

DELEGATURA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL
División de Nuevas Creaciones

SOLICITUD
PATENTE DE INVENCION

21. EXPEDIENTE No. _____

54. TÍTULO _____ COMPOSICIONES PLAGUICIDAS

51. CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL _____

71. SOLICITANTE _____ DOW AGROSCIENCES LLC

DOMICILIO _____ INDIANA, INDIANAPOLIS, ESTADOS UNIDOS DE AMERICA

74. APODERADO _____ LUZ CLEMENCIA DE PAEZ
C.C. 35.456.344 de Usaquén

22. BOGOTÁ, D. C., _____

**Industria y Comercio**

SUPERINTENDENCIA

PETITORIO

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 12-009988- -00000-0000

Fecha: 2012-01-24 12:11:19 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Follos: 193

ión

FORMULARIO UNICO I**PCT****ENTRADA EN FASE NACIONAL****SOLICITUD DE:**

1

☒ Patente de Invención.☐ Patente de Modelo de Utilidad.☒ Capítulo I.☐ Capítulo II.

2

**SOLICITANTE
(71)**Nombre: **DOW AGROSCIENCES LLC**
Sociedad constituida y existente bajo las
leyes del Estado de Delaware, Estados
Unidos de América.Dirección: 9330 Zionsville Road,
Indianapolis,
Indiana 46268,
Estados Unidos de AméricaDomicilio: Indianapolis,
Indiana,
Estados Unidos de América**IDENTIFICACIÓN**C.C. ☐ NIT ☐C.E. ☐ Otro ☐

Cual

Número

3

**REPRESENTANTE
O APODERADO**Nombre: **LUZ CLEMENCIA DE PAEZ**

Dirección: Carrera 4ª. No. 72-35

Teléfono: 347 36 11

Fax: 211 86 50

E-mail: clientes@cavelier.com

Domicilio: Bogotá, Colombia.

IDENTIFICACIÓNC.C. ☒ NIT ☐C.E. ☐ Otro ☐

Cual

Número 35.456.344 T.P 23.555

4

**INVENTOR (ES)
(72)**1. **Annette BROWN**
8132 Shottery Terrace,
Indianapolis,
Indiana 46268,
Estados Unidos de América3. **Thomas SPARKS**
1322 Greenhills Road,
Greenfield,
Indiana 46140,
Estados Unidos de América5. **Emily RIGSBEE**
8857 Traders Landing,
Brownsburg,
Indiana 46112,
Estados Unidos de América7. **Noormohamed NIYAZ**
1034 Saratoga Circle,
Indianapolis,
Indiana 46280,
Estados Unidos de América2. **Gary CROUSE**
5069 East 146th Street,
Noblesville,
Indiana 46062,
Estados Unidos de América4. **CaSandra MCLEOD**
1121 Walnut St, Apt 2R,
Philadelphia,
Pennsylvania 19107,
Estados Unidos de América6. **William LAMBERT**
1344 Valdosta Place,
Westfield,
Indiana 46074,
Estados Unidos de América

5

PCT (86)Solicitud Internacional No. PCT/US2010/044525Fecha: 05 de agosto de 2010Publicación Internacional No. WO 2011/017504 A1Fecha: 10 de febrero de 2011

6 Título (54) <u>COMPOSICIONES PLAGUICIDAS</u>			
7 Clasificación Internacional (51) <u>A01N 043/064</u>			
8 Prioridad SI ☒ NO ☐	(33) País de Origen	(32) Fecha	(31) Número de Solicitud
	<u>US</u>	<u>07 de agosto de 2009</u>	<u>61/232,152</u>
9 Comprobante de pago No.: <u>12-004885</u> Fecha: <u>18 de enero de 2012</u> Comprobante de pago No.: <u>12-00239</u> Fecha: <u>02 de enero de 2012</u> Comprobante de pago No.: <u>12-004879</u> Fecha: <u>18 de enero de 2012</u>			
10 Anexos:			
☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud por \$ 590.000.00.			
☒ Comprobante de pago por 5 reivindicaciones adicionales después de la décima reivindicación por \$150.000.00.			
☒ Documento que acredita la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica.			
☒ Poder de DOW AGOSCIENCES LLC.			
☐ Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante.			
☐ Declaraciones.			
☐ Copia de la solicitud internacional. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)			
☒ Copia de la carátula de la Publicación Internacional WO 2011/017504 A1.			
☒ Traducción de la solicitud internacional al castellano. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)			
☐ Copia del examen preliminar efectuado por la IPEA.			
☐ Traducción del examen preliminar efectuado por la IPEA.			
☐ De ser el caso, copia del contrato de acceso.			
☐ De ser el caso, documento que acredite la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas.			
☐ De ser el caso, certificado de depósito del material biológico.			
☐ Arte final 12x12			
☐ De ser el caso, información sobre otras solicitudes de patente o títulos obtenidos en el extranjero por el mismo titular o su causante, relacionadas parcial o totalmente con la invención de esta solicitud.			
☒ Otros: VER HOJA DE DOCUMENTOS ANEXOS			

11

FIGURA CARACTERÍSTICA

12

Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE:

LUZ CLEMENCIA DE PAEZ

FIRMA :



C.C. 35.456.344 de Usaquén T.P. 23.555



SCT

DOCUMENTOS ANEXOS

1. ☒ Publicación Internacional WO 2011/017504 A1

Descripción:

Páginas 161 en español

Reivindicaciones: Número (s) 15

Figuras: Número (s)

2. ☒ **Forma PCT/ISA/210.** Informe de Búsqueda Internacional.

3. ☒ Extracto de publicación.

**NO SE REALIZARON MODIFICACIONES EN LA FASE
INTERNACIONAL**

CAVELIER

ABDGA 203

EDIFICIO SISKI

CARRERA 4ª N° 72-35

BOGOTÁ, 8 - COLOMBIA

REPRESENTACION, RATIFICACION Y PODER

For patents, utility models, industrial designs, trademarks, commercial names, trade emblems, slogans.

Para patentes, modelos de utilidad, diseños industriales, marcas de fábrica, nombres comerciales, enseñas, lemas comerciales.

REPRESENTATION, RATIFICATION AND POWER OF ATTORNEY

I (we), the undersigned / Yo (nosotros), abajo firmado (s)

Dow AgroSciences LLC

of/domiciliado (s) en 9330 Zionsville Road,
Indianapolis, Indiana 46268, United
States of America,

por el presente ratificamos la _____
presentada por _____
como agente oficioso ante _____
en _____

el _____
y por el presente nombramos a GERMAN CAVELIER, tpa. 832; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; EMILIO FERRERO, tpa. 31929; y LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa. 23555; domiciliados en la Carrera 4ª N° 72-35, Bogotá, Colombia, en obediencia a lo dispuesto en el parágrafo 1º del Artículo 543 del Código de Comercio, el primero como principal y los demás como suplentes, en su orden, como mis (nuestros) representantes en todos los asuntos de propiedad industrial con facultad para recibir notificaciones y nombrar apoderados judiciales o extrajudiciales. El primer representante suplente reemplazará al principal en caso de ausencia o impedimento temporal o definitivo de aquél. La misma regla se aplicará cuando el segundo representante suplente haya de reemplazar al primero, o el tercero al segundo. En tales casos, el representante principal, o el primero, o segundo suplente, en su caso, o ambos, declararán su intención de no ejercer la representación mediante declaración autenticada por Notario Público en Colombia, o por Notario u otro Funcionario Público, o Cónsul de Colombia, en el extranjero; y si se tratare de impedimento, con el certificado respectivo. Si alguno de los nombrados faltare definitivamente, el siguiente tomará su lugar. Cuando cesare la ausencia o impedimento del representante principal, o de su primero o segundo suplentes, en su caso, podrán ejercer la representación, en su orden, uno u otros según el caso, asumiéndola por el solo hecho de ejercerla, cesando en ese momento el ejercicio de la representación por el primero, segundo o tercer suplente en su caso.

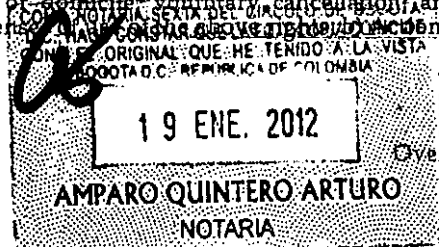
Además, confiero (conferimos) poder a los abogados arriba nombrados, para obtener la protección de mi (nuestra) propiedad industrial y contra la competencia desleal, a cuyo efecto autorizo (amos) a los dichos apoderados para que me (nos) representen ante cualesquiera entidades o personas, ejerzan o no jurisdicción, especialmente ante las del orden administrativo, contencioso-administrativo y judicial, así como los tribunales de arbitramento, en todo lo concerniente a los siguientes asuntos: a) Obtención de patentes de invención, modelos de utilidad y diseños industriales; el registro de marcas de fábrica, colectivas, defensivas, de servicio, lemas comerciales, nombres comerciales, enseñas, variedades vegetales y denominaciones de origen; su renovación, traspaso, cambio de nombre o domicilio, cancelación voluntaria; y el registro de licencias de uso de esos derechos; b) Las acciones de competencia desleal, protección del consumidor, oposiciones u observaciones, cancelación administrativa o judicial, nulidad,

hereby ratify the _____
filed without a Power of Attorney by _____
before _____
in _____
on _____

and do hereby appoint GERMAN CAVELIER, tpa. 832; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; EMILIO FERRERO, tpa. 31929; and LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa. 23555; domiciled at Carrera 4ª N° 72-35, Bogotá, Colombia, in due compliance with the terms of Paragraph 1st. of Article 543 of the Commercial Code, the first as principal and the others as alternates, in the order of their appointment, as our representatives for all industrial property matters with faculty to receive notifications and to appoint attorneys in and out of Court. The first alternate shall replace the principal in case of his absence or of temporal or definitive impediment. The same rule will apply when the second alternate representative is to replace the first one, or when the third is to replace the first or second alternates in their turn, or both of them, second. In such cases, the principal representative, or the shall state their intention not to act as representatives through a declaration given before a Notary Public in Colombia, or before a Notary or another Public Official or a Colombian Consul abroad; and in case of impediment, the appropriate certificate shall suffice. If any of the appointees were to be definitely absent, the following alternate shall take his place. When the absence or impediment of the principal representative, or of the first or second alternate in their turn ceases, the representation can be taken again in their sequence, by the principal, the first or second alternate depending on case, and the mere fact or its exercise will suffice. The exercise of the representation by the first, second or third alternates in their turn shall end at such time.

In addition, we grant a Power of Attorney in favor of the above-named attorneys-at-law so that they may obtain the protection of my (our) industrial property and against the unfair competition, for which purpose I (we) authorize the said attorneys to represent me (us) before any authorities or persons, with or without jurisdiction, specially those administrative, administrative contentious and judicial, as well as before Arbitration Court, in all matters concerning the following: a) Obtainment of patents, utility models and industrial designs; the registration of trademarks, collective, defensive and service marks, slogans, commercial names, trade emblems, vegetal varieties and denominations of origin; its renewal, assignment, change of name or domicile, voluntary cancellation; and the registration of licenses.

A la vuelta →



medidas cautelares, concesión de licencias, la tutela, la protección de secretos industriales, y en general los juicios civiles, penales, administrativos o contencioso-administrativos relacionados con estos derechos; acciones y procesos que promovamos o se nos promuevan. Y para que en todos los asuntos arriba determinados, puedan sustituir este mandato, transigir, conciliar, admitir los hechos del proceso, desistir, cancelar, recibir, renunciar, y ratificar los actos de agentes oficiosos.

unfair competition, protection to the consumer, oppositions or observations, administrative or Court cancellation, nullity, infringement, granting of licenses, the action for writ mandamus, the protection of trade secrets, and in general the civil, penal, and administrative suits relating to those rights; actions and suits instituted by me (us) or against me (us). And that in all the above matters they may substitute this Power of Attorney, compromise, conciliate, admit the facts of the case, desist, cancel, receive, resign, and ratify acts done by representatives without a power of attorney.

Given and signed this/Dado y firmado hoy _____

February 6, 1978

in/en Indianapolis, Indiana 46268

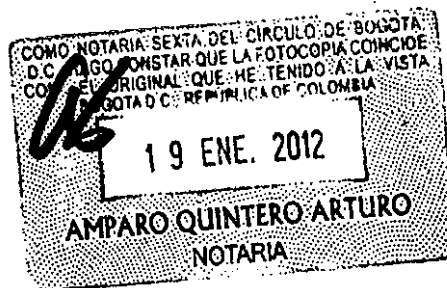
United States of America

Kenneth L. Loertscher

Signature

Firma

Kenneth L. Loertscher
Assistant Secretary
& General Patent Counsel





Consulado General de Colombia

500 NORTH MICHIGAN AVENUE, SUITE 2040
CHICAGO, ILLINOIS 60611

TEL. (312) 923-1196 FAX (312) 923-1197

No. 254

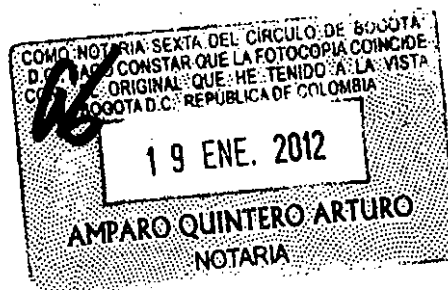
Chicago, FEB 20 1998

El suscrito Cónsul General de Colombia, CERTIFICA, que el señor (a) MARY REEVER, quien como SECRETARIA DELEGADA ESTADO, IN., autenticó la firma del signatario del poder precedente, ejercía en la fecha las funciones indicadas y su firma corresponde a la registrada en este Consulado; que la compañía DOW AGROSCIENCES LLC es una sociedad constituida de acuerdo con las leyes de DELAWARE y cumple su objeto conforme a las mismas; que el (a) señor (a) KENNETH L. LOERTSCHER, quien en su carácter de REPRESENTANTE LEGAL de la citada compañía confiere el poder precedente, es su representante legal en este país.

El Cónsul General no asume responsabilidad alguna por el contenido del documento.

PAGADO IMPUESTO DE TIMBRE Y DERECHOS CONSULARES
US\$56.00 (Cincuenta y seis dólares)


CARLOS ALFONSO NEGRET
Cónsul General



MINISTERIO DE RELACIONES
EXTERIORES

Carlos

321229

Dejados

LA FOTOCOPIA PRESENTADA EN EL
DOCUMENTO DESIEMPRE
CORRESPONDE A LAS
INDICACIONES INDICADAS

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

1998 MAR 11 11:55

[Signature]
JEFE DE LEGALIZACIONES
SANTAFE DE BOGOTA D.C.

Bernarda R. de Martínez
Traductora e Interprete Oficial
Resolución 683 Minjusticia 1994

COMO NOTARIA SEXTA DEL CÍRCULO DE BOGOTÁ
D.C. HAGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA COINCIDE
CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA
BOGOTÁ D.C. REPÚBLICA DE COLOMBIA

[Signature]

19 ENE. 2012

AMPARO QUINTERO ARTURO
NOTARIA

SF 20

UNITED STATES OF AMERICA
CERTIFICATE OF OFFICE
STATE OF INDIANA

I, Sue Anne Gilroy, Secretary of State of Indiana, DO HEREBY CERTIFY: That,
according to records on file in my office, Lydia S. Owens was duly elected
or appointed to the office of Notary Public in and for Hendricks County
and that the term of said office included the date of February 6, 1998: that to all his/her official acts as said offi-



cial, full faith and credit ought to be given in all Courts of
Justice and elsewhere. In testimony whereof, I have here unto
set my hand and affixed the Great Seal of the State of Indiana,
at Indianapolis, this Tenth day of
February, 1998

Sue Anne Gilroy
Secretary of State

by: CHICAGO
Mary Deever
Deputy

COM NOTARIA SEXTA DEL CIRCULO DE BOGOTA
D.C. HAYO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA COINCIDE
CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA
BOGOTA D.C. REPUBLICA DE COLOMBIA
19 ENE. 2012
AMPARO QUINTERO ARTURO
NOTARIA

CERTIFICADO NOTARIAL (INDIVIDUO)

A los 6 días del mes de FEBRERO de 19 98
ante mí, Notario Público de ESTADO DE INDIANA
compareció(eron) personalmente KENNETH L. LOERTSCHER

a quien(es) doy fe de conocer y me consta que es(son) la(s)
persona(s) firmante(s) del documento que precede, y quien(es)
tiene(n) capacidad legal para otorgarlo.

Notario Público — Notary Public

CERTIFICADO NOTARIAL (SOCIEDAD)

Hoy, 6 de FEBRERO de 19 98
compareció(eron) ante mí
KENNETH L. LOERTSCHER

a quien(es) conozco personalmente y que firma(n) este documen
to en representación de la Sociedad/compañía
denominada Dow AgroSciences LLC

Certifico:

1. Que he visto los siguientes documentos:

CERTIFICADO DE CONSTITUCION, FECHADO 1 JULIO 1997
CERTIFICADO DE MODIFICACION, FECHADO 1 OCT. 1997
RESOLUCION JUNTA DIRECTIVA, FECHADO 23 OCT, 1991
CONSENTIMIENTO ESCRITO DE LA JUNTA, 1 JULIO 1997

2. Que dichos documentos prueban lo siguiente:

2.1. Que Dow AgroSciences LLC

es una Sociedad/Compañía legalmente constituida y existente

de acuerdo con las leyes de 1 Estado de Delaware,
Estados Unidos de América

Que el domicilio de dicha Sociedad/Compañía es
9330 Zionsville Road, Indianapolis, Indiana
46268, Estados Unidos de America.

2.3. Que el objeto u objeto para los cuales se otorga el presente
poder están comprendidos dentro del objeto social de la
mencionada Sociedad/Compañía.

2.4. Que el(los) Sr.(Sres.) KENNETH L. LOERTSCHER
SECRETARIO ASISTENTE y ASESOR LEGAL PATENTES

está(n) autorizado(s) para otorgar el presente Poder.

Ciudad INDIANAPOLIS

Fado INDIANA

Hoy 6 FEB. de 19 98

Notario Público — Notary Public

* Los documentos deben identificarse con fecha y origen.

NOTARIAL CERTIFICATE (INDIVIDUAL)

On this 6th day of February 19 98
before me, a Notary Public of State of Indiana.
personally appeared Kenneth L. Loertscher

to me known, and known to me to be the person(s) who
executed that foregoing document, and who has(have) legal
capacity to execute it.

NOTARIAL CERTIFICATE (CORPORATION)

On this 6th day of February 19 98
appeared before me
Kenneth L. Loertscher

who(m) I know personally and who(m) signed this document as
representative(s) of the Dow AgroSciences LLC Limited
named Dow AgroSciences LLC Liability
Company.

I Certify:

1. That I have seen the following documents:

Certificate of formation, dated July 1, 1997
Certificate of amendment, dated October 1, 1997
Board resolution, dated October 23, 1991
Board written consent, dated July 1, 1997

2. That the above documents duly prove the following:

2.1. That Dow AgroSciences LLC

is a Limited Liability
Company legally constituted and in existence

In accordance with the laws of the State of Delaware,
United States of America

2.2. That the domicile of said Limited Liability
Company is
9330 Zionsville Road, Indianapolis, Indiana
46268, United States of America.

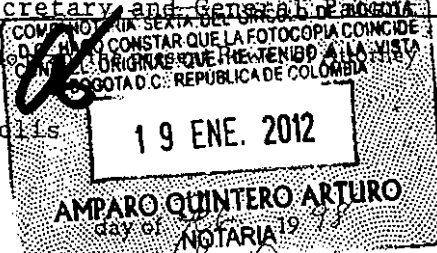
2.3. That the purpose of purposes for which the present Power
of Attorney is granted are comprised within the corporation
purposes set forth in the charter of the mentioned
corporation/Limited liability company.

2.4. That Mr.(Messrs.) Kenneth L. Loertscher
Assistant Secretary and General Counsel
is(are) authorized

City Indianapolis

State Indiana

This 6th



Lydia S. Owens
Notary Public, State of Indiana
Hendricks County
My Commission Expires 03/05/00

* Documents must be identified with date and origin.

**CERTIFICACION NOTARIAL
Y AUTENTICACION CONSULAR**

1. Es necesaria la legalización con certificado notarial. El Notario Público debe certificar:

1.1. Que la compañía está legalmente constituida y actualmente existente.

1.2. Su domicilio.

1.3. Que el propósito del poder está incluido en el objeto social de la compañía.

1.4. Que el poderdante está autorizado para dar el poder en nombre de la compañía.

2. Los documentos que hay que mostrarle al Notario Público para probar los puntos anteriores, deben estar expresados en el Certificado Notarial con fecha y origen:

2.1. Respecto a los puntos 1.1, 1.2 y 1.3 sugerimos referirse a los artículos de constitución con fecha y lugar de otorgamiento; y

2.2. Para el punto 1.4 sugerimos mencionar la resolución de la Junta Directiva o los estatutos, según los cuales la persona que otorga el poder está autorizada para ello.

3. Enseguida el Señor Cónsul de Colombia debe autenticar la firma del Notario Público.

**NOTARIAL CERTIFICATION AND
CONSULAR AUTENTIFICATION**

1. Notarial legalization is necessary. The Notary Public must certify:

1.1. That the company is legally constituted and presently existent.

1.2. Its place of business.

1.3. That the purpose of the Power-of-Attorney is included in the activities of the company.

1.4. That the grantor is empowered to give the Power of Attorney in the name of the company he represents.

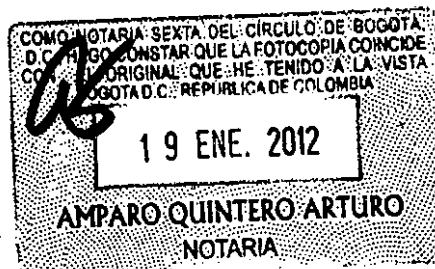
2. The documents which the Notary Public had before him to prove the above points must be listed by him in the Notarial Certificate with dated and origin:

2.1. In connection with points 1.1., 1.2. and 1.3 we suggest referring to the articles of incorporation with date and place of execution.

2.2. For point 1.4 we suggest to mention the resolution of the Board of Directors and/or the by-laws whereby the person who grants the Power of Attorney has been authorized to give it.

3. Then the Colombian Consul must legalize the signature of the Notary Public.

NOTA PARA EL SEÑOR CONSUL COLOMBIANO: Según el artículo 259 del C. de P.C. el Señor Cónsul debe autenticar la última precedente autenticación.



11

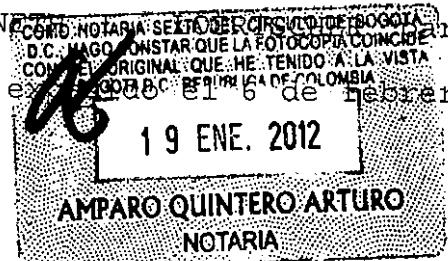
TRADUCCION OFICIAL No.03.075.98 de un documento escrito en inglés el cual para su identificación se sella con el sello del Traductor al mismo tiempo que la presente. Esta traducción ha sido preparada por Bernarda R. de Martínez, Traductora Oficial debidamente reconocida por el Ministerio de Relaciones Exteriores y aprobada por el Ministerio de Justicia de Colombia mediante Resolución No. 683 de 1991.

(Se traducen sellos y legalizaciones que aparecen a continuación de un documento escrito en inglés y español por medio del cual Dow AgroSciences LLC, otorga Poder a favor de GERMAN CAVELIER, GONZALO PERDOMO, EMILIO FERRERO y LUZ CLEMENCIA DE PAEZ.)

Dado y firmado hoy 6 de febrero de 1998, en Indianápolis, Indiana, E.E.U.U., por Kenneth L. Loertscher, Subsecretario y Asesor General de Patentes.

(Sellos parciales en tinta del Consulado General de Colombia en Chicago.)

CERTIFICADO NOTARIAL (INDIVIDUO), en inglés y español referente a la capacidad legal que tenía KENNETH L. LOERTSCHER para otorgar el documento antes mencionado, expedido el 6 de febrero de 1998 en el Estado de Indiana.



CERTIFICADO NOTARIAL (SOCIEDAD), en inglés y español referente a la existencia legal de la sociedad Dow AgroSciences LLC, expedido en la Ciudad de Indianápolis, Indiana, E.E.U.U., el 6 de febrero de 1998.

(Firmado), Lydia S. Owens, Notario Público

(Sello notarial en tinta), LYDIA S. OWENS Notario Público,
Estado de Indiana, Condado de Hendricks Mi comisión expira el
03/05/00

(Sello notarial seco), LYDIA S. OWENS NOTARIO PUBLICO INDIANA

(Sello parcial en tinta del Consulado General de Colombia en
Chicago.)

ESTADO UNIDOS DE AMERICA

CERTIFICADO DEL CARGO

ESTADO DE INDIANA

Yo, SUE ANN GILROY, Secretario de Estado de Indiana, POR EL
PRESENTE CERTIFICO: que, de acuerdo con los archivos que obran
en mi oficina, LYDIA S. OWENS fue debidamente elegido y
nombrado para el cargo de NOTARIO PUBLICO en y para el Condado
de Hendricks y que el término de dicho cargo incluía la fecha
del 6 de febrero de 1998: que a todos sus actos oficiales se
les debe dar completa fe y crédito dentro y fuera de todas las
Corte de Justicia. EN TESTIMONIO DE LO CUAL, he firmado y
estampado el Gran Sello del Estado de Indiana, en Indianápolis,
hoy 10 de febrero de 1998.

(Firma facsimilar), Sue Ann Gilroy

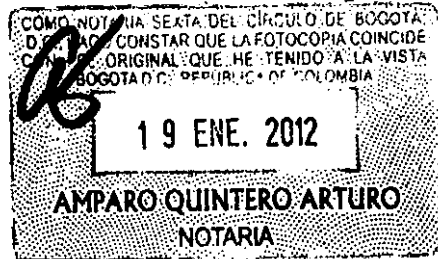
Secretario de Estado

(Firmado),

Por: Mary Reeve

Suplente

(Adherido se encuentra sello de oblea dorado con texto en
relieve), SELLO DEL ESTADO DE INDIANA 1816



(Sello parcial en tinta del Consulado General de Colombia en Chicago.)

(En español), Certificación de la firma y cargo de MARY REEVER, de la existencia legal de la compañía DOW AGROSCIENCES LLC y de la autoridad que tenía su representante Legal, KENNETH L. LOERTSCHER, para otorgar el poder mencionado arriba. Esta certificación fue expedida por el CONSULADO GENERAL DE COLOMBIA EN CHICAGO, ILLINOIS, bajo el N° 254, de fecha 20 de febrero de 1998 y firmada por Carlos Alfonso Negret Mosquera, Cónsul General. Pagados Impuesto de Timbre y Derechos Consulares por valor de veintiún dólares.

(Sello parcial en tinta del Consulado General de Colombia en Chicago.)

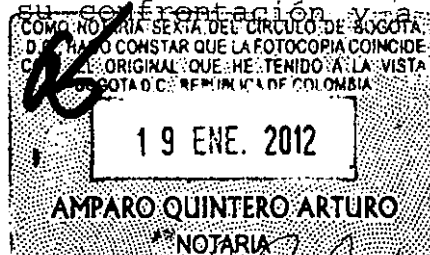
(al dorso), Legalización de la firma que antecede expedida por el MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES bajo el No. 221220, de fecha 11 de marzo de 1998 y firmada por el Jefe de Legalizaciones.

Es traducción fiel y completa de la cual se deja copia en los archivos de esta oficina para su confrontación y a la cual me remito.

Bogotá, 17 de marzo de 1998

COLO 6641-801-001-3

BRM.137



Bernarda R. de Martínez

Bernarda R. de Martínez

Traductora e Interprete Oficial

Resolución 683 Minjusticia 1994

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTAFE DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA(S) ANTERIOR(ES) FIRMA(S) PUESTA(S) POR

[Signature]

IDENTIFICADOS CON C.C. No.(s)

ES(SON) AUTENTICA(S)

SANTAFE DE BOGOTA, 17 MAR 1998

[Circular Stamp: SANTAFE DE BOGOTA, D.C.]

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

98 MAR 18 AMV 56

JEFE DE LEGALIZACIONES
SANTAFE DE BOGOTA D.C.

MINISTERIO DE RELACIONES
EXTERIORES

[Signature]

022686

[Signature]

CUYA FIRMA APARECE EN
DOCUMENTO DESEMPEÑ
LAS FUNCIONES INDICADAS

BOGOTA D.C.

19 ENE. 2012

AMPARO QUINTERO ARTURO
NOTARIA

CAVELIER

ABOGADOS

WEB SITE: www.cavelier.com
E-MAIL: cavelier@cavelier.com

EDIFICIO SISKI
CARRERA 4 No. 72 - 35
BOGOTA 8, COLOMBIA

TELEFONO: (57) (1) 347-3611
TELEFAX: (57) (1) 217-9211 (57) (1) 310-4995

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

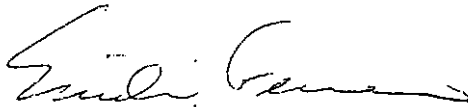
E. S. D.

Poderdante : DOW AGROSCIENCES LLC

Poder conferido el : 06/02/1998

Yo, EMILIO FERRERO, obrando como apoderado principal del poderdante arriba mencionado, mediante el presente escrito sustituyo el poder a mi otorgado a la doctora LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, identificada con cédula de ciudadanía No. 35.456.344 y Tarjeta Profesional N°23.555, con todas las facultades que me fueron conferidas.

Hago la anterior sustitución conforme al artículo 66 del Código de Procedimiento Civil.



EMILIO FERRERO

T.P.A. N° 31.929

C.C. N° 438.019 de Usaquén

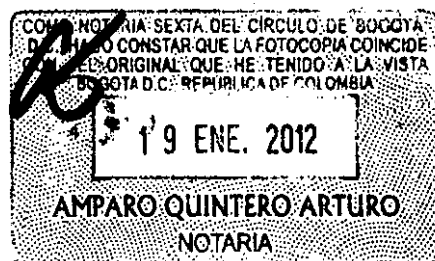
Acepto:



LUZ CLEMENCIA DE PAEZ

T.P.A. N° 23.555

C.C. No. 35.456.344 de Usaquén



NOTARIA SEXTA DE BOGOTA
RECONOCIMIENTO Y PRESENTACION PERSONAL
Bogota, D.C.
Ante mi AMPARO QUINTERO ARTURO
NOTARIA SEXTA DEL CIRCULO DE
BOGOTA, D.C.
Comparecido(s) *Emilio Ferrero
Williamson y Luz Clemencia
Gonzalez de Paez*
Quien(s) exhibi(o) la(s) C.C.
*CC 438019 TP 31929
CC 35456344 TP 23555*
y declaro(s) que la(s) firma(s) que se hace(n)
en el presente documento es(son) la(s) suya(s) y
que el contenido del mismo es cierto.
En constancia se firma esta diligencia.

*Emilio Ferrero
Luz Clemencia Gonzalez*



COMO NOTARIA SEXTA DEL CIRCULO DE BOGOTA
D.C. HAGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA COINCIDE
CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA
BOGOTA D.C. REPUBLICA DE COLOMBIA
19
19 ENE. 2012
AMPARO QUINTERO ARTURO
NOTARIA

15

(12) INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau



(43) International Publication Date
10 February 2011 (10.02.2011)

(10) International Publication Number
WO 2011/017504 A1

(51) International Patent Classification:
A01N 43/64 (2006.01)

(74) Agent: CORVIN, Carl; 9330 Zionsville Rd, Indianapolis, Indiana 46268 (US).

(21) International Application Number:
PCT/US2010/044525

(81) Designated States (unless otherwise indicated, for every kind of national protection available): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PE, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(22) International Filing Date:
5 August 2010 (05.08.2010)

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Data:
61/232,152 7 August 2009 (07.08.2009) US

(71) Applicant (for all designated States except US): DOW AGROSCIENCES LLC [US/US]; 9330 Zionsville Road, Indianapolis, IN 46268-1054 (US).

(84) Designated States (unless otherwise indicated, for every kind of regional protection available): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), Eurasian (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(72) Inventors; and

(75) Inventors/Applicants (for US only): BROWN, Annette [US/US]; 8132 Shottery Terrace, Indianapolis, IN 46268 (US). CROUSE, Gary [US/US]; 5069 East 146th Street, Noblesville, IN 46062 (US). SPARKS, Thomas [US/US]; 1322 Greenhills Road, Greenfield, IN 46140 (US). MCLEOD, CaSandra [US/US]; 1121 Walnut St, Apt 2R, Philadelphia, PA 19107 (US). RIGSBEE, Emily [US/US]; 8857 Traders Landing, Brownsburg, IN 46112 (US). LAMBERT, William [US/US]; 1344 Valdosta Place, Westfield, IN 46074 (US). NIYAZ, Noormohamed [LK/US]; 1034 Saratoga Circle, Indianapolis, IN 46280 (US).

Declarations under Rule 4.17:

— as to applicant's entitlement to apply for and be granted a patent (Rule 4.17(ii))

Published:

— with international search report (Art. 21(3))

(54) Title: PESTICIDAL COMPOSITIONS

(57) Abstract: The present invention concerns novel heteroaryl-N-aryl thiosemicarbazones and their use in pest control, as insecticides and acaricides. This invention also includes preparation of the pesticide compositions containing the compounds, and methods of controlling insects using the compounds.

WO 2011/017504 A1

COMPOSICIONES PLAGUICIDAS

Campo de la invención

La presente solicitud reivindica el beneficio de la Solicitud de patente de invención provisional estadounidense Nro. 5 de acta 61/232.152, presentada el día 7 de agosto de 2009, cuyo contenido se incorpora en su totalidad a la presente a modo de referencia. La invención descrita en este documento se refiere al campo de los plaguicidas y su uso en el control de plagas.

Antecedentes de la invención

10 Las plagas causan anualmente millones de muertes de seres humanos en el mundo. Incluso, existen más de diez mil especies de plagas que provocan pérdidas en la agricultura. Estas pérdidas en la agricultura ascienden a miles de millones de dólares estadounidenses anuales. Las termitas causan daños en 15 toda clase de estructuras, como, por ejemplo, los hogares. Estas pérdidas por daños causados por las termitas en el mundo ascienden a miles de millones de dólares estadounidenses por año. Como observación final, muchas plagas de alimentos almacenados comen y adulteran el alimento almacenado. Las pérdidas de 20 alimentos almacenados ascienden a miles de millones de dólares estadounidenses por año, pero más importante aún, privan a la población del alimento necesario.

Existe una gran necesidad de contar con nuevos plaguicidas. Ciertos insectos están desarrollando resistencia a los 25 plaguicidas de uso actual. Cientos de especies de insectos son resistentes a uno o más plaguicidas. El desarrollo de la resistencia a algunos de los plaguicidas más antiguos, como, por ejemplo, el DDT, los carbamatos y los organofosfatos es muy conocido. Pero han desarrollado resistencia a algunos de los 30 plaguicidas más recientes.

Por lo tanto, existe la necesidad de contar con nuevos plaguicidas, particularmente plaguicidas que posean nuevos modos de acción.

Sustituyentes (Lista no taxativa)

5 Los ejemplos provistos para los sustituyentes (excepto para halo) son no taxativos y no deben interpretarse como limitativos de la invención descrita en este documento.

"Alquenilo" significa un sustituyente acíclico, insaturado (por lo menos un doble enlace de carbono-carbono), ramificado o
10 no ramificado, que consta de carbono e hidrógeno, por ejemplo, vinilo, alilo, butenilo, pentenilo, hexenilo, heptenilo, octenilo, nonenilo, y decenilo.

"Alqueniloxi" significa un alquenilo que consta además de un enlace único de carbono-oxígeno, por ejemplo, aliloxi,
15 buteniloxi, penteniloxi, hexeniloxi, hepteniloxi, octeniloxi, noneniloxi, y deceniloxi.

"Alcoxi" significa un alquilo que además consta de un enlace simple de carbono-oxígeno, por ejemplo, metoxi, etoxi, propoxi, isopropoxi, 1-butoxi, 2-butoxi, isobutoxi, ter-butoxi, pentoxi,
20 2-metilbutoxi, 1,1-dimetilpropoxi, hexoxi, heptoxi, octoxi, nonoxi, y decoxi.

"Alquilo" significa un sustituyente acíclico, saturado, ramificado o no ramificado que consta de carbono e hidrógeno, por ejemplo, metilo, etilo, propilo, isopropilo, 1-butilo, 2-butilo,
25 isobutilo, ter-butilo, pentilo, 2-metilbutilo, 1,1-dimetilpropilo, hexilo, heptilo, octilo, nonilo y decilo.

"Alquinilo" significa un enlace acíclico, insaturado (por lo menos un triple enlace carbono-carbono, y cualquier doble enlace), ramificado o no ramificado, que consta de carbono e

hidrógeno, por ejemplo, etinilo, propargilo, butinilo, pentinilo, hexinilo, heptinilo, octinilo, noninilo y decinilo.

"Alquiniloxi" significa un alquinilo que además consta de un enlace simple de carbono-oxígeno, por ejemplo, pentiniloxi, hexiniloxi, heptiniloxi, octiniloxi, noniniloxi, y deciniloxi.

"Arilo" significa un sustituyente aromático, cíclico, que consta de hidrógeno y carbono, por ejemplo, fenilo, naftilo y bifenilo.

"Cicloalquenilo" significa un sustituyente monocíclico o policíclico, insaturado (por lo menos un doble enlace carbono-carbono) que consta de carbono e hidrógeno, por ejemplo, ciclobutenilo, ciclopentenilo, ciclohexenilo, cicloheptenilo, ciclooctenilo, ciclodecenilo, norbornenilo, biciclo[2.2.2]octenilo, tetrahidronaftilo, hexahidronaftilo, y octahidronaftilo.

"Cicloaqueniloxi" significa un cicloalquenilo que además consta de un enlace simple, por ejemplo, ciclobuteniloxi, ciclopenteniloxi, ciclohexeniloxi, ciclohepteniloxi, cicloocteniloxi, ciclodeceniloxi, norborneniloxi, y biciclo[2.2.2]octeniloxi.

"Cicloalquilo" significa un sustituyente monocíclico o policíclico, saturado, que consta de carbono e hidrógeno, por ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo, ciclooctilo, ciclodecilo, norbornilo, biciclo[2.2.2]octilo y decahidronaftilo.

"Cicloalcoxi" significa un cicloalquilo que además consta de un enlace simple de carbono-oxígeno, por ejemplo, ciclopropiloxi, ciclobutiloxi, ciclopentiloxi, ciclohexiloxi, cicloheptiloxi,

ciclooctiloxi, ciclodeciloxi, norborniloxi, y
biciclo[2.2.2]octiloxi.

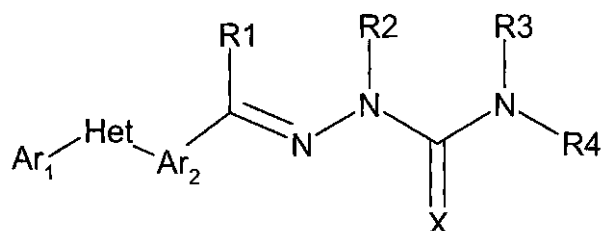
"Halo" significa flúor, cloro, bromo, y yodo.

"Haloalquilo" significa un alquilo que además consta desde
5 uno al número máximo posible de halos, idénticos o diferentes,
por ejemplo, fluormetilo, difluormetilo, trifluormetilo, 1-
fluoretilo, 2-fluoretilo, 2,2,2-trifluoretilo, clorometilo,
triclorometilo, y 1,1,2,2-tetrafluoretilo.

"Heterociclilo" significa un sustituyente cíclico que puede
10 estar completamente saturado, parcialmente insaturado, o
completamente insaturado, donde la estructura cíclica contiene al
menos un carbono y al menos un heteroátomo, donde dicho
heteroátomo es nitrógeno, azufre, u oxígeno, por ejemplo,
benzofuranilo, benzoisotiazolilo, benzoisoxazolilo,
15 benzoxazolilo, benzotienilo, benzotiazolil cinolinilo, furanilo,
indazolilo, indolilo, imidazolilo, isoindolilo, isoquinolinilo,
isotiazolilo, isoxazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, oxazolinilo,
oxazolilo, ftalazinilo, pirazinilo, pirazolinilo, pirazolilo,
piridazinilo, piridilo, pirimidinilo, pirrolilo, quinazolinilo,
20 quinolinilo, quinoxalinilo, 1,2,3,4-tetrazolilo, tiazolinilo,
tiazolilo, tienilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-
triazinilo, 1,2,3-triazolilo, y 1,2,4-triazolilo.

