

00-30047



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

Organización de la Ley

Delegatura de propiedad Industrial

División de Nuevas Creaciones

INVENTARIO

SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

00-30047

21. EXPEDIENTE No.

54. TÍTULO compuestas flaguicidas derivadas de trazina
composiciones para el control de plagas que com-
prenden dicho compuesto y cuando menos un auxi-
lior y métodos para controlar plagas.

51. CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL

AOIN 43/907

71. SOLICITANTE

Novartis, AG

DOMICILIO

Basilea, Suiza.

74. APODERADO

Jimena Escobar Uribe

22. BOGOTÁ, D. C.,

ABRIL 26 DEL 2000.



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

DELEGATURA PROPIEDAD INDUSTRIAL

División de Nuevas Creaciones

SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

21. EXPEDIENTE No.

2000-30047

54. TITULO

COMPUESTOS PLAGUICIDAS DERIVADOS DE TRIAZINA, COMPOSICIONES PARA

EL CONTROL DE PLAGAS QUE COMPRENDEN DICHO COMPUESTO Y CUANDO MENOS

UN AUXILIAR Y METODOS PARA CONTROLAR PLAGAS.

51. CLASIFICACION INTERNACIONAL

A01N 43/707

71. SOLICITANTE

NOVARTIS AG

DOMICILIO

BASILEA, SUIZA

74. APODERADO

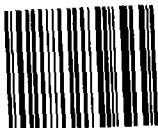
JIMENA ESCOBAR URIBE

22. SANTAFE DE BOGOTA, D.C.

ABRIL 26 DEL 2000

01

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA



00 30047

ICITU
ENTE
ENCK

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

Radicación : 00030047 00000000

Folios: 139

Fecha (AMD): 2000-04-26 16:27:29

Trámite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 411 PRESENTAC
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

DATOS DEL SOLICITANTE

(71) Nombres y Apellidos o Razón Social NOVARTIS AG

No. de Identificación

Representante Legal (Persona Jurídica)

País de Domicilio

SUIZA

Departamento o Estado

Dirección

Ciudad

BASILEA

Teléfono

(74) DATOS DEL APODERADO

Nombre

JIMENA ESCOBAR URIBE

Dirección y Domicilio

CRA. 11A No. 94-76, OFICINA 305

Ciudad

SANTAFÉ DE BOGOTÁ

Teléfono 6 162051/61

DATOS DEL INVENTOR

(72) Nombre del Inventor (es)

1. Dr. ARTHUR STEIGER 2. WERNER ZAMBACH 3. ANDRÉ JEANGUENAT
4. Dr. MARTIN EBERLE 5. STEPHAN TRAH 6. Dr. SALEEM FAROOQ.

Identificación

Dirección

1. ARLESHEIM, SUIZA 2. BÄTTWIL, SUIZA 3. BASILEA, SUIZA 4.
BÖTTMINGEN, SUIZA 5. FREIBURG, ALEMANIA 6. ARISDORF, SUIZA.

Ciudad

Teléfono

DATOS DE LA PATENTE DE INVENCION

(54) Título de la Invención COMPUESTOS PLAGUICIDAS DERIVADOS DE TRIAZINA, COMPOSICIONES PARA EL
CONTROL DE PLAGAS QUE COMPRENDE DICHO COMPUESTO Y CUANDO MENOS UN
AUXILIAR Y METODOS PARA CONTROLAR PLAGAS.

PRIORIDAD REIVINDICADA:

SÍ ☒

NO

TIPO DE PRIORIDAD:

ANDINA ☐

UNIONISTA ☒

(33) País SUIZA

Fecha MAYO 4, 1999

(31) No. Solicitud 832/99

Para publicar a los



6 meses



12 meses



18 meses a partir de la fecha de la presente solicitud

(51) CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL

C 07

2333/P

RESUMEN CON EL OBJETO Y LA FINALIDAD DE LA INVENCION

La presente invención se refiere a compuestos plaguicidas derivados de tiazina, en forma libre o en forma de sal agroquímicamente aceptable adecuados especialmente en el control de plagas en agricultura y en artículos almacenados y también en el cuidado de animales domésticos.

ANEXOS DE LA SOLICITUD

Certificado de existencia y Representación Legal cuando el solicitante sea Persona Jurídica No. 17.398	☒
Los poderes debidamente otorgados, o mención de su protocolización ante la SIC No. 17.398	☒
Recibo de la tasa respectiva No. 20,974	☒
Recibo de la tasa por concepto de excedente de palabras en la publicación	☐
Si se reivindica prioridad Andina:	
Copia de la primera solicitud	☐
Traducción oficial	☐
Si se reivindica prioridad Unionista:	
Copia certificada de la primera solicitud:	
Nota: Debe presentarse dentro de los tres (3) meses, contados a partir de la fecha de radicación de la solicitud posterior	
Traducción simple	☐
Capítulo descriptivo	☒
Dibujos planos necesarios	☐
Capítulo reivindicatorio	☒
Tarjeta archivo propiedad según formato	☒
Tarjeta archivo temático según formato	☒
Extracto para publicación según formato	☒
Arte final 12 x 12 cms Y 6x6 cms	☐
Otros documentos	☐

SOLICITO LA CONCESIÓN DE LA PATENTE DE INVENCION Y DECLARO QUE LA INVENCION ES NUEVA Y DE MI PROPIEDAD

FIRMA
NOMBRE


JIMENA ESCOBAR URIBE

C.C. 39.778.452 Usaquén.

T.P. No. 68.228



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

NIT : 800176089-2

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

Radicación : 00030047 00000000

Folios: 139

Fecha (AMD): 2000-04-26 16:27:29

Trámite : 002 PATENTES D 1 REGISTRO/ 411 PRESENTAC

Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 20,974
FECHA : MARZO 30 DE 2000

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	SUCURSAL	CUENTA	Nº. PAGO	Vr. PAGO
ESCOBAR URIBE ASOCIADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	BOGOTA	050-00024-9	2245618	10,800,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01	SOLICITUDES	
1		TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	608,000.00
		TOTAL :	\$ 608,000.00

SON: SEISCIENTOS OCHO MIL PESOS

RESPONSABLE :

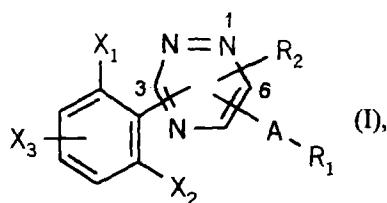


RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No.

Carrera 13 No. 27-00 Pisos 5 y 10
Conmutador: 334 12 21
Fax: 281 31 25
Santa Fe de Bogotá, D.C., Colombia

DERIVADOS DE TRIAZINA PLAGUICIDAS

La presente invención se refiere a un compuesto de la
5 fórmula:



en donde:

R₁ es arilo o heteroarilo insustituido o mono- a pen-
10 ta-sustituido, seleccionándose los sustituyentes de los anillos
de arilo y heteroarilo a partir del grupo que consiste en:

OH, halógeno, CN, NO₂, alquilo de 1 a 6 átomos de
carbono, cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, cicloalqueni-
lo de 3 a 8 átomos de carbono opcionalmente sustituido, alquilo
15 de 1 a 6 átomos de carbono-cicloalquilo de 3 a 8 átomos de car-
bono, cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono-alquilo de 1 a 6
átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, ha-
locicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 6
átomos de carbono, cicloalcoxilo de 3 a 8 átomos de carbono,
20 haloalcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, halocicloalcoxilo de 3
a 8 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono,
ciclotioalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, halotioalquilo de 1

a 6 átomos de carbono, halociclotioalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilsulfinilo de 3 a 8 átomos de carbono, haloalquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, halocicloalquilsulfinilo de 3 a 8 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilsulfonilo de 3 a 8 átomos de carbono, haloalquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, halocicloalquilsulfonilo de 3 a 8 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 8 átomos de carbono opcionalmente sustituido, alquinilo de 2 a 8 átomos de carbono opcionalmente sustituido, alquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono- $C(=NOR_6)$, $-P(=O)(O\text{-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono})_2$, R_7 ,

fenilo insustituido o mono- a penta-sustituido, heteroarilo insustituido o mono- a penta-sustituido; en donde los sustituyentes de los radicales de fenilo y heteroarilo se seleccionan a partir del grupo que consiste en OH, halógeno, CN, NO_2 , alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 8 átomos de carbono opcionalmente sustituido, alquinilo de 2 a 8 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, cicloalquenilo de 3 a 8 átomos de carbono opcionalmente sustituido, haloalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halocicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalcoxilo de 3 a 8 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, halocicloalcoxilo de 3 a 8 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, ciclotioalquilo de 3

a 8 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halociclotioalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilsulfinilo de 3 a 8 átomos de carbono, haloalquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, halocicloalquilsulfinilo de 3 a 8 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilsulfonilo de 3 a 8 átomos de carbono, haloalquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, halocicloalquilsulfonilo de 3 a 8 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 8 átomos de carbono, que está insustituido o sustituido, alquinilo de 2 a 8 átomos de carbono, que está insustituido o sustituido, alquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, $-CH(=NOR_6)$, $-C(\text{alquilo de 1 a 6 átomos de carbono})(=NOR_6)$, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono $-C(=NOR_6)$, $-CHO$, $-C(=O)-\text{alquilo de 1 a 6 átomos de carbono}$, y R_7 ;

fenoxilo insustituido o mono- a penta-sustituido;
tiofenilo insustituido o mono- a penta-sustituido;
fenilamino insustituido o mono- a penta-sustituido; y
fenil-(alquilo de 1 a 6 átomos de carbono)-amino insustituido o mono- a penta-sustituido;

seleccionándose los sustituyentes de los grupos fenoxilo, tiofenilo, fenilamino, y fenil-(alquilo de 1 a 6 átomos de carbono)-amino a partir del grupo que consiste en halógeno, CN , NO_2 , alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halocicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, alcóxido de 1 a 6

átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalcoxilo de 3 a 8 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, ciclotioalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, y halociclotioalquilo de 3 a 8 átomos de carbono;

R_2 es H, OH, halógeno, CN, NO_2 , alquilo de 1 a 6 átomos de carbono opcionalmente sustituido, alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halocicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, -NH-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, SH, ó CH_2-NO_2 ;

A es un solo enlace, alquilenos de 1 a 12 átomos de carbono, O, O(alquilenos de 1 a 12 átomos de carbono), $S(O)_n$, $S(O)_n$ (alquilenos de 1 a 12 átomos de carbono), alquénileno de 2 a 8 átomos de carbono, alquínileno de 2 a 8 átomos de carbono; NR_3 , ó NR_3 (alquilenos de 1 a 12 átomos de carbono);

R_3 es H, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquénilo de 2 a 8 átomos de carbono, alquínilo de

2 a 8 átomos de carbono, arilalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, $(CH_2)_pC(O)R_4$ ó alcóxido de 1 a 6 átomos de carbono-alquilo de 2 a 6 átomos de carbono;

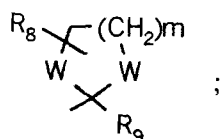
R_4 es H, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcóxido de 1 a 6 átomos de carbono, $N(R_5)_2$, ó alcóxido de 1 a 6 átomos de carbono-alquilo de 2 a 6 átomos de carbono;

R_5 es H, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, ó arilo-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono;

R_6 es H, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, o $-C(=O)-R_5$;

R_7 es:

15



R_8 y R_9 son cada uno, independientemente del otro, H, o alquilo de 1 a 6 átomos de carbono;

X_1 es R_{10} ;

20 X_2 y X_3 son cada uno independientemente del otro, H ó R_{10} ;

R_{10} es halógeno, CN, NO_2 , alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, haloalquilo

de 1 a 6 átomos de carbono, halocicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalcoxilo de 3 a 8 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, halocicloalcoxilo de 3 a 8 átomos de carbono, tialquilo de 1 a 6 átomos de carbono, ciclotioalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, o halociclotioalquilo de 3 a 8 átomos de carbono;

m es 1, 2, 3, ó 4;

n es 0, 1, ó 2; y

10 W es O ó S;

con la condición de que el radical $A-R_1$ y el grupo fenilo sustituido por X_1 , X_2 , y X_3 , no estén en la posición vicinal unos en relación con los otros sobre el anillo de triazina,

15 con la condición adicional, de que X_1 no sea CH_3 , Cl, ó F, cuando X_2 y X_3 sean H, A sea un solo enlace, R_1 sea fenilo, 2-fluorofenilo, p-fluorofenilo, ó 3-clorofenilo, y R_2 sea H, Cl, ó NHC_2H_5 ;

y con la excepción de 3,6-di-(2-clorofenil)-5-hidroxi-1,2,4-triazina, y

20 con la excepción de 3-(2-metilfenil)-6-(4-metilfenil)-5-trifluorometil-1,2,4-triazina; y a compuestos de adición fisiológicamente tolerables y agroquímicamente aceptables del mismo, y en donde sea apropiado, a isómeros E/Z, a mezclas de isómeros E/Z, y/o a tautó-

meros, en cada caso en forma libre o en forma de sal;

a un proceso para la preparación de estos compuestos, y a su uso, a composiciones plaguicidas en donde el ingrediente activo se selecciona a partir de estos compuestos, en cada caso
5 en forma libre o en forma de sal agroquímicamente aceptable, y a un proceso para la fabricación de estas composiciones y a su uso.

Se prefieren los compuestos de la fórmula (I), en donde:

10 R_1 es arilo o heteroarilo insustituido o mono- a penta-sustituido, en donde los sustituyentes se seleccionan a partir del grupo que consiste en OH, halógeno, CN, NO₂, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono-cicloalquilo de 3 a 8
15 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halocicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, alcóxilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalcóxilo de 3 a 8 átomos de carbono, haloalcóxilo de 1 a 6 átomos de carbono, halo-
20 cicloalcóxilo de 3 a 8 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, ciclotioalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halociclotioalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilsulfinilo de 3 a 8 átomos de carbono, haloalquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, halocicloal-

25

quilsulfinilo de 3 a 8 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilsulfonilo de 3 a 8 átomos de carbono, haloalquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, halocicloalquilsulfonilo de 3 a 8 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 8 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 8 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono-C(=NOR₆), R₇, es fenilo insustituido o mono- a penta-sustituido, en donde los sustituyentes se seleccionan a partir del grupo que consiste en OH, halógeno, CN, NO₂, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halocicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalcoxilo de 3 a 8 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, halocicloalcoxilo de 3 a 8 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, ciclotioalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halociclotioalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilsulfinilo de 3 a 8 átomos de carbono, haloalquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, halocicloalquilsulfinilo de 3 a 8 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilsulfonilo de 3 a 8 átomos de carbono, haloalquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, halocicloalquilsulfonilo de 3 a 8 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 8 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 8 átomos de carbono, alquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono,

mos de carbono, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono- $C(=NOR_5)$ y R_7 ; es fenoxilo insustituido o mono- a penta-sustituido, es tiofenilo insustituido o mono- a penta-sustituido, es fenilamino insustituido o mono- a penta-sustituido, y es fenil-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono)-amino insustituido o mono- a penta-sustituido, en donde los sustituyentes se seleccionan a partir del grupo que consiste en halógeno, CN, NO_2 , alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halocicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, alcóxilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalcóxilo de 3 a 8 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, ciclotioalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halociclotioalquilo de 3 a 8 átomos de carbono;

R_2 es H, halógeno, CN, NO_2 , alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, o halocicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono;

A es $(CR_{11}R_{12})_p$, $O(CR_{11}R_{12})_p$, $S(O)_n(CR_{11}R_{12})_p$, alquenileno de 2 a 8 átomos de carbono insustituido o sustituido, alquini-leno de 2 a 8 átomos de carbono insustituido o sustituido, en donde los sustituyentes se seleccionan a partir del grupo que consiste en R_{11} y R_{12} ; o $NR_3(CH_2)_p$;

R_3 es H, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 6 átomos

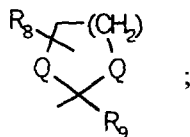
de carbono, alqueno de 2 a 8 átomos de carbono, alquino de 2 a 8 átomos de carbono, arilalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, $(\text{CH}_2)_p\text{C}(\text{O})\text{R}_4$ ó alcóxido de 1 a 6 átomos de carbono-alquilo de 2 a 6 átomos de carbono;

5 R_4 es H, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcóxido de 1 a 6 átomos de carbono, $\text{N}(\text{R}_5)_2$, o alcóxido de 1 a 6 átomos de carbono-alquilo de 2 a 6 átomos de carbono;

10 R_5 es H, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, o arilalquilo de 1 a 6 átomos de carbono;

R_6 es H, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, o cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono;

15 R_7 es:



R_8 y R_9 son cada uno independientemente del otro, H o alquilo de 1 a 6 átomos de carbono;

20 X_1 es R_{10} ;

X_2 y X_3 son cada uno independientemente el otro, H ó R_{10} ;

R_{10} es halógeno, CN, NO_2 , alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, haloalquilo

de 1 a 6 átomos de carbono, halocicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalcoxilo de 3 a 8 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, halocicloalcoxilo de 3 a 8 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, ciclotioalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, o halociclotioalquilo de 3 a 8 átomos de carbono;

R_{11} y R_{12} son cada uno independientemente del otro, H o alquilo de 1 a 6 átomos de carbono;

10

m es 1, 2, 3, ó 4;

n es 0, 1, ó 2;

p es 0, 1, 2, 3, 4, 5, ó 6; y

Q es O ó S.

15

En la literatura se proponen ciertos derivados de 1,2,4-triazina como ingredientes activos en composiciones para controlar plagas en animales domésticos y ganado productor, y en cultivos de plantas útiles. Sin embargo, las propiedades biológicas de estos compuestos conocidos no son enteramente satisfactorias en el campo del control de plagas, por cuya razón, existe una necesidad de proporcionar compuestos adicionales que tengan propiedades plaguicidas, resolviéndose ese problema de acuerdo con la invención mediante la provisión de los presentes compuestos de la formula (I).

25

Debido a que contienen cuando menos tres centros bá-

sicos, los compuestos de la fórmula (I) pueden estar en la forma de sales, o pueden formar, por ejemplo, sales de adición de ácido. Las últimas se forman, por ejemplo, con ácidos inorgánicos fuertes, tales como ácido minerales, por ejemplo ácido sulfúrico, un ácido fosfórico, o un ácido halohídrico, con ácidos carboxílicos orgánicos fuertes, tales como ácidos alcancarboxílicos de 1 a 4 átomos de carbono insustituídos o sustituidos, por ejemplo sustituidos por halógeno, por ejemplo ácido acético, ácidos dicarboxílicos saturados o insaturados, por ejemplo ácido oxálico, malónico, maleico, fumárico, o ftálico, ácido hidroxicarboxílicos, por ejemplo ácido ascórbico, láctico, málico, tartárico, o cítrico, o ácido benzoico, o con ácidos sulfónicos orgánicos, tales como ácidos alcan- o aril-sulfónicos de 1 a 4 átomos de carbono insustituídos o sustituidos, por ejemplo sustituidos por halógeno, por ejemplo ácido metan- ó p-toluen-sulfónico. Anteriormente en la presente y más adelante en la presente, cualquier referencia a los compuestos libres de la fórmula (I) o a sus sales, se debe entender para incluir también a las sales correspondientes de los compuestos libres de la fórmula (I), respectivamente, según sea apropiado y conveniente, prefiriéndose la forma libre.

Los términos generales utilizados anteriormente en la presente y más adelante en la presente, tienen los significados dados más adelante, a menos que se definan de otra manera.

A menos que se definan de otra manera, los grupos y

compuestos que contienen carbono, cada uno contienen de 1 hasta e incluyendo 6, de preferencia de 1 hasta e incluyendo 4, más especialmente 1 ó 2 átomos de carbono.

Arilo es fenilo o naftilo.

5 Heteroarilo es especialmente piridilo, pirimidilo, S-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, tienilo, furanilo, pirrilo, pirazolilo, imidazolilo, tiazolilo, triazolilo, oxazolilo, tiadiazolilo, oxadiazolilo, benzotienilo, benzofuranilo, benzotiazolilo, indolilo, o indazolilo, que de preferencia están enlazados por medio de un átomo de carbono; se prefieren tiazolilo, 10 benzofuranilo, benzotiazolilo, o indolilo, especialmente tiazolilo o indolilo.

Halógeno - tanto como un grupo por sí mismo y como un elemento estructural de otros grupos y compuestos, tales como 15 haloalquilo, haloalcoxilo, y halotioalquilo - es flúor, cloro, bromo, o yodo, especialmente flúor, cloro, o bromo, más especialmente flúor o cloro.

Alquilo - tanto como un grupo por sí mismo y como un elemento estructural de otros grupos y compuestos, tales como 20 haloalquilo, alcoxilo, y tioalquilo - es, en cada caso dando una debida consideración al número de átomos de carbono contenidos en el grupo o compuesto en cuestión, de cadena recta, es decir, metilo, etilo, propilo, butilo, pentilo, hexilo, heptilo, u octilo, o ramificada, por ejemplo isopropilo, isobutilo, 25 sec-butilo, terbutilo, isopentilo, neopentilo, o isohexilo.

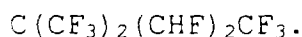
Cicloalquilo - tanto como un grupo por sí mismo y como un elemento estructural de otros grupos y compuestos, tales como halocicloalquilo, cicloalcoxilo, y ciclotioalquilo - es, en cada caso dando una debida consideración al número de átomos de carbono contenidos en el grupo o compuesto en cuestión, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo, ó ciclo-octilo.

Alquenilo - tanto como un grupo por sí mismo y como un elemento estructural de otros grupos y compuestos - es, en cada caso dando una debida consideración al número de átomos de carbono, y a los dobles enlaces conjugados o aislados contenidos en el grupo o compuesto en cuestión, de cadena recta, por ejemplo alilo, 2-butenilo, 3-pentenilo, 1-hexenilo, 1-heptenilo, 1,3-hexadienilo, ó 1,3-octadienilo, o ramificada, por ejemplo isopropenilo, isobutenilo, isoprenilo, terpentilo, isohexenilo, isoheptenilo, ó iso-octenilo.

Alquinilo - tanto como un grupo por sí mismo y como un elemento estructural de otros grupos y compuestos - es, en cada caso dando una debida consideración al número de átomos de carbono, y a los dobles enlaces conjugados o aislados contenidos en el grupo o compuesto en cuestión, de cadena recta, por ejemplo propargilo, 2-butinilo, 3-pentinilo, 1-hexinilo, 1-heptinilo, 3-hexen-1-inilo, ó 1,5-heptadien-3-inilo, o ramificada, por ejemplo 3-metilbut-1-inilo, 4-etilpent-1-inilo, 4-metilhex-2-inilo, ó 2-metilhept-3-inilo.

Alquilenos, alquilenos, y alquilenos son miembros de
puente de cadena recta o ramificada, especialmente $-\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2-$
 CH_2- , $\text{CH}(\text{CH}_3)-$, $-\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{CH}_2-\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_2-\text{CH}_2-$,
 $-\text{CH}=\text{CH}-$, $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-$, $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-$, $-\text{C}\equiv\text{C}-$, y $-\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{C}-$; más
5 especialmente $-\text{CH}_2-$.

Los grupos y compuestos que contienen carbono susti-
tuido por halógeno, tales como haloalquilo, haloalcoxilo, y
halotioalquilo, pueden estar parcialmente halogenados o per-
halogenados, siendo los sustituyentes de halógeno en el caso de
10 una polihalogenación iguales o diferentes. Los ejemplos de
haloalquilo - tanto como un grupo por sí mismo y como un ele-
mento estructural de otros grupos y compuestos, tales como
haloalcoxilo y halotioalquilo - son metilo sustituido de 1 a 3
veces por flúor, cloro, y/o bromo, tal como CHF_2 ó CF_3 ; etilo
15 sustituido de 1 a 5 veces por flúor, cloro, y/o bromo, tal como
 CH_2CF_3 , CF_2CF_3 , CF_2CCl_3 , CF_2CHCl_2 , CF_2CHF_2 , CF_2CFCl_2 , CF_2CHBr_2 ,
 CF_2CHClF , CF_2CHBrF , ó CClFCHClF ; propilo o isopropilo sustitui-
do de 1 a 7 veces por flúor, cloro, y/o bromo, tal como
 $\text{CH}_2\text{CHBrCH}_2\text{Br}$, $\text{CF}_2\text{CHF}_2\text{CF}_3$, $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$ ó $\text{CH}(\text{CF}_3)_2$; butilo o un isómero
20 del mismo, sustituido de 1 a 9 veces por flúor, cloro, y/o bro-
mo, tal como $\text{CF}(\text{CF}_3)\text{CHF}_2\text{CF}_3$ ó $\text{CH}_2(\text{CF}_2)_2\text{CF}_3$; pentilo o un isómero
del mismo, sustituido de 1 a 11 veces por flúor, cloro, y/o
bromo, tal como $\text{CF}(\text{CF}_3)(\text{CHF})_2\text{CF}_3$ ó $\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$; y hexilo o un
isómero del mismo, sustituido de 1 a 13 veces por flúor, cloro,
25 y/o bromo, tal como $(\text{CH}_2)_4\text{CHBrCH}_2\text{Br}$, $\text{CF}_2(\text{CHF})_4\text{CF}_3$, $\text{CH}_2(\text{CF}_2)_4\text{CF}_3$, ó



Los radicales opcionalmente sustituidos, tales como, por ejemplo, alquenilo de 2 a 8 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 8 átomos de carbono, cicloalquenilo de 3 a 8 átomos de carbono, o alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, de preferencia están sustituidos con OH, CN, nitro, halógeno, alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, fenilo, halogenfenilo, fenoxilo, NHR_3 , $-\text{C}(=\text{O})\text{NH}_2$, $-\text{C}(=\text{O})\text{O}$ -alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, y $-\text{C}(=\text{O})$ -alquilo de 1 a 6 átomos de carbono.

Las modalidades preferidas dentro del alcance de la invención, tomando en cuenta las condiciones mencionadas anteriormente, son un compuesto de la fórmula (I):

(1) en donde R_1 es un anillo de arilo o heteroarilo insustituido o mono- a tri-sustituido, seleccionándose los sustituyentes a partir del grupo que consiste en OH, halógeno, CN, NO_2 , alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono, cicloalquenilo de 5 a 6 átomos de carbono opcionalmente sustituido, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halo-

tioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 6 átomos de carbono opcionalmente sustituido, alquinilo de 2 a 6 átomos de carbono opcionalmente sustituido, alquilcarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, fenilo insustituido o mono- a penta-sustituido, seleccionándose los sustituyentes a partir del grupo que consiste en OH, halógeno, CN, NO₂, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcóxido de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcóxido de 1 a 4 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 6 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 6 átomos de carbono, y alquilcarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, y fenóxido insustituido o mono- a penta-sustituido, o fenilamino insustituido o mono- a penta-sustituido, seleccionándose los sustituyentes del grupo fenóxido y fenilamino a partir del grupo que consiste en halógeno, CN, NO₂, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcóxido de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcóxido de 1 a 4 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfinilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilsulfinilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilsulfonilo de 1

a 4 átomos de carbono, y halotioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono;

especialmente fenilo mono- ó di-sustituido, seleccionándose los sustituyentes a partir del grupo que consiste en
5 halógeno, CN, NO₂, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono, fenilo insustituido o mono- ó di-sustituido, seleccionándose los sustituyentes de este fenilo a partir del grupo que consiste en halógeno,
10 geno, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, y halotioalquilo de 1 a 2 átomos de carbono; y fenoxilo;

15 más especialmente fenilo mono- ó di-sustituido, seleccionándose los sustituyentes a partir del grupo que consiste en halógeno, metilo, halometilo, metoxilo, halometoxilo, fenilo insustituido ó mono- ó di-sustituido, seleccionándose los sustituyentes a partir del grupo que consiste en halógeno, metilo,
20 halometilo, metoxilo, halometoxilo, tiometilo, y halotiometilo; y fenoxilo;

especialmente en donde R₁ es un anillo de fenilo, el cual están mono- sustituido por fenilo mono- ó di-sustituido, que de preferencia está en la posición 4, seleccionándose los
25 sustituyentes sobre el radical de fenilo mencionado a partir

del grupo que consiste en halógeno, metilo, trifluorometilo, metoxilo, trifluorometoxilo, tiometilo, y trifluorotiomatilo;

(2) en donde R_2 es H, halógeno, o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, especialmente H o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, más especialmente H;

(3) un compuesto de la fórmula (I), en donde:

A es un solo enlace, alquilenio de 1 a 4 átomos de carbono, O, OCH_2 , alquilenio de 2 a 4 átomos de carbono, alquilenio de 2 a 4 átomos de carbono, ó NR_3 , especialmente un solo enlace, O, OCH_2 , $C\equiv C$, $CH=CH$, ó NH, más especialmente un solo enlace;

(4) en donde R_3 es H, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, o haloalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, especialmente H o alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, más especialmente H o alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, especialmente H;

(5) en donde X_1 es halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, o halotioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono; especialmente halógeno, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono, o haloalcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono; más especialmente flúor, cloro, metilo, trifluorometilo, o metoxilo, especialmente flúor o cloro, más especialmente flúor;

(6) en donde X_2 es H, halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, tioal-
5 quilo de 1 a 4 átomos de carbono, o halotioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono; especialmente H, halógeno, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono, o haloalcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono; más especialmente flúor, cloro, metilo, tri-
10 fluorometilo, o metoxilo, especialmente flúor o cloro, más especialmente flúor;

(7) en donde X_3 es H, halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, tioal-
15 quilo de 1 a 4 átomos de carbono, o halotioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono; especialmente H, halógeno, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono, o haloalcoxilo de 1 a
20 2 átomos de carbono; más especialmente flúor, cloro, metilo, trifluorometilo, o metoxilo, especialmente H, flúor, o cloro, de preferencia H;

(8) en donde el grupo fenilo sustituido por X_1 , X_2 , y X_3 está en la posición 3 sobre el anillo de triazina;

25 (9) en donde R_1 es un anillo de arilo o heteroarilo

insustituido o mono- a tri-sustituido, seleccionándose los sustituyentes a partir del grupo que consiste en OH, halógeno, CN, NO₂, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono, cicloalquenilo de 5 a 6 átomos de carbono
5 opcionalmente sustituido, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halo-
tioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 6 átomos de carbono opcionalmente susti-
10 tuido, alquinilo de 2 a 6 átomos de carbono opcionalmente sustituido, alquilcarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, fenilo insustituido o mono- a penta-sustituido, seleccionándose los sustituyentes a partir del grupo que consiste en OH, halógeno, CN,
15 NO₂, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 4 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halotioal-
quilo de 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono, haloalquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono,
20 alquenilo de 2 a 6 átomos de carbono, alquinilo de 2 a 6 átomos de carbono, y alquilcarbonilo de 1 a 4 átomos de carbono, fenoxilo insustituido o mono- a penta-sustituido, y fenilamino insustituido o mono- a penta-sustituido, seleccionándose los
25 sustituyentes a partir del grupo que consiste en halógeno, CN,

NO₂, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 6
O, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, alcóxido de 1 a 4
átomos de carbono, haloalcóxido de 1 a 4 átomos de carbono,
tioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 4
5 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono,
y haloalquilsulfonilo de 1 a 4 átomos de carbono;

R₂ es H, halógeno, o alquilo de 1 a 4 átomos de car-
bono;

A es un solo enlace, alquilenio de 1 a 6 átomos de
10 carbono, o(alquilenio de 1 a 6 átomos de carbono), alquénico
de 2 a 4 átomos de carbono, alquínico de 2 a 4 átomos de car-
bono, o NR₃;

R₃ es H, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, o ha-
loalquilo de 1 a 6 átomos de carbono;

15 X₁ es halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono,
cicloalquilo de 3 a 6 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4
átomos de carbono, alcóxido de 1 a 4 átomos de carbono, haloal-
cóxido de 1 a 4 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 4 átomos
de carbono, o halotioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono;

20 X₂ y X₃ son cada uno independientemente del otro, H,
halógeno, alquilo de 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo de 3
a 6 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 4 átomos de carbono,
alcóxido de 1 a 4 átomos de carbono, haloalcóxido de 1 a 4 áto-
mos de carbono, tioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono, o halo-
25 tioalquilo de 1 a 4 átomos de carbono; y

el grupo fenilo sustituido por X_1 , X_2 , y X_3 está en la posición 3 sobre el anillo de triazina;

(11) en donde R_1 es fenilo mono- ó di-sustituido, seleccionándose los sustituyentes a partir del grupo que consiste en halógeno, CN, NO_2 , alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono, fenilo insustituido o mono- ó di-sustituido, seleccionándose los sustituyentes a partir del grupo que consiste en halógeno, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, y halotioalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, y fenoxilo;

R_2 es H o alquilo de 1 a 4 átomos de carbono;

A es un solo enlace, O, OCH_2 , $C \equiv C$; $CH=CH$ ó NH;

X_1 es halógeno, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono, o haloalcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono;

X_2 y X_3 son cada uno independientemente del otro, H, halógeno, alquilo de 1 a 2 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 2 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono, o haloalcoxilo de 1 a 2 átomos de carbono; y

el grupo fenilo sustituido por X_1 , X_2 , y X_3 están en la posición 3 sobre el anillo de triazina;

(12) en donde R_1 es fenilo mono- ó di-sustituido, se-

leccionándose los sustituyentes a partir del grupo que consiste en halógeno, metilo, halometilo, metoxilo, halometoxilo, fenilo insustituido o mono- ó di-sustituido, seleccionándose los sustituyentes a partir del grupo que consiste en halógeno, metilo, halometilo, metoxilo, halometoxilo, tiometilo, y halometiometilo; y fenoxilo;

R_2 es H;

A es un solo enlace;

X_1 es flúor, cloro, metilo, trifluorometilo, o metoxilo;

X_2 y X_3 son cada uno independientemente del otro, H, flúor, cloro, metilo, trifluorometilo, o metoxilo; y

el grupo fenilo sustituido por X_1 , X_2 , y X_3 está en la posición 3 sobre el anillo de triazina;

incluyendo en cada caso los compuestos de adición fisiológicamente tolerables.

