

MOLÉCULAS QUE TIENEN UTILIDAD PLAGUICIDA, E INTERMEDIARIOS, COMPOSICIONES Y PROCESOS, RELACIONADOS CON ELLAS

REFERENCIA CRUZADA A SOLICITUDES RELACIONADAS

- 5 Esta solicitud reivindica el beneficio de prioridad de las solicitudes de patente provisionales de Estados Unidos núms. 62/286593 y 62/286599 presentadas ambas el 25 de enero de 2016, cuyo contenido se incorpora en la presente descripción como referencia.

CAMPO DE LA INVENCION

- 10 Esta descripción se refiere al campo de moléculas que tienen utilidad plaguicida contra plagas en los filos Arthropoda, Mollusca y Nematoda, procesos para producir tales moléculas, intermediarios usados en tales procesos, composiciones plaguicidas que contienen tales moléculas y procesos para usar tales composiciones plaguicidas contra tales plagas. Estas composiciones plaguicidas pueden usarse, por ejemplo, como acaricidas, insecticidas, 15 aracnidas, molusquicidas y nematocidas.

ANTECEDENTES DE LA INVENCION

- “Muchas de las enfermedades humanas más peligrosas son transmitidas por insectos vectores” (Rivero y otros). “Históricamente, la malaria, el dengue, la fiebre amarilla, la peste, la filariasis, 20 el tifus transmitido por piojos, la tripanosomiasis, la leishmaniasis y otras enfermedades transmitidas por vectores fueron responsables de más enfermedades humanas y muerte en los siglos 17 y principios del 20 que todas las demás causas combinadas” (Gubler). Las enfermedades transmitidas por vectores son responsables de aproximadamente el 17 % de las enfermedades parasitarias e infecciosas globales. Solamente la malaria provoca más de 800,000 25 muertes al año, 85 % de las cuales ocurren en niños menores de cinco años de edad. Cada año se presentan aproximadamente 50 a aproximadamente 100 millones de casos de dengue. Otros 250,000 a 500,000 casos de dengue hemorrágico ocurren cada año (Matthews). El control de vectores tiene un papel fundamental en la prevención y el control de las enfermedades infecciosas. Sin embargo, la resistencia a insecticidas, que incluye resistencia a múltiple

insecticidas, ha surgido en todas las especies de insectos que son importantes vectores de enfermedades humanas (Rivero y otros). Recientemente, más que 550 especies de plaga de artrópodos han desarrollado resistencia a al menos un plaguicida (Whalon y otros).

Cada año los insectos, los patógenos de plantas y las malas hierbas, destruyen más del 40 % de toda la producción de alimentos. Esta pérdida se produce a pesar de la aplicación de plaguicidas y el uso de una amplia variedad de controles no químicos, tales como rotaciones de los cultivos y controles biológicos. Si sólo se pudiera conservar parte de estos alimentos, podría usarse para alimentar a los más de tres mil millones de personas en el mundo que padecen malnutrición (Pimental).

Los nemátodos parásitos de las plantas se encuentran entre las plagas más extendidas y frecuentemente son de las más insidiosas y costosas. Se ha estimado que las pérdidas atribuibles a los nemátodos son de aproximadamente 9 % en los países desarrollados a aproximadamente 15 % en los países subdesarrollados. Sin embargo, en Estados Unidos un estudio de 35 estados sobre diversos cultivos indicó pérdidas provocadas por nemátodos de hasta el 25 % (Nicol y otros).

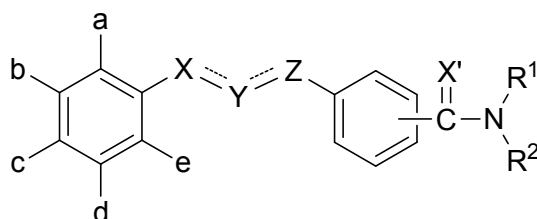
Cabe señalar que los gasterópodos (babosas y caracoles) son plagas de menor importancia económica que otros artrópodos o nemátodos, pero en determinados lugares pueden reducir sustancialmente los rendimientos, afectar gravemente la calidad de los productos cosechados, así como transmitir enfermedades a humanos, animales y plantas. Aunque sólo unas pocas docenas de especies de gasterópodos son plagas regionales graves, un conjunto de especies son importantes plagas a escala mundial. En particular, los gasterópodos afectan a una amplia variedad de cultivos agrícolas y hortícolas, tales como, cultivos en tierras cultivables, de pastoreo y de fibras; vegetales; frutos de arbustos y árboles; hierbas; y ornamentales (Speiser).

Las termitas provocan daños a todo tipo de estructuras públicas y privadas, así como a los recursos agrícolas y forestales. En 2005, se estimó que las termitas provocan daños de más de 50 mil millones de dólares americanos en todo el mundo cada año (Korb).

En consecuencia, por muchas razones, incluidas las mencionadas anteriormente, existe una necesidad continua del desarrollo de nuevos plaguicidas lo cual es costoso (estimado en aproximadamente 256 millones de dólares americanos por plaguicida en 2010), consume

mucho tiempo (en promedio aproximadamente 10 años por plaguicida) y difícil (CropLife America).

DeMassey y otros describen la siguiente estructura. Para más detalle, consultar el documento US 2002/0068838.



5

ALGUNAS REFERENCIAS CITADAS EN LA INVENCION

CropLife America, The Cost of New Agrochemical Product Discovery, Development & Registration, and Research & Development predictions for the Future, 2010.

- 10 Gubler, D., Resurgent Vector-Borne Diseases as a Global Health Problem, *Emerging Infectious Diseases*, Vol. 4, núm. 3, págs. 442-450, 1998.

Korb, J., Termites, *Current Biology*, Vol. 17, núm. 23, 2007.

Matthews, G., Integrated Vector Management: Controlling Vectors of Malaria and Other Insect Vector Borne Diseases, Cap. 1, pág. 1- 2011.

- 15 Nicol, J., Turner S., Coyne, L., den Nijs, L., Hockslan, L., Tahna-Maafi, Z., Current Nematode Threats to World Agriculture, *Genomic and Molecular Genetics of Plant – Nematode Interactions*, páginas 21-43, 2011).

Pimental, D., Pest Control in World Agriculture, *Agricultural Sciences – Vol. II*, 2009.

Rivero, A., Vezilier, J., Weill, M., Read, A., Gandon, S., Insect Control of Vector-Borne Diseases:

- 20 When is Insect Resistance a Problem? *Public Library of Science Pathogens*, Vol. 6, núm. 8, págs. 1-9, 2010.

Speiser, B., Molluscicides, *Enciclopedia of Pest Management*, Cap. 219, págs. 506-508, 2002.

Whalon, M., Mota-Sanchez, D., Hollingworth, R., Analysis of Global Pesticide Resistance in Arthropods, *Global Pesticide Resistance in Arthropods*, Cap. 1, pág. 5-33, 2008.

25

Definiciones usadas en esta descripción

Los ejemplos que se dan en estas definiciones son generalmente no exhaustivos y no deben interpretarse como limitantes de esta descripción. Se entiende que un sustituyente debe cumplir con las reglas de enlace químico y las restricciones de compatibilidad estérica con relación a la molécula en particular a la que se une. Estas definiciones solo se usarán para los propósitos de esta descripción.

“Ingrediente activo” significa un material que tiene actividad útil en el control de plagas y/o que es útil para ayudar a otros materiales a tener una mejor actividad en el control de plagas, ejemplos de tales materiales incluyen, pero sin limitarse a, acaricidas, algicidas, avicidas, bactericidas, fungicidas, herbicidas, insecticidas, molusquicidas, nematocidas, rodenticidas, virucidas, inhibidores de la alimentación, repelentes de aves, quimioesterilizantes, protectores de herbicidas, atrayentes de insectos, repelentes de insectos, repelentes de mamíferos, disruptores del apareamiento, activadores de plantas, reguladores del crecimiento vegetal y sinergistas. Ejemplos específicos de tales materiales incluyen, pero sin limitarse a, los materiales enumerados en el grupo de ingredientes activos alfa.

“Grupo de ingredientes activos alfa” (de aquí en adelante “AIGA”) se refiere colectivamente a los siguientes materiales:

(1)bromuro de (3-etoxipropil)mercurio, 1,2-dibromoetano, 1,2-dicloroetano, 1,2-dicloropropano, 1,3-dicloropropeno, 1-MCP, 1-metilciclopropeno, 1-naftol, 2-(octiltio)etanol, 2,3,3-TPA, ácido 2,3,5-tri-yodobenzoico, 2,3,6-TBA, 2,4,5-T, 2,4,5-TB, 2,4,5-TP, 2,4-D, 2,4-DB, 2,4-DEB, 2,4-DEP, 2,4-DES, 2,4-DP, 2,4-MCPA, 2,4-MCPB, 2iP, cloruro de 2-metoxietilmercurio, 2-fenilfenol, 3,4-DA, 3,4-DB, 3,4-DP, ácido 3,6-dicloropicolínico, 4-aminopiridina, 4-CPA, 4-CPB, 4-CPP, alcohol 4-hidroxifenetilo, sulfato de 8-hidroxiquinolina, 8-fenilmercurioxiquinolina, abamectina, abamectina-aminometilo, ácido abscísico, ACC, acefato, acequinocilo, acetamiprid, acetión, acetoclor, acetofenato, acetofos, acetoprol, acibenzolar, acifluorfen, aclonifen, ACN, acrep, acrinatrina, acroleína, acrilonitrilo, acipetacs, afidopiropen, afoxolaner, alacloro, alanap, alanycarb, albendazol, aldicarb, aldicarb sulfona, aldimorf, aldoxicarb, aldrina, aletrina, alicina, alidocloro, alosamidina, aloxidim, alcohol alílico, alixicarb, alorac, cipermetrina *alfa*, endosulfán *alfa*, alfametrina, altretamina, fosfuro de aluminio, ametotradina, ametridiona, ametrina,

ametrina, amibuzin, amicarbazona, amicartiazol, amiditi3n, amidoflumet, amidosulfur3n,
 aminocarb, aminociclopraclor, aminopirald, aminotriazol, amiprofos-metilo, amiprofos,
 amiprofos-metilo, amisulbrom, amiton, amitraz, amitrol, sulfamato de amonio, amobam, gel de
 s3lice amorfo, di3xido de silicio amorfo, ampropilf3s, AMS, anabasina, ancimidol, anilazina,
 5 anilofos, anisuron, antraquinona, antio, apolola, aramita, arprocarb, 3xido arsenioso, asomato,
 aspirina, asulam, atidati3n, atraton, atrazina, aureofungina, avermectina B1, AVG, aviglicina,
 azaconazol, azadiractina, azafenidina, azametifos, aziditi3n, azimsulfuron, azinfosetilo,
 azinfosetilo, azinfos metilo, azinfos metilo, aziprotrina, aziprotrina, azithiram, azobenceno,
 azociclotina, azotoato, azoxistrobina, bachmedesh, Barban, barbanato, hexafluorosilicato de
 10 bario, polisulfuro de bario, silicofluoruro de bario, bartrina, carbonato b3sico de cobre, cloruro
 de cobre b3sico, sulfato de cobre b3sico, CMPC, beflubutamida, benalaxil, benalaxil-M,
 benazolina, bencarbazona, benclotiaz, bendaqingbingzhi, bendiocarb, bendi3xido, benefina,
 benfluralina, benfuracarb, benfuresato, benmihuangcaoan, benodanil, benomil, benoxacor,
 benoxafos, benquinox, bensulfuron, bensulide, bensultap, bentaluron, bentazon, bentazona,
 15 bentiavalicarb, bentiazol, bentiocarb, bentrail, benzadox, cloruro de benzalconio, benzamacril,
 benzamizol, benzamorf, hexacloruro de benceno, benzfendizona, benzimina, benzipram,
 benzobicicl3n, benzoepina, benzofenap, benzofl3or, 3cido benzohidro3mico, benzomato,
 benzofosfato, benzotiadiazol, benzovindiflupir, benzoximato, benzoilprop, benztiazor3n,
 benzuocaotong, benzoato de bencilo, benciladenina, berberina, ciflutrina *beta*, cipermetrina
 20 *beta*, betoxazin, BHC, bialafos, biciclopirona, bifenazato, bifenox, bifentrina, bifujunzhi,
 bilanafos, binapacril, bingqingxiao, bioaletrina, bioetanometina, biopermetrina, biorresmetrina,
 bifenilo, bisazir, bismertiazol, bismertiazol-cobre, bisfenilmercurio metilendi(x-naftaleno-y-
 sulfonato), bispiribac, bistriflur3n, bisultap, bitercanol, bitionol, bixafen, blasticidin-S, b3rax,
 mezcla de Burdeos, 3cido b3rico, boscalid, BPPS, brassinolida, brassinolida-etilo, brevicomina,
 25 brodifacoum, brofenprox, brofenvalerato, broflanilida, broflutrinato, bromacilo, bromadiolona,
 bromcloil, brometalina, brometina, bromfenvinfos, bromoacetamida, bromobonil,
 bromobutide, bromociclen, bromociclen, bromo-DDT, bromofenoxim, bromofos,
 bromometano, bromofos, bromofosilato, bromoflalato, bromofenilato, bromoxionale,
 bromoxionale, bronopol, BRP, BTH, bucarpolato, bufencarb, buminafos, bupirimato, buprofezin,

Mezcla de Borgoña, busulfan, busulfan, butacarb, butaclor, butafenacil, butam, butamifos, butano-fipronil, butatiofos, butenacloro, buteno-fipronil, butetrina, butidazol, butiobato, butiuron, butifos, butocarboxim, butonato, butopironoxil, butoxicarboxim, butralina, butrizol, butroxidim, buturon, butilamina, butilato, butilclorofos, butileno-fipronil, ácido cacodílico, cadusafos, cafenstrol, calciferol, arseniato de calcio, clorato de calcio, cianamida cálcica, cianuro cálcico, polisulfuro de calcio, calvinfos, cambendicloro, canfeclor, alcanfor, captafol, captan, carbamorph, carbanátodo, carbaril, carbaril, carbasulam, carbathion, carbendazim, carbendazol, carbetamida, carbofenotion, carbofurano, disulfuro de carbono, tetracloruro de carbono, sulfuro de carbonilo, carbofenotión, carbofós, carbosulfán, carboxazol, carbóxido, carboxina, carfentrazona, carpropamida, cartap, carvacrol, carvona, CAVP, CDAA, CDEA, CDEC, celocidina, CEPC, ceralur, cerenox, cevadilla, mezcla de Cheshunt, chinalfos, chinalfos-metilo, chinometionat, chinometionato, quiralaxyl, quitosal, clobentiazona, clometoxifen, cloralosa, cloramben, cloramin fósforo, cloranfenicol, cloraniformetano, cloranil, cloranocril, clorantraniliprol, clorazifop, clorazina, clorbensida, clorbenzuron, clorbiciclen, clorbromuron, clorbufam, clordano, clordecona, clordimeform, clorempentrina, cloretazato, cloretefon, cloreto xifos, cloreturón, clorfenaco, clorfenapir, clorfenazol, clorfenetol, clorfenidim, clorfenprop, clorfenson, clorfensulfuro, clorfenvinfos, clorfenvinfos-metilo, clorfluazurón, clorflurazol, clorflurecol, clorflurenol, clorflurenol, cloridazona, clorimurón, cloro, cloro-IPC, clormefos, clormequat, clormesulona, clormetoxinil, clornidina, clornitrofen, ácido cloroacético, clorobencilato, clorodinitronaftalenos, clorofenizon, cloroformo, cloromebuform, clorometiurón, cloroneb, clorofacinona, clorofos, cloropicrina, cloropon, cloropropilato, clorotalonil, clorotoluron, cloroxifenidim, cloroxuron, cloroxinil, clorfonium, clorfoxim, clorprazofos, clorprocarb, clorprofam, clorpirifos, clorpirifos-metilo, clorquinox, clorsulfuron, clortal, clortiamid, clorthiofos, clortoluron, clozolinato, quitosan, colecalciferol, cloruro de colina, cromafenozida, cicloheximida, cimectacarb, cimetacarb, cinerina I, cinerina II, cinerinas, cinidon-etilo, cinmetilina, cinosulfurón, cintofen, ciobutida, cisanilida, cismetrina, clacifos, clefoxidim, clepirina, clepirina, cletodim, climbazol, clidionato, clodinafop, cloetocarb, clofencet, clofenotano, clofentezina, clofenvinfos, ácido clofíbrico, clofop, clomazona, clomeprop, clonitralid, cloprop, cloproxidim, clopiralid, cloquintocet, cloransulam, closantel, clotianidin,

clotrimazol, cloxifonac, cloxilacon, clozilacon, CMA, CMMP, CMP, CMU, codlelur, colecalciferol, colofonato, 8-quinolinolato de cobre, acetato de cobre, acetoarsenita de cobre, arseniato de cobre, carbonato de cobre básico, hidróxido de cobre, naftenato de cobre, oleato de cobre, oxiclورو de cobre, silicato de cobre, sulfato de cobre, sulfato de cobre básico, cromato de