Descripción detallada de la invención

Los compuestos de la presente invención poseen la siguiente
25 fórmula:



donde:

(a) Ar₁ es

(1) furanilo, fenilo, piridazinilo, piridil, pirimidinilo, tienilo, o

(2) furanilo sustituido, fenilo sustituido, piridazinilo sustituido, piridilo sustituido, pirimidinilo sustituido, o tienilo sustituido,

donde dicho furanilo sustituido, fenilo sustituido, piridazinilo sustituido, piridilo sustituido, pirimidinilo sustituido, y tienilo sustituido, poseen uno o más sustituyentes seleccionados de manera independiente de H, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, halocicloalcoxi C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, S(=O)_n(alquilo C₁-C₆), S(=O)_n(haloalquilo C₁-C₆), OSO₂(alquilo C₁-C₆), OSO₂(haloalquilo C₁-C₆), C(=O)NR_xR_y, (alquilo C₁-C₆)NR_xR_y, C(=O)(alquilo C₁-C₆), C(=O)O(alquilo C₁-C₆), C(=O)(haloalquilo C₁-C₆), C(=O)O(haloalquilo C₁-C₆), C(=O)(cicloalquilo C₃-C₆), C(=O)O(cicloalquilo C₃-C₆), C(=O)(alquenilo C₂-C₆), C(=O)O(alquenilo C₂-C₆), (alquilo C₁-C₆)O(alquilo C₁-C₆), (alquilo C₁-C₆)S(alquilo C₁-C₆), C(=O)(alquilo C₁-C₆)C(=O)O(alquilo C₁-C₆), fenilo, fenoxi, fenilo sustituido, y fenoxi sustituido,

donde el fenilo sustituido y el fenoxi sustituido poseen uno o más sustituyentes seleccionados de manera independiente de H, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, halocicloalcoxi C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, S(=O)_n(alquilo C₁-C₆), S(=O)_n(haloalquilo C₁-C₆), OSO₂(alquilo C₁-C₆), OSO₂(haloalquilo C₁-C₆), C(=O)NR_xR_y, (alquilo C₁-C₆)NR_xR_y, C(=O)(alquilo C₁-C₆),

$C(=O)O(\text{alquilo } C_1-C_6)$, $C(=O)(\text{haloalquilo } C_1-C_6)$,
 $C(=O)O(\text{haloalquilo } C_1-C_6)$, $C(=O)(\text{cicloalquilo } C_3-C_6)$,
 $C(=O)O(\text{cicloalquilo } C_3-C_6)$, $C(=O)(\text{alquenilo } C_2-C_6)$,
 $C(=O)O(\text{alquenilo } C_2-C_6)$, $(\text{alquilo } C_1-C_6)O(\text{alquilo } C_1-C_6)$, $(\text{alquilo } C_1-C_6)S(\text{alquilo } C_1-C_6)$, $C(=O)(\text{alquilo } C_1-C_6)C(=O)O(\text{alquilo } C_1-C_6)$
 5 fenilo, y fenoxi;

(b) Het es un anillo heterocíclico, saturado o insaturado, de 5 o 6 miembros, que contiene uno o más heteroátomos seleccionados de manera independiente de nitrógeno, azufre u
 10 oxígeno, y donde Ar_1 y Ar_2 no son orto entre sí (pero pueden ser meta o para, como, por ejemplo, para un anillo de cinco miembros, ellos son 1,3 y para un anillo de 6 miembros, son 1,3 o 1,4), y donde el anillo heterocíclico puede estar sustituido también con uno o más sustituyentes seleccionados de manera independiente de
 15 H, OH, F, Cl, Br, I, CN, NO_2 , oxo, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , cicloalcoxi C_3-C_6 , halocicloalcoxi C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , $S(=O)_n(\text{alquilo } C_1-C_6)$, $S(=O)_n(\text{haloalquilo } C_1-C_6)$, $OSO_2(\text{alquilo } C_1-C_6)$, $OSO_2(\text{haloalquilo } C_1-C_6)$, $C(=O)NR_xR_y$,
 20 $(\text{alquilo } C_1-C_6)NR_xR_y$, $C(=O)(\text{alquilo } C_1-C_6)$, $C(=O)O(\text{alquilo } C_1-C_6)$, $C(=O)(\text{haloalquilo } C_1-C_6)$, $C(=O)O(\text{haloalquilo } C_1-C_6)$, $C(=O)(\text{cicloalquilo } C_3-C_6)$, $C(=O)O(\text{cicloalquilo } C_3-C_6)$, $C(=O)(\text{alquenilo } C_2-C_6)$, $C(=O)O(\text{alquenilo } C_2-C_6)$, $(\text{alquilo } C_1-C_6)O(\text{alquilo } C_1-C_6)$, $(\text{alquilo } C_1-C_6)S(\text{alquilo } C_1-C_6)$, $C(=O)(\text{alquilo } C_1-C_6)C(=O)O(\text{alquilo } C_1-C_6)$, fenilo, fenoxi, fenilo sustituido y
 25 fenoxi sustituido,

donde dichos fenilo sustituido y fenoxi sustituido poseen uno o más sustituyentes seleccionados de manera independiente de H, F, Cl, Br, I, CN, NO_2 , alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 ,
 30

cicloalcoxi C₃-C₆, halocicloalcoxi C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, S(=O)_n(alquilo C₁-C₆), S(=O)_n(haloalquilo C₁-C₆), OSO₂(alquilo C₁-C₆), OSO₂(haloalquilo C₁-C₆), C(=O)H, C(=O)NR_xR_y, (alquilo C₁-C₆)NR_xR_y, C(=O)(alquilo C₁-C₆), C(=O)O(alquilo C₁-C₆), C(=O)(haloalquilo C₁-C₆), C(=O)O(haloalquilo C₁-C₆), C(=O)(cicloalquilo C₃-C₆), C(=O)O(cicloalquilo C₃-C₆), C(=O)(alquenilo C₂-C₆), C(=O)O(alquenilo C₂-C₆), (alquilo C₁-C₆)O(alquilo C₁-C₆), (alquilo C₁-C₆)S(alquilo C₁-C₆), C(=O)(alquilo C₁-C₆)C(=O)O(alquilo C₁-C₆), fenilo y fenoxi;

(c) Ar₂ es

(1) furanilo, fenilo, piridazinilo, piridilo, pirimidinilo, tienilo, o

(2) furanilo sustituido, fenilo sustituido, piridazinilo sustituido, piridilo sustituido, pirimidinilo sustituido, o tienilo sustituido,

donde dichos furanilo sustituido, fenilo sustituido, piridazinilo sustituido, piridilo sustituido, pirimidinilo sustituido, y tienilo sustituido, poseen uno o más sustituyentes seleccionados de manera independiente de H, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, halocicloalcoxi C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, S(=O)_n(alquilo C₁-C₆), S(=O)_n(haloalquilo C₁-C₆), OSO₂(alquilo C₁-C₆), OSO₂(haloalquilo C₁-C₆), C(=O)NR_xR_y, (alquilo C₁-C₆)NR_xR_y, C(=O)(alquilo C₁-C₆), C(=O)O(alquilo C₁-C₆), C(=O)(haloalquilo C₁-C₆), C(=O)O(haloalquilo C₁-C₆), C(=O)(cicloalquilo C₃-C₆), C(=O)O(cicloalquilo C₃-C₆), C(=O)(alquenilo C₂-C₆), C(=O)O(alquenilo C₂-C₆), (alquilo C₁-C₆)O(alquilo C₁-C₆), (alquilo

C_1-C_6)S(alquilo C_1-C_6), $C(=O)(alquilo\ C_1-C_6)C(=O)O(alquilo\ C_1-C_6)$,
fenilo, fenoxi, fenilo sustituido y fenoxi sustituido,

donde dichos fenilo sustituido y fenoxi sustituido poseen uno o más sustituyentes seleccionados de manera independiente de H, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , hidroxicicloalquilo C_3-C_6 , cicloalcoxi C_3-C_6 , halocicloalcoxi C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , S(=O)_n(alquilo C_1-C_6), S(=O)_n(haloalquilo C_1-C_6), OSO₂(alquilo C_1-C_6), OSO₂(haloalquilo C_1-C_6), C(=O)H, C(=O)NR_xR_y, (alquilo C_1-C_6)NR_xR_y, C(=O)(alquilo C_1-C_6), C(=O)O(alquilo C_1-C_6), C(=O)(haloalquilo C_1-C_6), C(=O)O(haloalquilo C_1-C_6), C(=O)(cicloalquilo C_3-C_6), C(=O)O(cicloalquilo C_3-C_6), C(=O)(haloalquilo C_1-C_6), C(=O)(alqueno C_2-C_6), C(=O)O(alqueno C_2-C_6), (alquilo C_1-C_6)O(alquilo C_1-C_6), (alquilo C_1-C_6)S(alquilo C_1-C_6), C(=O)(alquilo C_1-C_6)C(=O)O(alquilo C_1-C_6), fenilo, y fenoxi);

(d) X es O o S;

(e) R₁ se selecciona de H, CN, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , cicloalcoxi C_3-C_6 , halocicloalcoxi C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , S(=O)_n(alquilo C_1-C_6), S(=O)_n(haloalquilo C_1-C_6), OSO₂(alquilo C_1-C_6), OSO₂(haloalquilo C_1-C_6), C(=O)NR_xR_y, (alquilo C_1-C_6)NR_xR_y, C(=O)(alquilo C_1-C_6), C(=O)O(alquilo C_1-C_6), C(=O)(haloalquilo C_1-C_6), C(=O)O(haloalquilo C_1-C_6), C(=O)(cicloalquilo C_3-C_6), C(=O)O(cicloalquilo C_3-C_6), C(=O)(alqueno C_2-C_6), C(=O)O(alqueno C_2-C_6), (alquilo C_1-C_6)O(alquilo C_1-C_6), (alquilo

C_1-C_6)S(alquilo C_1-C_6), $C(=O)(alquilo\ C_1-C_6)C(=O)O(alquilo\ C_1-C_6)$,
fenilo, fenoxi;

(f) R2, R3 y R4 se seleccionan de manera independiente de
H, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino
5 C_2-C_6 , $C(=O)(alquilo\ C_1-C_6)$, $C(=O)O(alquilo\ C_1-C_6)$,
 $C(=O)(cicloalquilo\ C_3-C_6)$, $C(=O)O(cicloalquilo\ C_3-C_6)$,
 $C(=O)(alqueno\ C_2-C_6)$, $C(=O)O(alqueno\ C_2-C_6)$, (alquilo C_1-
 C_6)O(alquilo C_1-C_6), (alquilo C_1-C_6)S(alquilo C_1-C_6), $C(=O)(alquilo$
 $C_1-C_6)C(=O)O(alquilo\ C_1-C_6)$, $C(=O)$ fenilo, fenilo, alquilfenilo C_1-
10 C_6 , alquilfenoxi C_1-C_6 , indanilo, $C(=O)Het-1$, Het-1, (alquilo C_1-
 C_6)Het-1, o alquilo $C_1-C_6-O-Het-1$,

donde cada alquilo, cicloalquilo, cicloalcoxi,
halocicloalcoxi, alcoxi, haloalcoxi, alqueno, alquino,
alquilfenilo C_1-C_6 , fenilo, fenoxi, y Het-1, se encuentran
15 opcionalmente sustituidos con uno o más sustituyentes
seleccionados de manera independiente de F, Cl, Br, I, CN, NO₂,
NR_xR_y, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 ,
halocicloalquilo C_3-C_6 , cicloalcoxi C_3-C_6 , halocicloalcoxi C_3-C_6 ,
alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , cicloalqueno C_3-
20 C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquino C_3-C_6 , S(=O)_n(alquilo C_1-C_6),
S(=O)_n(haloalquilo C_1-C_6), S(=O)₂N(alquilo C_1-C_6)₂, OSO₂(alquilo C_1-
 C_6), OSO₂(haloalquilo C_1-C_6), $C(=O)H$, $C(=O)NR_xR_y$, (alquilo C_1-
 C_6)NR_xR_y, $C(=O)(alquilo\ C_1-C_6)$, $C(=O)O(alquilo\ C_1-C_6)$,
 $C(=O)(haloalquilo\ C_1-C_6)$, $C(=O)O(haloalquilo\ C_1-C_6)$,
25 $C(=O)(cicloalquilo\ C_3-C_6)$, $C(=O)O(cicloalquilo\ C_3-C_6)$,
 $C(=O)(alqueno\ C_2-C_6)$, $C(=O)O(alqueno\ C_2-C_6)$, (alquilo C_1-
 C_6)O(alquilo C_1-C_6), (alquilo C_1-C_6)S(alquilo C_1-C_6), $C(=O)(alquilo$
 $C_1-C_6)C(=O)O(alquilo\ C_1-C_6)$, fenilo, fenoxi, O-Het-1, y Het-1,

donde Het-1 es un anillo heterocíclico, saturado o insaturado, de 5 o 6 miembros, que contiene uno o más heteroátomos seleccionados de manera independiente de nitrógeno, azufre u oxígeno,

5 donde R3 y R4 juntos pueden formar opcionalmente un grupo cíclico, saturado o insaturado, de 3 a 8 miembros que puede contener uno o más heteroátomos seleccionados entre nitrógeno, azufre y oxígeno;

(g) $n = 0, 1, \text{ o } 2$;

10 (h) R_x y R_y se seleccionan de manera independiente de H, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , $S(=O)_n(\text{alquilo } C_1-C_6)$, $S(=O)_n(\text{haloalquilo } C_1-C_6)$, $OSO_2(\text{alquilo } C_1-C_6)$, $OSO_2(\text{haloalquilo } C_1-C_6)$, $C(=O)H$, $C(=O)(\text{alquilo } C_1-C_6)$,
 15 $C(=O)O(\text{alquilo } C_1-C_6)$, $C(=O)(\text{haloalquilo } C_1-C_6)$, $C(=O)O(\text{haloalquilo } C_1-C_6)$, $C(=O)(\text{cicloalquilo } C_3-C_6)$, $C(=O)O(\text{cicloalquilo } C_3-C_6)$, $C(=O)(\text{alqueno } C_2-C_6)$, $C(=O)O(\text{alqueno } C_2-C_6)$, $(\text{alquilo } C_1-C_6)O(\text{alquilo } C_1-C_6)$, $(\text{alquilo } C_1-C_6)S(\text{alquilo } C_1-C_6)$, $C(=O)(\text{alquilo } C_1-C_6)C(=O)O(\text{alquilo } C_1-C_6)$,
 20 y fenilo.

En otra realización, Ar_1 es un fenilo sustituido, donde el fenilo sustituido posee uno o más sustituyentes seleccionados de manera independiente de alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , y haloalcoxi C_1-C_6 . En una realización más preferida, Ar_1 es un
 25 fenilo sustituido, donde el fenilo sustituido posee uno o más sustituyentes seleccionados de manera independiente de OCF_3 , OCF_2CF_3 , CF_3 .

En otra realización, Het es un triazolilo, imidazolilo, pirrolilo, o pirazolilo.

En otra realización, Het es un pirazolilo sustituido, donde el pirazolilo sustituido posee uno o más sustituyentes seleccionados de manera independiente de H, $C(=O)O(\text{alquilo } C_1-C_6)$, o $C(=O)NR_xR_y$.

5 En otra realización, Ar_2 es un fenilo.

En otra realización, R_1 es un H o un alquilo C_1-C_6 .

En otra realización, R_2 es H o un alquilo C_1-C_6 .

En otra realización, R_3 es H.

En otra realización X, es S.

10 En otra realización, R_4 es un alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alqueno C_2-C_6 , $C(=O)$ fenilo, alquifenilo C_1-C_6 , Het-1, o $(\text{alquilo } C_1-C_6)\text{Het-1}$.

En otra realización, R_4 es un alquilo C_1-C_6 , alquifenilo C_1-C_6 , fenilo, o Het-1, donde cada uno de ellos se encuentra
15 sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de manera independiente de F, Cl, Br, I, CN, NO_2 , NR_xR_y , alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , cicloalqueno C_3-C_6 , $S(=O)_n(\text{alquilo } C_1-C_6)$, $S(=O)_n(\text{haloalquilo } C_1-C_6)$, $S(=O)_2N(\text{alquilo } C_1-C_6)_2$, $C(=O)(\text{alquilo } C_1-C_6)$, $C(=O)O(\text{alquilo } C_1-$
20 $C_6)$, $C(=O)(\text{haloalquilo } C_1-C_6)$, $(\text{alquilo } C_1-C_6)O(\text{alquilo } C_1-C_6)$, fenilo, O-Het-1, y Het-1.

Mientras se han expresado estas realizaciones, son posibles otras realizaciones y combinaciones de estas realizaciones expresadas y otras realizaciones.

25 Preparación de intermediarios de triarilo

Los compuestos de la presente invención se pueden preparar mediante la fabricación de un intermediario de triarilo, $Ar_1\text{-Het-}Ar_2$, y, posteriormente, su unión con el intermediario deseado para formar el compuesto deseado. Es posible utilizar una amplia

diversidad de intermediarios de triarilo para preparar compuestos de la presente invención, con la condición de que dichos intermediarios de triarilo contengan un grupo funcional adecuado en Ar₂ al que se puede unir el resto del intermediario deseado.

5 Los grupos funcionales adecuados incluyen un grupo oxoalquilo o formilo. Estos intermediarios de triarilo se pueden preparar mediante los métodos descriptos anteriormente en la literatura química. Varios de estos métodos se encuentran descriptos a continuación.

10 Los intermediarios en los que "Het" es una piridina, pirimidina, pirazina o piridizina sustituida se pueden preparar apareando una piridina, pirimidina o pirazina sustituida con halo o alquiltio con un ácido bórico de arilo o un éster de borato, bajo condiciones de arilación de Suzuki. Véase, por ejemplo, lo
15 siguiente:

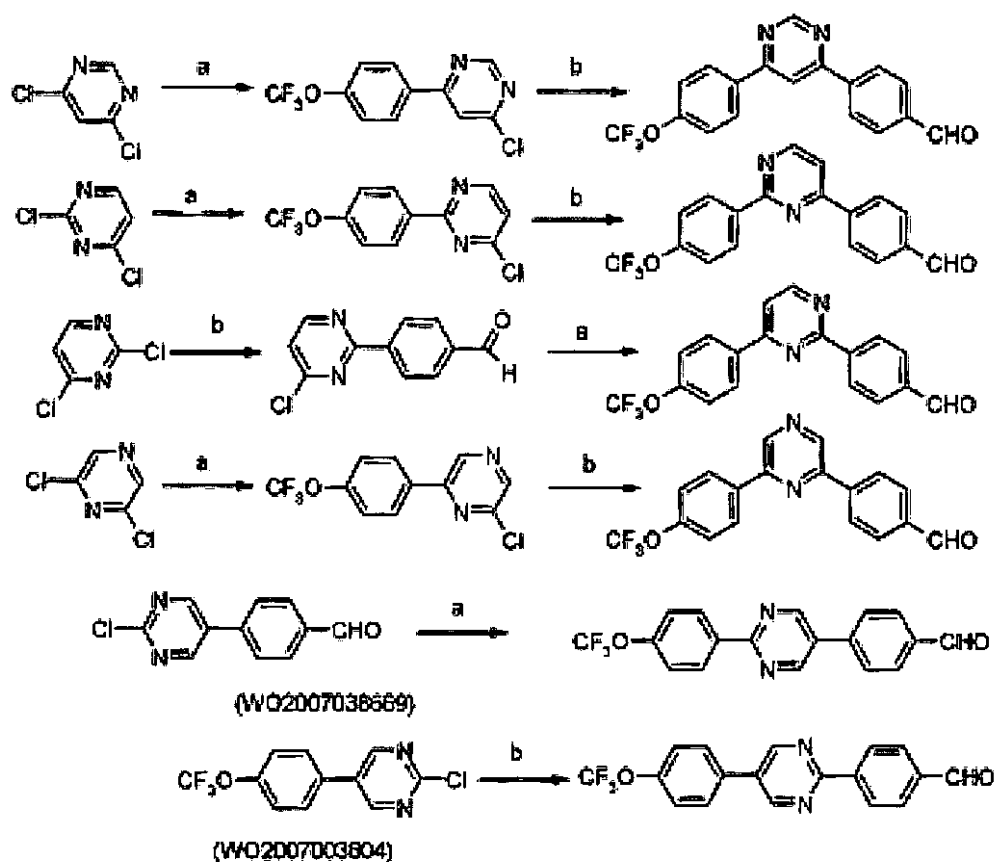
Para las piridinas: Couve-Bonnaire et al. *Tetrahedron* 2003, 59, 2793 y Puglisi et al. *Eur. J. Org. Chem.* 2003, 1552.

Para las pirazinas: Schultheiss y Bosch, *Heterocycles* 2003, 60, 1891.

20 Para las pirimidinas: Qing et al. *J. Fluorine Chem.* 2003, 120, 21, y Ceide y Montalban *Tetrahedron Lett.* 2006, 47, 4415.

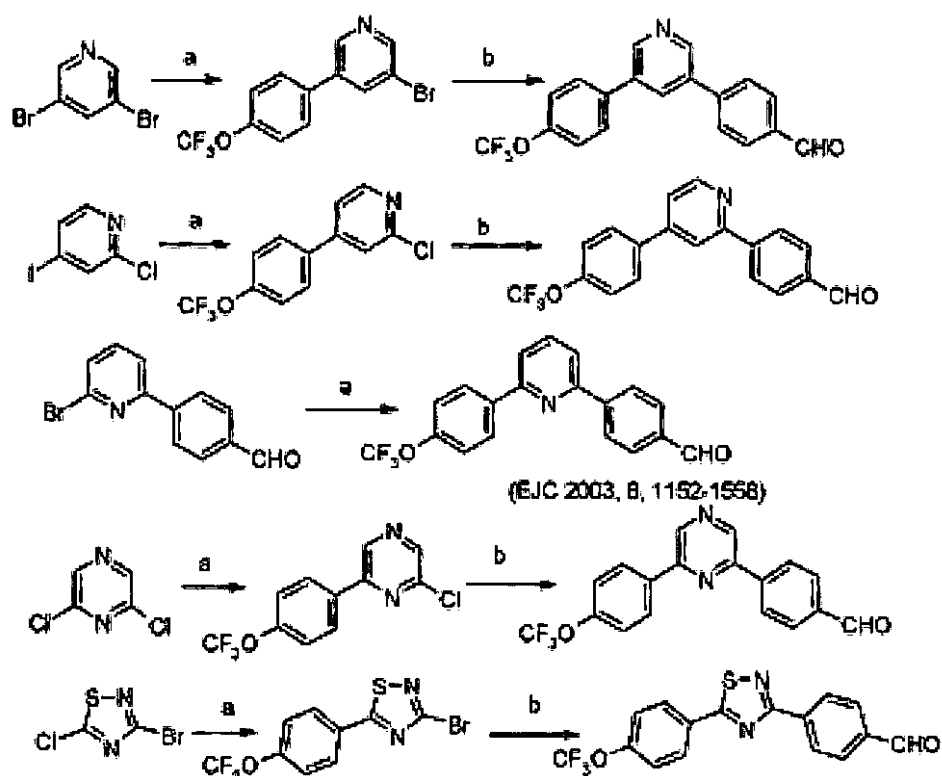
Para las 2,4-diaril pirimidinas: Schomaker y Delia, *J. Org.Chem.* 2001, 66, 7125.

Por lo tanto, las arilaciones catalizadas con paladio
25 sucesivas, con el uso de ácido 4-formilfenilbórico y ácido 4-trifluormetoxifenilo, pueden generar virtualmente cualquier patrón de sustitución particular, como se muestra en el siguiente esquema:



Condiciones: a) ácido 4-trifluorometoxifenilbórico, $(\text{Ph}_3\text{P})_4\text{Pd}$;
b) ácido 4-formilfenilbórico, $(\text{Ph}_3\text{P})_4\text{Pd}$

De manera similar, las diaril piridinas y pirazinas como también otros compuestos aromáticos heterocíclicos dihalogenados se pueden preparar a partir de piridinas y pirazinas dihalogenadas y otros compuestos aromáticos heterocíclicos dihalogenados con el mismo protocolo:

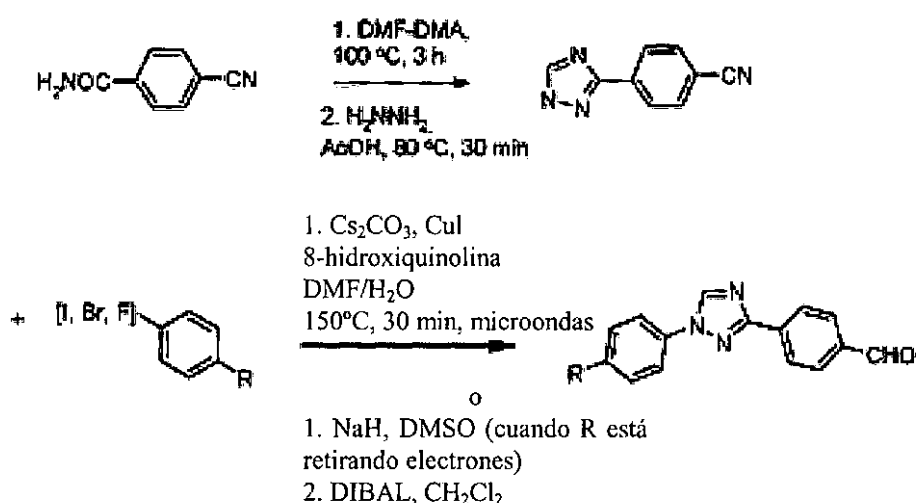


Condiciones: a) ácido 4-trifluorometoxifenilbórico, $(\text{Ph}_3\text{P})_4\text{Pd}$;
b) ácido 4-formilfenilbórico, $(\text{Ph}_3\text{P})_4\text{Pd}$

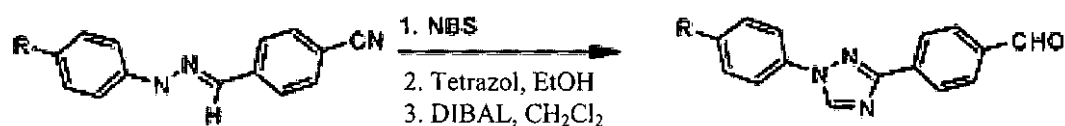
Los precursores de halo- o alquiltio-pirimidina y piridina se encuentran disponibles en el comercio o se pueden sintetizar mediante las vías descriptas en la literatura (Rorig y Wagner, Patente de invención estadounidense Nro. 3.149.109, 1964; Kreutzberger y Tesch *Arzneim.-Forsch.* 1978, 28, 235).

Los compuestos intermediarios en los que "Het" es un 1,2,4-triazol 1,3-disustituido se pueden preparar de acuerdo con uno de los siguientes esquemas.

Vía A: Los 1,3-diaril 1,2,4-triazoles se prepararon a partir de los -NH 3-aril 1,2,4-triazoles correspondientes siguiendo una vía publicada para la N-arilación de imidazoles (Lin et al. *J. Org. Chem.* 1979, 44, 4160). El apareamiento de 1,2,4-triazoles con haluros de arilo se realizó bajo condiciones térmicas o, preferentemente, de microondas (Antilla et al. *J. Org. Chem.* 2004, 69, 5578). (DIBAL es hidruro de diisobutilaluminio).

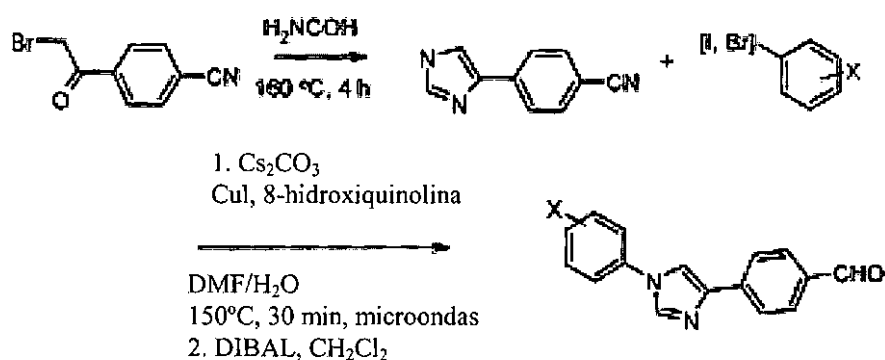


Vía B: La bromación de hidrazonas seguida por el tratamiento de la bromohidrazona con tetrazol resulta en la formación del 1,3-diaril 1,2,4-triazol (Butler y Fitzgerald *J. Chem. Soc., Perkin Trans. 1* 1988, 1587).

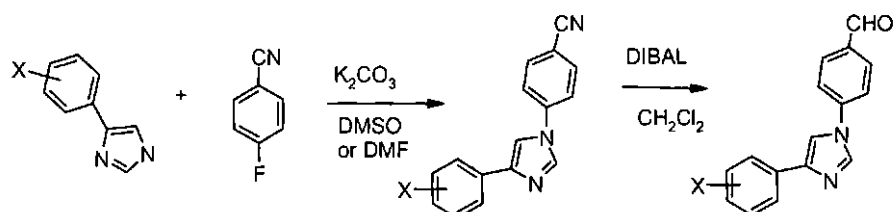


Los compuestos en los que "Het" es un imidazol se pueden preparar de acuerdo con uno de los siguientes esquemas:

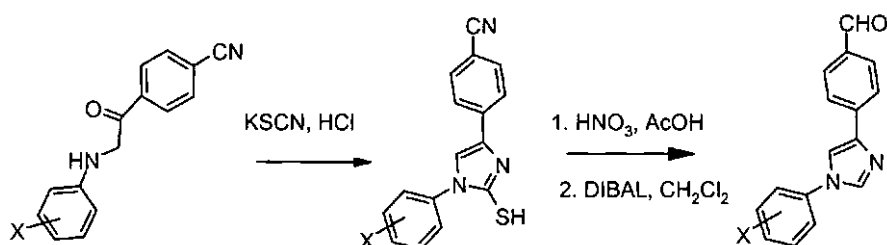
Vía A (Paso 1: Lynch et al. *J. Am. Chem. Soc.* 1994, 116, 11030. Paso 2: Liu et al. *J. Org. Chem.* 2005, 70, 10135):



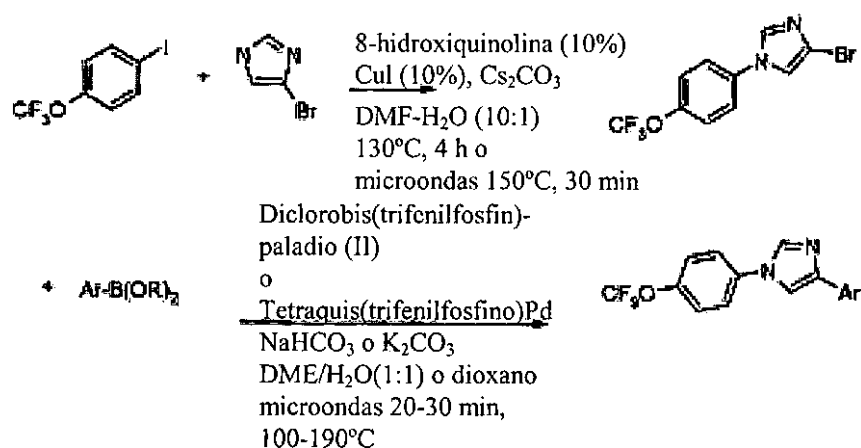
Vía B. Para los grupos halo-arilo que también contienen un grupo activador como, por ejemplo, nitro o ciano, el desplazamiento de un haluro de arilo con un imidazol, con el uso de una base como, por ejemplo, carbonato de potasio en un solvente aprótico polar, como, por ejemplo, *N,N*-dimetilformamida (DMF) o sulfóxido de dimetilo (DMSO), se puede lograr de la siguiente manera (Bouchet et al. *Tetrahedron* 1979, 35, 1331):



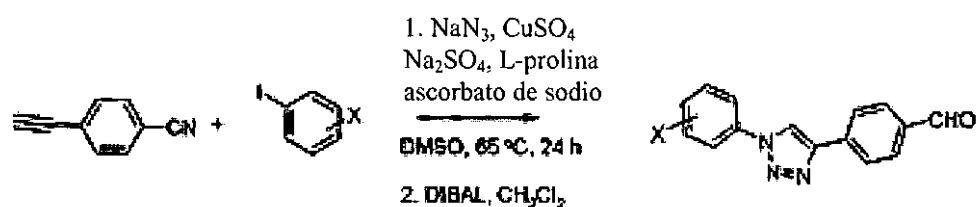
Vía C: Siguiendo un procedimiento descrito por primera vez por Porretta et al. (*Farmaco, Edizione Scientifica* 1985, 40, 404), se trata una *N*-fenacilalanina con tiocianato de potasio en un medio ácido (HCl), y el imidazol 2-mercapto resultante se convierte luego al imidazol de diarilo desulfurado mediante un tratamiento con ácido nítrico en ácido acético.



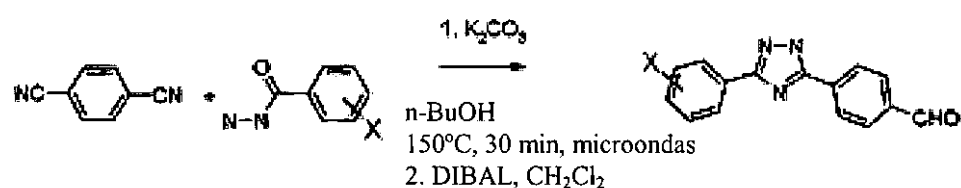
Vía D. La *N*-arilación de 4-bromoimidazol bajo condiciones de irradiación de microondas (Vía A, Paso 2) proporcionó el intermediario 1-aril-4-bromoimidazol, que se convirtió en los intermediarios de triarilo mediante un tratamiento con ácidos arilbóricos bajo condiciones catalizadas por paladio.



Los compuestos en los que "Het" es un 1,2,3-triazol 1,4-disustituido, se pueden preparar de acuerdo con el siguiente esquema (Feldman et al. *Org Lett.* 2004, 6, 3897):

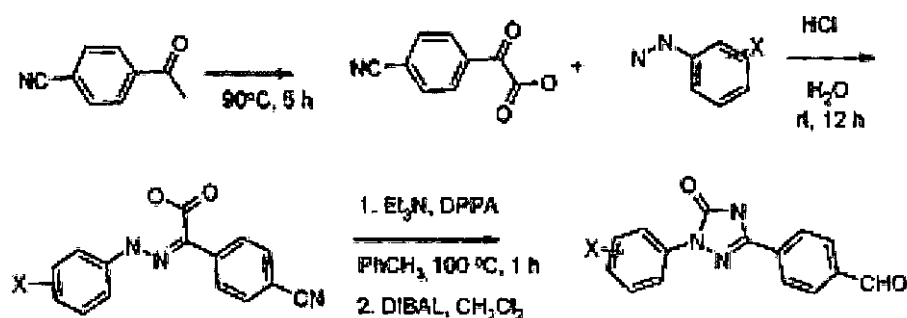


Los compuestos en los que "Het" es un 1,2,4-triazol 3,5-disustituido se pueden preparar de acuerdo con el siguiente esquema (Yeung et al. *Tetrahedron Lett.* 2005, 46, 3429):

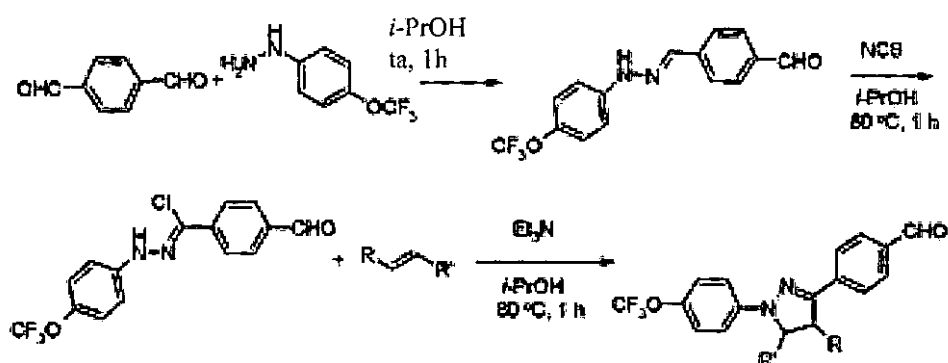


Los compuestos en los que "Het" es una 1,2,4-triazolin-5-ona 1,3-disustituida se pueden preparar de acuerdo con el siguiente esquema (Pirrung y Tepper *J. Org. Chem.* 1995, 60, 2461 y Lyga *Synth. Commun.* 1986, 16, 163). (DPPA es difenil fosforil azida):

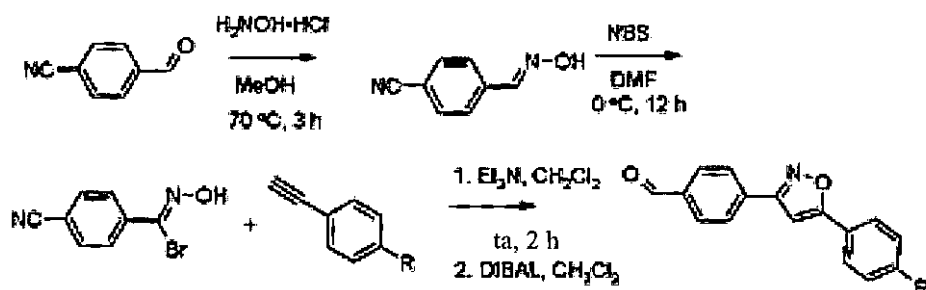
SeO₂
piridina



Los compuestos en los que "Het" es una 1,3-diaril pirazolina se pueden preparar de acuerdo con el siguiente esquema. La monohidrazona de tereftalaldehído se trata con *N*-clorosuccinimida (NCS) en alcohol isopropílico (*i*-PrOH), y el intermediario de clorohidrazona resultante se trata directamente con una base y una olefina sustituida para generar la pirazolina:

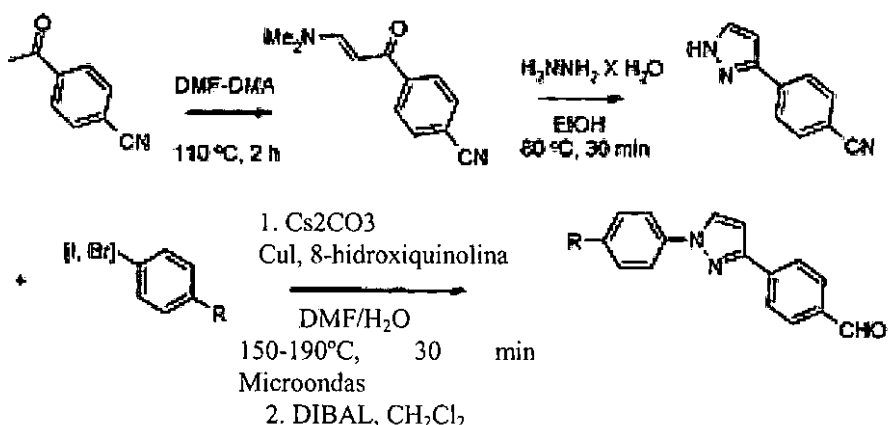


Los compuestos en los que "Het" es un isoxazol 3,5-disustituido se pueden preparar de acuerdo con el siguiente esquema:



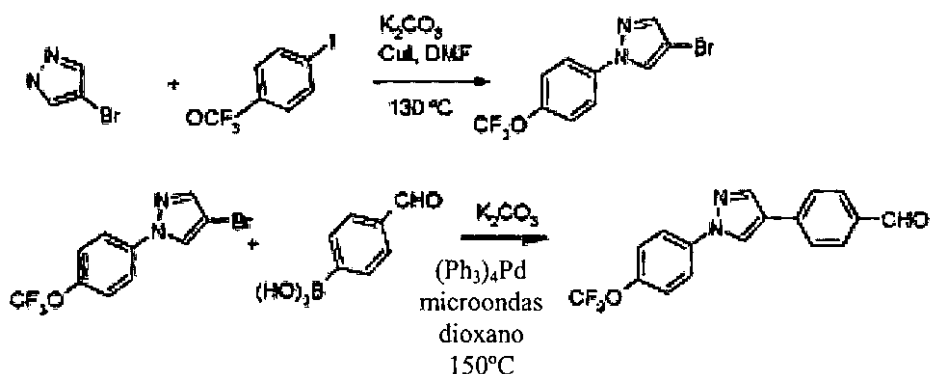
Los compuestos en los que "Het" es un pirazol 1,3-disustituido se pueden preparar de acuerdo con el siguiente esquema. El apareamiento del pirazol con los aromáticos

halogenados se realizó con las condiciones de microondas descriptas por Liu et al., Vía A, Paso 2, explicados anteriormente. (DMA es dimetil acetal).



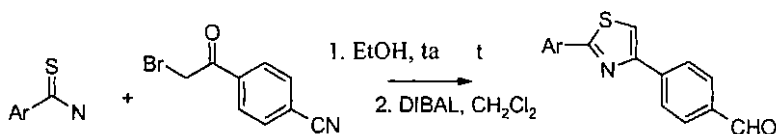
5 Los compuestos en los que "Het" es un pirazol 1,4-disustituido se pueden preparar de acuerdo con el siguiente esquema. El 4-bromopirazol se aparea en primer lugar con un análogo de yodofenilo y el 1-aryl-4-bromopirazol resultante se aparea luego con un ácido fenilbórico bajo las condiciones

10 descriptas anteriormente para la arilación de imidazoles.

