticarsia* (= *Thermesia*) spp. tal como *A. gemmatalis*; *Apamea* spp., *Approaerema modicella*, *Archips* spp. tal como *A. argyrospila*, *A. fuscocupreanus*, *A. rosana*, *A. xyloseanus*; *Argyresthia conjugella*, *Argyroplote* spp., *Argyrotaenia* spp. tal como *A. velutinana*; *Athetis mindara*, *Austroasca viridigrisea*, *Autographa gamma*, *Autographa nigrisigna*, *Barathra brassicae*, *Bedellia* spp., *Bonagota*

salubricola, *Borbo cinnara*, *Bucculatrix thurberiella*, *Bupalus piniarius*, *Busseola* spp., *Cacoecia* spp. tal como *C. murinana*, *C. podana*; *Cactoblastis cactorum*, *Cadra cautella*, *Calingo braziliensis*, *Caloptilis theivora*, *Capua reticulana*, *Carposina* spp. tal como *C. niponensis*, *C. sasakii*; *Cephus* spp., *Chaetocnema aridula*, *Cheimatobia brumata*, *Chilo* spp. tal como *C. Indicus*, *C. suppressalis*, *C. partellus*; *Choreutis pariana*, *Choristoneura* spp. tal como *C. conflictana*, *C. fumiferana*, *C. longicellana*, *C. murinana*, *C. occidentalis*, *C. rosaceana*; *Chrysodeixis* (=Pseudoplusia) spp. tal como *C. eriosoma*, *C. includens*; *Cirphis unipuncta*, *Clysia ambiguella*, *Cnaphalocerus* spp., *Cnaphalocrocis medinalis*, *Cnephasia* spp., *Cochylis hospes*, *Coleophora* spp., *Colias eurytheme*, *Conopomorpha* spp., *Conotrachelus* spp., *Copitarsia* spp., *Corcyra cephalonica*, *Crambus caliginosellus*, *Crambus teterrellus*, *Crociosema* (=Epinotia) *aporema*, *Cydalima* (=Diaphania) *perspectalis*, *Cydia* (=Carpocapsa) spp. tal como *C. pomonella*, *C. latiferreana*; *Dalaca noctuides*, *Datana integerrima*, *Dasychira pinicola*, *Dendrolimus* spp. tal como *D. pini*, *D. spectabilis*, *D. sibiricus*; *Desmia funeralis*, *Diaphania* spp. tal como *D. nitidalis*, *D. hyalinata*; *Diatraea grandiosella*, *Diatraea saccharalis*, *Diphthera festiva*, *Earias* spp. tal como *E. insulana*, *E. vittella*; *Ecdytolopha aurantianu*, *Egira* (=Xylomyges) *curialis*, *Elasmopalpus lignosellus*, *Eldana saccharina*, *Endopiza viteana*, *Ennomos subsignaria*, *Eoreuma loftini*, *Ephestia* spp. tal como *E. cautella*, *E. elutella*, *E. kuehniella*; *Epinotia aporema*, *Epiphyas postvittana*, *Erannotia tiliaria*, *Erionota thrax*, *Etiella* spp., *Eulia* spp., *Eupoecilia ambiguella*, *Euproctis chrysorrhoea*, *Euxoa* spp., *Evetria bouliana*, *Faronta albilinea*, *Feltia* spp. tal como *F. subterranean*; *Galleria mellonella*, *Gracillaria* spp., *Grapholita* spp. tal como *G. funebrana*, *G. molesta*, *G. inopinata*; *Halysidota* spp., *Harrisina americana*, *Hedylepta* spp., *Helicoverpa* spp. tal como *H. armigera* (=Heliothis *armigera*), *H. zea* (=Heliothis *zea*); *Heliothis* spp. tal como *H. assulta*, *H. subflexa*, *H. virescens*; *Hellula* spp. tal como *H. undalis*, *H. rogatalis*; *Helocoverpa gelatopoeon*, *Hemileuca oliviae*, *Herpetogramma licarsisalis*, *Hibernia defoliaria*, *Hofmannophila pseudospretella*, *Homoeosoma electellum*, *Homona magnanima*, *Hypena scabra*, *Hyphantria cunea*, *Hyponomeuta padella*, *Hyponomeuta malinellus*, *Kakivoria flavofasciata*, *Keiferia lycopersicella*, *Lambdina fiscellaria fiscellaria*, *Lambdina fiscellaria lugubrosa*, *Lamprosema indicata*, *Laspeyresia molesta*, *Leguminivora glycinivorella*, *Lerodea eufala*, *Leucinodes orbonalis*, *Leucoma salicis*, *Leucoptera* spp. tal como *L. coffeella*, *L. scitella*; *Leuminivora lycinivorella*, *Lithocolletis blancardella*, *Lithophane antennata*, *Llattia octo* (=Amyna *axis*), *Lobesia botrana*, *Lophocampa* spp., *Loxagrotis albicosta*, *Loxostege* spp. tal como *L. sticticalis*, *L. cerealis*; *Lymantria* spp. tal como *L. dispar*, *L. monacha*; *Lyonetia clerkella*, *Lyonetia prunifoliella*, *Malacosoma* spp. tal como *M. americanum*, *M. californicum*, *M. constrictum*, *M. neustria*; *Mamestra* spp. tal como *M. brassicae*, *M. configurata*; *Mamstra brassicae*, *Manduca* spp. tal como *M. quinquemaculata*, *M. sexta*; *Marasmia* spp., *Marmara* spp., *Maruca testualis*, *Megalopyge lanata*, *Melanchnra picta*, *Melanitis leda*, *Mocis* spp. tal como *M. lapites*, *M. repanda*; *Mocis latipes*, *Monochroa fragariae*, *Mythimna separata*, *Nemapogon cloacella*, *Neoleucinodes elegantalis*, *Nepytia* spp., *Nymphula* spp., *Oiketicus* spp., *Omiodes indicata*, *Omphisa anastomosalis*, *Operophtera brumata*, *Orgyia pseudotsugata*, *Oria* spp., *Orthaga thyrisalis*, *Ostrinia* spp. tal como *O. nubilalis*; *Oulema oryzae*, *Paleacrita vernata*, *Panolis flammea*, *Parnara* spp., *Papaipema nebris*, *Papilio cresphontes*, *Paramyelois transiella*, *Paranthrene regalis*, *Paysandisia archon*, *Pectinophora* spp. tal como *P. gossypiella*; *Peridroma saucia*, *Perileucoptera* spp., tal como *P. coffeella*; *Phalera bucephala*, *Phryganidia californica*, *Phthorimaea* spp. tal como *P. operculella*; *Phyllocnistis citrella*, *Phyllonorycter* spp. tal como *P. blancardella*, *P. crataegella*, *P. issikii*, *P. ringinella*; *Pieris* spp. tal como *P. brassicae*, *P. rapae*, *P. napi*; *Pilocrocis tripunctata*, *Plathyrena scabra*, *Platynota* spp. tal como *P. flavedana*, *P. idaeusalis*, *P. stultana*; *Platyptilia carduidactyla*, *Plebejus argus*, *Plodia interpunctella*, *Plusia* spp., *Plutella maculipennis*, *Plutella xylostella*, *Pontia protodica*, *Prays* spp., *Prodenia* spp., *Proxenus lepigone*, *Pseudaletia* spp. tal como *P. sequax*, *P. unipuncta*; *Pyrausta nubilalis*, *Rachiplusia nu*, *Richia albicosta*, *Rhizobius ventralis*, *Rhyacionia frustrana*, *Sabulodes aegrotata*, *Schizura concinna*, *Schoenobius* spp., *Schreckensteiniella festaliella*, *Scirpophaga* spp. tal como *S. incertulas*, *S. innotata*; *Scotia segetum*, *Sesamia* spp. tal como *S. inferens*, *Seudya subflava*, *Sitotroga cerealella*, *Sparganothis pillariana*, *Spilonota lechriaspis*, *S. ocellana*, *Spodoptera* (=Lamphygma) spp. tal como *S. cosmoides*, *S. eridania*, *S. exigua*, *S. frugiperda*, *S. latifascia*, *S. littoralis*, *S. litura*, *S. omithogalli*; *Stigmella* spp., *Stomopteryx subsecivella*, *Strymon bazochii*, *Sylepta derogata*, *Synanthedon* spp. tal como *S. exitiosa*, *Tecia solanivora*, *Telehin licus*, *Thaumatopoea pityocampa*, *Thaumatotibia* (=Cryptophlebia) *leucotreta*, *Thaumatopoea pityocampa*, *Theda* spp., *Theresimima ampelophaga*, *Thyrinteina* spp., *Tieldenia inconspicua*, *Tinea* spp. tal como *T. cloacella*, *T. pellionella*; *Tineola bisselliella*, *Tortrix* spp. tal como *T. viridana*; *Trichophaga tapetzella*, *Trichoplusia* spp. tal como *T. ni*; *Tuta* (=Scrobipalpula) *absoluta*, *Udea* spp. tal como *U. rubigalis*, *U. rubigalis*; *Virachola* spp., *Yponomeuta padella*, y *Zeiraphera canadensis*;

50 insectos del orden de **Coleoptera**, por ejemplo *Acalymma vittatum*, *Acanthoscehdus obtectus*, *Adoretus* spp., *Agelastica alni*, *Agrilus* spp. tal como *A. anxius*, *A. planipennis*, *A. sinuatus*; *Agriotes* spp. tal como *A. fuscicollis*, *A. lineatus*, *A. obscurus*; *Alphitobius diaperinus*, *Amphimallus solstitialis*, *Anisandrus dispar*, *Anisoplia austriaca*, *Anobium punctatum*, *Anomala corpulenta*, *Anomala rufocuprea*, *Anoplophora* spp. tal como *A. glabripennis*; *Anthonomus* spp. tal como *A. eugenii*, *A. grandis*, *A. pomorum*; *Anthrenus* spp., *Aphthona euphoridae*, *Apion* spp., *Apogonia* spp., *Athous haemorrhoidalis*, *Atomaria* spp. tal como *A. linearis*; *Attagenus* spp., *Aulacophora femoralis*, *Blastophagus piniperda*, *Blitophaga undata*, *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp. tal como *B. lentis*, *B. pisorum*, *B. rufimanus*; *Byctiscus betulae*, *Callidiellum rufipenne*, *Callopietria floridensis*, *Callosobruchus chinensis*, *Cameraria ohridella*, *Cassida nebulosa*, *Cerotoma trifurcata*, *Cetonia aurata*, *Ceuthorhynchus* spp. tal como *C. assimilis*, *C. napi*; *Chaetocnema tibialis*, *Cleonus mendicus*, *Conoderus* spp. tal como *C. vespertinus*; *Conotrachelus nenuphar*, *Cosmopolites* spp., *Costelytra zealandica*, *Crioceris asparagi*, *Cryptolestes ferrugineus*, *Cryptorhynchus lapathi*, *Ctenicera* spp. tal como *C. destructor*; *Curculio* spp., *Cylindrocaptus* spp., *Cyclocephala* spp., *Dactylispa balyi*, *Dectes texanus*, *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp. tal como *D. undecimpunctata*, *D. speciosa*, *D. longicornis*, *D. semipunctata*, *D. virgifera*; *Diaprepes abbreviatus*, *Dichocrocis* spp., *Di cladispa armigera*, *Diloboderus abderus*, *Diocalandra frumenti* (*Diocalandra stigmaticollis*), *Enaphalodes rufulus*, *Epilachna* spp. tal como *E. varivestis*, *E. vigintioctomaculata*; *Epitrix* spp. tal como *E. hirtipennis*, *E. similis*; *Euthola humilis*, *Eutinobothrus brasiliensis*, *Fastinus cubae*, *Gibbium psylloides*, *Gnathocerus cornutus*, *Hellula undalis*, *Heteronychus arator*, *Hylamorphia elegans*, *Hylobius abietis*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera* spp. tal

como *H. brunneipennis*, *H. postica*; *Hypomeces squamosus*, *Hypothenemus* spp., *Ips typographus*, *Lachnosterna consanguinea*, *Lasioderma serricorne*, *Latheticus oryzae*, *Lathridius* spp., *Lema* spp. tal como *L. bilineata*, *L. melanopus*; *Leptinotarsa* spp. tal como *L. decemlineata*; *Leptispa pygmaea*, *Limonius californicus*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lixus* spp., *Luperodes* spp., *Lyctus* spp. tal como *L. bruneus*; *Liogenys fuscus*, *Macroductylus* spp. tal como *M. subspinosus*; *Maladera matrida*, *Megaplatypus mutates*, *Megascelis* spp., *Melanotus communis*, *Meligethes* spp. tal como *M. aeneus*; *Melolontha* spp. tal como *M. hippocastani*, *M. melolontha*; *Metamasius hemipterus*, *Microtheca* spp., *Migdolus* spp. tal como *M. fryanus*, *Monochamus* spp. tal como *M. alternatus*; *Naupactus xanthographus*, *Niptus hololeucus*, *Oberia brevis*, *Oemona hirta*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Oryzaphagus oryzae*, *Otiorrhynchus sulcatus*, *Otiorrhynchus ovatus*, *Otiorrhynchus sulcatus*, *Oulema melanopus*, *Oulema oryzae*, *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon* spp. tal como *P. brassicae*, *P. cochleariae*; *Phoracantha recurva*, *Phyllobius pyri*, *Phyllopertha horticola*, *Phyllophaga* spp. tal como *P. helleri*; *Phyllotreta* spp. tal como *P. chrysocephala*, *P. nemorum*, *P. striolata*, *P. vittula*; *Phyllopertha horticola*, *Popillia japonica*, *Premnotrypes* spp., *Psacotheta hilaris*, *Psylliodes chrysocephala*, *Prostephanus truncatus*, *Psylliodes* spp., *Ptinus* spp., *Pulga saltona*, *Rhizopertha dominica*, *Rhynchophorus* spp. tal como *R. billineatus*, *R. ferrugineus*, *R. palmarum*, *R. phoenicis*, *R. vulneratus*; *Saperda candida*, *Scolytus schevyrewi*, *Scyphophorus acupunctatus*, *Sitona lineatus*, *Sitophilus* spp. tal como *S. granaria*, *S. oryzae*, *S. zeamais*; *Sphenophorus* spp. tal como *S. levis*; *Stegobium paniceum*, *Sternechus* spp. tal como *S. subsignatus*; *Strophomorpha ctenotus*, *Symphyletes* spp., *Tanymecus* spp., *Tenebrio molitor*, *Tenebrioides mauretanicus*, *Tribolium* spp. tal como *T. castaneum*; *Trogoderma* spp., *Tychius* spp., *Xylotrechus* spp. tal como *X. pyrrhoderus*; *Y.*, *Zabrus* spp. tal como *Z. tenebrioides*;

insectos del orden de **Diptera** por ejemplo, *Aedes* spp. tal como *A. aegypti*, *A. albopictus*, *A. vexans*; *Anastrepha ludens*, *Anopheles* spp. tal como *A. albimanus*, *A. crucians*, *A. freeborni*, *A. gambiae*, *A. leucosphyrus*, *A. maculipennis*, *A. minimus*, *A. quadrimaculatus*, *A. sinensis*; *Bactrocera invadens*, *Bibio hortulanus*, *Calliphora erythrocephala*, *Calliphora vicina*, *Ceratitis capitata*, *Chrysomya* spp. tal como *C. bezziana*, *C. hominivorax*, *C. macellaria*; *Chrysops atlanticus*, *Chrysops discalis*, *Chrysops silacea*, *Cochliomyia* spp. tal como *C. hominivorax*; *Contarinia* spp. tal como *C. sorghicola*; *Cordylobia anthropophaga*, *Culex* spp. tal como *C. nigripalpus*, *C. pipiens*, *C. quinquefasciatus*, *C. tarsalis*, *C. tritaeniorhynchus*; *Culicoides furens*, *Culiseta inornata*, *Culiseta melanura*, *Cuterebra* spp., *Dacus cucurbitae*, *Dacus oleae*, *Dasineura brassicae*, *Dasineura oxycoccana*, *Delia* spp. tal como *D. antique*, *D. coarctata*, *D. platura*, *D. radicum*; *Dermatobia hominis*, *Drosophila* spp. tal como *D. suzukii*, *Fannia* spp. tal como *F. canicularis*; *Gastrophilus* spp. tal como *G. intestinalis*; *Geomyza tipunctata*, *Glossina* spp. tal como *G. fuscipes*, *G. morsitans*, *G. palpalis*, *G. tachinoides*; *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hippelates* spp., *Hylemyia* spp. tal como *H. platura*; *Hypoderma* spp. tal como *H. lineata*; *Hypobosca* spp., *Hydrellia philippina*, *Leptoconops torrens*, *Liriomyza* spp. tal como *L. sativae*, *L. trifolii*; *Lucilia* spp. tal como *L. caprina*, *L. cuprina*, *L. sericata*; *Lycoria pectoralis*, *Mansonia titillanus*, *Mayetiola* spp. tal como *M. destructor*; *Musca* spp. tal como *M. autumnalis*, *M. domestica*; *Muscina stabulans*, *Oestrus* spp. tal como *O. ovis*; *Opomyza florum*, *Oscinella* spp. tal como *O. frit*; *Orseolia oryzae*, *Pegomya hysocyami*, *Phlebotomus argentipes*, *Phorbia* spp. tal como *P. antiqua*, *P. brassicae*, *P. coarctata*; *Phytomyza gymnostoma*, *Prosimulium mixtum*, *Psila rosae*, *Psorophora columbiae*, *Psorophora discolor*, *Rhagoletis* spp. tal como *R. cerasi*, *R. cingulate*, *R. indifferens*, *R. mendax*, *R. pomonella*; *Rivellia quadrifasciata*, *Sarcophaga* spp. tal como *S. haemorrhoidalis*; *Simulium vittatum*, *Sitodiplosis mosellana*, *Stomoxys* spp. tal como *S. calcitrans*; *Tabanus* spp. tal como *T. atratus*, *T. bovinus*, *T. lineola*, *T. similis*; *Tannia* spp., *Thecodiplosis japonensis*, *Tipula oleracea*, *Tipula paludosa*, y *Wohlfahrtia* spp;