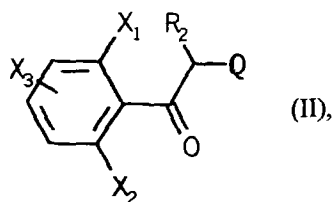
(13) en donde el grupo A- R_1 está en la posición 6 sobre el anillo de triazina.

Dentro del alcance de la invención, se da preferencia especialmente a los compuestos de la fórmula (I) mencionados en las Tablas 1 a 6, y más especialmente a los compuestos de la fórmula (I) mencionados en los Ejemplos de Síntesis.

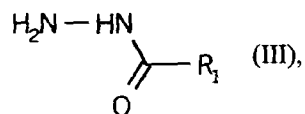
La invención también se refiere a un proceso para la preparación de los compuestos de la fórmula (I), en cada caso en forma libre o en forma de sal, el cual comprende, por ejem-

plo,

a) para la preparación de un compuesto de la fórmula (I), en donde A es un solo enlace, y el grupo fenilo sustituido por X_1 , X_2 , y X_3 está en la posición 6 sobre el anillo de triazina, hacer reaccionar un compuesto de la fórmula:



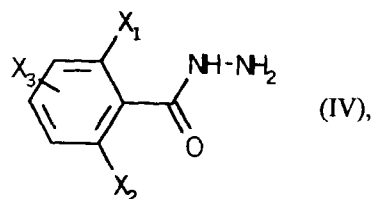
el cual es conocido o se puede preparar de una manera análoga a los compuestos conocidos correspondientes, y en donde X_1 , X_2 , X_3 , y R_2 son como se definen para la fórmula (I), y Q es un grupo saliente, con dos equivalentes de un compuesto de la fórmula:



el cual es conocido o se puede preparar de una manera análoga a los compuestos conocidos correspondientes, y en donde R_1 es como se define para la fórmula (I), opcionalmente en la presencia de un catalizador, de preferencia acetato de plata, o

b) para la preparación de un compuesto de la fórmula (I), en donde A es un solo enlace, y el grupo fenilo sustituido por X_1 , X_2 , y X_3 está en la posición 3 sobre el anillo de

triazina, hacer reaccionar dos equivalentes de un compuesto de la fórmula:



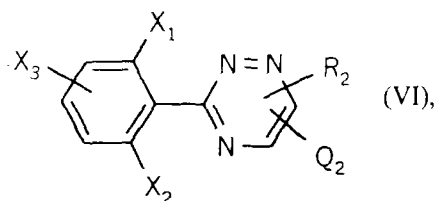
5 el cual es conocido o se puede preparar de una manera análoga a los compuestos conocidos correspondientes, y en donde X_1 , X_2 , y X_3 son como se definen para la fórmula (I), con un equivalente de un compuesto de la fórmula:



el cual es conocido o se puede preparar de una manera análoga a los compuestos conocidos correspondientes, y en donde R_1 y R_2 son como se definen para la fórmula (I), y Q_1 es un grupo saliente, opcionalmente en la presencia de un catalizador, de preferencia acetato de plata, o

15

c) para la preparación de un compuesto de la fórmula (I), en donde A tiene los significados definidos para la fórmula (I), con la excepción de un solo enlace, hacer reaccionar un compuesto de la fórmula:

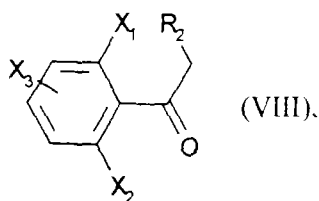


el cual es conocido o se puede preparar de una manera
análoga a los compuestos conocidos correspondientes, y en donde
 X_1 , X_2 , X_3 , y R_2 son como se definen para la fórmula (I), y Q_2
5 es un grupo saliente, con un compuesto de la fórmula:



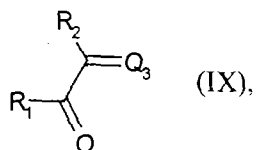
el cual es conocido o se puede preparar de una manera análoga a
los compuestos conocidos correspondientes, y en donde R_1 es co-
10 mo se define para la fórmula (I), y A tiene los significados
definidos para la fórmula (I), con la excepción de S(O),
S(C)(alquileo de 1 a 12 átomos de carbono), S(O)₂, y
S(C)₂(alquileo de 1 a 12 átomos de carbono), y M es hidrógeno,
un metal de transición o un metal alcalino, y cuando A es S ó
15 S(alquileo de 1 a 12 átomos de carbono), si se desea, se oxida
el producto resultante, opcionalmente después de un aislamiento
intermedio, para la preparación de un compuesto de la fórmula
(I), en donde A es S(O), S(O)(alquileo de 1 a 12 átomos de
carbono), S(O)₂, ó S(O)₂(alquileo de 1 a 12 átomos de carbo-
20 no, ó

d) para la preparación de un compuesto de la fórmula
la (I) en donde A es un solo enlace, oxidar un compuesto de la
fórmula:

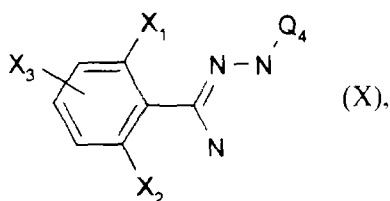


el cual es conocido o se puede preparar de una manera análoga a los compuestos conocidos correspondientes, y en donde X_1 , X_2 , X_3 , y R_2 son como se definen para la fórmula (I), con un agente oxidante, y hacer reaccionar el producto resultante, opcionalmente después del aislamiento intermedio, con un compuesto de la fórmula (III), y hacer reaccionar el producto resultante, opcionalmente después de un aislamiento intermedio, con una sal de amonio, de preferencia acetato de amonio, o

e) para la preparación de un compuesto de la fórmula (I), en donde el grupo fenilo sustituido por X_1 , X_2 , y X_3 está en la posición 3 sobre el anillo de triazina, hacer reaccionar un compuesto de la fórmula:



el cual es conocido o se puede preparar de una manera análoga a los compuestos conocidos correspondientes, y en donde R_1 y R_2 son como se definen para la fórmula (I), y Q_3 es O ó NOH, con un compuesto de la fórmula:



el cual es conocido o se puede preparar de una manera
 análoga a los compuestos conocidos correspondientes, y en donde X_1 ,
 X_2 , y X_3 son como se definen para la fórmula (I), y Q_4 es H, o un
 5 grupo protector capaz de removerse, en forma libre o en forma de sal,
 o

f) para la preparación de un compuesto de la fórmula
 (I), en donde A es alquileo de 1 a 12 átomos de carbono, alquenileno
 de 2 a 8 átomos de carbono, o alquinileno de 2 a 8 átomos de carbono,
 10 hacer reaccionar un compuesto de la fórmula (VI), el cual es conocido
 o se puede preparar de una manera análoga a los compuestos conocidos
 correspondientes, y en donde X_1 , X_2 , X_3 , y R_2 son como se definen para
 la fórmula (I), y Q_2 es alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, de
 preferencia metilo, con un compuesto de la fórmula:

15

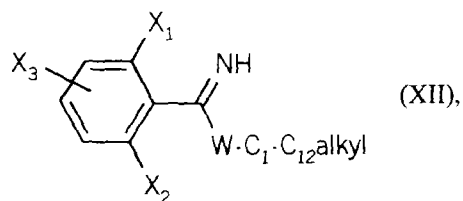
R_1 -alquilo de 1 a 10 átomos de carbono-CHO (XI),

el cual es conocido o se puede preparar de una manera
 análoga a los compuestos conocidos correspondientes, y en donde R_1 es
 como se define para la fórmula (I), opcionalmente en la presencia de
 20 un catalizador de base fuerte, de preferencia die-

tilamida de litio o litio butílico, y deshidratar el producto resultante, opcionalmente después del aislamiento intermedio, opcionalmente en la presencia de un ácido fuerte, y si se desea, para la preparación de un compuesto de la fórmula (I), en donde A es alquileo de 1 a 12 átomos de carbono, realizar la hidrogenación en la presencia de un catalizador de hidrogenación, y para la preparación de un compuesto de la fórmula (I), en donde A es alquinileno de 2 a 8 átomos de carbono, realizar la reacción con un halógeno y luego con una base fuerte, de preferencia NaOH; ó

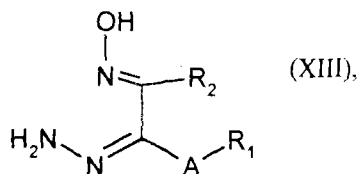
g) para la preparación de un compuesto de la fórmula (I), en donde el anillo de fenilo sustituido por los sustituyentes X en la posición 3, y AR₁ está en la posición 6, hacer reaccionar un compuesto de la fórmula:

15



el cual es conocido o se puede preparar de una manera análoga a los compuestos conocidos correspondientes, y en donde X₁, X₂, y X₃ son como se definen para la fórmula (I), y W es O ó S, o una sal del mismo, con un compuesto de la fórmula:

20



el cual es conocido o se puede preparar de una manera análoga a los compuestos conocidos correspondientes, y en donde A, R₁, y R₂ son como se definen para la fórmula (I);

5 y en cada caso, si se desea, convertir un compuesto de la fórmula (I), en cada caso en forma libre o en forma de sal, que se pueda obtener de acuerdo con el proceso o mediante otro método, en un compuesto diferente de la fórmula (I), separar una mezcla de isómeros que se pueda obtener de acuerdo con
10 el proceso, y aislar el isómero deseado, y/o convertir un compuesto libre de la fórmula (I) que se pueda obtener de acuerdo con el proceso, en una sal, o convertir una sal de un compuesto de la fórmula (I) que se pueda obtener de acuerdo con el proceso, en el compuesto libre de la fórmula (I) o en una sal diferente.
15

Los comentarios hechos anteriormente en relación con las sales de los compuestos de la fórmula (I) se aplican de una manera análoga, con respecto a su sales, a los materiales de partida mencionados anteriormente en la presente y más adelante
20 en la presente.

En los pasos del proceso individuales, los reactivos se pueden hacer reaccionar unos con otros como tales, es decir, sin la adición de un solvente o diluyente, por ejemplo en el

estado fundido. En general, sin embargo, es conveniente agregar un solvente o diluyente inerte o una mezcla de los mismos.

Variante a):

5 Los ejemplos de los solventes y diluyentes incluyen: hidrocarburos aromáticos, alifáticos, y alicíclicos, e hidrocarburos halogenados, tales como benceno, tolueno, xileno, mesitileno, tetralina, clorobenceno, diclorobenceno, bromobenceno, éter de petróleo, hexano, ciclohexano, diclorometano, tri-
10 clorometano, tetraclorometano, dicloroetano, tricloroetano, y tetracloroetano; éteres, tales como dietiléter, dipropiléter, di-isopropiléter, dibutiléter, terbutilmetiléter, monometiléter de etilenglicol, monoetiléter de etilenglicol, dimetiléter de etilenglicol, dimetoxidietiléter, tetrahidrofurano, y dioxano;
15 cetonas, tales como acetona, metiletilcetona, y metilisobutilcetona; alcoholes, tales como metanol, etanol, propanol, isopropanol, butanol, etilenglicol, y glicerol; amidas, tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dietilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilpirrolidona, y triamida de ácido hexa-
20 metilfosfórico; nitrilos, tales como acetonitrilo y propionitrilo; y sulfóxidos, tales como sulfóxido de dimetilo.

Los grupos salientes preferidos son halógenos, tosilatos, mesilatos, y triflatos, especialmente halógenos, más especialmente cloro.

25 La reacción convenientemente se efectúa en una escala

de temperatura de aproximadamente 0°C a aproximadamente +150°C, de preferencia de aproximadamente 20°C a aproximadamente +100°C.

En una modalidad preferida de la variante a), se hace reaccionar un compuesto de la fórmula (II) con un compuesto de la fórmula (III) de aproximadamente 50°C a aproximadamente 100°C, de preferencia a aproximadamente 85°C, en un éter, de preferencia dimetiléter de etilenglicol, en la presencia de un catalizador, de preferencia acetato de plata.

10

Variante b) :

Los ejemplos de los solventes y diluyentes se dan bajo la variante a).

Los grupos salientes preferidos son halógenos, tosilatos, mesilatos, y triflatos, especialmente halógenos, más especialmente cloro.

La reacción convenientemente se efectúa en una escala de temperatura de aproximadamente 0°C a aproximadamente +150°C, de preferencia de aproximadamente 20°C a aproximadamente +100°C.

En una modalidad preferida de la variante b), se hace reaccionar un compuesto de la fórmula (IV) con un compuesto de la fórmula (V) de aproximadamente 50°C a aproximadamente 100°C, de preferencia a aproximadamente 85°C, en un éter, de preferencia dimetiléter de etilenglicol, en la presencia de un catali-

25

zador, de preferencia acetato de plata.

Variante c):

Los ejemplos de los solventes y diluyentes se dan bajo la variante a).

Los grupos salientes preferidos son OH, halógenos, tosilatos, mesilatos, y triflatos, especialmente halógenos, más especialmente bromo y cloro.

La reacción convenientemente se efectúa en una escala de temperatura de aproximadamente 0°C a aproximadamente +150°C, de preferencia de aproximadamente 20°C a aproximadamente +100°C.

En una modalidad preferida de la variante c), se hace reaccionar un compuesto de la fórmula (VI) con un compuesto de la fórmula (VII) de aproximadamente 0°C a aproximadamente 100°C, de preferencia a aproximadamente 20°C, en un solvente inerte, opcionalmente en la presencia de una base como catalizador.

20

Variante d):

Los ejemplos de los solventes y diluyentes se dan bajo la variante a).

Los agentes oxidantes preferidos son halógenos, más especialmente bromo.

Las reacciones convenientemente se efectúan en una escala de temperatura de aproximadamente 0°C a aproximadamente +120°C, de preferencia de aproximadamente 0°C a aproximadamente +80°C.

5 En una modalidad preferida de la variante d), un compuesto de la fórmula (VIII) se oxida con bromo de aproximadamente 0°C a aproximadamente 100°C, de preferencia a aproximadamente 80°C, en un solvente polar, de preferencia sulfóxido de dimetilo/agua, y luego, después del aislamiento del intermedio
10 del compuesto de diceto resultante, se hace reaccionar con un compuesto de la fórmula (III) de aproximadamente 0°C a aproximadamente 60°C, de preferencia a aproximadamente 20°C, en un solvente polar, de preferencia un alcohol, y luego, de preferencia sin aislamiento intermedio, se hace reaccionar con acetato de amonio de aproximadamente 0°C a aproximadamente 120°C,
15 de preferencia a aproximadamente 100°C, en un solvente polar, de preferencia ácido acético glacial.

Variante e):

20 Los ejemplos de los solventes y diluyentes se dan bajo la variante a).

Los grupos protectores preferidos son alcóxicarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono.

Las reacciones convenientemente se efectúan en una
25 escala de temperatura de aproximadamente 0°C a aproximadamente

+150°C, de preferencia de aproximadamente 0°C a aproximadamente +120°C.

En una modalidad preferida de la variante e), un compuesto de la fórmula (IX) se hace reaccionar con un compuesto
5 de la fórmula (X) de aproximadamente 0°C a aproximadamente 100°C, de preferencia a aproximadamente 20°C, en un alcohol, de preferencia etanol, o en una mezcla de etanol/agua, opcionalmente en la presencia de un catalizador ácido, de preferencia ácido fórmico.

10

Variante f):

Los ejemplos de los solventes y diluyentes se dan bajo la variante a).

Las reacciones convenientemente se efectúan en una
15 escala de temperatura aproximadamente -80°C a aproximadamente +150°C, de preferencia de aproximadamente 0°C a aproximadamente +110°C.

En una modalidad preferida de la variante f), un compuesto de la fórmula (VI), en donde Q₂ es metilo, se hace reaccionar con un aldehído de la fórmula (XI), de aproximadamente
20 -80°C a aproximadamente 0°C, de preferencia a aproximadamente -70°C, en un solvente no polar, de preferencia tetrahidrofurano, en la presencia de una base fuerte, de preferencia litio n-butilico, y luego, de preferencia después del aislamiento intermedio,
25 se hace reaccionar con un ácido fuerte, de preferen-

cia ácido toluensulfónico, de aproximadamente 80°C a aproximadamente 150°C, de preferencia a la temperatura de ebullición del solvente, en un solvente no polar, de preferencia tolueno.

5 Variante g):

Los ejemplos de los solventes y diluyentes se dan bajo la variante a); son especialmente adecuados los alcoholes, tales como metanol, etanol, y propanol normal, y también las amidas, tales como dimetilformamida y dimetilacetamida.

10 Las reacciones convenientemente se efectúa en una escala de temperatura de aproximadamente la temperatura ambiente hasta el punto de ebullición del solvente utilizado, de preferencia de aproximadamente 60°C a aproximadamente +100°C.

En una modalidad preferida de la variante g), un compuesto de la fórmula (XII), en donde W es S, se hace reaccionar
15 con un compuesto de la fórmula (XIII), de aproximadamente 25°C a aproximadamente 100°C, de preferencia a aproximadamente 100°C, en un alcohol, de preferencia en propanol normal.

Las sales de los compuestos de la fórmula (I) se pueden preparar de una manera conocida por sí misma. Por ejemplo,
20 las sales de adición de ácido de los compuestos de la fórmula (I) se obtienen mediante el tratamiento con un ácido adecuado, o un reactivo de intercambio de iones adecuado, y las sales con bases mediante el tratamiento con una base adecuada o un reactivo de intercambio de iones adecuado.
25

Las sales de los compuestos de la fórmula (I) se pueden convertir en los compuestos libres de la fórmula (I) de la manera acostumbrada; las sales de adición de ácido, por ejemplo, mediante el tratamiento con un agente básico adecuado, o un reactivo de intercambio de iones adecuado, y las sales con bases, por ejemplo, mediante el tratamiento con un ácido adecuado, o un reactivo de intercambio de iones adecuado.

Las sales de los compuestos de la fórmula (I) se pueden convertir de una manera conocida por sí misma en otras sales de los compuestos de la fórmula (I); las sales de adición de ácido se pueden convertir, por ejemplo, en otras sales de adición de ácido, por ejemplo mediante el tratamiento de una sal de un ácido inorgánico, tal como un clorhidrato, con una sal de metal adecuada, tal como una sal de sodio, bario, o plata, de un ácido, por ejemplo con acetato de plata, en un solvente adecuado en donde sea insoluble una sal inorgánica que forme, por ejemplo, cloruro de plata, y por lo tanto, se precipite de la mezcla de reacción.

Dependiendo de procedimiento y de las condiciones de reacción, los compuestos de la fórmula (I) que tienen propiedades formadoras de sal se pueden obtener en forma libre o en la forma de sales.

Los compuestos de la fórmula (I) también se pueden obtener en la forma de solvatos, especialmente en la forma de sus hidratos.

La invención se refiere a todas aquellas formas del proceso en donde un compuesto que se pueda obtener como compuesto de partida o intermediario en cualquier etapa del proceso, se utiliza como material de partida, y se realizan todos o algunos de los pasos restantes, o se puede utilizar un material de partida en la forma de un derivado o sal, o especialmente, se forma bajo las condiciones de la reacción.

En el proceso de la presente invención, es preferible utilizar aquellos materiales de partida e intermediarios que den como resultado los compuestos de la fórmula (I) descritos al principio como especialmente valiosos.

La invención se refiere especialmente a los procesos descritos en los Ejemplos de Preparación.

La invención también se refiere a materiales de partida novedosos y a intermediarios, en cada caso en forma libre o en forma de sal, utilizados de acuerdo con la invención para la preparación de los compuestos de la fórmula (I) y sus sales, a su uso, y a procesos para su preparación.

En el área del control de plagas, los compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la invención, son ingredientes activos que exhiben una valiosa actividad preventiva y/o curativa con un espectro biocida muy conveniente, inclusive en bajos índices de concentración, mientras que son bien tolerados por los animales de sangre caliente, los peces, y las plantas. Los ingredientes activos de acuerdo con la invención son efec-

tivos contra todas las etapas de desarrollo individuales de las plagas animales normalmente sensibles, pero también de las plagas animales resistentes, tales como insectos y representantes de la orden *Acarina*. La acción insecticida, ovicida, y/o acaricida de los ingredientes activos de acuerdo con la invención, se puede manifestar directamente, es decir, en la mortalidad de las plagas, que se presenta inmediatamente o sólo después de algún tiempo, por ejemplo durante la muda o de sus huevos, o indirectamente, por ejemplo, en un índice reducido de oviposición y/o eclosión, correspondiendo la buena actividad a una mortalidad de cuando menos el 50 al 60 por ciento.

Estas plagas animales incluyen, por ejemplo, aquéllas mencionadas en la Solicitud de Patente Europea Número EP-A-736,252. Las plagas enlistadas en la misma, por consiguiente, se incluyen como referencia en el asunto objeto de la presente invención;

los representantes de la orden *Acarina* son especialmente:

Acarus siro, *Aceria sheldoni*, *Aculus schlechtendali*, *Amblyomma* spp., *Argas* spp., *Boophilus* spp., *Brevipalpus* spp., *Bryobia praetiosa*, *Calipitrimerus* spp., *Chorioptes* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Eotetranychus carpini*, *Eriophyes* spp., *Hyalomma* spp., *Iodes* spp., *Olygonychus pratensis*, *Ornithodoros* spp., *Panonychus* spp., *Phyllocoptruta oleivora*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Psoroptes* spp., *Rhipicephalus* spp., *Rhizoglyphus* spp., *Sarcop-*

tes spp., *Tarsonemus spp.* y *Tetranychus spp.*

Los compuestos de acuerdo con la invención se pueden utilizar para controlar, es decir, inhibir o destruir, plagas del tipo mencionado que se presentan especialmente en plantas, más especialmente en plantas útiles y ornamentales en agricultura, en horticultura, y el silvicultura, o en las partes de estas plantas, tales como las frutas, los retoños, las hojas, los tallos, los tubérculos, o las raíces, mientras que en algunos casos, todavía se protegen contra estas plagas las partes de las plantas que crezcan posteriormente.

Los cultivos objetivo incluyen tanto cultivos naturales como cultivos que se hayan modificado mediante métodos de reproducción o genéticos, especialmente cereales, tales como trigo, cebada, centeno, avena, arroz, maíz, y sorgo; remolacha, tal como remolacha azucarera y remolacha forrajera; fruta, por ejemplo pomelos, fruta dura y fruta blanda, tal como manzanas, peras, ciruelas, duraznos, almendras, cerezas, y bayas, por ejemplo fresas, frambuesas, y zarzamoras; plantas leguminosas, tales como frijoles, lentejas, chícharos, y frijoles de soya; plantas de aceite, tales como colza, mostaza, amapola, olivos, girasoles, coco, aceite de ricino, cacao y cacahuates; cucurbitáceas, tales como calabacines, pepinos, y melones; plantas de fibra, tales como algodón, lino, cáñamo, y yute; frutas cítricas, tales como naranjas, limones, toronjas, y mandarinas; verduras, tales como espinaca, lechuga, espárrago, coles, zanaho-

rias, cebollas, jitomates, papas, y paprika; lauráceas, tales como aguacate, canela, y alcanfor; y tabaco, nueces, café, berenjenas, caña de azúcar, té, pimienta, vides, lúpulos, plátanos, plantas de hule natural, y ornamentales.

5 Los compuestos de acuerdo con la invención son especialmente adecuados para controlar insectos y representantes de la orden *Acarina*, especialmente insectos que se alimentan destruyendo las plantas, tales como *Anthonomus grandis*, *Diabrotica balteata*, larvas de *Heliothis virescens*, *Plutella xylostella*, y
10 larvas de *Spodoptera littoralis*, y ácaros-araña, tales como *Tetranychus spp.*, en cultivos de algodón, fruta, cítricos, maíz, frijol de soya, colza, y verduras.

Otras áreas de uso de los compuestos de acuerdo con la invención son la protección de los artículos y suministros
15 almacenados, y del material, y también en el sector de higiene, especialmente en la protección de animales de sangre caliente, incluyendo animales de granja, tales como vacas, cerdos, ovejas, y cabras, aves de corral, tales como gallinas, pavos, y gansos, animales criados por su piel, tales como mink, zorras,
20 chinchillas, conejos y similares, y también animales domésticos y mascotas, tales como gatos y perros, e inclusive seres humanos, contra las plagas del tipo mencionado.

Por ejemplo, la infestación de pulgas en animales domésticos y en mascotas es un problema para el propietario del
25 animal para el que todavía se han encontrado soluciones sola-

mente insatisfactorias. Debido al complicado ciclo de vida de la pulga, ninguno de los métodos conocidos para controlar pulgas es totalmente satisfactorio, especialmente debido a que la mayoría de los métodos conocidos se dirigen principalmente al control de las pulgas completamente crecidas en el pelo, y no toman en cuenta todas las diferentes etapas juveniles de las pulgas, que viven no solamente en el pelo del animal, sino también en el piso, en las alfombras, en el lugar donde duerme el animal, en las sillas, en el jardín, y en todos los demás lugares con los que entra en contacto el animal infestado. El tratamiento de pulgas es en general costoso, y se debe continuar durante un período prolongado, lográndose el éxito solamente en general cuando el tratamiento se aplica no solamente al animal afectado, por ejemplo el perro o el gato, sino también simultáneamente a cualesquiera lugares frecuentados por el animal afectado.

Los compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la invención, se pueden utilizar solos o en combinación con otros biocidas. Por ejemplo, con el objeto de incrementar el efecto, se pueden combinar con plaguicidas que tengan la misma dirección de acción, o con el objeto de ampliar el espectro de acción, se pueden combinar con sustancias que tengan una dirección diferente de acción. Cuando se desee extender el espectro de acción hasta endoparásitos, por ejemplo gusanos, los compuestos de la fórmula (I) convenientemente se combinan con sus-

tancias que tengan propiedades endoparasitocidas. Por supuesto, también se pueden utilizar en combinación con agentes antibacterianos. Debido a que los compuestos de la fórmula (I) son "adulticidas", es decir, son efectivos especialmente contra las etapas completamente crecidas de los parásitos objetivo, la adición de plaguicidas que sean más efectivos contra las etapas juveniles del parásito puede ser muy conveniente, debido a que, de esta manera, se alcanzará todo el espectro de población de parásitos, y además, se hace una contribución sustancial para evitar el desarrollo de resistencia.

La buena actividad plaguicida de los compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la invención corresponde a una mortalidad de cuando menos el 50 al 60 por ciento de las plagas mencionadas.

La acción de los compuestos de acuerdo con la invención, y las composiciones que los comprenden, contra las plagas animales, se puede ampliar de una manera significativa, y se puede adaptar a las circunstancias dadas mediante la adición de otros insecticidas y/o acaricidas. Los aditivos adecuados incluyen, por ejemplo, representantes de las siguientes clases de ingredientes activos: compuestos de organofósforo, nitrofenoles y derivados, formamidas, ureas, carbamatos, piretroides, hidrocarburos clorados, y preparaciones de *Bacillus thuringiensis*.

Los compuestos de la fórmula (I) se utilizan en una

forma no modificada, o de preferencia junto con los auxiliares convencionalmente empleados en la tecnología de la formulación, y por consiguiente, se pueden formular de una manera conocida, por ejemplo en concentrados emulsionables, soluciones directamente rociables o diluibles, emulsiones diluidas, polvos humectables, polvos solubles, polvos secos, gránulos, y también encapsulaciones en sustancias poliméricas.

Las formulaciones, es decir, las composiciones, preparaciones, o mezclas que comprenden al compuesto (ingrediente activo) de la fórmula (I), o una combinación de ese ingrediente activo con otros ingredientes activos agroquímicos, y según sea apropiado, un auxiliar sólido o líquido, se preparan de una manera conocida, por ejemplo mediante mezcla homogénea y/o molienda de los ingredientes activos con extensores, por ejemplo con solventes, vehículos sólidos, y opcionalmente compuestos de actividad superficial (tensoactivos), y la invención también se refiere a los mismos.

La invención también se refiere a los métodos de aplicación de las composiciones, es decir, los métodos para controlar plagas del tipo mencionado, tales como rociado, atomización, espolvoreo, recubrimiento, revestimiento, dispersión, o riego, que se seleccionan de acuerdo con los objetivos pretendidos y las circunstancias prevalecientes, y al uso de las composiciones para controlar plagas del tipo mencionado. Los índices de concentración típicos son de 0.1 a 1,000 ppm, de

preferencia de 0.1 a 500 ppm del ingrediente activo. Las concentraciones de aplicación por hectárea son en general de 1 a 2,000 gramos de ingrediente activo por hectárea, especialmente de 10 a 1,000 gramos por hectárea, de preferencia de 20 a 600
5 gramos por hectárea.

Un método de aplicación preferido en el área de la protección de plantas, es la aplicación al follaje de las plantas (aplicación foliar), dependiendo la frecuencia y la concentración de la aplicación del riesgo de infestación por la plaga
10 en cuestión. Sin embargo, el ingrediente activo también puede penetrar en las plantas a través de las raíces (acción sistémica), mediante la impregnación del lugar de las plantas con una formulación líquida, o mediante la incorporación del ingrediente activo en forma sólida en el lugar de las plantas, por ejemplo
15 en la tierra, por ejemplo en forma granular (aplicación a la tierra). En el caso de los cultivos de arroz inundados, estos gránulos se pueden aplicar en cantidades medidas al campo de arroz inundado.