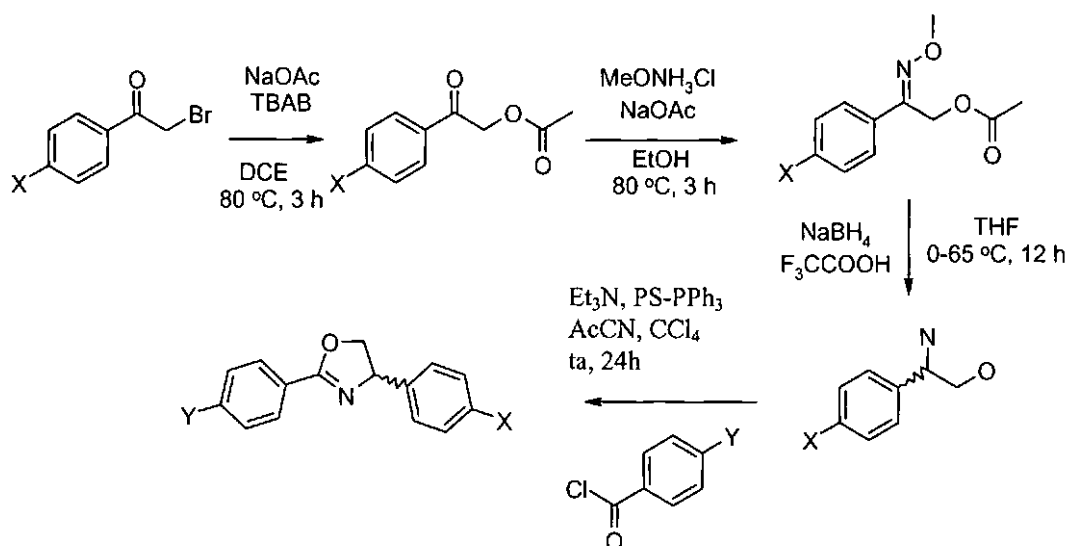


Los compuestos en los que "Het" es un tiazol 2,4-disustituido se preparan por condensación de una tioamida a una α -halo acetofenona en un solvente prótico como, por ejemplo,

15 etanol (por ejemplo, Potts y Marshall *J. Org. Chem.* 1976, 41, 129).

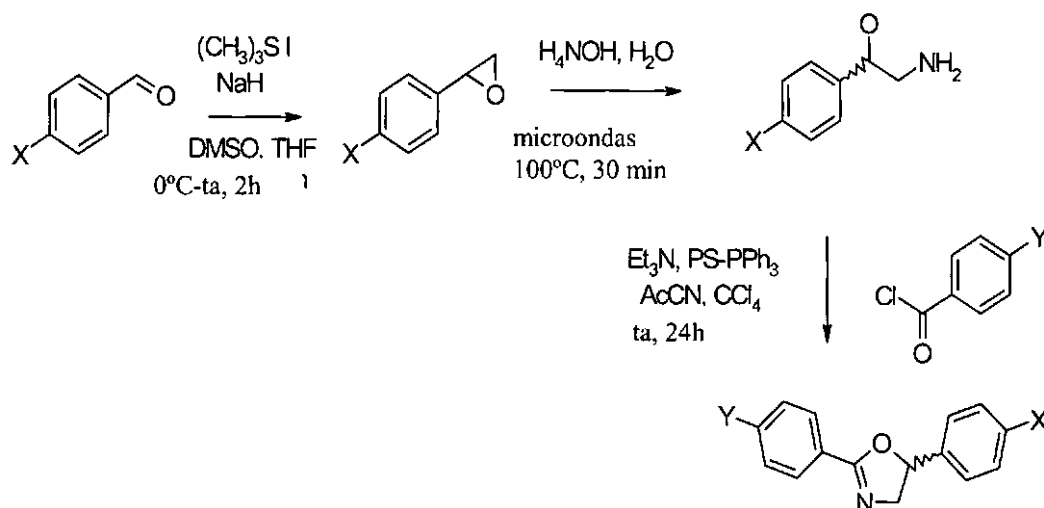


Los compuestos en los que "Het" es una oxazolina 2,4-disustituida se preparan a partir de la α -bromoacetofenona de acuerdo con el siguiente esquema (Periasamy et al. *Synthesis* 2003, 1965 y Liu et al. *J. Am. Chem. Soc.* 2007, 129, 5834).



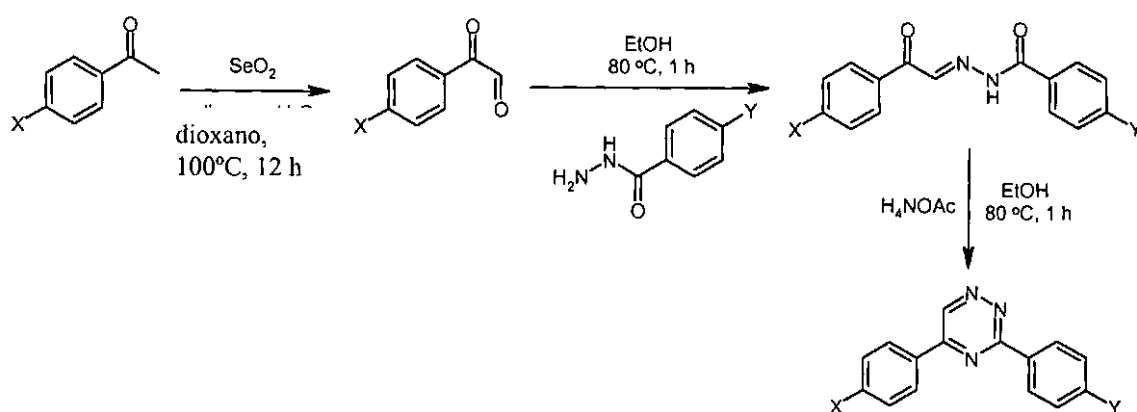
5

Los compuestos en los que "Het" es una oxazolina 2,5-disustituida se preparan de acuerdo con el siguiente esquema (Favretto et al. *Tetrahedron Lett.* 2002, 43, 2581 y Liu et al. *J. Am. Chem. Soc.* 2007, 129, 5834):



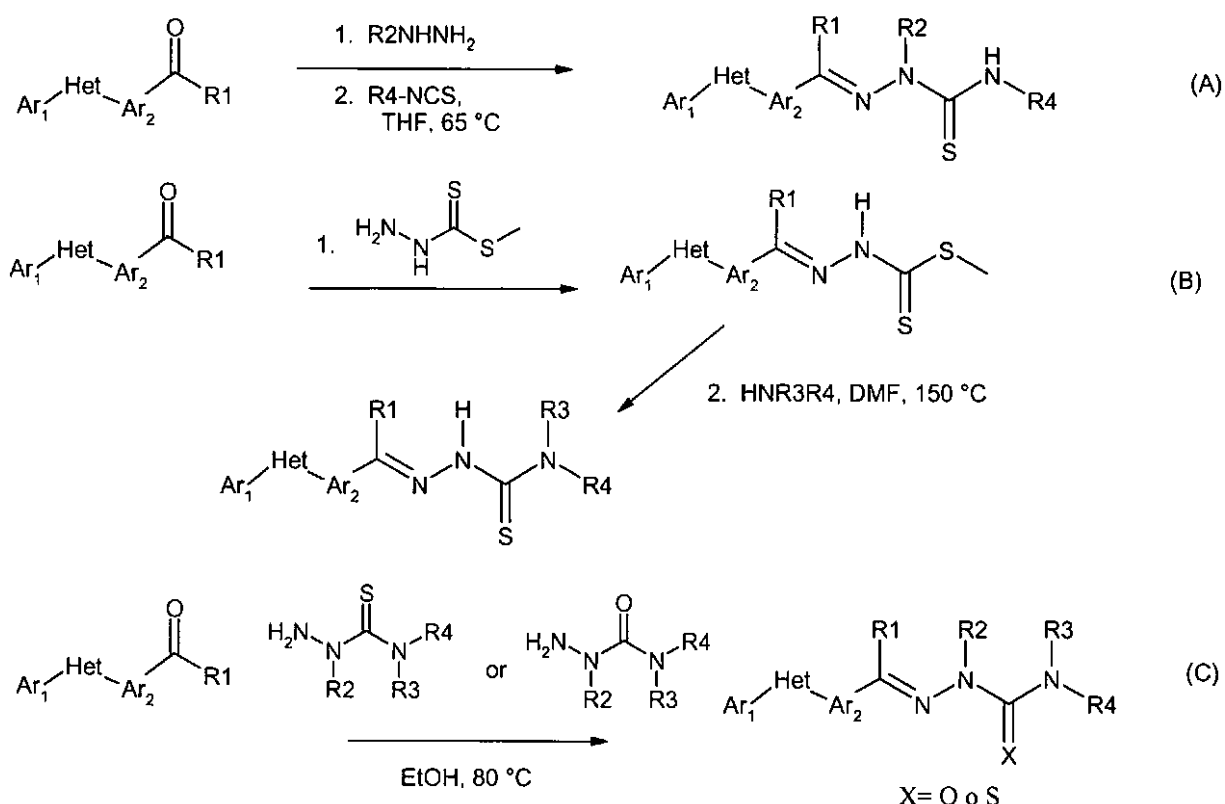
10

Los compuestos en los que "Het" es una 1,2,4-triazina 3,5-disustituida se preparan de acuerdo con el siguiente esquema (Reid et al. *Bioorg. Med. Chem. Lett.* 2008, 18, 2455 y Saraswathi y Srinivasan *Tetrahedron Lett.* 1971, 2315):



Preparación de compuestos unidos a hidrazona

Los compuestos unidos a hidrazona se pueden preparar a partir de los aril aldehídos o cetonas correspondientes mediante uno de tres métodos: (A) por reacción con hidrazina, seguido por una reacción con isotiocianato de arilo en tetrahidrofurano (THF), a temperaturas entre 0 y 100°C ; (B) por reacción con hidrazincarboditioato de metilo, seguido por la reacción con una amina en un solvente aprótico polar como, por ejemplo, DMF, a temperaturas entre 25 y 150°C ; o (C) por reacción con una alquil o aril semicarbazida o tiosemicarbazida, que se encuentra disponible en el comercio o bien puede ser preparada por un experto en la técnica, en un solvente prótico polar como, por ejemplo, alcohol de etilo (EtOH), a temperaturas entre 0 y 100°C .

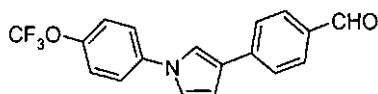


Ejemplos

Los ejemplos se proveen a los efectos ilustrativos y no deben interpretarse como limitativos de la invención descrita en este documento a sólo las realizaciones descritas en estos ejemplos.

Los materiales de partida, los reactivos y solventes que se obtuvieron de fuentes comerciales se utilizaron sin purificación adicional. Los solventes anhidros se adquirieron como Sure/Seal™ de Aldrich y se utilizaron tal como se recibieron. Los puntos de fusión se obtuvieron en un aparato de punto de fusión capilar Thomas Hoover Unimelt o un sistema de punto de fusión automatizado OptiMelt de Sanford Research Systems y no se corrigieron.

Ejemplo 1: Preparación de 4-[1-(4-trifluorometoxifenil)-1H-pirrol-3-il]-benzaldehído.



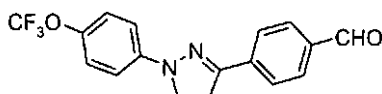
Paso 1. 1-(4-trifluormetoxifenil)-1H-pirrol. El compuesto se preparó de acuerdo con Colotta et al. *J. Med. Chem.* 2006, 49, 6015. Una solución de 4-trifluormetoxifenil amina (500 miligramos (mg), 2,82 milimoles (mmol), 1,00 equivalente (eq)) y 2,5-dietoxi tetrahidrofurano (452 mg, 2,82 mmol, 1,00 eq) en ácido acético glacial (20 mililitros (mL)) se calentó a 90°C durante 1 hora (h) antes de secarse sobre gel de sílice. El residuo se suspendió luego en hexano en reflujo, se filtró caliente, y se concentró hasta secarse para proporcionar el intermediario deseado (519 mg, 81%).

Paso 2. 3-bromo-1-(4-trifluormetoxifenil)-1H-pirrol. El compuesto se preparó de acuerdo con Bray et al. *J. Org. Chem.* 1990, 55, 6317. A una solución de 1-(4-trifluormetoxifenil)-1H-pirrol (519 mg, 2,29 mmol, 1,00 eq) en THF (250 mL) a -78°C se agregó una solución 0,05 M de N-bromosuccinimida (NBS; 408 mg, 2,29 mmol, 1,00 eq) en THF durante 45 minutos (min). El recipiente se entibió lentamente hasta la temperatura ambiente antes de la concentración para proporcionar el bromopirrol bruto, del cual se demostró que consta de 55% del intermediario deseado por CG-EM. El material se utilizó en la reacción siguiente sin purificación adicional.

Paso 3. 4-[1-(4-trifluormetoxifenil)-1H-pirrol-3-il]-benzaldehído. Una suspensión de 3-bromo-1-(4-trifluormetoxifenil)-1H-pirrol bruto (356 mg, 1,26 mmol, 1,00 eq), ácido 4-formilfenilbórico (283 mg, 1,89 mmol, 1,50 eq), dicloruro de bis(trifenilfosfino)paladio(II) (27 mg, 0,04 mmol, 0,03 eq), 2 M Na₂CO₃ (ac.) (1,26 mL, 2,52 mmol, 2,0 eq), y 1,4-

dioxano (5 mL) se calentó a 150°C en recipiente de reacción de microondas durante 45 min. La solución enfriada se diluyó luego con EtOAc (20 mL), se filtró sobre Celite®, se concentró hasta secarse, y se purificó por cromatografía (2:2:1, 5 hexano:EtOAc:acetona) para proporcionar el intermediario deseado (79 mg, 21%).

Ejemplo 2: Preparación de 4-[1-(4-trifluormetoxifenil)-4,5-dihidro-1H-pirazol-3-il]-benzaldehído.



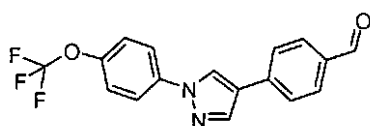
10 **Paso 1. 1-(4-trifluormetoxifenil)-pirazolidin-3-ona:** El compuesto se preparó de acuerdo con Rees y Tsoi *Chem. Commun.* 2000, 415. Una suspensión de clorhidrato de (4-trifluormetoxifenil)-hidrazina (300 mg, 1,32 mmol, 1,00 eq), cloruro de 3-cloropropionilo (167 mg, 1,32 mmol, 1,00 eq), y PS-
15 DIEA (1,30 gramos (g), 5,28 mmol, 4,00 eq) en THF (20 mL) se agitó a temperatura ambiente durante 12 h. La solución se filtró luego, se concentró hasta secarse y se purificó por cromatografía (2:2:1, hexano:EtOAc:acetona) para proporcionar el intermediario deseado (120 mg, 37%).

20 **Paso 2. 3-cloro-1-(4-trifluormetoxifenil)-4,5-dihidro-1H-pirazol:** El procedimiento general se tomó de Wang et al. *Tetrahedron Lett.* 2005, 46, 2631. A una solución de 1-(4-trifluormetoxifenil)-pirazolidin-3-ona (120 mg, 0,49 mmol, 1,00 eq) en tolueno (20 mL), se agregó lentamente cloruro de fosforilo
25 (22,5 mg, 1,47 mmol, 3,00 eq). La mezcla se calentó luego a 80°C durante 1 h antes de enfriar hasta la temperatura ambiente y se templó con H₂O (10 mL). El recipiente se agitó bajo una atmósfera

de nitrógeno (N₂) durante 8 h antes de extraerse el producto en EtOAc (200 mL), se secó (MgSO₄), y se concentró bajo presión reducida. La CG-EM demostró la formación de 88% del intermediario deseado, que se utilizó en reacciones posteriores sin purificación adicional.

Paso 3. 4-[1-(4-trifluormetoxifenil)-4,5-dihidro-1H-pirazol-3-il]-benzaldehído: Una suspensión de 3-cloro-1-(4-trifluormetoxifenil)-4,5-dihidro-1H-pirazol (114 mg, 0,43 mmol, 1,00 eq), ácido 4-formilfenilbórico (97 mg, 0,65 mmol, 1,50 eq), dicloruro de bis(trifenilfosfino)paladio(II) (10 mg, 0,01 mmol, 0,03 eq), 2 M Na₂CO₃ (aq) (0,43 mL, 0,86 mmol, 2,0 eq), y 1,4-dioxano (5 mL) se calentó a 150°C en un recipiente de reacción de microondas durante 45 min. La solución enfriada se diluyó luego con EtOAc (20 mL), se filtró sobre Celite®, se concentró hasta secarse, y se purificó por cromatografía (2:2:1, hexano:EtOAc:acetona) para proporcionar el intermediario deseado (50 mg, 0,15 mmol, 31%).

Ejemplo 3: Preparación de 4-[1-(4-trifluormetoxifenil)-1H-pirazol-4-il]-benzaldehído



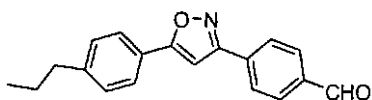
20

Paso 1. 4-bromo-1-(4-trifluormetoxifenil)-1H-pirazol. Se agitaron en DMF (8 mL) 4-bromopirazol (1,5 g, 10 mmol) y 4-yodotrifluormetoxibenceno (3,0 g, 10,3 mmol) y se trataron con fosfato de potasio (6,3 g, 30 mmol) y CuI (0,5 g, 2,6 mmol). La solución se agitó y calentó hasta 130°C durante 30 min, luego se enfrió hasta la temperatura ambiente y se vertió en NH₄OH 1 N (50 mL). El precipitado sólido se aisló por filtración, se redisolvió

en éter, se filtró y se concentró hasta obtener un sólido color tostado. La recristalización de EtOH proporcionó de un sólido blancuzco (2,1 g): pf 63-65°C; CLEM 308,6 (M+1).

Paso 2. 4-[1-(4-trifluormetoxifenil)-1H-pirazol-4-il]-benzaldehído. Una suspensión del bromopirazol (0,31 g, 1 mmol) y ácido 4-formilbórico (0,15 g, 1 mmol), una solución de carbonato de potasio acuosa 2 M (1 mL), y tetraquis(trifenilfosfino)-paladio(0) (35 mg, cat) en dioxano (6 mL) se calentó hasta 150°C en un reactor de microondas. El residuo se concentró luego in vacuo y se purificó por cromatografía (0-100% de EtOAc-hexanos) para proporcionar el compuesto del título (175 mg) en forma de sólido color tostado: pf 107-109°C; CLEM 332,8 (M+1).

Ejemplo 4: Preparación de 4-[5-(4-propilfenil)-isoxazol-3-il]-benzaldehído.



15

Paso 1. 4-(hidroxiiminometil)-benzonitrilo. El compuesto se preparó de acuerdo con Biasotti et al. *Bioorg. Med. Chem.* 2003, 11, 2247. Una suspensión de 4-formilbenzonitrilo (500 mg, 3,81 mmol, 1,00 eq), clorhidrato de hidroxilamina (290 mg, 4,19 mmol, 1,10 eq), y acetato de sodio (1,56 g, 19,05 mmol, 5,00 eq) en MeOH (50 mL) se calentó a 70°C durante 4 h antes de concentrarse hasta secarse. El residuo se suspendió luego en Et₂O, se filtró y concentró para proporcionar el intermediario deseado (496 mg, 3,39 mmol, 89%).

Paso 2. 4-(hidroxiimino-bromometil)-benzonitrilo. El compuesto se preparó de acuerdo con Tanaka et al. *Bull. Chem. Soc. Jpn.* 1984, 57, 2184. Una solución 0,05 M de N-

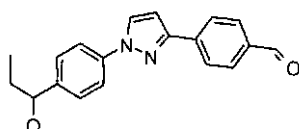
25

bromosuccinimida (724 mg, 4,07 mmol, 1,20 eq) en CH₂Cl₂ se agregó por goteo a una solución a 0°C de 4-(hidroxiiminometil)-benzonitrilo (496 mg, 3,39 mmol, 1,00 eq) en CH₂Cl₂ (50 mL). La solución se entibió hasta la temperatura ambiente antes de dividirse volumétricamente entre dos matraces de reacción diferentes. Cada matraz se concentró luego y el residuo bruto se utilizó sin purificación adicional.

Paso 3. 4-[5-(4-propilfenil)-isoxazol-3-il]-benzonitrilo.

Una solución de 4-(hidroxiimino-bromometil)-benzonitrilo (381 mg, 1,70 mmol), trietilamina (0,71 mL, 5,10 mmol, 3,0 eq), y 1-etinil-4-propilbenceno (1,23 g, 8,50 mmol, 5,0 eq) en tolueno (20 mL) se calentó a 100°C durante 1 h antes de la concentración hasta secarse. La purificación por medio de una cromatografía de fase normal proporcionó el intermediario deseado (108 mg, 22%). La reducción del nitrilo al aldehído correspondiente se logró siguiendo el procedimiento DIBAL descripto anteriormente.

Ejemplo 5: Preparación de 4-{1-[4-(1-hidroxipropil)-fenil]-1H-pirazol-3-il}-benzaldehído.

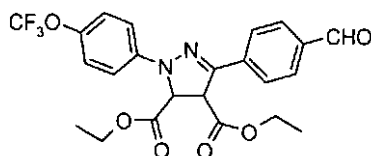


Paso 1. 3-(4-cianofenil)pirazol. A un matraz de base redonda equipado con una barra de agitación mecánica y un condensador de reflujo se agregaron p-cianoacetofenona (5 g, 34,44 mmol) y dimetilformamida dimetilacetal (DMF-DMA; 40 mL). La mezcla se agitó a reflujo durante 5 h antes de la concentración bajo presión reducida proporcionó el intermediario de dimetilamino-acriloilbenzonitrilo bruto. El residuo se suspendió luego en un volumen mínimo de EtOH (~20 mL), se cargó con monohidrato de

hidrazina (1,67 mL, 34,4 mmol), y se calentó a 80°C durante 30 min antes de la concentración. El material de 3-(4-cianofenil)pirazol bruto (5,59 g, 33 mmol, 96%) que se aisló presentó la pureza suficiente para utilizar en la siguiente
5 reacción.

Paso 2. 4-[1-(4-propionil-fenil)-1H-pirazol-3-il]-benzonitrilo. 4-(1H-pirazol-3-il)-benzonitrilo (100 mg, 0,591 mmol), 1-(4-bromofenil)-propan-1-ona (126 mg, 0,591 mmol), Cs₂CO₃ (770 mg, 2,364 mmol), CuI (4 mg, 0,018 mmol), 8-hidroxiquinolina
10 (3 mg, 0,018 mmol), y DMF/H₂O (2 mL; solución 10:1) se combinaron en un recipiente de reacción de microondas CEM de 10 mL equipado con una barra magnética de agitación y se sometieron a irradiación de microondas a 150°C durante 30 min. El contenido se filtró luego y se concentró hasta secarse para proporcionar el
15 nitrilo (158 mg, 0,508 mmol, 86%). La reducción del nitrilo al aldehído correspondiente se logró siguiendo el procedimiento DIBAL descrito anteriormente.

Ejemplo 6: Preparación de dietiléster del ácido 5-(4-formilfenil)-2-(4-trifluormetoxifenil)-3,4-dihidro-2H-pirazol-
20 3,4-dicarboxílico.



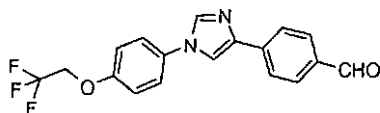
Paso 1. Preparación de 4-[(4-trifluormetoxifenil)-hidrazonometil]-benzaldehído. El compuesto se preparó de acuerdo con Paulvannan et al. *Tetrahedron* 2000, 56, 8071. A una solución
25 agitada de bencen-1,4-dicarbaldehído (1,50 g, 11,2 mmol, 1,0 eq) en *i*-PrOH (250 mL) se agregó clorhidrato de 4-

trifluormetoxifenilhidrazina (2,55 g, 11,2 mmol, 1,0 eq) en porciones durante 5 min. La solución se agitó a temperatura ambiente durante 1 h antes de la concentración hasta secarse y la purificación por cromatografía (2:2:1 hexano:EtOAc:acetona) para proporcionar el intermediario (2,48 g, 72%).

Paso 2. Síntesis de clorohidrazona. El intermediario se preparó de acuerdo con Lokanatha Rai y Hassner *Synth. Commun.* 1989, 19, 2799. Una solución de 4-[(4-trifluormetoxifenil)-hidrazonometil]-benzaldehído (2,48 g, 8,05 mmol, 1,00 eq) y *N*-clorosuccinimida (1,61 g, 12,08 mmol, 1,5 eq) en *i*-PrOH (100 mL) se calentó a 80°C durante 1 h. La solución se enfrió luego y se dividió volumétricamente de manera uniforme entre seis recipientes de reacción diferentes para que cada uno de ellos contenga 1,34 mmol del intermediario.

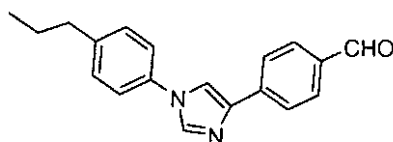
Paso 3. Síntesis de pirazolina. Los compuestos se prepararon de acuerdo con Paulvannan et al. *Tetrahedron* 2000, 56, 8071. A cada recipiente de reacción se agregaron trietilamina (0,56 mL, 4,02 mmol, 3,00 eq) y los acrilatos respectivos (6,70 mmol, 5,00 eq). Las mezclas de reacción se calentaron luego a 70°C durante 90 min antes de concentrarse hasta secarse y la purificación por cromatografía (2:2:1, hexano:EtOAc:acetona). La reducción de los nitrilos a los aldehídos correspondientes se logró siguiendo el procedimiento DIBAL descrito anteriormente.

Ejemplo 7: Preparación de 4-{1-[4-(2,2,2-trifluoretoxi)-fenil]-1*H*-imidazol-4-il}-benzaldehído.



4-(2-bromoacetil)-benzonitrilo (58 mg, 0,21 mmol) y 4-(2,2,2-trifluoretoxi)-fenilamina (50 mg, 0,21 mmol) se combinaron en un frasco Erlenmeyer de 100 mL equipado con una barra de agitación magnética. El contenido se disolvió en EtOH (1 mL) y se agitó a temperatura ambiente durante 2 h. El intermediario bruto se transfirió luego a una frasco de base redonda de 100 mL que contenía KSCN (21 mg, 0,21 mmol) y HCl concentrado (18 μ L, 0,21 mmol). El recipiente se calentó a 80°C durante 1 h antes de verter su contenido en una solución 1:1 de H₂O/NH₄OH (5 mL). La solución se dejó reposar durante 24 h y, luego se filtró el sólido y se lavó con éter para proporcionar el imidazoletiol intermediario (32 mg, 0,086 mmol, 33%). Posteriormente, se agregó una solución acuosa de HNO₃ (1,35 mL, 0,387 mmol) y KNO₃ (1 mg, 0,003 mmol) por goteo durante 10 min a una suspensión del imidazoltiol en ácido acético (2 mL). Luego de agitar durante 2 h a temperatura ambiente, la solución se vertió en hielo triturado y se neutralizó (pH = 7) con hidróxido de sodio 0,1 N (NaOH, aq). El nitrilo intermediario se aisló por filtración bajo vacío y se secó en un horno de vacío a 45°C durante 12 h (23 mg, 78%), pf 179°C. La reducción al aldehído correspondiente se logró con DIBAL bajo las condiciones descriptas anteriormente.

Ejemplo 8: Preparación de 4-[1-(4-propilfenil)-1H-imidazol-4-il]-benzaldehído.

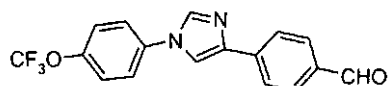


Se agregó por goteo 4-propilanilina (2,70 g, 20 mmol) a una solución de bromuro de 4-cianofenacilo (2,20 g, 10 mmol) en DMF (5 mL). Esta solución se agregó luego a formamida caliente

(180°C) (20 mL) durante 5 min y la solución combinada se dejó agitar a 180°C durante 2 h. La solución enfriada se vertió luego sobre hielo (100 mL) y se extrajo con éter (2 x 75 mL). Luego del secado y la concentración, el aceite oscuro resultante se purificó por cromatografía (3:1:2 hexanos:EtOAc:CH₂Cl₂). El primer producto (510 mg) se identificó como 4-(5-propil-1H-indol-3-il)-benzonitrilo, pf 140°C. La segunda fracción (275 mg) se identificó como el imidazol deseado: pf 133°C; ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ 7,95 (d, J = 6 Hz, 2H), 7,90 (s, 1H), 7,70 (d, J = 6 Hz, 2H), 7,68 (s, 1H), 7,38 (d, J = 4 Hz, 2H), 7,31 (d, J = 4 Hz, 2H), 2,69 (t, J = 8,9 Hz, 2H), 1,68 (m, 2H), 0,98 (t, J = 7,5 Hz, 3H); ESIMS m/z 288,1 (M+H).

La reducción al aldehído correspondiente se logró con DIBAL bajo las condiciones descriptas anteriormente: pf 97°C; ¹H RMN (300 MHz, CDCl₃) δ 10,02 (s, 1H), 8,03 (d, J = 6 Hz, 2H), 7,92 (d, J = 6 Hz, 2H), 7,90 (s, 1H), 7,72 (s, 1H), 7,38 (d, J = 4 Hz, 2H), 7,31 (d, J = 4 Hz, 2H), 2,69 (t, J = 8,9 Hz, 2H), 1,68 (m, 2H), 0,98 (t, J = 7,5 Hz, 3H); ESIMS m/z 291,1 (M+H).

Ejemplo 9: Preparación de 4-[1-(4-trifluormetoxifenil)-1H-imidazol-4-il]-benzaldehído.

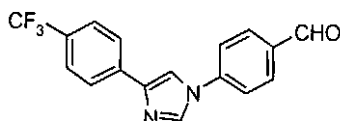


Se agregó por goteo 4-trifluormetoxianilina (2,20 g, 12,4 mmol) a una solución de bromuro de 4-cianofenacilo (1,50 g, 6,7 mmol) en DMF (5 mL). Esta solución se agregó luego a formamida caliente (180°C) (20 mL) durante 5 min, y la solución combinada se dejó agitar a 180°C durante 2 h. La solución enfriada se vertió entonces sobre hielo (100 mL), y se extrajo con éter (2 x 75 mL). Luego de secar y concentrar, el semisólido resultante se

cristalizó a partir de MeOH/H₂O. Una segunda recrystalización a partir de MeOH/H₂O retiró las trazas de la impureza de formanilida y proporcionó el producto bruto (200 mg): pf 155°C. Anal. Calcd. para C₁₇H₁₀F₃N₃O: C, 62,01; H, 3,06; N, 12,76.

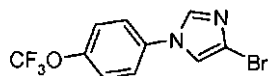
5 Hallado: C. 61,53; H, 3,13; N, 12,55. La reducción al aldehído correspondiente se logró con DIBAL bajo las condiciones descriptas anteriormente: pf 112°C; ¹H RMN (300 MHz, CDCl₃) δ 10,0 (s, 1H), 8,05-7,90 (m, 5H), 7,70 (s, 1H), 7,50 (d, J = 6 Hz, 2H), 7,42 (d, J = 6 Hz, 2H); ESIMS m/z 333,0 (M+H).

10 **Ejemplo 10: Preparación de 4-[4-(4-trifluormetilfenil)-1H-imidazol-1-il]-benzaldehído.**



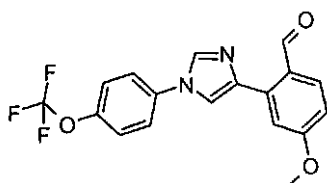
Se combinaron 4-trifluormetilfenil imidazol (4,0 g, 19 mmol), 4-fluorbenzonitrilo (1,2 g, 8,5 mmol) y carbonato de potasio (1,5 g, 10,9 mmol) en DMSO (15 mL) y se calentaron a 15 100°C durante 6 h. La solución enfriada se vertió luego sobre agua (H₂O; 100 mL) y el sólido resultante se filtró y secó con aire para proporcionar el nitrilo imidazol (4,65 g) en forma de sólido blanco: pf 252°C; ¹H RMN (300 MHz, CDCl₃) δ 8,05 (s, 1H), 20 7,95 (d, J = 8 Hz, 2H), 7,85 (d, J = 8 Hz, 2H), 7,72 (s, 1H), 7,72 (d, J = 8 Hz, 2H), 7,62 (d, J = 8 Hz, 2H); ESIMS m/z 314,1 (M+H). Anal. Calcd. para C₁₆H₁₀F₃N₃O₂: C, 65,18; H, 3,22; N, 13,41. Hallado: C, 64,49; H, 3,23; N, 13,08. Una porción del nitrilo (3,8 g) se redujo en presencia de DIBAL bajo las condiciones 25 descriptas anteriormente para proporcionar el aldehído correspondiente (2,41 g): pf 141°C; ¹H RMN (300 MHz, CDCl₃) δ 10,1 (s, 1H), 8,10 (d, J = 8 Hz, 2H), 8,05 (s, 1H), 7,95 (d, J = 8 Hz, 2H), 7,75 (s, 1H), 7,7 (m, 4H); ESIMS m/z 317,1 (M+H).

Ejemplo 11: Preparación de 4-bromo-1-(4-trifluormetoxifenil)-1H-imidazol.



5 Un frasco de base redonda se cargó con 4-bromoimidazol (1,15 g, 7,81 mmol), CuI (0,07 g, 0,36 mmol), 8-hidroxiquinolina (0,05 g, 0,36 mmol), carbonato de cesio (3,39 g, 10,4 mmol) y 4-trifluormetoxiyodobenceno (1,50 g, 5,21 mmol). Una mezcla 10:1 de DMF (15 mL) y H₂O (1.5 mL) se agregó a la mezcla de reacción y
10 la solución se calentó hasta 130°C durante 4 h. La mezcla de reacción se diluyó luego con EtOAc y se lavó secuencialmente con H₂O, cloruro de amonio (NH₄Cl, saturado), H₂O y bicarbonato de sodio (NaHCO₃). Los orgánicos se secaron sobre MgSO₄, se filtraron y purificaron por cromatografía en columna de fase
15 inversae para proporcionar el imidazol (820 mg) en forma de sólido blanco: pf 139-141°C; ESIMS m/z 308.0 (M+H).

Ejemplo 12: Preparación de 4-metoxi-2-[1-(4-trifluormetoxifenil)-1H-imidazol-4-il]-benzaldehído.

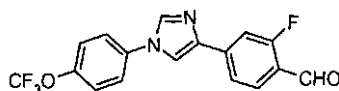


20 4-bromo-1-(4-trifluormetoxifenil)-1H-imidazol (100 mg, 0,326 mmol), ácido 2-formil-5-metoxifenilbórico (73 mg, 0,41 mmol), dicloruro de bis(trifenilfosfino)paladio (2 mg, 0,003 mmol), NaHCO₃ (49 mg, 0,59 mmol) y 1:1 DME/H₂O (8:8 mL) se combinaron y agregaron a un recipiente de microondas. La mezcla de reacción se

calentó en el microondas con agitación a 100°C durante 12 min. El microondas tardó 5 minutos en alcanzar 100°C, luego se mantuvo a 100°C durante 12 min y, luego, se enfrió. La TLC (1:1 EtOAc:ciclohexano) mostró la presencia de materiales de partida, por lo cual la muestra se calentó hasta 100°C durante otros 8 min. Con el enfriamiento, se formó un precipitado que luego se filtró y lavó con H₂O para proporcionar un sólido gris (86 mg): ESIMS m/z 363,0 (M+H).

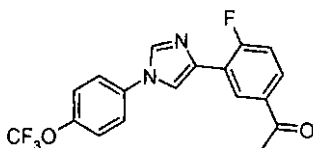
El siguiente intermediario se preparó también con este procedimiento:

Ejemplo 13: Preparación de 2-fluor-4-[1-(4-trifluormetoxifenil)-1H-imidazol-4-il]-benzaldehído.



ESIMS m/z 351.0 (M+H).

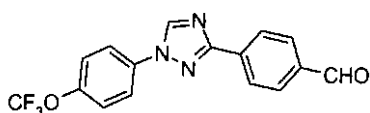
Ejemplo 14: Preparación de 1-{4-fluor-3-[1-(4-trifluormetoxifenil)-1H-imidazol-4-il]-fenil}-etanona.



Se combinaron 4-bromo-1-(4-trifluormetoxifenil)-1H-imidazol (200 mg, 0,651 mmol), ácido 5-acetil-2-fluorfenilbórico (178 mg, 0,977 mmol), tetraquis(trifenilfosfino)-paladio (0) (7 mg, 0,007 mmol), una solución acuosa 2 N de carbonato de potasio (0,651 mL) y dioxano (8 mL) y se agregaron a un recipiente de microondas. La mezcla de reacción se calentó en el microondas con agitación hasta 150°C durante 20 min. La CL-EM indicó 88% de un producto anticipado; La TLC (1:1 hexanos:EtOAc) indicó la presencia de

material de partida más otros 3 materiales. Se agregaron EtOAc y H₂O a la mezcla de reacción. La capa acuosa se extrajo con EtOAc y los extractos orgánicos se lavaron con salmuera, se secaron sobre MgSO₄, y se concentraron *in vacuo*. El producto bruto se purificó por cromatografía con levigación de gradiente (100% de hexanos a 100% de EtOAc), para resultar en un sólido blancuzco (90 mg): pf 129°C; ESIMS *m/z* 265,0 (M+H).

Ejemplo 15: Preparación de 4-[1-(4-trifluormetoxifenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-benzaldehído.



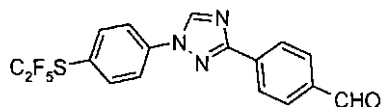
Paso 1. 4-(1H-[1,2,4]triazol-3-il)-benzonitrilo. Se utilizó el procedimiento general reseñado por Lin et al. (*J. Org. Chem.* 1979, 44, 4163) para la preparación de 3-(4-nitrofenil)-1H-[1,2,4]triazol. Se disolvió 4-cianobenzamida (21,63 g, 0,148 mol) en DMF-DMA (100 mL) y se agitó a reflujo bajo N₂ durante 8 h. La mezcla se concentró hasta secarse y se suspendió en AcOH (50 mL). El recipiente se cargó luego con monohidrato de hidrazina (7,18 mL, 0,148 mmol) y se agitó a reflujo durante 1 h antes de la concentración. El 4-(1H-[1,2,4]triazol-3-il)-benzonitrilo deseado se obtuvo con un 98% de pureza mediante trituración con Et₂O seguido por filtración (12,17 g, 0,072 mol, 48%).

Paso 2. 4-[1-(4-trifluormetoxifenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-benzonitrilo. Se combinaron triazol (70 mg, 0,41 mmol), 1-yodo-4-trifluormetoxibenceno (142 mg, 0,493 mmol), Cs₂CO₃ (535 mg, 1,644 mmol), CuI (3 mg, 0,012 mmol), 8-hidroxiquinolina (2 mg, 0,012 mmol) y DMF/H₂O (2 mL; solución 10:1) en un recipiente de reacción de microondas CEM de 10 mL equipado con una barra de

agitación magnética y se sometió a irradiación de microondas a 150°C durante 30 min. El contenido se filtró luego y se concentró hasta secarse para proporcionar el intermediario 1,3-difenil triazol (18 mg, 13%).

5 Paso 3. 4-[1-(4-trifluormetoxifenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-benzaldehído. El nitrilo se redujo con DIBAL bajo las condiciones descriptas anteriormente: pf 137-140°C; ¹H RMN (300 MHz, CDCl₃) δ 10,1 (s, 1H), 8,61 (s, 1H), 8,37 (d, J = 9 Hz, 2H), 8,0 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,8 (d, J = 9 Hz, 2H), 7,4 (d, J = 8,4
10 Hz, 2H); ESIMS m/z 334,2 (M+H).

Ejemplo 16: Preparación de 4-[1-(4-pentafluoretilsulfanilfenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-benzaldehído.

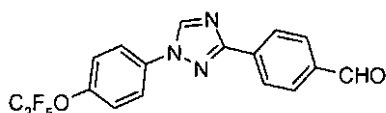


Paso 1. 1-bromo-4-pentafluoretilsulfanilbenceno. El
15 compuesto del título se preparó con las condiciones de perfluoralquilación originalmente descriptas por Popov et. al. *J. Fluorine Chem.* 1982, 21, 365. A una solución de 4-bromobencentiol (500 mg, 2,64 mmol, 1,00 eq) y cloruro de trietilbencilamonio (60 mg, 0,26 mmol, 0,10 eq) en 10 mL de 1:1 de Et₂O/NaOH (25% ac) a
20 0°C se burbujeó gas de 1,1,1,2,2-pentafluor-2-yodoetano durante 30 min (>5 eq). Durante este tiempo, se dirigió una lámpara de UV en el recipiente de reacción mientras la temperatura se mantuvo por debajo de 10°C por medio de un uso intermitente de un baño de hielo. El contenido se entibió luego hasta la temperatura
25 ambiente, se extrajo a Et₂O (300 mL), se secó (MgSO₄) y concentró bajo presión reducida. Una porción de este material bruto se

utilizó en las reacciones siguientes sin purificación adicional (200 mg de residuo: 120 mg de producto, 0,39 mmol, 1,2 eq).