insectos del orden de **Thysanoptera** por ejemplo, *Baliothrips biformis*, *Dichromothrips corbetti*, *Dichromothrips* spp., *Echinothrips americanus*, *Enneothrips flavens*, *Frankliniella* spp. tal como *F. fusca*, *F. occidentalis*, *F. tritici*; *Heliothrips* spp., *Hercinothrips femoralis*, *Kakothrips* spp., *Microcephalothrips abdominalis*, *Neohydatothrips samayunkur*, *Pezothrips kellyanus*, *Rhipiphorothrips cruentatus*, *Scirtothrips* spp. tal como *S. citri*, *S. dorsalis*, *S. perseae*; *Stemchaetothrips* spp., *Taeniothrips cardamoni*, *Taeniothrips inconsequens*, *Thrips* spp. tal como *T. imagines*, *T. hawaiiensis*, *T. oryzae*, *T. palmi*, *T. parvispinus*, *T. tabaci*;

insectos del orden de **Hemiptera** por ejemplo, *Acizzia jamatonica*, *Acrosternum* spp. tal como *A. hilare*; *Acyrtosipon* spp. tal como *A. onobrychis*, *A. pisum*; *Adelges laricis*, *Adelges tsugae*, *Adelphocoris* spp., tal como *A. rapidus*, *A. superbus*; *Aeneolamia* spp., *Agonoscena* spp., *Aulacorthum solani*, *Aleurocanthus woglumi*, *Aleurodes* spp., *Aleurodicus disperses*, *Aleurolobus barodensis*, *Aleurothrixus* spp., *Amrasca* spp., *Anasa tristis*, *Antestiopsis* spp., *Anuraphis cardui*, *Aonidiella* spp., *Aphanostigma piri*, *Aphidula nasturtii*, *Aphis* spp. tal como *A. craccivora*, *A. fabae*, *A. forbesi*, *A. gossypii*, *A. grossulariae*, *A. maidiradicis*, *A. pomi*, *A. sambuci*, *A. schneideri*, *A. spiraeicola*; *Arboridia apicalis*, *Arilus critatus*, *Aspidiella* spp., *Aspidiotus* spp., *Atanus* spp., *Aulacaspis yasumatsui*, *Aulacorthum solani*, *Bactericera cockerelli* (*Paratrioza cockerelli*), *Bemisia* spp. tal como *B. argentifolii*, *B. tabaci* (*Aleurodes tabaci*); *Blissus* spp. tal como *B. leucopterus*; *Brachycaudus* spp. tal como *B. cardui*, *B. helichrysi*, *B. persicae*, *B. prunicola*; *Brachycolus* spp., *Brachycorynella asparagi*, *Brevicoryne brassicae*, *Cacopsylla* spp. tal como *C. fulguralis*, *C. pyricola* (*Psylla piri*); *Calligypona marginata*, *Calocoris* spp., *Campylomma livida*, *Capitophorus horni*, *Carneiocephala fulgida*, *Cavalerius* spp., *Ceraplastes* spp., *Ceratovacuna lanigera*, *Ceroplastes ceriferus*, *Cerosiphia gossypii*, *Chaetosiphon fragaefolii*, *Chionaspis tegalensis*, *Chlorita onukii*, *Chromaphis juglandicola*, *Chrysomphalus ficus*, *Cicadulina mbila*, *Cimex* spp. tal como *C. hemipterus*, *C. lectularius*; *Coccomytilus halli*, *Coccus* spp. tal como *C. hesperidum*, *C. pseudomagnoliarum*; *Corythucha arcuata*, *Creontiades dilutus*, *Cryptomyzus ribis*, *Chrysomphalus aonidum*, *Cryptomyzus ribis*, *Ctenarytaina spatulata*, *Cyrtopeltis notatus*, *Dalbulus* spp., *Dasynus piperis*, *Dialeurodes* spp. tal como *D. citrifolii*; *Dalbulus maidis*, *Diaphorina* spp. tal como *D. citri*; *Diaspis* spp. tal como *D. bromeliae*; *Dichelops furcatus*, *Diconocoris hewetti*, *Doralis* spp., *Dreyfusia nordmanniana*, *Dreyfusia piceae*, *Drosicha* spp., *Dysaphis* spp. tal como *D. plantaginea*, *D. pyri*, *D. radicola*; *Dysaulacorthum pseudosolani*, *Dysdercus* spp. tal como *D. cingulatus*, *D. intermedius*; *Dysmicoccus* spp., *Edessa* spp., *Geocoris* spp., *Empoasca* spp. tal como *E. fabae*, *E. solana*; *Epidiaspis leperii*; *Eriosoma* spp. tal como *E. lanigerum*, *E. pyricola*; *Erythroneura* spp., *Eurygaster* spp. tal como *E. integriceps*; *Euscelis bilobatus*, *Euschistus* spp. tal como *E. heros*, *E. impictiventris*, *E. servus*; *Fiorinia theae*, *Geococcus coffeae*, *Glycaspis*

- 5
10
15
20
25
30
35
40
45
50
55
60
65
- brimblecombei*, *Halyomorpha* spp. tal como *H. halys*; *Heliopeltis* spp., *Homalodisca vitripennis* (= *H. coagulata*), *Horcias nobillellus*, *Hyalopterus pruni*, *Hyperomyzus lactucae*, *Icerya* spp. tal como *I. purchasei*; *Idiocerus* spp., *Idioscopus* spp., *Laodelphax striatellus*, *Lecanium* spp., *Lecanoides floccissimus*, *Lepidosaphes* spp. tal como *L. ulmi*; *Leptocoris* spp., *Leptoglossus phyllopus*, *Lipaphis erşimi*, *Lygus* spp. tal como *L. hesperus*, *L. lineolaris*, *L. pratensis*; *Maconellicoccus hirsutus*, *Marchalina hellenica*, *Macropes excavatus*, *Macrosiphum* spp. tal como *M. rosae*, *M. avenae*, *M. euphorbiae*; *Macrosteles quadrilineatus*, *Mahanarva fimbriolata*, *Megacopta cribraria*, *Megoura viciae*, *Melanaphis pyraeae*, *Melanaphis sacchari*, *Melanocallis* (= *Tinocallis*) *caryaefoliae*, *Metcafiella* spp., *Metopolophium dirhodum*, *Monellia costalis*, *Monelliopsis pecanisi*, *Myzocallis coryli*, *Murgantia* spp., *Myzus* spp. tal como *M. ascalonicus*, *M. cerasi*, *M. nicotianae*, *M. persicae*, *M. varians*; *Nasonovia ribis-nigri*, *Neotoxoptera formosana*, *Neomegalotomus* spp., *Nephotettix* spp. tal como *N. malayanus*, *N. nigropictus*, *N. parvus*, *N. virescens*; *Nezara* spp. tal como *N. viridula*; *Nilaparvata lugens*, *Nysius huttoni*, *Oebalus* spp. tal como *O. pugnax*; *Oncometopia* spp., *Orthezia praelonga*, *Oxycaraenus hyalinipennis*, *Parabemisia myricae*, *Parlatoria* spp., *Parthenolecanium* spp. tal como *P. corni*, *P. persicae*; *Pemphigus* spp. tal como *P. bursarius*, *P. populivinae*; *Peregrinus maidis*, *Perkinsiella saccharicida*, *Phenacoccus* spp. tal como *P. aceris*, *P. gossypii*; *Phloeomyzus passerinii*, *Phorodon humuli*, *Phylloxera* spp. tal como *P. devastatrix*, *Piesma quadrata*, *Piezodorus* spp. tal como *P. guildinii*; *Pinnaspis aspidistrae*, *Planococcus* spp. tal como *P. citri*, *P. ficus*; *Prosapia bicincta*, *Protospulvinaria pyriformis*, *Psallus seriatus*, *Pseudacysta perseae*, *Pseudaulacaspis pentagona*, *Pseudococcus* spp. tal como *P. comstocki*; *Psylla* spp. tal como *P. mali*; *Pteromalus* spp., *Pulvinaria amygdali*, *Pyrilla* spp., *Quadraspidiotus* spp., tal como *Q. perniciosus*; *Quesada gigas*, *Rastrococcus* spp., *Reduvius senilis*, *Rhizococcus americanus*, *Rhodnius* spp., *Rhopalomyzus ascalonicus*, *Rhopalosiphum* spp. tal como *R. pseudobrassicae*, *R. insertum*, *R. maidis*, *R. padi*; *Sagatodes* spp., *Sahlbergella singularis*, *Saissetia* spp., *Sappaphis mala*, *Sappaphis mali*, *Scaptocoris* spp., *Scaphoides titanus*, *Schizaphis graminum*, *Schizoneura lanuginosa*, *Scotinophora* spp., *Selenaspidus articulatus*, *Sitobion avenae*, *Sogata* spp., *Sogatella furcifera*, *Solubea insularis*, *Spissistilus festinus* (= *Stictiocephala festina*), *Stephanitis nashi*, *Stephanitis pyrioides*, *Stephanitis takeyai*, *Tenalaphara malayensis*, *Tetraleurodes perseae*, *Therioaphis maculata*, *Thyanta* spp. tal como *T. accerra*, *T. perditor*; *Tibraca* spp., *Tomaspis* spp., *Toxoptera* spp. tal como *T. aurantii*; *Trialeurodes* spp. tal como *T. abutilonea*, *T. ricini*, *T. vaporariorum*; *Triatoma* spp., *Trioza* spp., *Typhlocyba* spp., *Unaspis* spp. tal como *U. citri*, *U. yanonensis*; y *Viteus vitifolii*,
- Insectos del orden **Hymenoptera** por ejemplo *Acanthomyops interjectus*, *Athalia rosae*, *Atta* spp. tal como *A. capiguara*, *A. cephalotes*, *A. cephalotes*, *A. laevigata*, *A. robusta*, *A. sexdens*, *A. texana*, *Bombus* spp., *Brachymyrmex* spp., *Camponotus* spp. tal como *C. floridanus*, *C. pennsylvanicus*, *C. modoc*; *Cardicondyla nuda*, *Chalibion* sp., *Crematogaster* spp., *Dasymutilla occidentalis*, *Diprion* spp., *Dolichovespula maculata*, *Dorymyrmex* spp., *Dryocosmus kuriphilus*, *Formica* spp., *Hoplocampa* spp. tal como *H. minuta*, *H. testudinea*; *Iridomyrmex humilis*, *Lasius* spp. tal como *L. niger*, *Linepithema humile*, *Liometopum* spp., *Leptocybe invasa*, *Monomorium* spp. tal como *M. pharaonis*, *Monomorium*, *Nylandria fulva*, *Pachycondyla chinensis*, *Paratrechina longicornis*, *Paravespula* spp., tal como *P. germanica*, *P. pennsylvanica*, *P. vulgaris*; *Pheidole* spp. tal como *P. megacephala*; *Pogonomyrmex* spp. tal como *P. barbatus*, *P. californicus*, *Polistes rubiginosa*, *Prenolepis imparis*, *Pseudomyrmex gracilis*, *Schelipron* spp., *Sirex cyaneus*, *Solenopsis* spp. tal como *S. geminata*, *S. invicta*, *S. molesta*, *S. richteri*, *S. xyloni*, *Sphecius speciosus*, *Sphex* spp., *Tapinoma* spp. tal como *T. melanocephalum*, *T. sessile*; *Tetramorium* spp. tal como *T. caespitum*, *T. bicarinatum*, *Vespa* spp. tal como *V. crabro*; *Vespula* spp. tal como *V. squamosa*; *Wasmannia auropunctata*, *Xylocopa* sp;
- Insectos del orden **Orthoptera** por ejemplo *Acheta domesticus*, *Calliptamus italicus*, *Chortoicetes terminifera*, *Ceuthophilus* spp., *Diastramma asynamora*, *Doclostaurus maroccanus*, *Gryllotalpa* spp. tal como *G. africana*, *G. gryllotalpa*; *Gryllus* spp., *Hieroglyphus daganensis*, *Kraussaria angulifera*, *Locusta* spp. tal como *L. migratoria*, *L. pardalina*; *Melanoplus* spp. tal como *M. bivittatus*, *M. femurrubrum*, *M. mexicanus*, *M. sanguinipes*, *M. spretus*; *Nomadacris septemfasciata*, *Oedaleus senegalensis*, *Scapteriscus* spp., *Schistocerca* spp. tal como *S. americana*, *S. gregaria*, *Stemopelmatus* spp., *Tachycines asynamorus*, y *Zonozerus variegatus*;
- Plagas de la clase **Arachnida**, por ejemplo, **Acari**, por ejemplo, de las familias Argasidae, Ixodidae y Sarcoptidae, tales como *Amblyomma* spp. (por ejemplo, *A. americanum*, *A. variegatum*, *A. maculatum*), *Argas* spp., tal como *A. persicu*), *Boophilus* spp., tales como *B. annulatus*, *B. decoloratus*, *B. microplus*, *Dermacentor* spp., tales como *D. silvarum*, *D. andersoni*, *D. variabilis*, *Hyalomma* spp., tales como *H. truncatum*, *Ixodes* spp., tales como *I. ricinus*, *I. rubicundus*, *I. scapularis*, *I. holocyclus*, *I. pacificus*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Ornithodoros* spp., tales como *O. moubata*, *O. hermsi*, *O. turicata*, *Ornithonyssus bacoti*, *Otobius megnini*, *Dermanyssus gallinae*, *Psoroptes* spp., tales como *P. ovis*, *Rhipicephalus* spp., tales como *R. sanguineus*, *R. appendiculatus*, *Rhipicephalus evertsi*, *Rhizoglyphus* spp., *Sarcoptes* spp., tal como *S. Scabiei*; y Familia **Eriophyidae** incluyendo *Aceria* spp., tales como *A. sheldoni*, *A. anthocoptes*, *Acallitus* spp., *Aculops* spp., tales como *A. lycopersici*, *A. pelekassi*; *Aculus* spp., tales como *A. schlechtendali*; *Colomerus vitis*, *Epitrimerus pyri*, *Phyllocoptura oleivora*, *Eriophyes ribis* y *Eriophyes* spp., tal como *Eriophyes sheldoni*; Familia **Tarsonemidae** incluyendo *Hemitarsonemus* spp., *Phytonemus pallidus* y *Polyphagotarsonemus latus*, *Stenotarsonemus* spp. *Steneotarsonemus pinki*; Familia **Tenuipalpidae**, incluyendo *Brevipalpus* spp., tal como *B. phoenicis*; Familia **Tetranychidae**, incluyendo *Eotetranychus* spp., *Eutetranychus* spp., *Oligonychus* spp., *Petrobia latens*, *Tetranychus* spp., tales como *T. cinnabarinus*, *T. evansi*, *T. kanzawai*, *T. pacificus*, *T. phaseolus*, *T. telarius* y *T. urticae*; *Bryobia praetiosa*; *Panonychus* spp., tales como *P. ulmi*, *P. citri*; *Metatetranychus* spp. y *Oligonychus* spp., tal como *O. pratensis*, *O. perseae*, *Vasates lycopersici*; *Raoiella indica*, Familia **Carpoglyphidae**, incluyendo *Carpoglyphus* spp.; *Penthaleidae* spp., tal como *Halotydeus destructor*, Familia **Demodicidae** con especies tales como *Demodex* spp.; Familia **Trombicida**, incluyendo *Trombicula* spp.; Familia **Macronyssidae**, incluyendo *Ornithonyssus* spp.; Familia **Pyemotidae**, incluyendo *Pyemotes tritici*; *Tyrophagus putrescentiae*; Familia **Acaridae**, incluyendo *Acarus sired*, Familia **Araneida**, incluyendo *Latrodectus mactans*, *Tegenaria agrestis*, *Chiracanthium* sp, *Lycosa* sp *Achaearanea tepidariorum* y *Loxosceles reclusa*;
- Plagas del filo **Nematoda**, por ejemplo, nematodos parásitos de las plantas, tales como nematodos del nudo radicular,