Los agentes de protección de cultivos de la invención
20 también son adecuados para proteger al material reproductivo vegetativo, por ejemplo semillas, tales como frutas, tubérculos, o granos, o plántulas, de las plagas animales. El material reproductivo se puede tratar con la composición antes del inicio del cultivo, por ejemplo, revistiéndose las semillas antes de sembrarse. Los ingredientes activos de la invención también

se pueden aplicar a semillas (recubrimiento), remojando las semillas en una composición líquida, o recubriéndolas con una composición sólida. La composición también se puede dar cuando se introduce el material reproductivo al lugar de cultivo, por ejemplo cuando se siembran las semillas en el surco de semillas. Los procedimientos de tratamiento para el material reproductivo vegetativo, y el material reproductivo vegetativo así tratado, son objetos adicionales de la invención.

Como auxiliares de formulación se utilizan, por ejemplo, vehículos sólidos, solventes, estabilizantes, auxiliares de "liberación lenta", tintes, y opcionalmente sustancias de actividad superficial (tensoactivos). Los vehículos y auxiliares adecuados incluyen todas aquellas sustancias que se utilizan por costumbre en las composiciones de protección de las plantas. Los auxiliares adecuados, tales como solventes, vehículos sólidos, compuestos de actividad superficial, tensoactivos no iónicos, tensoactivos catiónicos, tensoactivos aniónicos, y otros auxiliares en las composiciones utilizadas de acuerdo con la invención, incluyen, por ejemplo, las descritas en la Patente Europea Número EP-A-736,252; se incluyen como referencia en el asunto objeto de la presente invención.

Los tensoactivos aniónicos adecuados incluyen los denominados jabones solubles en agua, y compuestos de actividad superficial sintéticos solubles en agua.

Los jabones adecuados son las sales de metal alcali-

no, sales de metal alcalinotérreo, o sales de amonio insustituido o sustituido de ácidos grasos superiores (de 10 a 22 átomos de carbono), por ejemplo, las sales sódica o potásica de ácido oleico o esteárico, o de mezclas de ácidos grasos naturales, que se pueden obtener, por ejemplo, a partir de aceite de coco o de aceite de sebo. También se puede hacer mención de las sales de metiltaurina de ácido graso como tensoactivos.

Sin embargo, con más frecuencia se utilizan los denominados tensoactivos sintéticos, como se mencionan en la Patente Europea Número EP-A-736,252, especialmente sulfonatos grasos, sulfatos grasos, derivados de bencimidazol sulfonatados, y sulfonatos de alquilarilo.

Los compuestos de la fórmula (I) se distinguen, entre otras cosas, también por su excelente actividad contra las pulgas, no solamente aniquilándose rápidamente las pulgas adultas, sino también, mediante una ruta en circuito, las etapas juveniles de las pulgas. Las larvas de pulgas que eclosionan de los huevos de pulga se alimentan sustancialmente de la excreción de las pulgas adultas. Debido a que los compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la invención aniquilan a las pulgas adultas muy rápidamente, falta la excreción necesaria, y se priva a las etapas juveniles del medio nutriente, de modo que perecen antes de alcanzar la etapa adulta.

Por consiguiente, la presente invención se refiere de preferencia a un método para controlar parásitos en seres huma-

nos, animales domésticos, ganado productor y mascotas, en donde se administra una cantidad efectiva de una composición que comprende cuando menos un compuesto de la fórmula (I), o una sal fisiológicamente tolerable del mismo, de una manera sistémica, o de preferencia tópicamente al animal de sangre caliente.

La acción de largo plazo se logra mediante los compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la invención con diferentes formas de administración, por ejemplo, mediante la administración del ingrediente activo en una forma formulada externamente o internamente al animal que se vaya a tratar. "Formulada" en este caso significa, por ejemplo, en la forma de un polvo, una tableta, o gránulos, en liposomas o una cápsula, en la forma de una emulsión, una espuma, o un rociado, en una forma microencapsulada, o en una forma vertida o aplicada. Se entenderá que todas las composiciones oralmente administrables comprenden, en adición a las sustancias de formulación acostumbradas, aditivos adicionales que alientan al animal huésped a tomar la composición oralmente de una manera voluntaria, por ejemplo odorantes y saborizantes adecuados.

La administración percutánea, por ejemplo mediante inyección subcutánea o intramuscular, o como una preparación de depósito en la forma de un implante, y la aplicación tópica, por ejemplo en la forma vertida o aplicada, representan objetos preferidos de esta invención, tomando en cuenta que son fáciles de realizar. Un modo de administración adicional es la adminis-

tración oral, por ejemplo, en la forma de una tableta. Las formas de administración percutánea y tópica son de interés particular, y dan excelentes resultados.

Las formas de administración percutánea incluyen, por ejemplo, administración subcutánea, intramuscular, e inclusive intravenosa de las formas inyectables. En adición a las jeringas acostumbradas con agujas, también es posible utilizar dispositivos de jeringa de alta presión sin aguja.

Las formulaciones vertidas y aplicadas son especialmente preferidas como formas tópicas de administración, pero también puede ser conveniente la administración en la forma de rociados, ungüentos, soluciones, o polvos.

Mediante la selección de una formulación adecuada, es posible mejorar la capacidad de los ingredientes activos para penetrar en el tejido vivo del animal huésped, y/o para mantener su disponibilidad. Esto es importante cuando, por ejemplo, se utilizan ingredientes activos más escasamente solubles, cuya baja solubilidad requiera de un medio para mejorar la solubilidad, debido a que, en estos casos, el fluido corporal del animal puede disolver solamente pequeñas cantidades de los ingredientes activos a la vez.

Además, con el objeto de obtener una liberación fuertemente demorada del ingrediente activo, también puede estar presente un compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con la invención en una formulación de matriz que impida físicamente que

el ingrediente activo se libere y se excrete prematuramente, y mantenga la biodisponibilidad del ingrediente activo. Esta formulación de matriz se inyecta en el cuerpo, por ejemplo intramuscularmente o subcutáneamente, y permanece allí como una forma de depósito desde donde se libera continuamente el ingrediente activo. Estas formulaciones de matriz son conocidas para una persona experta en la materia. En general son sustancias semisólidas de tipo de cera, por ejemplo ceras vegetales y polietilenglicoles que tienen un alto peso molecular, o formulaciones poliméricas sólidas, por ejemplo las denominadas microesferas.

La velocidad de liberación del ingrediente activo desde el implante, y por lo tanto, el período de tiempo durante el cual el implante exhibe una acción, generalmente es de terminada por la precisión con la que se haya calibrado el implante (cantidad de ingrediente activo en el implante), el medio ambiente alrededor del implante, y la formulación polimérica a partir de la cual se haya hecho el implante.

La administración de aditivos medicinales veterinarios al alimento para animales es bien conocida en el campo de la salud animal. Es usual preparar primero una denominada premezcla, en donde se dispersa el ingrediente activo en un líquido, o está en una forma finamente dividida en portadores sólidos. Esa premezcla normalmente puede comprender de aproximadamente 1 a 800 miligramos del compuesto por kilogramo de premez-

cla, dependiendo de la concentración final deseada en el alimento.

Debido a que los compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la invención se pueden hidrolizar con los constituyentes del alimento, se deben formular en una matriz protectora, por ejemplo, en
5 gelatina, antes de agregarse a la premezcla.

La presente invención, de acuerdo con lo anterior, también se refiere al aspecto de controlar parásitos mediante la administración al animal huésped, con su alimento, de un compuesto de la fórmula (I) que se haya protegido contra la hidrólisis.

10 Un compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con la invención, convenientemente se administra en una dosis de 0.01 a 800 miligramos/kilogramo, de preferencia de 0.1 a 200 miligramos/kilogramo, especialmente de 0.5 a 30 miligramos/kilogramo de peso del cuerpo, basándose en el animal huésped.

15 Una buena dosis que se puede administrar rutinariamente al animal huésped, es de 0.5 a 100 miligramos/kilogramo, especialmente de 0.1 a 40 miligramos/kilogramo de peso del cuerpo. La administración se efectúa a intervalos adecuados, dependiendo del modo de administración y del peso del cuerpo.

20 La dosis total puede variar de una especie de animal a otra, y también dentro de una especie de animal para el mismo ingrediente activo, debido a que depende, entre otras cosas,

del peso, de la edad, y de la constitución del animal huésped.

Cuando se utiliza de acuerdo con la invención, el compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con la invención, normalmente se administrará no en forma pura, sino, de preferen-
5 cia, en la forma de una composición que comprenda, en adición al ingrediente activo, constituyentes que asistan a la administración, siendo los constituyentes adecuados aquellos que sean tolerados por el animal huésped. Por supuesto, es posible, así como controlar los parásitos adultos de acuerdo con la inven-
10 ción, utilizar adicionalmente métodos convencionales para controlar las etapas juveniles de las pulgas, aunque ésto último no es absolutamente esencial.

Estas composiciones que se van a administrar de acuerdo con la invención, generalmente comprenden del 0.1 al 99
15 por ciento, especialmente del 0.1 al 95 por ciento en peso de un compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con la invención, y del 99.9 al 1 por ciento en peso, especialmente del 99.9 al 5 por ciento en peso de un vehículo sólido o líquido fisiológicamente tolerable, incluyendo del 0 al 25 por ciento en peso, es-
20 pecialmente del 0.1 al 25 por ciento en peso de un dispersante no tóxico.

Aunque los productos comerciales de preferencia se formularán como concentrados, el usuario final normalmente empleará formulaciones diluidas.

25 Estas formulaciones también pueden comprender auxi-

liares adicionales, tales como estabilizantes, antiespumantes, reguladores de viscosidad, aglutinantes y viscosantes, así como otros ingredientes activos para obtener efectos especiales.

Los vehículos fisiológicamente tolerables conocidos
5 de la práctica medicinal veterinaria para administración oral, percutánea, y tópica, se pueden utilizar como auxiliares de formulación. En seguida se dan algunos ejemplos.

Los vehículos adecuados son especialmente rellenos, tales como azúcares, por ejemplo lactosa, sacarosa, manitol, o
10 sorbitol, preparaciones de celulosa, y/o fosfatos de calcio, por ejemplo trifosfato de calcio, o fosfato ácido de calcio, y aglutinantes, tales como pastas de almidón utilizando, por ejemplo, almidón de maíz, de trigo, de arroz, o de papa, gelatina, tragacanto, metilcelulosa, y/o, si se desea, desintegrantes,
15 tales como los almidones anteriormente mencionados, también almidón de carboximetilo, polivinilpirrolidona reticulada, ágar, ácido algínico o una sal del mismo, tal como alginato de sodio. Los auxiliares son especialmente acondicionadores de flujo y lubricantes, por ejemplo ácido silícico, talco, ácido
20 esteárico o sales del mismo, tales como estearato de magnesio o de calcio, y/o polietilenglicol. A los núcleos de grageas se les pueden proporcionar recubrimientos adecuados, opcionalmente entéricos, utilizándose, entre otras cosas, soluciones de azúcar concentradas, que pueden comprender goma arábiga, talco,
25 polivinilpirrolidona, polietilenglicol, y/o dióxido de titanio,

o soluciones de recubrimiento en solventes orgánicos adecuados o mezclas de solventes, o, para la preparación de recubrimientos entéricos, soluciones de preparaciones de celulosa adecuadas, tales como ftalato de acetilcelulosa o ftalato de hidroxipropilmetilcelulosa. Se pueden agregar tintes, saborizantes, o pigmentos a las tabletas o a los recubrimientos de grageas, por ejemplo, para propósitos de identificación, o para indicar diferentes dosis del ingrediente activo.

Las preparaciones oralmente administrables son cápsulas de gelatina dura, y también cápsulas selladas blandas hechas de gelatina y un plastificante, tal como glicerol o sorbitol. Las cápsulas de gelatina dura pueden comprender al ingrediente activo en la forma de gránulos, por ejemplo mezclado con rellenos, tales como lactosa, aglutinantes, tales como almidones, y/o abrillantadores, tales como talco o estearato de magnesio, y si se desea, estabilizantes. En cápsulas blandas, el ingrediente activo de preferencia se disuelve o se suspende en líquidos adecuados, tales como aceites grasos, aceite de parafina, o polietilenglicoles líquidos, a los que de la misma manera se pueden haber agregado estabilizantes. Se da preferencia, entre otras cosas, a las cápsulas, las cuales se pueden morder fácilmente o tragar sin masticarse.

El método vertido o aplicado comprende aplicar el compuesto de la fórmula (I) a un área localmente definida de la piel o del pelo, convenientemente sobre la parte posterior del

cuello o el lomo del animal. Esto se realiza, por ejemplo, mediante la aplicación de un cotonete o rocío de la formulación vertida o aplicada a un área relativamente pequeña del pelo, desde donde se llega a distribuir el ingrediente activo sobre un área amplia del pelo casi automáticamente como un resultado de los constituyentes extensores de la formulación asistida por los movimientos del animal.

Las formulaciones vertidas o aplicadas convenientemente comprenden vehículos que asisten una rápida distribución sobre la superficie de la piel y en el pelo del animal huésped, y en general se denominan aceites extensores. Son adecuadas, por ejemplo, las soluciones oleosas; las soluciones alcohólicas e isopropanólicas, por ejemplo soluciones de 2-octildodecanol o alcohol oleílico; soluciones en ésteres de ácidos monocarboxílicos, tales como miristato de isopropilo, palmitato de isopropilo, éster oxálico de ácido láurico, oleiléster de ácido oleico, deciléster de ácido oleico, laurato de hexilo, oleato de oleílo, oleato de decilo, ésteres de ácido caproico de los alcoholes grasos saturados de una longitud de cadena de 12 a 18 átomos de carbono; soluciones de ésteres de ácidos dicarboxílicos, tales como ftalato de dibutilo, isoftalato de diisopropilo, di-isopropiléster de ácido adípico, adipato de di-N-butilo, o soluciones de ésteres de ácidos alifáticos, por ejemplo glicoles. Puede ser conveniente que también esté presente un dispersante conocido de la industria farmacéutica o

cosmética. Los ejemplos son pirrolidin-2-ona, N-alquilpirrolidin-2-ona, acetona, polietilenglicol y sus éteres y ésteres, propilenglicol, o triglicéridos sintéticos.

Las soluciones oleosas incluyen, por ejemplo, aceites
5 vegetales, tales como aceite de olivo, aceite de cacahuete, aceite de ajonjolí, aceite de pino, aceite de linasa, y aceite de ricino. Los aceites vegetales también pueden estar en una forma epoxidada. También es posible utilizar parafinas y aceites de silicona.

10 En general, una formulación vertida o aplicada contendrá del 1 al 20 por ciento en peso de un compuesto de la fórmula (I), del 0.1 al 50 por ciento en peso de un dispersante, y del 45 al 98.9 por ciento en peso de un solvente.

El método vertido o aplicado se puede utilizar de una
15 manera especialmente conveniente para animales en manada, tales como ganado, caballos, ovejas, y cerdos, en donde es difícil o tardado tratar a todos los animales oralmente o mediante inyección. En virtud de su simplicidad, este método, por supuesto, también se puede utilizar para todos los demás animales, inclu-
20 yendo animales domésticos individuales y mascotas, y es muy popular con los cuidadores de los animales, debido a que con frecuencia se realiza sin la asistencia experta de un cirujano veterinario.

Son adecuadas para administración parenteral y percutánea las soluciones o suspensiones oleosas para inyección,
25

utilizándose solventes o vehículos lipofílicos adecuados, tales como aceites grasos, por ejemplo aceite de ajonjolí, o ésteres de ácido graso sintéticos, por ejemplo oleato de etilo, o triglicéridos, o soluciones o suspensiones acuosas para inyección
5 que comprendan sustancias incrementadoras de viscosidad, por ejemplo carboximetilcelulosa de sodio, sorbitol y/o dextrano, y opcionalmente estabilizantes.

La preparaciones de la presente invención se pueden preparar de una manera conocida por sí misma, por ejemplo por
10 medio de procesos convencionales de mezcla, granulación, confitería, disolución, o liofilización. Por ejemplo, se pueden obtener preparaciones farmacéuticas para administración oral mediante la combinación del ingrediente activo con vehículos sólidos, opcionalmente granular la mezcla resultante, y procesar
15 la mezcla o los gránulos, si se desea, o es necesario, después de la adición de excipientes adecuados, para formar tabletas o núcleos de grageas.

Los siguientes ejemplos sirven meramente para ilustrar la invención, y no limitan la invención.

20 Las formulaciones preferidas tienen especialmente la siguiente composición (en todas partes, los porcentajes están en peso):

Concentrados emulsionables:

25 Ingrediente activo: del 1 al 90 por ciento, de preferencia

		del 5 al 20 por ciento.
	Agente de actividad superficial:	del 1 al 30 por ciento, de preferencia del 10 al 20 por ciento.
5	Vehículo líquido:	del 5 al 94 por ciento, de preferencia del 70 al 85 por ciento.

Polvos secos:

	Ingrediente activo:	del 0.1 al 10 por ciento, de preferencia del 0.1 al 1 por ciento.
10	Vehículo sólido:	del 99.9 al 90 por ciento, de preferencia del 99.9 al 99 por ciento.

Concentrados en suspensión:

15	Ingrediente activo:	del 5 al 75 por ciento, de preferencia del 10 al 50 por ciento.
	Agua:	del 94 al 24 por ciento, de preferencia del 88 al 30 por ciento.
	Agente de actividad superficial:	del 1 al 40 por ciento, de preferencia del 2 al 30 por ciento.

20

Polvos humectables:

	Ingrediente activo:	del 0.5 al 90 por ciento, de preferencia del 1 al 80 por ciento.
25	Agente de actividad superficial:	del 0.5 al 20 por ciento, de preferencia del 1 al 15 por ciento.

Vehículo sólido: del 5 al 95 por ciento, de preferencia del 15 al 90 por ciento.

Gránulos:

5 Ingrediente activo: del 0.5 al 30 por ciento, de preferencia del 3 al 15 por ciento.

Vehículo sólido: del 99.5 al 70 por ciento, de preferencia del 97 al 85 por ciento.

10 **Solución para inyección:**

Ingrediente activo: del 0.1 al 10 por ciento, de preferencia del 0.5 al 5 por ciento.

Tensoactivo no iónico: del 0.1 al 30 por ciento, de preferencia del 0.5 al 10 por ciento.

15 Mezcla de etanol y del 60 al 99 por ciento, de preferencia propilenglicol: del 85 al 90 por ciento.

Suspensión para inyección (acuosa u oleosa):

20 Ingrediente activo: del 0.1 al 20 por ciento, de preferencia del 1 al 10 por ciento.

Tensoactivo no iónico: del 0.1 al 20 por ciento, de preferencia del 1 al 10 por ciento.

Agua o aceite vegetal: del 60 al 99 por ciento, de preferencia del 85 al 95 por ciento.

Las composiciones también pueden comprender ingredientes adicionales, tales como estabilizantes, por ejemplo aceites vegetales o aceites vegetales epoxidados (aceite de coco epoxidado, aceite de colza, o aceite de frijol de soya), antiespumantes, por ejemplo aceite de silicona, conservadores, reguladores de viscosidad, aglutinantes y viscosantes, así como fertilizantes u otros ingredientes activos para obtener efectos especiales.

Los siguientes ejemplos ilustran la invención descrita anteriormente, pero no limitan su alcance de ninguna manera. Las temperaturas se dan en Grados Celsius. El símbolo 'h' significa 'hora':

1. Ejemplos de Síntesis

15 Ejemplo 1.1: 3-(4-bromofenil)-6-(2,6-difluorofenil)-[1,2,4]- triazina

a) 40.6 gramos de 2,6-difluoroacetofenona se colocan en 120 mililitros de cloroformo, y se agregan 0.1 gramos de cloruro de amonio. Luego, a 0°C, se agregan por goteo 37 gramos de bromo en 240 mililitros de cloroformo, y se realiza la agitación a 0°C durante 1 hora. Luego la mezcla de reacción se calienta a temperatura ambiente, y se concentra utilizando un evaporador giratorio. El residuo se destila sobre una columna Vigreux. De esta manera, se obtiene 2-bromo-1-(2,6-difluorofenil)-etanona que tiene un punto de ebullición de 101-

110°C a 9 mbar.

b) 24.2 gramos de hidrazida de ácido 4-bromobenzoico, y 9.17 gramos de acetato de plata, se colocan en 290 mililitros de dimetoxietano. La suspensión castaña se calienta a 60°C, se agregan 12.9 gramos de 2-bromo-1-(2,6-difluorofenil)etanona, y luego se realiza la agitación, con enfriamiento a reflujo (a aproximadamente 85°C), durante 48 horas. La suspensión se enfría a 40°C y se filtra, y el filtrado se concentra utilizando un evaporador giratorio. El producto crudo se purifica por medio de cromatografía por evaporación (gel de sílice; diclorometano/N-hexano, 1:1). De esta manera, se obtiene el compuesto del título que tiene un punto de fusión de 167-169°C.

15 **Ejemplo 1.2: 6-(2,6-difluorofenil)-3-(4'-trifluorometoxifenil-4-il)-[1,2,4]triazina**

244 miligramos de 3-(4-bromofenil)-6-(2,6-difluorofenil)-[1,2,4]triazina se colocan en 1.8 mililitros de 1,2-dimetoxietano, y se agregan en sucesión 2.5 miligramos de dicloruro de bis(trifenilfosfina)paladio (II), 159 miligramos de ácido 4-trifluorometoxifenilbórico, y 176 miligramos de carbonato ácido de sodio en 1.8 mililitros de agua. Luego la mezcla de reacción se calienta a 70°C durante 5 horas. Después de enfriar a temperatura ambiente, la suspensión se vierte en una solución de hidróxido de sodio 1N, y se extrae con acetato de

25

etilo. La fase orgánica se lava con una solución saturada de cloruro de sodio, se seca sobre sulfato de sodio, se filtra, y se concentra. El producto crudo se disuelve en un mínimo de acetato de etilo caliente, se filtra hasta quedar transparente, y se cristaliza a 0°C. De esta manera, se obtiene el compuesto del título que tiene un punto de fusión de 199-202°C.

Ejemplo 1.3: 6-(4-bromofenil)-3-(2,6-difluorofenil)-[1,2,4]-triazina

10 a) Bajo nitrógeno, se disuelven 3.15 gramos de yoduro de tiometil-2,6-difluorobenzimidinio en 30 mililitros de metanol absoluto, y se agregan 1.32 gramos de carbazato de terbutilo. Después de agitarse a temperatura ambiente durante 17 horas, la mezcla de reacción se concentra utilizando un evapora-

15 rador giratorio, y el residuo se seca bajo un alto vacío. De esta manera, se obtiene terbutiléster de ácido N'-[(2,6-difluorofenil)-iminofenil]-hidrazincarboxílico en la forma de una espuma amarillenta, que se hace reaccionar adicionalmente sin mayor purificación.

20

b) 19.9 gramos de 4-bromoacetofenona se colocan en 150 mililitros de metanol bajo nitrógeno, y se agregan 14.7 mililitros de nitrito de isopentilo. A la solución resultante, se le agregan entonces por goteo, a 17-23°C, 22.2 mililitros de una solución 5.4 M de metanolato de sodio en metanol. Después

25

de agitar durante 70 horas a temperatura ambiente, la suspensión naranja se concentra utilizando un evaporador giratorio. Se agregan 300 mililitros de agua al residuo, y la mezcla se hace ácida con 60 mililitros de ácido clorhídrico 2 N. La suspensión amarilla resultante se filtra y se lava con agua; la torta del filtro se recupera en acetato de etilo, y se lava con agua. La fase orgánica se lava con una solución saturada de cloruro de sodio, se seca sobre sulfato de sodio, se filtra, y se concentra. El producto crudo se recrystaliza a partir de acetato de etilo/tolueno. De esta manera se obtiene oxima de (4-bromofenil)-oxoacetaldehído en la forma de un polvo incoloro.

c) Una mezcla de 200 miligramos de terbutiléster de ácido N'-[(2,6-difluorofenil)-iminometil]-hidrazincarboxílico, 114 miligramos de oxima de (4-bromofenil)-oxoacetaldehído, y 123 miligramos de acetato de sodio en 1.5 mililitros de ácido acético glacial, se calienta a 100°C durante 3 horas. Después de enfriar a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se vierte en agua, y se extrae con acetato de etilo. La fase orgánica se lava en sucesión con una solución saturada de carbonato ácido de sodio y una solución saturada de cloruro de sodio, se seca sobre sulfato de sodio, se filtra, y se concentra. El residuo se purifica por medio de cromatografía por evaporación (metanol al 1 por ciento en diclorometano). De esta manera, se

obtiene el compuesto del título que tiene un punto de fusión de 180-181°C.

Ejemplo 1.4: 3-[2,6-difluorofenil)-6-(4'-trifluorometoxibi-fenil-4-il)-[1,2,4]triazina

De una manera análoga al procedimiento indicado en el Ejemplo 1.2, se obtiene el compuesto del título que tiene un punto de fusión de 225-230°C mediante acoplamiento catalizado con Pd de 6-(4-bromofenil)-3-(2,6-difluorofenil)-[1,2,4]triazina con ácido 4-trifluorometoxifenilbórico.

Ejemplo 1.5: 3-(4-bromofenil)-5-(2,6-difluorofenil)-[1,2,4] triazina

5 gramos de 2,6-difluoroacetofenona se colocan en 13.6 mililitros de sulfóxido de dimetilo, y se agregan por goteo 2.7 mililitros de bromo (8.8 M en agua), elevándose la temperatura de la reacción desde la temperatura ambiente hasta 40°C. Cuando se completa la adición de bromo, la mezcla se calienta a 80°C durante 30 minutos. Después de enfriar a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se vierte en 100 mililitros de diclorometano; con agitación, se agregan sulfato de sodio y carbonato ácido de sodio a la solución, se realiza la filtración, y la mezcla de reacción se concentra utilizando un evaporador giratorio. El producto crudo se somete a cromatografía por evaporación con diclorometano. De esta manera, se ob-

tiene (2,6-difluorofenil)-oxoacetaldehído en la forma de un aceite viscoso incoloro.

b) 2 gramos de (2,6-difluorofenil)-oxoacetaldehído se colocan en 15 mililitros de metanol a temperatura ambiente, y se agregan 1.59 gramos de 4-bromofenilhidrazida, disolviéndose ésta última completamente. Después de agitar a temperatura ambiente durante 2 horas, el producto precipitado se filtra, y luego se lava con una pequeña cantidad de metanol frío. De esta manera, se obtiene {2-(2,6-difluorofenil)-2-oxoetiliden}-hidrazida de ácido 4-bromobenzoico, y se hace reaccionar adicionalmente sin mayor purificación.

c) Una mezcla de 1.85 gramos de [2-(2,6-difluorofenil)-2-oxoetiliden]hidrazida de ácido 4-bromobenzoico, y 0.77 gramos de acetato de amonio, se calienta en 15 mililitros de ácido acético glacial a 100°C durante 14 horas. Después de enfriar a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se vierte en agua helada, y se extrae con acetato de etilo, y la fase orgánica se lava con carbonato ácido de sodio saturado, y una solución saturada de cloruro de sodio. Después de que se ha secado la fase orgánica sobre sulfato de sodio, se realizan la filtración y la concentración en un evaporador giratorio. El residuo se purifica por medio de cromatografía por evaporación (acetato de etilo al 5 por ciento en tolueno). De

esta manera, se obtiene el compuesto del título en la forma de cristales amarillos.

Ejemplo 1.6: 5-(2,6-difluorofenil)-3-(4-trifluorometoxibifenil)-

5 **4-il)-[1,2,4]triazina**

De una manera análoga al procedimiento indicado en el Ejemplo 1.2, se obtiene el compuesto del título que tiene un punto de fusión de 159-160°C mediante acoplamiento catalizado con Pd de 150 miligramos de 3-(4-bromofenil)-5-(2,6-
10 difluorofenil)-[1,2,4]triazina con 97 miligramos de ácido 4-trifluorometoxifenilbórico.

Ejemplo 1.7: 6-(4-clorobencilamino)-3-(2,6-difluorofenil)-
[1,2,4]triazina

15 a) A temperatura ambiente, 30 gramos de terbutiléster de ácido N'-[(2,6-difluorofenil)-imino-metil]-hidrazincarboxílico, y 23.8 gramos de etiléster de ácido glioxílico, se agitan en 500 mililitros de tolueno a 70°C durante 4 horas. Luego la mezcla de reacción se concentra, se agregan 200 mili-
20 litros de ácido fórmico, y se continúa la agitación a temperatura ambiente durante 5 horas. La mezcla de reacción se concentra, y el residuo se recupera en 300 mililitros de etanol, y se hierve bajo reflujo durante 6 horas. Después de la concentración de la mezcla de reacción, y de la recrystalización a par-
25 tir de acetato de etilo, se obtiene 3-(2,6-difluorofenil)-

[1,2,4]triazin-6(1H)-ona, que tiene un punto de fusión de 219-226°C.

b) Un gramo de 3-(2,6-difluorofenil)-
5 [1,2,4]triazin-6(1H)-ona, se coloca en 20 mililitros de dioxano, y a temperatura ambiente, se agregan 0.73 gramos de POCl₃. Luego, dentro de un período de 5 minutos, se agregan por goteo 0.48 gramos de trietilamina en 3 mililitros de dioxano, y se realiza agitación a temperatura ambiente durante 30 minutos.
10 Luego la mezcla de reacción se vierte en agua helada, y se extrae con acetato de etilo, y la fase orgánica se separa y se concentra. De esta manera, se obtiene 6-cloro-3-(2,6-difluorofenil)-[1,2,4]triazina en la forma de un aceite amarillo. El producto crudo se hace reaccionar adicionalmente sin
15 purificación.

c) 0.9 gramos de 6-cloro-3-(2,6-difluorofenil)-
[1,2,4]triazina se colocan en 10 mililitros de cloruro de metileno, y se agregan 0.57 gramos de 4-clorobencilamina y 0.81
20 gramos de trietilamina. Después de agitarse a temperatura ambiente durante 2 horas, la mezcla de reacción se vierte en agua, y se extrae con cloruro de metileno; la fase orgánica se concentra, y el residuo se purifica por medio de cromatografía en columna sobre gel de sílice. De esta manera, se obtiene el
25 compuesto del título que tiene un punto de fusión de 200-205°C.

**Ejemplo 1.8: 6-(3-clorofenoxi)-3-(2,6-difluorofenil)-[1,2,4]-
triazina**

325 miligramos de 6-cloro-3-(2,6-difluorofenil)-
5 [1,2,4]triazina (ver el ejemplo 1.7b), se colocan en 10 mililitros de acetonitrilo; se agregan 230 miligramos de 3-clorofenol y 190 miligramos de carbonato de potasio, y se realiza la agitación a temperatura ambiente durante 2 horas. Luego la mezcla de reacción se vierte en agua, y se extrae con acetato de etilo;
10 lo; la fase de acetato de etilo se concentra, y el producto crudo se purifica por medio de cromatografía en columna. De esta manera, se obtiene el compuesto del título que tiene un punto de fusión de 132-137°C.