Paso 2. 4-[1-(4-pentafluoretilsulfanilfenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-benzonitrilo. El apareamiento con 4-(1H-[1,2,4]triazol-3-il)-benzonitrilo de acuerdo con lo descripto proporcionó 4-[1-(4-pentafluoretilsulfanilfenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-benzonitrilo (70 mg, 46%). La reducción con DIBAL, de acuerdo con lo descripto anteriormente, proporcionó el aldehído correspondiente.

10 Ejemplo 17: Preparación de 4-[1-(4-pentafluoretiloxi-fenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-benzaldehído.

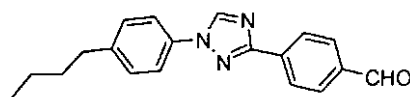


Paso 1. Una solución de 3-p-tolil-1H-[1,2,4]triazol (4,85 g, 30,5 mmol), 4-bromofenil pentafluoretil éter (10,0 g, 34,4 mmol), Cs₂CO₃ (25 g, 77 mmol), CuI (1,25 g, 6,5 mmol) y 8-hidroxiquinolina (0,35 g, 2,4 mmol) en 9:1 DMF/H₂O (50 mL) se agitó vigorosamente y se calentó hasta alcanzar 130°C (temperatura interna) durante 20 h. La solución se enfrió luego, se vertió en H₂O y se aciduló con HCl 2 N hasta alcanzar un pH 2. Posteriormente, se agregó éter (250 mL) y la solución se batió y filtró antes de separar las capas. La capa orgánica se secó y concentró y el sólido gomoso resultante se calentó con hexanos (100 mL). La capa de hexanos caliente se decantó del residuo insoluble. La solución resultante se enfrió hasta 0°C y el sólido precipitado se filtró y se secó con aire para proporcionar 1-(4-pentafluoretiloxi-fenil)-3-p-tolil-1H-[1,2,4]triazol (7,0 g, 61%

en base al triazol de partida) en forma de sólido blancuzco: pf 130-132°C; ESIMS m/z 370,8 (M+H).

Paso 2. El producto del Paso 1 (7,0 g, 18,7 mmol) se disolvió en acetonitrilo (200 mL) y se agitó a temperatura ambiente mientras se agregaba nitrato de amonio cérico (32 g, 58 mmol) en H₂O (60 mL) en porciones durante 10 min. La solución se calentó luego hasta alcanzar el reflujo durante 4 h, se enfrió y se diluyó con H₂O (200 mL). La solución se extrajo con éter (2 x 200 mL). La capa orgánica combinada se secó y concentró para proporcionar un aceite naranja. Este material se disolvió en dioxano (40 mL) y se trató con una solución de hidróxido de potasio (KOH; 5 g, 90 mmol) en H₂O (20 mL). La solución se calentó hasta alcanzar el reflujo durante 2 h. Posteriormente, se enfrió y diluyó con H₂O (100 mL). El aldehído se precipitó y se recogió por filtración. La recristalización a partir de MeOH/H₂O proporcionó el aldehído puro en forma de sólido blanco (2,2 g, 30%): pf 137-144°C; ¹H RMN (300 MHz, CDCl₃) δ 10,1 (s, 1H), 8,65 (s, 1H), 8,40 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 8,0 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,85 (d, J = 9 Hz, 2H), 7,45 (d, J = 9 Hz, 2H); ESIMS m/z 384,2 (M+H).

Ejemplo 18: Preparación de 4-[1-(4-butilfenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-benzaldehído.

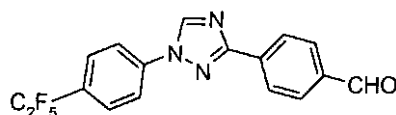


Paso 1. 4-[1-(4-butilfenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-benzonitrilo. Una solución de 4-n-butil fenil hidrazina (1,0 g, 5 mmol) y 4-cianobenzaldehído (0,8 g, 6,0 mmol) en *i*-PrOH (15 mL) se calentó sobre un baño de vapor durante 2 h y, luego, se enfrió y se diluyó con H₂O (5 mL). El sólido naranja resultante se

filtró y se secó con aire para proporcionar la hidrazona (1,30 g) en forma de sólido amarillo, pf 107°C. Una solución de esta hidrazona (1,1 g, 4,0 mmol) y NCS (0,67 g, 5 mmol) en *i*-PrOH (20 mL) se agitó bajo nitrógeno a temperatura ambiente durante 2 h, período en el cual se disolvió el sólido original y se formó un nuevo sólido. La solución naranja resultante se trató entonces con tetrazol (0,45 g, 6,4 mmol) y trietilamina (960 µL, 7,0 mmol). La solución marrón anaranjado se calentó a reflujo durante 2 h. La solución se enfrió luego, se diluyó con H₂O (25 mL), se extrajo con EtOAc, se secó, concentró y se purificó por cromatografía (Biotage, 4:1 hexano:EtOAc) para proporcionar el triazol (0,42 g, 35%) de un sólido blancuzco: pf 124°C; ¹H RMN (300 MHz, CDCl₃) δ 8,58 (s, 1H), 8,33 (d, *J* = 8 Hz, 2H), 7,78 (d, *J* = 8 Hz, 2H), 7,64 (d, *J* = 8,2 Hz, 2H), 7,33 (d, *J* = 8,2 Hz, 2H), 2,70 (t, *J* = 7,8 Hz, 2H), 1,63 (m, 2H), 1,38 (m, 2H), 0,95 (t, *J* = 7,5 Hz, 3H); ESIMS *m/z* 303,1.

Paso 2. 4-[1-(4-butilfenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-benzaldehído. La reducción con DIBAL, de acuerdo con lo descrito anteriormente, proporcionó el aldehído correspondiente: pf 124°C; ¹H RMN (300 MHz, CDCl₃) δ 10,08 (s, 1H), 8,58 (s, 1 H), 8,37 (d, *J* = 8 Hz, 2H), 7,98 (d, *J* = 8 Hz, 2H), 7,62 (d, *J* = 8,2 Hz, 2H), 7,33 (d, *J* = 8,2 Hz, 2H), 2,70 (t, *J* = 7,8 Hz, 2H), 1,63 (m, 2H), 1,38 (m, 2H), 0,95 (t, *J* = 7,5 Hz, 3H); ESIMS *m/z* 306,1.

Ejemplo 19: Preparación de 4-[1-(4-pentafluoretilfenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-benzaldehído.



SS

Paso 1. 1-(4-pentafluoretilfenil)-3-p-tolil-1H-

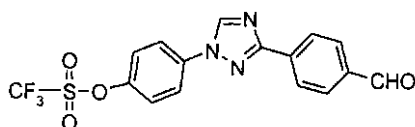
[1,2,4]triazol. Se condensó yoduro de pentafluoretilo (521 mg, 2,12 mmol) en un matraz que contenía 1-bromo-4-yodobenceno (300 mg, 1,06 mmol), polvo de cobre (0) (135 mg, 2,12 mmol), y DMSO (5 mL). El matraz se selló luego y se sometió a irradiación de microondas a 150°C durante 60 min. La CG-EM demostró el consumo del material de partida para proporcionar ambos intermediarios, el 1-bromo-4-pentafluoretilbenceno y el 1-yodo-4-pentafluoretilbenceno. La mezcla (1,06 mmol) se transfirió a un frasco de base redonda de 250 mL y se agregaron 3-p-tolil-1H-[1,2,4]triazol (169 mg, 1,06 mmol), Cs₂CO₃ (1,38 g, 4,24 mmol), CuI (202 mg, 1,06 mmol), 8-hidroxiquinolína (2 mg, 0,011 mmol), y DMF/H₂O (12 mL; solución 10:1). La solución se agitó a reflujo a 160°C durante 6 h. Una vez completado, el contenido enfriado se vertió en H₂O y se dejó precipitar durante 1 h. El precipitado se recogió mediante filtración bajo vacío y se secó durante la noche en un horno de vacío a 45°C. El intermediario de 1-(4-pentafluoretilfenil)-3-p-tolil-1H-[1,2,4]triazol bruto se utilizó en el paso 2 sin purificación adicional.

Paso 2. Oxidación al aldehído. Se combinaron nitrato de cerio de amonio (IV) (3,32 g, 4,24 mmol) y el intermediario del Paso 1 en un frasco de base redonda con acetonitrilo y H₂O (20 mL; 1:1). La solución se agitó a reflujo a 110°C durante 4 h, para proporcionar una mezcla de los intermediarios 3-(4-nitrooximetil-fenil)-1-(4-pentafluoretil-fenil)-1H-[1,2,4]triazol y 4-[1-(4-pentafluoretil-fenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-benzaldehído. El acetonitrilo se retiró bajo vacío y los precipitados de los intermediarios brutos se recogieron por filtración. El material se combinó luego con KOH en polvo (178 mg, 3,18 mmol) en dioxano y H₂O (10 mL; 1:1) y se agitó a reflujo

a 105°C durante 90 min antes de retirar el dioxano bajo vacío permitiendo la precipitación del intermediario a partir del H₂O.

El intermediario de 4-[1-(4-pentafluoretilfenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-benzaldehído se recogió por filtración (35 mg, 0,095 mmol, 9% en general a partir de 4-tolil triazol).

Ejemplo 20: Preparación de 4-[3-(4-formilfenil)-[1,2,4]triazol-1-il]-feniléster del ácido trifluormetansulfónico.

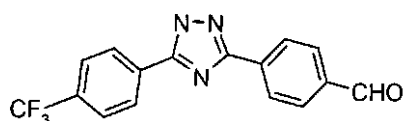


Paso 1. Se preparó 1-(4-metoxifenil)-3-p-tolil-1H-[1,2,4]triazol mediante el apareamiento de 3-p-tolil-1H-[1,2,4]triazol con 4-yodoanisol bajo las condiciones descriptas en el Paso 1 del ejemplo anterior. Este material se desmetiló luego con las condiciones descriptas en Hitchcock et al. *Synlett* 2006, 2625. Se agregó por goteo tribromuro de boro (1 M solución en hexanos; 1,67 mL, 1,67 mmol) a una solución de 1-(4-metoxifenil)-3-p-tolil-1H-[1,2,4]triazol (300 mg, 1,28 mmol) en CH₂Cl₂ (10 mL) a 0°C bajo N₂. Luego de completarse la adición, el recipiente se entibió hasta la temperatura ambiente antes de someter a reflujo a 40°C durante 6 h. El contenido enfriado se templó luego con H₂O antes de retirar el CH₂Cl₂ y dividir entre EtOAc y H₂O. Se recogió la capa orgánica, se lavó con salmuera, se secó (MgSO₄), concentró, y se purificó por cromatografía (3:1:1, hexanos:EtOAc:acetona) para proporcionar el intermediario 4-(3-p-tolil-[1,2,4]triazol-1-il)-fenol (219 mg, 0,872 mmol, 68%). Posteriormente, se agregó por goteo anhídrido trifluormetansulfónico (0,16 mL, 0,96 mmol) a una solución del fenol y 4-ter-butil-2,6-dimetilpiridina (142 mg, 0,872 mmol) en CH₂Cl₂ (10 mL) a 0°C bajo N₂. El recipiente se entibió hasta la

temperatura ambiente antes de retirar el solvente bajo presión reducida y el residuo se purificó por cromatografía (2:2:1, hexanos:EtOAc:acetona) para proporcionar el intermediario 4-(3-p-tolil-[1,2,4]triazol-1-il)-feniléster del ácido trifluormetansulfónico (304 mg, 0,794 mmol, 91%).

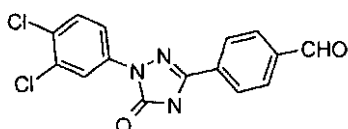
Paso 2. Se realizó una oxidación del intermediario 4-metilo mencionado precedentemente al aldehído correspondiente con el uso de nitrato de cerio de amonio (IV) bajo las condiciones descriptas en el Paso 2 del ejemplo anterior.

Ejemplo 21: Preparación de 4-[5-(4-trifluormetilfenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-benzaldehído.



Se combinaron tereftalonitrilo (115 mg, 0,90 mmol), hidrazida del ácido 4-trifluormetilbenzoico (92 mg, 0,450 mmol), K_2CO_3 (31 mg, 0,225 mmol), y alcohol de *n*-butilo (~2 mL) en un matraz de reacción de microondas CEM de 10 mL equipado con una barra de agitación magnética y se sometieron a irradiación de microondas a 150°C durante 30 min. El contenido se filtró luego y se concentró hasta secarse. Se realizó una cromatografía (3:1 hexanos/EtOAc) que proporcionó el 1,2,4-triazol nitrilo (72 mg, 0,230 mmol, 51%). Una reducción con DIBAL generó entonces el aldehído correspondiente.

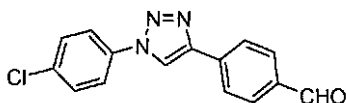
Ejemplo 22: Preparación de 4-[1-(3,4-diclorofenil)-5-oxo-4,5-dihidro-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-benzaldehído.



Paso 1. Ácido 4-cianofenil-oxo-acético. Una matraz de base redonda equipado con un agitador mecánico y un condensador de reflujo se cargó con *p*-cianoacetofenona (5 g, 34,44 mol), dióxido de selenio (SeO₂; 9,55 g, 86,1 mmol), y piridina (~100 mL). La
5 mezcla se agitó a reflujo durante 6 h antes de retirar los precipitados por filtración y el filtrado se cargó con HCl al 10% (ac) (20 mL). El filtrado se extrajo en EtOAc (3 x 50 mL) y las capas orgánicas combinadas se extrajeron luego en NaHCO₃ casi saturado. Posteriormente, la capa acuosa se aciduló
10 cuidadosamente (pH = 1) con HCl concentrado para proporcionar una pequeña cosecha del producto deseado. El resto del ácido oxoacético se obtuvo extrayendo en EtOAc, secando (MgSO₄) y concentrando (1,69 g, 28%).

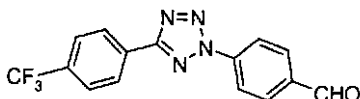
Paso 2. 4-[1-(3,4-diclorofenil)-5-oxo-4,5-dihidro-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-benzonitrilo. Una suspensión de ácido 4-cianofenil-oxo-acético (100 mg, 0,571 mmol), clorhidrato de (3,4-diclorofenil)hidrazina (122 mg, 0,571 mmol), HCl 12,1 N (5 µL, 0,057 mmol), y H₂O (~10 mL) en un matraz de reacción de 25 mL se agitó vigorosamente a temperatura ambiente durante 24 h. La
15 hidrazona se obtuvo mediante filtración bajo vacío y se colocó en un frasco de base redonda de 100 mL con una barra de agitación magnética. El frasco se complementó luego con trietilamina (0,08 mL, 0,571 mmol), difenilfosforil azida (157 mg, 0,571 mmol) y tolueno (20 mL) antes de calentar a 110°C durante 1 h. Una vez
25 enfriado, el contenido se templó con NaOH al 10% (ac) y se aciduló (pH 1) con HCl concentrado. Se dejó precipitar durante 15 min antes de obtener el intermediario por filtración bajo vacío. Se secó durante la noche en un horno de vacío a 45°C (16 mg, 8%). El nitrilo se redujo al aldehído con DIBAL bajo las condiciones
30 descriptas anteriormente.

Ejemplo 23: Preparación de 4-[1-(4-clorofenil)-1H-[1,2,3]triazol-4-il]-benzaldehído.



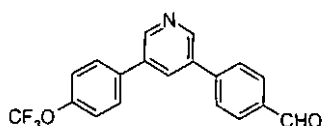
Siguiendo el procedimiento publicado por Feldman et al. (*Org*
5 *Lett.* 2004, 6, 3897), una suspensión de 4-etinilbenzonitrilo (50
mg, 0,393 mmol), 1-cloro-4-yodobenceno (94 mg, 0,393 mmol), L-
prolina (9 mg, 0,079 mmol), ácido ascórbico (7 mg, 0,039 mmol),
NaN₃ (31 mg, 0,472 mmol), CuSO₄ (3 mg, 0,020 mmol) y Na₂SO₄ (11
mg, 0,079 mmol) en DMSO (1,5 mL) se calentó a 65°C durante 24 h.
10 Luego del enfriamiento, se procedió a diluir la mezcla con H₂O y
se agitó durante 30 min a temperatura ambiente. El intermediario
4-[1-(4-clorofenil)-1H[1,2,3]triazol-4-il]-benzonitrilo (54 mg,
48%) se obtuvo entonces por filtración bajo vacío luego de lavar
con volúmenes copiosos de H₂O y 20% de NH₄OH (~20 mL). La
15 reducción al aldehído se condujo luego bajo las condiciones
descriptas anteriormente.

Ejemplo 24: Preparación de 4-[5-(4-trifluormetil-fenil)-tetrazol-
2-il]-benzaldehído.



20 Este aldehído se preparó a partir de 4-
trifluormetilbenzaldehído siguiendo la vía descripta en Roppe et
al. *J. Med Chem.* 2004, 47, 4645.

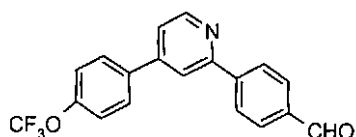
Ejemplo 25: Preparación de 4-[5-(4-trifluormetoxifenil)-piridin-
25 3-il]-benzaldehído.



Paso 1. 3,5-dibromopiridina (4,4 mmol), 4-ácido trifluormetoxifenilbórico (5,1 mmol), tetraquis(trifenilfosfino)paladio(0) (0,04 mmol), carbonato de potasio 2 M (8,44 mmol) y dioxano (21 mL) se combinaron en un matraz y se calentaron por microondas durante 10 min a 150°C. La mezcla de reacción se tomó en éter y se lavó con salmuera. La capa de éter se secó sobre sulfato de magnesio, se filtró y el solvente se retiró *in vacuo*. La mezcla bruta se purificó mediante cromatografía de gel de sílice para proporcionar 3-bromo-5-(4-trifluormetoxifenil)-piridina (130 mg) en forma de sólido amarillo: ^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) δ 8,71 (m, 2H), 8,00 (t, $J = 2,1$ Hz, 1H), 7,58 (d, $J = 8,8$ Hz, 2H), 7,34 (d, $J = 8,0$ Hz, 2H); EIMS m/z 317 (M^+).

Paso 2. El compuesto se preparó mediante arilación catalizada por paladio del producto del paso 1 con ácido 4-formilfenilbórico.

Ejemplo 26: Preparación de 4-[4-(4-trifluormetoxifenil)-piridin-2-il]-benzaldehído.

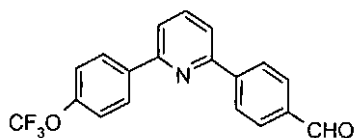


Paso 1. El compuesto se preparó mediante arilación catalizada por paladio de 2-cloro-4-yodopiridina con ácido 4-trifluormetoxifenilbórico.

Paso 2. 2-cloro-4-(4-trifluormetoxifenil)-piridina (0,55 mmol) a partir de 2-cloro-4-yodopiridina, ácido 4-formilfenil

bórico (0,82 mmol), tetraquis(trifenilfosfino)paladio(0) (0,005 mmol), carbonato de potasio 2 M (0,55 mL) y dioxano (3 mL) se combinaron en un matraz y se irradiaron con microondas durante 15 min a 150°C. La mezcla de reacción se tomó en EtOAc y se lavó con salmuera. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio, se filtró y el solvente se retiró *in vacuo*. La purificación mediante cromatografía de gel de sílice (EtOAc/hexanos) proporcionó el producto (120 mg) en forma de sólido blancuzco: ^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) δ 10,11 (s, 1H), 8,81 (d, $J = 4,8$ Hz, 1H), 8,24 (d, $J = 8,7$ Hz, 2H), 8,03 (d, $J = 8,4$ Hz, 2H), 7,96 (m, 1H), 7,73 (d, $J = 9,0$ Hz, 2H), 7,49 (dd, $J = 5,3, 1,8$ Hz, 1H), 7,37 (d, $J = 8,1$ Hz, 2H); EIMS m/z 343 (M^+).

Ejemplo 27: Preparación de 4-[6-(4-trifluormetoxifenil)-piridin-2-il]-benzaldehído.

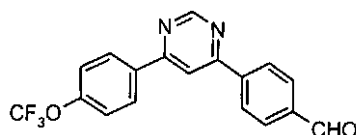


Paso 1. Se preparó 4-(6-bromopiridin-2-il)-benzaldehído (0,31 mmol) como en Puglisi et al. *Eur. J. Org. Chem* 2003, 8, 1552-1558.

Paso 2. 4-[6-(4-trifluormetoxifenil)-piridin-2-il]-benzaldehído. 4-(6-bromo-piridin-2-il)-benzaldehído (0,31 mmol), ácido 4-trifluormetoxifenilbórico (0,46 mmol), tetraquis(trifenilfosfino)paladio(0) (0,003 mmol), carbonato de potasio 2 M (0,31 mL) y dioxano (2 mL) se combinaron en un matraz y se irradiaron con microondas durante 10 min a 150°C. La mezcla de reacción se tomó en éter y se lavó con salmuera. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio, se filtró y el solvente se retiró *in vacuo*. La purificación por cromatografía de

gel de sílice (EtOAc/hexanos) proporcionó el producto (80 mg) en forma de sólido blancuzco: pf 109-112°C; ^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) δ 10,11 (s, 1H), 8,32 (d, $J = 8,5$ Hz, 2H), 8,19 (d, $J = 8,1$ Hz, 2H), 8,03 (d, $J = 8,4$ Hz, 2H), 7,89 (t, $J = 7,9$ Hz, 1H), 7,79 (d, $J = 7,7$ Hz, 1H), 7,74 (d, $J = 8,0$ Hz, 1H), 7,35 (d, $J = 8,3$ Hz, 2H); EIMS m/z 343 (M^+).

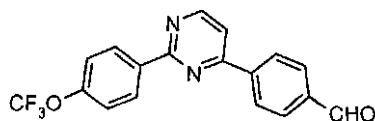
Ejemplo 28: Preparación de 4-[6-(4-trifluormetoxifenil)-pirimidin-4-il]-benzaldehído.



Paso 1. Se preparó 4-cloro-6-(4-trifluormetoxifenil)-pirimidina por medio de arilación catalizada por paladio de 4,6-dicloropirimidina y ácido 4-trifluormetoxifenilbórico: ^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) δ 9,05 (s, 1H), 8,14 (d, $J = 9,8$ Hz, 2H), 7,74 (m, 1H), 7,36 (d, $J = 8,4$ Hz, 2H); EIMS m/z 274 (M^+).

Paso 2. El compuesto se preparó mediante arilación catalizada por paladio del producto del paso 1 con ácido 4-formilfenilbórico: ^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) δ 10,15 (s, 1H), 9,38 (d, $J = 0,9$ Hz, 1H), 8,33 (d, $J = 8,4$ Hz, 2H), 8,23 (d, $J = 8,5$ Hz, 2H), 8,16 (d, $J = 0,8$ Hz, 1H), 8,08 (d, $J = 8,8$ Hz, 2H), 7,40 (d, $J = 8,1$ Hz, 2H); EIMS m/z 344 (M^+).

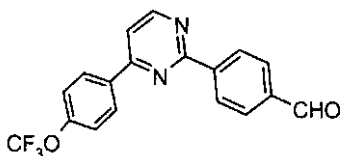
Ejemplo 29: Preparación de 4-[2-(4-trifluormetoxifenil)-pirimidin-4-il]-benzaldehído.



Paso 1. 4-cloro-2-(4-trifluormetoxifenil)-pirimidina. El compuesto del título se preparó mediante arilación catalizada por paladio de 2,4-dicloropirimidina y ácido 4-trifluormetoxifenilbórico: pf 70-73°C; ^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) δ 8,68 (d, $J = 5,6$ Hz, 1H), 8,16 (d, $J = 9,1$ Hz, 2H), 7,65 (d, $J = 5,3$ Hz, 1H), 7,36 (dd, $J = 9,2, 0,9$ Hz, 2H); EIMS m/z 274 (M^+).

Paso 2. El compuesto se preparó por arilación catalizada por paladio del producto del paso 1 con ácido 4-formilfenilbórico: ^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) δ 10,13 (s, 1H), 8,91 (d, $J = 4,8$ Hz, 1H), 8,74 (d, $J = 8,5$ Hz, 2H), 8,28 (d, $J = 8,4$ Hz, 2H), 8,03 (d, $J = 8,4$ Hz, 2H), 7,65 (d, $J = 5,3$ Hz, 1H), 7,39 (d, $J = 8,6$ Hz, 2H); EIMS m/z 344 (M^+).

Ejemplo 30: Preparación de 4-[4-(4-trifluormetoxifenil)-pirimidin-2-il]-benzaldehído.



15

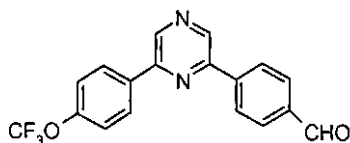
Paso 1. 4-(4-cloropirimidin-2-il)-benzaldehído. El compuesto se preparó por arilación catalizada por paladio de 2,4-dicloropirimidina y ácido 4-formilfenilbórico: ^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) δ 10,13 (s, 1H), 8,74 (d, $J = 5,0$ Hz, 1H), 8,27 (d, $J = 7,8$ Hz, 2H), 8,04 (d, $J = 7,9$ Hz, 2H), 7,74 (m, 1H); EIMS m/z 218 (M^+).

Paso 2. El compuesto se preparó por arilación catalizada por paladio del producto del paso 1 con ácido 4-trifluormetoxifenilbórico: ^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) δ 10,14 (s, 1H), 8,91 (d, $J = 4,2$ Hz, 1H), 8,63 (d, $J = 8,5$ Hz, 2H), 8,37 (d,

25

$J = 8,4 \text{ Hz}$, 2H), 8,06 (d, $J = 8,8 \text{ Hz}$, 2H), 7,67 (d, $J = 5,4 \text{ Hz}$, 1H), 7,35 (d, $J = 8,7 \text{ Hz}$, 2H); EIMS m/z 344 (M^+).

Ejemplo 31; Preparación de 4-[6-(4-trifluormetoxifenil)-pirazin-2-il]-benzaldehído.



5

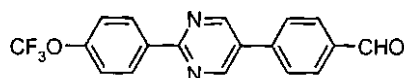
Paso 1. 2-cloro-6-(4-trifluormetoxifenil)-pirazina. El compuesto se preparó mediante arilación catalizada por paladio de 2,6-dicloropirazina y ácido 4-trifluormetoxifenilbórico: pf 58-60°C; ^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) δ 8,94 (s, 1H), 8,57 (s, 1H), 8,10 (d, $J = 9,0 \text{ Hz}$, 2H), 7,37 (d, $J = 8,4 \text{ Hz}$, 2H); EIMS m/z 274 (M^+).

10

Paso 2. El compuesto se preparó mediante arilación catalizada por paladio del producto del paso 1 con ácido 4-formilfenilbórico: ^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) δ 10,13 (s, 1H), 9,07 (s, 1H), 9,03 (s, 1H), 8,33 (d, $J = 8,1 \text{ Hz}$, 2H), 8,21 (d, $J = 8,7 \text{ Hz}$, 2H), 8,07 (d, $J = 7,6 \text{ Hz}$, 2H), 7,40 (d, $J = 8,3 \text{ Hz}$, 2H); EIMS m/z 344 (M^+).

15

Ejemplo 32: Preparación de 4-[2-(4-trifluormetoxifenil)-pirimidin-5-il]-benzaldehído.



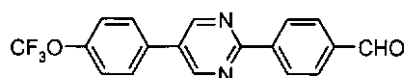
20

Paso 1. 4-(2-cloropirimidin-5-il)-benzaldehído. El compuesto se preparó mediante arilación catalizada por paladio de 2,5-dicloropirimidina y ácido 4-formilfenilbórico.

Paso 2. Se combinaron en un matraz 4-(2-cloropirimidin-5-il)-benzaldehído (0,92 mmol), ácido 4-trifluormetoxifenilbórico

(1,10 mmol), diclorobis(trifenilfosfino)-paladio(II) (0,01 mmol),
 carbonato de potasio 2 M (0,92 mL) y dioxano (5 mL) y se
 irradiaron con microondas durante 10 min a 150°C. La capa
 orgánica de la mezcla de reacción se cargó directamente sobre
 sílice y se secó *in vacuo*. La purificación mediante cromatografía
 5 de gel de sílice (EtOAc/hexanos) proporcionó el producto (140 mg)
 en forma de sólido blanco: ^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) δ 10,11 (s,
 1H), 9,07 (s, 2H), 8,57 (d, $J = 9,0$ Hz, 2H), 8,07 (d, $J = 8,5$ Hz,
 2H), 7,82 (d, $J = 8,3$ Hz, 2H), 7,35 (d, $J = 8,3$ Hz, 2H); EIMS m/z
 10 344 (M^+).

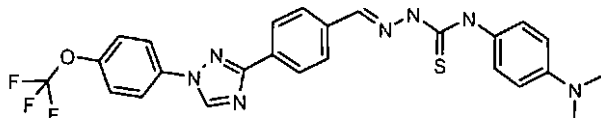
**Ejemplo 33: Preparación de 4-[5-(4-trifluormetoxifenil)-
 pirimidin-2-il]-benzaldehído.**



Paso 1. 2-cloro-5-(4-trifluormetoxifenil)-pirimidina. El
 15 compuesto se preparó por arilación catalizada por paladio de 2,5-
 dicloropirimidina con ácido 4-trifluormetoxifenilbórico.

Paso 2. Se combinaron en un matraz 2-cloro-5-(4-
 trifluormetoxifenil)-pirimidina (4,22 mmol), ácido 4-
 formilfenilbórico (5,1 mmol), diclorobis(trifenilfosfino)paladio
 20 (II) (0,05 mmol), carbonato de potasio 2 M (4,2 mL) y dioxano (21
 mL) y se irradiaron con microondas durante 20 min a 150°C. La
 capa orgánica de la mezcla de reacción se cargó directamente
 sobre sílice y se secó *in vacuo*. La purificación por medio de una
 cromatografía de gel de sílice (EtOAc/hexanos) proporcionó el
 25 producto (75 mg) en forma de sólido blanco: ^1H RMN (400 MHz,
 CDCl_3) δ 10,13 (s, 1H), 9,06 (s, 2H), 8,68 (d, $J = 8,8$ Hz, 2H),
 8,03 (d, $J = 8,3$ Hz, 2H), 7,68 (d, $J = 8,8$ Hz, 2H), 7,40 (d, $J =$
 8,7 Hz, 2H); EIMS m/z 344 (M^+).

Ejemplo 34: Preparación de (E)-N-(4-dimetilamino)fenil)-2-(4-(1-(4-(trifluormetoxi)fenil)-1H-1,2,4-triazol-3-il)benciliden)hidrazina-carbotioamida (Compuesto 1) [Método de síntesis A].

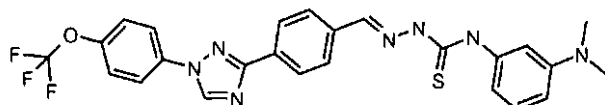


Paso 1. (E)-3-(4-(hidrazonometil)fenil)-1-(4-(trifluormetoxi)fenil)-1H-1,2,4-triazol. A un matraz de base redonda de 250 mL que contenía hidrato de hidrazina (solución acuosa al 64%; 7,27 mL, 15,0 mmol) en EtOH (100 mL) a 80°C, se agregó en porciones 4-[1-(4-trifluormetoxifenil)-1H-[1,2,4]triazol-3-il]-benzaldehído (5,00 g, 1,50 mmol) durante 5 min. La solución se agitó a reflujo durante otras 3 horas antes de diluir con H₂O (300 mL) y se enfrió hasta 0°C. El producto precipitado se recogió por filtración bajo vacío en forma de sólido blanco (4,89 g, 93%) pf 222-226°C; ¹H RMN (400 MHz, DMSO-d₆) δ 8,59 (s, 1H), 8,22 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 7,84-7,79 (m, 2H), 7,66 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,41 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 7,29 (s, 1H), 5,63 (br s, 2H); ESIMS m/z 348 (M+H).

Paso 2. A un matraz de base redonda de 25 mL que contenía (E)-3-(4-(hidrazonometil)fenil)-1-(4-(trifluormetoxi)fenil)-1H-1,2,4-triazol (250 mg, 0,720 mmol) en THF (10 mL), se agregó 4-isotiocianato-N,N-dimetilanilina (385 mg, 2,16 mmol). El contenido se calentó a 65°C con agitación durante 2 h antes de retirar el solvente bajo presión reducida. El residuo se suspendió en CH₂Cl₂ (10 mL) para dar como resultado la precipitación de material de producto. El producto deseado se obtuvo en forma de sólido amarillo por filtración bajo vacío (350 mg, 93%): pf 205-208°C; ¹H RMN (400 MHz, DMSO-d₆) δ 11,78 (s,

1H), 10,02 (s, 1H), 9,42 (s, 1H), 8,19-7,99 (m, 6H), 7,64 (d, $J = 8,3$ Hz, 2H), 7,28 (d, $J = 8,3$ Hz, 2H), 7,73 (d, $J = 8,3$ Hz, 2H), 2,92 (s, 6H); ESIMS m/z 526 (M+H).

- 5 **Ejemplo 35: Preparación de *N*-(3-(dimetilamino)fenil)-2-(4-(1-(4-(trifluormetoxi)fenil)-1*H*-1,2,4-triazol-3-il)benciliden)hidrazincarbodioamida (Compuesto 2) [Método de síntesis B].**

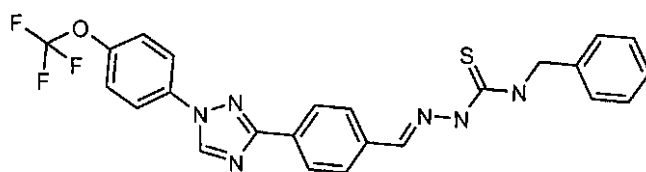


- Paso 1. (*E*)-metil 2-(4-(1-(4-(trifluormetoxi)fenil)-1*H*-1,2,4-triazol-3-il)benciliden)hidrazincarboditioato. A un matraz de base redonda de 250 mL que contenía metiléster del ácido hidrazincarboditioico (2,38 g, 1,95 mmol) en EtOH (100 mL), se agregó 4-[1-(4-trifluormetoxifenil)-1*H*-[1,2,4]triazol-3-il]-benzaldehído (5,00 g, 1,50 mmol). El recipiente se calentó a 80°C durante 3 h antes de diluir con H₂O (300 mL) y se enfrió hasta 0°C. El producto precipitado se recogió por medio de filtración bajo vacío en forma de sólido blancuzco (6,13 g, 93%) pf 204-206°C; ¹H RMN (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ 13,39 (s, 1H), 9,43 (s, 1H), 8,38 (s, 1H), 8,21 (d, $J = 8,3$ Hz, 2H), 8,09 (d, $J = 8,4$ Hz, 2H), 7,88 (d, $J = 8,4$ Hz, 2H), 7,62 (d, $J = 8,3$ Hz, 2H), 2,57 (s, 3H); ESIMS m/z 438 (M+H).

- Paso 2. A un matraz de base redonda de 50 mL que contenía 2-(4-(1-(4-(trifluormetoxi)fenil)-1*H*-1,2,4-triazol-3-il)benciliden)hidrazincarboditioato de (*E*)-metilo (250 mg, 0,571 mmol) en DMF (3 mL), se agregó *N,N*-dimetilbencen-1,3-diamina (195 mg, 1,43 mmol). El contenido se calentó a 150°C con agitación durante 5 h antes de dejar enfriar la solución durante la noche. La mezcla se filtró y el filtrado se purificó por RP-HPLC para proporcionar el material deseado (235 mg, 78%) en forma

de sólido blancuzco: pf 192-194°C; ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 11,82 (s, 1H), 10,04 (s, 1H), 9,41 (s, 1H), 8,19 (s, 1H), 8,16-7,99 (m, 6H), 7,61 (d, $J = 8,3$ Hz, 2H), 7,16 (t, $J = 7,2$ Hz, 1H), 7,01 (m, 1H), 6,87 (m, 1H), 6,58 (m, 1H), 2,88 (s, 6H); ESIMS m/z 526 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

Ejemplo 36: Preparación de *N*-bencil-2-(4-(1-(4-(trifluormetoxi)fenil)-1*H*-1,2,4-triazol-3-il)benciliden)hidrazincarbottioamida (Compuesto 3) [Método de síntesis C].



10

A un frasco de base redonda de 50 mL que contiene 4-[1-[4-(trifluormetoxi)fenil]-1,2,4-triazol-3-il]benzaldehído (500 mg, 1,5 mmol) en EtOH (3 mL), se agregó 4-benciltiosemicarbazida (650 mg, 3,6 mmol). La mezcla de reacción se calentó a 80°C durante la noche. Se agregó H_2O una vez completada la reacción y el material de producto bruto se aisló por filtración bajo vacío. El compuesto del título se aisló por medio de RP-HPLC en forma de sólido blanco (390 mg, 52% de rendimiento): pf 220-224°C; ^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) δ 9,29 (s, 1H), 8,59 (s, 1H), 8,21 (d, $J = 8,4$ Hz, 2H), 7,85-7,79 (m, 3H), 7,71 (d, $J = 8,4$ Hz, 2H), 7,46-7,30 (m, 8H), 5,01 (d, $J = 5,8$ Hz, 2H); ESIMS 497,2 ($\text{M}+\text{H}$).

20

Los compuestos 4-159 de la Tabla 1 se sintetizaron de acuerdo con los ejemplos provistos precedentemente.

25

Los compuestos se probaron contra la oruga militar de la remolacha y el gusano de la espiga del maíz con los procedimientos descritos en los siguientes ejemplos e informados en la Tabla 2.

En cada caso de la Tabla 2, la escala de clasificación es la siguiente:

% de control (o mortalidad)	Clasificación
50-100	A
Menos de 50	B
No probado	C

● Ejemplo 37: Prueba insecticida para la oruga militar de la
5 remolacha (*Spodoptera exigua*)

Se realizaron bioensayos en la oruga militar de la remolacha (BAW; *Spodoptera exigua*: Lepidóptero) con un ensayo de bandeja de dieta de 128 pocillos. Se colocaron de tres a cinco segundas larvas BAW instar en cada pocillo (3 mL) de la bandeja de la
10 dieta que se había rellenado previamente con 1 mL de dieta artificial a la que se habían aplicado 50 µg/cm² del compuesto de prueba (disuelto en 50 µL de una mezcla 90:10 de acetona-agua) (a cada uno de los ocho pocillos) y, luego, se dejaron secar. Las
bandejas se cubrieron con una cobertura clara autoadhesiva y se
15 mantuvieron a 25°C, 14:10 de luz-oscuridad durante seis días. El porcentaje de mortalidad se registró para las larvas en cada pocillo y se promedió luego la actividad en los ocho pocillos. Los resultados de ambos ensayos se indican en la Tabla 2.

● Ejemplo 38: Prueba insecticida para el gusano de la espiga del
20 maíz (*Helicoverpa zea*)

Los bioensayos en el gusano de la espiga del maíz (CEW; *Helicoverpa zea*: Lepidóptero) se realizaron con un ensayo de

bandeja de dieta de 128 pocillos. Se colocaron de tres a cinco segundas larvas CEW instar en cada pocillo (3 mL) de la bandeja de dieta que se había rellenado previamente con 1 mL de dieta artificial a la que se habían aplicado 50 $\mu\text{g}/\text{cm}^2$ del compuesto de prueba (disuelto en 50 μL de una mezcla 90:10 de acetona-agua) (a cada uno de los ocho pocillos) y, posteriormente, se dejaron secar. Las bandejas se cubrieron con una cubierta clara autoadhesiva y se mantuvieron a 25°C, 14:10 de luz-oscuridad durante seis días. El porcentaje de mortalidad se registró para las larvas en cada pocillo y se promedió luego la actividad en los ocho pocillos. Los resultados de ambos bioensayos se indican en la Tabla 2.

Los compuestos también se sometieron a prueba contra el áfido verde del durazno con un procedimiento descrito en el siguiente ejemplo e informado en la Tabla 2.