Meloidogyne spp., tales como *M. hapla*, *M. incognita*, *M. javanica*; nematodos formadores de quistes, *Globodera* spp., tales como *G. rostochiensis*; *Heterodera* spp., tales como *H. avenae*, *H. glyci-nes*, *H. schachtii*, *H. trifolii*; nematodos de la agalla de la semilla, *Anguina* spp.; nematodos foliares y del tallo, *Aphelenchoides* spp., tal como *A. besseyi*; nematodos picadores, *Belonolaimus* spp., tal como *B. longicaudatus*; nematodos del pino, *Bursaphelenchus* spp., tales como *B. lignicolus*, *B. xylophilus*; nematodos anulares, *Criconema* spp., *Criconemella* spp., tal como *C. xenoplax* and *C. ornata*; and, *Criconemoides* spp., tales como *Criconemoides informis*; *Mesocriconema* spp.; nematodos del tallo y del bulbo, *Ditylenchus* spp., tales como *D. destructor*, *D. dipsaci*; nematodos de la alca, *Dolichodorus* spp.; nematodos en espiral, *Heliocotylenchus multinctus*; nematodos de la vaina y los vainaides, *Hemicycliophora* spp. y *Hemicriconemoides* spp.; *Hirshmanniella* spp.; nematodos lanceolados, *Hoploaimus* spp.; nematodos falsos del nudo de la raíz, *Nacobbus* spp.; nematodos de aguja, *Longidorus* spp., tal como *L. elongatus*; nematodos lesionadores, *Pratylenchus* spp., tales como *P. brachyurus*, *P. neglectus*, *P. penetrans*, *P. curvatus*, *P. goodeyi*; nematodos excavadores, *Radopholus* spp., tales como *R. similis*; *Rhadopholus* spp.; *Rhodopholus* spp.; nematodos reniformes, *Rotylenchus* spp., tales como *R. robustus*, *R. reniformis*; *Scutellonema* spp.; nematodo de la raíz tuberosa, *Trichodorus* spp., tales como *T. obtusus*, *T. primitivus*; *Paratrichodorus* spp., tal como *P. minor*; nematodos atrofiadores, *Tylenchorhynchus* spp., tales como *T. claytoni*, *T. dubius*; nematodos de los cítricos, *Tylenchulus* spp., tal como *T. semipenetrans*; nematodos daga, *Xiphinema* spp.; y otras especies de nematodos parásitos de plantas;

Insectos del orden **Blattodea** por ejemplo *Macrotermes* spp. tal como *M. natalensis*; *Cornitermes cumulans*, *Procornitermes* spp., *Globitermes sulfureus*, *Neocapritermes* spp. tal como *N. opacus*, *N. parvus*; *Odontotermes* spp., *Nasutitermes* spp. tal como *N. corniger*, *Coptotermes* spp. tal como *C. formosanus*, *C. gestroi*, *C. acinaciformis*; *Reticulitermes* spp. tal como *R. hesperus*, *R. tibialis*, *R. speratus*, *R. flavipes*, *R. grassei*, *R. lucifugus*, *R. virginicus*; *Heterotermes* spp. tal como *H. aureus*, *H. longiceps*, *H. tenuis*; *Cryptotermes* spp. tal como *C. brevis*, *C. cavifrons*; *Incisitermes* spp. tal como *I. minor*, *I. snyderi*; *Marginitermes hubbardi*, *Kaloterms flavicollis*, *Neotermes* spp. tal como *N. castaneus*, *Zootermopsis* spp. tal como *Z. angusticollis*, *Z. nevadensis*, *Mastotermes* spp. tal como *M. darwiniensis*; *Blatta* spp. tal como *B. orientalis*, *B. lateralis*; *Blattella* spp. tal como *B. asahinae*, *B. germanica*; *Rhyparobia maderae*, *Panchlora nivea*, *Periplaneta* spp. tal como *P. americana*, *P. australasiae*, *P. brunnea*, *P. fuliginosa*, *P. japonica*; *Supella longipalpa*, *Parcoblatta pennsylvanica*, *Eurycotis floridana*, *Pycnoscelus surinamensis*,

Insectos del orden **Siphonoptera**, por ejemplo, *Cediopsylla simplex*, *Ceratophyllus* spp., *Ctenocephalides* spp. tal como *C. elis*, *C. canis*, *Xenopsylla cheopis*, *Pulex irritans*, *Trichodectes canis*, *Tunga penetrans*, y *Nosopsyllus fasciatus*,

Insectos del orden **Thysanura**, por ejemplo, *Lepisma saccharina*, *Ctenolepisma urbana* y *Thermobia domestica*,

Plagas de la clase **Chilopoda**, por ejemplo, *Geophilus* spp., *Scutigera* spp. tal como *Scutigera coleoptrata*;

Plagas de la clase **Diplopoda**, por ejemplo, *Blaniulus guttulatus*, *Julus* spp., *Narceus* spp.,

Plagas de la clase **Symphyla**, por ejemplo, *Scutigera* spp. tal como *Scutigera immaculata*,

Insectos del orden **Dermaptera**, por ejemplo, *Forficula auricularia*,

Insectos del orden **Collembola**, por ejemplo, *Onychiurus* spp., tal como *Onychiurus armatus*,

Plagas del orden **Isopoda**, por ejemplo, *Armadillidium vulgare*, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*,

Insectos del orden **Phthiraptera**, por ejemplo, *Damalinia* spp., *Pediculus* spp. tal como *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pediculus humanus humanus*; *Pthirus pubis*, *Haematopinus* spp. tal como *Haematopinus eurysternus*, *Haematopinus suis*; *Linognathus* spp. tal como *Linognathus vituli*; *Bovicola bovis*, *Menopon gallinae*, *Menacanthus stramineus* y *Solenopotes capillatus*, *Trichodectes* spp.,

Ejemplos de otras especies de plagas que pueden ser controladas por compuestos de fórmula (I) incluyen: del Phylum **Mollusca**, clase **Bivalvia**, por ejemplo, *Dreissena* spp.; clase **Gastropoda**, por ejemplo, *Arion* spp., *Biomphalaria* spp., *Bulinus* spp., *Deroceras* spp., *Galba* spp., *Lymnaea* spp., *Oncomelania* spp., *Pomacea canaliculata*, *Succinea* spp.; de la clase de los **helminths**, por ejemplo, *Ancylostoma duodenale*, *Ancylostoma ceylanicum*, *Ancylostoma braziliense*, *Ancylostoma* spp., *Ascaris lubricoides*, *Ascaris* spp., *Brugia malayi*, *Brugia timori*, *Bunostomum* spp., *Chabertia* spp., *Clonorchis* spp., *Cooperia* spp., *Dicrocoelium* spp., *Dictyocaulus filaria*, *Diphyllobothrium latum*, *Dracunculus medinensis*, *Echinococcus granulosus*, *Echinococcus multilocularis*, *Enterobius vermicularis*, *Faciola* spp., *Haemonchus* spp. tal como *Haemonchus contortus*; *Heterakis* spp., *Hymenolepis nana*, *Hyostrogylus* spp., *Loa Loa*, *Nematodirus* spp., *Oesophagostomum* spp., *Opisthorchis* spp., *Onchocerca volvulus*, *Ostertagia* spp., *Paragonimus* spp., *Schistosomen* spp., *Strongyloides fuelleborni*, *Strongyloides stercoralis*, *Strongyloides* spp., *Taenia saginata*, *Taenia solium*, *Trichinella spiralis*, *Trichinella nativa*, *Trichinella britovi*, *Trichinella nelsoni*, *Trichinella pseudopsiralis*, *Trichostrongylus* spp., *Trichuris trichuria*, *Wuchereria bancrofti*.

Salud animal

Los compuestos I son adecuados para su uso en el tratamiento o protección de animales contra la infestación o infección por parásitos. Por lo tanto, la invención también se refiere al uso de un compuesto de la invención para la fabricación de un medicamento para el tratamiento o la protección de los animales contra la infestación o infección por parásitos. Además, la invención se refiere a un método de tratamiento o protección de los animales contra la infestación e infección por parásitos, que comprende la administración oral, tópica o parenteral, o la aplicación a los animales de una cantidad parasiticida eficaz de un compuesto I.

La invención también se refiere al uso no terapéutico de los compuestos de la invención para tratar o proteger a los animales contra la infestación e infección por parásitos. Además, la invención se refiere a un método no terapéutico para tratar o proteger a los animales contra la infestación e infección por parásitos, que comprende la aplicación a un locus de una cantidad parasiticida eficaz de un compuesto I.

Los compuestos de la invención son adecuados para combatir o controlar parásitos en y sobre animales. Además, la invención se refiere a un método para combatir o controlar parásitos en y sobre animales, que comprende poner en contacto los parásitos con un cantidad parasiticida eficaz de un compuesto I.

5 La invención también se refiere al uso no terapéutico de compuestos I para controlar o combatir parásitos. Además, la invención se refiere a un método no terapéutico para combatir o controlar parásitos, que comprende aplicar a un locus una cantidad parasiticida eficaz de un compuesto I.

10 Los compuestos I pueden ser eficaces mediante el contacto (a través del suelo, vidrio, pared, red para cama, alfombra, mantas o partes de animales) y la ingestión (por ejemplo, cebos). Además, los compuestos I se pueden aplicar en todas y cada una de las etapas de desarrollo.

Los compuestos I pueden aplicarse como tales o en forma de composiciones que los comprenden.

15 El término "locus" significa el hábitat, suministro de alimentos, zona de reproducción, área, material o entorno en el que un parásito está creciendo o puede crecer fuera del animal.

20 Como se utiliza en la presente, el término "parásitos" incluye endo- y ectoparásitos. En algunas realizaciones de la invención, los endoparásitos pueden ser preferidos. En otras realizaciones, los ectoparásitos pueden ser preferidos. Las infestaciones en animales de sangre caliente y peces incluyen piojos, piojos mordedores, garrapatas, gusanos de la nariz, garrapatas de la oveja, moscas mordedoras, moscas muscoides, moscas, larvas de moscas miasíáticas, niguas, jejenes, mosquitos y pulgas.

25 Los compuestos de la invención son especialmente útiles para combatir los siguientes parásitos: *Cimex lectularius*, *Rhipicephalus sanguineus*, y *Ctenocephalides felis*.

30 Como se usa en la presente, el término "animal" incluye a los animales de sangre caliente (incluyendo a los seres humanos) y a los peces. Los más preferidos son los mamíferos, tales como ganado vacuno, ovino, porcino, camellos, ciervos, caballos, cerdos, aves de corral, conejos, cabras, perros y gatos, búfalos de agua, burros, gamos y renos, y también en animales de peletería, tales como visón, chinchilla y mapache, aves, tales como gallinas, gansos, pavos y patos, y peces, tales como peces de agua dulce y salada, tales como truchas, carpas y anguilas. Particularmente preferidos son los animales domésticos, tales como los perros o gatos.

35 Los compuestos I pueden aplicarse en cantidades totales de 0,5 mg/kg a 100 mg/kg al día, preferiblemente de 1 mg/kg a 50 mg/kg al día.

40 Para la administración oral a animales de sangre caliente, los compuestos I pueden formularse como piensos para animales, premezclas para piensos, concentrados para piensos, píldoras, disoluciones, pastas, suspensiones, disoluciones orales, geles, comprimidos, bolos y cápsulas. Para la administración oral, la forma de dosificación elegida debe proporcionar al animal de 0,01 mg/kg a 100 mg/kg de peso corporal animal por día de los compuestos I, preferiblemente de 0,5 mg/kg a 100 mg/kg de peso corporal animal por día.

45 Alternativamente, los compuestos I pueden administrarse a los animales por vía parenteral, por ejemplo, mediante inyección intraruminal, intramuscular, intravenosa o subcutánea. Los compuestos I pueden dispersarse o disolverse en un portador fisiológicamente aceptable para inyección subcutánea. Alternativamente, los compuestos I pueden ser formulados en un implante para la administración subcutánea. Alternativamente, los compuestos I pueden administrarse transdérmicamente a los animales. Para la administración parenteral, la forma de dosificación elegida debe proporcionar al animal de 0,01 mg/kg a 100 mg/kg de peso corporal animal por día de los compuestos I.

50 Los compuestos I también se pueden aplicar tópicamente a los animales en forma de baños, polvillos, polvos, collares, medallones, pulverizaciones, champús, formulaciones de unción puntual y unción continua, y en ungüentos o emulsiones de aceite en agua o agua en aceite. Para la aplicación tópica, las inmersiones y los aerosoles suelen contener de 0,5 ppm a 5.000 ppm y preferiblemente de 1 ppm a 3.000 ppm de los compuestos I. Además, los compuestos I pueden formularse como etiquetas auriculares para animales, en particular cuadrúpedos, por ejemplo, bovinos y ovinos.

55 Las disoluciones orales se administran directamente.

Las disoluciones que se aplican sobre la piel se gotean, se esparcen, se frotran, se rocían o se pulverizan. Los geles se aplican o se esparcen sobre la piel, o se introducen en las cavidades del cuerpo.

60 Las formulaciones de unción continua se vierten o se rocían sobre áreas limitadas de la piel, el compuesto activo penetra en la piel y actúa sistémicamente. Las formulaciones de unción continua se preparan disolviendo, suspendiendo o emulsionando el compuesto activo en disolventes o mezclas de disolvente adecuados compatibles con la piel.

65 Las emulsiones se pueden administrar por vía oral, dérmica o como inyecciones.

Las suspensiones se pueden administrar por vía oral o tópica/dérmica.

Las preparaciones semisólidas se pueden administrar por vía oral o tópica/dérmica.

- 5 Para la producción de preparaciones sólidas, el compuesto activo se mezcla con excipientes adecuados, en su caso con la adición de auxiliares, y se lleva a la forma deseada.

Las composiciones que se pueden utilizar en la invención pueden abarcar generalmente entre 0,001 y 95 % del compuesto I.

10

Las preparaciones listas para usar contienen los compuestos que actúan contra los parásitos, preferiblemente ectoparásitos, en concentraciones de 10 ppm a 80 % en peso, preferiblemente de 0,1 a 65 % en peso, más preferiblemente de 1 a 50 % en peso, más preferiblemente de 5 a 40 % en peso.

15

Las preparaciones que se diluyen antes de su uso contienen los compuestos que actúan contra los ectoparásitos en concentraciones de 0,5 a 90 % en peso, preferiblemente de 1 a 50 % en peso.

20

Además, las preparaciones comprenden los compuestos de fórmula I contra los endoparásitos en concentraciones de 10 ppm a 2 % en peso, preferiblemente de 0,05 a 0,9 % en peso, de manera muy particularmente preferible de 0,005 a 0,25 % en peso.

25

Las formulaciones sólidas que liberan compuestos de la invención pueden aplicarse en cantidades totales de 10 mg/kg a 300 mg/kg, preferiblemente de 20 mg/kg a 200 mg/kg, lo más preferiblemente de 25 mg/kg a 160 mg/kg de peso corporal del animal tratado en el transcurso de tres semanas.

25

Los siguientes ejemplos ilustran la invención.

A. Preparación de compuestos

30

Materiales: A menos que se indique lo contrario, los reactivos y disolventes se compraron con la más alta calidad comercial y se utilizaron sin purificación adicional.

35

Todas las reacciones se monitorearon mediante cromatografía de capa fina (TLC) utilizando placas precubiertas de gel de sílice 60 F₂₅₄ de Merck (0,25 mm). La cromatografía relámpago se llevó a cabo con gel de sílice de Kanto Chemical (Kanto Chemical, gel de sílice 60N, neutro esférico, 0,040-0,050 mm, No. de categoría: 37563-84). Se registraron espectros de ¹H NMR en JEOL JNM-ECA-500 (500 MHz). Los desplazamientos químicos se expresan en ppm de campo descendente desde los picos internos de disolvente para acetona-d₆ (¹H; δ = 2,05 ppm) Y CD₃OD (¹H; δ = 3,30 ppm), y los valores *J* se indican en Hertz. Se utilizaron las siguientes abreviaturas para explicar las multiplicidades: s = singlete, d = doblete, t = triplete, q = cuarteto, dd = doble doblete, ddd = doblete de dobletes de dobletes, dt = doble triplete, td = triplete de dobletes, m = multiplete, br = amplio, J = constante de acoplamiento. Los espectros de masas de alta resolución se midieron en un instrumento JMS-T100 de JEOL. Caracterización: Los compuestos se caracterizaron mediante cromatografía líquida de alta resolución acoplada con espectrometría de masas (HPLC/MS). Método A: UHPLC-MS en Shimadzu Nexera UHPLC y Shimadzu LCMS 20-20 ESI. Columna de UHPLC analítica: Phenomenex Kinetex 1,7 μm XB-C18 100A; 50 x 2,1 mm; fase móvil: A: Agua + TFA al 0,1 %; B: Acetonitrilo; gradiente: 5-100 % B en 1,50 minutos; 100 % B 0,20 min; flujo: 0,8 ml/min en 1,50 minutos a 60 °C. Método MS: ESI positivo; rango de masa (*m/z*) 100-700.