15 **Ejemplo 1.9: 6-[2-(4-clorofenil)-vinil]-3-(2,6-difluorofenil)-
[1,2,4]triazina**

a) Se agregan 1.89 gramos de metilglioxal (al 40 por ciento en agua) a 2.71 gramos de terbutiléster de ácido N'-
[(2,6-difluorofenil)-iminometil]-hidrazincarboxílico en 30 mililitros de etanol, y se realiza agitación a temperatura ambiente durante 16 horas. Luego la mezcla de reacción se concentra, y el residuo se recupera en 20 mililitros de ácido fórmico, y se continúa la agitación a temperatura ambiente durante 5 horas. La mezcla de reacción se concentra por evaporación; el
25 residuo nuevamente se disuelve en 20 mililitros de etanol, se

hierve bajo reflujo durante 2 horas, luego se concentra y se purifica por medio de cromatografía en columna. De esta manera se obtiene 3-(2,6-difluorofenil)-6-metil-[1,2,4]triazina, que tiene un punto de fusión de 90-93°C.

5

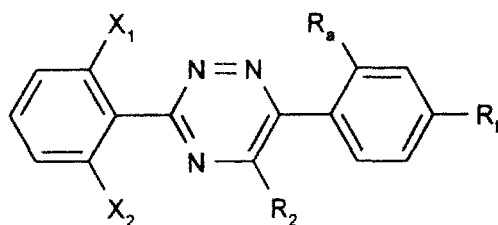
b) A -20°C, se agregan 1.5 mililitros de litio n-butílico (1.6 M en hexano) a 202 miligramos de diisopropilamina en 6 mililitros de tetrahydrofurano. Después de 15 minutos, la mezcla de reacción se enfría a -50°C, y se agregan por goteo 0.414 gramos de 3-(2,6-difluorofenil)-6-metil-[1,2,4]triazina en 2 mililitros de tetrahydrofurano. Después de 20 minutos, la mezcla se enfría a -70°C, se agregan por goteo 0.281 gramos de 4-clorobenzaldehído en 3 mililitros de tetrahydrofurano, y luego la mezcla se agita a -70°C durante 2 horas. 15 Luego la mezcla de reacción se vierte en agua helada, y se extrae con acetato de etilo; la fase orgánica se concentra, y el residuo se purifica por medio de cromatografía por evaporación. De esta manera, se obtiene 1-(4-clorofenil)-2-[3-(2,6-difluorofenil)-[1,2,4]triazin-6-il]-etanol en la forma de una 20 resina castaña clara. Después de la recristalización a partir de dietiléter/hexano, se obtiene 1-(4-clorofenil)-2-[3-(2,6-difluorofenil)-[1,2,4]triazin-6-il]-etanol en la forma de cristales beige, que tienen un punto de fusión de 98-102°C.

c) 140 miligramos de 1-(4-clorofenil)-2-[3-(2,6-

difluorofenil)-[1,2,4]triazin-6-il]-etanol, y 10 miligramos de ácido p-toluensulfónico en 10 mililitros de tolueno, se hierven bajo reflujo utilizando un separador de agua durante 2 horas; luego la mezcla de reacción se vierte en agua, y la fase de tolueno se separa, se seca con sulfato de sodio, y se concentra por evaporación. Después de la recristalización del residuo a partir de ciclohexano, se obtiene el compuesto del título que tiene un punto de fusión de 135-140°C.

De una manera análoga a los procedimientos descritos anteriormente, también es posible preparar las sustancias mencionadas en las siguientes Tablas 1 a 6. Los valores numéricos se refieren a los puntos de fusión, y se dan en °C.

Tabla 1: Compuestos de la fórmula:



No.	X ₁	X ₂	R ₂	R _a	R _b	Datos Fisicos
1.1	F	F	H	CH ₃	4-F-Ph	
1.2	F	F	H	CH ₃	4-Cl-Ph	
1.3	F	F	H	CH ₃	3-CF ₃ -Ph	
1.4	F	F	H	CH ₃	4-CF ₃ -Ph	
1.5	F	F	H	CH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
1.6	F	F	H	CH ₃	4-terbutil-Ph	
1.7	F	F	H	CH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
1.8	F	F	H	CH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
1.9	F	F	H	CH ₃	2-CF ₃ -Ph	
1.10	F	F	H	CH ₃	4-OCH ₃ -Ph	
1.11	F	F	H	CH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
1.12	F	F	H	CH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
1.13	F	F	H	CH ₃	3-Cl-Ph	
1.14	F	F	H	CH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
1.15	F	F	H	CH ₃	3-Cl-4-F-Ph	
1.16	F	F	H	CH ₃	4-Br	163-165
1.17	F	F	H	OCH ₃	4-F-Ph	
1.18	F	F	H	OCH ₃	4-Cl-Ph	172-173
1.19	F	F	H	OCH ₃	3-CF ₃ -Ph	
1.20	F	F	H	OCH ₃	4-CF ₃ -Ph	178-179
1.21	F	F	H	OCH ₃	4-OCF ₃ -Ph	162-163
1.22	F	F	H	OCH ₂ CH ₃	4-terbutil-Ph	135-137
1.23	F	F	H	OCH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
1.24	F	F	H	OCH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
1.25	F	F	H	OCH ₃	2-CF ₃ -Ph	
1.26	F	F	H	OCH ₃	4-OCH ₃ -Ph	
1.27	F	F	H	OCH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
1.28	F	F	H	OCH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
1.29	F	F	H	OCH ₃	3-Cl-Ph	
1.30	F	F	H	OCH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
1.31	F	F	H	OCH ₃	3-Cl-4-F-Ph	182-183
1.32	F	F	H	CF ₃	4-F-Ph	
1.33	F	F	H	CF ₃	4-Cl-Ph	
1.34	F	F	H	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	
1.35	F	F	H	CF ₃	4-CF ₃ -Ph	
1.36	F	F	H	CF ₃	4-OCF ₃ -Ph	
1.37	F	F	H	CF ₃	4-terbutil-Ph	
1.38	F	F	H	CF ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
1.39	F	F	H	CF ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
1.40	F	F	H	CF ₃	2-CF ₃ -Ph	
1.41	F	F	H	CF ₃	4-OCH ₃ -Ph	
1.42	F	F	H	CF ₃	4-SCH ₃ -Ph	
1.43	F	F	H	CF ₃	3-OCH ₃ -Ph	

No.	X ₁	X ₂	R ₂	R _a	R _b	Datos Físicos
1.44	F	F	H	CF ₃	3-Cl-Ph	
1.45	F	F	H	CF ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
1.46	F	F	H	CF ₃	3-Cl-4-F-Ph	
1.47	F	F	CH ₃	H	4-F-Ph	
1.48	F	F	CH ₃	H	4-Cl-Ph	
1.49	F	F	CH ₃	H	3-CF ₃ -Ph	
1.50	F	F	CH ₃	H	4-CF ₃ -Ph	201-203
1.51	F	F	CH ₃	H	4-OCF ₃ -Ph	168-189
1.52	F	F	CH ₃	H	4-terbutil-Ph	
1.53	F	F	CH ₃	H	2,4-Cl ₂ -Ph	
1.54	F	F	CH ₃	H	3,5-Cl ₂ -Ph	
1.55	F	F	CH ₃	H	2-CF ₃ -Ph	
1.56	F	F	CH ₃	H	4-OCH ₃ -Ph	
1.57	F	F	CH ₃	H	4-SCH ₃ -Ph	
1.58	F	F	CH ₃	H	3-OCH ₃ -Ph	
1.59	F	F	CH ₃	H	3-Cl-Ph	
1.60	F	F	CH ₃	H	3,4-Cl ₂ -Ph	
1.61	F	F	CH ₃	H	3-Cl-4-F-Ph	
1.62	F	F	CH ₃	CH ₃	4-F-Ph	
1.63	F	F	CH ₃	CH ₃	4-Cl-Ph	
1.64	F	F	CH ₃	CH ₃	3-CF ₃ -Ph	
1.65	F	F	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ -Ph	
1.66	F	F	CH ₃	CH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
1.67	F	F	CH ₃	CH ₃	4-terbutil-Ph	
1.68	F	F	CH ₃	CH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
1.69	F	F	CH ₃	CH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
1.70	F	F	CH ₃	CH ₃	2-CF ₃ -Ph	
1.71	F	F	CH ₃	CH ₃	4-OCH ₃ -Ph	
1.72	F	F	CH ₃	CH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
1.73	F	F	CH ₃	CH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
1.74	F	F	CH ₃	CH ₃	3-Cl-Ph	
1.75	F	F	CH ₃	CH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
1.76	F	F	CH ₃	CH ₃	3-Cl-4-F-Ph	
1.77	F	F	CH ₃	OCH ₃	4-F-Ph	
1.78	F	F	CH ₃	OCH ₃	4-Cl-Ph	
1.79	F	F	CH ₃	OCH ₃	3-CF ₃ -Ph	
1.80	F	F	CH ₃	OCH ₃	4-CF ₃ -Ph	
1.81	F	F	CH ₃	OCH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
1.82	F	F	CH ₃	OCH ₃	4-terbutil-Ph	
1.83	F	F	CH ₃	OCH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
1.84	F	F	CH ₃	OCH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
1.85	F	F	CH ₃	OCH ₃	2-CF ₃ -Ph	
1.86	F	F	CH ₃	OCH ₃	4-OCH ₃ -Ph	
1.87	F	F	CH ₃	OCH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
1.88	F	F	CH ₃	OCH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
1.89	F	F	CH ₃	OCH ₃	3-Cl-Ph	
1.90	F	F	CH ₃	OCH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
1.91	F	F	CH ₃	OCH ₃	3-Cl-4-F-Ph	
1.92	F	F	CH ₃	CF ₃	4-F-Ph	
1.93	F	F	CH ₃	CF ₃	4-Cl-Ph	
1.94	F	F	CH ₃	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	
1.95	F	F	CH ₃	CF ₃	4-CF ₃ -Ph	
1.96	F	F	CH ₃	CF ₃	4-OCF ₃ -Ph	
1.97	F	F	CH ₃	CF ₃	4-terbutil-Ph	

No.	X ₁	X ₂	R ₂	R _a	R _b	Datos Físicos
1.98	F	F	CH ₃	CF ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
1.99	F	F	CH ₃	CF ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
1.100	F	F	CH ₃	CF ₃	2-CF ₃ -Ph	
1.101	F	F	CH ₃	CF ₃	4-OCH ₃ -Ph	
1.102	F	F	CH ₃	CF ₃	4-SCH ₃ -Ph	
1.103	F	F	CH ₃	CF ₃	3-OCH ₃ -Ph	
1.104	F	F	CH ₃	CF ₃	3-Cl-Ph	
1.105	F	F	CH ₃	CF ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
1.106	F	F	CH ₃	CF ₃	3-Cl-4-F-Ph	
1.107	F	Cl	H	H	4-F-Ph	
1.108	F	Cl	H	H	4-Cl-Ph	
1.109	F	Cl	H	H	3-CF ₃ -Ph	
1.110	F	Cl	H	H	4-CF ₃ -Ph	
1.111	F	Cl	H	H	4-OCF ₃ -Ph	
1.112	F	Cl	H	H	4-terbutil-Ph	
1.113	F	Cl	H	H	2,4-Cl ₂ -Ph	
1.114	F	Cl	H	H	3,5-Cl ₂ -Ph	
1.115	F	Cl	H	H	2-CF ₃ -Ph	
1.116	F	Cl	H	H	4-OCH ₃ -Ph	
1.117	F	Cl	H	H	4-SCH ₃ -Ph	
1.118	F	Cl	H	H	3-OCH ₃ -Ph	
1.119	F	Cl	H	H	3-Cl-Ph	
1.120	F	Cl	H	H	3,4-Cl ₂ -Ph	
1.121	F	Cl	H	H	3-Cl-4-F-Ph	
1.122	F	Cl	H	CH ₃	4-F-Ph	
1.123	F	Cl	H	CH ₃	4-Cl-Ph	
1.124	F	Cl	H	CH ₃	3-CF ₃ -Ph	
1.125	F	Cl	H	CH ₃	4-CF ₃ -Ph	
1.126	F	Cl	H	CH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
1.127	F	Cl	H	CH ₃	4-terbutil-Ph	
1.128	F	Cl	H	CH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
1.129	F	Cl	H	CH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
1.130	F	Cl	H	CH ₃	2-CF ₃ -Ph	
1.131	F	Cl	H	CH ₃	4-OCH ₃ -Ph	
1.132	F	Cl	H	CH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
1.133	F	Cl	H	CH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
1.134	F	Cl	H	CH ₃	3-Cl-Ph	
1.135	F	Cl	H	CH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
1.136	F	Cl	H	CH ₃	3-Cl-4-F-Ph	
1.137	F	Cl	H	OCH ₃	4-F-Ph	
1.138	F	Cl	H	OCH ₃	4-Cl-Ph	
1.139	F	Cl	H	OCH ₃	3-CF ₃ -Ph	
1.140	F	Cl	H	OCH ₃	4-CF ₃ -Ph	
1.141	F	Cl	H	OCH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
1.142	F	Cl	H	OCH ₃	4-terbutil-Ph	
1.143	F	Cl	H	OCH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
1.144	F	Cl	H	OCH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
1.145	F	Cl	H	OCH ₃	2-CF ₃ -Ph	
1.146	F	Cl	H	OCH ₃	4-OCH ₃ -Ph	
1.147	F	Cl	H	OCH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
1.148	F	Cl	H	OCH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
1.149	F	Cl	H	OCH ₃	3-Cl-Ph	
1.150	F	Cl	H	OCH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
1.151	F	Cl	H	OCH ₃	3-Cl-4-F-Ph	

No.	X ₁	X ₂	R ₂	R _a	R _b	Datos Físicos
1.152	F	Cl	H	CF ₃	4-F-Ph	
1.153	F	Cl	H	CF ₃	4-Cl-Ph	
1.154	F	Cl	H	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	
1.155	F	Cl	H	CF ₃	4-CF ₃ -Ph	
1.156	F	Cl	H	CF ₃	4-OCF ₃ -Ph	
1.157	F	Cl	H	CF ₃	4-terbutil-Ph	
1.158	F	Cl	H	CF ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
1.159	F	Cl	H	CF ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
1.160	F	Cl	H	CF ₃	2-CF ₃ -Ph	
1.161	F	Cl	H	CF ₃	4-OCH ₃ -Ph	
1.162	F	Cl	H	CF ₃	4-SCH ₃ -Ph	
1.163	F	Cl	H	CF ₃	3-OCH ₃ -Ph	
1.164	F	Cl	H	CF ₃	3-Cl-Ph	
1.165	F	Cl	H	CF ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
1.166	F	Cl	H	CF ₃	3-Cl-4-F-Ph	
1.167	F	Cl	CH ₃	H	4-F-Ph	
1.168	F	Cl	CH ₃	H	4-Cl-Ph	
1.169	F	Cl	CH ₃	H	3-CF ₃ -Ph	
1.170	F	Cl	CH ₃	H	4-CF ₃ -Ph	
1.171	F	Cl	CH ₃	H	4-OCF ₃ -Ph	
1.172	F	Cl	CH ₃	H	4-terbutil-Ph	
1.173	F	Cl	CH ₃	H	2,4-Cl ₂ -Ph	
1.174	F	Cl	CH ₃	H	3,5-Cl ₂ -Ph	
1.175	F	Cl	CH ₃	H	2-CF ₃ -Ph	
1.176	F	Cl	CH ₃	H	4-OCH ₃ -Ph	
1.177	F	Cl	CH ₃	H	4-SCH ₃ -Ph	
1.178	F	Cl	CH ₃	H	3-OCH ₃ -Ph	
1.179	F	Cl	CH ₃	H	3-Cl-Ph	
1.180	F	Cl	CH ₃	H	3,4-Cl ₂ -Ph	
1.181	F	Cl	CH ₃	H	3-Cl-4-F-Ph	
1.182	F	Cl	CH ₃	CH ₃	4-F-Ph	
1.183	F	Cl	CH ₃	CH ₃	4-Cl-Ph	
1.184	F	Cl	CH ₃	CH ₃	3-CF ₃ -Ph	
1.185	F	Cl	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ -Ph	
1.186	F	Cl	CH ₃	CH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
1.187	F	Cl	CH ₃	CH ₃	4-terbutil-Ph	
1.188	F	Cl	CH ₃	CH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
1.189	F	Cl	CH ₃	CH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
1.190	F	Cl	CH ₃	CH ₃	2-CF ₃ -Ph	
1.191	F	Cl	CH ₃	CH ₃	4-OCH ₃ -Ph	
1.192	F	Cl	CH ₃	CH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
1.193	F	Cl	CH ₃	CH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
1.194	F	Cl	CH ₃	CH ₃	3-Cl-Ph	
1.195	F	Cl	CH ₃	CH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
1.196	F	Cl	CH ₃	CH ₃	3-Cl-4-F-Ph	
1.197	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-F-Ph	
1.198	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-Cl-Ph	
1.199	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-CF ₃ -Ph	
1.200	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-CF ₃ -Ph	
1.201	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
1.202	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-terbutil-Ph	
1.203	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
1.204	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
1.205	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	2-CF ₃ -Ph	

No.	X ₁	X ₂	R ₂	R _a	R _b	Datos Físicos
1.206	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-OCH ₃ -Ph	
1.207	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
1.208	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
1.209	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-Cl-Ph	
1.210	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
1.211	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-Cl-4-F-Ph	
1.212	F	Cl	CH ₃	CF ₃	4-F-Ph	
1.213	F	Cl	CH ₃	CF ₃	4-Cl-Ph	
1.214	F	Cl	CH ₃	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	
1.215	F	Cl	CH ₃	CF ₃	4-CF ₃ -Ph	
1.216	F	Cl	CH ₃	CF ₃	4-OCF ₃ -Ph	
1.217	F	Cl	CH ₃	CF ₃	4-terbutil-Ph	
1.218	F	Cl	CH ₃	CF ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
1.219	F	Cl	CH ₃	CF ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
1.220	F	Cl	CH ₃	CF ₃	2-CF ₃ -Ph	
1.221	F	Cl	CH ₃	CF ₃	4-OCH ₃ -Ph	
1.222	F	Cl	CH ₃	CF ₃	4-SCH ₃ -Ph	
1.223	F	Cl	CH ₃	CF ₃	3-OCH ₃ -Ph	
1.224	F	Cl	CH ₃	CF ₃	3-Cl-Ph	
1.225	F	Cl	CH ₃	CF ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
1.226	F	Cl	CH ₃	CF ₃	3-Cl-4-F-Ph	
1.227	Cl	Cl	H	H	4-F-Ph	
1.228	Cl	Cl	H	H	4-Cl-Ph	
1.229	Cl	Cl	H	H	3-CF ₃ -Ph	
1.230	Cl	Cl	H	H	4-CF ₃ -Ph	
1.231	Cl	Cl	H	H	4-OCF ₃ -Ph	
1.232	Cl	Cl	H	H	4-terbutil-Ph	
1.233	Cl	Cl	H	H	2,4-Cl ₂ -Ph	
1.234	Cl	Cl	H	H	3,5-Cl ₂ -Ph	
1.235	Cl	Cl	H	H	2-CF ₃ -Ph	
1.236	Cl	Cl	H	H	4-OCH ₃ -Ph	
1.237	Cl	Cl	H	H	4-SCH ₃ -Ph	
1.238	Cl	Cl	H	H	3-OCH ₃ -Ph	
1.239	Cl	Cl	H	H	3-Cl-Ph	
1.240	Cl	Cl	H	H	3,4-Cl ₂ -Ph	
1.241	Cl	Cl	H	H	3-Cl-4-F-Ph	
1.242	Cl	Cl	H	CH ₃	4-F-Ph	
1.243	Cl	Cl	H	CH ₃	4-Cl-Ph	
1.244	Cl	Cl	H	CH ₃	3-CF ₃ -Ph	
1.245	Cl	Cl	H	CH ₃	4-CF ₃ -Ph	
1.246	Cl	Cl	H	CH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
1.247	Cl	Cl	H	CH ₃	4-terbutil-Ph	
1.248	Cl	Cl	H	CH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
1.249	Cl	Cl	H	CH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
1.250	Cl	Cl	H	CH ₃	2-CF ₃ -Ph	
1.251	Cl	Cl	H	CH ₃	4-OCH ₃ -Ph	
1.252	Cl	Cl	H	CH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
1.253	Cl	Cl	H	CH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
1.254	Cl	Cl	H	CH ₃	3-Cl-Ph	
1.255	Cl	Cl	H	CH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
1.256	Cl	Cl	H	CH ₃	3-Cl-4-F-Ph	
1.257	Cl	Cl	H	OCH ₃	4-F-Ph	
1.258	Cl	Cl	H	OCH ₃	4-Cl-Ph	
1.259	Cl	Cl	H	OCH ₃	3-CF ₃ -Ph	

No.	X ₁	X ₂	R ₂	R _a	R _b	Datos Físicos
1.260	Cl	Cl	H	OCH ₃	4-CF ₃ -Ph	
1.261	Cl	Cl	H	OCH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
1.262	Cl	Cl	H	OCH ₃	4-terbutil-Ph	
1.263	Cl	Cl	H	OCH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
1.264	Cl	Cl	H	OCH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
1.265	Cl	Cl	H	OCH ₃	2-CF ₃ -Ph	
1.266	Cl	Cl	H	OCH ₃	4-OCH ₃ -Ph	
1.267	Cl	Cl	H	OCH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
1.268	Cl	Cl	H	OCH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
1.269	Cl	Cl	H	OCH ₃	3-Cl-Ph	
1.270	Cl	Cl	H	OCH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
1.271	Cl	Cl	H	OCH ₃	3-Cl-4-F-Ph	
1.272	Cl	Cl	H	CF ₃	4-F-Ph	
1.273	Cl	Cl	H	CF ₃	4-Cl-Ph	
1.274	Cl	Cl	H	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	
1.275	Cl	Cl	H	CF ₃	4-CF ₃ -Ph	
1.276	Cl	Cl	H	CF ₃	4-OCF ₃ -Ph	
1.277	Cl	Cl	H	CF ₃	4-terbutil-Ph	
1.278	Cl	Cl	H	CF ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
1.279	Cl	Cl	H	CF ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
1.280	Cl	Cl	H	CF ₃	2-CF ₃ -Ph	
1.281	Cl	Cl	H	CF ₃	4-OCH ₃ -Ph	
1.282	Cl	Cl	H	CF ₃	4-SCH ₃ -Ph	
1.283	Cl	Cl	H	CF ₃	3-OCH ₃ -Ph	
1.284	Cl	Cl	H	CF ₃	3-Cl-Ph	
1.285	Cl	Cl	H	CF ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
1.286	Cl	Cl	H	CF ₃	3-Cl-4-F-Ph	
1.287	Cl	Cl	CH ₃	H	4-F-Ph	
1.288	Cl	Cl	CH ₃	H	4-Cl-Ph	
1.289	Cl	Cl	CH ₃	H	3-CF ₃ -Ph	
1.290	Cl	Cl	CH ₃	H	4-CF ₃ -Ph	
1.291	Cl	Cl	CH ₃	H	4-OCF ₃ -Ph	
1.292	Cl	Cl	CH ₃	H	4-terbutil-Ph	
1.293	Cl	Cl	CH ₃	H	2,4-Cl ₂ -Ph	
1.294	Cl	Cl	CH ₃	H	3,5-Cl ₂ -Ph	
1.295	Cl	Cl	CH ₃	H	2-CF ₃ -Ph	
1.296	Cl	Cl	CH ₃	H	4-OCH ₃ -Ph	
1.297	Cl	Cl	CH ₃	H	4-SCH ₃ -Ph	
1.298	Cl	Cl	CH ₃	H	3-OCH ₃ -Ph	
1.299	Cl	Cl	CH ₃	H	3-Cl-Ph	
1.300	Cl	Cl	CH ₃	H	3,4-Cl ₂ -Ph	
1.301	Cl	Cl	CH ₃	H	3-Cl-4-F-Ph	
1.302	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	4-F-Ph	
1.303	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	4-Cl-Ph	
1.304	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	3-CF ₃ -Ph	
1.305	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ -Ph	
1.306	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
1.307	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	4-terbutil-Ph	
1.308	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
1.309	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
1.310	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	2-CF ₃ -Ph	
1.311	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	4-OCH ₃ -Ph	
1.312	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
1.313	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	3-OCH ₃ -Ph	

No.	X ₁	X ₂	R ₂	R _a	R _b	Datos Fisicos
1.314	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	3-Cl-Ph	
1.315	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
1.316	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	3-Cl-4-F-Ph	
1.317	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-F-Ph	
1.318	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-Cl-Ph	
1.319	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-CF ₃ -Ph	
1.320	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-CF ₃ -Ph	
1.321	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
1.322	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-terbutil-Ph	
1.323	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
1.324	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
1.325	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	2-CF ₃ -Ph	
1.326	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-OCH ₃ -Ph	
1.327	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
1.328	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
1.329	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-Cl-Ph	
1.330	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
1.331	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-Cl-4-F-Ph	
1.332	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	4-F-Ph	
1.333	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	4-Cl-Ph	
1.334	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	
1.335	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	4-CF ₃ -Ph	
1.336	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	4-OCF ₃ -Ph	
1.337	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	4-terbutil-Ph	
1.338	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
1.339	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
1.340	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	2-CF ₃ -Ph	
1.341	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	4-OCH ₃ -Ph	
1.342	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	4-SCH ₃ -Ph	
1.343	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	3-OCH ₃ -Ph	
1.344	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	3-Cl-Ph	
1.345	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
1.346	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	3-Cl-4-F-Ph	
1.347	F	F	H	H	4-SCH ₃ -Ph	
1.348	Cl	H	F	H	4-CF ₃ -Ph	
1.349	Cl	H	F	H	4-OCF ₃ -Ph	
1.350	Cl	H	F	H	3,5-Cl ₂ -Ph	
1.351	F	F	H	H	3,4(OCH ₃) ₂ -Ph	207-209
1.352	F	F	CH ₃	H	4-Br	182-185
1.353	F	F	H	H	4-OH-Ph	224-227
1.354	F	F	H	H	4-CN-Ph	146-147
1.355	F	F	H	H	3-CN-Ph	sólido
1.356	H	H	H	H	4-Br	210-212
1.357	F	F	H	H	4-OCH ₃	152-153
1.358	F	F	H	H	furan-2-ilo	183-184
1.359	F	F	H	H	-CH=CH-C(=O)OCH ₃	222-224
1.360	F	F	H	H	-CH=CH-C ₆ H ₅	220-221
1.361	F	F	H	H	-CH=CH-C ₆ H ₄ -Br	199-201
1.362	F	F	H	H	ciclohex-1-en-3-on-1-ilo	231-232
1.363	F	F	H	H	-CH=CH-C(=O)NH ₂	>250
1.364	F	F	H	H	-CH=C(CH ₃)-C(=O)OCH ₃	151-155
1.365	F	F	H	H	ciclohex-1-en-1-ilo	139-141
1.366	F	F	H	H	-CH=CH-SO ₂ CH ₃	231-232
1.367	F	F	H	H	-C[COOCH ₃]=CH-COOCH ₃	169-175

No.	X ₁	X ₂	R ₂	R _a	R _b	Datos Físicos
1.368	F	F	H	H	-CH=CH-CH ₂ -O-C ₆ H ₅	152-156
1.369	F	F	H	H	-C ₆ H ₄ -4-CHO	230-233
1.370	F	F	H	H	-C ₆ H ₄ -3-CHO	201-203
1.371	F	F	H	H	-C(CH ₃)=CH-C(=O)OCH ₃	185-187
1.372	F	F	H	H	-C ₆ H ₄ -4-CH=NOH	sólido
1.373	F	F	H	H	-C ₆ H ₄ -4-CH=NOC(=O)CH ₃	188-190
1.374	F	F	H	H	-C ₆ H ₄ -3-CH=NOH	sólido
1.375	F	F	H	H	-C ₆ H ₄ -4-C(=O)CH ₃	231-233
1.376	F	F	H	H	-C ₆ H ₄ -3-C(=O)CH ₃	200-203
1.377	F	F	H	H	-CH=CH-CN	>250
1.378	F	F	H	H	-C ₆ H ₄ -4-C(CH ₃)=NOCH ₃	198-201
1.379	F	F	H	H	-C ₆ H ₄ -3-C(CH ₃)=NOCH ₃	162-164
1.380	F	F	H	H	-C≡C-C ₆ H ₄ -2-F	191-192
1.381	F	F	H	H	-C≡C-C(CH ₃) ₂ OH	179-180
1.382	F	F	H	H	-P(=O)(OC ₂ H ₅) ₂	114-115
1.383	F	F	H	H	H	100-104
1.384	F	F	H	CH ₂ SCH ₃	4-CF ₃ -Ph	
1.385	F	F	H	CH ₂ SCH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
1.386	F	F	H	CH ₂ CH ₃	4-CF ₃ -Ph	
1.387	F	F	H	CH ₂ CH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
1.388	F	F	i-Prop	H	4-CF ₃ -Ph	165-170
1.389	F	F	H	H	-C≡C-C ₆ H ₄ -4-CH ₃	188-190
1.390	F	F	H	H	-C≡C-C ₆ H ₄ -4-Cl	199-202
1.391	F	F	CH ₂ Br	H	Br	
1.392	F	F	CHBr ₂	H	Br	
1.393	F	F	H	H	Ciclohexilo	138-140
1.394	F	H	H	H	4-CH ₃ -Ph	249-250
1.395	F	F	H	-O-C ₂ H ₅	t-Butilo	135-137
1.396	F	H	H	H	Br	173
1.397	F	F	H	H	4-SCF ₃ -Ph	
1.398	F	F	H	H	4-SOCF ₃ -Ph	
1.399	F	F	H	H	4-SO ₂ CF ₃ -Ph	
1.400	F	Cl	H	H	4-SCF ₃ -Ph	
1.401	F	Cl	H	H	4-SOCF ₃ -Ph	
1.402	F	Cl	H	H	4-SO ₂ CF ₃ -Ph	
1.403	F	F	CH ₃	H	4-SCF ₃ -Ph	
1.404	F	F	CH ₃	H	4-SOCF ₃ -Ph	
1.405	F	F	CH ₃	H	4-SO ₂ CF ₃ -Ph	
1.406	F	H	H	H	4-F-Ph	
1.407	F	H	H	H	4-Cl-Ph	277-278
1.408	F	H	H	H	3-CF ₃ -Ph	189-190
1.409	F	H	H	H	4-CF ₃ -Ph	294-295
1.410	F	H	H	H	4-OCF ₃ -Ph	302-303
1.411	F	H	H	H	4-t-Butil-Ph	206-207
1.412	F	H	H	H	2,4-Cl ₂ -Ph	229-230
1.413	F	H	H	H	3,5-Cl ₂ -Ph	203-204
1.414	F	H	H	H	2-CF ₃ -Ph	
1.415	F	H	H	H	4-OCH ₃ -Ph	
1.416	F	H	H	H	4-SCH ₃ -Ph	262-263
1.417	F	H	H	H	3-OCH ₃ -Ph	
1.418	F	H	H	H	3-Cl-Ph	194-195
1.419	F	H	H	H	3,4-Cl ₂ -Ph	