20

En cada caso de la Tabla 2, la escala de clasificación es la siguiente:

% de control (o mortalidad)	Clasificación
80-100	A

Menos de 80	B
No probado	C

Ejemplo 39: Prueba insecticida para el áfido verde del durazno (*Myzus persicae*) en un ensayo de atomización foliar

Se utilizaron como sustrato de prueba plántulas de repollo
 5 cultivadas en macetas de 3 pulgadas con 2-3 larvas pequeñas
 verdaderas (3-5 cm). Las plántulas se infestaron con 20-50
 áfidos verdes de durazno (adultos sin alas y ninfas) un día antes
 de la aplicación química. Se utilizaron cuatro macetas con
 plántulas individuales para cada tratamiento. Los compuestos (2
 10 mg) se disolvieron en 2 mL de solvente de acetona/metanol (1:1),
 formando soluciones madre de 1000 ppm. Las soluciones madre se
 diluyeron 5X con 0,025% de Tween 20 en H₂O para obtener la
 solución de prueba a 200 ppm. Se utilizó un atomizador manual
 Devilbiss para atomizar una solución a ambos lados de las hojas
 15 de repollo hasta escurrirse. Las plantas de referencia (control
 de solvente) se atomizaron sólo con diluyente. Las plantas
 tratadas se mantuvieron en un cuarto de mantenimiento durante
 tres días a aproximadamente 25°C y 40% de humedad relativa (RH)
 antes de la clasificación. Se realizó una evaluación contando la
 20 cantidad de áfidos vivos por planta bajo un microscopio. Los
 datos de la actividad insecticida, medida mediante la fórmula de
 corrección de Abbott, se presentan en la Tabla 2:

$$\% \text{ corregido de control} = 100 * (X - Y) / X$$

donde X = Cantidad de áfidos vivos en plantas de control de
 25 solvente

Y = Cantidad de áfidos vivos en las plantas tratadas

Derivados de sales y ácidos y solvatos

Los compuestos descriptos en la presente invención pueden hallarse en forma de sales de adición de ácido aceptables desde el punto de vista plaguicida.

A modo de ejemplo no limitativo, una función amina puede
5 formar sales con los ácidos clorhídrico, bromhídrico, sulfúrico, fosfórico, acético, benzoico, cítrico, malónico, salicílico, málico, fumárico, oxálico, succínico, tartárico, láctico, glucónico, ascórbico, maleico, aspártico, bencensulfónico, metansulfónico, etansulfónico, hidroximetansulfónico, e
10 hidroxietansulfónico.

Adicionalmente, a modo de ejemplo no limitativo, una función de ácido puede formar sales que incluyen aquellas derivadas de metales álcali o alcalinotérreos y aquellas derivadas de amoníaco y aminas. Los ejemplos de cationes preferidos incluyen sodio,
15 potasio, magnesio y amonio.

Las sales se preparan contactando la forma de base libre con una cantidad suficiente del ácido deseado para producir una sal. Las formas de bases libres se pueden regenerar mediante el tratamiento de la sal con una solución de base acuosa diluida
20 como, por ejemplo, NaOH acuoso diluido, carbonato de potasio, amoníaco y bicarbonato de sodio. Como ejemplo, en muchos casos, un plaguicida se modifica para que sea una forma más soluble en agua, por ejemplo, la sal de dimetilamina del ácido 2,4-diclorofenoxiacético es una forma más soluble de ácido 2,4-
25 diclorofenoxiacético, un herbicida muy conocido.

Los compuestos descriptos en la presente invención pueden formar también complejos estables con moléculas de solventes que permanecen intactas luego de retirar las moléculas de solvente no complejas de los compuestos. Estos complejos se mencionan con
30 frecuencia como "solvatos".

Estereoisómeros

Ciertos compuestos descritos en este documento pueden existir en forma de uno o más estereoisómeros. Los diversos estereoisómeros incluyen isómeros, diastereómeros y enantiómeros geométricos. Por lo tanto, los compuestos descritos en la presente invención incluyen mezclas racémicas, estereoisómeros individuales y mezclas ópticamente activas. Los expertos en la técnica apreciarán que un estereoisómero puede ser más activo que los demás. Los estereoisómeros individuales y las mezclas ópticamente activas se pueden obtener mediante procedimientos sintéticos selectivos, procedimientos sintéticos convencionales con el uso de materiales de partida resueltos o procedimientos de resolución convencionales.

Plagas

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar plagas.

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar plagas de los **Nemátodos Fila.**

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar plagas de **Artrópodos Fila.**

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar plagas de **Subfila Quelicerados.**

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar plagas de la **clase de Arácnidos.**

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar plagas de **Miriápodos subfila**.

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar plagas de la **clase Sinfila**.

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar plagas de **Hexápodos subfila**.

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar plagas de la **clase Insectos**.

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar **Coleópteros (escarabajos)**. Una lista no taxativa de estas plagas incluye, pero sin limitación, *Acanthoscelides* spp. (gorgojos), *Acanthoscelides obtectus* (gorgojo común del frijol), *Agrilus planipennis* (barrenillo esmeralda del fresno), *Agriotes* spp. (gusano de alambre), *Anoplophora glabripennis* (escarabajo asiático de cuerno largo), *Anthonomus* spp. (gorgojos), *Anthonomus grandis* (gorgojo del algodón), *Aphidius* spp., *Apion* spp. (gorgojos), *Apogonia* spp. (gusanos), *Ataenius spretulus* (Ataenius negro del césped), *Atomaria linearis* (escarabajo pigmeo de la remolacha forrajera), *Aulacophore* spp., *Bothynoderes punctiventris* (gorgojo de la raíz de remolacha), *Bruchus* spp. (gorgojos), *Bruchus pisorum* (gorgojo de la arveja), *Cacoesia* spp., *Callosobruchus maculatus* (gorgojo de la arveja de vaca del sudeste), *Carpophilus hemipteras* (escarabajo de frutos secos), *Cassida vittata*, *Cerosterna* spp., *Cerotoma* spp. (crisomélidos),

Cerotoma trifurcata (escarabajo de la hoja de frijol),
Ceutorhynchus spp. (gorgojos), *Ceutorhynchus assimilis* (gorgojo
de la vaina de semillas del repollo), *Ceutorhynchus napi*
(curculio del repollo), *Chaetocnema* spp. (crisomélidos), *Colaspis*
5 spp. (escarabajos del suelo), *Conoderus scalaris*, *Conoderus*
stigmaticus, *Conotrachelus nenuphar* (curculio de la ciruela),
Cotinus nitidis (escarabajo verde de junio), *Crioceris asparagi*
(escarabajo del espárrago), *Cryptolestes ferrugineus* (escarabajo
oxidado de los granos), *Cryptolestes pusillus* (escarabajo plano
10 de los granos), *Cryptolestes turcicus* (escarabajo turco de los
granos), *Ctenicera* spp. (gusanos de alambre), *Curculio* spp.
(gorgojos), *Cyclocephala* spp. (gusanos), *Cilindrocpturus*
adpersus (gorgojo del tallo del girasol), *Deporaus marginatus*
(gorgojo cortador de las hojas del mango), *Dermestes lardarius*
15 (escarabajo de la despensa), *Dermestes maculatus* (escarabajo del
cuero), *Diabrotica* spp. (crisomélidos), *Epilachna varivestis*
(escarabajo mexicano del poroto), *Faustinus cubae*, *Hylobius pales*
(gorgojo pales), *Hypera* spp. (gorgojos), *Hypera postica* (gorgojo
de la alfalfa), *Hyperdoes* spp. (gorgojo Hyperodes), *Hypothenemus*
20 *hampei* (escarabajo de los granos de café), *Ips* spp. (grabadores),
Lasioderma serricorne (escarabajo del cigarrillo), *Leptinotarsa*
decemlineata (escarabajo colorado de la papa), *Liogenys fuscus*,
Liogenys suturalis, *Lissorhoptrus oryzophilus* (gorgojo de agua de
arroz), *Lyctus* spp. (escarabajos de la madera/escarabajos
25 pulverizadores), *Maecolaspis joliveti*, *Megascelis* spp., *Melanotus*
communis, *Meligethes* spp., *Meligethes aeneus* (escarabajo de la
flor), *Melolontha melolontha* (abejorro común europeo), *Oberea*
brevis, *Oberea linearis*, *Oryctes rhinoceros* (escarabajo de la
palma de dátiles), *Oryzaephilus mercator* (escarabajo mercante de
30 los granos), *Oryzaephilus surinamensis* (escarabajo dentado de los

granos), *Otiorhynchus* spp. (gorgojos), *Oulema melanopus* (escarabajo de las hojas de los cereales), *Oulema oryzae*, *Pantomorus* spp. (gorgojos), *Phyllophaga* spp. (escarabajo de mayo/junio), *Phyllophaga cuyabana*, *Phyllotreta* spp. (crisomélidos), *Phynchites* spp., *Popillia japonica* (escarabajo japonés), *Prostephanus truncatus* (barrenador de los granos más grandes), *Rhizopertha dominica* (barrenador de los granos más chicos), *Rhizotrogus* spp. (escarabajo roedor europeo), *Rhynchophorus* spp. (gorgojos), *Scolytus* spp. (escarabajos de la madera), *Shenophorus* spp. (escarabajo picudo), *Sitona lineatus* (gorgojo de las hojas de la arveja), *Sitophilus* spp. (gorgojos de los granos), *Sitophilus granaries* (gorgojos graneros), *Sitophilus oryzae* (gorgojos del arroz), *Stegobium paniceum* (escarabajos de almacén), *Tribolium* spp. (escarabajos de la harina), *Tribolium castaneum* (escarabajo rojo de la harina), *Tribolium confusum* (escarabajo confundido de la harina), *Trogoderma variabile* (escarabajo de productos almacenados), y *Zabrus tenebrioides*.

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar **Dermápteros** (tijeretas).

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar **Dictiópteros** (cucarachas). Una lista no exhaustiva de estas plagas incluyen, pero en forma no taxativa, *Blattella germanica* (cucaracha alemana), *Blatta orientalis* (cucaracha oriental), *Parcoblatta pennsylvanica*, *Periplaneta americana* (cucaracha americana), *Periplaneta australoasiae* (cucaracha australiana), *Periplaneta brunnea* (cucaracha marrón), *Periplaneta fuliginosa* (cucaracha

marrón ahumado), *Pyncoselus suninamensis* (cucaracha de Surinam), y *Supella longipalpa* (cucaracha de bandas marrones).

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar **Dípteros** (moscas
 5 **verdaderas**). Una lista no exhaustiva de estas plagas incluyen, pero sin limitación, *Aedes* spp. (mosquitos), *Agromyza frontella* (minero manchador de las hojas de alfalfa), *Agromyza* spp. (moscas mineras de las hojas), *Anastrepha* spp. (moscas de la fruta), *Anastrepha suspensa* (mosca caribénea de la fruta), *Anopheles* spp.
 10 (mosquitos), *Bactrocera* spp. (moscas de la fruta), *Bactrocera cucurbitae* (mosca del melón), *Bactrocera dorsalis* (mosca oriental de la fruta), *Ceratitis* spp. (moscas de la fruta), *Ceratitis capitata* (mosca mediterránea de la fruta), *Chrysops* spp. (moscas del ciervo), *Cochliomyia* spp. (gusanos tornillo), *Contarinia* spp.
 15 (mosquitos de las agallas), *Culex* spp. (mosquitos), *Dasineura* spp. (mosquitos de las agallas), *Dasineura brassicae* (mosquito de las agallas del repollo), *Delia* spp., *Delia platura* (larvas de la semilla de maíz), *Drosophila* spp. (moscas del vinagre), *Fannia* spp. (moscas de la suciedad), *Fannia canicularis* (pequeña mosca
 20 del hogar), *Fannia scalaris* (mosca de letrina), *Gasterophilus intestinalis* (mosca estro del caballo), *Gracillia perseae*, *Haematobia irritans* (mosca de los cuernos), *Hylemyia* spp. (larvas de las raíces), *Hypoderma lineatum* (gusano común del ganado), *Liriomyza* spp. (moscas mineras de las hojas), *Liriomyza*
 25 *brassica* (minera serpentina de las hojas), *Melophagus ovinus* (garrapata de ovejas), *Musca* spp. (moscas múscidas), *Musca autumnalis* (mosca de la cara), *Musca domestica* (mosca del hogar), *Oestrus ovis* (mosca estro de la oveja), *Oscinella frit* (mosca frita), *Pegomyia betae* (minera de las hojas de remolacha),
 30 *Phorbia* spp., *Psila rosae* (mosca de óxido de zanahoria),

Rhagoletis cerasi (mosca de la fruta de cereza), *Rhagoletis pomonella* (larva de la manzana), *Sitodiplosis mosellana* (mosquito naranja de la flor de trigo), *Stomoxys calcitrans* (mosca estable), *Tabanus* spp. (moscas del caballo), y *Tipula* spp. (moscas del cráneo).

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar **Hemípteros** (chinchas verdaderas). Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye, pero en forma no taxativa, *Acrosternum hilare* (chinche verde),

10 *Blissus leucopterus* (chinche), *Calocoris norvegicus* (mirid de papa), *Cimex hemipterus* (chinche tropical de cama), *Cimex lectularius* (chinche de cama), *Dagbertus fasciatus*, *Dichelops furcatus*, *Dysdercus suturellus* (manchador del algodón), *Edessa meditabunda*, *Eurygaster maura* (chinche de los cereales),

15 *Euschistus heros*, *Euschistus servus* (chinche marrón), *Helopeltis antonii*, *Helopeltis theivora* (chinche de planta de tizne del té), *Lagynotomus* spp. (chinchas), *Leptocorisa oratorius*, *Leptocorisa varicornis*, *Lygus* spp. (chinchas de plantas), *Lygus hesperus* (chinche manchada del oeste de las plantas), *Maconellicoccus*

20 *hirsutus*, *Neurocolpus longirostris*, *Nezara viridula* (chinche verde del sur), *Phytocoris* spp. (chinchas de las plantas), *Phytocoris californicus*, *Phytocoris relativus*, *Piezodorus guildingi*, *Poecilopsus lineatus* (chinche de cuatro líneas de las plantas), *Psallus vaccinicola*, *Pseudacysta perseae*,

25 *Scaptocoris castanea*, y *Triatoma* spp. (chinche nariz de cono chupadora de sangre/chinchas besadoras).

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar **Homópteros** (áfidos, escamas, moscas blancas, saltamontes). Una lista no exhaustiva de

30 estas plagas incluye, pero en forma no taxativa, *Acrythosiphon*

pisum (áfidos de las arvejas), *Adelges* spp. (adelgidos),
Aleurodes proletella (mosca blanca del repollo), *Aleurodicus*
dispersus, *Aleurothrixus floccosus* (mosca blanca lanosa),
Aluacaspis spp., *Amrasca bigutella bigutella*, *Aphrophora* spp.
5 (saltamontes), *Aonidiella aurantii* (escama roja de California),
Aphis spp. (áfidos), *Aphis gossypii* (áfido del algodón), *Aphis*
pomi (áfido de la manzana), *Aulacorthum solani* (áfido de
foxglove), *Bemisia* spp. (moscas blancas), *Bemisia argentifolii*,
Bemisia tabaci (mosca blanca de la batata), *Brachycolus noxius*
10 (áfido ruso), *Brachycorynella asparagi* (áfido del espárrago),
Brevennia rehi, *Brevicoryne brassicae* (áfido del repollo),
Ceroplastes spp. (escamas), *Ceroplastes rubens* (escama roja de la
cera), *Chionaspis* spp. (escamas), *Chrysomphalus* spp. (escamas),
Coccus spp. (escamas), *Dysaphis plantaginea* (áfido rosado de la
15 manzana), *Empoasca* spp. (saltamontes), *Eriosoma lanigerum* (áfido
lanoso de la manzana), *Icerya purchasi* (escama algodonosa
acolchada), *Idioscopus nitidulus* (saltamontes del mango),
Laodelphax striatellus (saltamontes marrón más pequeño),
Lepidosaphes spp., *Macrosiphum* spp., *Macrosiphum euphorbiae*
20 (áfido de la papa), *Macrosiphum granarium* (áfido inglés de los
granos), *Macrosiphum rosae* (áfido rosa), *Macrosteles*
quadrilineatus (saltamontes del áster), *Mahanarva frimbiolata*,
Metopolophium dirhodum (áfido rosa de los granos), *Mictis*
longicornis, *Myzus persicae* (áfido verde del durazno),
25 *Nephotettix* spp. (saltamontes), *Nephotettix cinctipes*
(saltamontes verde), *Nilaparvata lugens* (saltamontes marrón),
Parlatoria pergandii (cochinilla morada), *Parlatoria ziziphi*
(cochinilla del ébano), *Peregrinus maidis* (delfácido del maíz),
Philaenus spp. (chinches salivosas), *Phylloxera vitifoliae*
30 (filóxeros de la vid), *Physokermes piceae* (cochinilla del abeto),

Planococcus spp. (piojos harinosos), *Pseudococcus* spp. (piojos harinosos), *Pseudococcus brevipes* (piojo harinoso del ananá), *Quadraspidiotus perniciosus* (escama de San José), *Rhapalosiphum* spp. (áfidos), *Rhapalosiphum maidi* (áfido de la hoja de maíz),
 5 *Rhapalosiphum padi* (pulgón negro de los cereales), *Saissetia* spp. (escamas), *Saissetia oleae* (escama negra), *Schizaphis graminum* (chinche verde), *Sitobion avenae* (áfido inglés de los granos), *Sogatella furcifera* (saltamontes de torso blanco), *Therioaphis* spp. (áfidos), *Toumeyella* spp. (escamas), *Toxoptera* spp. (áfidos),
 10 *Trialeurodes* spp. (moscas blancas), *Trialeurodes vaporariorum* (mosca blanca de invernadero), *Trialeurodes abutiloneus* (mosca blanca de alas bandeadas), *Unaspis* spp. (escamas), *Unaspis yanonensis* (escama cabeza de flecha), y *Zulia entreriana*.

15 En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar **Himenópteros** (hormigas, avispas y abejas). Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye, pero en forma no taxativa, *Acromyrmex* spp., *Athalia rosae*, *Atta* spp. (hormigas cortadoras de hojas),
 20 *Camponotus* spp. (hormigas carpinteras), *Diprion* spp. (mosca de sierras o sawflies), *Formica* spp. (hormigas), *Iridomyrmex humilis* (hormiga argentina), *Monomorium* spp., *Monomorium minimum* (hormiga pequeña negra), *Monomorium pharaonis* (hormiga faraón), *Neodiprion* spp. (mosca de las sierras o sawflies), *Pogonomyrmex* spp. (hormigas cosechadoras),
 25 *Polistes* spp. (avispa del papel), *Solenopsis* spp. (hormigas de fuego), *Tapinoma sessile* (hormigas olorosas del hogar), *Tetranomium* spp. (hormigas del pavimento), *Vespula* spp. (abeja), y *Xylocopa* spp. (abejas carpinteras).

En otra realización, la invención descrita en este
 30 documento se puede utilizar para controlar **isópteros** (termitas).

Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye, pero en forma no taxativa, *Coptotermes* spp., *Coptotermes curvignathus*, *Coptotermes frenchii*, *Coptotermes formosanus* (termita subterránea de Formosa), *Cornitermes* spp. (termitas nasute), *Cryptotermes* spp. (termitas de la madera seca), *Heterotermes* spp. (termitas subterráneas del desierto), *Heterotermes aureus*, *Kalotermes* spp. (termitas de la madera seca). *Incistitermes* spp. (termitas de la madera seca), *Macrotermes* spp. (termitas hongo-crecientes), *Marginitermes* spp. (termitas de la madera seca), *Microcerotermes* spp. (termitas cosechadoras), *Microtermes obesi*, *Procornitermes* spp., *Reticulitermes* spp. (termitas subterráneas), *Reticulitermes banyulensis*, *Reticulitermes grassei*, *Reticulitermes flavipes* (termitas subterráneas del este), *Reticulitermes hageni*, *Reticulitermes hesperus* (termita subterránea del oeste), *Reticulitermes santonensis*, *Reticulitermes speratus*, *Reticulitermes tibialis*, *Reticulitermes virginicus*, *Schedorhinotermes* spp., y *Zootermopsis* spp. (termitas de la madera podrida).

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar lepidópteros (polillas y mariposas). Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye, pero en forma no taxativa, *Achoea janata*, *Adoxophyes* spp., *Adoxophyes orana*, *Agrotis* spp. (gusanos cortadores), *Agrotis ipsilon* (gusano cortador negro), *Alabama argillacea* (gusano de la hoja del algodón), *Amorbia cuneana*, *Amyelosis transitella* (gusano de la naranja ombligo), *Anacamptodes defectaria*, *Anarsia lineatella* (taladro de las ramas del durazno), *Anomis sabulifera* (bucleador del yute), *Anticarsia gemmatalis* (oruga del frijol terciopelo), *Archips argyrospila* (enrollador de las hojas de los árboles frutales), *Archips rosana* (enrollador de la hoja del

rosal), *Argyrotaenia* spp. (polillas tortricidas), *Argyrotaenia*
citrana (tórtrix naranja), *Autographa gamma*, *Bonagota cranaodes*,
Borbo cinnara (doblador de las hojas del arroz), *Bucculatrix*
thurberiella (perforador de las hojas del algodón), *Caloptilia*
 5 spp. (minerías de las hojas), *Capua reticulana*, *Carposina*
nipponensis (polilla del durazno), *Chilo* spp., *Chlumetia*
transversa (perforador del brote del mango), *Choristoneura*
rosaceana (enrollador de las hojas bandeadas oblicuas),
Chrysodeixis spp., *Cnaphalocerus medinalis* (enrollador del
 10 césped), *Colias* spp., *Conpomorpha cramerella*, *Cossus cossus*
 (polilla carpintera), *Crambus* spp. (gusanos telarañeros del
 césped), *Cydia funebrana* (polilla de la ciruela), *Cydia molesta*
 (polilla oriental de la fruta), *Cydia nignicana* (polilla de las
 arvejas), *Cydia pomonella* (polilla de la manzana), *Darna diducta*,
 15 *Diaphania* spp. (perforadores del tallo), *Diatraea* spp.
 (perforadores del cabo), *Diatraea saccharalis* (perforador de la
 caña de azúcar), *Diatraea graniosella* (perforador del maíz del
 sudoeste), *Earias* spp. (gusanos del capullo de algodón), *Earias*
insulata (gusano egipcio del capullo de algodón), *Earias vitella*
 20 (gusano áspero del noroeste del capullo de algodón), *Ecdyttopopha*
aurantianum, *Elasmopalpus lignosellus* (perforador menor de la
 mazorca del maíz), *Epiphysias postruttana* (polilla marrón claro
 de la manzana), *Ephestia* spp. (polillas de la harina), *Ephestia*
cautella (polilla de la almendra), *Ephestia elutella* (polilla del
 25 tabaco), *Ephestia kuehniella* (polilla mediterránea de la harina),
Epimeces spp., *Epinotia aporema*, *Erionota thrax* (saltador del
 banano), *Eupoecilia ambiguella* (polilla de la vid), *Euxoa*
auxiliaris (gusano cortador del ejército), *Feltia* spp. (gusanos
 cortadores), *Gortyna* spp. (perforadores del tallo), *Grapholita*
 30 *molesta* (polilla oriental de la fruta), *Hedylepta indicata*

(telarañero de las hojas de los porotos), *Helicoverpa* spp. (polillas noctuidas), *Helicoverpa armigera* (gusano del capullo del algodón), *Helicoverpa zea* (gusano del capullo del algodón/gusano de la mazorca del maíz), *Heliothis* spp. (polillas noctuidas), *Heliothis virescens* (gusano del brote del tabaco), *Hellula undalis* (gusano telaraña del repollo), *Indarbela* spp. (taladros de la raíz), *Keiferia lycopersicella* (gusano alfiler del tomate), *Leucinodes orbonalis* (taladro de la berenjena), *Leucoptera malifoliella*, *Lithocolletis* spp., *Lobesia botrana* (polilla de la vid), *Loxagrotis* spp. (polillas noctuidas), *Loxagrotis albicosta* (gusano cortador de frijoles del oeste), *Lymantria dispar* (polilla gitana), *Lyonetia clerkella* (minera de las hojas del manzano), *Mahasena corbetti* (gusano de bolsa de palma de aceite), *Malacosoma* spp. (orugas de carpa), *Mamestra brassicae* (gusano del ejército del repollo), *Maruca testulalis* (taladro de la vaina del frijol), *Metisa plana* (gusano de bolsa), *Mythimna unipuncta* (gusano del ejército verdadero), *Neoleucinodes elegantalis* (taladro pequeño del tomate), *Nymphula depunctalis* (gusanos de cajas de arroz), *Operophtera brumata* (polilla de invierno), *Ostrinia nubilalis* (taladro europeo del maíz), *Oxydia vesulia*, *Pandemis cerasana* (tórtrix común de pasas), *Pandemis heparana* (tórtrix marrón de manzana), *Papilio demodocus*, *Pectinophora gossypiella* (gusano rosa del capullo de algodón), *Peridroma* spp. (gusanos cortadores), *Peridroma saucia* (gusano cortador jaspeado), *Perileuoptera coffeella* (minero blanco de las hojas de café), *Phthorimaea operculella* (polilla de los tubérculos de papa), *Phyllocnistis citrella*, *Phyllonorycter* spp. (mineros de hojas), *Pieris rapae* (gusano de repollo importado), *Plathypena scabra*, *Plodia interpunctella* (polilla india de alimentos), *Plutella xylostella* (polilla con dorso diamante),

Polychrosis viteana (polilla de la vid), *Prays endocarpa*, *Prays oleae* (polilla del olivo), *Pseudaletia* spp. (polillas noctuidas), *Pseudaletia unipunctata* (gusano del ejército), *Pseudoplusia includens* (bucleador de la soja), *Rachiplusia* nu, *Scirpophaga*
 5 *incertulas*, *Sesamia* spp. (taladros de los tallos), *Sesamia inferens* (taladro rosa de los tallos de arroz), *Sesamia nonagrioides*, *Setora nitens*, *Sitotroga cerealella* (polilla Angoumois de los granos), *Sparganothis pilleriana*, *Spodoptera*
 10 spp. (gusanos del ejército), *Spodoptera exigua* (gusano del ejército de la remolacha), *Spodoptera fugiperda* (gusano del ejército del otoño), *Spodoptera oridania* (gusano del ejército del sur), *Synanthedon* spp. (taladros de la raíz), *Thecla basilides*, *Thermisia gemmatalis*, *Tineola bisselliella* (polilla tejedora de la ropa), *Trichoplusia ni* (bucleador del repollo), *Tuta absoluta*,
 15 *Yponomeuta* spp., *Zeuzera coffeae* (taladro rojo de las ramas), and *Zeuzera pyrina* (polilla leopardo).

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar **Malófagos** (piojos **masticadores**). Una lista no exhaustiva de estas plagas incluyen,
 20 pero en forma no taxativa, *Bovicola ovis* (piojo mordedor de ovejas), *Menacanthus stramineus* (piojo del cuerpo de los pollos), y *Menopon gallinea* (gallinero común).

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar **Ortópteros**
 25 (**saltamontes, langostas, y grillos**). Una lista no exhaustiva de estas plagas incluyen, pero en forma no taxativa, *Anabrus simplex* (grillo mormón), *Gryllotalpidae* (grillos topo), *Locusta migratoria*, *Melanoplus* spp. (saltamontes), *Microcentrum retinerve* (saltamontes de alas angulares), *Pterophylla* spp. (saltamontes),

chistocerca gregaria, *Scudderia furcata* (saltamontes de arbustos de cola tenedor), y *Valanga nigricorni*.

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar **Ftírápteros** (piojos
5 **chupadores**). Una lista no exhaustiva de estas plagas incluyen, pero sin limitación, *Haematopinus* spp. (piojos del ganado y cerdos), *Linognathus ovillus* (piojo de las ovejas), *Pediculus humanus capitis* (piojo del cuerpo humano), *Pediculus humanus humanus* (piojo del cuerpo humano), y *Pthirus pubis* (ladilla).

10 En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar **Sifonápteros** (pulgas). Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye, pero en forma no taxativa, *Ctenocephalides canis* (pulga del perro), *Ctenocephalides felis* (pulga del gato), y *Pulex irritans* (pulga
15 del ser humano).

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar **Tisanópteros** (trips). Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye, pero en forma no taxativa, *Frankliniella fusca* (trips de tabaco), *Frankliniella*
20 *occidentalis* (trips de las flores del oeste), *Frankliniella shultzei* *Frankliniella williamsi* (trips del maíz), *Heliothrips haemorrhaidalis* (trips de invernadero), *Rhipiphorothrips cruentatus*, *Scirtothrips* spp., *Scirtothrips citri* (trips de citrus), *Scirtothrips dorsalis* (trips amarillo del té),
25 *Taeniothrips rhopalantennalis*, y *Thrips* spp.

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar **Tisanuros** (Colas de flecos). Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye, pero

en forma no taxativa, *Lepisma spp.* (lepisme) y *Thermobia spp.* (insecto de fuego).

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar **Acarinos (ácaros y**
 5 **garrapatas)**. Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye, pero en forma no taxativa, *Acarapsis woodi* (ácaros traqueales de abejas), *Acarus spp.* (ácaros de los alimentos), *Acarus siro* (ácaros de los granos), *Aceria mangiferae* (ácaros del mango), *Aculops spp.*, *Aculops lycopersici* (ácaro del bronceado del
 10 tomate), *Aculops pelekasi*, *Aculus pelekassi*, *Aculus schlechtendali* (ácaro del óxido de la manzana), *Amblyomma americanum* (garrapata estrella solitaria), *Boophilus spp.* (garrapatas), *Brevipalpus obovatus* (araña de la ligustrina), *Brevipalpus phoenicis* (ácaro plano rojo y negro), *Demodex spp.*
 15 (ácaros de la sarna), *Dermacentor spp.* (garrapatas duras), *Dermacentor variabilis* (garrapata americana del perro), *Dermatophagoides pteronyssinus* (ácaro del polvo del hogar), *Eotetranychus spp.*, *Eotetranychus carpini* (ácaro araña amarilla), *Epitimerus spp.*, *Eriophyes spp.*, *Ixodes spp.* (garrapatas),
 20 *Metatetranychus spp.*, *Notoedres cati*, *Oligonychus spp.*, *Oligonychus coffee*, *Oligonychus ilicus* (ácaro rojo del sur), *Panonychus spp.*, *Panonychus citri* (ácaro rojo de citrus), *Panonychus ulmi* (ácaro europeo rojo), *Phyllocoptruta oleivora* (ácaro del óxido del citrus), *Polyphagotarsonemus latus* (ácaro
 25 ancho), *Rhipicephalus sanguineus* (garrapata marrón del perro), *Rhizoglyphus spp.* (ácaros del bulbo), *Sarcoptes scabiei* (ácaro de la picazón), *Tegolophus perseafloreae*, *Tetranychus spp.*, *Tetranychus urticae* (ácaro araña de dos manchas), y *Varroa destructor* (ácaro de la abeja).

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar **Nemátodos (nemátodos)**. Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye, pero en forma no taxativa, *Aphelenchoides* spp. (nemátodos de las yemas, hojas y pinos), *Belonolaimus* spp. (sting nematodes), *Cricconemella* spp. (nemátodos de anillo), *Dirofilaria immitis* (gusano del corazón del perro), *Ditylenchus* spp. (nemátodos del tallo y bulbo), *Heterodera* spp. (nemátodos cist), *Heterodera zeae* (nemátodos cist del maíz), *Hirschmanniella* spp. (nemátodos de la raíz), *Hoplolaimus* spp. (nemátodos lanza), *Meloidogyne* spp. (nemátodos de los nudos de las raíces), *Meloidogyne incognita* (nemátodos de los nudos de las raíces), *Onchocerca volvulus* (gusano cola de gancho), *Pratylenchus* spp. (nemátodos de lesiones), *Radopholus* spp. (burrowing nematodes), and *Rotylenchus reniformis* (nemátodos con forma de riñón).

En otra realización, la invención descrita en este documento se puede utilizar para controlar **Sínfilos (sinfilanos)**. Una lista no exhaustiva de estas plagas incluye, pero en forma no taxativa, *Scutigerella immaculata*.

Para una información más detallada, consultar el "HANDBOOK OF PEST CONTROL - THE BEHAVIOR, LIFE HISTORY, AND CONTROL OF HOUSEHOLD PESTS" (Manual del Control de Plagas, la conducta, historia de vida y control de las plagas del hogar", de Arnold Mallis, 9ª Edición, derecho de autor 2004 de GIE Media Inc.

Mezclas

La invención descrita en este documento se puede utilizar incluso con diversos insecticidas, por razones de economía y sinergia. Estos insecticidas incluyen, en forma no taxativa, insecticidas antibióticos, insecticidas de lactona macrocíclica (por ejemplo, insecticidas de avermectina, insecticidas de

milbemicina e insecticidas de espinosina), insecticidas arsénicos, insecticidas botánicos, insecticidas de carbamato (por ejemplo, insecticidas de metilcarbamato de benzofuranilo, insecticidas de dimetilcarbamato, insecticidas de carbamato de oxima, e insecticidas de metilcarbamato de fenilo), insecticidas de diamida, insecticidas secantes, insecticidas de dinitrofenol, insecticidas de flúor, insecticidas de formamidina, insecticidas fumigantes, insecticidas inorgánicos, reguladores del crecimiento de insectos (por ejemplo, inhibidores de la síntesis de la quitina, imitadores de la hormona juvenil, hormonas juveniles, agonistas de la hormona de la muda, hormonas de la muda, inhibidores de la muda, precocenos, y otros reguladores no clasificados del crecimiento de los insectos), insecticidas análogos a la nereistoxina, insecticidas nicotinoides (por ejemplo, insecticidas de nitroguanidina, insecticidas de nitrometileno, e insecticidas de piridilmetilamina), insecticidas de organocloro, insecticidas de organofósforo, insecticidas de oxadiazina, insecticidas de oxadiazolona, insecticidas de ftalimida, insecticidas de pirazol, insecticidas piretroides, insecticidas de pirimidinamina, insecticidas de pirrol, insecticidas de ácido tetrámico, insecticidas de ácido tetrónico, insecticidas de tiazol, insecticidas de tiazolidina, insecticidas de tiourea, insecticidas de urea, como también, otros insecticidas no clasificados.

Algunos de los insecticidas particulares que se pueden emplear de manera beneficiosa en combinación con la invención descripta en este documento incluyen, pero en forma no taxativa, los siguientes 1,2-dicloropropano, 1,3 dicloropropeno, abamectina, acefato, acetamiprid, acetión, acetoprol, acrinatrin, acrilonitrilo, alanicarb, aldicarb, aldoxicarb, aldrin, aletrin, alosamidin, alixicarb, alfa-cipermetrin, alfa-endosulfan,

amiditi3n, aminocarb, amiton, amitraz, anabasina, atidati3n,
azadiractin, azametifos, azinfos-etilo, azinfosmetilo, azotoato,
hexafluorsilicato de bario, bartrin, bendiocarb, benfuracarb,
bensultap, beta-ciflutrin, beta-cipermetrin, bifentrin,
5 bioaletrin, bioetanometrin, biopermetrin, bioresmetrin,
bistriflur3n, borax, 3cido b3rico, 3cido b3rico, bromfenvinfos,
bromociclen, bromo-DDT, bromofos, bromofosetilo, bufencarb,
buprofezin, butacarb, butatiofos, butocarboxim, butonato,
butoxicarboxim, cadusafos, arsenato de calcio, polisulfuro de
10 calcio, camfeclor, carbanolato, carbarilo, carbofuran, disulfuro
de carbono, tetracloruro de carbono, carbofenoti3n, carbosulfan,
cartap, clorantraniliprol, clorbiciclen, clordano, clordecona,
clordimeform, cloretoxifos, clorfenapir, clorfenvinfos,
clorfluazur3n, clormefos, cloroform, cloropicrin, clorfoxim,
15 clorprazofos, clorpirifos, clorpirifos-metilo, clortiofos,
cromafenozida, cinerin I, cinerin II, cismetrin, cloetocarb,
closantel, clotianidin, acetoarsenita de cobre, arsenato de
cobre, naftenato de cobre, oleato de cobre, cumafos, cumitoato,
crotamiton, crotoxifos, cruformato, criolita, cianofenfos,
20 cianofos, ciantoato, ciantraniliprol, ciclettrin, cicloprotrin,
ciflutrin, cihalotrin, cipermetrin, cifenotrin, ciromazina,
citioato, DDT, decarbofuran, deltametrin, demefi3n, demefi3n-O,
demefi3n-S, demet3n, demeton-metilo, demeton-O, demeton-O-metilo,
demeton-S, demeton-S-metilo, demeton-S-metilsulfon, diafentiur3n,
25 dialifos, tierra diatom3cea, diazinon, dicapton, diclofention,
diclorvos, dicresil, dicrotofos, diciclanil, dieldrin,
diflubenzuron, dilor, dimeflutrin, dimefox, dimetan, dimetoato,
dimettrin, dimetilvinfos, dimetilan, dinex, dinoprop, dinosam,
dinotefuran, diofenolan, dioxabenzofos, dioxacarb, dioxati3n,
30 disulfot3n, diticrofos, d-limoneno, DNOC, doramectina,
ecdisterona, emamectina, EMPC, empentrina, endosulfan, endoti3n,

endrin, EPN, epofenonano, eprinomectina, esfenvalerato, etafos, etiofencarb, eti6n, etiprol, etoato-metilo, etoprofos, formiato de etilo, etil-DDD, dibromuro de etileno, dicloruro de etileno, 6xido de etileno, etofenprox, etrimfos, EXD, famfur, fenamifos, 5 fenazaflor, fenclorfos, fenetacarb, fenflutrin, fenitroti6n, fenobucarb, fenoxacrim, fenoxicarb, fenpiritrin, fenpropatrin, fensulfoti6n, fenti6n, fenti6n-etilo, fenvalerato, fipronilo, flonicamid, flubendiamida, flucofur6n, fluciclofur6n, flucitrinato, flufenerim, flufenoxur6n, flufenprox, fluvalinato, 10 fonofos, formetanato, formoti6n, formparanato, fosmetilan, fospirato, fostietan, furatiocarb, furetrin, gamma-cihalotrina, gamma-HCH, halfenprox, halofenozida, HCH, HEOD, heptaclor, heptenofos, heterofos, hexaflumuron, HHDN, hidrametilnon, cianuro de hidr6geno, hidropreno, hiquincarb, imidacloprid, imiprotrin, 15 indoxacarb, yodometano, IPSP, isazofos, isobenzan, isocarbofos, isodrin, isofenfos, isoprocarb, isoprotiolano, isotioato, isoxati6n, ivermectina, jasmolin I, jasmolin II, jodfenfos, hormona juvenil I, hormona juvenil II, hormona juvenil III, kelevan, kinopreno, lambda-cihalotrina, arsenato de plomo, 20 lepimectina, leptofos, lindano, lirimfos, lufenur6n, litidati6n, malati6n, malonoben, mazidox, mecarbam, mecarf6n, menazon, mefosfolan, cloruro de mercurio, mesulfenfos, metaflumizona, metacrifos, metamidofos, metidati6n, metiocarb, metocrotofos, metomil, metopreno, metoxiclor, metoxifenoazida, bromuro de 25 metilo, metilcloroformo, cloruro de metileno, metoflutrin, metolcarb, metoxadiazona, mevinfos, mexacarbato, milbemectin, milbemecin oxima, mipafox, mirex, monocrotofos, morfoti6n, moxidectin, naftalofos, naled, naftaleno, nicotina, nifluridida, nitenpiram, nitiazina, nitrilacarb, novalur6n, noviflumur6n, 30 ometoato, oxamil, oxidemeton-metilo, oxideprofos, oxidisulfoti6n, para-diclorobenceno, parati6n, parati6n-metilo, penflur6n,

pentaclorofenol, permetrina, fenkaptón, fenotrina, fentoato, forato, fosalona, fosfolan, fosmet, fosniclor, fosfamidón, fosfino, foxim, foxim-metilo, pirimetafos, pirimicarb, pirimifos-etilo, pirimifos-metilo, arsenito de potasio, tiocianato de potasio, pp'-DDT, praletrina, precoceno I, precoceno II, precoceno III, primidofos, profenofos, proflutrin, promacilo, promecarb, propafos, propetamfos, propoxur, protidati3n, protiofos, protoato, protrifenbuto, piraclofos, pirafluprol, pirazofos, piresmetrina, piretrina I, piretrina II, piridaben, piridalilo, piridafenti3n, pirifluquinaz3n, pirimidifen, pirimitato, piriprol, piriproxifen, cuasia, quinalfos, quinalfosmetilo, quinoti3n, rafoxanida, resmetrin, rotenona, riania, sabadilla, scradan, selamectina, silafluofen, gel de sílice, arsenito de sodio, fluoruro de sodio, hexafluorsilicato de sodio, tiocianato de sodio, sofamida, espinetoram, espinosad, espiromesifen, espirotetramat, sulcofur3n, sulfluramid, sulfotep, fluoruro de sulfurilo, sulprofos, tau-fluvalinato, tazimcarb, TDE, tebufenozida, tebufenpirad, tebupirimfos, teflubenzur3n, teflutrin, temefos, TEPP, teraletrin, terbufos, tetracloroetano, tetraclorvinfos, tetrametrin, teta-cipermetrina, tiacloprid, tiametoxam, ticrofos, tiocarboxima, tiociclam, tiodicarb, tiofanox, tiometon, tiosultap, turingiensin, tolfenpirad, tralometrina, transflutrina, transpermetrina, triaraten3n, triazamato, triazofos, triclorfon, triclormetafos-3, tricloronat, trifenofos, triflumur3n, trimetacarb, tripreno, vamidoti3n, vaniliprol, XMC, xililcarb, zeta-cipermetrin, zolaprofos, y α -ecdisona.