5 cobre y cobre, coumacloro, coumafenó, coumafurilo, coumafós, coumatetralilo, coumetoxistrobina, coumioato, coumoxistrobina, CPMC, CPMF, CPPC, credazina, cresol, ácido cresílico, crimidina, crotamiton, crotoxifos, crotoxifos, cruformato, criolita, cuclure, cufraneb, cumileron, cumiluron, cuprobam, óxido cuproso, curcumenol, CVMP, cianamida, cianatrina, cianazina, cianofenfos, cianógeno, cianofos, ciantoato, ciantraniliprol, ácido cianúrico,

10 ciazofamida, cibutrina, ciclafuramid, ciclanilida, ciclaniliprol, cicletrina, cicloato, cicloheximida, cicloprato, cicloprotrin, ciclopirimorato, ciclosulfamuron, cicloxidim, cicluron, cienopirafeno, ciflufenamida, ciflumetofeno, ciflutrina, cihalofop, cihalotrina, cihexatina, cimiazol, cimoxanil, ciometrinil, cependazol, cipermetrina, ciperquat, cifenotrina, ciprazina, ciprazol, ciproconazol, ciprodinil, ciprofuram, cipromid, ciprosulfamida, ciromazina, citioato, citrex, daimon, dalapon,

15 daminozida, dayoutong, dazomet, DBCP, *d*-camfor, DCB, DCIP, DCPA, DCPTA, DCU, DDD, DDPP, DDT, DDVP, debacarb, decafentin, decametrina, descarbofurano, deet, ácido dehidroacético, deiquat, delaclor, delnav, deltametrin, demefion, demefion-O, demefion-S, demeton, demeton-metilo, demeton-O, demeton-O-metilo, demeton-S, demeton-S-metilo, demeton-S-metilsulfona, DEP, depatonitrina, derris, desmedifam, desmetrin, desmetrina, *d*-

20 fanshiluquebingjuzhi, diafentiuron, dialifor, dialifos, dialato, diamidafos, dianat, tierra de diatomeas, diatomita, diazinon, dibrom, dibutilftalato, dibutil succinato, dicamba, dicapton, diclobenilo, diclofention, diclofluanida, diclona, dicloralurea, diclorbenzuron, diclorfenidim, diclorflurecol, diclorflurenol, diclormato, diclormid, diclorometano, dicloromezotiaz, diclorofeno, diclorprop, diclorprop-P, diclorvos, diclozolina, diclozolina, diclobutrazol,

25 diclocimet, diclofop, diclomezina, dicloran, diclosulm, dicofol, dicofano, dicumarol, dicresilo, dicrotofos, dicrilo, dicumarol, diciclanilo, dicicloclon, dieldrina, dienoclor, diethamquat, dietilato, dietilo, dietion, dietofencarb, dietolato, dieton, pirocarbonato de dietilo, dietiltoluamida, difenacoum, difenoconazol, difenopenten, difenoxuron, difenzoquat, difetialona, diflovidazin, diflubenzuron, diflumecanic, diflufenicanil, diflufenzopir, diflumetorim,

dikegulac, dilor, dimatif, dimeflutrin, dimefox, dimefuron, dimehipo, dimepiperato,
 dimetaclona, dimetan, dimetacarb, dimetaclorona, dimetacloro, dimetametrina, dimetenamida,
 dimetenamida-P, dimehipina, dimetirimol, dimetoato, dimetomorf, dimetina, dimetil carbato,
 dimetil disulfuro, dimetil ftalato, dimetilvinfos, dimetilan, dimexano, dimidazona,
 5 dimoxistrobina, dimpilato, dimuron, dinex, dingjunezuo, diniconazol, diniconazol-M,
 dinitramina, dinitrofenoles, dinobutón, dinocap, dinocap-4, dinocap-6, dinocton, dinofenato,
 dinopenton, dinoprop, dinosam, dinoseb, dinosulfon, dinotefuran, dinoterb, dinoterbon,
 diofenolan, dioxabenzofos, dioxacarb, dioxation, dioxation, difacin, difacinona, difenadiona,
 difenámica, difenamida, difenil sulfona, difenilamina, difenilsulfuro, ácido diprodulínico,
 10 dipropalina, dipropetría, dípteros, dipimetitrona, dipiritiona, diquat, tetraborato de sodio,
 disosultap, disparlur, disugran, disul, disulfiram, disulfoton, ditalimfos, ditianon, diticrofos,
 ditioéter, ditiometon, ditiopir, diuron, dixantogen, *d*- limoneno, DMDS, DMPA, DNOC,
 dodemorf, dodicina, dodina, dofenapin, doguadina, dominicalur, doramectin, DPC, drazoxolon,
 DSMA, *d-trans*-aletrina, *d-trans*-resmetrina, dufulin, dimron, EBEP, EBP, ebufos, ecdisterona,
 15 eclomezol, EDB, EDC, EDDP, edifenfos, eglinazina, emamectina, EMPC, empentrina, enadenina,
 endosulfán, endotelio, endotal, endotion, endrina, enestroburina, enilconazol, enoxastrobina,
 ephirsulfonato, EPN, epocoleon, epofenonano, epoxiconazol, eprinomectina, epronaz, EPTC,
 erbon, ergocalciferol, erlujixiancaoan, esdépalléthrine, esfenvalerato, ESP, esprocarb, etacelasil,
 etaconazol, etafos, etem, etaboxam, etaclor, etalfluralina, etametsulfurón, etaproclor, etefón,
 20 etidimurón, etiofencarb, etiolato, etion, etiozina, etiprol, etirimol, etoato-metilo, etobenzanid,
 etofumesato, etohexadiol, etoprop, etoprofos, etoxifen, etoxiquin, etoxisulfuron, eticlozato,
 formiato de etilo, pirofosfato de etilo, etilan, etil-DDD, etileno, dibromuro de etileno, dicloruro
 de etileno, óxido de etileno, etillicina, etilmercurio 2,3-dihidroxipropil mercáptido, acetato de
 etilmercurio, bromuro de etilmercurio, cloruro de etilmercurio, fosfato de etilmercurio,
 25 etinofeno, ETM, etnipromido, etobenzanid, etofenprox, etoxazol, etridiazol, etrimfos, étrimfos,
 eugenol, EXD, famoxadona, famphur, fenac, fenamidona, fenaminosulf, fenaminstrobin,
 fenamifos, fenapanil, fenarimol, fenaslav, fenazaflor, fenazaquin, fenbuconazol, óxido de
 fenbutatina, fenclorazol, fenclorfos, fenclofos, fenclorim, fenetacarb, fenflutrin, fenfuram,
 fenhexamid, fenidin, fenitropan, fenitrothion, fenizonto, fenjuntong, fenobucarb, fenolovo,

fenoprop, fenotiocarb, fenoxacrim, fenoxanil, fenoxaprop, fenoxaprop-P, fenoxasulfone,
 fenoxicarb, fempiclonil, fempiritrina, fenpropatrina, fenpropidin, fenpropimorf, fempirazamina,
 fempiroximato, fenquinotriona, fenridazon, fenson, fensulfotio, fenteracol, fentiaprop, fentión,
 fention-etilo, fentiaprop, fentin, fentrazamida, fentrifanil, fenurón, fenurón-TCA, fenvalerato,
 5 ferbam, ferimona, fosfato férrico, sulfato ferroso, fipronil, flamprop, flamprop-M, flazasulfuron,
 flocoumafen, flometoquin, flonicamid, florasulam, fluaciripirim, fluazifop, fluazifop-P, fluazinam,
 fluazolato, fluazurón, flubendiamida, flubenzimina, flubrocitinato, flucarbazona, flucetosulfuron,
 flucloalrin, flucofuron, flucicloخور, flucitinato, fludioxonil, fluenetilo, fluenetilo, fluensulfone,
 flufenacet, flufenerim, flufenican, flufenoxuron, flufenoxistrobina, flufenprox, flufenpir,
 10 flufenzina, flufiprol, fluhexafon, flumetrina, flumetover, flumetralin, flumetsulam, flumezina,
 flumiclorac, flumioxazin, flumipropin, flumorf, fluometuron, fluopiramida, fluopiram,
 fluorbensida, fluoridamid, fluoroacetamida, ácido fluoroacético, fluorocloridona, fluorodifeno,
 fluoroglicofeno, fluoroimida, fluoromida, fluoromidina, fluoronitrofen, fluoroxipir, fluotiuron,
 fluotrimazol, fluoxastrobina, flupoxam, flupropacil, flupropadina, flupropanato, flupiradifurona,
 15 flupirsulfurón, fluquinconazol, fluralaner, flurazol, flurecol, flurenol, fluridona, flurocloridona,
 fluromidina, fluroxipir, flurprimidol, flursulamida, flurtamona, flusilazol, flusulfamida, flutenzina,
 flutiacet, flutiamida, flutianilo, flutolanil, flutriafol, fluvalinato, fluxaproxad, fluxofenim, folpel,
 folpet, fomesafen, fonofos, foramsulfurón, forclorfenurón, formaldehído, formetanato,
 formotión, formparanate, fosamina, fosetilo, fosmetilan, fospirato, fostiazato, fostietan,
 20 frontalina, ftalidea, fuberidazol, fucaojing, fucaomi, fujunmanzhi, fulumi, fumarin,
 funaihecaoling, fufentiourea, furalano, furalaxil, furametrina, furametpir, furan tebufenozida,
 furatiocarb, furcarbanil, furconazol, furconazol-cis, furetrina, furfural, furilazol, furmeciclox,
 furofanato, furiloxifen, *gamma*-BHC, *gamma*-cihalotrina, *gamma*-HCH, genit, ácido giberélico,
 giberelina A3, giberelinas, gliftor, glitor, glucocloral, glufosinato, glufosinato-P, gliodin, glioxima,
 25 glifosato, glifosina, gossiplur, grandlur, griseofulvin, guanocina, guazatina, halacrinato,
 halauxifen, halfenprox, halofenozida, halosafen, halosulfuron, haloxidina, haloxifop, haloxifop-P,
 haloxifop-R, HCA, HCB, HCH, hemel, hempa, HEOD, heptacloro, heptaflutrina, heptenofos,
 heptopargilo, herbicina, herbicina A, heterofos, hexacloro, hexacloro, hexacloroacetona,
 hexaclorobenceno, hexaclorobutadieno, hexaclorofeno, hexaconazol, hexaflumuron,

hexafluoramin, hexaflurato, hexalur, hexamida, hexazinona, hexiltiofos, hexitiazox, HHDN, holosulf, homobrassinolida, huancaiwo, huanchongjing, huangcaoling, huanjunzuo, hidrametilnon, hidrargafen, cal hidratada, cianamida de hidrógeno, cianuro de hidrógeno, hidropreno, hidroxiiisoxazol, himexazol, hiquincarb, IAA, IBA, IBP, icaridina, imazalpina,

5 imazaptabenz, imazamox, imazapic, imazapir, imazaquin, imazetapir, imazosulfuron, imibenconazol, imiciafos, imidacloprid, imidaclotiz, iminoctadina, imiprotrina, inabenfida, indanofan, indaziflam, indoxacarb, inezin, tierra infusoria, yodobonilo, yodocarb, yodofenfos, yodoetano, yodosulfuron, iofensulfuron, ioxinilo, ipanina, IPC, ipconazol, ipfencarbazona, ipfentrifluconazol, iprobenfos, iprodiona, iprovalicarb, iprimidam, ipsidienol, ipsovalicar, IPSP,

10 IPX, isamidofos, isazofos, isobenzan, isocarbamida, isocarbamida, isocarbofos, isocilo, isodrina, isofenfos, isofenfos-metilo, isofetamida, isolan, isometiozina, isonoruron, esopamfos, isopolinato, isoprocab, isoproclil, isopropalina, isopropazol, isoprotiolano, isoproturon, isopirazam, isopirimol, isotioato, isotianil, isouron, isovalediona, isoxaben, isoxaclortol, isoxadifen, isoxaflutol, isoxapirifop, isoxation, isuron, ivermectina, ixoxaben, izopamfos,

15 izopamphos, japonilur, japotrin, jasmolin I, jasmolin II, ácido jasmónico, jiahuangchongzong, jiajizengxiaolin, jiaxiangjunzhi, jiecaowan, jiecaoxi, Jinganmicina A, jodfenfos, hormona juvenil I, hormona juvenil II, hormona juvenil III, kadetrina, kappa-bifentrina, kappa-teflutrina, karbutilato, karetazan, kasugamicina, kejunlin, kelevan, ketospiradox, kieselguhr, kinetina, kinopreno, kiralaxilo, kresoxim-metilo, kuicaoxi, lactofen, *lambda*-alhalotrina, latilur, arseniato

20 de plomo, lenacilo, lepimectina, leptofos, lianbenjingzhi, azufre lima, lindano, lineatina, linuron, lirimfos, litlur, looplur, lufenuron, lüxiancaolin, lvdingjunzhi, lvfumijvzhi, lvxiancaolin, litidation, M-74, M-81, MAA, fosfuro de magnesio, malation, maldison, hidrazida maleica, malonoben, maltodextrina, MAMA, mancopper, mancozeb, mandestrobina, mandipropamid, maneb,