No.	X ₁	X ₂	R ₂	R _a	R _b	Datos Físicos
1.420	F	H	H	H	3-Cl-4-F-Ph	208-209
1.421	F	H	H	H	4-SCF ₃ -Ph	
1.422	F	H	H	H	4-SOCF ₃ -Ph	
1.423	F	H	H	H	4-SO ₂ CF ₃ -Ph	
1.424	CH ₃	H	H	H	4-F-Ph	
1.425	CH ₃	H	H	H	4-Cl-Ph	221-222
1.426	CH ₃	H	H	H	3-CF ₃ -Ph	
1.427	CH ₃	H	H	H	4-CF ₃ -Ph	
1.428	CH ₃	H	H	H	4-OCF ₃ -Ph	
1.429	CH ₃	H	H	H	4-t-Butil-Ph	
1.430	CH ₃	H	H	H	2,4-Cl ₂ -Ph	216-217
1.431	CH ₃	H	H	H	3,5-Cl ₂ -Ph	
1.432	CH ₃	H	H	H	2-CF ₃ -Ph	
1.433	CH ₃	H	H	H	4-OCH ₃ -Ph	
1.434	CH ₃	H	H	H	4-SCH ₃ -Ph	
1.435	CH ₃	H	H	H	3-OCH ₃ -Ph	181-182
1.436	CH ₃	H	H	H	3-Cl-Ph	
1.437	CH ₃	H	H	H	3,4-Cl ₂ -Ph	
1.438	CH ₃	H	H	H	3-Cl-4-F-Ph	
1.439	CH ₃	H	H	H	4-SCF ₃ -Ph	
1.440	CH ₃	H	H	H	4-SOCF ₃ -Ph	
1.441	CH ₃	H	H	H	4-SO ₂ CF ₃ -Ph	
1.442	F	F	OH	H	4-F-Ph	
1.443	F	F	OH	H	4-Cl-Ph	
1.444	F	F	OH	H	3-CF ₃ -Ph	
1.445	F	F	OH	H	4-CF ₃ -Ph	
1.446	F	F	OH	H	4-OCF ₃ -Ph	
1.447	F	F	OH	H	4-t-Butil-Ph	
1.448	F	F	OH	H	2,4-Cl ₂ -Ph	
1.449	F	F	OH	H	3,5-Cl ₂ -Ph	
1.450	F	F	OH	H	2-CF ₃ -Ph	
1.451	F	F	OH	H	4-OCH ₃ -Ph	
1.452	F	F	OH	H	4-SCH ₃ -Ph	
1.453	F	F	OH	H	3-OCH ₃ -Ph	
1.454	F	F	OH	H	3-Cl-Ph	
1.455	F	F	OH	H	3,4-Cl ₂ -Ph	
1.456	F	F	OH	H	3-Cl-4-F-Ph	
1.457	F	F	OH	H	4-SCF ₃ -Ph	
1.458	F	F	OH	H	4-SOCF ₃ -Ph	
1.459	F	F	OH	H	4-SO ₂ CF ₃ -Ph	
1.460	F	F	OCH ₃	H	4-Cl-Ph	
1.461	F	F	OCH ₃	H	3-CF ₃ -Ph	
1.462	F	F	OCH ₃	H	4-CF ₃ -Ph	
1.463	F	F	OCH ₃	H	4-OCF ₃ -Ph	
1.464	F	F	OCH ₃	H	4-t-Butil-Ph	
1.465	F	F	OCH ₃	H	2,4-Cl ₂ -Ph	
1.466	F	F	OCH ₃	H	3,5-Cl ₂ -Ph	
1.467	F	F	OCH ₃	H	2-CF ₃ -Ph	
1.468	F	F	OCH ₃	H	4-OCH ₃ -Ph	
1.469	F	F	OCH ₃	H	4-SCH ₃ -Ph	

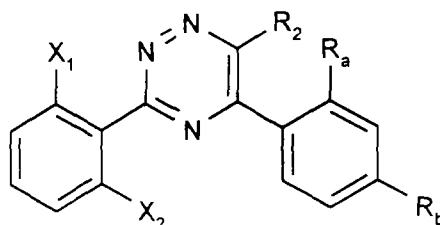
No.	X ₁	X ₂	R ₂	R _a	R _b	Datos Físicos
1.470	F	F	OCH ₃	H	3-OCH ₃ -Ph	
1.471	F	F	OCH ₃	H	3-Cl-Ph	
1.472	F	F	OCH ₃	H	3,4-Cl ₂ -Ph	
1.473	F	F	OCH ₃	H	3-Cl-4-F-Ph	
1.474	F	F	OCH ₃	H	4-SCF ₃ -Ph	
1.475	F	F	OCH ₃	H	4-SOCF ₃ -Ph	
1.476	F	F	OCH ₃	H	4-SO ₂ CF ₃ -Ph	
1.477	F	F	Cl	H	4-F-Ph	
1.478	F	F	Cl	H	4-Cl-Ph	
1.479	F	F	Cl	H	3-CF ₃ -Ph	
1.480	F	F	Cl	H	4-CF ₃ -Ph	
1.481	F	F	Cl	H	4-OCF ₃ -Ph	
1.482	F	F	Cl	H	4-t-Butil-Ph	
1.483	F	F	Cl	H	2,4-Cl ₂ -Ph	
1.484	F	F	Cl	H	3,5-Cl ₂ -Ph	
1.485	F	F	Cl	H	2-CF ₃ -Ph	
1.486	F	F	Cl	H	4-OCH ₃ -Ph	
1.487	F	F	Cl	H	4-SCH ₃ -Ph	
1.488	F	F	Cl	H	3-OCH ₃ -Ph	
1.489	F	F	Cl	H	3-Cl-Ph	
1.490	F	F	Cl	H	3,4-Cl ₂ -Ph	
1.491	F	F	Cl	H	3-Cl-4-F-Ph	
1.492	F	F	Cl	H	4-SCF ₃ -Ph	
1.493	F	F	Cl	H	4-SOCF ₃ -Ph	
1.494	F	F	Cl	H	4-SO ₂ CF ₃ -Ph	
1.495	F	F	SCH ₃	H	4-F-Ph	
1.496	F	F	SCH ₃	H	4-Cl-Ph	
1.497	F	F	SCH ₃	H	3-CF ₃ -Ph	
1.498	F	F	SCH ₃	H	4-CF ₃ -Ph	
1.499	F	F	SCH ₃	H	4-OCF ₃ -Ph	
1.500	F	F	SCH ₃	H	4-t-Butil-Ph	
1.501	F	F	SCH ₃	H	2,4-Cl ₂ -Ph	
1.502	F	F	SCH ₃	H	3,5-Cl ₂ -Ph	
1.503	F	F	SCH ₃	H	2-CF ₃ -Ph	
1.504	F	F	SCH ₃	H	4-OCH ₃ -Ph	
1.505	F	F	SCH ₃	H	4-SCH ₃ -Ph	
1.506	F	F	SCH ₃	H	3-OCH ₃ -Ph	
1.507	F	F	SCH ₃	H	3-Cl-Ph	
1.508	F	F	SCH ₃	H	3,4-Cl ₂ -Ph	
1.509	F	F	SCH ₃	H	3-Cl-4-F-Ph	
1.510	F	F	SCH ₃	H	4-SCF ₃ -Ph	
1.511	F	F	SCH ₃	H	4-SOCF ₃ -Ph	
1.512	F	F	SCH ₃	H	4-SO ₂ CF ₃ -Ph	
1.513	F	F	CN	H	4-F-Ph	
1.514	F	F	CN	H	4-Cl-Ph	
1.515	F	F	CN	H	3-CF ₃ -Ph	
1.516	F	F	CN	H	4-CF ₃ -Ph	
1.517	F	F	CN	H	4-OCF ₃ -Ph	
1.518	F	F	CN	H	4-t-Butil-Ph	
1.519	F	F	CN	H	2,4-Cl ₂ -Ph	

No.	X ₁	X ₂	R ₂	R _a	R _b	Datos Físicos
1.520	F	F	CN	H	3,5-Cl ₂ -Ph	
1.521	F	F	CN	H	2-CF ₃ -Ph	
1.522	F	F	CN	H	4-OCH ₃ -Ph	
1.523	F	F	CN	H	4-SCH ₃ -Ph	
1.524	F	F	CN	H	3-OCH ₃ -Ph	
1.525	F	F	CN	H	3-Cl-Ph	
1.526	F	F	CN	H	3,4-Cl ₂ -Ph	
1.527	F	F	CN	H	3-Cl-4-F-Ph	
1.528	F	F	CN	H	4-SCF ₃ -Ph	
1.529	F	F	CN	H	4-SOCF ₃ -Ph	
1.530	F	F	CN	H	4-SO ₂ CF ₃ -Ph	
1.531	F	F	NHCH ₃	H	4-F-Ph	
1.532	F	F	NHCH ₃	H	4-Cl-Ph	
1.533	F	F	NHCH ₃	H	3-CF ₃ -Ph	
1.534	F	F	NHCH ₃	H	4-CF ₃ -Ph	
1.535	F	F	NHCH ₃	H	4-OCF ₃ -Ph	
1.536	F	F	NHCH ₃	H	4-t-Butil-Ph	
1.537	F	F	NHCH ₃	H	2,4-Cl ₂ -Ph	
1.538	F	F	NHCH ₃	H	3,5-Cl ₂ -Ph	
1.539	F	F	NHCH ₃	H	2-CF ₃ -Ph	
1.540	F	F	NHCH ₃	H	4-OCH ₃ -Ph	
1.541	F	F	NHCH ₃	H	4-SCH ₃ -Ph	
1.542	F	F	NHCH ₃	H	3-OCH ₃ -Ph	
1.543	F	F	NHCH ₃	H	3-Cl-Ph	
1.544	F	F	NHCH ₃	H	3,4-Cl ₂ -Ph	
1.545	F	F	NHCH ₃	H	3-Cl-4-F-Ph	
1.546	F	F	NHCH ₃	H	4-SCF ₃ -Ph	
1.547	F	F	NHCH ₃	H	4-SOCF ₃ -Ph	
1.548	F	F	NHCH ₃	H	4-SO ₂ CF ₃ -Ph	
1.549	F	F	SH	H	4-F-Ph	
1.550	F	F	SH	H	4-Cl-Ph	
1.551	F	F	SH	H	3-CF ₃ -Ph	
1.552	F	F	SH	H	4-CF ₃ -Ph	
1.553	F	F	SH	H	4-OCF ₃ -Ph	
1.554	F	F	SH	H	4-t-Butil-Ph	
1.555	F	F	SH	H	2,4-Cl ₂ -Ph	
1.556	F	F	SH	H	3,5-Cl ₂ -Ph	
1.557	F	F	SH	H	2-CF ₃ -Ph	
1.558	F	F	SH	H	4-OCH ₃ -Ph	
1.559	F	F	SH	H	4-SCH ₃ -Ph	
1.560	F	F	SH	H	3-OCH ₃ -Ph	
1.561	F	F	SH	H	3-Cl-Ph	
1.562	F	F	SH	H	3,4-Cl ₂ -Ph	
1.563	F	F	SH	H	3-Cl-4-F-Ph	
1.564	F	F	SH	H	4-SCF ₃ -Ph	
1.565	F	F	SH	H	4-SOCF ₃ -Ph	
1.566	F	F	SH	H	4-SO ₂ CF ₃ -Ph	
1.567	F	F	CH ₂ NO ₂	H	4-F-Ph	
1.568	F	F	CH ₂ NO ₂	H	4-Cl-Ph	
1.569	F	F	CH ₂ NO ₂	H	3-CF ₃ -Ph	

No.	X ₁	X ₂	R ₂	R _a	R _b	Datos Físicos
1.570	F	F	CH ₂ NO ₂	H	4-CF ₃ -Ph	141-142
1.571	F	F	CH ₂ NO ₂	H	4-OCF ₃ -Ph	137-139
1.572	F	F	CH ₂ NO ₂	H	4-t-Butil-Ph	
1.573	F	F	CH ₂ NO ₂	H	2,4-Cl ₂ -Ph	
1.574	F	F	CH ₂ NO ₂	H	3,5-Cl ₂ -Ph	
1.575	F	F	CH ₂ NO ₂	H	2-CF ₃ -Ph	
1.576	F	F	CH ₂ NO ₂	H	4-OCH ₃ -Ph	
1.577	F	F	CH ₂ NO ₂	H	4-SCH ₃ -Ph	
1.578	F	F	CH ₂ NO ₂	H	3-OCH ₃ -Ph	
1.579	F	F	CH ₂ NO ₂	H	3-Cl-Ph	
1.580	F	F	CH ₂ NO ₂	H	3,4-Cl ₂ -Ph	
1.581	F	F	CH ₂ NO ₂	H	3-Cl-4-F-Ph	
1.582	F	F	CH ₂ NO ₂	H	4-SCF ₃ -Ph	
1.583	F	F	CH ₂ NO ₂	H	4-SOCF ₃ -Ph	
1.584	F	F	CH ₂ NO ₂	H	4-SO ₂ CF ₃ -Ph	
1.585	F	F	CH ₂ SCH ₃	H	4-F-Ph	
1.586	F	F	CH ₂ SCH ₃	H	4-Cl-Ph	
1.587	F	F	CH ₂ SCH ₃	H	3-CF ₃ -Ph	
1.588	F	F	CH ₂ SCH ₃	H	4-CF ₃ -Ph	174-176
1.589	F	F	CH ₂ SCH ₃	H	4-OCF ₃ -Ph	
1.590	F	F	CH ₂ SCH ₃	H	4-t-Butil-Ph	
1.591	F	F	CH ₂ SCH ₃	H	2,4-Cl ₂ -Ph	
1.592	F	F	CH ₂ SCH ₃	H	3,5-Cl ₂ -Ph	
1.593	F	F	CH ₂ SCH ₃	H	2-CF ₃ -Ph	
1.594	F	F	CH ₂ SCH ₃	H	4-OCH ₃ -Ph	
1.595	F	F	CH ₂ SCH ₃	H	4-SCH ₃ -Ph	
1.596	F	F	CH ₂ SCH ₃	H	3-OCH ₃ -Ph	
1.597	F	F	CH ₂ SCH ₃	H	3-Cl-Ph	
1.598	F	F	CH ₂ SCH ₃	H	3,4-Cl ₂ -Ph	
1.599	F	F	CH ₂ SCH ₃	H	3-Cl-4-F-Ph	
1.600	F	F	CH ₂ SCH ₃	H	4-SCF ₃ -Ph	
1.601	F	F	CH ₂ SCH ₃	H	4-SOCF ₃ -Ph	
1.602	F	F	CH ₂ SCH ₃	H	4-SO ₂ CF ₃ -Ph	
1.603	F	F	H	H	4-F-Fenoxilo	150-152
1.604	F	F	H	H	4-Cl-Fenoxilo	126-130
1.605	F	F	H	H	3-CF ₃ -Fenoxilo	111-114
1.606	F	F	H	H	4-CF ₃ -Fenoxilo	
1.607	F	F	H	H	4-OCF ₃ -Fenoxilo	142-144
1.608	F	F	H	H	4-t-Butyl-Fenoxilo	170-173
1.609	F	F	H	H	2,4-Cl ₂ -Fenoxilo	
1.610	F	F	H	H	3,5-Cl ₂ -Fenoxilo	146-148
1.611	F	F	H	H	2-CF ₃ -Fenoxilo	
1.612	F	F	H	H	4-OCH ₃ -Fenoxilo	
1.613	F	F	H	H	4-SCH ₃ -Fenoxilo	
1.614	F	F	H	H	3-OCH ₃ -Fenoxilo	
1.615	F	F	H	H	3-Cl-Fenoxilo	
1.616	F	F	H	H	3,4-Cl ₂ -Fenoxilo	
1.617	F	F	H	H	3-Cl-4-F-Fenoxilo	
1.618	F	F	H	H	4-SCF ₃ -Fenoxilo	
1.619	F	F	H	H	4-SOCF ₃ -Fenoxilo	

No.	X ₁	X ₂	R ₂	R _a	R _b	Datos Físicos
1.620	F	F	H	H	4-SO ₂ CF ₃ -Fenoxilo	222-223
1.621	F	F	H	H	4-F-Fenilamino	
1.622	F	F	H	H	4-Cl-Fenilamino	
1.623	F	F	H	H	3-CF ₃ -Fenilamino	
1.624	F	F	H	H	4-CF ₃ -Fenilamino	
1.625	F	F	H	H	4-OCF ₃ -Fenilamino	
1.626	F	F	H	H	4-t-Butyl-Fenilamino	
1.627	F	F	H	H	2,4-Cl ₂ -Fenilamino	
1.628	F	F	H	H	3,5-Cl ₂ -Fenilamino	
1.629	F	F	H	H	2-CF ₃ -Fenilamino	
1.630	F	F	H	H	4-OCH ₃ -Fenilamino	
1.631	F	F	H	H	4-SCH ₃ -Fenilamino	
1.632	F	F	H	H	3-OCH ₃ -Fenilamino	
1.633	F	F	H	H	3-Cl-Fenilamino	
1.634	F	F	H	H	3,4-Cl ₂ -Fenilamino	
1.635	F	F	H	H	3-Cl-4-F-Fenilamino	
1.636	F	F	H	H	4-SCF ₃ -Fenilamino	
1.637	F	F	H	H	4-SOCF ₃ -Fenilamino	
1.638	F	F	H	H	4-SO ₂ CF ₃ -Fenilamino	171-172
1.639	F	F	H	H	4-CH ₃ -Fenilamino	

Tabla 2: Compuestos de la fórmula:



5

No.	X ₁	X ₂	R ₂	R _a	R _b	Datos Físicos
2.1	F	F	H	CH ₃	4-F-Ph	171-173
2.2	F	F	H	CH ₃	4-Cl-Ph	
2.3	F	F	H	CH ₃	3-CF ₃ -Ph	
2.4	F	F	H	CH ₃	4-CF ₃ -Ph	
2.5	F	F	H	CH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
2.6	F	F	H	CH ₃	4-terbutil-Ph	
2.7	F	F	H	CH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
2.8	F	F	H	CH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
2.9	F	F	H	CH ₃	2-CF ₃ -Ph	
2.10	F	F	H	CH ₃	4-OCH ₃ -Ph	
2.11	F	F	H	CH ₃	4-SCH ₃ -Ph	195-197
2.12	F	F	H	CH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
2.13	F	F	H	CH ₃	3-Cl-Ph	
2.14	F	F	H	CH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
2.15	F	F	H	CH ₃	3-Cl-4-F-Ph	
2.16	F	F	H	OCH ₃	4-F-Ph	
2.17	F	F	H	OCH ₃	4-Cl-Ph	
2.18	F	F	H	OCH ₃	3-CF ₃ -Ph	
2.19	F	F	H	OCH ₃	4-CF ₃ -Ph	174-176

No.	X ₁	X ₂	R ₂	R _a	R _b	Datos Físicos
2.20	F	F	H	OCH ₃	4-OCF ₃ -Ph	109-111
2.21	F	F	H	OCH ₃	4-terbutil-Ph	
2.22	F	F	H	OCH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
2.23	F	F	H	OCH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	210-211
2.24	F	F	H	OCH ₃	2-CF ₃ -Ph	
2.25	F	F	H	OCH ₃	4-OCH ₃ -Ph	
2.26	F	F	H	OCH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
2.27	F	F	H	OCH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
2.28	F	F	H	OCH ₃	3-Cl-Ph	
2.29	F	F	H	OCH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
2.30	F	F	H	OCH ₃	3-Cl-4-F-Ph	196-197
2.31	F	F	H	OCH ₃	4-Br	165-166
2.32	F	F	H	CF ₃	4-F-Ph	
2.33	F	F	H	CF ₃	4-Cl-Ph	
2.34	F	F	H	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	
2.35	F	F	H	CF ₃	4-CF ₃ -Ph	
2.36	F	F	H	CF ₃	4-OCF ₃ -Ph	
2.37	F	F	H	CF ₃	4-terbutil-Ph	
2.38	F	F	H	CF ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
2.39	F	F	H	CF ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
2.40	F	F	H	CF ₃	2-CF ₃ -Ph	
2.41	F	F	H	CF ₃	4-OCH ₃ -Ph	
2.42	F	F	H	CF ₃	4-SCH ₃ -Ph	
2.43	F	F	H	CF ₃	3-OCH ₃ -Ph	
2.44	F	F	H	CF ₃	3-Cl-Ph	
2.45	F	F	H	CF ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
2.46	F	F	H	CF ₃	3-Cl-4-F-Ph	
2.47	F	F	CH ₃	H	4-F-Ph	
2.48	F	F	CH ₃	H	4-Cl-Ph	
2.49	F	F	CH ₃	H	3-CF ₃ -Ph	
2.50	F	F	CH ₃	H	4-CF ₃ -Ph	
2.51	F	F	CH ₃	H	4-OCF ₃ -Ph	
2.52	F	F	CH ₃	H	4-terbutil-Ph	
2.53	F	F	CH ₃	H	2,4-Cl ₂ -Ph	
2.54	F	F	CH ₃	H	3,5-Cl ₂ -Ph	
2.55	F	F	CH ₃	H	2-CF ₃ -Ph	
2.56	F	F	CH ₃	H	4-OCH ₃ -Ph	
2.57	F	F	CH ₃	H	4-SCH ₃ -Ph	
2.58	F	F	CH ₃	H	3-OCH ₃ -Ph	
2.59	F	F	CH ₃	H	3-Cl-Ph	
2.60	F	F	CH ₃	H	3,4-Cl ₂ -Ph	
2.61	F	F	CH ₃	H	3-Cl-4-F-Ph	
2.62	F	F	CH ₃	CH ₃	4-F-Ph	
2.63	F	F	CH ₃	CH ₃	4-Cl-Ph	
2.64	F	F	CH ₃	CH ₃	3-CF ₃ -Ph	
2.65	F	F	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ -Ph	
2.66	F	F	CH ₃	CH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
2.67	F	F	CH ₃	CH ₃	4-terbutil-Ph	
2.68	F	F	CH ₃	CH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
2.69	F	F	CH ₃	CH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
2.70	F	F	CH ₃	CH ₃	2-CF ₃ -Ph	
2.71	F	F	CH ₃	CH ₃	4-OCH ₃ -Ph	
2.72	F	F	CH ₃	CH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
2.73	F	F	CH ₃	CH ₃	3-OCH ₃ -Ph	

No.	X ₁	X ₂	R ₂	R _a	R _b	Datos Físicos
2.74	F	F	CH ₃	CH ₃	3-Cl-Ph	
2.75	F	F	CH ₃	CH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
2.76	F	F	CH ₃	CH ₃	3-Cl-4-F-Ph	
2.77	F	F	CH ₃	OCH ₃	4-F-Ph	
2.78	F	F	CH ₃	OCH ₃	4-Cl-Ph	
2.79	F	F	CH ₃	OCH ₃	3-CF ₃ -Ph	
2.80	F	F	CH ₃	OCH ₃	4-CF ₃ -Ph	
2.81	F	F	CH ₃	OCH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
2.82	F	F	CH ₃	OCH ₃	4-terbutil-Ph	
2.83	F	F	CH ₃	OCH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
2.84	F	F	CH ₃	OCH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
2.85	F	F	CH ₃	OCH ₃	2-CF ₃ -Ph	
2.86	F	F	CH ₃	OCH ₃	4-OCH ₃ -Ph	
2.87	F	F	CH ₃	OCH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
2.88	F	F	CH ₃	OCH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
2.89	F	F	CH ₃	OCH ₃	3-Cl-Ph	
2.90	F	F	CH ₃	OCH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
2.91	F	F	CH ₃	OCH ₃	3-Cl-4-F-Ph	
2.92	F	F	CH ₃	CF ₃	4-F-Ph	
2.93	F	F	CH ₃	CF ₃	4-Cl-Ph	
2.94	F	F	CH ₃	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	
2.95	F	F	CH ₃	CF ₃	4-CF ₃ -Ph	
2.96	F	F	CH ₃	CF ₃	4-OCF ₃ -Ph	
2.97	F	F	CH ₃	CF ₃	4-terbutil-Ph	
2.98	F	F	CH ₃	CF ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
2.99	F	F	CH ₃	CF ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
2.100	F	F	CH ₃	CF ₃	2-CF ₃ -Ph	
2.101	F	F	CH ₃	CF ₃	4-OCH ₃ -Ph	
2.102	F	F	CH ₃	CF ₃	4-SCH ₃ -Ph	
2.103	F	F	CH ₃	CF ₃	3-OCH ₃ -Ph	
2.104	F	F	CH ₃	CF ₃	3-Cl-Ph	
2.105	F	F	CH ₃	CF ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
2.106	F	F	CH ₃	CF ₃	3-Cl-4-F-Ph	
2.107	F	Cl	H	H	4-F-Ph	
2.108	F	Cl	H	H	4-Cl-Ph	
2.109	F	Cl	H	H	3-CF ₃ -Ph	
2.110	F	Cl	H	H	4-CF ₃ -Ph	
2.111	F	Cl	H	H	4-OCF ₃ -Ph	
2.112	F	Cl	H	H	4-terbutil-Ph	
2.113	F	Cl	H	H	2,4-Cl ₂ -Ph	
2.114	F	Cl	H	H	3,5-Cl ₂ -Ph	
2.115	F	Cl	H	H	2-CF ₃ -Ph	
2.116	F	Cl	H	H	4-OCH ₃ -Ph	
2.117	F	Cl	H	H	4-SCH ₃ -Ph	
2.118	F	Cl	H	H	3-OCH ₃ -Ph	
2.119	F	Cl	H	H	3-Cl-Ph	
2.120	F	Cl	H	H	3,4-Cl ₂ -Ph	
2.121	F	Cl	H	H	3-Cl-4-F-Ph	
2.122	F	Cl	H	CH ₃	4-F-Ph	
2.123	F	Cl	H	CH ₃	4-Cl-Ph	
2.124	F	Cl	H	CH ₃	3-CF ₃ -Ph	
2.125	F	Cl	H	CH ₃	4-CF ₃ -Ph	
2.126	F	Cl	H	CH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
2.127	F	Cl	H	CH ₃	4-terbutil-Ph	

No.	X ₁	X ₂	R ₂	R _a	R _b	Datos Físicos
2.128	F	Cl	H	CH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
2.129	F	Cl	H	CH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
2.130	F	Cl	H	CH ₃	2-CF ₃ -Ph	
2.131	F	Cl	H	CH ₃	4-OCH ₃ -Ph	
2.132	F	Cl	H	CH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
2.133	F	Cl	H	CH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
2.134	F	Cl	H	CH ₃	3-Cl-Ph	
2.135	F	Cl	H	CH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
2.136	F	Cl	H	CH ₃	3-Cl-4-F-Ph	
2.137	F	Cl	H	OCH ₃	4-F-Ph	
2.138	F	Cl	H	OCH ₃	4-Cl-Ph	
2.139	F	Cl	H	OCH ₃	3-CF ₃ -Ph	
2.140	F	Cl	H	OCH ₃	4-CF ₃ -Ph	
2.141	F	Cl	H	OCH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
2.142	F	Cl	H	OCH ₃	4-terbutil-Ph	
2.143	F	Cl	H	OCH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
2.144	F	Cl	H	OCH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
2.145	F	Cl	H	OCH ₃	2-CF ₃ -Ph	
2.146	F	Cl	H	OCH ₃	4-OCH ₃ -Ph	
2.147	F	Cl	H	OCH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
2.148	F	Cl	H	OCH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
2.149	F	Cl	H	OCH ₃	3-Cl-Ph	
2.150	F	Cl	H	OCH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
2.151	F	Cl	H	OCH ₃	3-Cl-4-F-Ph	
2.152	F	Cl	H	CF ₃	4-F-Ph	
2.153	F	Cl	H	CF ₃	4-Cl-Ph	
2.154	F	Cl	H	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	
2.155	F	Cl	H	CF ₃	4-CF ₃ -Ph	
2.156	F	Cl	H	CF ₃	4-OCF ₃ -Ph	
2.157	F	Cl	H	CF ₃	4-terbutil-Ph	
2.158	F	Cl	H	CF ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
2.159	F	Cl	H	CF ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
2.160	F	Cl	H	CF ₃	2-CF ₃ -Ph	
2.161	F	Cl	H	CF ₃	4-OCH ₃ -Ph	
2.162	F	Cl	H	CF ₃	4-SCH ₃ -Ph	
2.163	F	Cl	H	CF ₃	3-OCH ₃ -Ph	
2.164	F	Cl	H	CF ₃	3-Cl-Ph	
2.165	F	Cl	H	CF ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
2.166	F	Cl	H	CF ₃	3-Cl-4-F-Ph	
2.167	F	Cl	CH ₃	H	4-F-Ph	
2.168	F	Cl	CH ₃	H	4-Cl-Ph	
2.169	F	Cl	CH ₃	H	3-CF ₃ -Ph	
2.170	F	Cl	CH ₃	H	4-CF ₃ -Ph	
2.171	F	Cl	CH ₃	H	4-OCF ₃ -Ph	
2.172	F	Cl	CH ₃	H	4-terbutil-Ph	
2.173	F	Cl	CH ₃	H	2,4-Cl ₂ -Ph	
2.174	F	Cl	CH ₃	H	3,5-Cl ₂ -Ph	
2.175	F	Cl	CH ₃	H	2-CF ₃ -Ph	
2.176	F	Cl	CH ₃	H	4-OCH ₃ -Ph	
2.177	F	Cl	CH ₃	H	4-SCH ₃ -Ph	
2.178	F	Cl	CH ₃	H	3-OCH ₃ -Ph	
2.179	F	Cl	CH ₃	H	3-Cl-Ph	
2.180	F	Cl	CH ₃	H	3,4-Cl ₂ -Ph	
2.181	F	Cl	CH ₃	H	3-Cl-4-F-Ph	

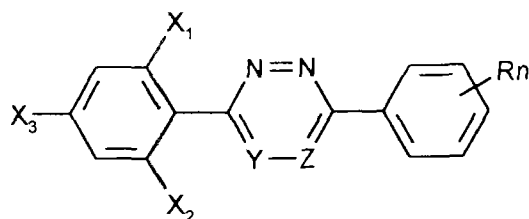
No.	X ₁	X ₂	R ₂	R _a	R _b	Datos Físicos
2.182	F	Cl	CH ₃	CH ₃	4-F-Ph	
2.183	F	Cl	CH ₃	CH ₃	4-Cl-Ph	
2.184	F	Cl	CH ₃	CH ₃	3-CF ₃ -Ph	
2.185	F	Cl	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ -Ph	
2.186	F	Cl	CH ₃	CH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
2.187	F	Cl	CH ₃	CH ₃	4-terbutil-Ph	
2.188	F	Cl	CH ₃	CH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
2.189	F	Cl	CH ₃	CH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
2.190	F	Cl	CH ₃	CH ₃	2-CF ₃ -Ph	
2.191	F	Cl	CH ₃	CH ₃	4-OCH ₃ -Ph	
2.192	F	Cl	CH ₃	CH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
2.193	F	Cl	CH ₃	CH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
2.194	F	Cl	CH ₃	CH ₃	3-Cl-Ph	
2.195	F	Cl	CH ₃	CH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
2.196	F	Cl	CH ₃	CH ₃	3-Cl-4-F-Ph	
2.197	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-F-Ph	
2.198	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-Cl-Ph	
2.199	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-CF ₃ -Ph	
2.200	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-CF ₃ -Ph	
2.201	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
2.202	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-terbutil-Ph	
2.203	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
2.204	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
2.205	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	2-CF ₃ -Ph	
2.206	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-OCH ₃ -Ph	
2.207	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
2.208	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
2.209	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-Cl-Ph	
2.210	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
2.211	F	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-Cl-4-F-Ph	
2.212	F	Cl	CH ₃	CF ₃	4-F-Ph	
2.213	F	Cl	CH ₃	CF ₃	4-Cl-Ph	
2.214	F	Cl	CH ₃	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	
2.215	F	Cl	CH ₃	CF ₃	4-CF ₃ -Ph	
2.216	F	Cl	CH ₃	CF ₃	4-OCF ₃ -Ph	
2.217	F	Cl	CH ₃	CF ₃	4-terbutil-Ph	
2.218	F	Cl	CH ₃	CF ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
2.219	F	Cl	CH ₃	CF ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
2.220	F	Cl	CH ₃	CF ₃	2-CF ₃ -Ph	
2.221	F	Cl	CH ₃	CF ₃	4-OCH ₃ -Ph	
2.222	F	Cl	CH ₃	CF ₃	4-SCH ₃ -Ph	
2.223	F	Cl	CH ₃	CF ₃	3-OCH ₃ -Ph	
2.224	F	Cl	CH ₃	CF ₃	3-Cl-Ph	
2.225	F	Cl	CH ₃	CF ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
2.226	F	Cl	CH ₃	CF ₃	3-Cl-4-F-Ph	
2.227	Cl	Cl	H	H	4-F-Ph	
2.228	Cl	Cl	H	H	4-Cl-Ph	
2.229	Cl	Cl	H	H	3-CF ₃ -Ph	
2.230	Cl	Cl	H	H	4-CF ₃ -Ph	
2.231	Cl	Cl	H	H	4-OCF ₃ -Ph	
2.232	Cl	Cl	H	H	4-terbutil-Ph	
2.233	Cl	Cl	H	H	2,4-Cl ₂ -Ph	
2.234	Cl	Cl	H	H	3,5-Cl ₂ -Ph	
2.235	Cl	Cl	H	H	2-CF ₃ -Ph	