Adicionalmente, se puede utilizar cualquier combinaci3n de los insecticidas mencionados precedentemente.

La invenci3n descrita en este documento se puede utilizar tambi3n, por razones de economía y sinergia, con acaricidas,

alguicidas, antialimentadores, avicidas, bactericidas, repelentes de aves, quimioesterilizantes, fungicidas, aseguradores de herbicidas, herbicidas, atrayentes de insectos, repelentes de insectos, repelentes de mamíferos, interruptores de la
5 copulación, moluscicidas, activadores de vegetales, reguladores del crecimiento de los vegetales, rodenticidas, sinergistas, desfoliantes, secantes, desinfectantes, semioquímicos, y virucidas (estas categorías no son necesariamente mutuamente exclusivas).

10 Para mayor información, consultar "COMPENDIUM OF PESTICIDE COMMON NAMES" (Compendio de nombres comunes de plaguicidas) en <http://www.alanwood.net/pesticides/index.html>. Incluso, consúltese "THE PESTICIDE MANUAL" (El Manual Plaguicida) 14^a Edición, editado por C D S Tomlin, derecho de autor 2006, de
15 British Crop Production Council.

Mezclas sinérgicas

La invención descrita en este documento se puede utilizar con otros compuestos como, por ejemplo, aquellos mencionados bajo el título "Mezclas" para formar mezclas sinérgicas en las que los
20 modos de acción de los compuestos en las mezclas son iguales, similares o diferentes.

Los ejemplos del modo de las acciones incluyen, en forma no taxativa: inhibidor de acetilcolinesterasa; modulador de canales de sodio; inhibidor de la biosíntesis de la quitina; antagonista
25 del canal de cloruro con compuerta GABA; agonista del canal de cloro de compuerta de glutamato; agonista del receptor acetilcolina; inhibidor de MET I; inhibidor de ATPasa estimulada con Mg; receptor de acetilcolina nicotínico; interruptor de la membrana del intestino medio; interruptor de la fosforilación
30 oxidante, y receptor de rianodina (RyRs).

Adicionalmente, los siguientes compuestos son conocidos como sinérgicos y se pueden utilizar con la invención descrita en este documento: butóxido de piperonilo, piprotal, propil isoma, sesamex, sesamolin, y sulfóxido.

5

Formulaciones

Un plaguicida raramente es adecuado para la aplicación en su forma pura. Generalmente, es necesario agregar otras sustancias de manera que el plaguicida se pueda utilizar en la concentración requerida y en forma adecuada, a los efectos de permitir la
10 facilidad de aplicación, manipulación, transporte, almacenamiento y máxima actividad plaguicida. Por lo tanto, los plaguicidas se formulan, por ejemplo, en cebos, emulsiones concentradas, polvos, concentrados emulsionables, fumigantes, geles, gránulos, microencapsulaciones, tratamientos de semillas, concentrados en
15 suspensión, suspoemulsiones, comprimidos, líquidos solubles en agua, gránulos dispersables en agua o fluibles secos, polvos humectables, y soluciones de volumen ultra bajo.

Para mayor información sobre los tipos de formulación, véase "Catalogue of Pesticide Formulation Types and International
20 Coding System" (Catálogo de tipos de formulaciones plaguicidas y sistema de codificación internacional), Monografía técnica nro. 2, 5a Edición, de CropLife International (2002).

Los plaguicidas se aplican mayormente en forma de suspensiones o emulsiones acuosas preparadas a partir de
25 formulaciones concentradas de esos plaguicidas. Esas formulaciones solubles en agua, suspendibles en agua, o emulsionables son sólidas, generalmente conocidas como polvos humectables, gránulos dispersables en agua, líquidos generalmente conocidos como concentrados emulsionables, o suspensiones
30 acuosas. Los polvos humectables, que se pueden compactar para

formar gránulos dispersables en agua, comprenden una mezcla íntima del plaguicida, un vehículo, y tensioactivos. La concentración del plaguicida es, generalmente, de alrededor de 10% a alrededor de 90% en peso. El vehículo se elige generalmente
5 entre arcillas de atapulgita, arcillas de montmorillonita, tierras diatomáceas, o silicatos purificados. Los tensioactivos efectivos, que comprenden de alrededor de 0,5% a alrededor de 10% del polvo humectable, se hallan entre ligninas sulfonadas, naftalensulfonatos condensados, naftalensulfonatos,
10 alquilbencensulfonatos, alquil sulfatos, y tensioactivos no iónicos como, por ejemplo, aductos de óxido de etileno de alquifenoles.

Los concentrados emulsionables de plaguicidas comprenden una concentración conveniente de un plaguicida, como, por ejemplo, de
15 aproximadamente 50 a aproximadamente 500 gramos por litro de líquido disuelto en un vehículo que puede ser un solvente miscible en agua o una mezcla de solvente y emulsionante orgánicos inmiscibles en agua. Los solventes orgánicos útiles incluyen aromáticos, especialmente fracciones de xileno y
20 petróleo, especialmente las porciones naftalénicas y olefínicas de alta ebullición de petróleo como, por ejemplo, nafta aromática pesada. Otros solventes orgánicos se pueden utilizar también, como, por ejemplo, los solventes terpénicos que incluyen derivados de rosin, cetonas alifáticas como, por ejemplo,
25 ciclohexanona, y alcoholes complejos como, por ejemplo, 2-etoxietanol. Los emulsionables adecuados para los concentrados emulsionables se eligen de tensioactivos convencionales aniónicos y no iónicos.

Las suspensiones acuosas comprenden suspensiones de
30 plaguicidas insolubles en agua dispersados en un vehículo acuoso

a una concentración en el rango de aproximadamente 5% hasta aproximadamente 50% en peso. Las suspensiones se preparan triturando finamente el plaguicida y mezclándolo vigorosamente en un vehículo que comprende agua y tensioactivos. Los ingredientes, como, por ejemplo, sales inorgánicas y gomas sintéticas o naturales se pueden agregar también a los efectos de aumentar la densidad y viscosidad del vehículo acuoso. Con frecuencia, resulta más efectivo triturar y mezclar el plaguicida al mismo tiempo preparando la mezcla acuosa y homogenizándola en un implemento como, por ejemplo, un molino de arena, un molino de bola, o un homogenizador tipo pistón.

Los plaguicidas se pueden aplicar también en forma de composiciones granulares que son particularmente útiles para aplicaciones en el suelo. Las composiciones granulares contienen generalmente de aproximadamente 0,5% hasta aproximadamente 10% en peso del plaguicida, dispersado en un vehículo que comprende arcilla o una sustancia similar. Esas composiciones se preparan generalmente disolviendo el plaguicida en un solvente adecuado y aplicándolo a un vehículo granulado que se ha preformado hasta alcanzar un tamaño de partícula adecuado, en el rango de aproximadamente 0,5 hasta aproximadamente 3 mm. Estas composiciones se pueden formular incluso con la preparación de una masa o pasta del vehículo y el compuesto y su trituración y secado para obtener el tamaño de partícula granular deseado.

Los polvos que contienen un plaguicida se preparan mezclando íntimamente el plaguicida en polvo con un vehículo agrícola polvoriento adecuado, como, por ejemplo, arcilla caolín, roca volcánica triturada, y similares. Los polvos pueden contener en forma adecuada alrededor de 1% hasta aproximadamente 10% del plaguicida. Se pueden aplicar como envoltura de semillas o como una aplicación foliar con una máquina sopladora de polvo.

Resulta igualmente práctico aplicar un plaguicida en forma de solución en un solvente orgánico adecuado, generalmente aceite de petróleo, como, por ejemplo, los aceites de atomización, que se utilizan ampliamente en la química agrícola.

5 Los plaguicidas también se pueden aplicar en forma de composición en aerosol. En estas composiciones, el plaguicida se disuelve o dispersa en un vehículo, que consiste en una mezcla propulsora que genera presión. La composición en aerosol se envasa en un recipiente del cual se administra la mezcla a través
10 de una válvula atomizadora.

Los cebos plaguicidas se forman cuando el plaguicida se mezcla con un alimento, un atrayente o ambos. Cuando las plagas ingieren el cebo, también consumen el plaguicida. Los cebos pueden tomar forma de gránulos, geles, polvos fluibles, líquidos,
15 o sólidos. Se pueden utilizar en los refugios de las plagas.

Los fumigantes son plaguicidas que poseen una presión de vapor relativamente alta y, por ende, pueden existir en forma de gas en concentraciones suficientes para matar las plagas en el suelo o en espacios cerrados. La toxicidad del fumigante es
20 proporcional a su concentración y el tiempo de exposición. Se caracterizan por tener una buena capacidad de difusión y actúan penetrando en el sistema respiratorio de la plaga o por absorción a través de la cutícula de la plaga. Los fumigantes se aplican a las plagas del producto almacenado de control bajo láminas a
25 prueba de gas, en sales selladas contra el gas, edificios o en cámaras especiales.

Los plaguicidas se pueden microencapsular mediante la suspensión de las partículas o gotitas plaguicidas en polímeros de plástico de diversos tipos. Al alternar la química del
30 polímero o al cambiar los factores en el proceso, se pueden formar microcápsulas de diversos tamaños, diversas solubilidades,

diversos grosores de pared, y grados de capacidad de penetración. Estos factores rigen la velocidad a la que se libera el ingrediente activo en el interior, lo cual a su vez afecta el rendimiento residual, la velocidad de acción y el olor del producto.

Los concentrados de solución de aceite se preparan disolviendo el plaguicida en un solvente que mantendrá el plaguicida en solución. Las soluciones de aceite de un plaguicida generalmente proporcionan un derribamiento y una matanza más rápidos de las plagas que otras formulaciones debido a que los mismos solventes poseen acción plaguicida y la disolución del recubrimiento ceroso del integumento aumenta la velocidad de absorción del plaguicida. Otras ventajas de las soluciones de aceite incluyen una mejor estabilidad de almacenamiento, mejor penetración de las hendiduras, y mejor adhesión a las superficies grasosas.

Otra realización es una emulsión de aceite en agua, donde la emulsión comprende glóbulos oleosos, cada uno de los cuales se encuentra provisto de un recubrimiento de cristal líquido lamelar y se encuentran dispersados en una fase acuosa, donde cada glóbulo oleoso comprende por lo menos un compuesto que es agrícolamente activo y se encuentra recubierto individualmente con una capa monolamelar u oligolamelar que comprende: (1) por lo menos un agente superficie-activo lipófilo no iónico, (2) por lo menos un agente superficie-activo hidrófilo no iónico y (3) al menos un agente superficie-activo iónico, donde los glóbulos poseen un diámetro medio de partícula inferior a 800 nanómetros. Mayor información sobre la realización se encuentra descripta en la publicación de patente de invención estadounidense 20070027034, publicada el 1° de febrero de 2007, correspondiente a la solicitud de patente de invención con número de acta

11/495.228. Por facilitar el uso, la presente realización se mencionará como "OIWE".

Para mayor información, consúltese **"Insect Pest Management"** (Manejo de las plagas de insectos), 2ª Edición, de D. Dent, derecho de autor CAB International (2000). Adicionalmente, para una información más detallada, consúltese el **"Handbook of Pest Control - The Behavior, Life History, and Control of Household Pests"** (Manual del control de plagas, comportamiento, historia de vida y control de las plagas hogareñas) de Arnold Mallis, 9ª Edición, derecho de autor 2004, de GIE Media Inc.

Otros componentes de la formulación

Generalmente, cuando la invención descrita en este documento se utiliza en una formulación, esa formulación puede contener también otros componentes. Estos componentes incluyen, pero en forma no taxativa (se trata de una lista no exhaustiva y no mutuamente exclusiva) humectantes, difusores, adhesivos, penetrantes, tampones, agentes de secuestro, agentes de reducción de deriva, agentes de compatibilidad, agentes antiespuma, agentes de limpieza y emulsionantes. Algunos componentes se encuentran descritos a continuación.

Un agente humectante es una sustancia que al agregarse a un líquido aumenta la difusión o el poder de penetración del líquido, ya que reduce la tensión entre interfases entre el líquido y la superficie sobre la que se esparce. Los agentes humectantes se utilizan para dos funciones principales en las formulaciones agroquímicas: durante el procesamiento y la fabricación a fin de aumentar la velocidad de humectación de los polvos en agua para preparar concentrados para líquidos solubles o concentrados en suspensión; y durante la mezcla de un producto

con agua en un tanque de atomización para reducir el tiempo de humectación de los polvos humectables y mejorar la penetración del agua en los gránulos dispersables en agua. Los ejemplos de agentes humectantes utilizados en las formulaciones del polvo humectable, el concentrado en suspensión, y gránulos dispersables en agua son: laurilsulfato de sodio; sulfosuccinato de dioctil de sodio; etoxilatos de alquilfenol; y etoxilatos de alcohol alifático.

Un agente dispersante es una sustancia que se adsorbe sobre la superficie de las partículas y contribuye a conservar el estado de dispersión de las partículas y evita que se reconglomeren. Los agentes dispersantes se agregan a formulaciones agroquímicas para facilitar la dispersión y suspensión durante la fabricación y asegurar que las partículas se redispersen en agua en un tanque de atomización. Se utilizan ampliamente en polvos humectables, concentrados en suspensión y gránulos dispersables en agua. Los tensioactivos que se utilizan como agentes dispersantes poseen la capacidad de adsorberse fuertemente sobre una superficie de partícula y proveer una barrera cargada o estérica a la reconglomeración de partículas. Los tensioactivos utilizados con mayor frecuencia son aniónicos, no iónicos o mezclas de estos dos tipos. Para las formulaciones de polvo humectable, los agentes dispersantes más comunes son lignosulfonatos de sodio. Para los concentrados en suspensión, se obtienen una muy buena adsorción y estabilización con el uso de polielectrolitos, como, por ejemplo, condensados de formaldehído de naftalensulfonato de sodio. También, se utilizan tristirilfenol etoxilato fosfato ésteres. No iónicos como, por ejemplo, condensados de óxido de alquilariletileno y copolímeros de bloques de EO-PO se combinan a veces con aniónicos como agentes dispersantes para los concentrados en suspensión. En los

años recientes, se han desarrollado nuevos tipos de tensioactivos poliméricos de muy alto peso molecular como agentes dispersantes. Ellos poseen "estructuras principales" hidrófobas muy largas y una gran cantidad de cadenas de óxido de etileno que forman los "dientes" de un tensioactivo "peine". Estos polímeros de alto peso molecular pueden proporcionar una muy buena estabilidad a largo plazo para los concentrados en suspensión debido a que las estructuras principales hidrófobas poseen muchos puntos de anclaje sobre las superficies de las partículas. Los ejemplos de agentes dispersantes utilizados en las formulaciones agroquímicas son: lignosulfonatos de sodio; condensados de formaldehído de naftalensulfonato de sodio; tristirilfenol etoxilato fosfato ésteres; etoxilatos de alcohol alifático; etoxilatos de alquilo; copolímeros en bloque de EO-PO; y copolímeros de injerto.

Un agente emulsionante es una sustancia que estabiliza una suspensión de gotas de una fase líquida en otra fase líquida. Sin el agente emulsionante, los dos líquidos se separarían en dos fases líquidas inmiscibles. Las combinaciones emulsionantes utilizadas más comúnmente contienen alquilfenol o alcohol alifático con doce o más unidades de óxido de etileno y la sal de calcio soluble en aceite del ácido dodecylbencensulfónico. Un rango de valores de equilibrio de hidrófilos-lipófilos ("HLB") de 8 a 18 proporcionará normalmente buenas emulsiones estables. La estabilidad de las emulsiones se puede mejorar a veces mediante la adición de una pequeña cantidad de tensioactivo de copolímero de bloques de EO-PO.

Un agente solubilizante es un tensioactivo que formará micelas en agua en concentraciones superiores a la concentración crítica de micelas. Las micelas pueden disolver entonces o solubilizar materiales insolubles en agua dentro de la parte hidrófoba de la micela. Los tipos de tensioactivos utilizados

generalmente para la solubilización son no iónicos, monooleatos de sorbitán, etoxilatos de monooleato de sorbitán y ésteres de oleato de metilo.

A veces, se utilizan tensioactivos, ya sea solos o con otros
5 aditivos como, por ejemplo, aceites minerales o vegetales como adyuvantes para mezclas de tanques de atomización a fin de mejorar el rendimiento biológico del plaguicida sobre el objetivo. Los tipos de tensioactivos utilizados para el bioincremento dependen generalmente de la naturaleza y el modo de
10 acción del plaguicida. Sin embargo, son con frecuencia no iónicos como, por ejemplo, etoxilatos de alquilo; etoxilatos de alcohol alifático lineales; y etoxilatos de aminas alifáticas.

Un vehículo o diluyente en una formulación agrícola es un material agregado al plaguicida para proporcionar un producto de
15 la fuerza requerida. Los vehículos son, generalmente, materiales con altas capacidades de absorción, mientras que los diluyentes son generalmente materiales con baja capacidad de absorción. Los vehículos y diluyentes se utilizan en la formulación de polvos, polvos humectables, gránulos y gránulos dispersables en agua.

20 Los solventes orgánicos se utilizan principalmente en la formulación de concentrados emulsionables, formulaciones ULV (volumen ultra bajo) y, en menor grado, formulaciones granulares. A veces, se utilizan mezclas de solventes. Los primeros grupos principales de solventes son aceites parafínicos alifáticos como,
25 por ejemplo, querosene o parafinas refinadas. El segundo grupo principal comprende los solventes aromáticos como, por ejemplo, xileno y fracciones de mayor peso molecular de solventes aromáticos C9 y C10. Los hidrocarburos clorados son útiles como cosolventes para evitar la cristalización de los plaguicidas
30 cuando la formulación se emulsiona en agua. Los alcoholes se

utilizan a veces como cosolventes para aumentar el poder de los solventes.

Los espesantes o agentes gelantes se utilizan principalmente en la formulación de concentrados en suspensión, emulsiones y suspoemulsiones a los efectos de modificar la reología o las propiedades de flujo del líquido y evitar la separación y la sedimentación de las partículas o gotas dispersadas. Los agentes espesantes, gelantes, y antisedimentantes generalmente quedan comprendidos en dos categorías, a saber macropartículas insolubles en agua y polímeros solubles en agua. Es posible producir formulaciones de concentrados en suspensión con el uso de arcillas y silicatos. Los ejemplos de estos tipos de materiales incluyen, pero sin limitación, montmorillonita, bentonita, silicato de aluminio magnesio y atapulgita. Se han utilizado durante muchos años polisacáridos solubles en agua como agentes espesantes-gelificantes. Los tipos de polisacáridos utilizados más comúnmente son los extractos naturales de semillas y algas o son derivados sintéticos de celulosa. Los ejemplos de estos tipos de materiales incluyen, pero en forma no taxativa, goma guar; goma arábiga; carragenan; alginatos; metilcelulosa; carboximetilcelulosa de sodio (SCMC); hidroxietilcelulosa (HEC). Otros tipos de agentes de antisedimentación se basan en almidones modificados, poliacrilatos, alcohol de polivinilo y óxido de polietileno. Otro buen agente antisedimentante es la goma de xantan.

Los microorganismos pueden causar el deterioro de los productos formulados. Por lo tanto, se utilizan agentes conservantes para eliminar o reducir su efecto. Los ejemplos de estos agentes incluyen, pero en forma no taxativa: ácido propiónico y su sal de sodio; ácido sórbico y sus sales de sodio o potasio; ácido benzoico y su sal de sodio; sal de sodio del

ácido *p*-hidroxibenzoico; *p*-hidroxibenzoato de metilo; y 1,2-bencisotiazolin-3-ona (BIT).

La presencia de tensioactivos, que disminuyen la tensión de las interfases, con frecuencia genera una espuma de las formulaciones basadas en agua durante las operaciones de mezcla en la producción y aplicación a través de un tanque de atomización. A los efectos de reducir la tendencia al espumado, con frecuencia se agregan agentes antiespuma, ya sea durante la etapa de producción o antes del relleno en las botellas. Generalmente, existen dos tipos de agentes antiespuma, como, por ejemplo, siliconas y no siliconas. Las siliconas son generalmente emulsiones acuosas de dimetil polisiloxano, mientras que los agentes antiespuma que no son de silicona consisten en aceites insolubles en agua, como, por ejemplo, octanol y nonanol, o sílice. En ambos casos, la función del agente antiespuma consiste en desplazar el tensioactivo de la interfase aire-agua.

Para mayor información, véase "Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations" (Química y tecnología de las formulaciones agroquímicas), editado por D.A. Knowles, derecho de autor 1998 de Kluwer Academic Publishers. También, véase "Insecticides in Agriculture and Environment - Retrospects and Prospects" (Insecticidas en la agricultura y el medio ambiente, retrospectivas y perspectivas) de A.S. Perry, I. Yamamoto, I. Ishaaya, y R. Perry, derecho de autor 1998 de Springer-Verlag.

25 Aplicaciones

La cantidad real de un plaguicida que se desea aplicar en el lugar en el que se encuentran las plagas generalmente no es esencial y puede ser determinada por los expertos en la técnica. En general, se espera que las concentraciones de aproximadamente

0,01 gramos de plaguicida por hectárea hasta aproximadamente 5000 gramos de plaguicida por hectárea proporcionen un buen control.

El lugar en el que se aplica un plaguicida puede ser cualquier lugar habitado por una plaga como, por ejemplo, cultivos vegetales, árboles frutales y de frutos secos, vid, plantas ornamentales, animales domésticos, superficies internas o externas de los edificios, y el suelo que rodea a las construcciones o edificios. Controlar plagas significa generalmente que las poblaciones de la plaga, su actividad o ambas se encuentran reducidas en un lugar. Ello puede surgir cuando: las poblaciones de las plagas se repelen de un lugar; cuando las plagas resultan incapacitadas en un lugar o en las inmediaciones; o cuando las plagas son exterminadas, en forma total o parcial, en un lugar o las inmediaciones. Por supuesto, se puede dar una combinación de estos resultados. Generalmente, las poblaciones de las plagas, su actividad, o ambas se reducen deseablemente en más del cincuenta por ciento, con preferencia, más del 90 por ciento.

Generalmente, con los cebos, los cebos se colocan en la tierra en la que, por ejemplo, las termitas pueden tomar contacto con el cebo. Los cebos se pueden aplicar también a una superficie de una construcción o edificio (superficie horizontal, vertical, o inclinada) donde, por ejemplo, las hormigas, termitas, cucarachas, y moscas pueden tomar contacto con el cebo.

Debido a la única capacidad de los huevos de algunas plagas para resistir a las composiciones plaguicidas, pueden ser necesarias repetidas aplicaciones a fin de controlar las larvas recién nacidas.

El desplazamiento sistémico de los plaguicidas en las plantas se puede utilizar para controlar las plagas en una porción de la planta mediante la aplicación del plaguicida en una

porción diferente de la planta. Por ejemplo, el control de los insectos que se alimentan del follaje se puede realizar mediante una irrigación por goteo o aplicación en los surcos, o mediante el tratamiento de la semilla antes de sembrarse. El tratamiento de las semillas se puede aplicar a todos los tipos de semillas, con inclusión de aquellas de las cuales germinarán plantas transformadas genéticamente para expresar rasgos especializados. Los ejemplos representativos incluyen aquellas que expresan proteínas tóxicas para las plagas de invertebrados, como, por ejemplo, *Bacillus thuringiensis* u otras toxinas insecticidas, aquellas que expresan resistencia a herbicidas, como, por ejemplo, la semilla "Roundup Ready", o aquellas con genes extraños "apilados" que expresan toxinas insecticidas, resistencia a herbicidas, incrementadores de la nutrición o cualquier otro rasgo beneficioso. Además, esos tratamientos de semillas con la invención descrita en este documento pueden aumentar la capacidad de una planta para soportar mejor las condiciones de crecimiento estresantes. Ello resulta en una planta más saludable y vigorosa, que puede conducir a mayores rendimientos durante la cosecha.

Debería ser fácilmente evidente que la invención se puede utilizar con plantas transformadas genéticamente para expresar rasgos especializados, como, por ejemplo, *Bacillus thuringiensis* u otras toxinas insecticidas, o aquellas que expresan resistencia a herbicidas o con genes extraños "apilados" que expresan toxinas insecticidas, resistencia a herbicidas, aumento de la nutrición o cualquier otro rasgo beneficioso.

La invención descrita en este documento es adecuada para controlar endoparásitos o ectoparásitos en el sector de la medicina veterinaria o en el campo del mantenimiento de animales. Los compuestos se aplican de manera conocida, como, por ejemplo,

por administración oral en forma de, por ejemplo, comprimidos, cápsulas, bebidas, gránulos, por aplicación dérmica en forma, por ejemplo, de atomización, vertido, manchado y empolvoreado y por administración parenteral, por ejemplo, en forma de inyección.

5 La invención descrita en este documento se puede emplear también de manera ventajosa en el mantenimiento del ganado, por ejemplo, el ganado vacuno, ovino, porcino, en pollos y gansos. Las formulaciones adecuadas se administran oralmente a los animales con el agua para beber o en el alimento. Las dosis y
10 formulaciones adecuadas dependen de la especie.

 Antes de poder utilizar o vender comercialmente un plaguicida, ese plaguicida se somete a procesos de evaluación prolongados por parte de diversas autoridades gubernamentales (locales, regionales, estatales, nacionales, e internacionales).
15 Las autoridades reguladoras especifican numerosos requisitos de datos y éstos deben abordarse a través de la generación y presentación de datos por el registrante del producto o por cualquier otra persona en representación del registrante del producto. Estas autoridades gubernamentales revisan entonces esos
20 datos y si se concluye en la documentación de seguridad, proporcionan al futuro usuario o vendedor una aprobación de registro del producto. Por lo tanto, en esa localidad en la que se otorga y apoya el registro del producto, ese usuario o vendedor puede utilizar o vender ese plaguicida.

25 Los encabezados de este documento se proveen sólo por conveniencia y no deben utilizarse para interpretar ninguna parte del mismo.

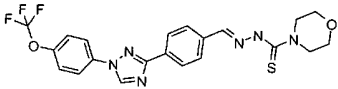
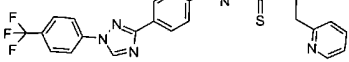
5



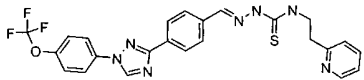
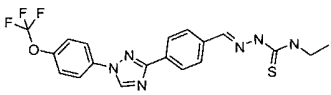
10

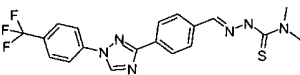
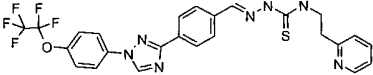


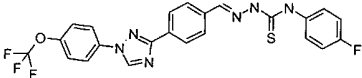
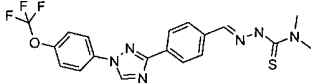
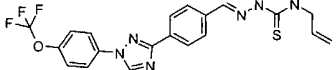
Tabla I

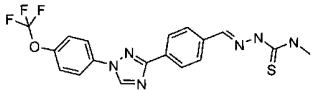
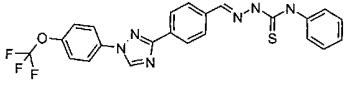
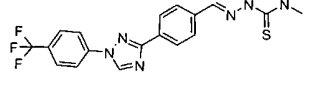
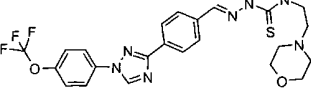
#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , □) ¹
4		C	461 (M+H)	107-114	10,50 (s, 1H), 9,42 (s, 1H), 8,16 (s, 1H), 8,14 (d, J = 8,1 Hz, 2H), 7,80 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,76 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,62 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 3,60 (t, J = 4,5 Hz, 4H), 3,42 (t, J = 4,2 Hz, 4H)
5		C	496 (M+H)	207-220	11,64 (s, 1H), 9,57 (s, 1H), 8,88 (t, J = 5,6 Hz, 1H), 8,63-8,50 (m, 1H), 8,20 (m, 5H), 8,13 (s, 1H), 8,00 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 7,94 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,40-7,19 (m, 2H), 3,93 (dd, J = 13,2, 7,0 Hz, 2H), 3,11 (t, J = 7,3 Hz, 2H)

109

#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , □) ¹
6		C	512 (M+H)	211-217	11,67 (s, 1H), 9,46 (s, 1H), 8,80 (br s, 2H), 8,41-8,38 (m, 1H), 8,15 (d, J = 8,0 Hz, 2H), 8,10 (d, J = 8,0 Hz, 2H), 7,93 (d, J = 8,0 Hz, 2H), 7,86-7,82 (m, 3H), 7,64 (d, J = 8,0 Hz, 2H), 4,07-4,02 (m, 2H), 3,36 (t, J = 8,0 Hz, 2H)
7		C	403 (M+H)	237-247	10,44 (s, 1H), 9,56 (s, 1H), 8,21 (d, J = 8,0 Hz, 2H), 8,14 (d, J = 8,0 Hz, 2H), 8,02 (d, J = 8,0 Hz, 2H), 7,89 (d, J = 8,0 Hz, 3H), 7,14 (t, J = 8,0 Hz, 1H), 3,25-3,16 (m, 2H), 1,10 (t, J = 8,0 Hz, 3H)

#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , □) ¹
8		C	419 (M+H)		10,43 (s, 1H), 9,43 (s, 1H), 8,13-8,07 (m, 4H), 7,88 (d, J = 8,0 Hz, 3H), 7,63 (d, J = 12,0 Hz, 2H), 7,13 (t, J = 8,0 Hz, 1H), 3,20-3,16 (m, 2H), 1,10 (t, J = 8,0 Hz, 3H)
9		C	562 (M+H)	221-227	11,64 (br s, 1H), 9,46 (s, 1H), 8,88 (t, J = 4,0 Hz, 1H), 8,58 (d, J = 4,0 Hz, 1H), 8,17 (d, J = 8,0 Hz, 2H), 8,11 (d, J = 8,0 Hz, 3H), 7,93 (d, J = 8,0 Hz, 2H), 7,76 (td, J = 8,0, 1,7 Hz, 1H), 7,64 (d, J = 8,0 Hz, 2H), 7,34 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 7,28 (dd, J = 8,0, 4,0 Hz, 1H), 3,92 (q, J = 8,0 Hz, 2H), 3,10 (t, J = 8,0 Hz, 2H)

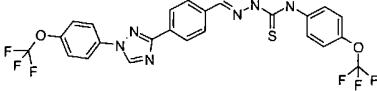
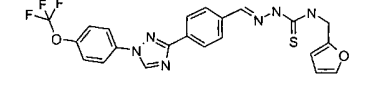
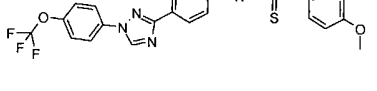
#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , □) ¹
10		C	501 (M+H)	194-196	(CDCl ₃) 9,65 (s, 1H), 9,12 (s, 1H), 8,60 (s, 1H), 8,27 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,90 (s, 1H), 7,81 (m, 4H), 7,62 (m, 2H), 7,41 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,15-7,09 (m, 2H)
11		C	435 (M+H)	151 dec	(CDCl ₃) 8,83 (s, 1H), 8,59 (s, 1H), 8,22 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,81 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,74-7,68 (m, 3H), 7,40 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 3,48 (s, 6H)
12		C	447 (M+H)	220-225	(CDCl ₃) 9,17 (s, 1H), 8,60 (s, 1H), 8,25 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,84-7,79 (m, 3H), 7,76 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,56 (s, 1H), 7,41 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 6,08-5,96 (m, 1H), 5,30 (m, J = 13,7, 11,6, 1,3 Hz, 2H), 4,43 (m, 2H)

#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , [D]) ¹
13		C	421 (M+H)	239-241	(CDCl ₃) 9,20 (s, 1H), 8,60 (s, 1H), 8,24 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,79 (m, 5H), 7,52 (s, 1H), 7,41 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 3,30 (s, J = 4,8 Hz, 3H)
14		C	483 (M+H)	215-220	(CDCl ₃) 9,47 (s, 1H), 9,23 (s, 1H), 8,60 (s, 1H), 8,27 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,91 (s, 1H), 7,81 (m, 4H), 7,70 (d, J = 7,6 Hz, 2H), 7,43 (m, 4H), 7,29 (d, J = 7,4 Hz, 1H)
15		C	404 (M+H)		[DMSO-d ₆] 9,20 (s, 1H), 8,77 (s, 1H), 8,19 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 7,94 (s, 1H), 7,86 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,78-7,64 (m, 4H), 7,58 (m, 1H), 3,21 (d, J = 4,9 Hz, 3H)
16		B	520 (M+H)	207-209	11,62 (s, 1H), 9,40 (s, 1H), 8,55 (br s, 1H), 8,19-8,06 (m, 5H), 7,92 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 7,62 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 3,78-3,58 (m, 6H), 2,58-2,42 (m, 6H)

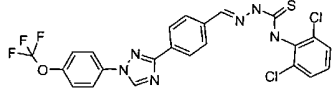
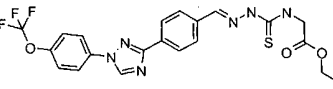
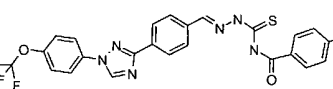
#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , [λ]) ¹
17		B	528 (M+H)	178-185	11,63 (s, 1H), 9,41 (s, 1H), 8,78 (br s, 1H), 8,18-8,02 (m, 6H), 7,94 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,68-7,58 (m, 3H), 6,99 (m, 1H), 6,82 (m, 1H), 4,44 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 3,98 (t, J = 7,1 Hz, 2H)
18		B	464 (M+H)	200-203	9,82 (s, 1H), 8,61 (s, 1H), 8,21 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,89 (s, 1H), 7,82-7,78 (m, 3H), 7,74 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,39 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 3,97 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 3,66 (t, J = 7,1 Hz, 2H), 3,42 (s, 3H)
19		B	492 (M+H)	212-215	11,57 (s, 1H), 9,42 (s, 1H), 8,88 (br s, 1H), 8,18-8,06 (m, 5H), 7,89 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,63 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 3,64-3,57 (m, 2H), 2,38 (t, J = 7,3 Hz, 2H), 2,19 (s, 6H), 1,76 (t, J = 7,1 Hz, 2H)

114

#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , Δ) ¹
23		A	446	220-222	11,60 (s, 1H), 9,44 (s, 1H), 8,39 (br s, 1H), 8,18-8,02 (m, 5H), 7,96 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 7,63 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 3,08 (m, 1H), 0,78 (m, 4H)
24		A	477 (M+H)	221-224	11,43 (s, 1H), 9,39 (s, 1H), 8,58 (br s, 1H), 8,14-7,99 (m, 5H), 7,95 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,62 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 3,59-3,49 (m, 2H), 1,68-1,55 (m, 2H), 1,39-1,22 (m, 4H), 0,98 (t, J = 7,2 Hz, 3H)
25		A	489 (M+H)	208-210	11,48 (s, 1H), 9,42 (s, 1H), 8,18-8,04 (m, 5H), 7,92 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 7,61 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 4,24-4,18 (m, 1H), 1,91-1,87 (m, 2H), 1,84-1,76 (m, 2H), 1,74-1,62 (m, 2H), 1,60-1,44 (m, 2H), 1,43-1,18 (m, 2H)

#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , □) ¹
26		A	566	204-206	11,99 (s, 1H), 10,24 (s, 1H), 9,41 (s, 1H), 8,22 (s, 1H), 8,18-8,00 (m, 6H), 7,67 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 7,58 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,37 (d, J = 8,2 Hz, 2H)
27		A	486	213-217	11,71 (s, 1H), 9,44 (s, 1H), 9,06 (br s, 1H), 8,18-8,03 (m, 5H), 7,97 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 7,64-7,58 (m, 3H), 6,41 (m, 1H), 6,28 (m, 1H), 4,83 (d, J = 6,0 Hz, 2H)
28		A	513 (M+H)	208-210	11,82 (s, 1H), 10,06 (s, 1H), 9,42 (s, 1H), 8,20 (s, 1H), 8,18-8,01 (m, 6H), 7,62 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 7,39 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 6,94 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 3,78 (s, 3H)

17

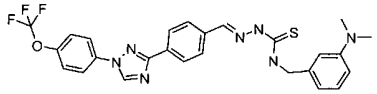
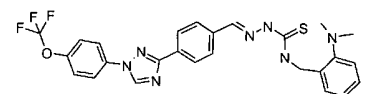
#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , Δ) ¹
29		A	551	209-211	12,06 (s, 1H), 10,19 (s, 1H), 9,42 (s, 1H), 8,22 (s, 1H), 8,17-8,03 (m, 5H), 7,66-7,57 (m, 4H), 7,42-7,38 (m, 2H)
30		A	492	233-235	11,82 (s, 1H), 9,42 (s, 1H), 8,89 (br s, 1H), 8,17-8,05 (m, 5H), 7,96 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,64 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 4,34 (d, J = 6,2 Hz, 2H), 4,17 (q, J = 7,3 Hz, 2H), 1,22 (t, J = 7,1 Hz, 3H)
31		A	555	154-157	12,78 (s, 1H), 11,32 (s, 1H), 9,39 (s, 1H), 8,38-8,02 (m, 9H), 7,61-7,54 (m, 4H)

118

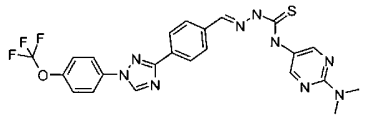
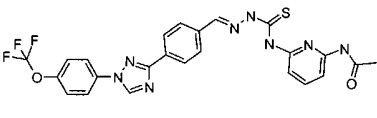
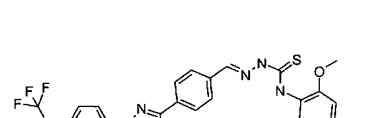
#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , □) ¹
32		A	550	228-230	12,12 (s, 1H), 10,38 (s, 1H), 9,44 (s, 1H), 8,26 (s, 1H), 8,18 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 8,14-8,03 (m, 4H), 7,92 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 7,61 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,64 (d, J = 8,2 Hz, 2H)
33		A	525 (M+H)	233-236	12,12 (s, 1H), 10,38 (s, 1H), 9,43 (s, 1H), 8,24 (s, 1H), 8,12 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 8,10-8,02 (m, 4H), 7,96 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,82 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,61 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 2,58 (s, 3H)
34		A	531 (M+H)	230-232	11,72 (s, 1H), 9,41 (s, 1H), 9,18 (br s, 1H), 8,16-8,02 (m, 5H), 7,97 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,63 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,38 (m, 4H), 4,84 (d, J = 6,2 Hz, 2H)

119

#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , [I]) ¹
35		A	484 (M+H)	221-224	10,82 (s, 1H), 9,43 (s, 1H), 9,04 (s, 1H), 8,18-7,97 (m, 7H), 7,69-7,58 (m, 4H), 7,18-7,06 (m, 2H)
36		A	576 (M+H)	200-203	11,78 (s, 1H), 9,98 (s, 1H), 9,42 (s, 1H), 8,19-8,02 (m, 7H), 7,64 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 7,28 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 6,73 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 2,91 (s, 6H)
37		B	540 (M+H)	193-196	11,61 (s, 1H), 9,42 (s, 1H), 9,00 (br s, 1H), 8,17-8,04 (m, 5H), 7,94 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,63 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,22 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 6,65 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 4,74 (d, J = 6,0 Hz, 2H), 2,86 (s, 6H)

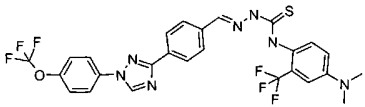
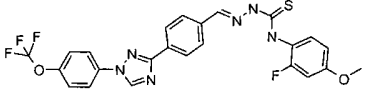
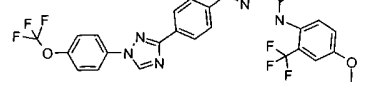
#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , Δ) ¹
38		B	540 (M+H)	181-183	11,64 (s, 1H), 9,41 (s, 1H), 9,08 (br s, 1H), 8,18-8,02 (m, 4H), 7,97 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,62 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,16 (m, 2H), 6,78 (br s, 1H), 6,64-6,55 (m, 2H), 4,79 (d, J = 6,0 Hz, 2H), 2,84 (s, 6H)
39		B	540 (M+H)	165-167	11,74 (s, 1H), 9,41 (s, 1H), 9,18 (br s, 1H), 8,17-8,04 (m, 4H), 7,93 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 7,63 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,24-7,18 (m, 4H), 7,03 (m, 1H), 4,92 (d, J = 6,2 Hz, 2H), 2,68 (s, 6H)