40

45

Ejemplo de síntesis A: 2-[3-etilsulfonil-6-(trifluorometil)imidazo[1,2-*a*]piridin-2-il]-6-metil-7-(trifluorometil)imidazo[1,2-*c*]pirimidin-5-ona (compuesto 1,1)

50

Paso 1) Fabricación de 2-bromo-1-[3-etilsulfanil-6-(trifluorometil)imidazo[1,2-*a*]piridin-2-il]etanona

55

Una disolución de 185 mg de 1-[3-etilsulfanil-6-(trifluorometil)imidazo[1,2-*a*]piridin-2-il]etanona (tal como se divulga y sintetiza en el documento EP3257853A1, tabla 30, i-6-004) se disolvió en 3 ml de HBr al 25 % en CH₃COOH, y se añadió una disolución de 123 mg de Br₂ en 3 ml de CH₃COOH a temperatura ambiente y se agitó durante 4 horas. Se añadió agua y la mezcla se extrajo dos veces con metil terc-butil éter. Las capas orgánicas combinadas se secaron y concentraron a presión reducida para proporcionar un residuo. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna en condiciones de fase inversa para obtener 130 mg de 2-bromo-1-[3-etilsulfanil-6-(trifluorometil)imidazo[1,2-*a*]piridin-2-il]etanona, LC-MS: masa encontrada 366,8; t_R = 1,215 min (t_R: tiempo de retención).

60

Paso 2) Fabricación de 2-[3-etilsulfonil-6-(trifluorometil)imidazo[1,2-*a*]piridin-2-il]-6-metil-7-(trifluorometil)imidazo[1,2-*c*]pirimidin-5-ona

65

Paso 2a: Una mezcla de 122 mg de 2-bromo-1-[3-etilsulfanil-6-(trifluorometil)imidazo[1,2-*a*]piridin-2-il]etanona y 4-amino-1-metil-6-(trifluorometil)pirimidin-2-ona (77 mg) se disolvió en 3 ml de 1,4-dioxano y se calentó a 140 °C durante 4 horas en un reactor de microondas. A continuación, la reacción se enfrió a 20 a 25 °C y se concentró al vacío para obtener un residuo. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna en condiciones de fase inversa para obtener 51 mg de

2-[3-etilsulfanil-6-(trifluorometil)imidazo[1,2-a]piridin-2-il]-6-metil-7-(trifluorometil)imidazo[1,2-c]pirimidin-5-ona. LC-MS: masa encontrada para $C_{18}H_{13}N_5O_6F_6S$ $[M+H]^+ = 461,9$; $t_R = 1,186$ min (t_R : tiempo de retención).

5 Paso 2b: A una disolución de 2-[3-etilsulfanil-6-(trifluorometil)imidazo[1,2-a]piridin-2-il]-6-metil-7-(trifluorometil)imidazo[1,2-c]pirimidin-5-ona (51 mg) en CH_2Cl_2 (5 mL) a $5^\circ C$ se añadió ácido metacloroperoxibenzoico (63 mg), se dejó calentar la mezcla de reacción hasta $20-25^\circ C$ y se agitó durante 16 horas. A continuación, la mezcla de reacción se vertió en agua y se extrajo con CH_2Cl_2 . Las capas orgánicas combinadas se secaron y concentraron a presión reducida para proporcionar un residuo. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna en condiciones de fase inversa eluyendo con agua/acetonitrilo para obtener el compuesto I.1 (20,4 mg, 37 % de rendimiento). LC-MS: masa encontrada para $C_{18}H_{13}N_5O_3F_6S$ $[M+H]^+ 493,9$; $t_R = 1,165$ min (t_R : tiempo de retención).

Ejemplo de síntesis B: 6-ciclopropil-2-[3-(etanosulfonil)imidazo[1,2-a]piridin-2-il]-7-(trifluorometil)imidazo[1,2-c]pirimidin-5-ona (compuesto 1,2)

15 Paso 1) Fabricación de imidazo[1,2-a]piridin-2-carboxilato de etilo

A una composición agitada que comprendía 2-aminopiridina (10 g) y CH_3CH_2OH (100 mL) se añadió bromopiruvato de etilo (24,86 g) gota a gota durante un periodo de tiempo de 10 min a 20 a $25^\circ C$. La mezcla de reacción resultante se calentó a temperatura de ebullición bajo reflujo durante 5 horas. A continuación, el disolvente se evaporó bajo presión reducida. El tratamiento del residuo mediante extracción y cromatografía en columna proporcionó imidazo[1,2-a]piridin-2-carboxilato de etilo (10 g, 60 % de rendimiento).

25 1H -RMN (500 MHz, Cloroformo-d) δ 8,17 (dt, $J = 7,0, 1,2$ Hz, 1H), 7,71 (dt, $J = 9,3, 1,1$ Hz, 1H), 7,70 (s, 1H), 7,34 (ddd, $J = 9,2, 6,7, 1,3$ Hz, 1H), 7,04 (td, $J = 6,9, 1,1$ Hz, 1H), 4,52 (q, $J = 7,1$ Hz, 2H), 1,48 (t, $J = 7,1$ Hz, 3H). LC-MS: Masa encontrada ($M+1$) = 190,1.

Paso-2: Fabricación de 3-cloroimidazo[1,2-a]piridin-2-carboxilato de etilo

30 El imidazo[1,2-a]piridin-2-carboxilato de etilo (1 g) del paso-1 se disolvió en DMF (10 mL), después se añadió N-clorosuccinimida (0,913 g) a $20-25^\circ C$ bajo atmósfera de nitrógeno. La mezcla de reacción se calentó a $40^\circ C$ durante 4 horas. La mezcla de reacción se inactivó con agua y se trabajó por extracción para obtener un aceite de color marrón de 3-cloroimidazo[1,2-a]piridin-2-carboxilato de etilo (1,0 g, 80 % de rendimiento). 1H -RMN (500 MHz, Cloroformo-d) δ 8,22 - 8,10 (m, 1H), 7,72 (d, $J = 9,0$ Hz, 1H), 7,35 (ddd, $J = 9,4, 6,8, 1,4$ Hz, 1H), 7,09 - 6,98 (m, 1H), 4,58 - 4,44 (m, 2H), 1,55 - 1,42 (m, 3H). LC-MS: Masa encontrada ($M+1$) = 224,1.

35 Paso-3: Fabricación de 3-etilsulfanilimidazo[1,2-a]piridin-2-carboxilato de etilo

40 A una composición agitada que comprendía 3-cloroimidazo[1,2-a]piridin-2-carboxilato de etilo (4 g) del paso-2 en DMF (40 mL) se añadió etanotiolato sódico (2,24 g) a 20 a $25^\circ C$. La mezcla de reacción resultante se agitó la mezcla de reacción a 20 a $25^\circ C$ durante 2 horas. A continuación, la mezcla de reacción se inactivó con agua y se procesó mediante extracción para obtener 3-etilsulfanilimidazo[1,2-a]piridin-2-carboxilato de etilo (3 g, 70 % de rendimiento). 1H -RMN (500 MHz, Cloroformo-d) δ 8,49 (dt, $J = 7,0, 1,2$ Hz, 1H), 7,64 (dt, $J = 9,0, 1,1$ Hz, 1H), 7,30 - 7,20 (m, 1H), 6,92 (td, $J = 6,8, 1,2$ Hz, 1H), 4,43 (d, $J = 7,1$ Hz, 2H), 2,86 (d, $J = 7,3$ Hz, 2H), 1,40 (t, $J = 7,1$ Hz, 3H), 1,11 (t, $J = 7,4$ Hz, 3H). LC-MS: Masa encontrada ($M+1$) = 250,1.

45 Paso-4: Fabricación de 3-etilsulfonilimidazo[1,2-a]piridin-2-carboxilato de etilo

50 A una composición agitada que comprendía 3-etilsulfanilimidazo[1,2-a]piridin-2-carboxilato de etilo (13 g) del paso 3 se añadió ácido meta-cloroperoxibenzoico (3 equivalentes) a $0^\circ C$. A continuación, se dejó que la mezcla de reacción se calentara hasta $20-25^\circ C$ y se agitó durante 16 horas. A continuación, la reacción se inactivó con agua, sobre la que se añadió una disolución de bisulfato de sodio. El procesamiento mediante extracción proporcionó 3-etilsulfonilimidazo[1,2-a]piridin-2-carboxilato de etilo como sólido de color amarillo (14 g, 90 % de rendimiento).

55 1H -RMN (500 MHz, Cloroformo-d) δ 9,27 (dt, $J = 7,2, 1,2$ Hz, 1H), 7,85 (dt, $J = 9,0, 1,2$ Hz, 1H), 7,53 (ddd, $J = 9,1, 6,8, 1,2$ Hz, 1H), 7,13 (td, $J = 7,0, 1,3$ Hz, 1H), 4,54 (q, $J = 7,1$ Hz, 2H), 3,74 (q, $J = 7,4$ Hz, 2H), 1,49 (t, $J = 7,1$ Hz, 3H), 1,38 (t, $J = 7,4$ Hz, 3H). LC-MS: Masa encontrada ($M+1$) = 282,1.

Paso-5: Fabricación de ácido 3-etilsulfonilimidazo[1,2-a]piridin-2-carboxílico

60 A una composición agitada que comprendía 3-etilsulfanilimidazo[1,2-a]piridin-2-carboxilato de etilo (1 g) del paso 4 en CH_3CH_2OH (10 mL) se añadió $LiOH \cdot H_2O$ (0,250 g) a $20-25^\circ C$. La mezcla de reacción se agitó durante 2 horas, tras lo cual se eliminó el disolvente mediante evaporación. El residuo se diluyó con una solución acuosa de HCl (1 M) para ajustar el pH a aproximadamente 2. La composición resultante se procesó mediante extracción para obtener el ácido 3-etilsulfonilimidazo[1,2-a]piridin-2-carboxílico (0,7 g, 80 % de rendimiento).

65 1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,79 (d, $J = 6,9$ Hz, 1H), 7,80 (d, $J = 9,0$ Hz, 1H), 7,70 (t, $J = 7,9$ Hz, 1H), 7,33 (t, $J = 6,8$

Hz, 1H), 2,93 (t, $J = 7,3$ Hz, 2H), 1,09 (t, $J = 7,3$ Hz, 3H). LC-MS: Masa encontrada (M-1) =253,1.

Paso-6: Fabricación de 3-etilsulfonil-N-metoxi-N-metil-imidazo[1,2-a]piridin-2-carboxamida

5 A una composición agitada que comprendía ácido 3-etilsulfonilimidazo[1,2-a] piridin-2-carboxílico (0,1 g) en DCM seco (10 mL) se añadieron N,O-dimetilhidroxilamina (0,042 g) y diisopropiltilamina (0,203 g) a 0 °C bajo atmósfera de nitrógeno. La mezcla de reacción resultante se agitó a 0 °C durante 10 min. Después se añadió anhídrido de ácido propanofosfónico (0,375 g) y se dejó que la mezcla de reacción se calentara hasta 20-25 °C tras lo cual se agitó durante toda la noche. A continuación, la mezcla de reacción se inactivó con agua y se elaboró mediante extracción para obtener 3-etilsulfonil-N-metoxi-N-metil-imidazo[1,2-a]piridina-2-carboxamida (0,08 g, 70 % de rendimiento).

15 $^1\text{H-RMN}$ (500 MHz, Cloroformo- d) δ 8,89 (d, $J = 7,0$ Hz, 1H), 7,70 (dt, $J = 9,1, 1,2$ Hz, 1H), 7,44 (t, $J = 7,9$ Hz, 1H), 7,03 (t, $J = 6,9$ Hz, 1H), 3,62 (s, 3H), 3,40 (t, $J = 7,5$ Hz, 2H), 3,36 (s, 3H), 1,28 (t, $J = 7,4$ Hz, 3H). LC-MS: Masa encontrada (M-1) =297,1.

Paso-7: Fabricación de 1-(3-etilsulfonilimidazo[1,2-a] piridin-2-il)etanona

20 A una composición agitada que comprendía 3-etilsulfonil-N-metoxi-N-metil-imidazo[1,2-a]piridin-2-carboxamida (1 g) del paso 6 en THF (15 mL) se añadió una disolución de CH_3MgBr en éter dietílico (3 M, 0,006 mol) a 0 °C bajo atmósfera de nitrógeno. La mezcla de reacción resultante se agitó a 0 °C durante 30 min. El trabajo de la mezcla de reacción proporcionó 1-(3-etilsulfonilimidazo[1,2-a] piridin-2-il)etanona como sólido blanco. (0,84 g, rendimiento: 75%). $^1\text{H-RMN}$ (500 MHz, Cloroformo- d) δ 9,23 (dt, $J = 7,2, 1,2$ Hz, 1H), 7,72 (dt, $J = 9,1, 1,2$ Hz, 1H), 7,44 (ddd, $J = 9,1, 6,8, 1,2$ Hz, 1H), 7,03 (td, $J = 7,0, 1,3$ Hz, 1H), 3,69 (q, $J = 7,5$ Hz, 2H), 2,71 (s, 3H), 1,27 (t, $J = 7,4$ Hz, 3H). LC-MS: Masa encontrada (M+1) = 252,1.

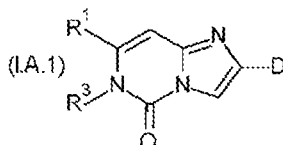
25 Paso-8: Fabricación de 2-bromo-1-(3-etilsulfonilimidazor1,2-alpiridin-2-il)etanona

30 A una composición agitada que comprendía 1-(3-etilsulfonilimidazo[1,2-a]piridin-2-il)etanona (1 g) en CH_3COOH glacial (10 mL) a 0 °C se añadió 33 % en peso de HBr en disolución de ácido acético (10 mL), que posteriormente se agitó a 0 °C durante 10 min. A continuación, se añadió gota a gota Br_2 (0,04 mol) en CH_2Cl_2 (10 mL) a la mezcla de reacción durante 5 min. A continuación, la mezcla de reacción se calentó a 50 °C de temperatura exterior durante 2 horas. A continuación, se dejó enfriar la mezcla de reacción de 20 a 25 °C y se vertió lentamente en hielo, cuya composición se diluyó con acetato de etilo (30 mL). El procesamiento de la composición mediante extracción y purificación por cromatografía en columna proporcionó 2-bromo-1-(3-etilsulfonilimidazo[1,2-a] piridin-2-il)etanona (1,0 g, 76 % de rendimiento). $^1\text{H RMN}$ (500 MHz, Cloroformo- d) δ 9,32 (dd, $J = 7,1, 1,1$ Hz, 1H), 7,82 (d, $J = 9,2$ Hz, 1H), 7,56 (ddd, $J = 8,9, 6,8, 1,2$ Hz, 1H), 7,16 (td, $J = 7,0, 1,4$ Hz, 1H), 4,82 (s, 2H), 3,76 (q, $J = 7,4$ Hz, 2H), 1,37 (s, 3H). LC-MS: Masa encontrada (M+1) = 331,12.

40 Paso-9: Fabricación de 6-ciclopropil-2-[3-(etanosulfonil)imidazo[1,2-a]piridin-2-il]-7-(trifluorometil)imidazo[1,2-c]pirimidin-5-ona

45 A un compuesto agitado que comprendía 2-bromo-1-[3-(etanosulfonil)imidazo[1,2-a]piridin-2-il]etanona (0,113 g) del paso 8 en $(\text{CH}_3)_3\text{COH}$ (2 mL) se añadió 4-amino-1-ciclopropil-6-(trifluorometil)pirimidin-2-ona (0,05 g). Se añadieron tamices moleculares a la mezcla de reacción resultante (0,4 g), que posteriormente se calentó a 120 °C durante 24 horas. A continuación, la mezcla de reacción se filtró a través de un lecho de celita, tras lo cual se recolectó el filtrado y se concentró a presión reducida. El residuo resultante se purificó mediante cromatografía en columna para obtener 6-ciclopropil-2-[3-(etanosulfonil)imidazo[1,2-a]piridin-2-il]-7-(trifluorometil)imidazo[1,2-c]pirimidin-5-ona con un 91,96 % de pureza como sólido amarillo (0,044 g, 45 % de rendimiento). $^1\text{H-RMN}$ (500 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9,14 - 9,02 (m, 1H), 8,31 (s, 1H), 7,86 (dd, $J = 9,0, 1,2$ Hz, 1H), 7,65(ddd, $J = 8,8, 6,8, 1,2$ Hz, 1H), 7,48 (s, 1H), 7,27 (td, $J = 7,0, 1,3$ Hz, 1H), 3,85 (q, $J = 7,4$ Hz, 2H), 3,17 (s, 1H), 1,22 (t, $J = 7,4$ Hz, 3H), 1,12 (ddt, $J = 23,1, 7,0, 2,7$ Hz, 4H). LC-MS: masa calculada 452, LC-MS: Masa encontrada (M+1) 452.

55 En la Tabla B a continuación se enumeran los compuestos de fórmula I.A.1 según el significado de las variables R^1 , R^3 y D,



cuyos compuestos se sintetizaron como se describe en los Ejemplos de Síntesis A, B, o en analogía con los mismos.

60 Tabla B: compuestos I.1 a I.10 con datos de caracterización física. & significa la conexión con el resto de la molécula de la fórmula I.A.1. n.m. significa no medido.