25 matrina, mazidox, MCC, MCP, MCPA, MCPA-tioetilo, MCPB, MCPB, mebenil, mecarbame, mecarbinzid, mecarfon, mecoprop, mecoprop-P, medimeform, medinoterb, medlur, mefenacet, mefenoxam, mefenpir, mefluidida, ácido megatomoico, melissil alcohol, melitoxina, MEMC, menazon, MEP, mepanipirim, meperflutrina, mefenato, mefosfolan, mepiquat, mepronil, meptildinocap, mercaptodimetur, mercaptofos, mercaptofosiol, mercaptotion, cloruro de mercurio, óxido de mercurio, cloruro de mercurio, merfos, óxido de merfo, mesoprazina,

mesosulfurón, mesotriona, mesulfen, mesulfenfos, mesulfen, metacresol, metaflumizona, metalaxilo, metalaxil-M, metaldehído, metam, metamifop, metamitrón, metafos, metaxon, metazacloro, metazosulfurón, metazoxolon, metconazol, metepa, metflurazon, metabenzotiazurón, metacrifos, metanfetamina alpropalin, metam, metamidofos, 5 metasulfocarb, metazol, metfuroxam, metibenzuron, metidation, metiobencarb, metiocarb, metiopirisulfuron, meti-scopa, metiozolin, metiuron, metocrotofos, metohetrol, metometon, metomil, metopreno, metoprotrina, metoprotrina, metoquin-butilo, metotrina, metoxicloro, metoxifenoza, metoxifenona, metil afolato, bromuro de metilo, metil eugenol, yoduro de metilo, isotiocianato de metilo, metil paration, metilacetofos, metilcloroformo, ácido 10 metilditiocarbámico, metildimron, cloruro de metileno, metil-isofenfos, metilmercaptofos, óxido de metilmercaptofos, metilmercaptofos tiol, benzoato de metilmercurio, metilmercurio diciandiamida, metilmercurio pentaclorofenóxido, metilneodecanamida, metilnitrofos, metiltriazotión, metiozolin, metiram, metiram-zinc, metobenzuron, metobromuron, metoflutrina, metolaclor, metolcarb, metometuron, metominostrobina, metosulam, 15 metoxadiazona, metoxuron, metrafenona, metriam, metribuzina, metrifonato, metrifonato, metsulfovax, metsulfuron, mevinfos, mexacarbato, miechuwei, mieshuan, miewenjuzhi, milbemectina, milbemicina oxima, milneb, mima2nan, mipafox, MIPC, mirex, MNAF, moguchun, molinato, molosultap, momfluorotrina, monaluro, monisuron, monoamitraz, ácido monocloroacético, monocrotofos, monolinuron, monomehipo, monosulfiram, monosulfuron, 20 monosultap, monuron, monuron-TCA, morfamquat, moroxidina, morfotion, morzid, moxidectina, MPMC, MSMA, MTMC, muscalur, miclobutanilo, miclozolin, miricil alcohol, N-(etilmercurio)-*p*-toluenesulfonanilida, NAA, NAAm, nabam, naftalofos, naled, naftaleno, naftaleneacetamida, anhídrido naftálico, naftalofos, ácidos nafttoxiacéticos, ácidos naftilacéticos, naftilindano-1,3-dionas, ácidos naftiloxiacéticos, naproanilida, napropamida, 25 napropamida-M, naptalam, natamicina, NBPOS, neburea, neburon, nendrina, neonicotina, niclorfos, niclofen, niclosamida, nicobifen, nicosulfuron, nicotina, sulfato de nicotina, nifluridida, nikkomicinas, NIP, nipur aclofeno, nipiralofen, nitenpiram, nitiazina, nitralina, nitrapirina, nitrilcarb, nitrofen, nitrofluorfen, nitroestireno, nitrotal-isopropilo, nobormide, nonanol, norbormide, norea, norflurazon, nor nicotina, noruron, novaluron, noviflumuron, NPA, nuarimol,

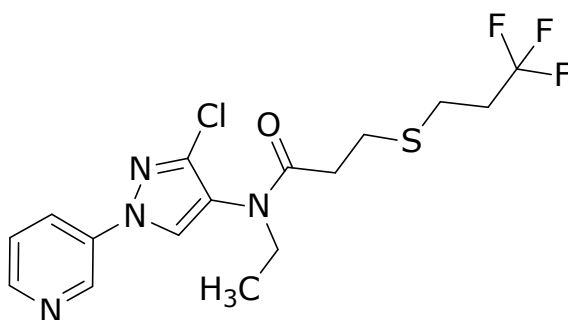
nuranona, OCH, éter de octaclorodipropilo, octilinona, *o*-diclorobenceno, ofurace, ometoato, *o*-
 fenilfenol, orbencarb, orfralur, ortobencarb, *orto*-diclorobenceno, ortosulfamuron, orictalur,
 orisaestrobina, orizalina, ostol, ostola, ostromona, ovatron, Ovex, oxabetrinilo, oxadiargilo,
 oxadiazon, oxadixilo, oxamato, oxamil, oxapirazon, oxapirazona, oxasulfuron, oxatiapiprolina,
 5 oxaziclomefona, oxina-cobre, oxina-Cu, ácido oxolínico, oxpoconazol, oxicarboxina, oxidemeton-
 metilo, oxideprofos, oxidisulfoton, oxienadenina, oxifluorfen, oximatrina, oxitetraciclina,
 oxtioquinox, PAC, paclobutrazol, paichongding, paletrina, PAP, *para*-diclorobenceno,
 parafluron, paraquat, paratión, paratión-metilo, parinol, verde de París, PCNB, PCP, PCP-Na, *p*-
 diclorobenceno, PDJ, pebulado, pedinex, pefurazoato, ácido pelargónico, penconazol,
 10 penciclórico, pendiftalínico, penfenato, penfluorfen, penflurón, penoxalina, penoxsulam,
 pentaclorofenol, laurato de pentaclorofenilo, pentanocloro, pentiopirad, pentmetrina,
 pentoxazona, perclordecona, perfluidona, permetrina, petoxamid, PHC, fenamacril, fenamacril-
 etilo, fenaminosulf, óxido de fenazina, fenetacarbo, fenisofam, fenkapton, fenmedifam,
 fenmedifam-etilo, fenobenzuron, fenotiol, fenotrina, fenpróxido, fentoato, fenilmercuriurea,
 15 acetato de fenilmercurio, cloruro de fenilmercurio, derivado fenilmercurio de pirocatecol,
 nitrato de fenilmercurio, salicilato de fenilmercurio, forato, fosasona, fosasulfonato, fosfo-
 fosfato, fosfocínico, fosfocloro, fosfocloro, fosfonato, fosfamida, fosfamidina, fosfamidina,
 fosfatidina, fosfoamida fósforo, fostin, foxim, foxim-metilo, ftalida, ftalofos, phthalthrin,
 picarbutrazox, picaridin, picloram, picolinafen, picoxistrobina, pimaricina, pindona, pinoxaden,
 20 piperalina, piperazina, butóxido de piperonilo, piperonil ciclonena, piperofos, piproctanli,
 piproctanlo, piprotal, pirimetafos, pirimicarb, piriminil, pirimioxifos, pirimifos-etilo, pirimifos-
 metilo, Pival, pivaldiona, plifenato, PMA, PMP, polibutenos, policarbamato, policlorcamfeno,
 polietoxiquinolina, polioxina D, polioxinas, polioxorim, politialan, arsenito de potasio, azida de
 potasio, cianato de potasio, etilxantato de potasio, naftenato de potasio, polisulfuro de potasio,
 25 tiocianato de potasio, pp'-DDT, pralettrina, precoceno I, precoceno II, precoceno III, pretilacloro,
 primidofos, primisulfuron, probenazol, procloraz, proclonol, procyazina, procimidona,
 prodiamina, profenofos, profluazol, profluralin, proflutrin, profoxidim, profurite-aminium,
 proglinazina, prohexadiona, prohidrojasmon, promacil, promecarb, prometón, prometrina,
 prometrina, promurit, pronamida, propaclor, propafos, propamidina, propamocarb, propanilo,

propafos, propaquizafop, propargita, propartrina, propazina, propetamfos, profam, propiconazol, propidine, propineb, propisocloro, propoxur, propoxicarbazona, propilisoma, propirisulfuron, propizamida, proquinazid, prosuler, prosulfalin, prosulfocarb, prosulfuron, protidación, protiocarb, protioconazol, protofos, prothoato, protrifenbuto, proxan, primidofos, 5 prinaclor, psoralen, psoraleno, pidanon, piflubumida, pimetrozina, piracarbolid, piraclofos, piraclonil, piraclostrobina, piraflufen, pirafluprol, piramat, pirametostrobina, piraoxistrobina, piosulfotol, piraziflumido, pirazolato, pirazolileno, pirazono, pirazoforos, pirazotion, pirazofen, piresmetrina, piretrina I, piretrina II, piretrinas, piribambenz-isopropilo, piribambenz-propilo, piribencarb, piribenzoxim, piributicarb, piricloro, piridaben, piridalilo, piridalilo, piridafention, 10 piridafention, piridato, piridinitril, pirifenox, pirifluquinazon, piriftalid, pirimetafos, pirimetanil, pirimicarbo, pirimidifen, piriminobac, piriminostrobina, pirimifos-etilo, pirimifos-metilo, pirimisulfan, pirimitate, pirinuron, piriofenona, piriprol, piripropanol, piriproxifeno, pirisoxazol, piritiobac, pirolan, piroquilon, piroxasulfona, piroxsulam, piroxichlor, piroxifur, qincaosuan, qingkuling, quassia, quinacetol, quinalfos, quinalfos-metilo, quinazamid, quinclorac, 15 quinconazol, quinmerac, quinoclamina, quinometionato, quinonamid, quinion, quinoxifen, quintiofos, quintozeno, quizalofop, quizalofop-P, quwenzhi, quyingding, rabenzazol, rafoxanida, R-diniconazol, rebemida, reglone, renriduron, rescalur, resmetrina, rodetanil, rodojaponina-III, ribavirina, rimsulfurón, rizazol, R-metalaxil, rodetanil, ronnel, rotenona, riania, sabadilla, saflufenacil, saijunmao, saisentong, salicilanilida, salifluofen, sanguinarina, santonina, S- 20 bioaletrina, scradan, scillirosida, sebutilazina, sebumeton, sedax, selamectin, semiamitraz, sesamex, sesamolina, sesona, setoxidim, sevin, shuangjiaancaolin, shuangjianancaolin, S-hidropreno, siduron, sifumijvzhi, siglur, silafluofen, silatrano, gel de sílice, gel de sílice, siltiofam, siltiofam, siltiofan, silvex, simazina, simeconazol, simeton, simetrina, simetrina, sintofen, S-kinopreno, cal apagada, SMA, S-metopreno, S-metolacloro, arsenito de sodio, azida de sodio, 25 clorato de sodio, cianuro de sodio, fluoruro de sodio, fluoroacetato de sodio, hexafluorosilicato de sodio, naftenato de sodio, o-fenilfenóxido de sodio, ortofenilfenóxido de sodio, pentaclorofenato de sodio, pentaclorofenóxido de sodio, polisulfuro de sodio, silicofluoruro de sodio, tetratiocarbonato de sodio, tiocianato de sodio, solan, sofamida, spinetoram, spinosad, spirodiclofen, spiromesifen, spirotetramat, spiroxamina, stirofos, estreptomicina, estricnina,

sulcatol, sulcofuron, sulcotriona, sulfallato, sulfentrazona, sulfiram, sulfluramid, sulfodiazol,
 sulfometuron, sulfosato, sulfosulfuron, sulfotep, sulfotepp, sulfoxaflor, sulfóxido, sulfoxima,
 azufre, ácido sulfúrico, fluoruro de sulfurilo, sulglicapina, sulfosfato, sulprofos, sultropen, swep,
tau-fluvalinato, tavrón, tazimcarb, TBTO, TBZ, TCA, TCBA, TCMTB, TCNB, TDE, tebuconazol,
 5 tebufenozida, tebufenpirato, tebufloquin, tebupirimfos, tebutam, tebutiuron, tecloftalam,
 tecnazeno, tecoram, tedion, teflubenzuron, teflutrin, tefuriltriona, tembotriona, temefos,
 temefos, tepa, TEPP, tepraloxidim, teproloxidim, teraletrina, terbacilo, terbucarb, terbuclor,
 terbufos, terbumeton, terbutilazina, terbutol, terbutrina, terbutrina, terraclor, terramicina,
 terramicina, tetciclacis, tetracloroetano, tetraclorvinfos, tetraconazol, tetradifon, tetradisul,
 10 tetrafluron, tetrametilrin, tetrametilflutrin, tetramina, tetranactin, tetraniliprol, tetrapion,
 tetrasul, sulfato de talio, sulfato de talio, tenilclor, *theta*-cipermetrina, tiabendazol, tiaclopid,
 tiadiazina, tiadifluor, tiametoxam, tiameturon, tiapronil, Tiazafluron, tiazfluron, tiazona, tiazopir,
 ticrofos, ticrofeno, tidiazimina, tidiazurón, tiencarbazona, tifensulfurón, tifluzamida, timerosal,
 timet, tiobencarb, tiocarboxima, tioclorfenfem, tioclorfenfime, tiocianatodinitrobenzenos,
 15 tiociclam, Tiodan, tiodiazol-cobre, tiodicarb, tiofanocarb, tiofanox, tiofluoximato, tiohempa,
 tiomersal, tiometón, tionazina, tiofanato, tiofanato de etilo, tiofanato de metilo, tiofos,
 tioquinox, tiosemicarbazida, tiosultap, tiotepa, tioxamilo, tiram, tiuram, turingiosina,
 tiabendazol, tiadinilo, tiafenacilo, tiaojian, TIBA, tifatol, tiocarbacilo, tioclorim, tioxazafen,
 tioximid, tirpato, TMTD, tolclofos-metilo, tolfenpirad, tolprocarb, tolopralato, tolilfluanida,
 20 tolilfluanida, acetato de tolilmercurio, tomarina, topamezona, toxafeno, TPN, tralcoxidim,
 tralocitrina, tralometriona, tralopirilo, transflutrina, transpermetrina, tretamina, triacontanol,
 triadimefon, triadimenol, triafamona, trialato, tri-alilato, triamifos, triapentenol, triarateno,
 triarimol, triasulfurón, triazabonato, triazbutil, triaziflam, triazofos, triazotion, triazóxido, cloruro
 de cobre tribásico, sulfato de cobre tribásico, tribenurón, tribufos, óxido de tributilestaño,
 25 tricamba, triclámida, tricloro, triclorfon, triclormetafos-3, tricloronat, tricloronato,
 triclorotrinitrobenzenos, triclorfon, triclopir, triclopiricarb, tricresol, triciclazol, hidróxido de
 triciclohexiltin, tridemorf, tridifano, trietazina, trifenmorf, trifenofos, trifloxistrobina,
 trifloxisulfuron, trifludimoxazin, triflumezopyrim, triflumizol, triflumuron, trifluralin,
 triflusulfuron, trifop, trifopsina, triforina, trihidroxitriazina, trimedlur, trimetacarb, trimeturon,

trinexapac, trifeniltin, tripreno, tripropindan, triptolida, tritac, tritilan, triticonazol, tritosulfuron, trunc-call, tuoyelin, uniconazol, uniconazol-P, urbacida, uredepa, valerato, validamicina, validamicina A, valifenalato, valona, vamidotion, vangard, vaniliprol, vernolato, vinclozolin, vitamina D3, warfarina, xiaochongliulin, xinjunan, xiwojunan, xiwojunzhi, XMC, xilaclor, xilenoles, xililcarb, ximiazol, yishijing, zarilamid, zeatin, zengxiaoan, zengxiaolin, zeta-cipermetrina, naftenato de zinc, fosfuro de zinc, tiazol zinc, tiozol zinc, triclorofenato de zinc, triclorofenóxido de zinc, zineb, ziram, zolaprofos, zoocoumarina, zoxamida, zuoanjuan zhi, zuocaoan, zuojunzhi, zuomihuanglong, α -clorohidrina, α -ecdisona, α -multistriatina, α -naftalenoacéticos, y β -ecdisona;