121

#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , □) ¹
43		B	528 (M+H)	219-222	12,02 (s, 1H), 10,03 (s, 1H), 9,42 (s, 1H), 8,38 (s, 2H), 8,22-8,01 (m, 7H), 7,63 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 3,17 (s, 6H)
44		B	541 (M+H)	206-209	12,22 (s, 1H), 10,46 (s, 1H), 9,98 (s, 1H), 9,42 (s, 1H), 8,84 (br s, 1H), 8,31-8,18 (m, 3H), 8,12-8,04 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 7,98-7,63 (m, 4H), 7,61 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 2,06 (s, 3H)
45		B	543 (M+H)	193-196	11,82 (s, 1H), 9,81 (s, 1H), 9,42 (s, 1H), 8,21-8,14 (m, 3H), 8,08 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,96 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,74 (m, 1H), 7,63 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 6,64 (m, 1H), 6,57 (m, 1H), 3,82 (s, 3H), 3,78 (s, 3H)

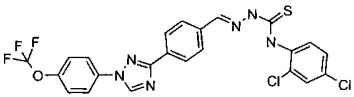
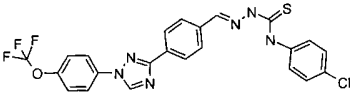
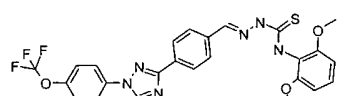
123

#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , Δ) ¹
46		B	527 (M+H)	198-201	11,81 (s, 1H), 9,96 (s, 1H), 9,41 (s, 1H), 8,18 (s, 1H), 8,14-8,02 (m, 6H), 7,62 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 7,18 (m, 1H), 6,84 (m, 1H), 6,77 (m, 1H), 3,78 (s, 3H), 2,21 (s, 3H)
47		B	518	209-211	12,20 (s, 1H), 9,89 (s, 1H), 9,43 (s, 1H), 8,22 (s, 1H), 8,19-8,01 (m, 6H), 7,61 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 7,48-7,39 (m, 1H), 7,23 (m, 2H)
48		B	640	198-201	12,04 (s, 1H), 10,22 (s, 1H), 9,41 (s, 1H), 8,23 (s, 1H), 8,18-8,04 (m, 6H), 7,76 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 7,63 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,22 (m, 1H)

#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , □) ¹
49		B	594 (M+H)	205-208	11,98 (s, 1H), 9,82 (s, 1H), 9,41 (s, 1H), 8,19-7,96 (m, 7H), 7,62 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 7,31 (m, 1H), 6,98 (m, 1H), 6,84 (m, 1H), 2,99 (s, 6H)
50		B	531 (M+H)	198-201	11,98 (s, 1H), 9,96 (s, 1H), 9,43 (s, 1H), 8,20 (s, 1H), 8,17-8,03 (m, 6H), 7,63 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,34 (m, 1H), 6,96 (m, 1H), 6,78 (m, 1H), 3,78 (s, 3H)
51		B	581 (M+H)	205-208	12,03 (s, 1H), 9,97 (s, 1H), 9,42 (s, 1H), 8,18 (s, 1H), 8,16-8,01 (m, 6H), 7,62 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,48 (m, 1H), 7,33-7,18 (m, 2H), 3,84 (s, 3H)

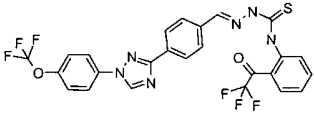
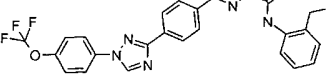
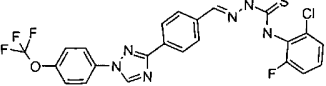
125

126

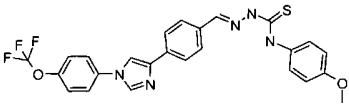
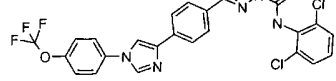
#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , □) ¹
55		B	551	215-218	12,17 (s, 1H), 10,17 (s, 1H), 9,41 (s, 1H), 8,22 (s, 1H), 8,17-7,98 (m, 6H), 7,74-7,58 (m, 4H), 7,43 (m, 1H)
56		B	517 (M+H)	214-217	11,98 (s, 1H), 10,22 (s, 1H), 9,41 (s, 1H), 8,21 (s, 1H), 8,19-8,03 (m, 8H), 7,63 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,42 (d, J = 8,3 Hz, 2H)
57		B	543 (M+H)	197-199	11,76 (s, 1H), 9,42 (s, 1H), 9,38 (s, 1H), 8,17-8,01 (m, 7H), 7,61 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,23 (m, 1H), 6,68 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 3,78 (s, 6H)

121

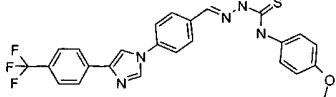
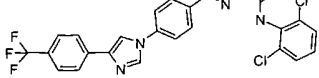
#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , □) ¹
58		B	527 (M+H)	195-197	11,81 (s, 1H), 10,07 (s, 1H), 9,42 (s, 1H), 8,19 (s, 1H), 8,16-8,01 (m, 6H), 7,63 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,38 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 6,91 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 4,04 (q, J = 7,3 Hz, 2H), 1,38 (t, J = 7,2 Hz, 3H)
59		B	518 (M+H)	202-204	12,28 (s, 1H), 10,32 (s, 1H), 9,42 (s, 1H), 8,46 (m, 1H), 8,24 (s, 1H), 8,21-7,96 (m, 8H), 7,63 (d, J = 8,2 Hz, 2H)
60		B	608 (M+H)	135 dec	10,86 (s, 1H), 10,04 (s, 1H), 9,41 (s, 1H), 8,18 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 8,14-8,02 (m, 3H), 7,84-7,78 (m, 3H), 7,62 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,42 (m, 1H), 7,33 (m, 1H), 7,12 (m, 1H)

#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , □) ¹
61		B	579 (M+H)	128 dec	(CDCl ₃) 10,09 (s, 1H), 8,62 (m, 2H), 8,38 (d, J = 8,2 Hz, 1H), 8,31 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 8,01 (d, J = 8,5 Hz, 1H), 7,85-7,76 (m, 6H), 7,41 (m, 3H)
62		B	511 (M+H)	189-194	(CDCl ₃) 9,06 (s, 1H), 8,63 (s, 1H), 8,26 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,93 (s, 1H), 7,85-7,76 (m, 5H), 7,70 (s, 1H), 7,41 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,32-7,27 (m, 3H), 2,73 (q, J = 7,6 Hz, 2H), 1,30 (t, J = 7,6 Hz, 3H)
63		B	535 (M+H)	175-187	11999688 (CDCl ₃) 9,49 (s, 1H), 8,63 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 8,26 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,91 (s, 1H), 7,86-7,79 (m, 4H), 7,41 (d, J = 8,1 Hz, 2H), 7,33 (d, J = 8,2 Hz, 2H)

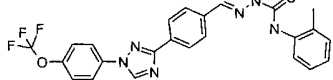
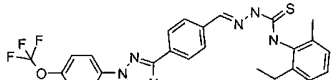
#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , δ) ¹
64		B	573 (M+H)	190 dec	12,47 (s, 1H), 10,07 (s, 1H), 9,45 (s, 1H), 8,25 (s, 1H), 8,23-8,02 (m, 6H), 7,64 (d, J = 8,4 Hz, 2H)
65		B	531 (M+H)	197-205	(CDCl ₃) 11,65 (s, 1H), 9,88 (s, 1H), 8,93 (dd, J = 8,2, 1,4 Hz, 1H), 8,70 (s, 1H), 8,24 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 8,18 (s, 1H), 7,89-7,80 (m, J = 15,8, 8,7 Hz, 4H), 7,41 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,34-7,31 (m, 1H), 7,28-7,16 (m, 1H), 2,45 (s, 3H)
66		B	567 (M+H)	200-210	(CDCl ₃) 11,65 (s, 1H), 9,88 (s, 1H), 8,93 (dd, J = 8,2, 1,4 Hz, 1H), 8,70 (s, 1H), 8,24 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 8,18 (s, 1H), 7,89-7,79 (m, 5H), 7,45-7,38 (m, J = 8,3 Hz, 3H), 7,21 (dd, J = 8,4, 1,5 Hz, 1H)

#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , □) ¹
67		C	513 (M+2) 510 (M-1)	199-200	11,74 (br s, 1H), 10,87 (br s, 1H), 10,04 (s, 1H), 8,43 (dd, J= 10,2, 1,2 Hz, 2H), 8,16 (s, 1H), 7,87-7,96 (m, 6H), 7,60 (d, J = 8,1 Hz, 2H), 7,41 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 6,95 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 3,78 (s, 3H)
68		C	552 (M+2)	195-196	12,02 (br s, 1H), 10,12 (br s, 1H), 8,46 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 8,42 (d, J= 1,2 Hz, 1H), 8,16 (s, 1H), 7,86-7,96 (m, 6H), 7,60 (d, J = 7,8 Hz, 2H), 7,57 (d, J = 7,8 Hz, 2H), 7,39 (dd, J = 8,7, 7,5 Hz, 1H)

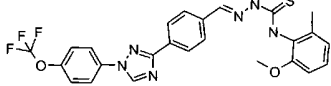
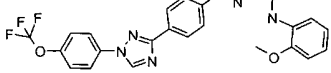
131

#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , □) ¹
69		C	495	209-210	11,77 (br s, 1H), 10,10 (br s, 1H), 8,57 (s, 1H), 8,52 (d, J= 1,5 Hz, 1H), 8,16 (s, 1H), 8,15 (d, J = 5,4 Hz, 2H), 8,06 (d, J = 4,8 Hz, 2H), 7,80 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,38 (d, J = 7,2 Hz, 2H), 7,37 (d, J = 6,9 Hz, 2H), 6,92 (dd, J = 8,2, 2,1Hz, 1H), 3,76 (s, 3H)
70		C	536 (M+2) 535 (M+H)	218-219	12,07 (br s, 1H), 10,18 (br s, 1H), 8,57 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 8,52 (d, J= 1,2 Hz, 1H), 8,17 (s, 1H), 8,05-8,17 (m, 4H), 7,80 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,75 (d, J = 8,4Hz, 2H), 7,55 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,39 (dd, J = 9,3 Hz, 1H)

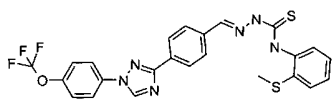
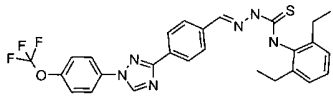
132

#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , □) ¹
71		B		189-198	(CDCl ₃) 9,57 (s, 1H), 9,02 (s, 1H), 8,60 (s, 1H), 8,26 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,93 (s, 1H), 7,85 (m, 4H), 7,71 (d, J = 7,5 Hz, 1H), 7,41 (d, J = 8,9 Hz, 2H), 7,34-7,24 (m, 3H), 2,39 (s, 3H)
72		B		198-218	(CDCl ₃) 9,55 (s, 1H), 8,70 (s, 1H), 8,60 (s, 1H), 8,3 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,9 (s, 1H), 7,85-7,7 (m, 4H), 7,4 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,25-7,20 (m, 3H), 2,75 (q, J = 7 Hz, 2H), 2,45 (s, 3H), 1,30 (t, J = 7 Hz, 3H)

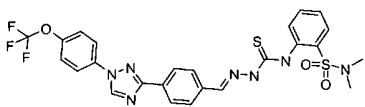
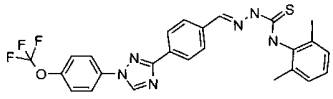
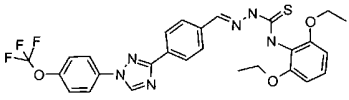
133

#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , □) ¹
73		B		184-190	(CDCl ₃) 9,42 (s, 1H), 8,60 (s, 2H), 8,26 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,88 (s, 1H), 7,85 - 7,74 (m, 4H), 7,41 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,3-7,25 (m, 1H), 6,92 (d J = 8,1 Hz, 1H), 6,85 (d J = 8,1 Hz, 1H), 3,85 (s, 3H), 2,38 (s, 3H)
74		B	513 (M+1)	195-208	(CDCl ₃) 9,00 (s, 1H), 8,85 (d, J = 8,2 Hz, 1H), 8,60 (s, 1H), 8,28 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,90-7,75 (m, 5H), 7,41 (d, J = 8,9 Hz, 2H), 7,26 (m, 1H), 7,17 (t, J = 7,8 Hz, 1H), 7,09-6,92 (m, 2H), 3,99 (s, 3H)

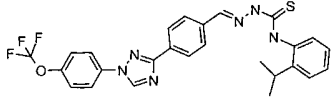
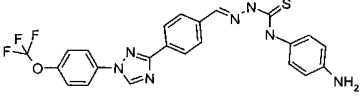
134

#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , □) ¹
75		B	529 (M+H)	170-230 dec	(CDCl ₃) 11,45 (s, 1H), 10,24 (s, 1H), 8,70 (s, 1H), 8,62 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 8,25 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 8,16 (s, 1H), 7,94-7,81 (m, 4H), 7,59-7,09 (m, 5H), 2,45 (s, 3H)
76		B	539 (M+1)	212-219	(CDCl ₃) 9,41 (s, 1H), 8,71 (s, 1H), 8,60 (s, 1H), 8,26 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,91 (s, 1H), 7,86-7,69 (m, 4H), 7,41 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,36-7,16 (m, 3H), 2,71 (q, J = 7,6 Hz, 4H), 1,27 (t, J = 7,6 Hz, 6H)

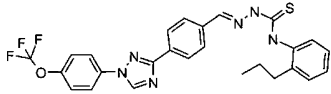
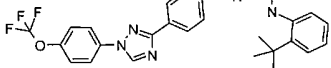
135

#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , □) ¹
77		B	570 (M+1)	213-215	(CDCl ₃) 11,11 (s, 1H), 9,16 (s, 1H), 8,71 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 8,60 (s, 1H), 8,29 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 8,01-7,77 (m, 5H), 7,66 (t, J = 7,9 Hz, 1H), 7,46-7,29 (m, 3H), 2,75 (s, 6H)
78		C	511 (M+1)	220-225	(CDCl ₃) 9,30 (s, 1H), 8,69 (s, 1H), 8,60 (s, 1H), 8,26 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,89 (s, 1H), 7,81 (m, 4H), 7,41 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,19 (m, 3H), 2,35 (s, 6H)
79		B	496 (M+H)	206-208	11,78 (s, 1H), 9,41 (s, 1H), 9,37 (s, 1H), 8,22-7,99 (m, 6H), 7,63 (d, J = 8,26 Hz, 2H), 7,23 (m, 1H), 6,70 (d, J = 8,24 Hz, 2H), 6,48 (m, 1H), 4,12-3,98 (m, 4H), 1,39-1,22 (m, 6H)

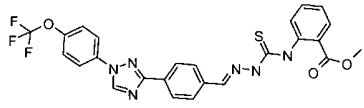
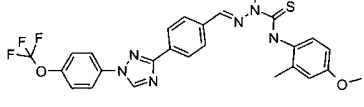
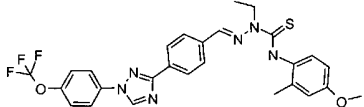
136

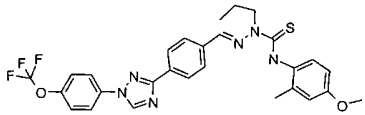
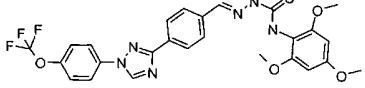
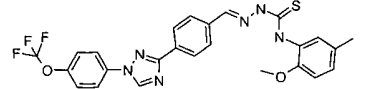
#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , □) ¹
80		B	525 (M+H)	168-180	(CDCl ₃) 10,2 (s, 1H), 9,07 (s, 1H), 8,63 (s, 1H), 8,25 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 8,0 (s, 1H), 7,9-7,7 (m, 4H), 7,65 (d, J = 8 Hz, 1H), 7,4-7,25 (m, 5H), 3,25 (heptet, J = 7 Hz, 1H), 1,35 (d, J = 7 Hz, 6H)
81		B	498 (M+H)	191-195	11,72 (s, 1H), 9,96 (s, 1H), 9,42 (s, 1H), 8,21-8,01 (m, 5H), 7,63 (d, J = 8,26 Hz, 2H), 7,08 (d, J = 8,22 Hz, 2H), 6,58 (d, J = 8,22 Hz, 2H), 5,19 (br s, 2H)

13x

#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , Δ) ¹
82		B		184-189	9,5 (br s, 1H), 9,11 (s, 1H), 8,61 (s, 1H), 8,27 (d, J = 8 Hz, 2H), 7,92 (s, 1H), 7,81 (m, 5H), 7,41 (d, J = 8 Hz, 2H), 7,28 (m, 3H), 2,67 (t, J = 8 Hz, 2H), 1,70 (m, 2H), 1,01 (t, J = 7,5 Hz, 3H)
83		B	536 (M-H)	--	(CDCl ₃) 10,1 (s, 1H), 8,62 (s, 1H), 8,4 (s, 1H), 8,36 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 8,03 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 7,85 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,45-7,38 (m, 3H), 7,30-7,19 (m, 3H), 6,9 (d, J = 7 Ha, 1H), 1,50 (s, 9H)

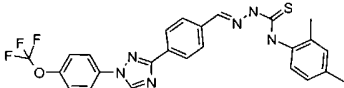
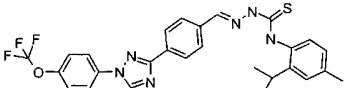
138

#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , □) ¹
84		B	541 (M+1)	160-170	12,25 (s, 1H), 12,24 (s, 1H), 20117139,5 (s, 1H), 9,23 (s, 1H), 8,4-8,05 (m, 8H), 7,68 (m, 3H), 7,4 (t, J = 7 Hz, 1H), 3,50 (s, 3H)
85		A	541 (M+H)	171-173	10,22 (s, 1H), 9,41 (s, 1H), 8,23-8,04 (m, 7H), 7,62 (d, J = 8,24 Hz, 2H), 7,10 (m, 1H), 6,83-6,77 (m, 2H), 3,96 (s, 3H), 3,78 (s, 3H), 2,00 (s, 3H)
86		A	555 (M+H)	188-190	10,17 (s, 1H), 9,42 (s, 1H), 8,23 (d, J = 8,26 Hz, 2H), 8,17-8,03 (m, 5H), 7,63 (d, J = 8,24 Hz, 2H), 7,11 (m, 1H), 6,85-6,76 (m, 2H), 4,68 (q, J = 7,26 Hz, 2H), 3,78 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 1,24 (t, J = 7,36 Hz, 3H)

#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , □) ¹
87		A	569 (M+H)	195-197	10,18 (s, 1H), 9,41 (s, 1H), 8,23 (d, J = 8,26 Hz, 2H), 8,17-8,05 (m, 5H), 7,63 (d, J = 8,24 Hz, 2H), 7,12 (m, 1H), 6,86-6,78 (m, 2H), 4,61-4,58 (m, 2H), 3,79 (s, 3H), 2,18 (s, 3H), 1,76-1,60 (m, 2H), 1,01-0,97 (t, J = 7,38 Hz, 3H)
88		B	573 (M+1)	--	11,72 (s, 1H), 9,44 (s, 1H), 9,28 (s, 1H), 8,14-8,1 (m, 7H), 7,63 (d, J = 8 Hz, 2H), 7,63 (s, 2H), 3,81 (s, 3H), 3,74 (s, 6H)
89		B	527 (M+H)	210-217	11,96 (s, 1H), 10,0 (s, 1H), 9,42 (s, 1H), 8,2-7,9 (m, 8H), 7,6 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 6,96 (s, 2H), 3,85 (s, 3H), 4,27 (s, 3H)

II

#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , □) ¹
92		B	497 (M+1)	204-211	11,88 (s, 1H), 10,13 (s, 1H), 9,44 (s, 1H), 8,21 (s, 1H), 8,15 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 8,11-8,04 (m, 4H), 7,64 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 7,43 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 7,19 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 2,32 (s, 3H)
93		B	525 (M+1)	218-225	(CDCl ₃) 9,37 (s, 1H), 8,63 (s, 1H), 8,60 (s, 1H), 8,26 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,89 (s, 1H), 7,85-7,76 (m, 4H), 7,41 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 6,97 (s, 2H), 2,32 (s, 3H), 2,30 (s, 6H)
94		B	513 (M+1)	80 dec	11,94 (s, 1H), 10,15 (s, 1H), 9,44 (s, 1H), 8,22 (s, 1H), 8,20-8,02 (m, 6H), 7,64 (d, J = 8,7 Hz, 2H), 7,28 (m, 2H), 7,19 (d, J = 8,6 Hz, 1H), 6,80 (d, J = 6,5 Hz, 1H), 3,78 (s, 3H)

#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , □) ¹
95		B	511 (M+1)	201-207	(CDCl ₃) 9,26 (s, 1H), 8,92 (s, 1H), 8,60 (s, 1H), 8,26 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,88 (s, 1H), 7,84-7,77 (m, 4H), 7,50 (d, J = 7,8 Hz, 1H), 7,41 (m 2H), 7,14-7,07 (m, 2H), 2,36 (s, 3H), 2,34 (s, 3H)
96		B		205 dec	(CDCl ₃) 9,82 (s, 1H), 8,60 (s, 1H), 8,26 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,96 (s, 1H), 7,85-7,75 (m, 5H), 7,40 (d, J = 8,8 Hz, 2H), 7,34-7,23 (m, 2H), 7,16 (d, J = 7,2 Hz, 1H), 3,23-3,12 (m, 1H), 2,36 (s, 3H), 1,33 (d, J = 6,8 Hz, 3H), 1,23 (d, J = 6,9 Hz, 3H)

#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , □) ¹
97		C	561 (M+H)	234-238	(CDCl ₃) 9,62 (s, 1H), 8,70 (s, 1H), 8,60 (s, 1H), 8,26 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,92 (s, 1H), 7,86-7,75 (m, 4H), 7,41 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,18 (m, 3H), 2,35 (s, 6H)
98		B	537 (M+H)	200-205	12,2 (s, 1H), 10,85 (s, 1H), 9,39 (s, 1H), 8,20 (s, 1H), 8,18-7,97 (m, 6H), 7,6 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 7,45 (m, 2H)
99		B		190 dec	12,05 (s, 1H), 10,17 (s, 1H), 9,44 (s, 1H), 8,37 (d, J = 3,7 Hz, 1H), 8,22 (s, 1H), 8,20-8,00 (m, 6H), 7,75-7,57 (m, 3H), 7,38-7,24 (m, 1H), 2,44 (s, 3H)

14

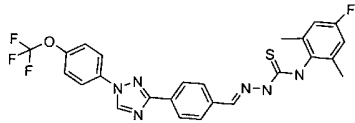
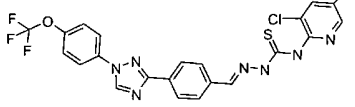
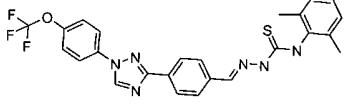
145

14b

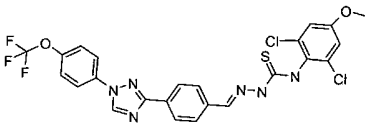
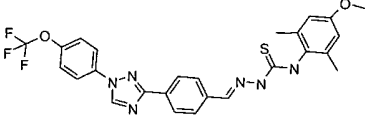
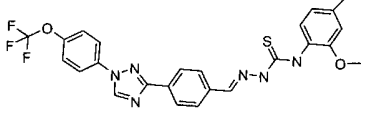
#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , □) ¹
106		B	526 (M+1)	195-207	11,97 (s, 1H), 9,96 (s, 1H), 9,40 (s, 1H), 8,21 (s, 1H), 8,19-8,02 (m, 6H), 7,63 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 7,0 (s, 1H), 2,38 (s, 3H), 2,26 (s, 3H), 2,15 (s, 3H)
107		B	567 (M+H)	217-224	11,80 (s, 1H), 9,85 (s, 1H), 9,40 (s, 1H), 8,2 (s, 1H), 8,18-8,0 (m, 6H), 7,6 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,5-7,1 (m, 3H), 3,05 (m, 2H), 1,17 (m, 12H)
108		B	549 (M+H)	206-213	12,14 (s, 1H), 10,88 (s, 1H), 10,42 (s, 1H), 8,22 (s, 1H), 8,2-8,0 (m, 6H), 7,65 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 6,87 (d, J = 9 Hz, 2H), 3,82 (s, 3H)

47

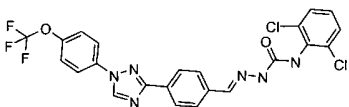
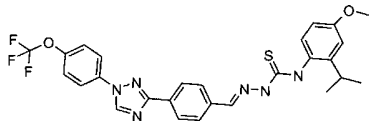
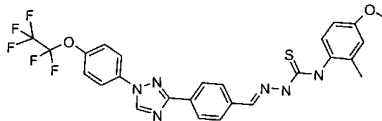
148

#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , □) ¹
112		B	529 (M+H)	214 dec	11,89 (s, 1H), 10,90 (s, 1H), 9,42 (s, 1H), 8,21 (s, 1H), 8,2-8,0 (m, 6H), 7,6 (d, J = 8 4 Hz, 2H), 6,99 (d, J = 9 Hz, 2H), 2,2 (s, 6H)
113		B	552	142-162 dec	12,16 (s, 1H), 10,52 (s, 1H), 9,43 (s, 1H), 8,59 (s, 1H), 8,40 (s, 1H), 8,25-8,0 (m, 7H), 7,6 (d, J = 8,4 Hz, 2H)
114		B	545 (M+H)	238-245	11,89 (s, 1H), 9,90 (s, 1H), 9,42 (s, 1H), 8,21 (s, 1H), 8,2-8,0 (m, 6H), 7,6 (d, J = 8 4 Hz, 2H), 7,20 (s, 2H), 2,2 (s, 6H)

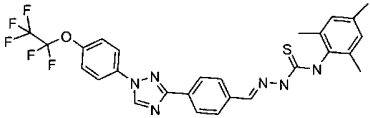
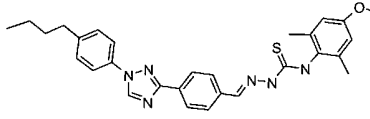
149

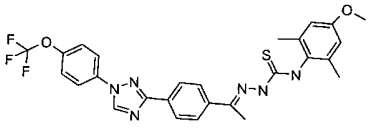
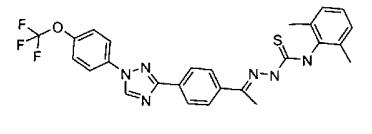
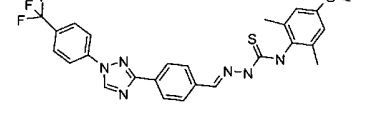
#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , [L]) ¹
115		B	581	195-199	(CDCl ₃) 10,2 (s, 1H), 8,7 (s, 1H), 8,6 (s, 1H), 8,25 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 8,0 (s, 1H), 7,82 (m, 4H), 7,4 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,0 (s, 2H), 3,82 (s, 3H)
116		C	541 (M+H)	202-210	(CDCl ₃) 9,88 (s, 1H), 8,61 (s, 1H), 8,60 (s, 1H), 8,27 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,9 (s, 1H), 7,9-7,7 (m, 4H), 7,4 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 6,7 (s, 2H), 3,81 (s, 3H), 2,33 (s, 6H)
117		C	527 (M+H)	210-214	(CDCl ₃) 9,89 (s, 1H), 9,02 (s, 1H), 8,6 (m, 3H), 8,3 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 7,9-7,8 (m, 4H), 7,43 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 6,85 (d, J = 6 Hz, 1H), 6,8 (s, 1H), 3,95 (s, 3H), 2,38 (s, 3H)

#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , □) ¹
118		B	509 (M+H)	246-249	10,65 (s, 1H), 10,07 (s, 1H), 9,40 (s, 1H), 8,5 (s, 1H), 8,15-7,9 (m, 6H), 7,61 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 6,89 (s, 2H), 2,27 (s, 3H), 2,19 (s, 6H)
119		C	calcd for C ₂₅ H ₂₁ F ₃ N ₆ O ₃ , 510.1627; found, 510.165	240-241	10,72 (s, 1H), 9,41 (s, 1H), 8,49 (s, 1H), 8,14 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 8,09 (d, J = 9,1 Hz, 2H), 8,00 (s, 1H), 7,94 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,62 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,37 (d, J = 8,7 Hz, 1H), 6,83 (d, J = 2,8 Hz, 1H), 6,76 (dd, J = 8,7, 2,9 Hz, 1H), 3,74 (s, 3H), 2,25 (s, 3H)

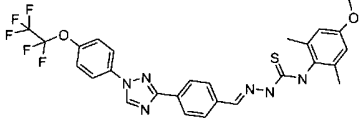
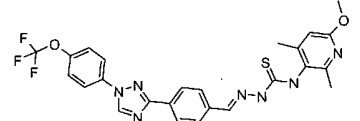
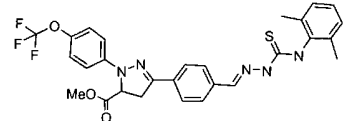
#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , □) ¹
120		C	535 (M+H)	222-223	10,92 (s, 1H), 9,42 (s, 1H), 9,03 (s, 1H), 8,13 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 8,09 (d, J = 9,1 Hz, 2H), 7,99 (s, 2H), 7,97 (s, 1H), 7,63 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,56 (d, J = 8,1 Hz, 2H), 7,41-7,32 (m, 1H)
121		B	555 (M+H)	186-192	(CDCl ₃) 10,42 (s, 1H), 8,88 (s, 1H), 8,60 (s, 1H), 8,22 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 8,0 (s, 1H), 7,9-7,7 (m, 4H), 7,45-7,38 (m, 3H), 6,9-6,7 (m, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,12 (m, 1H), 1,25 (d, J = 6,5 Hz, 6H)
122		C	577 (M+H)	197-200	(CDCl ₃) 10,2 (s, 1H), 8,90 (s, 1H), 8,62 (s, 1H), 8,25 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,98 (s, 1H), 7,9-7,7 (m, 4H), 7,4 (m, 3H), 6,8 (m, 2H), 3,82 (s, 3H), 2,37 (s, 3H)

152

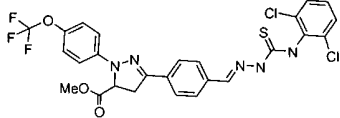
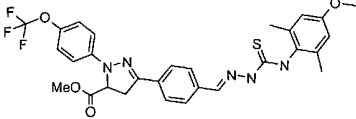
#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , □) ¹
123		B	575 (M+H)	237-240	(CDCl ₃) 9,85 (s, 1H), 8,63 (s, 1H), 8,60 (s, 1H), 8,26 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,89 (s, 1H), 7,85-7,76 (m, 4H), 7,41 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 6,97 (s, 2H), 2,32 (s, 3H), 2,30 (s, 6H)
124		C	513 (M+H)	240-248	(CDCl ₃) 9,57 (s, 1H), 8,60 (s, 1H), 8,54 (s, 1H), 8,26 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,91 (s, 1H), 7,77 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,64 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 7,33 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 6,69 (s, 2H), 3,81 (s, 3H), 2,76 - 2,59 (m, 2H), 2,31 (s, 6H), 1,75-1,57 (m, 2H), 1,48 -1,30 (m, 2H), 0,95 (t, J = 7,3 Hz, 3H)

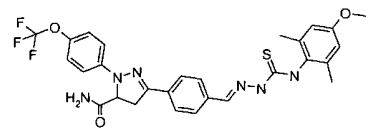
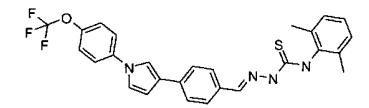
#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , □) ¹
125		C	555 (M+H)	206-209	(CDCl ₃) 8,90 (s, 1H), 8,80 (s, 1H), 8,6 (s, 1H), 8,28 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 8,9-8,7 (m, 4H), 7,4 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 6,7 (s, 2H), 3,80 (s, 3H), 2,39 (s, 3H), 2,32 (s, 6H)
126		C	525 (M+H)	209-215	(CDCl ₃) 8,92 (s, 1H), 8,90 (s, 1H), 8,80 (s, 1H), 8,26 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 8,9-8,8 (m, 4H), 7,4 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 7,25-7,15 (m, 3H), 2,40 (s, 3H), 2,36 (s, 6H)
127		C	525 (M+H)	230-240	(CDCl ₃) 9,93 (s, 1H), 8,69 (s, 1H), 8,60 (s, 1H), 8,26 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,93 (d, J = 9,5 Hz, 2H), 7,95 (s, 1H), 7,86-7,75 (m, 4H), 6,69 (s, 2H), 3,81 (s, 3H), 2,31 (s, 6H)

154

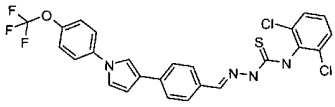
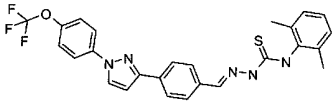
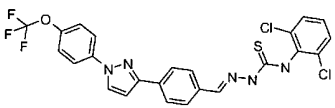
#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , □) ¹
128		C	592 (M+H)	233-236	(CDCl ₃) 9,89 (s, 1H), 8,60 (s, 2H), 8,25 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 7,95 (s, 1H), 7,88-7,70 (m, 4H), 7,41 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 6,70 (s, 2H), 3,81 (s, 3H), 2,31 (s, 6H)
129		C	542 (M+1)	215-219	(CDCl ₃) 9,98 (s, 1H), 8,63-8,52 (m, 2H), 8,26 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 7,97 (s, 1H), 7,84-7,69 (m, 4H), 7,46-7,32 (m, 2H), 6,53 (s, 1H), 3,93 (s, 3H), 2,45 (s, 3H), 2,29 (s, 3H)
130		C	570 (M+H)	221-223	11,82 (s, 1H), 9,98 (s, 1H), 8,17 (s, 1H), 7,97 (d, J = 8,26 Hz, 2H), 7,76 (d, J = 8,26 Hz, 2H), 7,29 (d, J = 8,22 Hz, 2H), 7,18-7,04 (m, 5H), 5,22-5,16 (m, 1H), 3,88-3,76 (m, 1H), 3,71 (s, 3H), 3,64-3,58 (m, 1H), 2,21 (s, 6H)

15

#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , □) ¹
131		C	611 (M+H)	215-217	12,03 (s, 1H), 10,21 (s, 1H), 8,17 (s, 1H), 7,98 (d, J = 8,24 Hz, 2H), 7,76 (d, J = 8,24 Hz, 2H), 7,59-7,56 (m, 2H), 7,41-7,39 (m, 1H), 7,27 (d, J = 8,26 Hz, 2H), 7,08 (d, J = 8,26 Hz, 2H), 5,22-5,19 (m, 1H), 3,84-3,76 (m, 1H), 3,71 (s, 3H), 3,64-3,59 (m, 1H)
132		C	601 (M+H)	205-211	(CDCl ₃) 9,31 (s, 1H), 8,69 (s, 1H), 8,56 (s, 1H), 8,03-7,40 (m, 6H), 7,18 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 6,69 (s, 2H), 4,87 (dd, J = 12,7, 6,6 Hz, 1H), 3,72 (s, 3H), 3,9-3,6 (m, 2H), 3,49 (s, 3H), 2,23 (s, 6H)

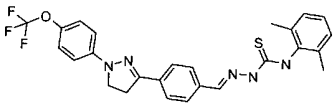
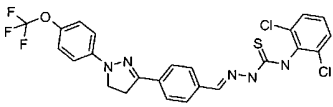
#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , □) ¹
133		C	585 (M+H)	250 dec	(CDCl ₃) 9,27 (s, 1H), 8,69 (s, 1H), 8,56 (s, 1H), 8,05-7,55 (m, 6H), 7,24- 6,96 (m, 2H), 6,69 (s, 2H), 6,22 (s, 1H), 5,40 (s, 1H), 4,62 (m, 1H), 3,9-3,75 (m, 1H), 3,81 (s, 3H), 3,52-3,42 (m, 1H), 2,30 (s, 6H)
134		C	509 (M+H)	200-202	11,78 (s, 1H), 9,81 (s, 1H), 8,17 (s, 1H), 8,06 (s, 1H), 7,84 (d, J = 8,24 Hz, 2H), 7,81 (d, J = 8,26 Hz, 2H), 7,76 (d, J = 8,24 Hz, 2H), 7,53-7,48 (m, 3H), 7,13-7,09 (m, 2H), 7,04-7,02 (m, 1H), 6,83-6,80 (m, 1H), 2,21 (s, 6H)

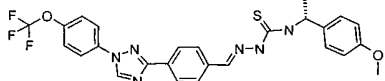
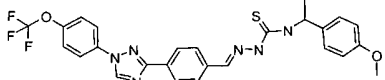
157

#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , □) ¹
135		C	550 (M+H)	218-220	12,00 (s, 1H), 10,12 (s, 1H), 8,18 (s, 1H), 8,06 (s, 1H), 7,89 (d, J = 8,22 Hz, 2H), 7,81 (d, J = 8,24 Hz, 2H), 7,75 (d, J = 8,24 Hz, 2H), 7,59-7,47 (m, 5H), 7,41-7,38 (m, 1H), 6,83-6,81 (m, 1H)
136		C	510 (M+H)	216-218	11,81 (s, 1H), 9,97 (s, 1H), 8,62 (s, 1H), 8,21-8,19 (m, 1H), 8,10-8,07 (d, J = 8,26 Hz, 2H), 8,04-7,99 (m, 4H), 7,58 (d, J = 8,24 Hz, 2H), 7,19-7,06 (m, 4H), 2,21 (s, 6H)
137		C	551 (M+H)	220-222	12,02 (s, 1H), 10,18 (s, 1H), 8,62 (s, 1H), 8,19-8,17 (m, 1H), 8,09-7,97 (m, 6H), 7,61-7,57 (m, 4H), 7,42-7,37 (m, 1H), 7,21-7,19 (m, 1H)

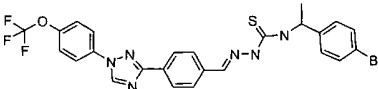
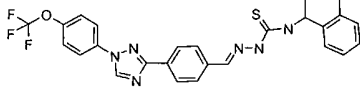
158

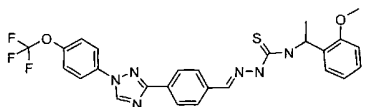
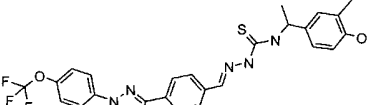
#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , [Δ]) ¹
138		C	510 (M+H)	250-260	(CDCl ₃) 9,75 (s, 1H), 8,70 (s, 1H), 8,21 (s, 1H), 8,07 (s, 1H), 7,92 (s, 1H), 7,8 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,71 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 7,62 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,35 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 7,3-7,1 (m, 3H), 2,33 (s, 6H)
139		C	524 (M+H)	235-242	(CDCl ₃) Major isomer: 8,87 (s, 1H), 8,85 (s, 1H), 8,19 (s, 1H), 8,02 (s, 1H), 7,86-7,74 (m, 4H), 7,6 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 7,35 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,23-7,06 (m, 3H), 2,38 (s, 3H), 2,34 (s, 6H)

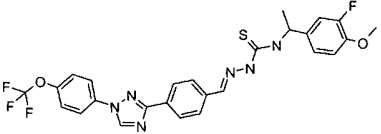
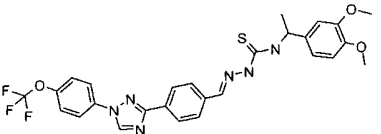
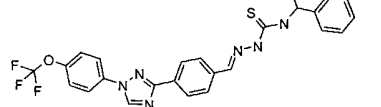
#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , □) ¹
140		C	512 (M+H)	238-240	11,79 (s, 1H), 10,96 (s, 1H), 8,17 (s, 1H), 7,98 (d, J = 8,22 Hz, 2H), 7,76 (d, J = 8,22 Hz, 2H), 7,26 (d, J = 8,26 Hz, 2H), 7,18-7,06 (m, 5H), 3,97-3,91 (m, 2H), 3,39-3,34 (m, 2H), 2,20 (s, 6H)
141		C	553 (M+H)	224-226	12,03 (s, 1H), 10,17 (s, 1H), 8,18 (s, 1H), 7,96 (d, J = 8,24 Hz, 2H), 7,76 (d, J = 8,24 Hz, 2H), 7,59-7,54 (m, 2H), 7,42-7,39 (m, 1H), 7,37 (d, J = 8,26 Hz, 2H), 7,17 (d, J = 8,26 Hz, 2H), 3,98-3,84 (m, 2H), 3,43-3,37 (m, 2H)