No.	X ₁	X ₂	R ₂	R _a	R _b	Datos Físicos
2.236	Cl	Cl	H	H	4-OCH ₃ -Ph	
2.237	Cl	Cl	H	H	4-SCH ₃ -Ph	
2.238	Cl	Cl	H	H	3-OCH ₃ -Ph	
2.239	Cl	Cl	H	H	3-Cl-Ph	
2.240	Cl	Cl	H	H	3,4-Cl ₂ -Ph	
2.241	Cl	Cl	H	H	3-Cl-4-F-Ph	
2.242	Cl	Cl	H	CH ₃	4-F-Ph	
2.243	Cl	Cl	H	CH ₃	4-Cl-Ph	
2.244	Cl	Cl	H	CH ₃	3-CF ₃ -Ph	
2.245	Cl	Cl	H	CH ₃	4-CF ₃ -Ph	
2.246	Cl	Cl	H	CH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
2.247	Cl	Cl	H	CH ₃	4-terbutil-Ph	
2.248	Cl	Cl	H	CH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
2.249	Cl	Cl	H	CH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
2.250	Cl	Cl	H	CH ₃	2-CF ₃ -Ph	
2.251	Cl	Cl	H	CH ₃	4-OCH ₃ -Ph	
2.252	Cl	Cl	H	CH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
2.253	Cl	Cl	H	CH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
2.254	Cl	Cl	H	CH ₃	3-Cl-Ph	
2.255	Cl	Cl	H	CH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
2.256	Cl	Cl	H	CH ₃	3-Cl-4-F-Ph	
2.257	Cl	Cl	H	OCH ₃	4-F-Ph	
2.258	Cl	Cl	H	OCH ₃	4-Cl-Ph	
2.259	Cl	Cl	H	OCH ₃	3-CF ₃ -Ph	
2.260	Cl	Cl	H	OCH ₃	4-CF ₃ -Ph	
2.261	Cl	Cl	H	OCH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
2.262	Cl	Cl	H	OCH ₃	4-terbutil-Ph	
2.263	Cl	Cl	H	OCH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
2.264	Cl	Cl	H	OCH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
2.265	Cl	Cl	H	OCH ₃	2-CF ₃ -Ph	
2.266	Cl	Cl	H	OCH ₃	4-OCH ₃ -Ph	
2.267	Cl	Cl	H	OCH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
2.268	Cl	Cl	H	OCH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
2.269	Cl	Cl	H	OCH ₃	3-Cl-Ph	
2.270	Cl	Cl	H	OCH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
2.271	Cl	Cl	H	OCH ₃	3-Cl-4-F-Ph	
2.272	Cl	Cl	H	CF ₃	4-F-Ph	
2.273	Cl	Cl	H	CF ₃	4-Cl-Ph	
2.274	Cl	Cl	H	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	
2.275	Cl	Cl	H	CF ₃	4-CF ₃ -Ph	
2.276	Cl	Cl	H	CF ₃	4-OCF ₃ -Ph	
2.277	Cl	Cl	H	CF ₃	4-terbutil-Ph	
2.278	Cl	Cl	H	CF ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
2.279	Cl	Cl	H	CF ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
2.280	Cl	Cl	H	CF ₃	2-CF ₃ -Ph	
2.281	Cl	Cl	H	CF ₃	4-OCH ₃ -Ph	
2.282	Cl	Cl	H	CF ₃	4-SCH ₃ -Ph	
2.283	Cl	Cl	H	CF ₃	3-OCH ₃ -Ph	
2.284	Cl	Cl	H	CF ₃	3-Cl-Ph	
2.285	Cl	Cl	H	CF ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
2.286	Cl	Cl	H	CF ₃	3-Cl-4-F-Ph	
2.287	Cl	Cl	CH ₃	H	4-F-Ph	
2.288	Cl	Cl	CH ₃	H	4-Cl-Ph	
2.289	Cl	Cl	CH ₃	H	3-CF ₃ -Ph	

No.	X ₁	X ₂	R ₂	R _a	R _b	Datos Físicos
2.290	Cl	Cl	CH ₃	H	4-CF ₃ -Ph	
2.291	Cl	Cl	CH ₃	H	4-OCF ₃ -Ph	
2.292	Cl	Cl	CH ₃	H	4-terbutil-Ph	
2.293	Cl	Cl	CH ₃	H	2,4-Cl ₂ -Ph	
2.294	Cl	Cl	CH ₃	H	3,5-Cl ₂ -Ph	
2.295	Cl	Cl	CH ₃	H	2-CF ₃ -Ph	
2.296	Cl	Cl	CH ₃	H	4-OCH ₃ -Ph	
2.297	Cl	Cl	CH ₃	H	4-SCH ₃ -Ph	
2.298	Cl	Cl	CH ₃	H	3-OCH ₃ -Ph	
2.299	Cl	Cl	CH ₃	H	3-Cl-Ph	
2.300	Cl	Cl	CH ₃	H	3,4-Cl ₂ -Ph	
2.301	Cl	Cl	CH ₃	H	3-Cl-4-F-Ph	
2.302	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	4-F-Ph	
2.303	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	4-Cl-Ph	
2.304	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	3-CF ₃ -Ph	
2.305	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃ -Ph	
2.306	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
2.307	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	4-terbutil-Ph	
2.308	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
2.309	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
2.310	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	2-CF ₃ -Ph	
2.311	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	4-OCH ₃ -Ph	
2.312	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
2.313	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
2.314	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	3-Cl-Ph	
2.315	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
2.316	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	3-Cl-4-F-Ph	
2.317	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-F-Ph	
2.318	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-Cl-Ph	
2.319	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-CF ₃ -Ph	
2.320	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-CF ₃ -Ph	
2.321	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-OCF ₃ -Ph	
2.322	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-terbutil-Ph	
2.323	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
2.324	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
2.325	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	2-CF ₃ -Ph	
2.326	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-OCH ₃ -Ph	
2.327	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	4-SCH ₃ -Ph	
2.328	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-OCH ₃ -Ph	
2.329	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-Cl-Ph	
2.330	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
2.331	Cl	Cl	CH ₃	OCH ₃	3-Cl-4-F-Ph	
2.332	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	4-F-Ph	
2.333	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	4-Cl-Ph	
2.334	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	
2.335	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	4-CF ₃ -Ph	
2.336	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	4-OCF ₃ -Ph	
2.337	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	4-terbutil-Ph	
2.338	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	2,4-Cl ₂ -Ph	
2.339	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	3,5-Cl ₂ -Ph	
2.340	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	2-CF ₃ -Ph	
2.341	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	4-OCH ₃ -Ph	
2.342	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	4-SCH ₃ -Ph	
2.343	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	3-OCH ₃ -Ph	

No.	X ₁	X ₂	R ₂	R _a	R _b	Datos Físicos
2.344	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	3-Cl-Ph	
2.345	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	3,4-Cl ₂ -Ph	
2.346	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	3-Cl-4-F-Ph	
2.347	Cl	H	F	H	4-CF ₃ -Ph	
2.348	F	F	H	H	3,4-Cl ₂ -Ph	sólido
2.349	F	F	H	H	4-SCH ₃ -Ph	125-129
2.350	F	F	H	H	2-CH ₃ -Ph	

Tabla 3: Compuestos de la fórmula:



5

No.	X ₁	X ₂	X ₃	Y	Z	R _n	Datos Físicos ¹⁾
3.1	Cl	H	Cl	N	CH	4-OPh	MH ⁺ : 394
3.2	Cl	H	Cl	N	CH	4-CF ₃	
3.3	Cl	H	Cl	N	CH	4-(3-CF ₃ -Ph)	
3.4	Cl	H	Cl	N	CH	4-(4-CF ₃ -Ph)	MH ⁺ : 446
3.5	Cl	H	Cl	N	CH	4-(2,4-Cl ₂ -Ph)	MH ⁺ : 446
3.6	Cl	H	Cl	N	CH	2,4-Cl ₂	MH ⁺ : 369.9
3.7	F	F	H	N	CH	4-(4-CH ₃ -Ph)	MH ⁺ : 360
3.8	F	F	H	N	CH	4-OPh	MH ⁺ : 362.1
3.9	F	F	H	N	CH	4-terbutilo	MH ⁺ : 362.1
3.10	F	F	H	N	CH	2,6-F ₂	MH ⁺ : 305.9
3.11	F	F	H	N	CH	2,4-Cl ₂	MH ⁺ : 338
3.12	F	F	H	N	CH	4-(4-Cl-Ph)	217-224
3.13	F	F	H	N	CH	4-(3-CF ₃ -Ph)	193-194
3.14	F	F	H	N	CH	4-(2,4-Cl ₂ -Ph)	214-215
3.15	F	F	H	N	CH	4-(4-OCF ₃ -Ph)	225-230
3.16	F	F	H	N	CH	4-(4-CF ₃ -Ph)	243-245
3.17	F	F	H	N	CH	4-Br	180-181
3.18	F	F	H	N	CH	4-(4-F-Ph)	195-197
3.19	F	F	H	N	CH	4-(3-Cl-4-F-Ph)	218-220
3.20	F	F	H	N	CH	4-(3,5-Cl ₂ -Ph)	205-207
3.21	F	F	H	N	CH	4-(4-SCH ₃ -Ph)	199-201
3.22	F	F	H	N	CH	4-(3-Cl-Ph)	185-187
3.23	F	F	H	N	CH	4-(3-OCH ₃ -Ph)	181-183
3.24	F	F	H	N	CH	4-(4-t-Bu-Ph)	206-207
3.25	F	F	H	N	CH	4-(4-OCH ₃ -Ph)	226-229
3.26	F	F	H	N	CH	4-(3,4-Cl ₂ -Ph)	235-237
3.27	F	F	H	N	CH	4-(2-CF ₃ -Ph)	151-153
3.28	F	F	H	CH	N	4-Br	167-169
3.29	F	F	H	CH	N	4-(4-F-Ph)	207-209
3.30	F	F	H	CH	N	4-(4-Cl-Ph)	216-218
3.31	F	F	H	CH	N	4-(3-CF ₃ -Ph)	194-195
3.32	F	F	H	CH	N	4-(4-CF ₃ -Ph)	230-232
3.33	F	F	H	CH	N	4-(4-OCF ₃ -Ph)	199-202
3.34	F	F	H	CH	N	4-(4-terbutil-Ph)	187-189

No.	X ₁	X ₂	X ₃	Y	Z	R _n	Datos Físicos ¹⁾
3.35	F	F	H	CH	N	4-(2,4-Cl ₂ -Ph)	267-269
3.36	F	F	H	CH	N	4-(3,5-Cl ₂ -Ph)	213-214
3.37	F	F	H	CH	N	4-(2-CF ₃ -Ph)	154-155
3.38	F	F	H	CH	N	4-(4-OCH ₃ -Ph)	188-191
3.39	F	F	H	CH	N	4-(4-SCH ₃ -Ph)	212-214
3.40	F	F	H	CH	N	4-(3-OCH ₃ -Ph)	168-170
3.41	F	F	H	CH	N	4-(3-Cl-Ph)	177-180
3.42	F	F	H	CH	N	4-(3,4-Cl ₂ -Ph)	261-263
3.43	F	F	H	CH	N	4-(3-Cl-4-F-Ph)	236-237
3.44	Cl	H	Cl	CH	N	H	163-165
3.45	Cl	H	F	N	CH	4-Br	188-189
3.46	Cl	H	F	N	CH	4-(3-Cl-4-F-Ph)	199-200
3.47	Cl	H	F	N	CH	4-(3-Cl-Ph)	194-195
3.48	F	F	H	N	CH	4-(3-CF ₃ -Fenoxilo)	111-114
3.49	F	F	H	N	CH	4-Benciloxilo	179-181
3.50	F	F	H	N	CH	4-CF ₃	161-163
3.51	F	F	H	N	CH	4-([3-CH=NOMe]-Ph)	200-201
3.52	F	F	H	N	CH	4-([3-CH=NOEt]-Ph)	129-131
3.53	F	F	H	N	CH	4-([3-C{CH ₃ }=NOEt]-Ph)	141-143
3.54	Cl	H	H	N	CH	4-(4-F-Ph)	
3.55	Cl	H	H	N	CH	4-(4-Cl-Ph)	
3.56	Cl	H	H	N	CH	4-(3-CF ₃ -Ph)	
3.57	Cl	H	H	N	CH	4-(4-CF ₃ -Ph)	
3.58	Cl	H	H	N	CH	4-(4-OCF ₃ -Ph)	
3.59	Cl	H	H	N	CH	4-(4-t-Butil-Ph)	
3.60	Cl	H	H	N	CH	4-(2,4-Cl ₂ -Ph)	
3.61	Cl	H	H	N	CH	4-(3,5-Cl ₂ -Ph)	
3.62	Cl	H	H	N	CH	4-(2-CF ₃ -Ph)	
3.63	Cl	H	H	N	CH	4-(4-OCH ₃ -Ph)	
3.64	Cl	H	H	N	CH	4-(4-SCH ₃ -Ph)	
3.65	Cl	H	H	N	CH	4-(3-OCH ₃ -Ph)	
3.66	Cl	H	H	N	CH	4-(3-Cl-Ph)	
3.67	Cl	H	H	N	CH	4-(3,4-Cl ₂ -Ph)	
3.68	Cl	H	H	N	CH	4-(3-Cl-4-F-Ph)	
3.69	Cl	H	H	N	CH	4-Br	
3.70	Cl	H	H	N	CH	4-(4-CH ₃ -Ph)	
3.71	CH ₃	H	F	N	CH	4-(4-F-Ph)	
3.72	CH ₃	H	F	N	CH	4-(4-Cl-Ph)	
3.73	CH ₃	H	F	N	CH	4-(3-CF ₃ -Ph)	
3.74	CH ₃	H	F	N	CH	4-(4-CF ₃ -Ph)	
3.75	CH ₃	H	F	N	CH	4-(4-OCF ₃ -Ph)	
3.76	CH ₃	H	F	N	CH	4-(4-t-Butil-Ph)	
3.77	CH ₃	H	F	N	CH	4-(2,4-Cl ₂ -Ph)	
3.78	CH ₃	H	F	N	CH	4-(3,5-Cl ₂ -Ph)	
3.79	CH ₃	H	F	N	CH	4-(2-CF ₃ -Ph)	
3.80	CH ₃	H	F	N	CH	4-(4-OCH ₃ -Ph)	
3.81	CH ₃	H	F	N	CH	4-(4-SCH ₃ -Ph)	
3.82	CH ₃	H	F	N	CH	4-(3-OCH ₃ -Ph)	
3.83	CH ₃	H	F	N	CH	4-(3-Cl-Ph)	
3.84	CH ₃	H	F	N	CH	4-(3,4-Cl ₂ -Ph)	
3.85	CH ₃	H	F	N	CH	4-(3-Cl-4-F-Ph)	
3.86	CH ₃	H	F	N	CH	4-Br	
3.87	CH ₃	H	F	N	CH	4-(4-CH ₃ -Ph)	
3.88	F	CH ₃	H	N	CH	4-(4-F-Ph)	

No.	X ₁	X ₂	X ₃	Y	Z	R _n	Datos Físicos ¹⁾
3.89	F	CH ₃	H	N	CH	4-(4-Cl-Ph)	
3.90	F	CH ₃	H	N	CH	4-(3-CF ₃ -Ph)	
3.91	F	CH ₃	H	N	CH	4-(4-CF ₃ -Ph)	
3.92	F	CH ₃	H	N	CH	4-(4-OCF ₃ -Ph)	
3.93	F	CH ₃	H	N	CH	4-(4-t-Butil-Ph)	
3.94	F	CH ₃	H	N	CH	4-(2,4-Cl ₂ -Ph)	
3.95	F	CH ₃	H	N	CH	4-(3,5-Cl ₂ -Ph)	
3.96	F	CH ₃	H	N	CH	4-(2-CF ₃ -Ph)	
3.97	F	CH ₃	H	N	CH	4-(4-OCH ₃ -Ph)	
3.98	F	CH ₃	H	N	CH	4-(4-SCH ₃ -Ph)	
3.99	F	CH ₃	H	N	CH	4-(3-OCH ₃ -Ph)	
3.100	F	CH ₃	H	N	CH	4-(3-Cl-Ph)	
3.101	F	CH ₃	H	N	CH	4-(3,4-Cl ₂ -Ph)	
3.102	F	CH ₃	H	N	CH	4-(3-Cl-4-F-Ph)	
3.103	F	CH ₃	H	N	CH	4-Br	173-174
3.104	F	CH ₃	H	N	CH	4-(4-CH ₃ -Ph)	
3.105	Cl	H	F	N	CH	4-(4-F-Ph)	
3.106	Cl	H	F	N	CH	4-(4-Cl-Ph)	
3.107	Cl	H	F	N	CH	4-(3-CF ₃ -Ph)	146-147
3.108	Cl	H	F	N	CH	4-(4-CF ₃ -Ph)	195-196
3.109	Cl	H	F	N	CH	4-(4-OCF ₃ -Ph)	198-200
3.110	Cl	H	F	N	CH	4-(4-t-Butil-Ph)	
3.111	Cl	H	F	N	CH	4-(2,4-Cl ₂ -Ph)	
3.112	Cl	H	F	N	CH	4-(3,5-Cl ₂ -Ph)	198-200
3.113	Cl	H	F	N	CH	4-(2-CF ₃ -Ph)	
3.114	Cl	H	F	N	CH	4-(4-OCH ₃ -Ph)	
3.115	Cl	H	F	N	CH	4-(4-SCH ₃ -Ph)	
3.116	Cl	H	F	N	CH	4-(3-OCH ₃ -Ph)	
3.117	Cl	H	F	N	CH	4-(3-Cl-Ph)	194-195
3.118	Cl	H	F	N	CH	4-(3,4-Cl ₂ -Ph)	
3.119	Cl	H	F	N	CH	4-(3-Cl-4-F-Ph)	199-200
3.120	Cl	H	F	N	CH	4-Br	
3.121	Cl	H	F	N	CH	4-(4-CH ₃ -Ph)	
3.122	F	H	Cl	N	CH	4-(4-F-Ph)	
3.123	F	H	Cl	N	CH	4-(4-Cl-Ph)	
3.124	F	H	Cl	N	CH	4-(3-CF ₃ -Ph)	
3.125	F	H	Cl	N	CH	4-(4-CF ₃ -Ph)	
3.126	F	H	Cl	N	CH	4-(4-OCF ₃ -Ph)	
3.127	F	H	Cl	N	CH	4-(4-t-Butil-Ph)	
3.128	F	H	Cl	N	CH	4-(2,4-Cl ₂ -Ph)	
3.129	F	H	Cl	N	CH	4-(3,5-Cl ₂ -Ph)	
3.130	F	H	Cl	N	CH	4-(2-CF ₃ -Ph)	
3.131	F	H	Cl	N	CH	4-(4-OCH ₃ -Ph)	
3.132	F	H	Cl	N	CH	4-(4-SCH ₃ -Ph)	
3.133	F	H	Cl	N	CH	4-(3-OCH ₃ -Ph)	
3.134	F	H	Cl	N	CH	4-(3-Cl-Ph)	
3.135	F	H	Cl	N	CH	4-(3,4-Cl ₂ -Ph)	
3.136	F	H	Cl	N	CH	4-(3-Cl-4-F-Ph)	
3.137	F	H	Cl	N	CH	4-Br	
3.138	F	H	Cl	N	CH	4-(4-CH ₃ -Ph)	
3.139	OMe	OMe	H	N	CH	4-(4-F-Ph)	
3.140	OMe	OMe	H	N	CH	4-(4-Cl-Ph)	
3.141	OMe	OMe	H	N	CH	4-(3-CF ₃ -Ph)	
3.142	OMe	OMe	H	N	CH	4-(4-CF ₃ -Ph)	

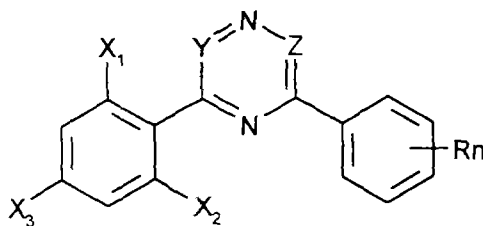
No.	X ₁	X ₂	X ₃	Y	Z	R _n	Datos Físicos ¹⁾
3.143	OMe	OMe	H	N	CH	4-(4-OCF ₃ -Ph)	
3.144	OMe	OMe	H	N	CH	4-(4-t-Butil-Ph)	
3.145	OMe	OMe	H	N	CH	4-(2,4-Cl ₂ -Ph)	
3.146	OMe	OMe	H	N	CH	4-(3,5-Cl ₂ -Ph)	
3.147	OMe	OMe	H	N	CH	4-(2-CF ₃ -Ph)	
3.148	OMe	OMe	H	N	CH	4-(4-OCH ₃ -Ph)	
3.149	OMe	OMe	H	N	CH	4-(4-SCH ₃ -Ph)	
3.150	OMe	OMe	H	N	CH	4-(3-OCH ₃ -Ph)	
3.151	OMe	OMe	H	N	CH	4-(3-Cl-Ph)	
3.152	OMe	OMe	H	N	CH	4-(3,4-Cl ₂ -Ph)	
3.153	OMe	OMe	H	N	CH	4-(3-Cl-4-F-Ph)	
3.154	OMe	OMe	H	N	CH	4-Br	
3.155	OMe	OMe	H	N	CH	4-(4-CH ₃ -Ph)	
3.156	F	F	OMe	N	CH	4-(4-F-Ph)	
3.157	F	F	OMe	N	CH	4-(4-Cl-Ph)	
3.158	F	F	OMe	N	CH	4-(3-CF ₃ -Ph)	
3.159	F	F	OMe	N	CH	4-(4-CF ₃ -Ph)	
3.160	F	F	OMe	N	CH	4-(4-OCF ₃ -Ph)	
3.161	F	F	OMe	N	CH	4-(4-t-Butil-Ph)	
3.162	F	F	OMe	N	CH	4-(2,4-Cl ₂ -Ph)	
3.163	F	F	OMe	N	CH	4-(3,5-Cl ₂ -Ph)	
3.164	F	F	OMe	N	CH	4-(2-CF ₃ -Ph)	
3.165	F	F	OMe	N	CH	4-(4-OCH ₃ -Ph)	
3.166	F	F	OMe	N	CH	4-(4-SCH ₃ -Ph)	
3.167	F	F	OMe	N	CH	4-(3-OCH ₃ -Ph)	
3.168	F	F	OMe	N	CH	4-(3-Cl-Ph)	
3.169	F	F	OMe	N	CH	4-(3,4-Cl ₂ -Ph)	
3.170	F	F	OMe	N	CH	4-(3-Cl-4-F-Ph)	
3.171	F	F	OMe	N	CH	4-Br	
3.172	F	F	OMe	N	CH	4-(4-CH ₃ -Ph)	
3.173	F	CF ₃	H	N	CH	4-(4-F-Ph)	
3.174	F	CF ₃	H	N	CH	4-(4-Cl-Ph)	
3.175	F	CF ₃	H	N	CH	4-(3-CF ₃ -Ph)	
3.176	F	CF ₃	H	N	CH	4-(4-CF ₃ -Ph)	
3.177	F	CF ₃	H	N	CH	4-(4-OCF ₃ -Ph)	
3.178	F	CF ₃	H	N	CH	4-(4-t-Butil-Ph)	
3.179	F	CF ₃	H	N	CH	4-(2,4-Cl ₂ -Ph)	
3.180	F	CF ₃	H	N	CH	4-(3,5-Cl ₂ -Ph)	
3.181	F	CF ₃	H	N	CH	4-(2-CF ₃ -Ph)	
3.182	F	CF ₃	H	N	CH	4-(4-OCH ₃ -Ph)	
3.183	F	CF ₃	H	N	CH	4-(4-SCH ₃ -Ph)	
3.184	F	CF ₃	H	N	CH	4-(3-OCH ₃ -Ph)	
3.185	F	CF ₃	H	N	CH	4-(3-Cl-Ph)	
3.186	F	CF ₃	H	N	CH	4-(3,4-Cl ₂ -Ph)	
3.187	F	CF ₃	H	N	CH	4-(3-Cl-4-F-Ph)	
3.188	F	CF ₃	H	N	CH	4-Br	
3.189	F	CF ₃	H	N	CH	4-(4-CH ₃ -Ph)	
3.190	SMe	H	H	N	CH	4-(4-F-Ph)	
3.191	SMe	H	H	N	CH	4-(4-Cl-Ph)	
3.192	SMe	H	H	N	CH	4-(3-CF ₃ -Ph)	
3.193	SMe	H	H	N	CH	4-(4-CF ₃ -Ph)	
3.194	SMe	H	H	N	CH	4-(4-OCF ₃ -Ph)	
3.195	SMe	H	H	N	CH	4-(4-t-Butil-Ph)	
3.196	SMe	H	H	N	CH	4-(2,4-Cl ₂ -Ph)	

No.	X ₁	X ₂	X ₃	Y	Z	R _n	Datos Físicos ¹⁾
3.197	SMe	H	H	N	CH	4-(3,5-Cl ₂ -Ph)	
3.198	SMe	H	H	N	CH	4-(2-CF ₃ -Ph)	
3.199	SMe	H	H	N	CH	4-(4-OCH ₃ -Ph)	
3.200	SMe	H	H	N	CH	4-(4-SCH ₃ -Ph)	
3.201	SMe	H	H	N	CH	4-(3-OCH ₃ -Ph)	
3.202	SMe	H	H	N	CH	4-(3-Cl-Ph)	
3.203	SMe	H	H	N	CH	4-(3,4-Cl ₂ -Ph)	
3.204	SMe	H	H	N	CH	4-(3-Cl-4-F-Ph)	
3.205	SMe	H	H	N	CH	4-Br	
3.206	SMe	H	H	N	CH	4-(4-CH ₃ -Ph)	
3.207	Cl	H	F	N	CH	4-(4-SCF ₃ -Ph)	
3.208	Cl	H	F	N	CH	4-(4-SOCF ₃ -Ph)	
3.209	Cl	H	F	N	CH	4-(4-SO ₂ CF ₃ -Ph)	
3.210	Cl	H	F	N	CCH ₃	4-(4-CF ₃ -Ph)	
3.211	Cl	H	F	N	CCH ₃	4-(4-OCF ₃ -Ph)	
3.212	Cl	H	F	N	CCH ₃	4-(2,5-Cl ₂ -Ph)	
3.213	Cl	H	F	N	CCH ₃	4-(3-Cl,4-F-Ph)	
3.214	Cl	H	F	N	CCH ₃	4-(4-SCF ₃ -Ph)	
3.215	F	F	H	N	CH	4-(4-CF ₃ -Benciloxilo)	173-175
3.216	F	F	H	N	CH	4-(3-CF ₃ -Benciloxilo)	151-153

¹⁾MH⁺: Pico molecular a partir de las mediciones LC-MS; otras cifras: punto de fusión.

Tabla 4: Compuestos de la fórmula:

5



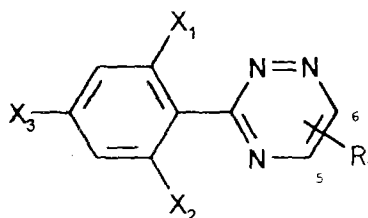
No.	X ₁	X ₂	X ₃	Y	Z	R _n	Datos Físicos ¹⁾
4.1	Cl	H	Cl	N	CH	4-OPh	MH ⁺ : 394
4.2	Cl	H	Cl	N	CH	4-CF ₃	MH ⁺ : 369.9
4.3	Cl	H	Cl	N	CH	4-(3-CF ₃ -Ph)	MH ⁺ : 446
4.4	Cl	H	Cl	N	CH	4-(4-CF ₃ -Ph)	MH ⁺ : 446
4.5	Cl	H	Cl	N	CH	4-(2,4-Cl ₂ -Ph)	MH ⁺ : 446
4.6	Cl	H	Cl	N	CH	2,4-Cl ₂	MH ⁺ : 369.9
4.7	Cl	H	Cl	N	CH	4-(4-Cl-Ph)	MH ⁺ : 411.9
4.8	Cl	H	Cl	N	CH	4-terbutilo	MH ⁺ : 357.9
4.9	Cl	H	Cl	N	CH	4-(4-CH ₃ -Ph)	MH ⁺ : 392
4.10	Cl	H	Cl	N	CH	2,6-F ₂	MH ⁺ : 337.9
4.11	F	F	H	N	CH	4-CF ₃	MH ⁺ : 337.9
4.12	F	F	H	N	CH	4-(4-CH ₃ -Ph)	MH ⁺ : 360
4.13	F	F	H	N	CH	4-(4-Cl-Ph)	MH ⁺ : 380
4.14	F	F	H	N	CH	4-(3-CF ₃ -Ph)	MH ⁺ : 414.1
4.15	F	F	H	N	CH	4-(4-CF ₃ -Ph)	MH ⁺ : 414.1

No.	X ₁	X ₂	X ₃	Y	Z	R _n	Datos Físicos ¹⁾
4.16	F	F	H	N	CH	4-OPh	MH ⁺ : 362
4.17	F	F	H	N	CH	4-terbutilo	MH ⁺ : 326.1
4.18	F	F	H	N	CH	4-(2,4-Cl ₂ -Ph)	MH ⁺ : 413.9
4.19	F	F	H	N	CH	2,6-F ₂	MH ⁺ : 306
4.20	F	F	H	N	CH	2,4-Cl ₂	MH ⁺ : 337.9
4.21	F	F	H	N	CH	4-Br	179-180
4.22	F	F	H	N	CH	4-(4-F-Ph)	172-173
4.23	F	F	H	N	CH	4-(4-OCH ₃ -Ph)	139-140
4.24	F	F	H	N	CH	4-(4-t-Bu-Ph)	210-211
4.25	F	F	H	N	CH	4-(3-OCH ₃ -Ph)	193-194
4.26	F	F	H	N	CH	4-(2-CF ₃ -Ph)	193-194
4.27	F	F	H	N	CH	4-(3-Cl-4-F-Ph)	187-188
4.28	F	F	H	N	CH	4-(3-Cl-Ph)	213-215
4.29	F	F	H	N	CH	4-(3,5-Cl ₂ -Ph)	197-199
4.30	F	F	H	CH	N	4-(4-Cl-Ph)	189-190
4.31	F	F	H	CH	N	4-(3-CF ₃ -Ph)	155-156
4.32	F	F	H	CH	N	4-(4-CF ₃ -Ph)	193-194
4.33	F	F	H	CH	N	4-(4-OCF ₃ -Ph)	159-160
4.34	F	F	H	CH	N	4-(3,4-Cl ₂ -Ph)	208-209
4.35	F	F	H	CH	N	4-(3-Cl-4-F-Ph)	203-204
4.36	F	F	H	CH	N	4-Br	
4.37	Cl	H	F	N	CH	4-Br	sólido
4.38	Cl	H	F	N	CH	4-(4-CF ₃ -Ph)	126-127
4.39	Cl	H	F	N	CH	4-(4-OCF ₃ -Ph)	107-108
4.40	Cl	H	F	N	CH	4-(3,5-Cl ₂ -Ph)	196-198
4.41	F	F	H	N	CH	4-(4-OCF ₃ -Ph)	Harz
4.42	F	F	H	N	CH	4-(4-Cl-Fenoxilo)	Harz

¹⁾MH⁺: Pico molecular a partir de las mediciones LC-MS; otras cifras: punto de fusión.