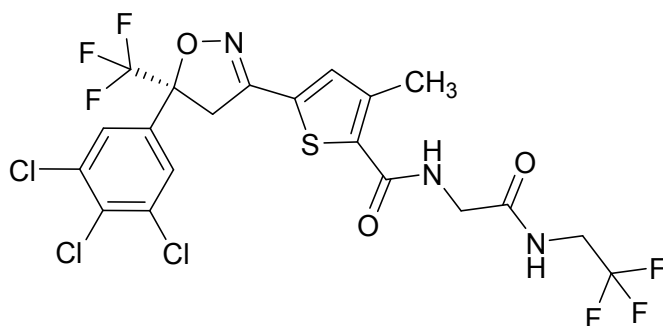
(2) la siguiente molécula



N-(3-cloro-1-(piridin-3-il)-1*H*-pirazol-4-il)-*N*-etil-3-((3,3,3-trifluoropropil)tio)propanamida

En este documento, esta molécula, para un uso fácil, se nombra “AI-1;”

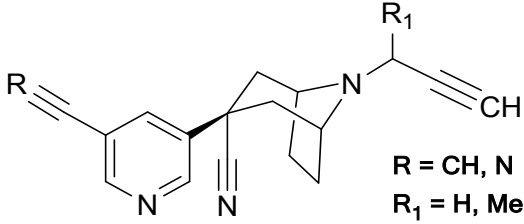
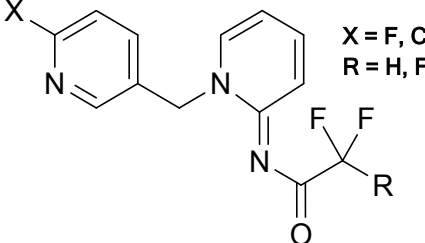
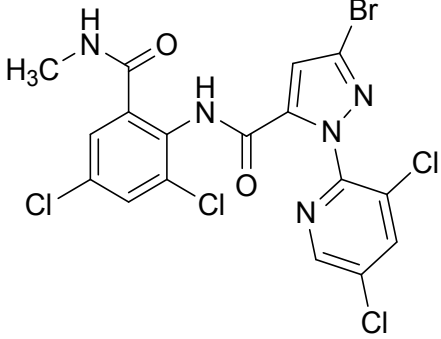
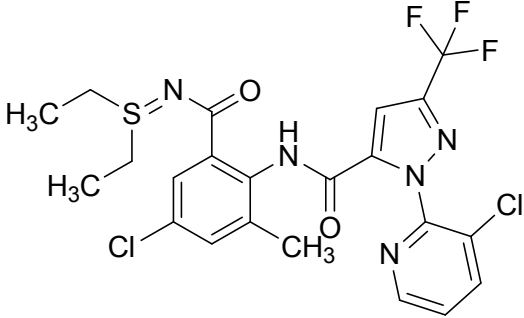
(3) una molécula conocida como Lotilaner que tiene la siguiente estructura

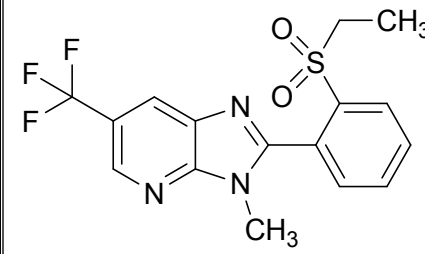
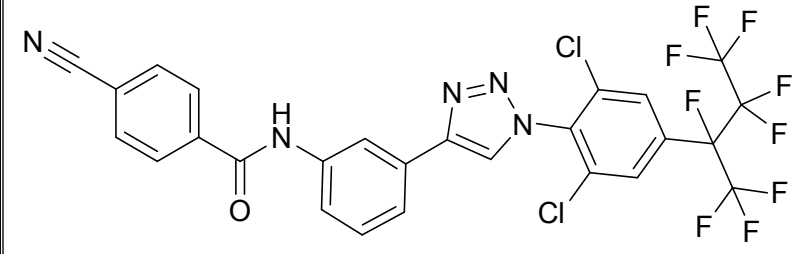


; y

(4) las siguientes moléculas en la Tabla A

Tabla A. Estructura de ingredientes activos – M

Nombre	Estructura
M1	 $R = \text{CH}, \text{N}$ $R_1 = \text{H}, \text{Me}$
M2	 $X = \text{F}, \text{Cl}$ $R = \text{H}, \text{F}$
M3	
M4	

M5	
M6	

Como se usa en esta descripción, cada uno de los anteriores es un ingrediente activo, y dos o más ingredientes activos. Para más información consultar el “COMPENDIUM OF PESTICIDE COMMON NAMES” que se encuentra en ALANWOOD.NET y varias ediciones, que incluyen la edición en línea de “The Pesticide Manual” que se encuentra en bcpcdata.com.

El término “alquenilo” significa un sustituyente acíclico, insaturado (al menos enlace doble carbono-carbono), ramificado o no ramificado, que consiste en carbono e hidrógeno, por ejemplo, vinilo, alilo, butenilo, pentenilo y hexenilo.

El término “alqueniloxi” significa un alquenilo que consiste además en un enlace simple carbono-oxígeno, por ejemplo, aliloxi, buteniloxi, penteniloxi, hexeniloxi.

El término “alcoxi” significa un alquilo que consiste además en un enlace simple carbono-oxígeno, por ejemplo, metoxi, etoxi, propoxi, isopropoxi, butoxi, isobutoxi y *terc*-butoxi.

El término “alquilo” significa un sustituyente acíclico, saturado, ramificado o no ramificado, que consiste en carbono e hidrógeno, por ejemplo, metilo, etilo, propilo, isopropilo, butilo y *terc*-butilo.

El término “alquinilo” significa un sustituyente acíclico, insaturado (al menos un enlace triple carbono-carbono), ramificado o no ramificado, que consiste en carbono e hidrógeno, por ejemplo, etinilo, propargilo, butinilo y pentinilo.

El término “alquiniloxi” significa un alquinilo que consiste además en un enlace simple carbono-oxígeno, por ejemplo, pentiniloxi, hexiniloxi, heptiniloxi y octiniloxi.

El término “arilo” significa un sustituyente aromático, cíclico que consiste en hidrógeno y carbono, por ejemplo, fenilo, naftilo y bifenilo.

- 5 El término “bioplaguicida” significa un agente de control biológico microbiano que, en general, se aplica de una manera similar a los plaguicidas químicos. Comúnmente son bacterianos, pero también son ejemplos de agentes de control fúngico, que incluye *Trichoderma* spp. y *Ampelomyces quisqualis*. Un ejemplo de bioplaguicida bien conocido es *Bacillus thuringiensis*, una enfermedad bacteriana de Lepidoptera, Coleoptera y Diptera. Los bioplaguicidas incluyen
- 10 los productos basados en:

(1) hongos entomopatógenos (por ejemplo *Metarhizium anisopliae*);

(2) nemátodos entomopatógenos (por ejemplo *Steinernema feltiae*); y

(3) virus entomopatógenos (por ejemplo *Cydia pomonella* granulovirus).

- Otros ejemplos de organismos entomopatógenos incluyen, pero sin limitarse a, baculovirus,
- 15 protozoos y microsporidios. Para evitar dudas, los bioplaguicidas son considerados como ingredientes activos.

- El término “cicloalquenilo” significa un sustituyente monocíclico o policíclico, insaturado (al menos un enlace doble carbono-carbono) que consiste en carbono e hidrógeno, por ejemplo, ciclobutenilo, ciclopentenilo, ciclohexenilo, norbornenilo, biciclo[2.2.2]octenilo,
- 20 tetrahidronaftilo, hexahidronaftilo y octahidronaftilo.

El término “cicloalqueniloxi” significa un cicloalquenilo que consiste además en un enlace simple carbono-oxígeno, por ejemplo, ciclobuteniloxi, ciclopenteniloxi, norborneniloxi y biciclo[2.2.2]octeniloxi.

- El término “cicloalquilo” significa un sustituyente monocíclico o policíclico, saturado que
- 25 consiste en carbono e hidrógeno, por ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, norbornilo, biciclo[2.2.2]octilo y decahidronaftilo.

El término “cicloalcoxi” significa un cicloalquilo que consiste además en un enlace simple carbono-oxígeno, por ejemplo, ciclopropiloxi, ciclobutiloxi, ciclopentiloxi, norborniloxi y biciclo[2.2.2]octiloxi.

El término “halo” significa un flúor, cloro, bromo y yodo.

El término “haloalcoxi” significa un alcoxi que consiste además en, de uno hasta el máximo número posible de halos idénticos o diferentes, por ejemplo, fluorometoxi, trifluorometoxi, 2,2-difluoropropoxi, clorometoxi, triclorometoxi, 1,1,2,2-tetrafluoroetoxi y pentafluoroetoxi.

- 5 El término “haloalquilo” significa un alquilo que consiste además en, de uno hasta el máximo número posible de halos idénticos o diferentes, por ejemplo, fluorometilo, trifluorometilo, 2,2-difluoropropilo, clorometilo, triclorometilo y 1,1,2,2-tetrafluoroetilo.

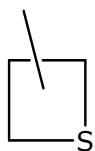
El término “heterociclilo” significa un sustituyente cíclico que puede ser aromático, completamente saturado, o parcialmente o completamente insaturado, donde la estructura
10 cíclica contiene al menos un carbono y al menos un heteroátomo, donde dicho heteroátomo es nitrógeno, azufre, u oxígeno. Los ejemplos son:

(1) sustituyentes heterociclilo aromáticos incluyen, sin limitarse a, benzofuranilo, benzoisotiazolilo, benzoisoxazolilo, benzoxazolilo, benzotienilo, benzotiazolilo cinnolinilo, furanilo, indazolilo, indolilo, imidazolilo, isoindolilo, isoquinolinilo, isotiazolilo, isoxazolilo,
15 oxadiazolilo, oxazolinilo, oxazolilo, ftalazinilo, pirazinilo, pirazolinilo, pirazolilo, piridazinilo, piridilo, pirimidinilo, pirrolilo, quinazolinilo, quinolinilo, quinoxalinilo, tetrazolilo, tiazolinilo, tiazolilo, tienilo, triazinilo y triazolilo;

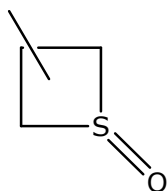
(2) sustituyentes heterociclilo completamente saturados incluyen, sin limitarse a, piperazinilo, piperidinilo, morfolinilo, pirrolidinilo, tetrahidrofuranilo, y tetrahidropiranilo;

20 (3) sustituyentes heterociclilos parcialmente o completamente insaturados incluyen, pero sin limitarse a, 1,2,3,4-tetrahidro-quinolinil, 4,5-dihidro-oxazolilo, 4,5-dihidro-1*H*-pirazolilo, 4,5-dihidro-isoxazolilo, y 2,3-dihidro-[1,3,4]-oxadiazolilo, y

(4) Ejemplos adicionales de heterociclos incluyen los siguientes:

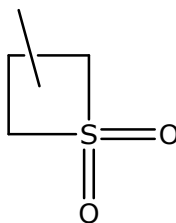


25 tiettano



tiettano-óxido

y



tiettano-dióxido.

El término “locus” significa un hábitat, tierra de cultivo, planta, semilla, suelo, material, o ambiente, en el que una plaga crece, puede crecer, o puede atravesar, por ejemplo, un locus puede ser: donde crecen cultivos, árboles, frutas, cereales, especies forrajeras, viñas, césped y/o plantas ornamentales; donde residen animales domesticados; las superficies interiores o exteriores de los edificios (tales como los lugares donde se almacenan los granos); los materiales de construcción utilizados en los edificios (tal como la madera impregnada); y el suelo alrededor de los edificios.

La frase “Material MoA” se refiere a un material que tiene un modo de acción (“MoA”) como se indica en la Puntuación de MoA IRAC v. 7.3, que se encuentra en irac-online.org., la cual describe:

- (1) Inhibidores de acetilcolinesterasa (AChE);
- (2) Antagonistas de canales de cloro dependientes de GABA;
- (3) Moduladores de canales de sodio;
- (4) Agonistas de receptores nicotínicos de acetilcolina (nAChR);
- (5) Activadores alostéricos de receptores nicotínicos de acetilcolina (nAChR);
- (6) Activadores de canales de cloro;
- (7) Imitadores de la hormona juvenil;
- (8) Inhibidores misceláneos no específicos (multisitios);
- (9) Moduladores de Órgano Chordotonal;
- (10) Inhibidores del crecimiento de ácaros;
- (11) Disruptores microbianos de las membranas de intestino medio de insectos;
- (12) Inhibidores de la ATP sintasa mitocondrial;
- (13) Desacopladores de la fosforilación oxidativa a través de la interrupción del gradiente de protones;
- (14) Bloqueadores de los canales del receptor nicotínico de acetilcolina (nAChR);
- (15) Inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 0;
- (16) Inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 1;
- (17) Disruptor de muda, Dipteran;
- (18) Agonistas del receptor de Ecdisona;

- (19) Agonistas del receptor de octopamina;
- (20) Inhibidores del transporte de electrones del complejo III mitocondrial;
- (21) Inhibidores del transporte de electrones del complejo I mitocondrial;
- (22) Bloqueadores de canales de sodio dependientes de voltaje;
- 5 (23) Inhibidores de la acetil CoA carboxilasa;
- (24) Inhibidores del transporte de electrones del complejo mitocondrial IV;
- (25) Inhibidores del transporte de electrones del complejo II mitocondrial; y
- (28) Moduladores del receptor de la Ryanodina.