Compuesto	R1	R ³	D	Datos ¹ H-NMR , desplazamiento químico (δ), (500 MHz, DMSO-d ₆)
I.1	CF ₃	CH ₃		n.m., identificado por LC-MS, véase el Ejemplo de síntesis A anterior
I.2	CF ₃	ciclopropilo		δ 9,14 - 9,02 (m, 1H), 8,31 (s, 1H), 7,86 (dd, 1H, J = 9,0, 1,2 Hz), 7,65(ddd, 1H, J = 8,8, 6,8, 1,2 Hz), 7,48 (s, 1H), 1H, 7,27 (td, J = 7,0, 1,3 Hz), 3,85 (q, 2H, J = 7,4 Hz), 3,17 (s, 1H), 1,22 (t, 3H, J = 7,4, Hz), 1,12 (ddt, 4H, J = 23,1, 7,0, 2,7 Hz).
I.3	CF ₃	ciclopropilmetilo		9,10 (d, 1H, J = 5 Hz), 8,40 (s, 1H), 7,87 (d, 1H, J = 5 Hz), 7,66 (dd, 1H, J = 7 Hz), 7,56 (s, 1H), 7,28 (d, 1H, J = 5 Hz), 4,0 (d, 2H, J = 7 Hz), 3,85 (t, 2H, J = 7 Hz), 3,18 (s, 1H), 1,22 (t, 3H, J = 5 Hz), 0,55 (m, 4H)
I.4	CF ₃	CHCCH ₂ -		9,09 (dd, J = 7,0, 1,2 Hz, 1H), 8,43 (s, 1H), 7,87 (dt, J = 9,0, 1,2 Hz, 1H), 7,66 - 7,62 (m, 2H), 7,28 (td, J = 6,9, 1,3 Hz, 1H), 4,83 (d, J = 2,5 Hz, 2H), 3,83 (q, J = 7,4 Hz, 2H), 3,45 (s, 1H), 1,22 (t, J = 7,3 Hz, 3H)
I.5	CF ₃	CF ₃ CH ₂		9,09 (d, J = 7,0 Hz, 1H), 8,45 (s, 1H), 7,87 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,72 (s, 1H), 7,66 (ddd, J = 8,7, 6,9, 1,2 Hz, 1H), 7,28 (td, J = 7,0, 1,2 Hz, 1H), 4,93 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 3,84 (q, J = 7,3 Hz, 2H), 1,23 (t, J = 7,3 Hz, 3H)
I.6	CF ₃	ciclopropilo		δ 9,54 - 9,40 (m, 1H), 8,36 (s, 1H), 8,06 (d, 1H, J = 9,3 Hz), 7,91 (dd, 1H, J = 9,5, 1,9 Hz), 7,50 (s, 1H), 3,98 (q, 2H, J = 7,3 Hz), 3,17 (d, 1H, J = 4,2 Hz), 1,26 (t, 3H, J = 7,4 Hz), 1,20-1,01 (m, 4H)
I.7	CF ₃	CH ₃		9,20 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 8,38 (s, 1H), 7,97 - 7,70 (m, 2H), 7,53 (s, 1H), 3,91 (q, J = 7,3 Hz, 2H), 3,61 (s, 3H), 1,24 (t, J = 7,3 Hz, 3H)
I.8	CF ₃	ciclopropilo		9,19 (d, 1H, J = 5 Hz), 8,32 (s, 1H), 7,8 (d, 2H, J = 5 Hz), 7,47 (s, 1H), 3,90 (t, 2H, J = 7 Hz), 3,18 (s, 1H), 1,22 (t, 3H, J = 5 Hz), 1,13 (m, 4H)
I.9	CF ₃	ciclopropilo		9,24 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 8,32 (s, 1H), 7,93 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 7,86 (dd, J = 9,5, 2,0 Hz, 1H), 7,48 (s, 1H), 3,90 (q, J = 7,3 Hz, 2H), 3,17 (s, 1H), 1,79 (s, 6H), 1,24 (t, J = 7,3 Hz, 3H), 1,17 - 1,04 (m, 4H)
I.10	CF ₃	CH ₃		9,24 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 8,32 (s, 1H), 7,93 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 7,86 (dd, J = 9,5, 2,0 Hz, 1H), 7,48 (s, 1H), 3,90 (q, J = 7,3 Hz, 2H), 3,61 (s, 3H), 1,79 (s, 6H), 1,24 (t, J = 7,3 Hz, 3H)

Ejemplo de síntesis C: 6-ciclopropil-2-(3-etilsulfonylpirazolo[1,5-a]piridin-2-il)-7-(trifluorometil)imidazo[1,2-c]pirimidin-5-ona (compuesto 1,11)

Paso-1: Fabricación de pirazolo[1,5-a]piridina-2,3-dicarboxilato de dimetilo

5 A una composición que comprendía yoduro de piridin-1-ilo-1-amina (5 g) en DMF (50 mL) se añadió K₂CO₃ (6,21 g) en porciones a 0 °C durante un periodo de 10 min. Posteriormente, se añadió bu-2-iodoato de dimetilo (6,39 g) gota a gota durante un periodo de 15 minutos a la misma temperatura. La mezcla de reacción resultante se agitó a 20 a 25 °C durante 12 horas. A continuación, la reacción se inactivó con agua. El procesamiento mediante extracción y purificación por cromatografía en columna dio como resultado pirazolo[1,5-a]piridina-2,3-dicarboxilato de dimetilo (2,3 g, 43,39 % de rendimiento). ¹H-RMN (CDCl₃) 8,52 (d,1H), 8,17-8,19 (d,1H), 7,45-7,49 (dd,1H), 7,04-7,07 (dd,1H), 4,05 (S,3H), 3,95 (S,3H). LC-MS: Masa encontrada (M+1) 235.

10 Paso-2: Fabricación de ácido pirazolo[1,5-a]piridin-2-carboxílico

15 A una composición que comprendía pirazolo[1,5-a]piridin-2,3-dicarboxilato de dimetilo (2,3 g) del paso-1 en agua (6 ml) se añadió H₂SO₄ (3 mL) a 0 °C. La mezcla de reacción resultante se calentó a 110 °C durante 24 horas. Posteriormente, la mezcla de reacción se enfrió entre 20 y 25 °C y se inactivó en una disolución acuosa de NaOH (10 % en peso) para ajustar el pH a 8-9. El procesamiento mediante extracción proporcionó ácido pirazolo[1,5-a]piridin-2-carboxílico (1,5 g, 78,6 % de rendimiento). ¹H-RMN (DMSO-d₆) 13,0 (brod S,1H), 8,73-8,74 (d,1H), 7,77-7,79 (d,1H), 7,29-7,31 (dd,1H), 7,28 (S,1H), 7,03-7,06 (dd,1H). LC-MS: Masa encontrada (M+1)=163

20 Paso-3: Fabricación de pirazolo[1,5-a]piridin-2-carboxilato de metilo

25 A una composición que comprendía ácido pirazolo[1,5-a]piridin-2-carboxílico (9 g) del paso-2 en CH₃OH (150 ml) se añadió H₂SO₄ (10 ml) a 0 °C y la mezcla de reacción resultante se calentó a reflujo a 80 °C durante 12 horas. Posteriormente, la mezcla de reacción se concentró por evaporación del disolvente y la reacción se inactivó en agua fría. El precipitado resultante se filtró y se lavó con agua fría para obtener pirazolo[1,5-a]piridin-2-carboxilato de metilo (8 g, 81,38 % de rendimiento). ¹H-RMN (DMSO-d₆) 8,76 (d,1H), 7,79-7,81 (d,1H), 7,31-7,34 (dd,1H), 7,13 (S,1H), 7,07-7,12 (dd,1H), 3,89 (S, 3H). LC-MS: Masa encontrada (M+1) =177

Paso-4: Fabricación de 3-yodopirazolo[1,5-a]piridin-2-carboxilato de etilo

30 A una composición que comprendía pirazolo[1,5-a]piridin-2-carboxilato de metilo (0,25 g) del paso-3 en CH₃CN (5 ml) se añadió N-Iodosuccinimida (0,447 g) a 20-25 °C. La mezcla de reacción resultante se agitó a 40 °C durante 12 horas. La reacción se inactivó con agua. El procesamiento mediante extracción y purificación por cromatografía en columna proporcionó 3-yodopirazolo[1,5-a]piridin-2-carboxilato de etilo (0,36 g, 84,11 % de rendimiento). ¹H-RMN (CDCl₃) 8,51(d,1H), 7,61-7,63 (d,1H), 7,28-7,31 (dd,1H), 6,97-7,0 (dd,1H), 4,05 (S,3H). LC-MS: Masa encontrada (M+1) = 303.

35 Paso-5: Fabricación de 3-etilsulfanilpirazolo[1,5-a]piridin-2-carboxilato de metilo

40 A una composición que comprendía 3-yodopirazolo[1,5-a]piridin-2-carboxilato de etilo (0,4 g) del paso 4 en dioxano (10 ml) se añadió N,N-diisopropiletilamina (0,523 g) y la mezcla de reacción resultante se desgasificó durante 20 minutos purgando con nitrógeno. A continuación, se añadieron tris(dibencilideneacetona)-dipaladio(0) (0,030 g) y 4,5-Bis(difenilfosfino)-9,9-dimetilxanteno (0,038 g) a la mezcla de reacción, que posteriormente se desgasificó de nuevo durante 10 min purgando con nitrógeno. A continuación, se añadió etanotiol (0,205 g) a la mezcla de reacción, que se calentó posteriormente a 90 °C durante 3 horas. A continuación, la reacción se inactivó con agua. El tratamiento de la mezcla de reacción mediante extracción y cromatografía en columna proporcionó 3-etilsulfanil-pirazolo[1,5-a]piridin-2-carboxilato de metilo 0,29 g, 92,90 % de rendimiento. ¹H-RMN (CDCl₃) 8,50(d,1H), 7,81-7,83 (d,1H), 7,27-7,30 (dd,1H), 6,95-6,98 (dd,1H), 4,05 (S,3H), 2,85-2,90 (q,2H), 1,15-1,18 (t,3H). LC-MS: Masa encontrada (M-1) =237.

Paso-6: Fabricación de 3-etilsulfonilpirazolo[1,5-a]piridin-2-carboxilato de metilo

50 A una disolución agitada de 3-etilsulfanilpirazolo[1,5-a]piridin-2-carboxilato de metilo (0,285 g, 1,20 mmol) en DCM (5 mL) se añadió ácido *meta*-cloroperoxibenzoico (3 equivalentes) a 0 °C. La mezcla de reacción se dejó calentar hasta 20-25 °C y se agitó durante 16 horas. A continuación, se inactivó la reacción con una solución acuosa saturada de NaHCO₃. El tratamiento de la mezcla de reacción mediante extracción y purificación por cromatografía en columna permitió obtener 3-etilsulfonilpirazolo[1,5-a]piridin-2-carboxilato de metilo (0,295 g, 91,33 % de rendimiento). ¹H-RMN (CDCl₃) 8,58-8,59(d,1H), 8,34-8,36 (d,1H), 7,50-7,53 (dd,1H), 7,14-7,17 (dd,1H), 4,07 (S,3H), 3,63-3,67 (q,2H), 1,26-1,35 (t,3H). LC-MS: Masa encontrada (M-1) =269.

Paso-7: Fabricación de ácido 3-etilsulfonilpirazolo[1,5-a]piridina-2-carboxílico

60 A una composición que comprendía 3-etilsulfonilpirazolo[1,5-a]piridin-2-carboxilato de metilo (8,2 g) en agua (100 mL) se añadió LiOH (3,28 g) a 0 °C y se agitó durante 10 min. A continuación, se añadió CH₃CH₂OH (50 mL) y la mezcla de reacción resultante se calentó a 100 °C durante 2 horas. Posteriormente, el pH de la mezcla de reacción se ajustó a pH 2 mediante la adición de HCl (2M). El tratamiento de la mezcla de reacción mediante extracción permitió obtener un producto puro de ácido 3-etilsulfonilpirazolo[1,5-a]piridin-2-carboxílico. (6,5 g, 83,6 % de rendimiento). ¹H-RMN (DMSO-d₆) 8,96-8,94 (d,1H), 8,09-8,11 (d,1H), 7,68-7,71 (dd,1H), 7,31-7,34 (dd,1H), 3,54-3,58 (q,2H), 1,06-1,11 (t,3H). LC-MS: Masa encontrada (M+1) = 255.

Paso-8: Fabricación de 3-etilsulfonil-N-metoxi-N-metil-pirazolo[1,5-a]piridin-2-carboxamida

5 A una composición agitada que comprendía ácido 3-etilsulfonilpirazolo[1,5-a]piridina-2-carboxílico (1 g) del paso-7 en CH₂Cl₂ seco (20 mL) se añadieron clorhidrato de N,O-dimetilhidroxilamina (0,496 g), diisopropiletilamina (2,03 g) a 0 °C bajo atmósfera de nitrógeno. La mezcla de reacción resultante se agitó a 0 °C durante 10 min, tras lo cual se añadió anhídrido de ácido propanofosfónico (3,75 g). La mezcla de reacción resultante se dejó calentar lentamente hasta 20-25 °C y se agitó durante aproximadamente 16 horas. A continuación, la reacción se inactivó con agua. El trabajo de la mezcla de reacción mediante extracción proporcionó 3-etilsulfonil-N-metoxi-N-metil-pirazolo[1,5-a]piridin-2-carboxamida (1 g, 85,5 % de rendimiento). ¹H-RMN (CDCl₃) 8,48 (d, 1H), 8,25-8,26 (d, 1H), 7,42-7,45 (dd, 1H), 7,01-7,04 (dd, 1H), 4,03-4,07 (q, 2H), 3,62 (s, 3H), 3,49 (s, 3H), 1,17-1,19 (t, 3H). LC-MS: Masa encontrada (M-1) = 298.

Paso-9: Fabricación de 1-(3-etilsulfonilpirazolo[1,5-a]piridin-2-il)etanona

15 A una composición agitada que comprendía 3-etilsulfonil-N-metoxi-N-metil-pirazolo[1,5-a]piridina-2-carboxamida (1g) en THF (10 mL) se añadió una solución de CH₃MgBr en éter dietílico (3M, 6,73 mmol) a 0 °C bajo atmósfera de nitrógeno. La mezcla de reacción resultante se agitó a continuación a 0 °C durante 30 min. A continuación, la mezcla de reacción se diluyó con una disolución acuosa 1N de HCl (10 mL). El procesamiento de la mezcla resultante mediante extracción proporcionó 1-(3-etilsulfonilpirazolo[1,5-a]piridin-2-il)etanona (0,6 g, 70,75 % de rendimiento) como sólido blanquecino. ¹H-RMN (CDCl₃) 8,44 (d, 1H), 8,27-8,29 (d, 1H), 7,41-7,43 (dd, 1H), 7,07-7,08 (dd, 1H), 3,58-3,62 (q, 2H), 2,68 (s, 3H), 1,20-1,24 (t, 3H). LC-MS: Masa encontrada (M+1) = 253.

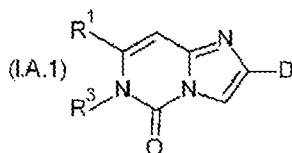
Paso -10: Fabricación de 2-bromo-1-(3-etilsulfonilpirazolo[1,5-a]piridin-2-il)etanona

25 A una composición que comprendía 1-(3-etilsulfonilpirazolo[1,5-a]piridin-2-il)etanona (3,8 g) del paso-9 en tolueno (50 ml) se añadió 33 % de HBr en CH₃COOH (15 ml) a 25 °C gota a gota durante un periodo de 25 min. A esta mezcla de reacción se añadió Br₂ (2,44 g) gota a gota durante un periodo de 20 min, tras lo cual la mezcla de reacción se agitó a 25 °C durante 16 horas. A continuación, la reacción se inactivó con agua. El procesamiento mediante extracción y recristalización en heptano : acetato de etilo (8:2) permitió obtener 2-bromo-1-(3-etilsulfonilpirazolo[1,5-a]piridin-2-il)etanona pura (3,5 g, 70,10 % de rendimiento). ¹H-RMN (CDCl₃) 8,58 (d, 1H), 8,39 (d, 1H), 7,5 (dd, 1H), 7,19 (dd, 1H), 4,74 (s, 2H), 3,65-3,67 (q, 2H), 1,31-1,34 (t, 3H). LC-MS: Masa encontrada (M+1) = 331.

Paso - 11: Síntesis de 6-ciclopropil-2-(3-etilsulfonilpirazolo[1,5-a]piridin-2-il)-7-(trifluorometil)imidazo[1,2-c]pirimidin-5-ona (compuesto 1,11)

35 A una composición agitada que comprendía 1-ciclopropil-4-imino-6-(trifluorometil)pirimidin-2-ona (2 g) en (CH₃)₃COH (20 mL) se añadió 2-bromo-1-(3-etilsulfonilpirazolo[1,5-a]piridin-2-il)etanona (3,6 g). Se añadieron tamices moleculares a la mezcla de reacción resultante (2 g), que posteriormente se calentó a 120 °C durante 24 horas. A continuación, la mezcla de reacción se filtró a través de un lecho de celita y el filtrado se recolectó y se concentró a presión reducida. El residuo resultante se purificó mediante cromatografía en columna para obtener 6-ciclopropil-2-(3-etilsulfonilpirazolo[1,5-a]piridin-2-il)-7-(trifluorometil)imidazo[1,2-c]pirimidin-5-ona como un sólido blanco (1,5 g, 50 % de rendimiento). ¹H-RMN (500 MHz, DMSO-d₆): δ 8,95 (d, 1H, J = 5 Hz), 8,40 (s, 1H), 8,13 (d, 1H, J = 5 Hz), 7,66 (dd, 1H, J = 7 Hz), 7,49 (s, 1H), 7,26 (d, 1H, J = 5 Hz), 3,66 (t, 2H, J = 7 Hz), 3,18 (s, 1H), 1,22 (t, 3H, J = 5 Hz), 1,13 (m, 4H). LC-MS: masa calculada [M+1]⁺ 452,42, LC-MS: Masa encontrada 452,0.