Tabla 5: Compuestos de la fórmula:

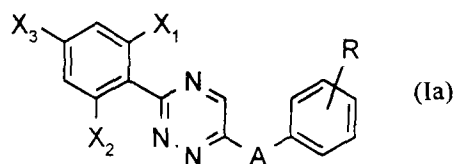
5



No.	X ₁	X ₂	X ₃	R ₁	Datos Físicos
5.1	Cl	H	Cl	5-(4-feniltiazol-2-ilo)	
5.2	Cl	H	Cl	6-(benzofuran-5-ilo)	
5.3	Cl	H	Cl	5-(tiazol-2-ilo)	
5.4	Cl	H	Cl	6-(benzotiazol-2-ilo)	
5.5	F	F	H	5-(tiazol-2-ilo)	
5.6	F	F	H	6-(4-feniltiazol-2-ilo)	
5.7	Cl	H	Cl	6-(4-feniltiazol-2-ilo)	
5.8	F	F	H	5-(indol-3-ilo)	
5.9	Cl	H	Cl	5-(indol-3-ilo)	

No.	X ₁	X ₂	X ₃	R ₁	Datos Físicos
5.10	Cl	H	Cl	6-(indol-3-ilo)	196-197
5.11	F	F	H	6-(5-Br-tiofen-2-ilo)	
5.12	F	F	H	6-(5-feniltiofen-2-ilo)	
5.13	F	F	H	6-(furan-2-ilo)	131-132
5.14	F	F	H	6-(naft-2-ilo)	160-162

Tabla A:



No.	X ₁	X ₂	X ₃	A
A.1	F	F	F	-C≡C-
A.2	F	F	Cl	-C≡C-
A.3	F	F	H	-C≡C-
A.4	F	Cl	F	-C≡C-
A.5	F	Cl	Cl	-C≡C-
A.6	F	Cl	H	-C≡C-
A.7	Cl	Cl	F	-C≡C-
A.8	Cl	Cl	Cl	-C≡C-
A.9	Cl	Cl	H	-C≡C-
A.10	Cl	H	F	-C≡C-
A.11	F	H	H	-C≡C-
A.12	Cl	H	H	-C≡C-
A.13	F	F	F	-HC=CH-
A.14	F	F	Cl	-HC=CH-
A.15	F	F	H	-HC=CH-
A.16	F	Cl	F	-HC=CH-
A.17	F	Cl	Cl	-HC=CH-
A.18	F	Cl	H	-HC=CH-
A.19	Cl	Cl	F	-HC=CH-
A.20	Cl	Cl	Cl	-HC=CH-
A.21	Cl	Cl	H	-HC=CH-
A.22	Cl	H	F	-HC=CH-
A.23	F	H	H	-HC=CH-
A.24	Cl	H	H	-HC=CH-
A.25	F	F	F	O
A.26	F	F	Cl	O
A.27	F	F	H	O
A.28	F	Cl	F	O
A.29	F	Cl	Cl	O
A.30	F	Cl	H	O
A.31	Cl	Cl	F	O
A.32	Cl	Cl	Cl	O
A.33	Cl	Cl	H	O
A.34	Cl	H	F	O
A.35	F	H	H	O
A.36	Cl	H	H	O
A.37	F	F	F	NH

No.	X ₁	X ₂	X ₃	A
A.38	F	F	Cl	NH
A.39	F	F	H	NH
A.40	F	Cl	F	NH
A.41	F	Cl	Cl	NH
A.42	F	Cl	H	NH
A.43	Cl	Cl	F	NH
A.44	Cl	Cl	Cl	NH
A.45	Cl	Cl	H	NH
A.46	Cl	H	F	NH
A.47	F	H	H	NH
A.48	Cl	H	H	NH
A.49	F	F	F	N(CH ₃)
A.50	F	F	Cl	N(CH ₃)
A.51	F	F	H	N(CH ₃)
A.52	F	Cl	F	N(CH ₃)
A.53	F	Cl	Cl	N(CH ₃)
A.54	F	Cl	H	N(CH ₃)
A.55	Cl	Cl	F	N(CH ₃)
A.56	Cl	Cl	Cl	N(CH ₃)
A.57	Cl	Cl	H	N(CH ₃)
A.58	Cl	H	F	N(CH ₃)
A.59	F	H	H	N(CH ₃)
A.60	Cl	H	H	N(CH ₃)
A.61	F	F	F	*NH(CH ₂)
A.62	F	F	Cl	*NH(CH ₂)
A.63	F	F	H	*NH(CH ₂)
A.64	F	Cl	F	*NH(CH ₂)
A.65	F	Cl	Cl	*NH(CH ₂)
A.66	F	Cl	H	*NH(CH ₂)
A.67	Cl	Cl	F	*NH(CH ₂)
A.68	Cl	Cl	Cl	*NH(CH ₂)
A.69	Cl	Cl	H	*NH(CH ₂)
A.70	Cl	H	F	*NH(CH ₂)
A.71	F	H	H	*NH(CH ₂)
A.72	Cl	H	H	*NH(CH ₂)
A.73	F	F	F	S
A.74	F	F	Cl	S
A.75	F	F	H	S
A.76	F	Cl	F	S
A.77	F	Cl	Cl	S
A.78	F	Cl	H	S
A.79	Cl	Cl	F	S
A.80	Cl	Cl	Cl	S
A.81	Cl	Cl	H	S
A.82	Cl	H	F	S
A.83	F	H	H	S
A.84	Cl	H	H	S
A.85	F	F	F	SO
A.86	F	F	Cl	SO
A.87	F	F	H	SO
A.88	F	Cl	F	SO
A.89	F	Cl	Cl	SO
A.90	F	Cl	H	SO
A.91	Cl	Cl	F	SO

No.	X ₁	X ₂	X ₃	A
A.92	Cl	Cl	Cl	SO
A.93	Cl	Cl	H	SO
A.94	Cl	H	F	SO
A.95	F	H	H	SO
A.96	Cl	H	H	SO
A.97	F	F	F	SO ₂
A.98	F	F	Cl	SO ₂
A.99	F	F	H	SO ₂
A.100	F	Cl	F	SO ₂
A.101	F	Cl	Cl	SO ₂
A.102	F	Cl	H	SO ₂
A.103	Cl	Cl	F	SO ₂
A.104	Cl	Cl	Cl	SO ₂
A.105	Cl	Cl	H	SO ₂
A.106	Cl	H	F	SO ₂
A.107	F	H	H	SO ₂
A.108	Cl	H	H	SO ₂

*N enlazado con anillo de triazina.

Tabla 6.1: Compuestos de la fórmula general (Ia), en donde
 5 R es 4-Cl, y la combinación de sustituyentes X₁, X₂, X₃, y A para
 un compuesto corresponde en cada caso a una línea A.1 a
 A.108 en la Tabla A.

Tabla 6.2: Compuestos de la fórmula general (Ia), en donde
 10 R es 4-F, y la combinación de sustituyentes X₁, X₂, X₃, y A para
 un compuesto corresponde en cada caso a una línea A.1 a A.108
 en la Tabla A.

Tabla 6.3: Compuestos de la fórmula general (Ia), en donde
 R es 4-CH₃, y la combinación de sustituyentes X₁, X₂, X₃, y A
 para un compuesto corresponde en cada caso a una línea A.1 a
 15 A.108 en la Tabla A.

Tabla 6.4: Compuestos de la fórmula general (Ia), en donde R es 4-CF₃, y la combinación de sustituyentes X₁, X₂, X₃, y A para un compuesto corresponde en cada caso a una línea A.1 a A.108 en la Tabla A.

5 **Tabla 6.5:** Compuestos de la fórmula general (Ia), en donde R es 3-CF₃, y la combinación de sustituyentes X₁, X₂, X₃, y A para un compuesto corresponde en cada caso a una línea A.1 a A.108 en la Tabla A.

Tabla 6.6: Compuestos de la fórmula general (Ia), en donde
10 R es 4-OCF₃, y la combinación de sustituyentes X₁, X₂, X₃, y A para un compuesto corresponde en cada caso a una línea A.1 a A.108 en la Tabla A.

Tabla 6.7: Compuestos de la fórmula general (Ia), en donde
15 R es 2-Cl, y la combinación de sustituyentes X₁, X₂, X₃, y A para un compuesto corresponde en cada caso a una línea A.1 a A.108 en la Tabla A.

Tabla 6.8: Compuestos de la fórmula general (Ia), en donde
20 R es 3-Cl, y la combinación de sustituyentes X₁, X₂, X₃, y A para un compuesto corresponde en cada caso a una línea A.1 a A.108 en la Tabla A.

Tabla 6.9: Compuestos de la fórmula general (Ia), en donde R es 2-CF, y la combinación de sustituyentes X₁, X₂, X₃, y A para un compuesto corresponde en cada caso a una línea A.1 a A.108 en la Tabla A.

Tabla 6.10: Compuestos de la fórmula general (Ia), en donde R es H, y la combinación de sustituyentes X_1 , X_2 , X_3 , y A para un compuesto corresponde en cada caso a una línea A.1 a A.108 en la Tabla A.

- 5 **Tabla 6.11:** Compuestos de la fórmula general (Ia), en donde R es 4-OCH₃, y la combinación de sustituyentes X_1 , X_2 , X_3 , y A para un compuesto corresponde en cada caso a una línea A.1 a A.108 en la Tabla A.

- 10 **Tabla 6.12:** Compuestos de la fórmula general (Ia), en donde R es 2,4-Cl₂, y la combinación de sustituyentes X_1 , X_2 , X_3 , y A para un compuesto corresponde en cada caso a una línea A.1 a A.108 en la Tabla A.

- 15 **Tabla 6.13:** Compuestos de la fórmula general (Ia), en donde R es 3,5-Cl₂, y la combinación de sustituyentes X_1 , X_2 , X_3 , y A para un compuesto corresponde en cada caso a una línea A.1 a A.108 en la Tabla A.

- 20 **Tabla 6.14:** Compuestos de la fórmula general (Ia), en donde R es 4-SCH₃, y la combinación de sustituyentes X_1 , X_2 , X_3 , y A para un compuesto corresponde en cada caso a una línea A.1 a A.108 en la Tabla A.

Tabla 6.15: Compuestos de la fórmula general (Ia), en donde R es 4-SCF₃, y la combinación de sustituyentes X_1 , X_2 , X_3 , y A para un compuesto corresponde en cada caso a una línea A.1 a A.108 en la Tabla A.

Tabla 6.16: Compuestos de la fórmula general (Ia), en donde R es 3-Cl, 4-F, y la combinación de sustituyentes X_1 , X_2 , X_3 , y A para un compuesto corresponde en cada caso a una línea A.1 a A.108 en la Tabla A.

- 5 **Tabla 6.17:** Compuestos de la fórmula general (Ia), en donde R es 4-t-But, y la combinación de sustituyentes X_1 , X_2 , X_3 , y A para un compuesto corresponde en cada caso a una línea A.1 a A.108 en la Tabla A.

- 10 **Tabla 6.18:** Compuestos de la fórmula general (Ia), en donde R es 3,4-Cl₂, y la combinación de sustituyentes X_1 , X_2 , X_3 , y A para un compuesto corresponde en cada caso a una línea A.1 a A.108 en la Tabla A.

- 15 **Tabla 6.19:** Compuestos de la fórmula general (Ia), en donde R es 4-Br, y la combinación de sustituyentes X_1 , X_2 , X_3 , y A para un compuesto corresponde en cada caso a una línea A.1 a A.108 en la Tabla A.

- 20 **Tabla 6.20:** Compuestos de la fórmula general (Ia), en donde R es 4-O(CH₂)₅CH₃, y la combinación de sustituyentes X_1 , X_2 , X_3 , y A para un compuesto corresponde en cada caso a una línea A.1 a A.108 en la Tabla A.

Tabla 6.21: Compuestos de la fórmula general (Ia), en donde R es 4-O(CH₂)₂CH₃, y la combinación de sustituyentes X_1 , X_2 , X_3 , y A para un compuesto corresponde en cada caso a una línea A.1 a A.108 en la Tabla A.

Tabla 6.22: Compuestos de la fórmula general (Ia), en donde R es 4-O(CH₂)₃CH₃, y la combinación de sustituyentes X₁, X₂, X₃, y A para un compuesto corresponde en cada caso a una línea A.1 a A.108 en la Tabla A.

5 **Tabla 6.23:** Compuestos de la fórmula general (Ia), en donde R es 4-CH₂CH₃, y la combinación de sustituyentes X₁, X₂, X₃, y A para un compuesto corresponde en cada caso a una línea A.1 a A.108 en la Tabla A.

Tabla 6.24: Compuestos de la fórmula general (Ia), en donde
10 R es 4-(CH₂)₅CH₃, y la combinación de sustituyentes X₁, X₂, X₃, y A para un compuesto corresponde en cada caso a una línea A.1 a A.108 en la Tabla A.

Tabla 6.25: Compuestos de la fórmula general (Ia), en donde R es 4-[4-fluorofenilo], y la combinación de sustituyentes X₁,
15 X₂, X₃, y A para un compuesto corresponde en cada caso a una línea A.1 a A.108 en la Tabla A.

Tabla 6.26: Compuestos de la fórmula general (Ia), en donde R es 4-[4-clorofenilo], y la combinación de sustituyentes X₁, X₂, X₃, y A para un compuesto corresponde en cada caso a una
20 línea A.1 a A.108 en la Tabla A.

Tabla 6.27: Compuestos de la fórmula general (Ia), en donde R es 4-(CH₂)₂CH₃, y la combinación de sustituyentes X₁, X₂, X₃, y A para un compuesto corresponde en cada caso a una línea A.1 a A.108 en la Tabla A.

106
106

Tabla 6.28: Compuestos de la fórmula general (Ia), en donde R es 4-[4-metilfenilo], y la combinación de sustituyentes X_1 , X_2 , X_3 , y A para un compuesto corresponde en cada caso a una línea A.1 a A.108 en la Tabla A.

5 **Tabla 6.29:** Compuestos de la fórmula general (Ia), en donde R es 4-(4-OCF₃-fenilo], y la combinación de sustituyentes X_1 , X_2 , X_3 , y A para un compuesto corresponde en cada caso a una línea A.1 a A.108 en la Tabla A.

Tabla 6.30: Compuestos de la fórmula general (Ia), en donde
10 R es 4-[4-OCF₃-fenoxilo], y la combinación de sustituyentes X_1 , X_2 , X_3 , y A para un compuesto corresponde en cada caso a una línea A.1 a A.108 en la Tabla A.

Tabla 6.31: Compuestos de la fórmula general (Ia), en donde
15 R es 4-[4-CF₃-fenilo], y la combinación de sustituyentes X_1 , X_2 , X_3 , y A para un compuesto corresponde en cada caso a una línea A.1 a A.108 en la Tabla A.

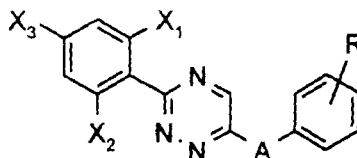
Tabla 6.32: Compuestos de la fórmula general (Ia), en donde
R es 4-[4-CF₃-fenoxilo], y la combinación de sustituyentes X_1 , X_2 , X_3 , y A para un compuesto corresponde en cada caso a una
20 línea A.1 a A.108 en la Tabla A.

Tabla 6.33: Compuestos de la fórmula general (Ia), en donde
R es 4-[2-Cl-4-CF₃-fenoxilo], y la combinación de sustituyentes X_1 , X_2 , X_3 , y A para un compuesto corresponde en cada caso a una línea A.1 a A.108 en la Tabla A.

Tabla 6.34: Compuestos de la fórmula general (Ia), en donde R es 4-[4-clorofenoxilo], y la combinación de sustituyentes X_1 , X_2 , X_3 , y A para un compuesto corresponde en cada caso a una línea A.1 a A.108 en la Tabla A.

5

Tabla 6.35: Compuestos de la fórmula:

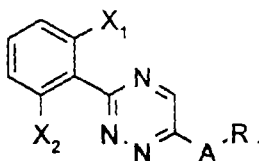


X_1	X_2	X_3	R	A	p.f. (°C)
F	F	H	4-Cl	CH=CH	135-140
F	F	H	3-Cl	CH=CH	86-89
F	F	H	3,4-Cl ₂	CH=CH	94-97
F	F	H	4-CF ₃	CH=CH	112-115
F	F	H	3-CF ₃	CH=CH	Harz
F	F	H	3-Cl	O	132-137
F	F	H	4-Br	O	147-150
F	F	H	4-OCF ₃	O	resina
F	F	H	4-[4-CF ₃ -fenoxilo]	O	169-170
F	F	H	4-[2-Cl-4-CF ₃ -fenoxilo]	O	resina
F	F	H	4-Cl	*NHCH ₂	200-205
F	F	H	4-terbutilo	O	142-146

*N enlazado con anillo de triazina.

10

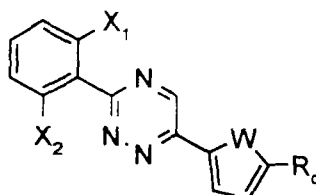
Tabla 7: Compuestos de la fórmula:



No.	X_1	X_2	R_1	A	Datos Fisicos
7.1	F	F	benzotiazol-2-ilo	-	sólido
7.2	F	F	5-Cl-benzotiazol-2-ilo	-	
7.3	F	F	5-CF ₃ -benzotiazol-2-ilo	-	
7.4	F	F	5-OCF ₃ -benzotiazol-2-ilo	-	
7.5	F	F	5-F-benzotiazol-2-ilo	-	
7.6	F	F	benzotiazol-2-ilo	-C≡C-	

No.	X ₁	X ₂	R ₁	A	Datos Físicos
7.7	F	F	5-Cl-benzotiazol-2-ilo	-C≡C-	
7.8	F	F	5-CF ₃ -benzotiazol-2-ilo	-C≡C-	
7.9	F	F	5-OCF ₃ -benzotiazol-2-ilo	-C≡C-	
7.10	F	F	5-F-benzotiazol-2-ilo	-C≡C-	
7.11	F	F	5-Bromo-tien-2-ilo	-	195-197

Tabla 8: Compuestos de la fórmula:



No.	X ₁	X ₂	W	R _q	Datos Físicos
8.1	F	F	O	4-F-Ph	
8.2	F	F	O	4-Cl-Ph	
8.3	F	F	O	3-CF ₃ -Ph	
8.4	F	F	O	4-CF ₃ -Ph	
8.5	F	F	O	4-OCF ₃ -Ph	
8.6	F	F	O	4-t-Butil-Ph	
8.7	F	F	O	2,4-Cl ₂ -Ph	
8.8	F	F	O	3,5-Cl ₂ -Ph	
8.9	F	F	O	2-CF ₃ -Ph	
8.10	F	F	O	4-OCH ₃ -Ph	
8.11	F	F	O	4-SCH ₃ -Ph	
8.12	F	F	O	3-OCH ₃ -Ph	
8.13	F	F	O	3-Cl-Ph	
8.14	F	F	O	3,4-Cl ₂ -Ph	
8.15	F	F	O	3-Cl-4-F-Ph	
8.16	F	F	O	4-SCF ₃ -Ph	
8.17	F	F	O	4-SOCF ₃ -Ph	
8.18	F	F	O	4-SO ₂ CF ₃ -Ph	
8.19	F	F	S	4-F-Ph	
8.20	F	F	S	4-Cl-Ph	
8.21	F	F	S	3-CF ₃ -Ph	
8.22	F	F	S	4-CF ₃ -Ph	214-216
8.23	F	F	S	4-OCF ₃ -Ph	197-198
8.24	F	F	S	4-t-Butil-Ph	
8.25	F	F	S	2,4-Cl ₂ -Ph	
8.26	F	F	S	3,5-Cl ₂ -Ph	
8.27	F	F	S	2-CF ₃ -Ph	
8.28	F	F	S	4-OCH ₃ -Ph	
8.29	F	F	S	4-SCH ₃ -Ph	
8.30	F	F	S	3-OCH ₃ -Ph	
8.31	F	F	S	3-Cl-Ph	
8.32	F	F	S	3,4-Cl ₂ -Ph	
8.33	F	F	S	3-Cl-4-F-Ph	
8.34	F	F	S	4-SCF ₃ -Ph	
8.35	F	F	S	4-SOCF ₃ -Ph	
8.36	F	F	S	4-SO ₂ CF ₃ -Ph	

No.	X ₁	X ₂	W	R _q	Datos Físicos
8.37	F	F	NH	4-F-Ph	
8.38	F	F	NH	4-Cl-Ph	
8.39	F	F	NH	3-CF ₃ -Ph	
8.40	F	F	NH	4-CF ₃ -Ph	
8.41	F	F	NH	4-OCF ₃ -Ph	
8.42	F	F	NH	4-t-Butil-Ph	
8.43	F	F	NH	2,4-Cl ₂ -Ph	
8.44	F	F	NH	3,5-Cl ₂ -Ph	
8.45	F	F	NH	2-CF ₃ -Ph	
8.46	F	F	NH	4-OCH ₃ -Ph	
8.47	F	F	NH	4-SCH ₃ -Ph	
8.48	F	F	NH	3-OCH ₃ -Ph	
8.49	F	F	NH	3-Cl-Ph	
8.50	F	F	NH	3,4-Cl ₂ -Ph	
8.51	F	F	NH	3-Cl-4-F-Ph	
8.52	F	F	NH	4-SCF ₃ -Ph	
8.53	F	F	NH	4-SOCF ₃ -Ph	
8.54	F	F	NH	4-SO ₂ CF ₃ -Ph	

2. Ejemplos de Formulación

2.1. Concentrados emulsionables

	a)	b)	c)
Un compuesto de las Tablas 1 a 6	25%	40%	50%
5 Dodecylbencensulfonato de calcio	5%	8%	6%
Poliethylenglicoléter de aceite	5%	-	-
de ricino (36 moles de óxido de etileno).			
Poliethylenglicoléter de tribu-	-	12%	4%
10 tilfenol (30 moles de óxido de etileno).			
Ciclohexanona	-	15%	20%
Mezcla de xilenos	65%	25%	20%

Se pueden preparar emulsiones de cualquier concentración deseada a partir de estos concentrados mediante su dilución con agua.

5	<u>2.2. Concentrados emulsionables</u>	a)	b)	c)
	Un compuesto de las Tablas 1 a 6	10%	8%	60%
	Polietilenglicoléter de octilfenol (4 a 5 moles de óxido de etileno)	3%	3%	2%
	Dodecilbencensulfonato de calcio	3%	4%	4%
10	Polietilenglicoléter de aceite de ricino (35 moles de óxido de etileno).	4%	5%	4%
	Ciclohexanona	30%	40%	15%
	Mezcla de xilenos	50%	40%	15%

15

Se pueden preparar emulsiones de cualquier concentración deseada a partir de estos concentrados mediante su dilución con agua.

20	<u>2.3. Concentrado en suspensión</u>	
	Un compuesto de las Tablas 1 a 6	40%
	Etilenglicol	10%
	Polietilenglicoléter de nonilfenol (15 moles de óxido de etileno)	6%
25	Lignosulfonato de sodio	10%

Carboximetilcelulosa	1%
Solución acuosa de formaldehído	0.2%
al 37 por ciento.	
Aceite de silicona en la forma de	0.8%
5 una emulsión acuosa al 75 por ciento.	
Agua	32%

El ingrediente activo finamente molido se mezcla íntimamente con los auxiliares, dando un concentrado para suspensión a partir del cual se pueden obtener suspensiones de cualquier concentración deseada mediante su dilución con agua.

2.4. Mezclas de polvo dispersables en agua

	a)	b)	c)
15 Un compuesto de las Tablas 1 a 6	25%	50%	75%
Lignosulfonato de sodio	5%	5%	-
Ácido oleico	3%	-	5%
Di-isobutilnaftalensulfonato de sodio -		6%	10%
Poli-etilenglicoléter de octilfenol	-	2%	-
20 (7 a 8 moles de óxido de etileno)			
Ácido silícico altamente dispersado	5%	10%	10%
Caolín	62%	27%	-

El ingrediente activo se mezcla completamente con los auxiliares, y la mezcla se muele completamente en un molino

adecuado, proporcionando polvos humectables que se pueden diluir con agua para dar suspensiones de cualquier concentración deseada.

5	<u>2.5. Polvos secos</u>	a)	b)
	Un compuesto de las Tablas 1 a 6	2%	5%
	Acido silícico altamente dispersado	1%	5%
	Talco	97%	-
	Caolín	-	90%

10

Se obtienen polvos secos listos para usarse mediante la mezcla íntima de los vehículos con el ingrediente activo, y moliendo la mezcla.

15	<u>2.6. Gránulos</u>	a)	b)
	Un compuesto de las Tablas 1 a 6	5%	10%
	Caolín	94%	-
	Acido silícico altamente dispersado	1%	-
	Atapulgita	-	90%

20

El ingrediente activo se disuelve en cloruro de metileno, y la solución se rocía sobre el vehículo, y subsecuentemente el solvente se evapora al vacío. Estos gránulos se pueden mezclar con el alimento para animales.

25

2.7. Gránulos

	Un compuesto de las Tablas 1 a 6	10%
	Lignosulfonato de sodio	2%
	Carboximetilcelulosa	1%
5	Caolín	87%

El ingrediente activo se mezcla y se muele los auxiliares, y la mezcla se humedece con agua. La mezcla se extruye, y luego se seca en una corriente de aire.

10

2.8. Gránulos

	Un compuesto de las Tablas 1 a 6	3%
	Polietilenglicol (MW 200)	3%
	Caolín	94%
15	(MW = peso molecular)	

El ingrediente activo finamente molido se aplica uniformemente, en una mezcladora, al caolín humedecido con polietilenglicol. Se obtienen gránulos recubiertos no polvosos de esta manera.

20

2.9. Tabletas

Constituyentes (para 1000 tabletas):

	Un compuesto de las Tablas 1 a 6	25.0 gramos
	Lactosa	100.7 gramos

	Almidón de trigo	7.5 gramos
	Polietilenglicol 6000	5.0 gramos
	Talco	5.0 gramos
	Estearato de magnesio	1.8 gramos
5	Agua desmineralizada	c.s.

Todos los ingredientes sólidos se fuerzan primero a través de un tamiz de un tamaño de malla de 0.6 milímetros. Luego se mezclan entre sí, el ingrediente activo, la lactosa, el talco, y la mitad del almidón. La otra mitad del almidón se suspende en 40 mililitros de agua, y la suspensión se agrega a una solución en ebullición del polietilenglicol en 100 mililitros de agua. La pasta de almidón resultante se agrega al lote principal, y la mezcla se granula, si es necesario, con la adición de agua. Los gránulos se secan durante la noche a 35°C, se fuerzan a través de un tamiz de un tamaño de malla de 1.2 milímetros, se mezclan con el estearato de magnesio, y se comprimen para formar tabletas que tienen un tamaño de malla de aproximadamente 6 milímetros, y que son cóncavas por ambos lados.

20

2.10. Formulaciones inyectables

A. Vehículo oleoso (liberación lenta)

	Un compuesto de las Tablas 1 a 6	0.1-1.0 g
	Aceite de cacahuete	hasta 100 ml
25	Un compuesto de las Tablas 1 a 6	0.1-1.0 g

Aceite de ajonjolí

hasta 100 ml

El ingrediente activo se disuelve en una porción del aceite con agitación, y opcionalmente con ligero calentamiento, y después de enfriar, la solución se rellena hasta el volumen deseado, y se filtra estéril a través de un filtro de membrana adecuado de 0.22 milímetros.

B. Solvente miscible en agua (velocidad de liberación mediana)

10	Un compuesto de las Tablas 1 a 6	0.1-1.0 g
	4-hidroximetil-1,3-dioxolano	40 g
	(glicerol-formal)	
	1,2-propanodiol	hasta 100 ml
	Un compuesto de las Tablas 1 a 6	0.1-1.0 g
15	Gliceroldimetilcetal	40 g
	1,2-propanodiol	hasta 100 ml

El ingrediente activo se disuelve en una porción del solvente con agitación, y la solución se rellena hasta el volumen deseado, y se filtra estéril a través de un filtro de membrana adecuado de 0.22 milímetros.

C. Solubilizado acuoso (liberación rápida)

	Un compuesto de las Tablas 1 a 6	0.1-1.0 g
25	Aceite de ricino polietoxilado	10g

	(40 unidades de óxido de etileno)	
	1,2-propanodiol	20 g
	Alcohol bencílico	1 g
	Agua para inyección	hasta 100 ml
5	Un compuesto de las Tablas 1 a 6	0.1-1.0 g
	Mono-oleato de sorbitán polietoxilado (20 unidades de óxido de etileno)	8 g
	4-hidroximetil-1,3-dioxolano	20 g
10	(glicerol-formal)	
	Alcohol bencílico	1 g
	Agua para inyección	hasta 100 ml

Preparación: El ingrediente activo se disuelve en los
 15 solventes y el tensoactivo, y la solución se rellena hasta el volumen deseado con agua. Luego se realiza la filtración estéril a través de un filtro de membrana adecuado de 1 diámetro de poros de 0.22 milímetros.

Los sistemas acuosos se pueden utilizar de una manera
 20 preferida también para administración oral y/o intrarruminal.

2.11. Vertido

A.

	Un compuesto de las Tablas 1 a 6	10%
25	Aceite de frijol de soya epoxidado	5%

	Alcohol oleílico	85%
	B.	
	Un compuesto de las Tablas 1 a 6	20%
	pirrolidin-2-ona	15%
5	Miristato de isopropilo	65%

También es posible agregar a las composiciones descritas, sustancias biológicamente activas adicionales, o aditivos que tengan un comportamiento neutro hacia los compuestos de la fórmula (I), y que no tengan un efecto adverso sobre el animal huésped que se vaya a tratar, y también sales minerales o vitaminas.

3. Ejemplos Biológicos

15 A. Acción insecticida

3.1. Acción contra *Aphis craccivora*

Las plántulas de chícharo se infestan con *Aphis craccivora*, subsecuentemente se rocían con una mezcla de rociado que comprende 100 ppm de ingrediente activo, y luego se incuban a 20°C. 3 y 6 días después, se determina el porcentaje de reducción en la población (porcentaje de actividad), comparando el número de áfidos muertos en las plantas tratadas, con aquél en las plantas no tratadas.

Los compuestos de las Tablas 1 a 6 exhiben una buena actividad en esta prueba.

3.2. Acción contra *Diabrotica balteata*

Las plántulas de maíz se rocían con una mezcla de rociado en emulsión acuosa que comprende 100 ppm de ingrediente activo, y, después de que se ha secado el recubrimiento rociado, se pueblan con 10 larvas de *Diabrotica balteata* en la segunda etapa, y luego se colocan en un recipiente de plástico. Seis días después, se determina el porcentaje de reducción en la población (porcentaje de actividad), comparando el número de larvas muertas en las plantas tratadas, con aquél en las plantas no tratadas.