La frase “grupo de materiales MoA alfa” (en adelante “MoAMGA”) significa colectivamente los

10 siguientes materiales, abamectina, acefato, acequinocilo, acetamiprid, acrinatrina, alanicarb, aldicarb, aletrina, *alfa*-cipermetrina, fosfuro de aluminio, amitraz, azametifos, azinfos-etilo, azinfos-metilo, azociclotina, bendiocarb, benfuracarb, bensultap, *beta*-ciflutrina, *beta*-ciceritrina, bifentrina, bioaletrina, isómero de S-ciclopentenilo bioaletrina, biorresmetrina, bistriflurón, bórax, buprofezina, butocarboxim, butoxicarboxim, cadusafos, fosfuro de calcio,

15 carbarilo, carbofurano, carbosulfán, clorhidrato de cartap, clorantraniliprol, clordano, cloretoxifos, clorfenapir, clorfenvinfos, clorfluazuron, clormefos, cloropicrina, clorpirifos, clorpirifos-metilo, cromafenozida, clofentezina, clotianidina, coumafos, cianida, cianofos, ciantraniliprol, cicloprotrin, cienopirafen, ciflumetofen, ciflutrina, cihalotrina, cihexatina, cipermetrina, cifenotrina, ciromazina, *d-cis-trans*- aletrina, DDT, deltametrina, demeton-S-

20 metilo, diafentiuurón, diazinon, diclorvos/DDVP, dicrotofos, diflovidazin, diflubenzurón, dimetoato, dimetilvinfos, dinotefurano, disulfotonsulfona, DNOC, *d-trans*-aletrina, benzoato de emamectina, empentrina, endosulfán, EPN, esfenvalerato, etiofencarb, etiión, etoprofos, etofenprox, etoxazol, famfur, fenamifos, fenazaquin, óxido de fenbutatin, fenitrothion, fenobucarb, fenoxicarb, fenpropatrin, fenpiroximato, fention, fenvalerato, flonicamid,

25 fluacripirim, flubendiamida, flucicloxuron, flucitrinato, flufenoxuron, flumetrina, flupiradifurona, formetanato, fostiazato, furatiocarb, *gamma*-alhalotrina, halfenprox, halofenozida, heptenofos, hexaflumurón, hexitiazox, hydrametilnon, hidropreno, imiaciafos, imidacloprid, imiprotrin, indoxacarb, isofenfos, isoprocarb, isoxation, kadetrin, kinopreno, *lambda*-alhalotrina, lepimectina, lufenurón, malatión, mecarbam, metaflumizona, metamidofós, metidatión,

metiocarb, metomil, metopreno, (metoxiaminotio-fosforilo) salicilato, metoxicloro, metoxifenoazida, metilbromuro, metolcarb, mevinfos, milbemectina, monocrotofos, naled, nicotina, nitenpiram, novalurón, noviflumurón, oxamilo, oxidemetón-metilo, paratión, paratión-metilo, permetrina, fenotrina, fentoato, forato, fosadona, fosmet, fosfamidon, fosfina, foxim, 5 pirimicarb, pirimifos-metilo, praletrina, profenofos, propargita, propetamfos, propoxur, protiofos, pirimetrozina, piraclofos, piretrina, piridaben, piridafention, pirimidifeno, piriproxifen, quinalfos, resmetrina, rotenona, silafluofeno, spinetoram, spinosad, spirodiclofen, spiromesifen, spirotriamat, sulfluramid, sulfotep, sulfoxaflor, fluoruro de sulfurilo, tártaro emético, *tau*-fluvalinato, tebufenoazida, tebufenpirad, tebupirimfos, teflubenzurón, teflutrina, temefós, 10 terbufos, tetraclorvinfos, tetradifón, tetrametrina, tetrametrina, *theta*-cipermetrina, tiacloprid, tiametoxam, tiociclam, tiodicarb, tiofanox, tiometon, tiosultap-sodio, tolfenpirad, tralometrina, transflutrina, triazamato, triazofos, triclorfon, triflumuron, trimetacarb, vamidotion, XMC, xililcarb, *zeta*-cipermetrina, y fosfuro de zinc. Para evitar dudas, cada uno de los materiales anteriores es un ingrediente activo.

15 El término “plaga” significa un organismo que es perjudicial para los seres humanos, o las preocupaciones humanas (como cultivos, alimentos, ganado, etc.), donde dicho organismo es del filo Arthropoda, Mollusca o Nematoda, los ejemplos particulares son hormigas, áfidos, escarabajos, cola de flecos, cucarachas, grillos, tijeretas, pulgas, moscas, saltamontes, chicharritas, piojos (incluidos los piojos de mar), langostas, ácaros, polillas, nematodos, 20 escamas, synfilas, termitas, trips, garrapatas, avispas y moscas blancas, ejemplos adicionales son plagas en:

- (1) Subfilos Chelicerata, Myriapoda, Crustacea, y Hexapoda;
- (2) Clases de Arachnida, Maxillopoda, Symphyla, e Insecta;
- (3) Orden Anoplura. Una lista no exhaustiva de géneros particulares incluye, pero sin limitarse a, 25 *Haematopinus* spp., *Hoplopleura* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., y *Polyplax* spp. Una lista no exhaustiva de especies particulares incluye, pero sin limitarse a, *Haematopinus asini*, *Haematopinus suis*, *Linognathus setosus*, *Linognathus ovillus*, *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus humanus*, y *Pthirus pubis*.

- (4) Orden Coleoptera. Una lista no exhaustiva de géneros particulares incluye, pero sin limitarse a, *Acanthoscelides* spp., *Agriotes* spp., *Anthonomus* spp., *Apion* spp., *Apogonia* spp., *Aulacophora* spp., *Bruchus* spp., *Cerosterna* spp., *Cerotoma* spp., *Ceutorhynchus* spp., *Chaetocnema* spp., *Colaspis* spp., *Ctenicera* spp., *Curculio* spp., *Cyclocephala* spp., *Diabrotica* spp., *Hypera* spp., *Ips* spp., *Lyctus* spp., *Megascelis* spp., *Meligethes* spp., *Otiorhynchus* spp., *Pantomorus* spp., *Phyllophaga* spp., *Phyllotreta* spp., *Rhizotrogus* spp., *Rhynchites* spp., *Rhynchophorus* spp., *Scolytus* spp., *Sphenophorus* spp., *Sitophilus* spp., y *Tribolium* spp. Una lista no exhaustiva de especies particulares incluye, pero sin limitarse a, *Acanthoscelides obtectus*, *Agrilus planipennis*, *Anoplophora glabripennis*, *Anthonomus grandis*, *Ataenius spretulus*, *Atomaria linearis*, *Bothynoderes punctiventris*, *Bruchus pisorum*, *Callosobruchus maculatus*, *Carpophilus hemipterus*, *Cassida vittata*, *Cerotoma trifurcata*, *Ceutorhynchus assimilis*, *Ceutorhynchus napi*, *Conoderus scalaris*, *Conoderus stigmosus*, *Conotrachelus nenuphar*, *Cotinis nitida*, *Crioceris asparagi*, *Cryptolestes ferrugineus*, *Cryptolestes pusillus*, *Cryptolestes turcicus*, *Cylindrocopturus adspersus*, *Deporaus marginatus*, *Dermestes lardarius*, *Dermestes maculatus*, *Epilachna varivestis*, *Faustinus cubae*, *Hylobius pales*, *Hypera postica*, *Hypothenemus hampei*, *Lasioderma serricorne*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Liogenys fuscus*, *Liogenys suturalis*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Maecolaspis jolivetii*, *Melanotus communis*, *Meligethes aeneus*, *Melolontha melolontha*, *Oberea brevis*, *Oberea linearis*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus mercator*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Oulema melanopus*, *Oulema oryzae*, *Phyllophaga cuyabana*, *Popillia japonica*, *Prostephanus truncatus*, *Rhyzopertha dominica*, *Sitona lineatus*, *Sitophilus granarius*, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Stegobium paniceum*, *Tribolium castaneum*, *Tribolium confusum*, *Trogoderma variabile*, y *Zabrus tenebrioides*.
- (5) Orden Dermaptera. Una lista no exhaustiva de especies particulares incluye, pero sin limitarse a, *Forficula auricularia*.
- (6) Orden Blattaria. Una lista no exhaustiva de especies particulares incluye, pero sin limitarse a, *Blattella germanica*, *Blatta orientalis*, *Parcoblatta pennsilvanica*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta australasiae*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Pycnoscelus surinamensis*, y *Supella longipalpa*.

(7) Orden Diptera. Una lista no exhaustiva de géneros particulares incluye, pero sin limitarse a, *Aedes* spp., *Agromyza* spp., *Anastrepha* spp., *Anopheles* spp., *Bactrocera* spp., *Ceratitis* spp., *Chrysops* spp., *Cochliomyia* spp., *Contarinia* spp., *Culex* spp., *Dasineura* spp., *Delia* spp., *Drosophila* spp., *Fannia* spp., *ilemyia* spp., *Liriomyza* spp., *Musca* spp., *Phorbia* spp., *Tabanus* spp., y *Tipula* spp. Una lista no exhaustiva de especies particulares incluye, pero sin limitarse a, *Agromyza frontella*, *Anastrepha suspensa*, *Anastrepha ludens*, *Anastrepha obliqua*, *Bactrocera cucurbitae*, *Bactrocera dorsalis*, *Bactrocera invadens*, *Bactrocera zonata*, *Ceratitis capitata*, *Dasineura brassicae*, *Delia platyura*, *Fannia canicularis*, *Fannia scalaris*, *Gasterophilus intestinalis*, *Gracillia perseae*, *Haematobia irritans*, *Hypoderma lineatum*, *Liriomyza brassicae*, *Melophagus ovinus*, *Musca autumnalis*, *Musca domestica*, *Oestrus ovis*, *Oscinella frit*, *Pegomya betae*, *Psila rosae*, *Rhagoletis cerasi*, *Rhagoletis pomonella*, *Rhagoletis mendax*, *Sitodiplosis mosellana*, y *Stomoxys calcitrans*.

(8) Orden Hemiptera. Una lista no exhaustiva de géneros particulares incluye, pero sin limitarse a, *Adelges* spp., *Aulacaspis* spp., *Aphrophora* spp., *Aphis* spp., *Bemisia* spp., *Ceroplastes* spp., *Chionaspis* spp., *Chrysomphalus* spp., *Coccus* spp., *Empoasca* spp., *Lepidosaphes* spp., *Lagynotomus* spp., *Lygus* spp., *Macrosiphum* spp., *Nephotettix* spp., *Nezara* spp., *Philaenus* spp., *Phytocoris* spp., *Piezodorus* spp., *Planococcus* spp., *Pseudococcus* spp., *Rhopalosiphum* spp., *Saissetia* spp., *Therioaphis* spp., *Toumeyella* spp., *Toxoptera* spp., *Trialeurodes* spp., *Triatoma* spp. y *Unaspis* spp. Una lista no exhaustiva de especies particulares incluye, pero no se limita a,, *Acrosternum hilare*, *Acyrtosiphon pisum*, *Aleyrodes proletella*, *Aleurodicus dispersus*, *Aleurothrixus floccosus*, *Amrasca biguttula biguttula*, *Aonidiella aurantii*, *Aphis gossypii*, *Aphis glycines*, *Aphis pomi*, *Aulacorthum solani*, *Bemisia argentifolii*, *Bemisia tabaci*, *Blissus leucopterus*, *Brachycorynella asparagi*, *Brevinnia rehi*, *Brevicoryne brassicae*, *Calocoris norvegicus*, *Ceroplastes rubens*, *Cimex hemipterus*, *Cimex lectularius*, *Dagbertus fasciatus*, *Dichelops furcatus*, *Diuraphis noxia*, *Diaphorina citri*, *Dysaphis plantaginea*, *Dysdercus suturellus*, *Edessa mediatubunda*, *Eriosoma lanigerum*, *Eurygaster maura*, *Euschistus heros*, *Euschistus servus*, *Helopeltis antonii*, *Helopeltis theivora*, *Icerya purchasi*, *Idioscopus nitidulus*, *Laodelphax striatellus*, *Leptocorisa oratorius*, *Leptocorisa varicornis*, *Lygus hesperus*, *Maconellicoccus hirsutus*, *Macrosiphum euphorbiae*, *Macrosiphum granarium*, *Macrosiphum rosae*, *Macrosteles*

quadrilineatus, *Mahanarva frimbiolata*, *Metopolophium dirhodum*, *Mictis longicornis*, *Myzus persicae*, *Nephotettix cinctipes*, *Neurocolpus longirostris*, *Nezara viridula*, *Nilaparvata lugens*, *Parlatoria pergandii*, *Parlatoria ziziphi*, *Peregrinus maidis*, *Phylloxera vitifoliae*, *Physokermes piceae*, *Phytocoris californicus*, *Phytocoris relativus*, *Piezodorus guildinii*, *Poecilocapsus lineatus*,
5 *Psallus vaccinicola*, *Pseudacysta perseae*, *Pseudococcus brevipes*, *Quadraspidiotus perniciosus*, *Rhopalosiphum maidis*, *Rhopalosiphum padi*, *Saissetia oleae*, *Scaptocoris castanea*, *Schizaphis graminum*, *Sitobion avenae*, *Sogatella furcifera*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Trialeurodes abutiloneus*, *Unaspis yanonensis*, y *Zulia entrerriana*.

(9) Orden Hymenoptera. Una lista no exhaustiva de géneros particulares incluye, pero sin
10 limitarse a, *Acromyrmex* spp., *Atta* spp., *Camponotus* spp., *Diprion* spp., *Formica* spp., *Monomorium* spp., *Neodiprion* spp., *Pogonomyrmex* spp., *Polistes* spp., *Solenopsis* spp., *Vespula* spp., y *Xylocopa* spp. Una lista no exhaustiva de especies particulares incluye, pero sin limitarse a, *Athalia rosae*, *Atta texana*, *Iridomyrmex humilis*, *Monomorium minimum*, *Monomorium pharaonis*, *Solenopsis invicta*, *Solenopsis geminata*, *Solenopsis molesta*, *Solenopsis richteri*,
15 *Solenopsis xyloni*, y *Tapinoma sessile*.

(10) Orden Isoptera. Una lista no exhaustiva de géneros particulares incluye, pero sin limitarse a, *Coptotermes* spp., *Cornitermes* spp., *Cryptotermes* spp., *Heterotermes* spp., *Kaloterms* spp., *Incisitermes* spp., *Macrotermes* spp., *Marginitermes* spp., *Microcerotermes* spp., *Procornitermes* spp., *Reticulitermes* spp., *Schedorhinotermes* spp., y *Zootermopsis* spp. Una lista no exhaustiva
20 de especies particulares incluye, pero sin limitarse a, *Coptotermes curvignathus*, *Coptotermes frenchi*, *Coptotermes formosanus*, *Heterotermes aureus*, *Microtermes obesi*, *Reticulitermes banyulensis*, *Reticulitermes grassei*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes hageni*, *Reticulitermes hesperus*, *Reticulitermes santonensis*, *Reticulitermes speratus*, *Reticulitermes tibialis*, y *Reticulitermes virginicus*.