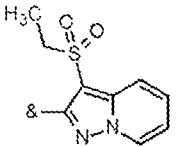
45 En la Tabla C se enumeran los compuestos de fórmula I.A.1 según el significado de las variables R¹, R³ y D,



50 cuyos compuestos se sintetizaron como se describe en el Ejemplo de síntesis C, o en analogía con el mismo.

Tabla C: compuestos I.11 a I.12 con datos de caracterización física. y significa la conexión con el resto de la molécula de fórmula I.A.1.

Compuesto	R ¹	R ³	D	Datos de ¹ H-NMR, δ, (500 MHz), disolvente entre paréntesis
I.11	CF ₃	ciclopropilo		8,95 (d, 1H, J = 5 Hz), 8,40 (s, 1H), 8,13 (d, 1H, J = 5 Hz), 7,66 (dd, 1H, J = 7 Hz), 7,49 (s, 1H), 7,26 (d, 1H, J = 5 Hz), 3,66 (t, 2H, J = 7 Hz), 3,18 (s, 1H), 1,22 (t, 3H, J = 5 Hz), 1,13 (m, 4H). (CDCl ₃)

Compuesto	R ¹	R ³	D	Datos de ¹ H-NMR, δ, (500 MHz), disolvente entre paréntesis
I.12	CF ₃	CH ₃		8,96 (d, J = 6,9 Hz, 1H), 8,46 (s, 1H), 8,14 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,6 (dd, J = 9,1, 6,9 Hz, 1H), 7,55 (s, 1H), 7,28 (t, J = 6,9 Hz, 1H), 3,65 (q, J = 7,4 Hz, 2H), 3,62 (s, 3H), 1,16 (t, J = 7,3 Hz, 3H) (DMSO-d6)

Ejemplo de síntesis D: 2-(3-etilsulfonil-5,6,7,8-tetrahidroimidazo[1,2-a]piridin-2-il)-6-metil-7-(trifluorometil)imidazo[1,2-c]pirimidin-5-ona (compuesto 1,13)

5 Paso-1: Fabricación de 5,6,7,8-tetrahidroimidazo[1,2-a]piridin-2-carboxilato de etilo

10 Se preparó una composición que comprendía imidazo[1,2-a]piridin-2-carboxilato de etilo (5,2 g) tal como se obtuvo en el Ejemplo de síntesis B, paso-1, en THF (100 mL), CH₃CH₂OH (100mL), CH₃COOH (10 mL) y Pd sobre carbono (10 %, 1,44 g). Posteriormente, se aplicó gas de H₂ a una presión de 500 kPa (5 bares) a la composición durante 16 horas. La composición resultante se filtró y se concentró mediante evaporación bajo presión reducida. El procesamiento mediante extracción proporcionó 5,6,7,8-tetrahidro-imidazo[1,2-a]piridin-2-carboxilato de etilo (4,61 g, 86,81 % de rendimiento). ¹H-RMN (CDCl₃) 7,74(S, 1H), 4,18-4,21 (q, 2H), 3,97-3,99 (t, 2H), 2,72-2,74 (t, 2H), 1,83-1,89 (m, 4H), 1,23-1,26 (t, 3H). LC-MS: Masa encontrada (M+1) 195.

15 Paso-2: Fabricación de 1-(3-etilsulfonil-5,6,7,8-tetrahidroimidazo[1,2-a]piridin-2-il)etanona

20 El compuesto 5,6,7,8-tetrahidroimidazo[1,2-a]piridin-2-carboxilato de etilo del paso-1 se convirtió en pasos de proceso análogos a los del Ejemplo de síntesis C, paso-4 a paso-9, en el compuesto 1-(3-etilsulfonil-5,6,7,8-tetrahidroimidazo[1,2-a]piridin-2-il)etanona. ¹H-RMN (DMSO-d6) 4,22-4,25 (t, 2H), 3,57-3,60 (t, 2H), 2,85-2,88 (t, 2H), 2,51 (s, 3H), 1,92-1,94 (t, 2H), 1,84-1,86 (t, 2H), 1,19 (t, 3H), LC-MS: Masa encontrada (M+1) 257.

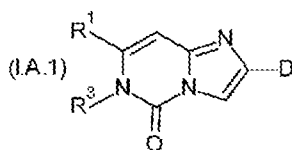
Paso-3: Fabricación de 2-bromo-1-(3-etilsulfonil-5,6,7,8-tetrahidroimidazo[1,2-a]piridin-2-il)etanona

25 A una disolución que comprendía 1-(3-etilsulfonil-5,6,7,8-tetrahidroimidazo[1,2-a]piridin-2-il)etanona (2 g) del paso-2 en dioxano (30 mL) se añadió tribromuro de piridinio (2,5 g) a 25 °C y la mezcla de reacción resultante se calentó a 105 °C durante 2 horas. El enfriamiento con agua, la extracción de la mezcla de reacción y la purificación del producto bruto extraído mediante cromatografía en columna proporcionaron 2-bromo-1-(3-etilsulfonil-5,6,7,8-tetrahidroimidazo[1,2-a]piridin-2-il)etanona. (0,9 g, 35,24 % de rendimiento). ¹H-RMN (DMSO-d6) 4,76 (s, 2H), 4,25-4,27 (t, 2H), 3,57-3,61 (q, 2H), 2,87-2,89 (t, 2H), 1,82-1,96 (m, 4H), 1,25 (t, 3H), LC-MS: Masa encontrada (M+1) 335.

30 Paso-4: Fabricación de 2-(3-etilsulfonil-5,6,7,8-tetrahidroimidazo[1,2-a]piridin-2-il)-6-metil-7-(trifluorometil)imidazo[1,2-c]pirimidin-5-ona (compuesto 1,13)

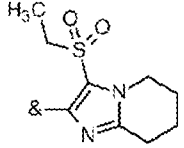
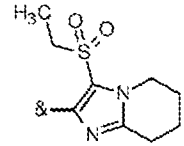
35 A una composición agitada que comprendía 4-amino-1-metil-6-(trifluorometil)pirimidin-2-ona (0,15 g) en terc-butanol (2 mL) se añadió 2-bromo-1-(3-etilsulfonil-5,6,7,8-tetrahidroimidazo[1,2-a]piridin-2-il)etanona (0,25 g) del paso-3. Se añadieron tamices moleculares a la mezcla de reacción anterior (0,2 g), que posteriormente se calentó a 120 °C durante 24 horas. A continuación, la mezcla de reacción se filtró a través de un lecho de celita, tras lo cual se relectó el filtrado y se concentró a presión reducida para obtener un producto bruto. La purificación del producto bruto mediante cromatografía en columna proporcionó el compuesto I.12 como un sólido amarillo (0,12 g, 33,4 % de rendimiento). ¹H RMN (500 MHz, DMSO-d6): 8,12 (s, 1H), 7,45 (s, 1H), 4,22 (t, 2H), 3,63 (q, 2H), 3,33 (s, 3H), 2,74 (t, 2H), 1,20 (q, 2H), 1,19 (q, 2H), 1,18 (t, 3H), LC-MS: masa calculada [M+1] 429, LC-MS: Masa encontrada (M+1) 430,0.

45 En la Tabla D a continuación se enumeran los compuestos de fórmula I.A.1 según el significado de las variables R¹, R³ y D,



cuyos compuestos se sintetizaron como se describe en el Ejemplo de síntesis D, o o en analogía con el mismo.

50 Tabla D: compuestos 1,13 a 1,14 con datos de caracterización física. y significa la conexión con el resto de la molécula de fórmula I.A.1.

Compuesto	R ¹	R ³	D	Datos de ¹ H-NMR, δ, (500 MHz), disolvente entre paréntesis
I.13	CF ₃	CH ₃		8,12 (s, 1H), 7,45 (s, 1H), 4,22 (t, 2H), 3,63 (q, 2H), 3,33 (s, 3H), 2,74 (t, 2H), 1,20 (q, 2H), 1,19 (q, 2H), 1,18 (t, 3H)
I.14	CF ₃	ciclopropilo		8,07 (s, 1H), 7,40 (s, 1H), 4,22 (m, 2H), 3,95 (t, 2H), 3,18 (s, 1H), 2,89 (m, 2H), 1,91 (m, 2H), 1,86 (m, 2H), 1,22 (t, 3H), 1,14 (s, 2H), 1,13 (s, 2H).

Ejemplo de síntesis E: 6-ciclopropil-2-(3-etilsulfonilimidazo[1,2-a]pirimidin-2-il)-7-(trifluorometil)imidazo[1,2-c]pirimidin-5-ona (compuesto 1,15)

5 Paso-1: Fabricación de 1-imidazo[1,2-a]pirimidin-2-iletanona

10 A una composición que comprendía 2-aminopirimidina (1 g) en acetona (10 mL) se añadió lentamente 1-bromobutano-2,3-diona (1,5 g) gota a gota durante un periodo de tiempo de 10 min a 20 a 25 °C. Posteriormente, la mezcla de reacción resultante se calentó a reflujo durante 2 horas. El precipitado sólido se disolvió en una mezcla de CH₃CH₂OH: H₂O (relación en peso 10 : 3) y se calentó a 64 °C. Tras enfriar a 20-25 °C y trabajar por concentración a presión reducida, se obtuvo 1-imidazo[1,2-a]pirimidin-2-iletanona (1,0 g, 60 % de rendimiento). ¹H-RMN (CDCl₃) 9,01-8,99(dd, 1H), 8,69-8,68 (dd,1H), 8,45 (s,1H), 7,17-7,15 (dd, 1H),2,58 (s,3H), LC-MS: Masa encontrada (M+1) 161,1.

15 Paso-2: Fabricación de 1-(3-cloroimidazo[1,2-a]pirimidin-2-il)etanona

20 A una composición agitada que comprendía 1-imidazo[1,2-a]pirimidin-2-iletanona (1 g) del paso-1 en CHCl₃ (10 mL) se añadió cloruro de Palau (0,913 g) a 20-25 °C bajo atmósfera de nitrógeno. La mezcla de reacción resultante se agitó a la misma temperatura durante aproximadamente 15 horas. La reacción se inactivó posteriormente mediante adición de agua y se elaboró mediante extracción para obtener 1-(3-cloroimidazo[1,2-a]pirimidin-2-il)etanona como sólido blanco. (1,0 g, 60 % de rendimiento). ¹H-RMN (d6-CDCl₃) 8,78-8,75 (m,2H), 7,32-7,29 (m,1H), 2,65 (s, 3H), LC-MS: Masa encontrada (M+1) 195,1.

25 Paso-3: Fabricación de 1-(3-etilsulfanilimidazo[1,2-a]pirimidin-2-il)etanona

30 A una composición agitada que comprendía 1-(3-cloroimidazo[1,2-a]pirimidin-2-il)etanona (4 g) del paso-2 en THF (40 mL) se añadió etanotiolato de sodio (2,24 g) a 0 °C. La mezcla de reacción resultante se agitó a 0 °C durante 2 horas. A continuación, la reacción se inactivó con agua. El procesamiento de la mezcla resultante mediante extracción proporcionó 1-(3-etilsulfanilimidazo[1,2-a]pirimidin-2-il)etanona (2,0 g, rendimiento: 60%). ¹H-RMN (d6-CDCl₃) 9,07-9,06(d,1H), 8,78-8,77 (dd,1H), 7,30-7,27(dd,1H), 3,61(s,3H), 2,93(q,2H), 1,06(t,3H), LC-MS: Masa encontrada (M+1) 221,1.

35 Paso-4: Fabricación de 1-(3-etilsulfonilimidazo[1,2-a]pirimidin-2-il)etanona

40 A una composición agitada que comprendía 3-etilsulfanilimidazo[1,2-a]piridin-2-carboxilato de etilo (5g) en CH₂Cl₂ (100mL) se añadió ácido meta-cloroperoxibenzoico (3eq) a 0 °C. La mezcla de reacción resultante se dejó calentar hasta 20-25 °C y se agitó durante 16 horas. La reacción se diluyó con agua (50 mL) y se añadió una disolución acuosa saturada de bisulfito sódico (50 mL). La mezcla de reacción se agitó durante otros 10 minutos, tras lo cual se añadieron 50 mL de una disolución acuosa de NaHCO₃ (10 % en peso). La extracción de la mezcla de reacción dio 1-(3-etilsulfonilimidazo[1,2-a]pirimidin-2-il)etanona como sólido de color amarillo. (3 g, rendimiento: 65%). ¹H-RMN(CDCl₃): 9,50-9,48(dd,1H), 8,99-8,98(d,1H), 7,61-7,55(dd,1H), 3,70(s,3H), 3,76-3,72(q,2H), 1,30-1,34(t,3H), LC-MS: Masa encontrada (M+1) 254,2

45 Paso-5: Fabricación de 2-bromo-1-(3-etilsulfonilimidazo[1,2-a]pirimidin-2-il)etanona

50 Se preparó una composición que comprendía 1-(3-etilsulfonilimidazo[1,2-a]pirimidin-2-il)etanona (0,3 g) del paso-4 en tolueno (3 mL) a 0 °C. Posteriormente, se añadió a la mezcla de reacción una composición de 33 % en peso de HBr en CH₃COOH (1 mL) a 0 °C. La mezcla de reacción se agitó durante 10 min. A continuación, se añadió gota a gota Br₂ (0,004 mol) a la mezcla de reacción, que se agitó entre 20 y 25 °C durante aproximadamente 15 horas. El tratamiento de la mezcla de reacción mediante enfriamiento con agua, extracción y cromatografía en columna proporcionó 2-bromo-1-(3-etilsulfonilimidazo[1,2-a]pirimidin-2-il)etanona (0,1 g, 60 % de rendimiento). ¹H-RMN (DMSO-d₆) 9,96(m,1H),8,97 (m,1H),7,50 (m,1H),5,02 (s,2H),3,74 (q,2H), 1,26 (t,3H), LC-MS: Masa encontrada (M+1) 331,12.

Paso-6: Fabricación de 6-ciclopropil-2-(3-etilsulfonilimidazo[1,2-a]pirimidin-2-il)-7-(trifluorometil)imidazo[1,2-c]pirimidin-5-

ona (compuesto 1,15)

A una composición agitada de 1-ciclopropil-4-imino-6-(trifluorometil)pirimidin-2-ona (0,15 g, 6,8 mmol) en terc-butanol (2 mL) se añadió 2-bromo-1-(3-etilsulfonilimidazo[1,2-a]pirimidin-2-il)etanona (0,23 g, 6,8 mol). Se añadieron tamices moleculares a la mezcla de reacción anterior (0,2 g) y la mezcla de reacción resultante se calentó a 120 °C durante 24 horas. Posteriormente, la mezcla de reacción se filtró a través de un lecho de celita, y el filtrado se recolectó y se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a cromatografía en columna para obtener 6-ciclopropil-2-(3-etilsulfonilimidazo[1,2-a]pirimidin-2-il)-7-(trifluorometil)imidazo[1,2-c]pirimidin-5-ona como un sólido amarillo (0,12 g, 30,9 % de rendimiento). ¹H RMN (500 MHz, DMSO-d₆): δ 9,42 (q, 1H), 8,85 (q, 1H), 8,37 (s, 1H), 7,50 (s, 1H), 7,38 (q, 1H), 3,95 (t, 2H), 3,18 (s, 1H), 1,22 (t, 3H), 1,14 (s, 2H), 1,13 (s, 2H). LC-MS: masa calculada [M+1]⁺ 453,4, LC-MS: Masa encontrada (M+1) 453,0.

B. Ejemplos biológicos

La actividad de los compuestos de fórmula (I) de la presente invención podría demostrarse y evaluarse en las pruebas biológicas descritas a continuación. Si no se especifica lo contrario, las disoluciones de prueba se preparan de la siguiente manera: El compuesto activo se disuelve a la concentración deseada en un mezcla de 1:1 (vol:vol) de agua destilada:acetona. La disolución de prueba se prepara el día de su uso. Las disoluciones de prueba se preparan en general a concentraciones de 2500 ppm, 1415 ppm, 828 ppm, 800 ppm y 300 ppm (peso/vol).