Los compuestos de las Tablas 1 a 6 exhiben una buena actividad en esta prueba. Por ejemplo, especialmente los compuestos 3.9, 4.13, 4.15, y 4.20 provocan una reducción de más del 80 por ciento en la población de la plaga.

3.3. Acción contra *Heliothis virescens*

Las plantas de frijol de soya jóvenes se rocían con una mezcla de rociado en emulsión acuosa que comprende 100 ppm de ingrediente activo, y después de que se ha secado el recubrimiento rociado, se puebla con 10 orugas de *Heliothis virescens* en la primera etapa, y luego se colocan en un recipiente de plástico. Seis días después, se determinan el porcentaje de reducción en la población y el daño por alimentación (porcentaje de actividad), comparando el número de orugas muertas y el

daño por alimentación en las plantas tratadas con aquél en las plantas no tratadas.

Los compuestos de las Tablas 1 a 6 exhiben una buena actividad en esta prueba. Por ejemplo, especialmente los compuestos 3.12, 3.13, 3.15, 3.20, 3.21, 3.107 a 3.109 y 3.112 provocan una reducción de más del 80 por ciento en la población de la plaga.

3.4. Acción contra *Spodoptera littoralis*

10 Las plantas de frijol de soya jóvenes se rocían con una mezcla de rociado en emulsión acuosa que comprende 100 ppm de ingrediente activo, y después de que se ha secado el recubrimiento rociado, se pueblan con 10 orugas de *Spodoptera littoralis* en la tercera etapa, y luego se colocan en un recipiente de plástico. 3 días después, se determinan el porcentaje de reducción en la población y el porcentaje de reducción en el daño por alimentación (porcentaje de actividad), comparando el número de orugas muertas y el daño por alimentación en las plantas tratadas, con aquéllos en las plantas no tratadas.

20 Los compuestos de las Tablas 1 a 6 exhiben una buena actividad en esta prueba. Por ejemplo, especialmente los compuestos 1.50, 1.361, 1.374, 1.380, 1.390, 1.606, 3.9, 3.12 a 3.16, 3.20 a 3.22, 3.31, 3.43, 3.108, 3.109, 3.112, 4.05, 4.13, 4.14, 8.22 y 8.23 provoca una reducción de más del 80 por ciento en la población de la plaga.

25

3.5. Acción contra *Nilaparvata lugens*

Las plantas de arroz se tratan con una mezcla de rociado en emulsión acuosa que comprende 400 ppm de ingrediente activo. Después de que se ha secado el recubrimiento rociado, las plantas de arroz se pueblan con larvas de cicada en las segunda y tercera etapas. La evaluación se realiza 21 días después. Se determina el porcentaje de reducción en la población (porcentaje de actividad) comparándose el número de cicadas sobrevivientes en las plantas tratadas, con aquél en las plantas no tratadas.

Los compuestos de las Tablas 1 a 6 exhiben una buena actividad en esta prueba.

3.6. Acción contra *Crocicidolomia binotalis*

Las plantas de col jóvenes se rocían con una mezcla de rociado en emulsión acuosa que comprende 400 ppm de ingrediente activo. Después de que se ha secado el recubrimiento rociado, las plantas de col se pueblan con 10 orugas de *Crocicidolomia binotalis* en la tercera etapa, y se colocan en un recipiente de plástico. La evaluación se realiza 3 días después. Se determinan el porcentaje de reducción en la población y el porcentaje de reducción en el daño por alimentación (porcentaje de actividad) comparándose el número de orugas muertas y el daño por alimentación en las plantas tratadas, con aquel en las plantas no tratadas.

Los compuestos de las Tablas 1 a 6 exhiben una buena actividad en esta prueba.

3.7. Acción contra *Anthonomus grandis*

5 Las plantas de algodón jóvenes se rocían con una mezcla de rociado en emulsión acuosa que comprende 400 ppm de ingrediente activo. Después de que se ha secado el recubrimiento rociado, las plantas de algodón se pueblan con 10 adultos de *Anthonomus grandis*, y se colocan en un recipiente de plástico.

10 La evaluación se realiza 3 días después. Se determinan el porcentaje de reducción en la población y el porcentaje de reducción en el daño por alimentación (porcentaje de actividad) comparando el número de gorgojos muertos, y el daño por alimentación en las plantas tratadas, con aquél en las plantas no tra-

15 tadas.

Los compuestos de las Tablas 1 a 6 exhiben una buena actividad en esta prueba.

3.8. Acción contra *Aonidiella aurantii*

20 Los tubérculos de papa se pueblan con orugas de *Aonidiella aurantii*. Después de aproximadamente dos semanas, las papas se sumergen en una mezcla de rociado en emulsión o en suspensión acuosa que comprende 400 ppm de ingrediente activo. Cuando los tubérculos se han secado, se incuban en un recipiente

25 de plástico. Para la evaluación, de 10 a 12 semanas después,

se compara el índice de sobrevivencia de las orugas de la primera generación subsecuente de la población tratada, con aquél de los controles no tratados.

Los compuestos de las Tablas 1 a 6 exhiben una buena
5 actividad en esta prueba.

3.9. Acción contra *Bemisia tabaci*

Las plantas de frijol enano se colocan en canastillas de gasa, y se pueblan con adultos de *Bemisia tabaci*. Después de
10 que ha tenido lugar a oviposición, se remueven todos los adultos. Diez días después, las plantas y las ninfas localizadas en las mismas se rocían con una mezcla de rociado en emulsión acuosa, que comprende 400 ppm de ingrediente activo. Después de
14 días adicionales, se evalúa el porcentaje de huevos que han
15 eclosionado en comparación con los controles no tratados.

Los compuestos de las Tablas 1 a 6 exhiben una buena actividad en esta prueba.

B. Acción acaricida

20 3.10. Acción contra *Tetranychus urticae*

Las plantas de frijol jóvenes se pueblan con una población mixta de *Tetranychus urticae*, y se rocían 1 día después con una mezcla de rociado en emulsión acuosa que comprende 100 ppm de ingrediente activo, se incuban durante 6 días a 25°C, y
25 luego se evalúan. Se determina el porcentaje de reducción en la

población (porcentaje de actividad) comparando el número de huevos, larvas, y adultos muertos en las plantas tratadas, con aquél en las plantas no tratadas.

Los compuestos de las Tablas 1 a 6 exhiben una buena actividad en esta prueba. Por ejemplo, especialmente los compuestos 3.13, 3.14, 3.16, 3.19 a 3.22, 4.13, 4.30 y 4.33, provocan una reducción de más del 80 por ciento en la población de la plaga.

10 3.11. Acción contra *Panonychus ulmi* (resistente a OP y carb.)

Las plántulas de manzana se pueblan con hembras adultas de *Panonychus ulmi*. Después de 7 días, las plantas infestadas se rocían hasta el punto de goteo con una mezcla de rociado en emulsión acuosa que comprende 400 ppm del compuesto de prueba, y se cultivan en un invernadero. La evaluación se realiza después de 14 días. Se determina el porcentaje de reducción en la población (porcentaje de actividad) comparando el número de ácaros-araña muertos en las plantas tratadas, con aquel en las plantas no tratadas.

20 Los compuestos de las Tablas 1 a 6 exhiben una buena actividad en esta prueba.

C. Acción ectoparasiticida

3.12. Control de pulgas adultas en gatos por medio de aplicación vertida

Con el objeto de determinar la efectividad de los compuestos de prueba contra las pulgas completamente crecidas, se utilizaron cuatro grupos, cada uno de dos gatos. Cada gato se infesta con 100 pulgas de gato [*Ctenocephalides felis* (Bouche)], y se trata con 20 miligramos de ingrediente activo por kilogramo de peso del cuerpo. El tratamiento se efectúa mediante la aplicación de la formulación a un área localmente limitada en la parte posterior del cuello del gato. Un grupo se infesta con pulgas pero se trata solamente con un placebo, es decir, una formulación sin ingrediente activo, y sirve como control. Otro grupo se trata con nitenpiram como sustancia de comparación; los dos grupos restantes se tratan con los compuestos de prueba. La evaluación se hace en cada caso combinando las pulgas sobrevivientes del pelo del animal, contándolas, y comparando el número contado con el número de pulgas en el grupo de control y en el grupo tratado con nitenpiram. El procedimiento con detalle es como sigue: cada gato se infesta con 100 pulgas inmediatamente después del tratamiento en el día 0. En el día +1, cada animal se peina, y se determina el número de pulgas sobrevivientes; luego las pulgas sobrevivientes se vuelven a colocar en el mismo gato, y, después de 24 horas, se repite el peinado y la evaluación. Las pulgas que todavía sobreviven después de esas 24 horas no se regresan al gato. Luego se repite el procedimiento descrito en los días +3, +7, +9, +14, +21, +28, +35, +42, y +49, y de esta manera se determinan la

efectividad y la duración de acción. En cada día en que se pei-
nan las pulgas sobrevivientes, se toma una muestra de sangre de
aproximadamente 2.7 mililitros de cada gato - con la excepción
del grupo de control - , y se mide el contenido de ingrediente
5 activo. La efectividad se determina de acuerdo con la siguiente
fórmula:

$$\begin{array}{rcl} \text{número de pulgas vivas} & & \text{número de pulgas} \\ \text{por animal de control} & \text{menos} & \text{vivas por animal de} \\ \% \text{ de efec-} & & \text{prueba.} \\ \text{tividad} = & \frac{\text{número de pulgas vivas por animal de control}}{\text{número de pulgas vivas por animal de control}} & * 100 \end{array}$$

Se muestra que los compuestos de la fórmula (I) de
acuerdo con la invención, logran una excelente acción a largo
15 plazo en comparación con el nitenpiram.

En perros, la prueba procede de una manera enteramen-
te análoga. También se observan efectos similares cuando las
sustancias se administran, no en la forma de un vertido, sino
en la forma de una solución para inyección.

20

3.13. Control de pulgas adultas en gatos por medio de inyec- ción subcutánea

Con el objeto de determinar la efectividad de los
compuestos de prueba contra pulgas completamente crecidas, se
25 utilizan cuatro grupos, cada uno de dos gatos de edades de 1.5

a 4 años. Cada gato se infesta con 100 pulgas de gato [*Ctenocephalides felis* (Bouche)], y se trata con 20 miligramos de ingrediente activo por kilogramo de peso del cuerpo. El tratamiento se efectúa mediante inyección subcutánea de una solución
5 del ingrediente activo detrás de la paleta del hombro izquierdo. Un grupo se infesta con pulgas pero se trata solamente con un placebo, es decir, una formulación sin ingrediente activo, y sirve como control. Otro grupo se trata con nitenpiram como una sustancia de comparación; los dos grupos restantes se tratan
10 con los compuestos de prueba. La evaluación en cada caso se realiza de una manera análoga al ejemplo anterior.

Se muestra que, después de la inyección subcutánea de los compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la invención, se logra una excelente acción a largo plazo en comparación con
15 nitenpiram.

La prueba análoga con perros da resultados comparables.

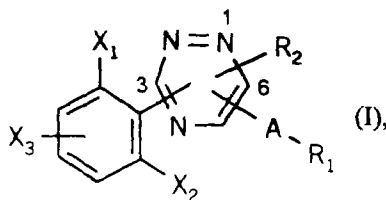
NOVEDAD DE LA INVENCION

Habiendo descrito la invención que antecede, se considera como una novedad, y por lo tanto, se reclama como propiedad lo contenido en las siguientes:

REIVINDICACIONES ✓

1. Un compuesto de la fórmula:

10



en donde:

R₁ es arilo o heteroarilo insustituido o mono- a penta-sustituido, seleccionándose los sustituyentes de los anillos de arilo y heteroarilo a partir del grupo que consiste en:

OH, halógeno, CN, NO₂, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, cicloalqueni-
lo de 3 a 8 átomos de carbono opcionalmente sustituido, alquilo
de 1 a 6 átomos de carbono-cicloalquilo de 3 a 8 átomos de car-
20 bono, cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono-alquilo de 1 a 6
átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, ha-
locicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, alcóxilo de 1 a 6

átomos de carbono, cicloalcoxilo de 3 a 8 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, halocicloalcoxilo de 3 a 8 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, ciclotioalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halociclotioalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilsulfinilo de 3 a 8 átomos de carbono, haloalquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, halocicloalquilsulfinilo de 3 a 8 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilsulfonilo de 3 a 8 átomos de carbono, haloalquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, halocicloalquilsulfonilo de 3 a 8 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 8 átomos de carbono opcionalmente sustituido, alquinilo de 2 a 8 átomos de carbono opcionalmente sustituido, alquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono-C(=NOR₅), -P(=O)(O-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono)₂, R₇,

fenilo insustituido o mono- a penta-sustituido, heteroarilo insustituido o mono- a penta-sustituido; en donde los sustituyentes de los radicales de fenilo y heteroarilo se seleccionan a partir del grupo que consiste en OH, halógeno, CN, NO₂, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquenilo de 2 a 8 átomos de carbono opcionalmente sustituido, alquinilo de 2 a 8 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, cicloalquenilo de 3 a 8 átomos de carbono opcionalmente sustituido, haloalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halocicloalquilo de

+29
129

3 a 8 átomos de carbono, alcóxido de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalcóxido de 3 a 8 átomos de carbono, haloalcóxido de 1 a 6 átomos de carbono, halocicloalcóxido de 3 a 8 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, ciclotioalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halociclotioalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilsulfinilo de 3 a 8 átomos de carbono, haloalquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, halocicloalquilsulfinilo de 3 a 8 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilsulfonilo de 3 a 8 átomos de carbono, haloalquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, halocicloalquilsulfonilo de 3 a 8 átomos de carbono, alqueno de 2 a 8 átomos de carbono, que está insustituido o sustituido, alqueno de 2 a 8 átomos de carbono, que está insustituido o sustituido, alquilcarbonilo de 1 a 6 átomos de carbono, $-CH(=NOR_6)$, $-C(\text{alquilo de 1 a 6 átomos de carbono})(=NOR_6)$, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono- $C(=NOR_6)$, $-CHO$, $-C(=O)$ -alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, y R_7 ;

fenóxido insustituido o mono- a penta-sustituido;

tiofenilo insustituido o mono- a penta-sustituido;

20 fenilamino insustituido o mono- a penta-sustituido; y

fenil-(alquilo de 1 a 6 átomos de carbono)-amino insustituido o mono- a penta-sustituido;

seleccionándose los sustituyentes de los grupos fenóxido, tiofenilo, fenilamino, y fenil-(alquilo de 1 a 6 átomos

de carbono)-amino a partir del grupo que consiste en halógeno, CN, NO₂, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halocicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, alcóxido de 1 a 6 átomos de carbono, haloalcóxido de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalcóxido de 3 a 8 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilsulfinilo de 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilsulfonilo de 1 a 6 átomos de carbono, ciclotioalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, y halociclotioalquilo de 3 a 8 átomos de carbono;

R₂ es H, OH, halógeno, CN, NO₂, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono opcionalmente sustituido, alcóxido de 1 a 6 átomos de carbono, alcóxido de 1 a 6 átomos de carbono-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halocicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, -NH-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, SH, ó CH₂-NO₂;

A es un solo enlace, alquileno de 1 a 12 átomos de carbono, O, O(alquileno de 1 a 12 átomos de carbono), S(O)_m, S(O)_n(alquileno de 1 a 12 átomos de carbono), alquénico de 2 a 8 átomos de carbono, alquínico de 2 a 8 átomos de carbono;

NR₃, ó NR₃(alquileo de 1 a 12 átomos de carbono);

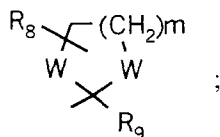
R₃ es H, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alqueno de 2 a 8 átomos de carbono, alquino de 2 a 8 átomos de carbono, arilalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, (CH₂)_pC(O)R₄ ó alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono-alquilo de 2 a 6 átomos de carbono;

R₄ es H, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, N(R₅)₂, ó alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono-alquilo de 2 a 6 átomos de carbono;

R₅ es H, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, ó arilo-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono;

R₆ es H, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, o -C(=O)-R₅;

R₇ es:



R₈ y R₉ son cada uno, independientemente del otro, H, o alquilo de 1 a 6 átomos de carbono;

X₁ es R₁₀;

X_2 y X_3 son cada uno independientemente del otro, H ó R_{10} ;

R_{10} es halógeno, CN, NO_2 , alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halocicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalcoxilo de 3 a 8 átomos de carbono, haloalcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, halocicloalcoxilo de 3 a 8 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, ciclotioalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, o halociclotioalquilo de 3 a 8 átomos de carbono;

m es 1, 2, 3, ó 4;

n es 0, 1, ó 2; y

W es O ó S;

con la condición de que el radical $A-R_1$ y el grupo fenilo sustituido por X_1 , X_2 , y X_3 , no estén en la posición vicinal unos en relación con los otros sobre el anillo de triazina,

con la condición adicional, de que X_1 no sea CH_3 , Cl, ó F, cuando X_2 y X_3 sean H, A sea un solo enlace, R_1 sea fenilo, 2-fluorofenilo, p-fluorofenilo, ó 3-clorofenilo, y R_2 sea H, Cl, ó NHC_2H_5 ;

y con la excepción de 3,6-di-(2-clorofenil)-5-hidroxi-1,2,4-triazina, y

con la excepción de 3-(2-metilfenil)-6-(4-

describe en la reivindicación 4, --

7. Un método para controlar plagas, el cual comprende aplicar una cantidad plaguicidamente efectiva de cuando menos un compuesto de la fórmula (I) como se describe en la reivindicación 1 a las plagas o al lugar de las mismas.

5 (8.) El uso de un compuesto de la fórmula (I) como se describe en la reivindicación 1, en un método para controlar parásitos en plantas y en animales de sangre caliente.

9. Un método de acuerdo con la reivindicación 7, para la protección del material reproductivo vegetativo, el cual
10 al comprende al tratamiento de este material reproductivo, o del área de cultivo para este material de reproducción.

(10.) El material de propagación de plantas tratado con un compuesto como se describe en la reivindicación 1 de la fórmula (I), o con una composición como se describe en la reivindicación 5.
15

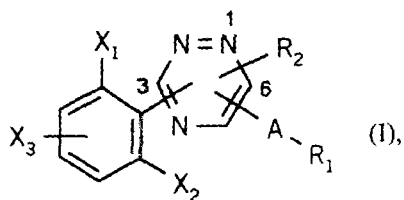
20

25

+35
135

RESUMEN DE LA INVENCION

Un compuesto de la fórmula:



5 en donde:

R_1 es arilo o heteroarilo insustituido o sustituido, seleccionándose los sustituyentes de los anillos de arilo y heteroarilo, por ejemplo, a partir del grupo que consiste en OH, halógeno, CN, NO_2 , alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloal-

10 quilo de 3 a 8 átomos de carbono, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono-cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono-alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halocicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, alcóxido de 1 a 6 átomos de carbono, y fe-

15 nilo; fenóxido; tiofenilo; fenilamino; y fenil-(alquilo de 1 a 6 átomos de carbono)-amino;

seleccionándose los sustituyentes de los grupos fenóxido, tiofenilo, fenilamino, y fenil-(alquilo de 1 a 6 átomos de carbono)-amino a partir del grupo que consiste en halógeno,

20 CN, NO_2 , alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, halocicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, alcóxido de 1 a 6

átomos de carbono, cicloalcoxilo de 3 a 8 átomos de carbono, tioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, ciclotioalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, halotioalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, y halociclotioalquilo de 3 a 8 átomos de carbono;

5 R_2 es, por ejemplo, H, OH, halógeno, CN, NO_2 , alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, o alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono;

 A es, por ejemplo, un solo enlace, alquilenos de 1 a 12 átomos de carbono, O, u O(alquilenos de 1 a 12 átomos de carbono);

10

R_4 es H, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono, $\text{N}(\text{R}_5)_2$, o alcoxilo de 1 a 6 átomos de carbono-alquilo de 2 a 6 átomos de carbono;

15

R_5 es H, alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono, haloalquilo de 1 a 6 átomos de carbono, o arilalquilo de 1 a 6 átomos de carbono;

X_1 es R_{10} ; X_2 y X_3 son cada uno independientemente del otro, H, ó R_{10} ;

20

R_{10} es, por ejemplo, halógeno, CN, NO_2 , alquilo de 1 a 6 átomos de carbono, o cicloalquilo de 3 a 8 átomos de carbono;

y

n es 0, 1, ó 2,

y sus compuestos de adición fisiológicamente tolerables y agroquímicamente aceptables, y donde sea apropiado, isómeros E/Z, mezclas de isómeros E/Z, y/o tautómeros, en cada caso en forma libre o en forma de sal.

- 5 Los compuestos, en forma libre o en forma de sal agroquímicamente aceptable, exhiben propiedades plaguicidas convenientes. Son adecuados especialmente en el control de plagas en agricultura y en artículos almacenados, y también en el cuidado de animales domésticos.

10

* * * * *

Folio 139 corresponde a la pte de proyectos 2029

138

**EXTRACTO PARA PUBLICACIÓN
SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION**

DELEGATURA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL

(21) No. SOLICITUD:

(51) INT. CL.: C 07

(22) FECHA DE
PRESENTACIÓN:

(71) SOLICITANTE: **NOVARTIS AG**
Domiciliada en Basilea, Suiza.

(30) PRIORIDAD: **SÍ**
(31) No. DE SOLICITUD: 832/99

(72) INVENTORES: Dr. ARTHUR STEIGER (Arlesheim, Suiza)
WERNER ZAMBACH (Bättwil, Suiza); ANDRÉ JEANGUE-
NAT (Basilea, Suiza); Dr. MARTIN EBERLE (Bottmingen,
Suiza); STEPHAN TRAH (Freiburg, Alemania); Dr.
SALEEM FAROOQ (Arisdorf, Suiza).

(32) FECHA DE
PRESENTACIÓN: Mayo 4, 1999

(33) PAÍS: SUIZA

(74) APODERADO: JIMENA ESCOBAR URIBE

(54) TÍTULO: **COMPUESTOS PLAGUICIDAS DERIVADOS DE TRIAZINA, COMPOSICIONES PARA
EL CONTROL DE PLAGAS QUE COMPRENDE DICHO COMPUESTO Y CUANDO
NOS UN AUXILIAR Y METODOS PARA CONTROLAR PLAGAS.**

(57) RESUMEN:

La presente invención se refiere a compuestos plaguicidas derivados de tiazina, en forma libre o en forma de sal agroquímicamente aceptable adecuados especialmente en el control de plagas en agricultura y en artículos almacenados y también en el cuidado de animales domésticos.

REQUISITOS MÍNIMOS PARA ADMISIÓN/TRÁMIT

SECRETARÍA DE ECONOMÍA
 DIRECCIÓN GENERAL DE REGISTROS Y MARCAS
 FOLIO 102
 TÍTULO 1. LOS PATENTES Y EL REGISTRO DE LAS MARCAS
 Dependencia: CERO REGISTRO DE NUEVAS OPERACIONES

139

Patente de Invención



Modelo de

- | | |
|---|--------------------------|
| ☒ Nombre e identificación del solicitante — 1 | ☐ |
| ☒ Nombre e identificación del inventor — 1 | ☐ |
| ☒ Título o nombre de la invención — 1 | ☐ |
| ☒ Descripción — 3 | ☐ |
| ☒ Relvindicaciones — 127 | ☐ |
| ☒ Resumen — 1 | ☐ |
| ☒ Comprobante de pago — 2 | ☐ |

COMPLETA

INCOMPLETA

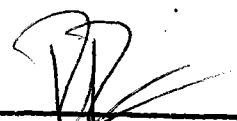
Diseño Industrial



- ☐ Nombre e identificación del solicitante
- ☐ Nombre e identificación del inventor o diseñador
- ☐ Indicación del género de productos para los cuales debe utilizarse
- ☐ Representación gráfica
- ☐ Comprobante de pago

COMPLETA

INCOMPLETA


 FIRMA RESPONSABLE

Fecha _____

141
140

INFORME DE PROTOCOLO

Expediente 00-030047

Fecha: 27 de abril del 2000.

Se certifica que:

Desde fecha 16 de abril de 1997,
del folio 90.643 al folio 90.650 del
libro de Protocolo N° 311, obra el poder
N° 17.398 conferido por NOVARTIS AG
(NOVARTISSA) (NOVARTIS INC.)

domiciliado(a) en Basilea - Suiza

al doctor JIMENA ESCOBAR URIBE y/o IGNACIO
ESCOBAR URIBE

presentante en Santafé de Bogotá D.C. Los

28

ad para desistir y sustituir SI.

f

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
PRIMER EXAMEN DE FORMA

430
2000-04-27

EXPEDIENTE 00-030047

Practicado el examen jurídico de acuerdo con lo establecido en el art. 21 de la Decisión 344 se determinó que esta solicitud de **Patente de Invención**:

- | | | |
|-----------------|-----------------|--|
| SI [x] | NO [] | NO APLICABLE [] Presentó los poderes necesarios en forma correcta (Decisión 344, art. 14-a). |
| SI [x] | NO [] | NO APLICABLE [] Acreditó, en forma correcta, la existencia y representación de la persona jurídica solicitante (art. 14-c de la Decisión 344; literal g) del art. 4 del Decreto 117/94). |
| SI [x] | NO [] | NO APLICABLE [] Presentó, en forma correcta el comprobante de pago por la tasa de presentación establecida (art. 13-f de la Decisión 344 y la Resolución 02 del 4 de enero del 2000). |
| SI [x] | NO [] | EXTEMPORANEAMENTE [] Reivindicó prioridad, dentro del plazo y de acuerdo con lo previsto en el Artículo 4 del Convenio de París. |
| SI [] | NO [x] | NO APLICABLE [] Presentó copia, certificada su conformidad por la Administración que recibió la solicitud de la cual reivindica prioridad, al momento de radicar la solicitud nacional. |
| SI [] | NO [x] | NO APLICABLE [] Presentó la traducción del capítulo reivindicatorio de la solicitud de la cual se reivindica prioridad (Art. 4, D-3 Convenio de París; Concepto: 5 de enero de 1999 S.I.C.). |
| SI [] | NO [x] | CUMPLE LOS REQUISITOS JURIDICOS |

OBSERVACIONES JURIDICAS CONVENIO DE PARIS: En todo caso, deberá presentar copia certificada su conformidad por la Administración que recibió la solicitud de la cual reivindica prioridad, **en cualquier momento dentro del plazo de tres (3) meses**, contados a partir de la fecha de depósito de la solicitud posterior. La omisión de esta formalidad implicará la pérdida del derecho de prioridad.

En consecuencia, se conceptúa que esta solicitud:

- | | | |
|---------------|-----------------|--|
| SI [] | NO [X] | Se ajusta a los aspectos FORMALES indicados en la Decisión 344 y por tanto, |
| SI [] | NO [x] | Se recomienda PUBLICAR el extracto correspondiente. |

Santafé de Bogotá, D.C., 27 de abril del 2000.


EXAMINADOR JURIDICO

142

PRIMER EXAMEN DE FORMA

Radicación no 0-30047

430
2000-07-14

Concepto Técnico no 1086 Clasificación Internacional de Patentes AOIN 43/707

Practicado el examen de acuerdo a lo establecido en el Art. 21 de la Decisión 344 se determinó que esta solicitud de **Patente de Invención**:

- | | |
|--|--|
| SI ☒ NO ☐ | Contiene la identificación correcta del inventor (Art.8, Art.13-a). |
| SI ☒ NO ☐ | Contiene la identificación correcta del solicitante (Artículo 13-a). |
| SI ☒ NO ☐ | Contiene el resumen con el objeto y finalidad de la invención en forma correcta (Art.13-e). |
| SI ☒ NO ☐ | Contiene el título o nombre de la invención en forma correcta (Art.13-b). |
| SI ☒ NO ☐ | Contiene la descripción clara y completa de la invención (Art.13-c). |
| SI ☐ NO ☒ | Contiene los dibujos correctos (Art.14-c junto con el literal d) del Art. 4 del Dto. 117 del 94). |
| SI ☒ NO ☐ | Contiene las unidades de medida en el sistema exigido (Art.14-c junto con el Decreto 3464 del 26 de diciembre de 1980). |
| SI ☒ NO ☐ | Contiene una o más reivindicaciones, en forma correcta, que precisen la materia para la cual se solicita la protección mediante la patente (Art.13-d). |
| SI ☒ NO ☐ | Contiene el extracto de acuerdo con el literal c) del artículo 4 del Dto. 117 /94. |
| SI ☐ NO ☒ | Contiene el arte final del dibujo característico de acuerdo con el literal c) del artículo 4 y el artículo 27 del Dto. 117 /94. |
| SI ☐ NO ☒ | Contiene la tarjeta del Archivo Temático [formato P-104] en forma correcta (Art.14-c junto con el literal b) del artículo 4 del Dto. 117 /94). |
| SI ☒ NO ☐ | Contiene la tarjeta del Archivo de Propietarios [formato P-105] en forma correcta (Art.14-c junto con el literal b) del artículo 4 del Dto. 117 /94). |
| SI ☐ NO ☒ | CUMPLE LOS REQUISITOS TÉCNICOS |

OBSERVACIONES Y OTROS: SI ☒ NO ☐ ver hoja(s) anexa(s)

Santa Fe de Bogotá, D.C., 14-07-00

EXAMINADOR TÉCNICO
Código 202001

DIVISIÓN DE NUEVAS CREACIONES
PRIMER EXAMEN DE FORMA

144 1/2

EXPEDIENTE N° 00-30047
CONCEPTO TÉCNICO N° 1086

IPC: A01N43/707

Las siguientes son las observaciones que se desprenden del primer examen de forma:

Se sugiere que en el resumen del extracto se indiquen las reivindicaciones principales del compuesto con todos sus respectivos sustituyentes y la composición. Si el resumen del extracto sobrepasa el límite del número de palabras establecidas se debe pagar el valor correspondiente asignado por la oficina por cada palabra adicional que se quiera publicar.

Falta la tarjeta de archivo temático, se debe indicar en el resumen la primera reivindicación.

Falta arte final de la fórmula estructural tamaño 12x12 cm por duplicado para efecto de la publicación y uno de 6x6 cm.

Examinador Técnico de Patentes
202001

Santa Fe de Bogotá, 14 de julio de 2000

145
144

EXPEDIENTE 00-030047

AUTO 1225

420
2000-07-25

LA JEFE DE LA DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

DISPONE

ARTICULO PRIMERO: Reconocer personería al doctor JIMENA ESCOBAR URIBE, como apoderado del solicitante, en los términos y para los efectos del poder conferido

ARTICULO SEGUNDO: Conforme lo establece el artículo 22 de la Decisión 344 de la Comisión del Acuerdo de Cartagena, requiérese al solicitante, para que dentro del plazo de treinta (30) días hábiles siguientes a la fecha de notificación del auto, presente respuesta a las observaciones o complemente los antecedentes señalados en el examen de forma.

ARTICULO TERCERO: Notificar por estado el presente auto, advirtiéndole que contra el no procede recurso alguno en la vía gubernativa.

NOTIFIQUESE Y CUMPLASE

Dado en Santafé de Bogotá D.C., a los 25 JUL 2000

LA JEFE DE LA DIVISION DE NUEVAS CREACIONES,

ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL

NOTIFICADO POR ESTADO

Santafé de Bogotá D.C., 27 JUL 2000 notificado por anotación en estado de esta misma fecha.

VENCIMIENTO NOTIFICACION ESTADO

SOLICITO PRORROGA TERMINO SI _____ NO _____

VENCIMIENTO TERMINO PRORROGA