(11) Orden Lepidoptera. Una lista no exhaustiva de géneros particulares incluye, pero no se
25 limita a, *Adoxophyes* spp., *Agrotis* spp., *Argyrotaenia* spp., *Cacoecia* spp., *Caloptilia* spp., *Chilo* spp., *Chrysodeixis* spp., *Colias* spp., *Crambus* spp., *Diaphania* spp., *Diatraea* spp., *Earias* spp., *Ephestia* spp., *Epimecis* spp., *Feltia* spp., *Gortyna* spp., *Helicoverpa* spp., *Heliothis* spp., *Indarbela* spp., *Lithocolletis* spp., *Loxagrotis* spp., *Malacosoma* spp., *Peridroma* spp., *Pillonorycter* spp.,

Pseudaletia spp., *Sesamia* spp., *Spodoptera* spp., *Synanthedon* spp., y *Yponomeuta* spp. Una lista no exhaustiva de especies particulares incluye, pero no se limita a, *Achaea janata*, *Adoxophyes orana*, *Agrotis ipsilon*, *Alabama argillacea*, *Amorbia cuneana*, *Amyelois transitella*, *Anacamptodes defectaria*, *Anarsia lineatella*, *Anomis sabulifera*, *Anticarsia gemmatalis*, *Archips argyrospila*, *Archips rosana*, *Argyrotaenia citrana*, *Autographa gamma*, *Bonagota cranaodes*, *Borbo cinnara*, *Bucculatrix thurberiella*, *Capua reticulana*, *Carposina niponensis*, *Chlumetia transversa*, *Choristoneura rosaceana*, *Cnaphalocrocis medinalis*, *Conopomorpha cramerella*, *Cossus cossus*, *Cydia caryana*, *Cydia funebrana*, *Cydia molesta*, *Cydia nigricana*, *Cydia pomonella*, *Darna diducta*, *Diatraea saccharalis*, *Diatraea grandiosella*, *Earias insulana*, *Earias vittella*, *Ecdytolopha aurantianum*, *Elasmopalpus lignosellus*, *Ephestia cautella*, *Ephestia elutella*, *Ephestia kuehniella*, *Epinotia aporema*, *Epiphyas postvittana*, *Erionota thrax*, *Eupoecilia ambiguella*, *Euxoa auxiliaris*, *Grapholita molesta*, *Hedylepta indicata*, *Helicoverpa armigera*, *Helicoverpa zea*, *Heliiothis virescens*, *Hellula undalis*, *Keiferia lycopersicella*, *Leucinodes orbonalis*, *Leucoptera coffeella*, *Leucoptera malifoliella*, *Lobesia botrana*, *Loxagrotis albicosta*, *Lymantria dispar*, *Lyonetia clerkella*, *Mahasena corbetti*, *Mamestra brassicae*, *Maruca testulalis*, *Metisa plana*, *Mythimna unipuncta*, *Neoleucinodes elegantalis*, *Nymphula depunctalis*, *Operophtera brumata*, *Ostrinia nubilalis*, *Oxydia vesulia*, *Pandemis cerasana*, *Pandemis heparana*, *Papilio demodocus*, *Pectinophora gossypiella*, *Peridroma saucia*, *Perileucoptera coffeella*, *Phthorimaea operculella*, *Phyllocnistis citrella*, *Pieris rapae*, *Plathypena scabra*, *Plodia interpunctella*, *Plutella xylostella*, *Polychrosis viteana*, *Prays endocarpa*, *Prays oleae*, *Pseudaletia unipuncta*, *Pseudoplusia includens*, *Rachiplusia nu*, *Scirpophaga incertulas*, *Sesamia inferens*, *Sesamia nonagrioides*, *Setora nitens*, *Sitotroga cerealella*, *Sparganothis pilleriana*, *Spodoptera exigua*, *Spodoptera frugiperda*, *Spodoptera eridania*, *Thecla basilides*, *Tineola bisselliella*, *Trichoplusia ni*, *Tuta absoluta*, *Zeuzera coffeae*, y *Zeuzera pyrina*;

(12) Orden Mallophaga. Una lista no exhaustiva de géneros particulares incluye, pero sin limitarse a *Anaticola* spp., *Bovicola* spp., *Chelopistes* spp., *Goniodes* spp., *Menacanthus* spp., y *Trichodectes* spp. Una lista no exhaustiva de especies particulares incluye, pero sin limitarse a, *Bovicola bovis*, *Bovicola caprae*, *Bovicola ovis*, *Chelopistes meleagridis*, *Goniodes dissimilis*, *Goniodes gigas*, *Menacanthus stramineus*, *Menopon gallinae*, y *Trichodectes canis*.

- (13) Orden Orthoptera. Una lista no exhaustiva de géneros particulares incluye, pero sin limitarse a, *Melanoplus* spp. y *Pterofilla* spp. Una lista no exhaustiva de especies particulares incluye, pero sin limitarse a, *Anabrus simplex*, *Gryllotalpa africana*, *Gryllotalpa australis*, *Gryllotalpa brachyptera*, *Gryllotalpa hexadactyla*, *Locusta migratoria*, *Microcentrum retinerve*,
5 *Schistocerca gregaria*, y *Scuddería furcata*.
- (14) Orden Siphonaptera. Una lista no exhaustiva de especies particulares incluye, pero sin limitarse a, *Ceratopillus gallinae*, *Ceratopillus niger*, *Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*, y *Pulex irritans*.
- (15) Orden Siphonostomatoida. Una lista no exhaustiva de especies particulares incluye, pero
10 sin limitarse a, *Lepeophtheirus salmonis*, *Lepeophtheirus pectoralis*, *Caligus elongatus*, y *Caligus clemensi*.
- (16) Orden Thysanoptera. Una lista no exhaustiva de géneros particulares incluye, pero sin limitarse a, *Caliothrips* spp., *Frankliniella* spp., *Scirtothrips* spp. y *Thrips* spp. Una lista no exhaustiva de especies particulares incluye, pero sin limitarse a, *Frankliniella fusca*, *Frankliniella*
15 *occidentalis*, *Frankliniella schultzei*, *Frankliniella williamsi*, *Heliothrips haemorrhoidalis*, *Rhipiphorothrips cruentatus*, *Scirtothrips citri*, *Scirtothrips dorsalis*, *Taeniothrips rhopalantennalis*, *Thrips hawaiiensis*, *Thrips nigropilosus*, *Thrips orientalis*, y *Thrips tabaci*.
- (17) Orden Thysanura. Una lista no exhaustiva de géneros particulares incluye, pero sin limitarse a, *Lepisma* spp. y *Thermobia* spp..
- (18) Orden Acarina. Una lista no exhaustiva de géneros particulares incluye, pero sin limitarse a,
20 *Acarus* spp., *Aculops* spp., *Boophilus* spp., *Demodex* spp., *Dermacentor* spp., *Epitrimerus* spp., *Eriophyes* spp., *Ixodes* spp., *Oligonychus* spp., *Panonychus* spp., *Rhizoglyphus* spp., y *Tetranychus* spp. Una lista no exhaustiva de géneros particulares incluye, pero sin limitarse a,
25 *Acarapis woodi*, *Acarus siro*, *Aceria mangiferae*, *Aculops lycopersici*, *Aculus pelekassi*, *Aculus schlechtendali*, *Amblyomma americanum*, *Brevipalpus obovatus*, *Brevipalpus phoenicis*, *Dermacentor variabilis*, *Dermatophagoides pteronyssinus*, *Eotetranychus carpini*, *Notoedres cati*, *Oligonychus coffeae*, *Oligonychus ilicis*, *Panonychus citri*, *Panonychus ulmi*, *Pillocoptruta oleivora*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Sarcoptes scabiei*, *Tegolophus perseafloae*, *Tetranychus urticae*, y *Varroa destructor*.

(19) Orden Symphyla. Una lista no exhaustiva de especies particulares incluye, pero sin limitarse a, *Scutigera immaculata*.

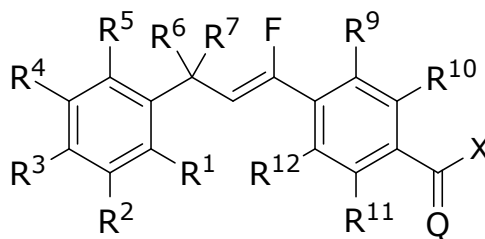
(20) Filo Nematoda. Una lista no exhaustiva de géneros particulares incluye, pero sin limitarse a, *Aphelenchoides* spp., *Belonolaimus* spp., *Criconebella* spp., *Ditylenchus* spp., *Heterodera* spp., *Hirschmanniella* spp., *Hoplolaimus* spp., *Meloidogyne* spp., *Pratylenchus* spp., y *Radopholus* spp.

Una lista no exhaustiva de especies particulares incluye, pero sin limitarse a, *Dirofilaria immitis*, *Heterodera zea*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne javanica*, *Onchocerca volvulus*, *Radopholus similis*, y *Rotylenchulus reniformis*.

La frase “cantidad con eficacia plaguicida” significa la cantidad de un plaguicida necesaria para lograr un efecto observable sobre una plaga, por ejemplo, los efectos de necrosis, muerte, retardo, prevención, eliminación, destrucción o disminución de cualquier otra manera de la ocurrencia y/o actividad de una plaga en un locus, este efecto puede surgir cuando, las poblaciones de plagas son rechazadas de un locus, las plagas quedan incapacitadas en, o alrededor de, un locus, y/o las plagas son exterminadas en, o alrededor de, un locus. Por supuesto, puede ocurrir una combinación de estos efectos. Generalmente, las poblaciones de plagas, su actividad, o ambas se reducen convenientemente en más del cincuenta por ciento, preferentemente más del 90 por ciento y con la máxima preferencia más del 99 por ciento. En general, una cantidad con eficacia plaguicida, para propósitos de la agricultura, es de aproximadamente 0.0001 gramos por hectárea (10^{-8} gramos por m^2) a aproximadamente 5000 gramos por hectárea (0.5 gramos por m^2), preferentemente de aproximadamente 0.0001 gramos por hectárea (10^{-8} gramos por m^2) a aproximadamente 500 gramos por hectárea (0.05 gramos por m^2) e incluso con mayor preferencia de aproximadamente 0.0001 gramos por hectárea (10^{-8} gramos por m^2) a aproximadamente 50 gramos por hectárea (0.005 gramos por m^2).

DESCRIPCIÓN DETALLADA DE LA DESCRIPCIÓN

Este documento describe las moléculas de la Fórmula Uno



Fórmula Uno

en donde:

- (A) R^1 , R^5 , R^6 , R^{11} , y R^{12} se seleccionan cada uno independientemente del grupo que consiste en H, F, Cl, Br, I, CN, (C₁-C₄)alquilo, (C₁-C₄)haloalquilo, (C₁-C₄)alcoxi, y (C₁-C₄)haloalcoxi;
- (B) R^2 , R^3 , y R^4 se seleccionan cada uno independientemente del grupo que consiste en H, F, Cl, Br, I, CN, (C₁-C₄)alquilo, (C₂-C₄)alquenilo, (C₂-C₄)alquinilo, (C₁-C₄)haloalquilo, (C₁-C₄)alcoxi, y (C₁-C₄)haloalcoxi;
- (C) R^7 es (C₁-C₆)haloalquilo;
- (D) R^9 se selecciona del grupo que consiste en (F), H, F, Cl, Br, I, CN, (C₁-C₄)alquilo, (C₁-C₄)haloalquilo, (C₁-C₄)alcoxi, y (C₁-C₄)haloalcoxi;
- (E) R^{10} se selecciona del grupo que consiste en (F), F, Cl, Br, I, CN, (C₁-C₄)alquilo, (C₂-C₄)alquenilo, (C₂-C₄)alquinilo, (C₁-C₄)haloalquilo, (C₁-C₄)alcoxi, y (C₁-C₄)haloalcoxi;
- (F) R^9 y R^{10} pueden, opcionalmente, formar juntos un enlace hidrocarbilo de 3 a 5 miembros saturados o no saturados,
- en donde dicho enlace hidrocarbilo puede sustituirse opcionalmente con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, y CN;
- (G) X es
 - (1) $NR^{13}R^{14}$ en donde R^{13} y R^{14} se seleccionan cada uno independientemente del grupo que consiste en H, CHO, (C₁-C₄)alquilo, (C₂-C₄)alquenilo, (C₁-C₄)haloalquilo, (C₁-C₄)alcoxi, (C₁-C₄)haloalcoxi, (C₃-C₈)cicloalquilo, (C₁-C₄)alquilfenilo, (C₁-C₄)alquilpiridilo, piridilo, CH=NO(C₁-C₄)alquilo, (C₁-C₄)alquilCH=NO(C₁-C₄)haloalquilo, (C₁-C₄)alquilNH(C₁-C₄)haloalquilo, (C₁-C₄)alquilN((C₁-C₄)alquil)(C₁-C₄)haloalquilo, tietanilo, tietanil-óxido, y tietanil-dióxido,
 - en donde cada alquilo, alquenilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, cicloalquilo, fenilo, piridilo, tietanilo, tietanil-óxido, y tietanil-dióxido puede sustituirse opcionalmente con uno o más

sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, CN, OH, (C₁-C₄)alquilo, y (C₁-C₄)alcoxi,

(2)N=CHN((C₁-C₄)alquil)₂, o

(3)Z donde Z es un heterociclilo que comprende 3- a 7-átomos, en donde al menos uno de dichos átomos es un nitrógeno, y en donde dicho nitrógeno tiene un enlace a C(=Q), en donde dicho heterohidrociclilo puede sustituirse opcionalmente con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, y CN;

(H)Q se selecciona del grupo que consiste en O y S; y

sales de adición de ácido aceptables en la agricultura, derivados de sales, solvatos, derivados de ésteres, polimorfos cristalinos, isótopos, estereoisómeros resueltos y tautómeros, de las moléculas de la Fórmula Uno.

En otra modalidad R¹, R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁹, R¹¹, R¹², R¹³, y R¹⁴ son H. Esta modalidad puede usarse en combinación con las otras modalidades de R², R⁷, R¹⁰, y Q.

En otra modalidad R² es Cl, Br, o CH₃. Esta modalidad puede usarse en combinación con las otras modalidades de R¹, R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁴, y Q.

En otra modalidad R³ es F, Cl, o Br. Esta modalidad puede usarse en combinación con las otras modalidades de R¹, R², R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁴, y Q.

En otra modalidad R⁴ es Cl, Br, o CH₃. Esta modalidad puede usarse en combinación con las otras modalidades de R¹, R², R³, R⁵, R⁶, R⁷, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁴, y Q.

En otra modalidad R², R³, y R⁴ son Cl. Esta modalidad puede usarse en combinación con las otras modalidades de R¹, R⁵, R⁶, R⁷, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁴, y Q.

En otra modalidad R⁷ es (C₁-C₆)haloalquilo. Esta modalidad puede usarse en combinación con las otras modalidades de R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁴, y Q.

En otra modalidad R⁷ es CF₃. Esta modalidad puede usarse en combinación con las otras modalidades de R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁴, y Q.

En otra modalidad R¹⁰ es Br, CH₃, o CF₃. Esta modalidad puede usarse en combinación con las otras modalidades de R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁹, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁴, y Q.

En otra modalidad X es NR¹³R¹⁴ en donde R¹³ y R¹⁴ son H, CHO, CH₃, CH₂CF₃, CH(CH₃)CF₃, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclohexilo, CH(CH₃)fenilo, CH₂piridilo, piridilo, o CH=NOCH₃, en donde

dicho ciclohexilo y fenilo puede sustituirse opcionalmente con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en F, Cl, CH₃, y OCH₃. Esta modalidad puede usarse en combinación con las otras modalidades de R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁹, R¹¹, R¹², y Q.

- 5 En otra modalidad X es N=CHN(CH₃)₂. Esta modalidad puede usarse en combinación con las otras modalidades de R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁹, R¹¹, R¹², y Q.

En otra modalidad X es Z donde Z es pirrolidina. Esta modalidad puede usarse en combinación con las otras modalidades de R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁹, R¹¹, R¹², y Q.

- 10 En otra modalidad Q es O o S. Esta modalidad puede usarse en combinación con las otras modalidades de R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹³, y R¹⁴.