Gorgojo del algodón (*Anthonomus grandis*)

Para evaluar el control del gorgojo del algodón (*Anthonomus grandis*), la unidad de prueba consistía en placas de microtitulación de 96 pozos que contenían una dieta de insectos y 5-10 huevos de *A. grandis*. Los compuestos fueron formulados usando un disolución que contenía 75 % v/v de agua y 25 % v/v de DMSO. Se rociaron diferentes concentraciones de compuestos formulados sobre la dieta de insectos a 5 µl, usando un micro atomizador hecho a medida, en dos repeticiones. Después de la aplicación, las placas de microtitulación se incubaron a aproximadamente 25 ± 1 °C y aproximadamente 75 ± 5 % de humedad relativa durante 5 días. A continuación, se evaluó visualmente la mortalidad de huevos y larvas. En esta prueba, los compuestos I.2, I.3, I.4, I.5, e I.6 a 828 ppm mostraron una mortalidad superior al 75 % en comparación con los controles no tratados. En esta prueba, los compuestos I.1, I.8, I.11 e I.13 a 800 ppm mostraron una mortalidad superior al 75 % en comparación con los controles no tratados.

Gusano bellotero (*Heliothis virescens*)

Para evaluar el control del gusano bellotero (*Heliothis virescens*), la unidad de prueba consistía en placas de microtitulación de 96 pozos que contenían una dieta de insectos y 15-25 huevos de *H. virescens*. Los compuestos fueron formulados usando un disolución que contenía 75 % v/v de agua y 25 % v/v de DMSO. Se rociaron diferentes concentraciones de compuestos formulados sobre la dieta de insectos a 10 µl, usando un micro atomizador hecho a medida, en dos repeticiones. Después de la aplicación, las placas de microtitulación se incubaron a aproximadamente 28 ± 1 °C y aproximadamente 80 ± 5 % de humedad relativa durante 5 días. A continuación, se evaluó visualmente la mortalidad de huevos y larvas. En esta prueba, los compuestos 1,1, I.3, I.4, I.5 e I.6 a 2500 ppm mostraron una mortalidad superior al 75 % en comparación con los controles no tratados. En esta prueba, los compuestos I.8 e I.11 a 800 ppm mostraron una mortalidad superior al 75 % en comparación con los controles no tratados.

Áfido de la arveja (*Megoura viciae*)

Para evaluar el control del áfido de la arveja (*Megoura viciae*) a través de contacto o medios sistémicos, la unidad de prueba consistía en placas de microtitulación de 24 pozos que contenían discos foliares de haba común.

Los compuestos fueron formulados usando un disolución que contenía 75 % v/v de agua y 25 % v/v de DMSO. Se rociaron diferentes concentraciones de compuestos formulados en los discos foliares a 2,5 µl, usando un microatomizador construido a medida, en dos repeticiones. Después de la aplicación, los discos foliares se secaron al aire y se colocaron de 5 a 8 áfidos adultos en los discos foliares dentro de los pozos de la placa de microtitulación. Se permitió que los áfidos chuparan los discos foliares tratados y se incubaron a aproximadamente 23 ± 1 °C y aproximadamente 50 ± 5 % de humedad relativa durante 5 días. A continuación, se evaluó visualmente la mortalidad y fecundidad de los áfidos. En esta prueba, el compuesto 1,1 a 2500 ppm mostró una mortalidad superior al 75 % en comparación con los controles no tratados.

Pulgón del duraznero (*Myzus persicae*)

Para evaluar el control del pulgón del duraznero (*Myzus persicae*) a través de medios sistémicos, la unidad de prueba consistía en placas de microtitulación de 96 pozos que contenían una dieta artificial líquida bajo una membrana artificial. Los compuestos fueron formulados usando un disolución que contenía 75 % v/v de agua y 25 % v/v de DMSO. Se pipetearon diferentes concentraciones de compuestos formulados en la dieta del áfido, utilizando una pipeta construida a medida, en dos repeticiones. Después de la aplicación, se colocaron 5-8 áfidos adultos en la membrana artificial dentro de los pozos de la placa de microtitulación. Se permitió que los áfidos chuparan la dieta para áfidos tratada y se incubaron

a aproximadamente 23 ± 1 °C y aproximadamente 50 ± 5 % de humedad relativa durante 3 días. A continuación, se evaluó visualmente la mortalidad y fecundidad de los áfidos. En esta prueba, los compuestos I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, e I.6 a 2500 ppm mostraron una mortalidad superior al 75 % en comparación con los controles no tratados. En esta prueba, los compuestos I.7, I.8, I.11 y I.12 a 800 ppm mostraron una mortalidad superior al 75 % en comparación con los controles no tratados.

5

Mosca blanca de los invernaderos (*Trialeurodes vaporariorum*)

Para evaluar el control de la mosca blanca de los invernaderos (*Trialeurodes vaporariorum*), la unidad de prueba consistía en placas de microtitulación de 96 pozos que contenían un disco foliar de la planta con huevos de mosca blanca. Los compuestos o mezclas fueron formulados usando una disolución que contiene 75 % de agua y 25 % de DMSO. Se rociaron diferentes concentraciones de compuestos formulados sobre la dieta de insectos a 2,5 µl, usando un micro atomizador hecho a medida, en dos repeticiones. Después de la aplicación, las placas de microtitulación se incubaron a 23 ± 1 °C, 65 ± 5 % de HR durante 6 días. A continuación, se evaluó visualmente la mortalidad de los rastreadores incubados. En esta prueba, los compuestos I.2 e I.6 a 2500 ppm mostraron al menos un 75 % de mortalidad en comparación con los controles no tratados. En esta prueba, el compuesto I.12 a 800 ppm mostró una mortalidad de al menos 75 % en comparación con los controles no tratados.

10

15

Mosquito de la fiebre amarilla (*Aedes aegypti*)

Para evaluar el control del mosquito de la fiebre amarilla (*Aedes aegypti*), la unidad de prueba consistió en placas de microtitulación de 96 pocillos que contenían 200 µl de agua del grifo por pozo y 5-15 larvas de *A. aegypti* recién eclosionadas. Los compuestos activos fueron formulados usando una disolución que contenía 75 % (v/v) de agua y 25 % (v/v) de DMSO. Se rociaron diferentes concentraciones de compuestos o mezclas formulados sobre la dieta de insectos a 2,5 µl, usando un micro atomizador hecho a medida, en dos repeticiones. Después de la aplicación, las placas de microtitulación se incubaron a 28 ± 1 °C, 80 ± 5 % de HR durante 2 días. A continuación, se evaluó visualmente la mortalidad de 10 larvas. En esta prueba, los compuestos I.1, I.2, I.3, I.4, I.5, e I.6 a 2500 ppm mostraron una mortalidad de al menos 75 % en comparación con los controles no tratados. En esta prueba, los compuestos I.8 e I.11 a 800 ppm mostraron una mortalidad de al menos 75 % en comparación con los controles no tratados.

20

25

30

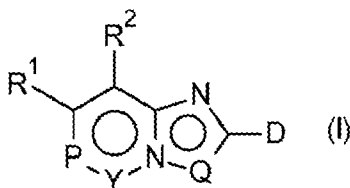
Chinche verde (*Nezara viridula*)

El compuesto activo se disuelve a la concentración deseada en una mezcla de 1:1 (vol:vol) de agua destilada:acetona. El tensoactivo (KineticR HV) se añade en una tasa de 0,01 % (vol/vol). La disolución de prueba se prepara el día de su uso. Las vainas de soja se colocaron en placas Petri de vidrio de 90 x 50 mm forradas con papel de filtro húmedo y se inocularon con diez *N. viridula* de 3er estadio tardío. Con un atomizador manual, se pulveriza una disolución de aproximadamente 2 ml en cada placa de Petri. Los vasos tratados se mantuvieron a aproximadamente 25-26 °C y a una humedad relativa del 65-70 %. El porcentaje de mortalidad se registró al cabo de 5 días. En esta prueba, los compuestos I.6 y I.8 a 300 ppm mostraron una mortalidad superior al 75 % en comparación con los controles no tratados.

35

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula (I):



5

en donde
el círculo en el anillo representa que el anillo está totalmente insaturado;

10 Y es C=X, en donde X es O o S;
P es N(R³) o C(R⁴);
Q es N(R³) o C(R⁶);

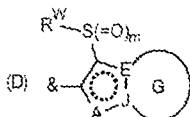
15 R¹ es H, halógeno, alquilo de C₁-C₆, alqueno de C₂-C₆, alquino de C₂-C₆, alcoxi de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₆-alquilo de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalcoxi de C₃-C₆, sulfenilo de C₁-C₆, sulfinilo de C₁-C₆, o sulfonilo de C₁-C₆, cuyos grupos están no sustituidos o halogenados;

20 R³, R⁵ son independientemente alquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₆, alqueno de C₂-C₆, alquino de C₂-C₆, alcoxi de C₁-C₆-alquilo de C₁-C₄, alcoxi de C₁-C₆-alcoxi de C₁-C₄, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, o cicloalcoxi de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, que están no sustituidos o halogenados; C(=O)OR^A, NR^BR^C, alqueno de C₁-C₆-NR^BR^C, O-alqueno de C₁-C₆-NR^BR^C, alqueno de C₁-C₆-CN, Nh-alqueno de C₁-C₆-NR^BR^C, C(=O)NR^BR^C, C(=O)R^D, C(=S)R^D, SO₂NR^BR^C, S(=O)_nR^E; fenilo o bencilo, en donde el anillo fenilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^F iguales o diferentes;

25 R², R⁴, R⁶ son independientemente H, halógeno, N₃, CN, NO₂, SCN, SF₅; alquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₆, alqueno de C₂-C₆, tri-alquilsililo de C₁-C₆, alquino de C₂-C₆, alcoxi de C₁-C₆-alquilo de C₁-C₄, alcoxi de C₁-C₆-alcoxi de C₁-C₄, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalcoxi de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cicloalcoxi de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno, C(=O)OR^A, NR^BR^C, NOR^A, ONR^BR^C, alqueno de C₁-C₆-NR^BR^C, O-alqueno de C₁-C₆-NR^BR^C, alqueno de C₁-C₆-CN, NH-alqueno de C₁-C₆-NR^BR^C, C(=O)NR^BR^C, C(=O)R^D, C(=S)R^D, SO₂NR^BR^C, S(=O)_nR^E; fenilo o bencilo, en donde el anillo fenilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^F iguales o diferentes;

30

D es un anillo bicíclico fusionado de la siguiente fórmula



35 en donde el símbolo "&" significa la conexión con el resto de la fórmula (I), en donde el círculo de puntos en el anillo de 5 miembros significa que el anillo de 5 miembros puede estar saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado; y en donde

A es N, S, O, CR⁷, o NR⁸;

40 E, J son independientemente C o N, en donde al menos una de las variables seleccionadas entre E y J es C;
G es un carbociclo o heterociclo saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado de 5 o 6 miembros, cuyo carbociclo o heterociclo incluye los átomos E y J como miembros del anillo y está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R⁹ iguales o diferentes, y en donde dicho heterociclo comprende ningún, uno o más heteroátomos O, N, o S, iguales o diferentes, además de los que puedan estar presentes como miembros del anillo E y J;

45

R⁷ es H, halógeno, OH, CN, NC, NO₂, N₃, SCN, NCS, NCO, SF₅; alquilo de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆, alqueno de C₂-C₆, cicloalqueno de C₃-C₆, alquino de C₂-C₆, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes R⁹ iguales o diferentes;

50

un anillo o sistema de anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado de

55

3 a 12 miembros, en donde dicho anillo o sistema de anillo heterocíclico comprende uno o más heteroátomos iguales o diferentes O, N o S, y está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^H iguales o diferentes, y en donde dichos átomos N y S están independientemente oxidados o no oxidados; fenilo, que está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^J iguales o diferentes; OR^K, SR^K, OC(=O)R^K, OC(=O)OR^K, OC(=O)NR^LR^M, OC(=O)SR^K, OC(=S)NR^LR^M, OC(=S)SR^K, OS(=O)_mR^K, OS(=O)_mNR^LR^M, ONR^LR^M, ON=CR^NO, NR^LR^M, NOR^K, ONR^LR^M, N=CR^NO, NNR^L, N(R^L)C(=O)R^K, N(R^L)C(=O)OR^K, S(=O)_nR^V, SC(=O)SR^K, SC(=O)NR^LR^M, S(=O)_mNR^LR^M, C(=O)R^P,

$C(=S)R^P$, $C(=O)NR^L R^M$, $C(=O)OR^K$, $C(=S)NR^L R^M$, $C(=S)OR^K$, $C(=S)SR^K$, $C(=NR^L)R^M$, $C(=NR^L)NR^M R^R$, $Si(R^S)_2 R^T$;

R^8 es H, halógeno, CN;

alquilo de C_1-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_6 , alqueno de C_2-C_6 , cicloalqueno de C_3-C_6 , alquino de C_2-C_6 , cuyos grupos están no sustituidos, o sustituidos con uno o más sustituyentes R^G iguales o diferentes;

un anillo o sistema de anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado de 3 a 12 miembros, en donde dicho anillo o sistema de anillo heterocíclico comprende uno o más heteroátomos iguales o diferentes O, N o S, y está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^H iguales o diferentes, y en donde dichos átomos N y S están independientemente oxidados o no oxidados;

fenilo, que está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^J iguales o diferentes;

OR^K , SR^K , $OC(=O)R^K$, $OC(=O)OR^K$, $OC(=O)NR^L R^M$, $OC(=O)SR^K$, $OC(=S)NR^L R^M$, $OC(=S)SR^K$, $OS(=O)_m R^K$, $OS(=O)_m NR^L R^M$, $ONR^L R^M$, $ON=CR^{NR^O}$, $NR^L R^M$, NOR^K , $ONR^L R^M$, $N=CR^{NR^O}$, NNR^L , $N(R^L)C(=O)R^K$, $N(R^L)C(=O)OR^K$, $S(=O)_n R^V$, $SC(=O)SR^K$, $SC(=O)NR^L R^M$, $S(=O)_m NR^L R^M$, $C(=O)R^P$, $C(=S)R^P$, $C(=O)NR^L R^M$, $C(=O)OR^K$, $C(=S)NR^L R^M$, $C(=S)OR^K$, $C(=S)SR^K$, $C(=NR^L)R^M$, $C(=NR^L)NR^M R^R$, $Si(R^S)_2 R^T$;

cada R^9 es independientemente H, halógeno, OH, CN, NC, NO_2 , N_3 , SCN, NCS, NCO, SF_5 ; alquilo de C_1-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_6 , alqueno de C_2-C_6 , cicloalqueno de C_3-C_6 , alquino de C_2-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_6 -alquilo de C_1-C_3 , cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes R^G iguales o diferentes;

un anillo o sistema de anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado de

3 a 12 miembros, en donde dicho anillo o sistema de anillo heterocíclico comprende uno o más heteroátomos iguales o diferentes O, N o S, y está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^H iguales o diferentes, y en donde dichos átomos N y S están independientemente oxidados o no oxidados;

fenilo, que está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^J iguales o diferentes;