#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , □) ¹
142		B	541 (M+H)	195-200	(CDCl ₃) 10,33 (s, 1H), 8,6 (s, 1H), 8,21 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,92 (s, 1H), 7,8 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 7,75 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,68 (d, J = 7 Hz, 1H), 7,45-7,35 (m, 4H), 6,91 (d, J = 8 Hz, 2H), 5,73 (m, 1H), 3,80 (s, 3H), 1,65 (d, J = 7,2 Hz, 3H)
143		B	541 (M+H)	180-186	(CDCl ₃) 9,9 (s, 1H), 8,6 (s, 1H), 8,23 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,9 (s, 1H), 7,8 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 7,75 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,7 (d, J = 7 Hz, 1H), 7,45-7,35 (m, 4H), 6,91 (d, J = 8 Hz, 2H), 5,73 (m, 1H), 3,80 (s, 3H), 1,65 (d, J = 7,2 Hz, 3H)

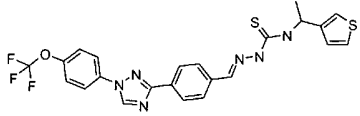
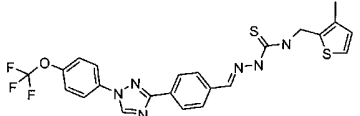
#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , □) ¹
144		B	525 (M+H)	193-198	(CDCl ₃) 9,02 (s, 1H), 8,60 (s, 1H), 8,42 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,8-7,6 (m, 6H), 7,4 (d, J = 8 Hz, 2H), 7,32 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 7,21 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 5,71 (m, 1H), 2,37 (s, 3H), 1,69 (d, J = 7,2 Hz, 3H)
145		B	523 (M+H)	160-220 dec	(CDCl ₃) 10,21 (s, 1H), 8,60 (s, 1H), 8,2 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,99 (s, 1H), 7,8 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 7,8-7,6 (m, 3H), 7,55-7,2 (m, 6H), 6,17 (m, 1H), 3,2-2,8 (m, 3H), 2,1-1,95 (m, 1H)

#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , □) ¹
146		B	591 (M+H)	205-210	(CDCl ₃) 9,12 (s, 1H), 8,60 (s, 1H), 8,25 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,78 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 7,77 (s, 1H), 7,71 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,63 (d, J = 7 Hz, 1H), 7,5 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 7,4 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,35 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 5,8-5,6 (m, 1H), 1,67 (d, J = 7 Hz, 3H)
147		B	525 (M+H)	209-213	(CDCl ₃) 9,27 (s, 1H), 8,6 (s, 1H), 8,25 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,8 (m, 3H), 7,77 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 7,63 (d, J = 7 Hz, 1H), 7,42 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 7,4 (s, 1H), 7,35-7,22 (m, 3H), 5,78 (m, 1H), 2,28 (s, 3H), 1,62 (d, J = 7 Hz, 3H)

#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , □) ¹
148		B	541 (M+H)	216-220	(CDCl ₃) 9,4 (s, 1H), 8,8 (d, J = 8 Hz, 1H), 8,62 (s, 1H), 8,3 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,9-7,7 (m, 5H), 7,4 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 7,4-7,3 (m, 2H), 6,93 (m, 2H), 5,78 (m, 1H), 4,03 (s, 3H), 1,62 (d, J = 6 Hz, 3H)
149		B	553 (M-H)	165 dec	(CDCl ₃) 9,1 (s, 1H), 8,6 (s, 1H), 8,22 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,85-7,6 (m, 6H), 7,4 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 7,23 (m, 2H), 6,82 (d, J = 6 Hz, 1H), 5,68 (m, 1H), 3,81 (s, 3H), 2,25 (s, 3H), 1,62 (d, J = 6 Hz, 3H)

#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , [J]) ¹
150		B	541 (M+H)	196-203	(CDCl ₃) 9,32 (s, 1H), 8,6 (s, 1H), 8,22 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,85-7,7 (m, 5H), 7,6 (d, J = 6 Hz, 1H), 7,4 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 7,25-7,15 (m, 2H), 6,93 (m, 1H), 5,7 (m, 1H), 3,89 (s, 3H), 1,67 (d, J = 6 Hz, 3H)
151		B	571 (M+H)	165 dec	(CDCl ₃) 9,41 (s, 1H), 8,6 (s, 1H), 8,22 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,85-7,6 (m, 6H), 7,4 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 7,05 (m, 2H), 6,91 (m, 1H), 5,7 (m, 1H), 3,92 (s, 3H), 3,89 (s, 3H), 1,68 (d, J = 6 Hz, 3H)
152		B	511 (M+H)	201-206	(CDCl ₃) 9,32 (s, 1H), 8,61 (s, 1H), 8,27 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,9-7,7 (m, 6H), 7,5-7,3 (m, 7H), 5,76 (m, 1H), 1,67 (d, J = 7 Hz, 3H)

#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , □) ¹
153		B	541 (M+H)	185-190	(CDCl ₃) 9,85 (s, 1H), 8,6 (s, 1H), 8,23 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,9 (s, 1H), 7,87-7,7 (m, 5H), 7,4 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 7,4-7,4 (m, 1H), 7,1-6,95 (m, 2H), 6,85 (m, 1H), 5,73 (m, 1H), 3,81 (s, 3H), 1,69 (d, J = 6 Hz, 3H)
154		B	503 (M+H)	214-218	(CDCl ₃) 9,36 (s, 1H), 8,60 (s, 1H), 8,21 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,9-7,7 (m, 5H), 7,4-7,25 (m, 5H), 7,2 (d, J = 3 Hz, 1H), 5,0 (s, 2 H)

#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , Δ) ¹
155		B	517 (M+H)	171-180	9,36 (s, 1H), 8,59 (s, 1H), 8,23 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,85 - 7,77 (m, 3H), 7,72 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,61 (d, J = 8,9 Hz, 1H), 7,40 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,35 (m, 1H), 7,30-7,26 (m, 1H), 7,19 (dd, J = 5,0, 1,3 Hz, 1H), 5,96-5,75 (m, 1H), 1,72 (d, J = 6,8 Hz, 3H)
156		B		205-213	11,68 (s, 1H), 9,42 (s, 1H), 9,05 (br s, 1H), 8,2-8,0 (m, 5H), 7,95 (d, J = 8,5 Hz, 2H), 7,6 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,23 (d, J = 5 Hz, 1H), 6,8 (d, J = 5 Hz, 1H), 4,9 (d, J = 6 Hz, 2H), 2,25 (s, 3H)

167

#	Estructura	Método de síntesis	EM	pf (°C)	¹ H RMN (DMSO-d ₆ , □) ¹
157		B	555 (M+H)	174-178	(CDCl ₃) 9,20 (s, 1H), 8,8 (s, 1H), 8,23 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,85-7,65 (m, 6H), 7,5-7,4 (m, 6H), 5,75 (q, J = 7 Hz, 1H), 4,46 (s, 2H), 3,20 (s, 3H), 1,71 (d, J = 7 Hz, 3H)
158		B	512 (M+H)	--	11,7 (s, 1H), 9,42 (s, 1H), 8,87 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 8,6 (s, 1H), 8,42 (d, J = 2 Hz, 1H), 8,2-7,95 (m, 7H), 7,8 (d, J = 5,4 Hz, 1H), 7,6 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,38 (m, 1H), 5,8 (m, 1H), 1,6 (d, J = 6 Hz, 3H)

Cc1ccc2c(c1)OCO2C(=S)N=N/C=C/c3ccc(cc3)/N=N/c4ccc(cc4)Oc5ccc(cc5)C(F)(F)F

¹ Todos los datos de la RMN medidos en DMSO-*d*₆ a 300 o 400 MHz a menos que se indique otra cosa.

Tabla 2

Compuesto	Mortalidad CEW 50 µg/cm ²	Mortalidad BAW 50 µg/cm ²	Mortalidad GPA 200 ppm
1	A	A	B
2	A	A	B
3	B	A	B
4	A	A	B
5	A	A	B
6	A	A	B
7	A	B	B
8	A	A	B
9	A	A	B
10	A	A	B
11	A	A	B
12	A	A	B
13	A	A	B
14	A	A	B
15	A	A	B
16	A	A	B
17	A	A	B
18	A	A	B
19	B	B	B

20	A	A	B
21	A	A	B
22	A	A	B
23	A	A	B
24	B	A	B
25	A	A	B
26	A	A	B
27	A	A	B
28	A	A	B
29	A	A	B
30	A	A	B
31	B	B	B
32	B	B	B
33	A	A	B
34	A	A	B
35	B	B	B
36	A	A	B
37	A	A	B
38	A	A	B
39	A	A	B
40	A	A	B
41	A	A	B
42	A	A	B
43	A	A	B

44	B	B	B
45	A	A	B
46	A	A	B
47	A	A	B
48	A	A	C
49	A	A	B
50	A	A	B
51	A	A	B
52	A	A	B
53	A	A	B
54	B	B	B
55	B	B	B
56	A	A	B
57	A	A	B
58	A	A	B
59	B	B	B
60	A	A	C
61	A	A	B
62	A	A	B
63	A	A	B
64	A	A	B
65	A	A	B
66	A	A	B
67	A	A	B

68	A	A	B
69	A	A	B
70	A	A	B
71	A	A	B
72	A	A	B
73	A	A	B
74	A	A	B
75	A	A	B
76	A	A	B
77	A	A	B
78	A	A	B
79	A	A	B
80	A	A	C
81	A	A	B
82	A	A	C
83	B	B	C
84	B	B	C
85	A	A	C
86	A	A	C
87	B	B	C
88	A	A	C
89	A	A	C
90	A	A	C
91	A	A	C

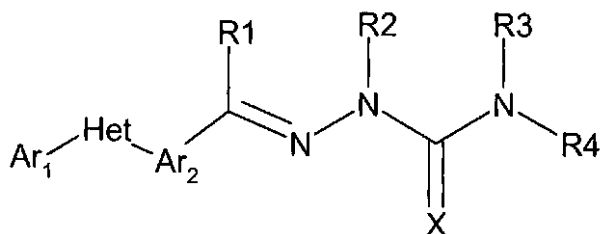
92	A	A	C
93	A	A	C
94	A	A	C
95	A	A	C
96	A	A	C
97	A	A	B
98	A	A	C
99	A	A	C
100	A	A	C
101	A	A	C
102	A	A	C
103	A	A	C
104	A	A	C
105	A	A	C
106	A	A	C
107	A	A	C
108	A	A	C
109	A	A	B
110	A	A	C
111	A	A	C
112	A	A	C
113	B	B	C
114	A	A	C
115	A	A	C

116	A	A	C
117	A	A	C
118	A	A	C
119	A	A	B
120	A	A	B
121	A	A	C
122	A	A	C
123	A	A	C
124	A	A	C
125	A	A	B
126	A	A	B
127	A	A	B
128	A	A	B
129	A	A	B
130	A	A	C
131	A	A	C
132	A	A	B
133	A	A	B
134	A	A	C
135	A	A	C
136	A	A	C
137	A	A	C
138	A	A	C
139	A	A	C

140	A	A	C
141	A	A	C
142	A	A	C
143	A	A	C
144	A	A	C
145	A	A	C
146	A	A	C
147	A	A	C
148	A	A	C
149	A	A	C
150	A	A	C
151	A	A	C
152	A	A	C
153	A	A	C
154	A	A	C
155	A	A	C
156	A	A	C
157	A	A	C
158	A	A	C
159	A	A	C

Reivindicaciones

1. Una molécula de la siguiente fórmula:



donde :

5 (a) Ar_1 es

(1) furanilo, fenilo, piridazinilo, piridilo,
pirimidinilo, tienilo, o

(2) furanilo sustituido, fenilo sustituido, piridazinilo sustituido, piridilo sustituido, pirimidinilo sustituido, o tienilo sustituido,

donde dicho furanilo sustituido, fenilo sustituido, piridazinilo sustituido, piridilo sustituido, pirimidinilo sustituido, y tienilo sustituido, poseen uno o más sustituyentes seleccionados de manera independiente de H, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, halocicloalcoxi C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, S(=O)_n(alquilo C₁-C₆), S(=O)_n(haloalquilo C₁-C₆), OSO₂(alquilo C₁-C₆), OSO₂(haloalquilo C₁-C₆), C(=O)NR_xR_y, (alquilo C₁-C₆)NR_xR_y, C(=O)(alquilo C₁-C₆), C(=O)O(alquilo C₁-C₆), C(=O)(haloalquilo C₁-C₆), C(=O)O(haloalquilo C₁-C₆), C(=O)(cicloalquilo C₃-C₆), C(=O)O(cicloalquilo C₃-C₆),

$C(=O)(\text{alquenoilo } C_2-C_6)$, $C(=O)O(\text{alquenoilo } C_2-C_6)$, $(\text{alquilo } C_1-C_6)O(\text{alquilo } C_1-C_6)$, $(\text{alquilo } C_1-C_6)S(\text{alquilo } C_1-C_6)$, $C(=O)(\text{alquilo } C_1-C_6)C(=O)O(\text{alquilo } C_1-C_6)$, fenilo, fenoxi, fenilo sustituido, y fenoxi sustituido,

5 donde el fenilo sustituido y el fenoxi sustituido poseen uno o más sustituyentes seleccionados de manera independiente de H, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, halocicloalcoxi C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆,
 10 haloalcoxi C₁-C₆, alquenoilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, S(=O)_n(alquilo C₁-C₆), S(=O)_n(haloalquilo C₁-C₆), OSO₂(alquilo C₁-C₆), OSO₂(haloalquilo C₁-C₆), C(=O)NR_xR_y, (alquilo C₁-C₆)NR_xR_y, C(=O)(alquilo C₁-C₆), C(=O)O(alquilo C₁-C₆), C(=O)(haloalquilo C₁-C₆), C(=O)O(haloalquilo C₁-C₆), C(=O)(cicloalquilo C₃-C₆),
 15 C(=O)O(cicloalquilo C₃-C₆), C(=O)(alquenoilo C₂-C₆), C(=O)O(alquenoilo C₂-C₆), (alquilo C₁-C₆)O(alquilo C₁-C₆), (alquilo C₁-C₆)S(alquilo C₁-C₆), C(=O)(alquilo C₁-C₆)C(=O)O(alquilo C₁-C₆) fenilo, y fenoxi;

(b) Het es un anillo heterocíclico, saturado o
 20 insaturado, de 5 o 6 miembros, que contiene uno o más heteroátomos seleccionados de manera independiente de nitrógeno, azufre u oxígeno, y donde Ar₁ y Ar₂ no son orto entre sí (pero pueden ser meta o para, como, por ejemplo, para un anillo de cinco miembros, ellos son 1,3 y para un anillo de
 25 6 miembros, son 1,3 o 1,4), y donde el anillo heterocíclico puede estar sustituido también con uno o más sustituyentes

seleccionados de manera independiente de H, OH, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, oxo, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, halocicloalcoxi C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, S(=O)_n(alquilo C₁-C₆), S(=O)_n(haloalquilo C₁-C₆), OSO₂(alquilo C₁-C₆), OSO₂(haloalquilo C₁-C₆), C(=O)NR_xR_y, (alquilo C₁-C₆)NR_xR_y, C(=O)(alquilo C₁-C₆), C(=O)O(alquilo C₁-C₆), C(=O)(haloalquilo C₁-C₆), C(=O)O(haloalquilo C₁-C₆), C(=O)(cicloalquilo C₃-C₆), C(=O)O(cicloalquilo C₃-C₆), C(=O)(alquenilo C₂-C₆), C(=O)O(alquenilo C₂-C₆), (alquilo C₁-C₆)O(alquilo C₁-C₆), (alquilo C₁-C₆)S(alquilo C₁-C₆), C(=O)(alquilo C₁-C₆)C(=O)O(alquilo C₁-C₆), fenilo, fenoxi, fenilo sustituido y fenoxi sustituido,

donde dichos fenilo sustituido y fenoxi sustituido poseen uno o más sustituyentes seleccionados de manera independiente de H, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, halocicloalcoxi C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, S(=O)_n(alquilo C₁-C₆), S(=O)_n(haloalquilo C₁-C₆), OSO₂(alquilo C₁-C₆), OSO₂(haloalquilo C₁-C₆), C(=O)H, C(=O)NR_xR_y, (alquilo C₁-C₆)NR_xR_y, C(=O)(alquilo C₁-C₆), C(=O)O(alquilo C₁-C₆), C(=O)(haloalquilo C₁-C₆), C(=O)O(haloalquilo C₁-C₆), C(=O)(cicloalquilo C₃-C₆), C(=O)O(cicloalquilo C₃-C₆), C(=O)(alquenilo C₂-C₆), C(=O)O(alquenilo C₂-C₆), (alquilo C₁-C₆)O(alquilo C₁-C₆), (alquilo C₁-C₆)S(alquilo C₁-C₆), C(=O)(alquilo C₁-C₆)C(=O)O(alquilo C₁-C₆), fenilo y fenoxi;

(c) Ar₂ es

(1) furanilo, fenilo, piridazinilo, piridilo, pirimidinilo, tienilo, o

5 (2) furanilo sustituido, fenilo sustituido, piridazinilo sustituido, piridilo sustituido, pirimidinilo sustituido, o tienilo sustituido,

donde dichos furanilo sustituido, fenilo sustituido, piridazinilo sustituido, piridilo sustituido, 10 pirimidinilo sustituido, y tienilo sustituido, poseen uno o más sustituyentes seleccionados de manera independiente de H, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, halocicloalcoxi C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquenilo 15 C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, S(=O)_n(alquilo C₁-C₆), S(=O)_n(haloalquilo C₁-C₆), OSO₂(alquilo C₁-C₆), OSO₂(haloalquilo C₁-C₆), C(=O)NR_xR_y, (alquilo C₁-C₆)NR_xR_y, C(=O)(alquilo C₁-C₆), C(=O)O(alquilo C₁-C₆), C(=O)(haloalquilo C₁-C₆), C(=O)O(haloalquilo C₁-C₆), C(=O)(cicloalquilo C₃-C₆), C(=O)O(cicloalquilo C₃-C₆), 20 C(=O)(alquenilo C₂-C₆), C(=O)O(alquenilo C₂-C₆), (alquilo C₁-C₆)O(alquilo C₁-C₆), (alquilo C₁-C₆)S(alquilo C₁-C₆), C(=O)(alquilo C₁-C₆)C(=O)O(alquilo C₁-C₆), fenilo, fenoxi, fenilo sustituido y fenoxi sustituido,

donde dichos fenilo sustituido y fenoxi sustituido poseen uno o más sustituyentes seleccionados de manera independiente de H, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, hidroxicicloalquilo C₃-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, halocicloalcoxi C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, S(=O)_n(alquilo C₁-C₆), S(=O)_n(haloalquilo C₁-C₆), OSO₂(alquilo C₁-C₆), OSO₂(haloalquilo C₁-C₆), C(=O)H, C(=O)NR_xR_y, (alquilo C₁-C₆)NR_xR_y, C(=O)(alquilo C₁-C₆), C(=O)O(alquilo C₁-C₆), C(=O)(haloalquilo C₁-C₆), C(=O)O(haloalquilo C₁-C₆), C(=O)(cicloalquilo C₃-C₆), C(=O)O(cicloalquilo C₃-C₆), C(=O)(haloalquilo C₁-C₆), C(=O)(alquenilo C₂-C₆), C(=O)O(alquenilo C₂-C₆), (alquilo C₁-C₆)O(alquilo C₁-C₆), (alquilo C₁-C₆)S(alquilo C₁-C₆), C(=O)(alquilo C₁-C₆)C(=O)O(alquilo C₁-C₆), fenilo, y fenoxi);

(d) X es O o S;

(e) R₁ se selecciona de H, CN, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, halocicloalcoxi C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, S(=O)_n(alquilo C₁-C₆), S(=O)_n(haloalquilo C₁-C₆), OSO₂(alquilo C₁-C₆), OSO₂(haloalquilo C₁-C₆), C(=O)NR_xR_y, (alquilo C₁-C₆)NR_xR_y, C(=O)(alquilo C₁-C₆), C(=O)O(alquilo C₁-C₆), C(=O)(haloalquilo C₁-C₆), C(=O)O(haloalquilo C₁-C₆), C(=O)(cicloalquilo C₃-C₆), C(=O)O(cicloalquilo C₃-C₆), C(=O)(alquenilo C₂-C₆), C(=O)O(alquenilo C₂-C₆), (alquilo C₁-C₆)O(alquilo C₁-C₆),

(alquilo C_1-C_6)S(alquilo C_1-C_6), $C(=O)$ (alquilo C_1-C_6)
 C_6) $C(=O)O$ (alquilo C_1-C_6), fenilo, fenoxi;

(f) R2, R3 y R4 se seleccionan de manera independiente
 de H, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquenilo C_2-C_6 ,
 5 alquinilo C_2-C_6 , $C(=O)$ (alquilo C_1-C_6), $C(=O)O$ (alquilo C_1-C_6),
 $C(=O)$ (cicloalquilo C_3-C_6), $C(=O)O$ (cicloalquilo C_3-C_6),
 $C(=O)$ (alquenilo C_2-C_6), $C(=O)O$ (alquenilo C_2-C_6), (alquilo C_1-
 C_6) O (alquilo C_1-C_6), (alquilo C_1-C_6)S(alquilo C_1-C_6),
 $C(=O)$ (alquilo C_1-C_6) $C(=O)O$ (alquilo C_1-C_6), $C(=O)$ fenilo, fenilo,
 10 alquilfenilo C_1-C_6 , alquilfenoxi C_1-C_6 , indanilo, $C(=O)$ Het-1,
 Het-1, (alquilo C_1-C_6)Het-1, o alquilo C_1-C_6-O -Het-1,

donde cada alquilo, cicloalquilo, cicloalcoxi,
 halocicloalcoxi, alcoxi, haloalcoxi, alquenilo, alquinilo,
 alquilfenilo C_1-C_6 , fenilo, fenoxi, y Het-1, se encuentran
 15 opcionalmente sistituidos con uno o más sustituyentes
 seleccionados de manera independiente de F, Cl, Br, I, CN, NO₂,
 NR_xR_y, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 ,
 halocicloalquilo C_3-C_6 , cicloalcoxi C_3-C_6 , halocicloalcoxi C_3-
 C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 ,
 20 cicloalquenilo C_3-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquinilo C_3-C_6 ,
 $S(=O)_n$ (alquilo C_1-C_6), $S(=O)_n$ (haloalquilo C_1-C_6), $S(=O)_2N$ (alquilo
 C_1-C_6)₂, OSO₂(alquilo C_1-C_6), OSO₂(haloalquilo C_1-C_6), $C(=O)H$,
 $C(=O)NR_xR_y$, (alquilo C_1-C_6)NR_xR_y, $C(=O)$ (alquilo C_1-C_6),
 $C(=O)O$ (alquilo C_1-C_6), $C(=O)$ (haloalquilo C_1-C_6),
 25 $C(=O)O$ (haloalquilo C_1-C_6), $C(=O)$ (cicloalquilo C_3-C_6),
 $C(=O)O$ (cicloalquilo C_3-C_6), $C(=O)$ (alquenilo C_2-C_6),

$C(=O)O(\text{alqueno} \text{ } C_2-C_6), (\text{alquilo} \text{ } C_1-C_6)O(\text{alquilo} \text{ } C_1-C_6),$
 $(\text{alquilo} \text{ } C_1-C_6)S(\text{alquilo} \text{ } C_1-C_6), C(=O)(\text{alquilo} \text{ } C_1-$
 $C_6)C(=O)O(\text{alquilo} \text{ } C_1-C_6), \text{ fenilo}, \text{ fenoxi}, O\text{-Het-1}, \text{ y Het-1},$

donde Het-1 es un anillo heterocíclico,
 5 saturado o insaturado, de 5 o 6 miembros, que contiene uno o
 más heteroátomos seleccionados de manera independiente de
 nitrógeno, azufre u oxígeno,

donde R3 y R4 juntos pueden formar opcionalmente un grupo
 cíclico, saturado o insaturado, de 3 a 8 miembros que puede
 10 contener uno o más heteroátomos seleccionados entre nitrógeno,
 azufre y oxígeno;

(g) $n = 0, 1, \text{ o } 2;$

(h) R_x y R_y se seleccionan de manera independiente de H,
 alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 ,
 15 halocicloalquilo C_3-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 ,
 $S(=O)_n(\text{alquilo} \text{ } C_1-C_6), S(=O)_n(\text{haloalquilo} \text{ } C_1-C_6), OSO_2(\text{alquilo}$
 $C_1-C_6), OSO_2(\text{haloalquilo} \text{ } C_1-C_6), C(=O)H, C(=O)(\text{alquilo} \text{ } C_1-C_6),$
 $C(=O)O(\text{alquilo} \text{ } C_1-C_6), C(=O)(\text{haloalquilo} \text{ } C_1-C_6),$
 $C(=O)O(\text{haloalquilo} \text{ } C_1-C_6), C(=O)(\text{cicloalquilo} \text{ } C_3-C_6),$
 20 $C(=O)O(\text{cicloalquilo} \text{ } C_3-C_6), C(=O)(\text{alqueno} \text{ } C_2-C_6),$
 $C(=O)O(\text{alqueno} \text{ } C_2-C_6), (\text{alquilo} \text{ } C_1-C_6)O(\text{alquilo} \text{ } C_1-C_6),$
 $(\text{alquilo} \text{ } C_1-C_6)S(\text{alquilo} \text{ } C_1-C_6), C(=O)(\text{alquilo} \text{ } C_1-$
 $C_6)C(=O)O(\text{alquilo} \text{ } C_1-C_6), \text{ y fenilo}.$

2. Una molécula de acuerdo con la reivindicación 1,
 25 donde Ar_1 es un fenilo sustituido, donde dicho fenilo
 sustituido posee uno o más sustituyentes seleccionados de

manera independiente de alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , y haloalcoxi C_1-C_6 ;

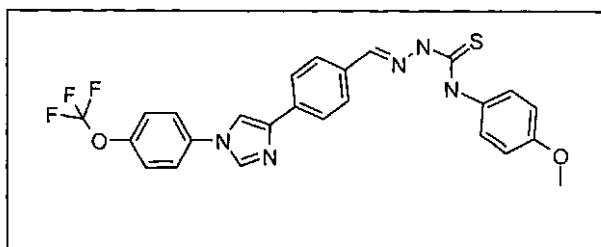
3. Una molécula de acuerdo con la reivindicación 1, donde Het es un triazolilo, imidazolilo, pirrolilo, o
5 pirazolilo.

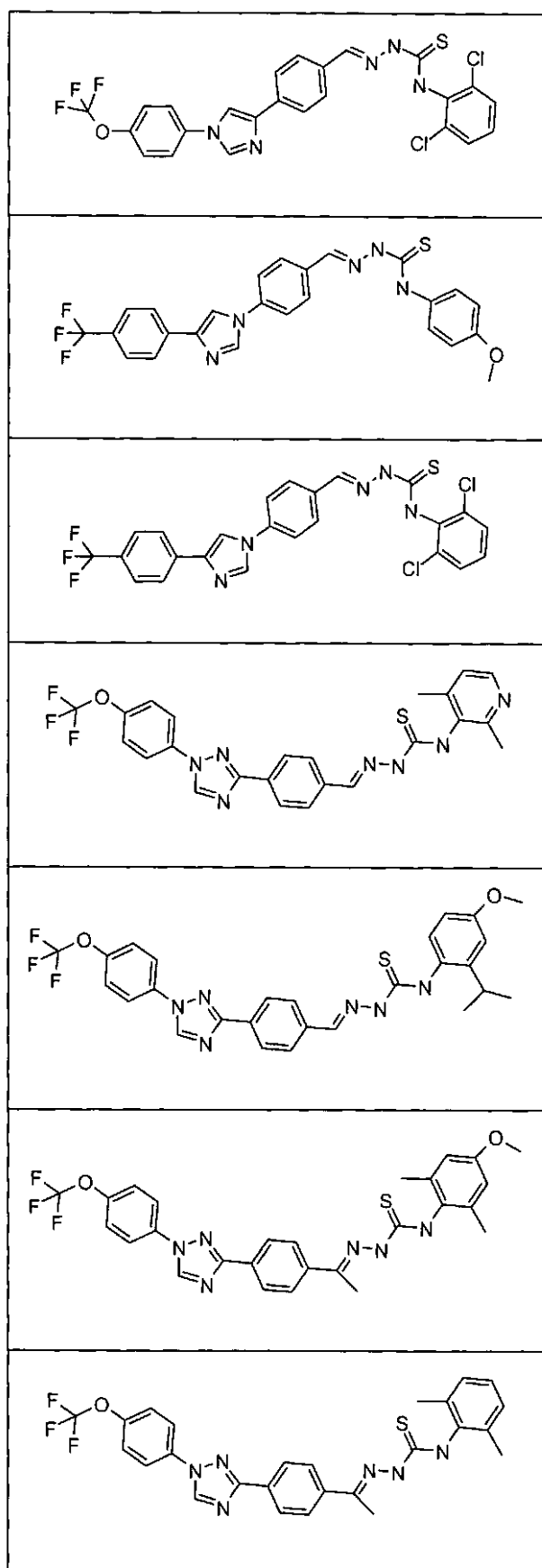
4. Una molécula de acuerdo con la reivindicación 1, donde Ar_2 es un fenilo.

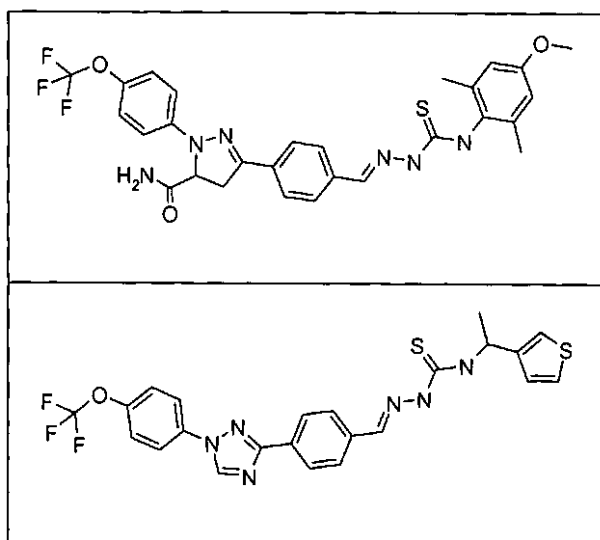
5. Una molécula de acuerdo con la reivindicación 1, donde R4 es un alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alqueno C_2-C_6 , $C(=O)$ fenilo, alquilfenilo C_1-C_6 , Het-1, o (alquilo C_1-C_6)Het-1.
10

6. Una molécula de acuerdo con la reivindicación 1, donde R4 es un alquilo C_1-C_6 , alquilfenilo C_1-C_6 , fenilo, o Het-1, donde cada uno se encuentra sustituido con uno o más
15 sustituyentes seleccionados de manera independiente de F, Cl, Br, I, CN, NO_2 , NR_xR_y , alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , cicloalqueno C_3-C_6 , $S(=O)_n$ (alquilo C_1-C_6), $S(=O)_n$ (haloalquilo C_1-C_6), $S(=O)_2N$ (alquilo C_1-C_6) $_2$, $C(=O)$ (alquilo C_1-C_6), $C(=O)O$ (alquilo C_1-C_6), $C(=O)$ (haloalquilo C_1-C_6), (alquilo C_1-C_6)O(alquilo C_1-C_6), fenilo, O-Het-1, y Het-1.
20

7. Una molécula de acuerdo con la reivindicación 1, que posee una de las siguientes estructuras:







8. Un proceso para aplicar una molécula de acuerdo con la reivindicación 1, donde dicho proceso comprende aplicar una molécula de acuerdo con la reivindicación 1 a un área para controlar una plaga, en una cantidad suficiente para controlar dicha plaga.

9. Un proceso de acuerdo con la reivindicación 8, donde dicha plaga es BAW, CEW, o GPA.

10. Una molécula que es una sal de adición de ácido aceptable desde el punto de vista plaguicida, un derivado de sal, un solvato, o un derivado de éster, de una molécula de acuerdo con la reivindicación 1.

11. Una molécula de acuerdo con la reivindicación 1, donde al menos un H es ²H o al menos un C es ¹⁴C.

12. Una composición que comprende una molécula de acuerdo con la reivindicación 1 y al menos otro compuesto que posee actividad insecticida, herbicida, acaricida, nematocida o fungicida.

13. Una composición que comprende una molécula de acuerdo con la reivindicación 1 y una semilla.

14. Un proceso que comprende aplicar una molécula de acuerdo con la reivindicación 1 a una planta genéticamente modificada o a una semilla genéticamente modificada, que se ha modificado en su genética a los efectos de expresar uno o más rasgos especializados.

15. Un proceso que comprende: administrar en forma oral o aplicar en forma tópica una molécula de acuerdo con la reivindicación 1 a un animal no humano a los efectos de controlar endoparásitos, ectoparásitos o ambos.

Buenos Aires, agosto de 2010, p.p. de DOW AGROSCIENCES LLC.

Resumen

Se describen composiciones plaguicidas y sus usos.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/US 10/44525

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER IPC(8) - A01N 43/64 (2010.01) USPC - 514/359 According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) USPC: 514/359 Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched USPC: 514/359 ; 514/91 ; 514/92 ; 514/96 ; 548/476 (see keywords below) Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) WEST: PGPB, USPT, USOC, EPAB, JPAB Google: Scholar/patents: pesticidal composition thioureas hydrazones diphenyl imidazole antiparasitic insecticide benzylidene thiosemicarbazone aryl genetically modified plant beet armyworm pesticides parasites		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	US 6,417,187 B2 (HEGDE et al) 09 July 2002 (09.07.2002) Col 1, ln 40-67; Col 2, ln 22-23; Col 4, ln 8-21; Col 39, ln 64-67; Col 40, ln 63-67; Col 41, ln 1-12; Col 41, ln 23-29; Col 16, ln 42-45; Col 39, Table 7	1-15
Y	PEDERSEN et al. Synthesis and Insect Growth Regulating Activity of Thiosemicarbazones of Methyl 2-Pyridyl Ketones in Pest. Sci. 1984, Vol 25, pp 462-470 pg 462, para 3; pg 463, Tables 1 and 2	1-15
Y	US 2008/0262057 A1 (TISDELL et al) 23 October 2008 (23.10.2008) para [0089]-[0116]; [0150]-[0152]	12;14;15
Y	ELMARAKBY et al. Degradation of [14C]-Carfentrazone-ethyl under Aerobic Aquatic Conditions in Journal of Agricultural Food Chemistry, 2001, Vol 49, pp 5285-5293. pg 5285, abstract; Col 2, para 2; Col 3, para 1, Figure 1	11
☐ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☐		
* Special categories of cited documents: "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier application or patent but published on or after the international filing date "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art "&" document member of the same patent family		
Date of the actual completion of the international search 16 September 2010 (16.09.2010)		Date of mailing of the international search report 23 SEP 2010
Name and mailing address of the ISA/US Mail Stop PCT, Attn: ISA/US, Commissioner for Patents P.O. Box 1450, Alexandria, Virginia 22313-1450 Facsimile No. 571-273-3201		Authorized officer: Lee W. Young PCT Helpdesk: 571-272-4300 PCT OSP: 571-272-7774

 Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA		SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO DIVISION DE NUEVAS CREACIONES EXTRACTO PARA PUBLICACIÓN SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION PCT	
(21) N° de solicitud:		(51) Int Cl: A01N 043/064	
22) Fecha de solicitud:		(71) Solicitante(s) DOW AGROSCIENCES LLC	
(30) Prioridad	(31) Prioridad 61/232,152	(32) Fecha 07/08/2009	(33) País US
		(72) Inventor(es) ANNETTE BROWN Y OTROS	
		(74) Apoderado: LUZ CLEMENCIA DE PAEZ	
(85)	Fecha límite inicio fase nacional: 07/03/2012		(87) Publicación internacional
(86)	Datos relativos a la presentación de la solicitud PCT		Fecha: 10/02/2011
	Fecha de presentación de la solicitud: 05/08/2010		N° publicación: WO 2011/017504 A1
	No. de solicitud PCT/US2010/044525		
(54) Título: COMPOSICIONES PLAGUICIDAS			

Resumen:

Se describen composiciones plaguicidas y sus usos.

191

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800.176.089-2

-/-



RECIBO DE CAJA

No. 12 - 004885

Bogotá D.C., Enero 18 de 2012 - 16:03:22

RECIBIDO DE : CAVELIER ABOGADOS

NI 860.041.367

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR. PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	427470934	18/01/2012	15.880.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr. UNDITARIO	Vr. CONCEPTO
1	50005-01-01 SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE INVENCIÓN	590.000.00	590.000.00
				\$590.000.00

SON: **QUINIENTOS NOVENTA MIL PESOS MONEDA CORRIENTE***

Responsable: _____

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 12-009988- -00000-0000

Fecha: 2012-01-24 12:11:19 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 193

COLO: 10975-841-080-6

Sede Centro: Carrera 13 No. 27 - 00 Pisos 3,4,5 y 10 Bogotá, D.C.- Colombia

Web: www.sic.gov.co e-mail: info@sic.gov.co Conmutador: (571) 5870000 Fax: (571) 5870284 Línea: 018000-910165 Call Center: (571) 6513240

Enero 18 de 2012 - 16:03:25

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
NIT : 800.176.089-2
- / -

 Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA	RECIBO DE CAJA	No. 12 - 000239
		Bogotá D.C., Enero 02 de 2012 - 17:19:44

RECIBIDO DE : CAVELIER ABOGADOS	NI 860.041.367
---------------------------------	----------------

*** Soporte del Pago ***					
TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR. PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	427470831	02/01/2012	63.604.000.00

*** Conceptos Pagados ***				
CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr.UNDITARIO	Vr.CONCEPTO
1	50005-01-01 SOLICITUDES	1607 REIVINDICACION UNITARIA ADICIONAL A LAS 10 INICIALES	30.000.00	30.000.00
				<u>\$30.000.00</u>

SON: **TREINTA MIL PESOS MONEDA CORRIENTE**

Responsable: 
Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

No. 12-009988- -00000-0000
Fecha: 2012-01-24 12:11:19 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 193

COLO: 10975- 841-080-6

193

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO NIT : 800.176.089-2 - / -					
 Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA	RECIBO DE CAJA			No. 12 - 004879	
				Bogotá D.C., Enero 18 de 2012 - 16:03:22	
RECIBIDO DE : CAVELIER ABOGADOS				NI 860.041.367	
*** Soporte del Pago ***					
TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR. PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	427470934	18/01/2012	15.880.000.00
*** Conceptos Pagados ***					
CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO		Vr. UNDITARIO	Vr. CONCEPTO
1	50005-01-03 CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICACIONES EN CREACION CORRECCION A SOLICITUD EN TRAMITE / MODIFICA			120.000.00	120.000.00
					\$120.000.00
=====					
SON: **CIENTO VEINTE MIL PESOS MONEDA CORRIENTE**					
Responsable: _____					
Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____					
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO  No. 12-009988-00000-0000 Fecha: 2012-01-24 12:11:19 Dep. 2020 DIR. NUEVASCR Tra. 11 PATENTEIYI Eve: 378 FASENACIONALI Act. 411 PRESENTACION Folios: 193					
COLO: 10975-841-080-6,					
Sede Centro: Carrera 13 No. 27 - 00 Pisos 3,4,5 y 10 Bogotá, D.C. - Colombia Web: www.sic.gov.co e-mail: Info@sic.gov.co Conmutador: (571) 5870000 Fax: (571) 5870284 Línea: 018000-910165 Call Center: (571) 6513240 Enero 18 de 2012 - 16:03:24					



No. 12-009988- -00000-0000

Fecha: 2012-01-24 12:11:19 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 193

PATENTE DE INVENCION ☐ MODELO DE UT

☐	Indicación que se solicita una patente.
☐	Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud
☐	Descripción de la invención
☐	Dibujos de ser estos pertinentes
☐	Comprobante de pago de las tasas establecidas (De ser el caso formato de descuento)
Completa ☐	Incompleta ☐

PATENTE DE INVENCION PCT ☒ MODELO DE UTILIDAD PCT ☐ Art.33 Decisión 486/00, Circular Única

☒	Indicación que se solicita una PCT
☒	Copia de la solicitud en español, tal como fue presentada inicialmente (capítulo descriptivo, reivindicatorio, resumen)
☐	Dibujos de ser estos pertinentes
☒	Comprobante de pago de las tasas establecidas (de ser el caso formato de descuento)
Completa ☒	Incompleta ☐

DISEÑO INDUSTRIAL ☐ (Art. 119 Decisión 486/00)

☐	Indicación que se solicita Diseño industrial
☐	Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud
☐	Representación gráfica y fotográfica del Diseño industrial o muestra del material que incorpora el diseño
☐	Comprobante de pago de las tasas establecidas
Completa ☐	Incompleta ☐

ESQUEMA DE TRAZADO ☐ (Art. 92 Decisión 486/00)

☐	Indicación que se solicita un esquema de trazado
☐	Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud
☐	Representación gráfica de un esquema de trazado
☐	Comprobante de pago de las tasas establecidas
Completa ☐	Incompleta ☐