En otra modalidad:

(A)R¹, R⁵, R⁶, R¹¹, y R¹² son H;

(B)R², R³, y R⁴ se seleccionan cada uno independientemente del grupo que consiste en H, F, Cl, Br, y (C₁-C₄)alquilo;

- 15 (C)R⁷ es (C₁-C₆)haloalquilo;

(D)R⁹ es H;

(E)R¹⁰ se selecciona del grupo que consiste en Br, (C₁-C₄)alquilo, y (C₁-C₄)haloalquilo;

(G)X es

- 20 (1)NR¹³R¹⁴ en donde R¹³ y R¹⁴ se seleccionan cada uno independientemente del grupo que consiste en H, CHO, (C₁-C₄)alquilo, (C₁-C₄)haloalquilo, (C₃-C₈)cicloalquilo, (C₁-C₄)alquil fenilo, (C₁-C₄)alquil piridilo, piridilo, y CH=NO(C₁-C₄)alquilo,

en donde cada alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, fenilo, y piridil puede sustituirse opcionalmente con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en F, Cl, (C₁-C₄)alquilo, y (C₁-C₄)alcoxi,

- 25 (2)N=CHN((C₁-C₄)alquil)₂, o

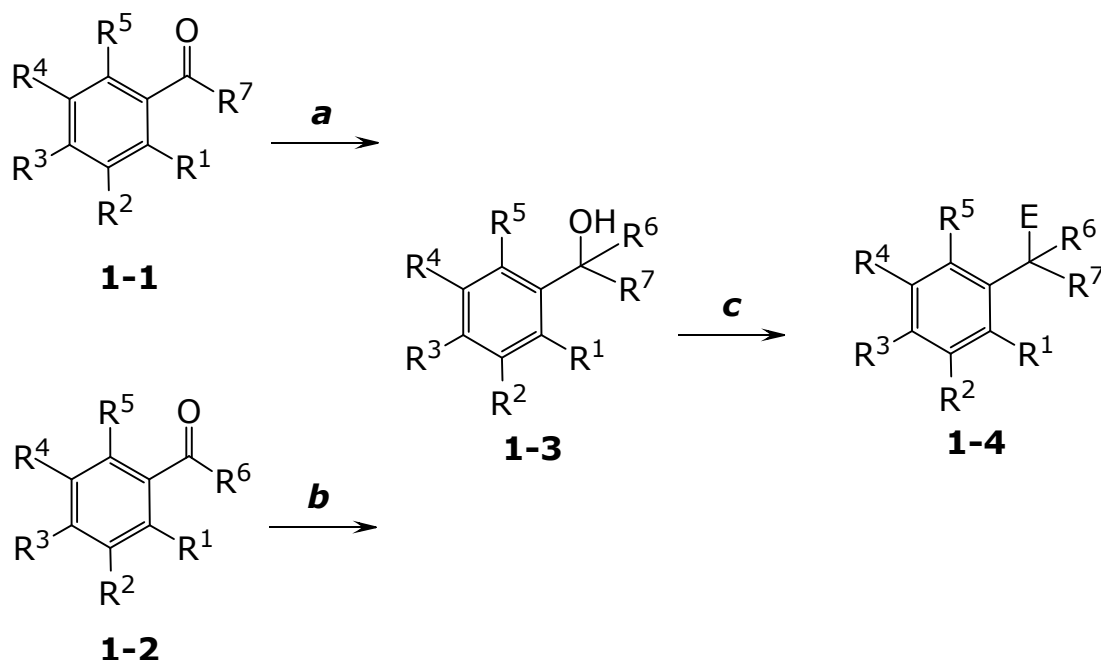
(3)Z donde Z es un heterocicilo que comprende 3- a 7-átomos, en donde al menos uno de dichos átomos es un nitrógeno, y en donde dicho nitrógeno tiene un enlace a C(=Q); y

(H)Q se selecciona del grupo que consiste en O y S.

PREPARACIÓN DE HALUROS DE BENCILO

El alcohol de bencilo 1-3, en donde R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , y R^7 son como se describió anteriormente, puede prepararse de varias maneras. Las cetonas 1-1 pueden prepararse mediante el tratamiento de bromobencenos con una base de litio tal como *n*-butillitio en un
5 solvente aprótico polar preferentemente éter dietílico a temperaturas de aproximadamente $-78\text{ }^{\circ}\text{C}$ a aproximadamente $0\text{ }^{\circ}\text{C}$ seguido del tratamiento con ésteres $R^7\text{C(O)O(C}_1\text{-C}_4\text{)alquilo}$, en donde R^7 es como se describió anteriormente, tal como 2,2-difluoropropanoato de etilo (no mostrado). El tratamiento de cetonas 1-1, en donde R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , y R^7 son como se describió anteriormente, con un agente reductor tal como borohidruro de sodio, en presencia de una
10 base, tal como hidróxido de sodio acuoso, en un solvente prótico polar preferentemente metanol a aproximadamente $-10\text{ }^{\circ}\text{C}$ a aproximadamente $10\text{ }^{\circ}\text{C}$ puede proporcionar alcoholes de bencilo 1-3 (Esquema 1, etapa *a*). Alternativamente, los aldehídos 1-2, en donde R^6 es H y R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , y R^5 son como se describió anteriormente, pueden dejarse reaccionar con trifluorotrimetilsilano en presencia de una cantidad catalítica de fluoruro de tetrabutilamonio
15 en un solvente aprótico polar preferentemente tetrahidrofurano (Esquema 1, etapa *b*) para proporcionar alcoholes de bencilo 1-3, en donde R^7 es CF_3 . Posteriormente, los alcoholes de bencilo 1-3 pueden convertirse en haluros de bencilo 1-4, en donde E es Br, Cl, o I, y R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , y R^7 son como se describió anteriormente, mediante el tratamiento con un reactivo halogenante, tal como *N*-bromosuccinimida, y trietilfosfito en un solvente que no reacciona con
20 los reactivos preferentemente diclorometano a aproximadamente $40\text{ }^{\circ}\text{C}$ para proporcionar haluros de bencilo 1-4, E es Br (Esquema 1, etapa *c*). Alternativamente, los alcoholes de bencilo 1-3 pueden convertirse en haluros de bencilo 1-4, donde E es Br mediante el tratamiento con un cloruro de sulfonilo tal como cloruro de metanosulfonilo en presencia de una base tal como trietilamina y el tratamiento posterior del sulfonato resultante con un bromuro de metal de
25 transición tal como bromuro de hierro(III). Además, el tratamiento con reactivos clorantes tal como cloruro de tionilo en presencia de una base tal como piridina en un solvente de hidrocarburo tal como tolueno a aproximadamente $110\text{ }^{\circ}\text{C}$ puede proporcionar haluros de bencilo 1-4, donde E es Cl (Esquema 1, etapa *c*).

Esquema 1



PREPARACIÓN DE ÉSTERES Y ÁCIDOS VINILBENZOICOS FLUORADOS

Los ácidos halobenzoicos 2-1, en donde R^9 , R^{10} , R^{11} , y R^{12} son como se describió anteriormente

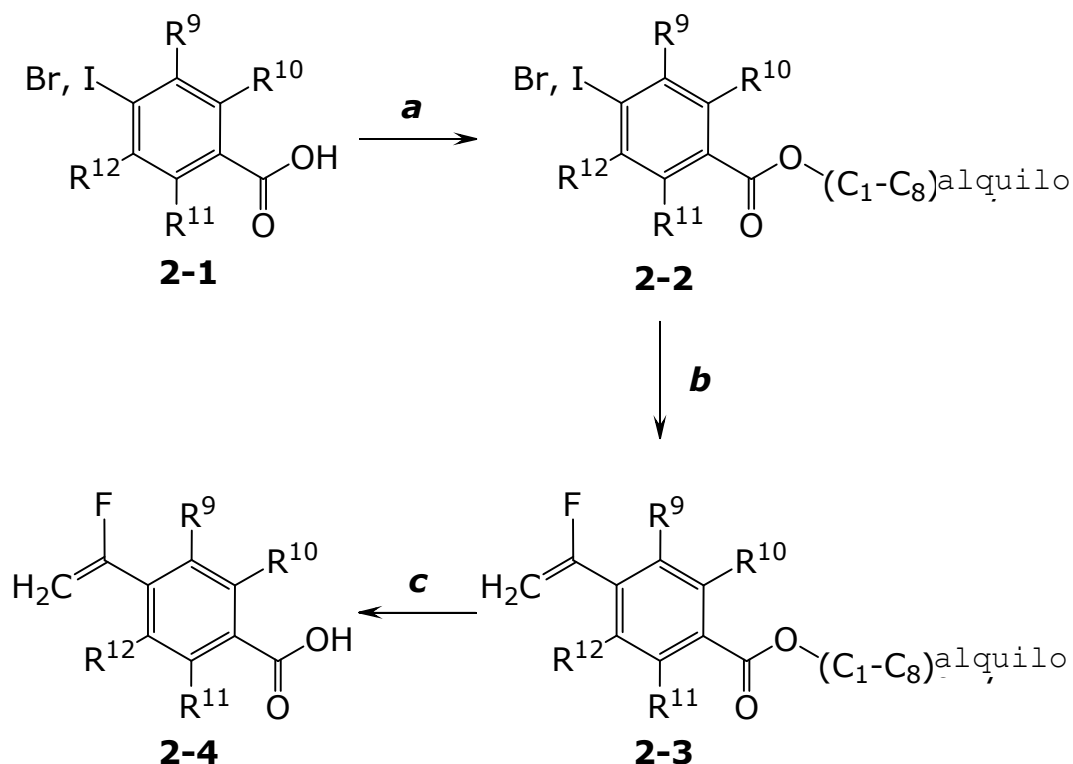
5 pueden convertirse en ésteres de ácido halobenzoico 2-2, en donde R^9 , R^{10} , R^{11} , y R^{12} son como se describió anteriormente. Los ácidos halobenzoicos 2-1, pueden tratarse con un ácido, tal como ácido sulfúrico, en presencia de un (C_1-C_8) alcohol tal como etanol, para proporcionar ésteres etílicos de ácido benzoico 2-2 (Esquema 2, etapa *a*). Los ésteres de ácido vinilbenzoico fluorados 2-3 pueden obtenerse *mediante* la reacción de 2-2 con un silano de vinilo fluorado en

10 presencia de un catalizador de paladio tal como tetrakis(trifenilfosfina)paladio(0), un aditivo de cobre tal como yoduro de cobre(I), y una fuente de fluoruro, tal como fluoruro de cesio en un solvente aprótico polar preferentemente 1,3-dimetil-2-imidazolidinona a temperaturas en el intervalo de aproximadamente temperatura ambiente a aproximadamente 45 °C, para proporcionar ésteres de ácido vinilbenzoico fluorados 2-3 (Esquema 2, etapa *b*). Los ésteres de

15 ácido vinilbenzoico fluorados 2-3 pueden tratarse con una fuente de hidróxido metálico tal como hidróxido de litio en un sistema de solventes mezclados que comprende un solvente aprótico polar preferentemente tetrahidrofurano y solventes próticos polares preferentemente

metanol y agua a aproximadamente temperatura ambiente para proporcionar ácidos vinilbenzoicos fluorados 2-4 (Esquema 2, etapa c).

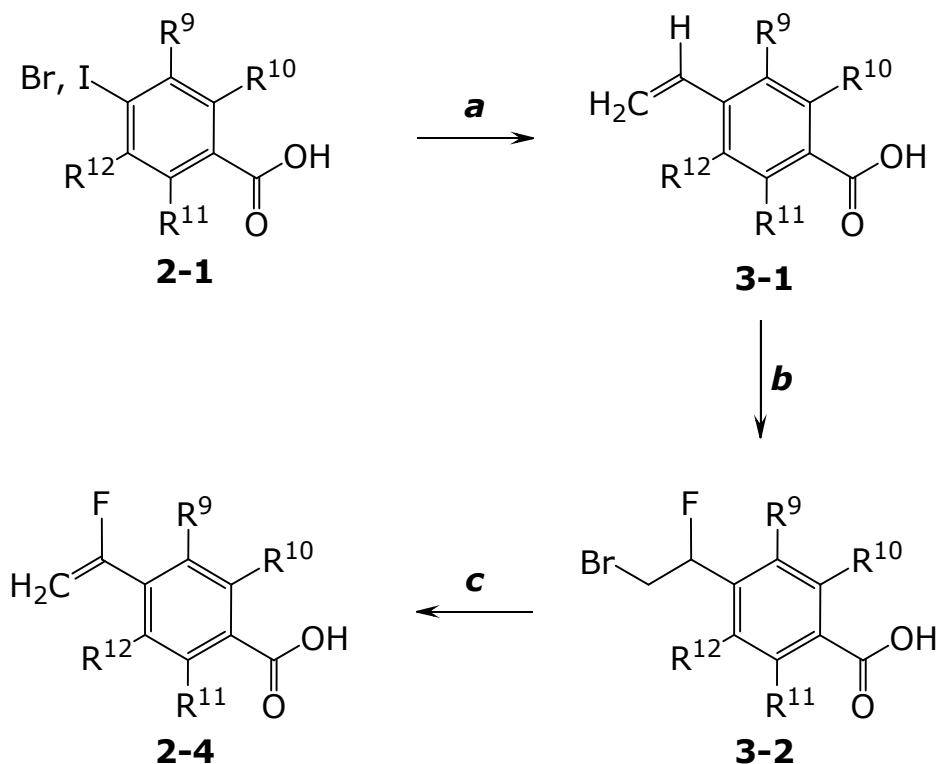
Esquema 2



- 5 Alternativamente, los ácidos halobenzoicos 2-1 pueden tratarse directamente con una fuente de borano de vinilo tal como viniltrifluoroborato o hidrógeno vinilboronato de 3-hidroxi-2,3-dimetilbutan-2-ilo en presencia de un catalizador de paladio tal como dicloruro de 1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno de paladio(II), y una base tal como carbonato de potasio, en un solvente aprótico polar preferentemente dimetilsulfóxido a temperaturas en el intervalo de
- 10 aproximadamente 80 °C a aproximadamente 140 °C, para proporcionar ácidos vinilbenzoicos 3-1, en donde R⁹, R¹⁰, R¹¹, y R¹² son como se describió anteriormente (Esquema 3, etapa a). Los ácidos vinilbenzoicos 3-1 pueden tratarse con una fuente de bromo tal como *N*-bromosuccinimida, y una fuente de flúor tal como trihidrofluoruro de trietilamina, en un solvente aprótico polar preferentemente diclorometano a aproximadamente 0 °C, para
- 15 proporcionar ácidos benzoicos de bromofluoroalquilo 3-2, en donde R⁹, R¹⁰, R¹¹, y R¹² son como se describió anteriormente (Esquema 3, etapa b). Los ácidos benzoicos de bromofluoroalquilo 3-

2 pueden tratarse con una base tal como *tert*-butoxido de potasio, en un solvente prótico polar preferentemente metanol, a temperaturas en el intervalo de aproximadamente 0 °C a aproximadamente temperatura ambiente, para proporcionar ácidos vinilbenzoicos fluorados 2-4 (Esquema 3, etapa c).

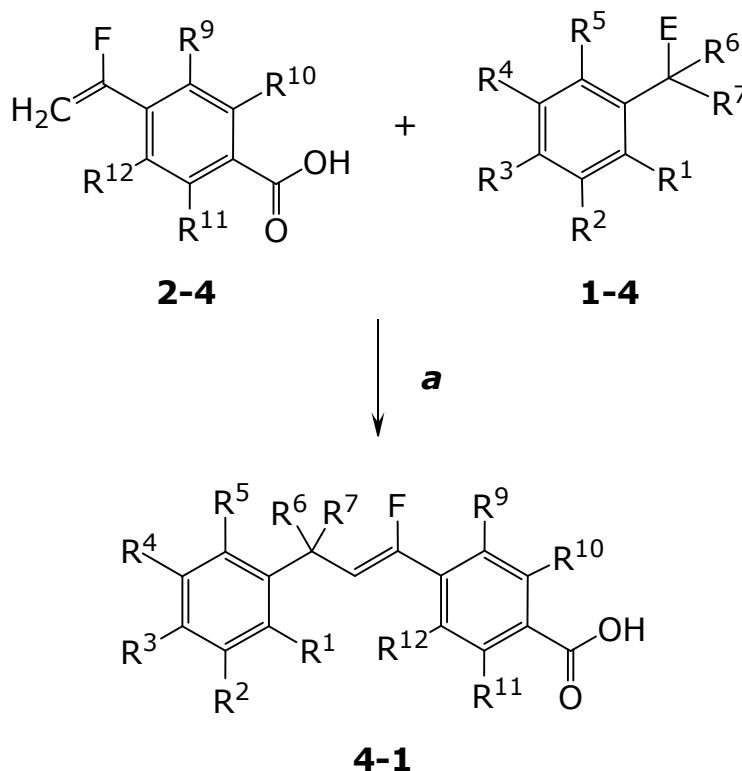
5 Esquema 3



PREPARACIÓN DE ÁCIDOS FENIL ALILBENZOICOS FLUORADOS

Los haluros de bencilo 1-4 y los ácidos vinilbenzoicos fluorados 2-4 pueden tratarse con una fuente de cobre(I) tal como cloruro de cobre(I) o bromuro de cobre(I) y un ligando de piridina tal como 2,2-bipiridil en un solvente aprótico polar preferentemente *N*-metil-2-pirrolidona, a una temperatura entre aproximadamente 100 °C a aproximadamente 180 °C para proporcionar ácidos fenil alilbenzoicos fluorados 4-1, en donde $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^9, R^{10}, R^{11}$, y R^{12} son como se describió anteriormente (Esquema 4, etapa a).