OR^K , SR^K , $OC(=O)R^K$, $OC(=O)OR^K$, $OC(=O)NR^L R^M$, $OC(=O)SR^K$, $OC(=S)NR^L R^M$, $OC(=S)SR^K$, $OS(=O)_m R^K$, $OS(=O)_m NR^L R^M$, $ONR^L R^M$, $ON=CR^{NR^O}$, $NR^L R^M$, NOR^K , $ONR^L R^M$, $N=CR^{NR^O}$, NNR^L , $N(R^L)C(=O)R^K$, $N(R^L)C(=O)OR^K$, $S(=O)_n R^V$, $SC(=O)SR^K$, $SC(=O)NR^L R^M$, $S(=O)_m NR^L R^M$, $C(=O)R^P$, $C(=S)R^P$, $C(=O)NR^L R^M$, $C(=O)OR^K$, $C(=S)NR^L R^M$, $C(=S)OR^K$, $C(=S)SR^K$, $C(=NR^L)R^M$, $C(=NR^L)NR^M R^R$, $Si(R^S)_2 R^T$;

o dos sustituyentes R^9 forman, junto con los miembros del anillo G a los que están unidos, un carbociclo o heterociclo saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado de 5 o 6 miembros, cuyo carbociclo o heterociclo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^J iguales o diferentes, y en donde dicho heterociclo comprende uno o más heteroátomos O, N o S iguales o diferentes;

cada R^A es independientemente H; alquilo de C_1-C_6 , alqueno de C_2-C_6 , alquino de C_2-C_6 , alcoxi de C_1-C_6 -alquilo de C_1-C_4 , cicloalquilo de C_3-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_6 -alquilo de C_1-C_4 , cicloalcoxi de C_3-C_6 -alquilo de C_1-C_4 , cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno; alqueno de C_1-C_6 - $NR^B R^C$, alqueno de C_1-C_6 -CN; o fenilo o bencilo, en donde el anillo fenilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^F iguales o diferentes;

cada R^B es independientemente H;

alquilo de C_1-C_6 , alqueno de C_2-C_6 , alquino de C_2-C_6 , alcoxi de C_1-C_6 -alquilo de C_1-C_4 , cicloalquilo de C_3-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_6 -alquilo de C_1-C_4 , cicloalcoxi de C_3-C_6 -alquilo de C_1-C_4 , cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno;

alqueno de C_1-C_6 -CN;

fenilo y bencilo, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes R^F iguales o diferentes;

cada R^C es independientemente H; alquilo de C_1-C_6 , alqueno de C_2-C_6 , alquino de C_2-C_6 , alcoxi de C_1-C_6 -alquilo de C_1-C_4 , cicloalquilo de C_3-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_6 -alquilo de C_1-C_4 , cicloalcoxi de C_3-C_6 -alquilo de C_1-C_4 , cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno; alqueno de C_1-C_6 -CN; o fenilo o bencilo, en donde el anillo fenilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^F iguales o diferentes;

cada resto NR^{BR^C} también puede formar un heterociclo saturado de 5 a 8 miembros, unido a N, que además del átomo de nitrógeno puede tener 1 o 2 heteroátomos o restos de heteroátomos adicionales seleccionados de O, $S(=O)_m$ y $N-R'$, en donde R' es H o alquilo de C_1-C_6 , y en donde el heterociclo unido a N está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados de halógeno, alquilo de C_1-C_4 , haloalquilo de C_1-C_4 , alcoxi de C_1-C_4 y haloalcoxi de C_1-C_4 ;

cada R^O es independientemente H;

alquilo de C_1-C_6 , alqueno de C_2-C_6 , alquino de C_2-C_6 , alcoxi de C_1-C_6 -alquilo de C_1-C_4 , cicloalquilo de C_3-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_6 -alquilo de C_1-C_4 , cicloalcoxi de C_3-C_6 -alquilo de C_1-C_4 , cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno; fenilo o bencilo, en donde el anillo fenilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^F iguales o diferentes;

cada R^W es independientemente alquilo de C_1-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_6 -alquilo de C_1-C_4 , que están no sustituidos o sustituidos con halógeno; o fenilo o bencilo, en donde el anillo fenilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^F iguales o diferentes;

cada R^F es independientemente halógeno, N_3 , OH, CN, NO_2 , SCN, SF_5 ;

alquilo de C_1-C_6 , alcoxi de C_1-C_6 , alqueno de C_2-C_6 , alquino de C_2-C_6 , alcoxi de C_1-C_6 -alquilo de C_1-C_4 , alcoxi de C_1-C_6 -alcoxi de C_1-C_4 , cicloalquilo de C_3-C_6 , cicloalcoxi de C_3-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_6 -alquilo de C_1-C_4 , cicloalcoxi de C_3-C_6 -alquilo de C_1-C_4 , cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno;

cada R^G es independientemente halógeno, OH, CN, NC, NO_2 ;

alquilo de C_1-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_6 , cicloalqueno de C_3-C_6 , cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados entre halógeno, OH, CN, alcoxi de C_1-C_3 , haloalcoxi de C_1-C_3 , y alquilcarbonilo de C_1-C_3 ; un anillo o sistema de anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado de 3 a 12 miembros, en donde dicho anillo o sistema de anillo heterocíclico comprende uno o varios heteroátomos O, N o S iguales o diferentes, y está no sustituido o sustituido por uno o varios sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados entre halógeno, OH, CN, alcoxi de C_1-C_3 , haloalcoxi de C_1-C_3 y alquilcarbonilo de C_1-C_3 , y en donde dichos átomos N y S están independientemente oxidados o no oxidados;

fenilo, que está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de halógeno, OH, CN, NO_2 , alquilo de C_1-C_3 , haloalquilo de C_1-C_3 , alcoxi de C_1-C_3 , haloalcoxi de C_1-C_3 , y alquilo de C_1-C_3 -carbonilo; OR^K , SR^K , $OC(=O)R^K$, $OC(=O)OR^K$, $OC(=O)NR^L R^M$, $OC(=O)SR^K$, $OC(=S)NR^L R^M$, $OC(=S)SR^K$, $OS(=O)_m R^K$, $OS(=O)_m NR^L R^M$, $ONR^L R^M$, $ON=CR^N R^O$, $NR^L R^M$, NOR^K , $ONR^L R^M$, $N=CR^N R^O$, NNR^L , $N(R^L)C(=O)R^K$, $N(R^L)C(=O)OR^K$, $S(=O)_n R^V$, $SC(=O)SR^K$, $SC(=O)NR^L R^M$, $S(=O)_m NR^L R^M$, $C(=O)R^P$, $C(=S)R^P$, $C(=O)NR^L R^M$, $C(=O)OR^K$, $C(=S)NR^L R^M$, $C(=S)OR^K$, $C(=S)SR^K$, $C(=NR^L)R^M$, $C(=NR^L)NR^M R^R$, $Si(R^S)_2 R^T$;

cada R^H es independientemente halógeno, CN, NC, NO_2 , SCN, NCS, NCO;

alquilo de C_1-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_6 , cicloalqueno de C_3-C_6 , cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados entre halógeno, OH, CN, alcoxi de C_1-C_{10} , haloalcoxi de C_1-C_3 , y alquilcarbonilo de C_1-C_3 ; fenilo, que está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados entre halógeno, OH, CN, NO_2 , alquilo de C_1-C_3 , haloalquilo de C_1-C_3 , OR^K , SR^K , $OC(=O)R^K$, $OC(=O)OR^K$, $OC(=O)NR^L R^M$, $OC(=O)SR^K$, $OC(=S)NR^L R^M$, $OC(=S)SR^K$, $OS(=O)_m R^K$, $OS(=O)_m NR^L R^M$, $ONR^L R^M$, $ON=CR^N R^O$, $NR^L R^M$, NOR^K , $ONR^L R^M$, $N=CR^N R^O$, NNR^L , $N(R^L)C(=O)R^K$, $N(R^L)C(=O)OR^K$, $S(=O)_n R^V$, $SC(=O)SR^K$, $SC(=O)NR^L R^M$, $S(=O)_m NR^L R^M$, $C(=O)R^P$, $C(=S)R^P$, $C(=O)NR^L R^M$, $C(=O)OR^K$, $C(=S)NR^L R^M$, $C(=S)OR^K$, $C(=S)SR^K$, $C(=NR^L)R^M$, $C(=NR^L)NR^M R^R$, $Si(R^S)_2 R^T$; o dos sustituyentes gemínicos R^H forman junto con el átomo al que están unidos un grupo =O, =S, o=NR^L.

cada R^J es independientemente halógeno, CN, NC, NO_2 , SCN, NCS, NCO; alquilo de C_1-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_6 , cicloalqueno de C_3-C_6 , cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados entre halógeno, OH, CN, alcoxi de C_1-C_{10} , haloalcoxi de C_1-C_3 , y alquilcarbonilo de C_1-C_3 ; fenilo, que está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados entre halógeno, OH, CN, NO_2 , alquilo de C_1-C_3 , haloalquilo de C_1-C_3 , OR^K , SR^K , $OC(=O)R^K$, $OC(=O)OR^K$, $OC(=O)NR^L R^M$, $OC(=O)SR^K$, $OC(=S)NR^L R^M$, $OC(=S)SR^K$, $OS(=O)_m R^K$, $OS(=O)_m NR^L R^M$, $ONR^L R^M$, $ON=CR^N R^O$, $NR^L R^M$, NOR^K , $ONR^L R^M$, $N=CR^N R^O$, NNR^L , $N(R^L)C(=O)R^K$, $N(R^L)C(=O)OR^K$, $S(=O)_n R^V$, $SC(=O)SR^K$, $SC(=O)NR^L R^M$, $S(=O)_m NR^L R^M$, $C(=O)R^P$, $C(=S)R^P$, $C(=O)NR^L R^M$, $C(=O)OR^K$, $C(=S)NR^L R^M$, $C(=S)OR^K$, $C(=S)SR^K$, $C(=NR^L)R^M$, $C(=NR^L)NR^M R^R$, $Si(R^S)_2 R^T$;

cada R^K es independientemente H;

alquilo de C_1-C_6 , alqueno de C_2-C_6 , alquino de C_2-C_6 , alcoxi de C_1-C_6 -alquilo de C_1-C_4 , cicloalquilo de C_3-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_6 -alquilo de C_1-C_4 , cicloalcoxi de C_3-C_6 -alquilo de C_1-C_4 , cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados de halógeno, CN, $NR^M R^N$; $C(=O)NR^M R^N$, $C(=O)R^T$; o fenilo o bencilo, en donde el anillo fenilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^X iguales o diferentes;

cada R^L es independientemente H;

alquilo de C_1-C_6 , alqueno de C_2-C_6 , alquino de C_2-C_6 , alcoxi de C_1-C_6 -alquilo de C_1-C_4 , cicloalquilo de C_3-C_6 , cicloalquilo de C_3-C_6 -alquilo de C_1-C_4 , cicloalcoxi de C_3-C_6 -alquilo de C_1-C_4 , cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno; alqueno de C_1-C_6 -CN;

fenilo y bencilo, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes R^X iguales o diferentes;

cada R^M , R^R es independientemente H;

alquilo de C_1-C_6 , alqueno de C_2-C_6 , alquino de C_2-C_6 , alcoxi de C_1-C_6 -alquilo de C_1-C_4 , cicloalquilo de

C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cicloalcoxi de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno; alquileo de C₁-C₆-CN; o fenilo o bencilo, en donde el anillo fenilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^X iguales o diferentes; cada resto NR^MR^R o NR^LR^M también puede formar un heterociclo saturado de 5 a 8 miembros, unido a N, que además del átomo de nitrógeno puede tener 1 o 2 heteroátomos o restos de heteroátomos adicionales seleccionados de O, S(=O)_m y N-R', en donde R' es H o alquilo de C₁-C₆, y en donde el heterociclo unido a N está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados de halógeno, alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₄, alcoxi de C₁-C₄ y haloalcoxi de C₁-C₄;

cada R^N es independientemente H, halógeno, CN, NO₂, SCN;

alquilo de C₁-C₁₀, cicloalquilo de C₃-C₈, alquileo de C₂-C₆, cicloalquileo de C₃-C₆, alquileo de C₂-C₆, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con uno o más sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados entre halógeno, alquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₆, haloalquilo de C₁-C₆ y haloalcoxi C₁-C₆; un anillo o sistema de anillos heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado de 3 a 12 miembros, en donde dicho anillo o sistema de anillos heterocíclico comprende uno o varios heteroátomos iguales o diferentes O, N o S, y está no sustituido o sustituido por uno o varios sustituyentes iguales o diferentes seleccionados entre halógeno, alquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃ y haloalcoxi de C₁-C₃, y en donde dichos átomos N y S están independientemente oxidados o no oxidados; fenilo, que está no sustituido, o sustituido con uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de halógeno, alquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, haloalquilo de C₁-C₃, y haloalcoxi de C₁-C₃;

cada R^o es independientemente H, alquilo de C₁-C₄, cicloalquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₂-alquilo de C₁-C₂, fenilo o bencilo;

cada R^p es independientemente H;

alquilo de C₁-C₆, alquileo de C₂-C₆, alquileo de C₂-C₆, alcoxi de C₁-C₆-alquilo de C₁-C₄, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cicloalcoxi de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno; fenilo o bencilo, en donde el anillo fenilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^X iguales o diferentes;

cada R^s, R^t es independientemente H, alquilo de C₁-C₆, haloalquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₄-alquilo de C₁-C₄, cicloalquilo de C₃-C₆, halocicloalquilo de C₃-C₆, haloalcoxi de C₁-C₄-alquilo de C₁-C₄, o fenilo;

cada R^v es independientemente alquilo de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, que están no sustituidos o sustituidos con halógeno; o fenilo o bencilo, en donde el anillo fenilo está no sustituido o sustituido con R^x;

cada R^w es alquilo de C₁-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, que están no sustituidos o sustituidos con halógeno; o fenilo o bencilo, en donde el anillo fenilo está no sustituido o sustituido con uno o más sustituyentes R^X iguales o diferentes;

cada R^x es independientemente halógeno, N₃, OH, CN, NO₂, SCN, SF₅;

alquilo de C₁-C₆, alcoxi de C₁-C₆, alquileo de C₂-C₆, alquileo de C₂-C₆, alquileo de C₁-C₆-alquilo de C₁-C₄, alcoxi de C₁-C₆-alcoxi de C₁-C₄, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalcoxi de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cicloalcoxi de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₄, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos con halógeno;

m es 0, 1 o 2;

n es 0, 1, 2 o 3;

50 y los N-óxidos, estereoisómeros, tautómeros y sales agrícola o veterinariamente aceptables de los mismos.

2. El compuesto de fórmula (I) de conformidad con la reivindicación 1, en donde

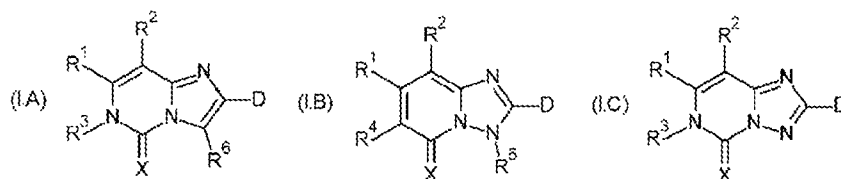
R¹ es H;

55 alquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, cuyos grupos están no sustituidos o halogenados;

R² es H, halógeno;

alquilo de C₁-C₃, alcoxi de C₁-C₃, alquileo de C₂-C₃, alquileo de C₂-C₃, cuyos grupos están no sustituidos o halogenados,

3. El compuesto de fórmula (I) de conformidad con la reivindicación 1 o 2, en donde el compuesto de fórmula (I) es un compuesto de fórmula (I.A), (I.B) o (I.C);



en donde todas las variables tienen un significado según lo definido para la fórmula (I).

5 4. El compuesto de fórmula (I-A) de conformidad con la reivindicación 3, en donde

R³ es alquilo de C₁-C₄, alquenoilo de C₂-C₄, alquinoilo de C₂-C₄, alcoxi de C₁-C₃-alquilo de C₁-C₃, cicloalquilo de C₃-C₆, cicloalquilo de C₃-C₆-alquilo de C₁-C₂, cuyos grupos están no sustituidos o halogenados; fenilo o bencilo, en cuyos grupos el anillo fenilo está no sustituido o sustituido con R^F;

10 R⁶ es H; alquilo de C₁-C₃ o haloalquilo de C₁-C₃.

5. El compuesto de fórmula (I-B) de conformidad con la reivindicación 3 o 4, en donde

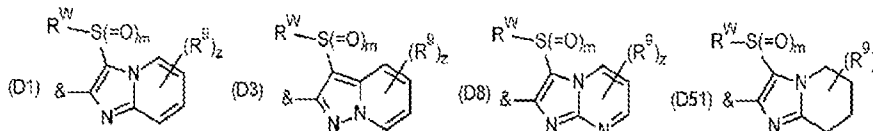
R⁴ es H; o

15 alquilo de C₁-C₃ o haloalquilo de C₁-C₃;

R⁵ es alquilo de C₁-C₃ o haloalquilo de C₁-C₃.

6. Los compuestos de fórmula (I) de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, en donde la variable D representa un anillo bicíclico fusionado de las siguientes fórmulas (D1), (D3), (D8) o (D51)

20



en donde el índice z es 0, 1, 2, 3 o 4 para (D1), (D3), (D51), o en donde z es 0, 1, 2 o 3 para (D8), y en donde las demás variables se definen como para la fórmula (I), y en donde el símbolo "&" significa la conexión con el resto de la fórmula (I).

25

7. El compuesto de fórmula (I) de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7, en donde cada R⁹ se selecciona independientemente entre H, halógeno; y alquilo de C₁-C₃, alquenoilo de C₂-C₃ y alquinoilo de C₂-C₃, cuyos grupos están no sustituidos o halogenados.

30

8. El compuesto de fórmula (I) de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7, en donde

R^W es alquilo de C₁-C₃ o haloalquilo de C₁-C₃, y
m es 0 o 2

35

9. Una mezcla pesticida que comprende el compuesto de fórmula (I), como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7, un N-óxido o una sal agrícolamente aceptable del mismo, y otro ingrediente pesticida.

10. Un uso de los compuestos de fórmula (I) de acuerdo con lo definido en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 como un pesticida agroquímico.

40

11. Un método no terapéutico para combatir o controlar plagas de invertebrados, que comprende poner en contacto dicha plaga o su suministro de alimentos, hábitat o lugares de cría con una cantidad pesticida eficaz de al menos un compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 o la composición de acuerdo con la reivindicación 9.

45

12. Un método para proteger las plantas en crecimiento del ataque o la infestación de plagas invertebradas, en donde el método comprende poner en contacto una planta, o el suelo o el agua en el que crece la planta, con una cantidad pesticida eficaz de al menos un compuesto de la fórmula (I), de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 o la composición de acuerdo con la reivindicación 9.

50

13. Una semilla que comprende un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con lo definido en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, o la composición de acuerdo con lo definido en la reivindicación 9, en una cantidad de 0,1 g a 10 kg por 100 kg de semillas.

55

14. Uso de un compuesto de la fórmula (I), como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, o de las

composiciones como se define en la reivindicación 9, para proteger las plantas en crecimiento del ataque o infestación por plagas de invertebrados.

- 5 15. Un método no terapéutico para tratar o proteger a un animal de la infestación o infección por plagas invertebradas que comprende poner en contacto al animal con una cantidad pesticida eficaz de un compuesto de la fórmula (I) como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, o una composición como se define en la reivindicación 9.