Esquema 4



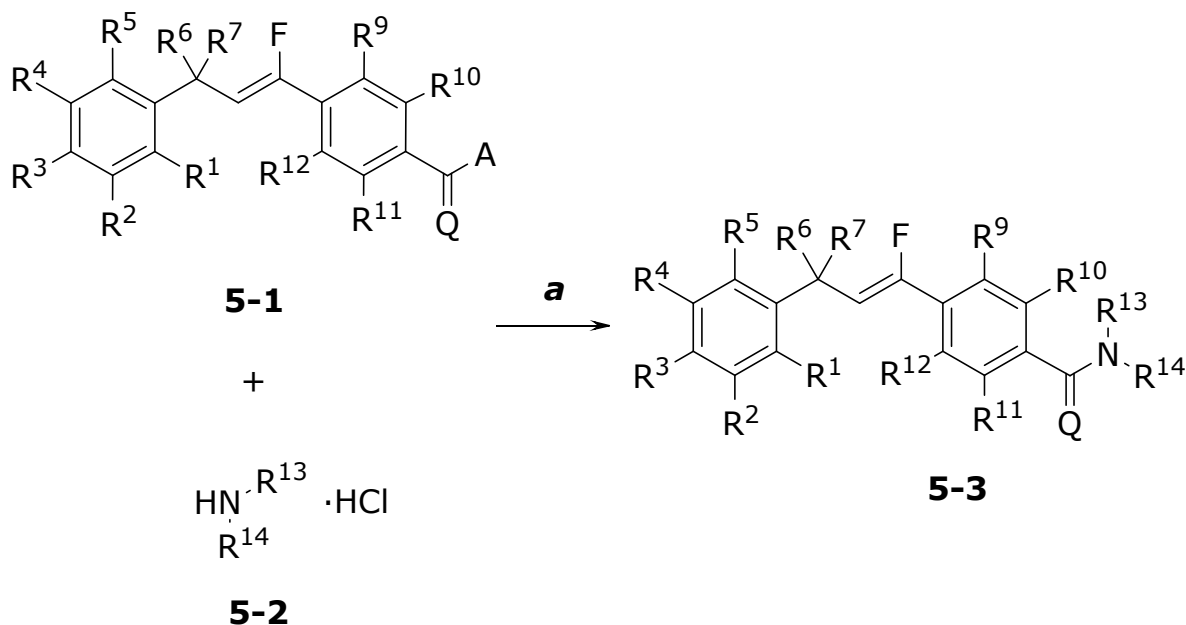
PREPARACIÓN DE FENIL ALILBENZAMIDAS FLUORADAS

Las fenil alilbenzamidas fluoradas 5-3, en donde Q es O y $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}$, y R^{14} son como se describió anteriormente, pueden prepararse mediante el tratamiento con aminas o sales de amina 5-2, en donde R^{13} y R^{14} son como se describió anteriormente, y ácidos carboxílicos activados 5-1, en donde Q es O, A es un grupo de activación, y $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^9, R^{10}, R^{11}$, y R^{12} son como se describió anteriormente, con una base, tal como trietilamina, diisopropiletilamina, 4-metilmorfolina en un solvente aprótico anhidro tal como diclorometano, tetrahidrofurano, 1,2-dicloroetano, *N,N,N*-dimetilformamida, o cualquier combinación de estos, a temperaturas entre aproximadamente 0 °C y aproximadamente 120 °C (Esquema 5, etapa *a*).

Los ácidos carboxílicos activados 5-1 pueden ser un haluro ácido, tal como un cloruro ácido, un bromuro ácido, o un fluoruro ácido; un éster carboxílico, tal como un *para*-nitrofenil éster, un pentafluorofenil éster, un etil (hidroxiimino)cianoacetato éster, un metil éster, un etil éster, un bencil éster, un *N*-hidroxisuccinimidil éster, un hidroxibenzotriazol-1-il éster, o un hidroxipiridiltriazol-1-il éster; una *O*-acilisourea; un anhídruo ácido; o un tioéster. Los cloruros

ácidos pueden prepararse a partir de los ácidos carboxílicos correspondientes por medio de tratamiento con un reactivo de cloración deshidratante, tal como cloruro de oxalilo o cloruro de tionilo. Los ácidos carboxílicos activados 5-1 pueden prepararse a partir de ácidos carboxílicos *in situ* con una sal de uronio tal como 3-óxido hexafluorofosfato de 1-[bis(dimetilamino)metileno]-
5 1*H*-1,2,3-triazolo[4,5-*b*]piridinio (HATU), hexafluorofosfato de *O*-(benzotriazol-1-il)-*N,N,N',N'*-tetrametiluronio (HBTU), o hexafluorofosfato de (1-ciano-2-etoxi-2-oxoetilidenaminoxidimetilamino-morfolino-carbenio (COMU). Los ácidos carboxílicos activados 5-1 pueden prepararse también a partir de ácidos carboxílicos *in situ* con una sal de fosfonio tal como hexafluorofosfato de benzotriazol-1-il-oxitripirrolidinofosfonio (PyBop). Los
10 ácidos carboxílicos activados 5-1 pueden prepararse también a partir de ácidos carboxílicos *in situ* con un reactivo de acoplamiento tal como 1-(3-dimetilamino propil)-3-etilcarbodiimida (EDC), o dicitclohexilcarbodiimida (DCC) en presencia de un triazol tal como hidroxibenzotriazol-monohidrato (HOBt) o 1-hidroxí-7-azabenzotriazol (HOAt). Las *O*-acilisoureas pueden prepararse con una carbodimida deshidratante tal como 1-(3-dimetilamino
15 propil)-3-etilcarbodiimida o dicitclohexilcarbodiimida. Los ácidos carboxílicos activados 5-1 pueden prepararse también a partir de ácidos carboxílicos *in situ* con un reactivo de acoplamiento tal como hexafluorofosfato de 2-cloro-1,3-dimetilimidazolidinio (CIP) en la presencia de un triazol tal como 1-hidroxí-7-azabenzotriazol (HOAt).

Esquema 5

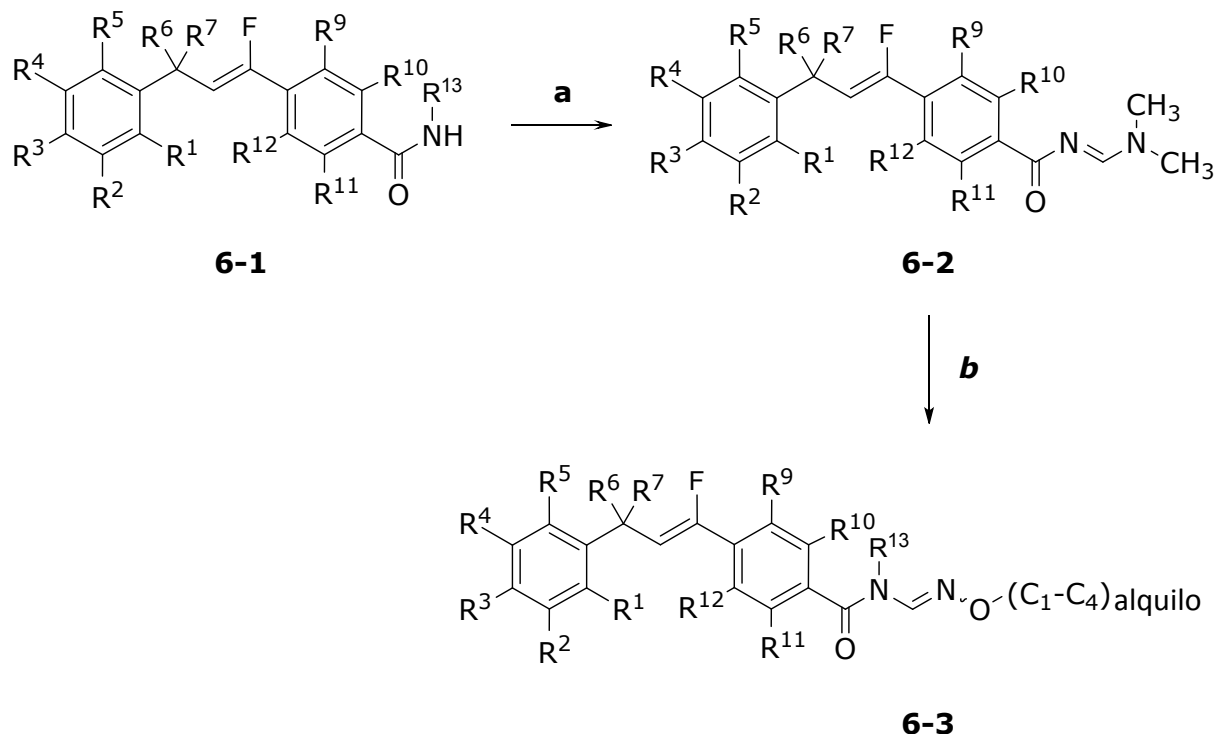


Las aminas o sales de aminas 5-2 pueden generarse *in situ* a partir de las aminas de *N-terc-*butoxicarbonilo correspondientes mediante el tratamiento con un ácido tal como cloruro de hidrógeno. Opcionalmente, las sales de aminas 5-2 pueden neutralizarse en presencia de una base tal como bicarbonato de sodio o trietilamina antes de la reacción con ácidos carboxílicos activados 5-1 o *in situ* durante la reacción con ácidos carboxílicos activados 5-1 para proporcionar alilbenzamidias de fenilo 5-3.

Las fenil alilbenzamidias fluoradas 6-1, en donde Q es O, R¹³ y R¹⁴ son H, y R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁹, R¹⁰, R¹¹, y R¹² son como se describió anteriormente, pueden tratarse con un electrófilo, tal como *N, N*-dimetilformamida dimetil acetal, en un solvente aprótico, tal como tolueno, a temperaturas entre aproximadamente 80 °C y aproximadamente 130 °C para dar dimetilaminometileno fenil alilbenzamidias 6-2, en donde Q es O y R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁹, R¹⁰, R¹¹, y R¹² son como se describió anteriormente (Esquema 6, etapa a). Las dimetilaminometileno fenil alilbenzamidias 6-2 pueden tratarse con (C₁-C₄) alquil-OH₂ o sales de este, tal como hidrocloreuro de *O*-metilhidroxilamina, un ácido, tal como ácido acético, y una base, tal como hidróxido de sodio acuoso, en un solvente aprótico, polar, tal como dioxano, a temperaturas entre aproximadamente 0 °C y aproximadamente 80 °C, para dar *N*-alcoxiimino

fenil alilbenzamidas 6-3, en donde Q es O, R¹³ es H, y R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁹, R¹⁰, R¹¹, y R¹² son como se describió anteriormente (Esquema 6, etapa *b*).

Esquema 6



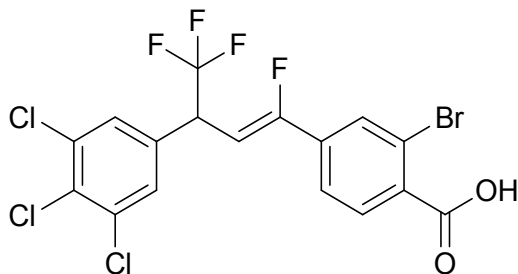
5 EJEMPLOS

Estos ejemplos tienen propósitos de ilustración y no deben interpretarse que limitan esta descripción sólo a las modalidades descritas en estos ejemplos.

Los materiales de partida, los reactivos y los disolventes que se obtuvieron a partir de fuentes comerciales se usaron sin purificación adicional. Los disolventes anhidros se adquirieron como Sure/Seal™ de Aldrich y se usaron como se recibieron. Los puntos de fusión se obtuvieron en un instrumento de punto de fusión capilar Thomas Hoover Unimelt o un Sistema de punto de fusión Automatizado OptiMelt de Stanford Research Systems y no están corregidos. Los ejemplos que usan “temperatura ambiente” se llevaron a cabo en laboratorios de clima controlado con temperaturas que están en el intervalo de aproximadamente 20 C a aproximadamente 24 C. A las moléculas se les dan sus nombres conocidos, de acuerdo con los programas de nomenclatura dentro de ISIS Draw, ChemDraw, o ACD Name Pro. En caso de que tales programas no sean capaces de nombrar una molécula, dicha molécula se denomina con el

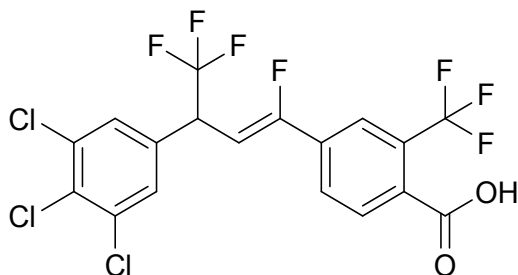
uso de las reglas de nomenclatura convencionales. Los datos espectrales de ^1H NMR son en ppm (δ) y se registraron a 300, 400, 500, o 600 MHz; los datos espectrales de ^{13}C NMR son en ppm (δ) y se registraron a 75, 100, o 150 MHz y los datos espectrales de ^{19}F NMR son en ppm (δ) y se registraron a 376 MHz, a menos que se indique de cualquier otra manera.

- 5 Ejemplo 1: Preparación de ácido (Z)-2-bromo-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)benzoico (C1)



- A un de matraz de fondo redondo 25 ml se añadieron ácido 2,2'-bipiridina (0.255 g, 1.63 mmol), 2-bromo-4-(1-fluorovinil)benzoico (C24) (1.00 g, 4.08 mmol), y 5-(1-bromo-2,2,2-trifluoroetil)-1,2,3-triclorobenceno (2.79 g, 8.16 mmol) en *N*-metilpirrolidona (2.0 mL) para dar una solución amarilla. El bromuro de cobre(I) (0.117 g, 0.816 mmol) se añadió y la mezcla de reacción se vertió con nitrógeno durante 5 minutos. La mezcla de reacción se calentó luego hasta 150 °C durante 3 horas. La mezcla de reacción se vertió en agua con hielo (100 mL). El agua se filtró y la goma negra resultante se disolvió en acetato de etilo (800 mL), se lavó con salmuera (2 x 200 mL), y agua (2 x 200 mL), se secó sobre sulfato de magnesio, se filtró y se concentró para proporcionar el compuesto del título como un aceite marrón (1.40 g, 64%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 8.03 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.89 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.59 (dd, J = 8.3, 1.8 Hz, 1H), 7.43 (s, 2H), 5.83 (dd, J = 32.4, 9.6 Hz, 1H), 4.60 (p, J = 8.8 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) δ -69.32 (d, J = 2.3 Hz), -108.70 – -119.01 (m); ESIMS m/z 505 ($[\text{M}-\text{H}]^-$).
- 20 *Los siguientes compuestos se prepararon de la misma manera que el procedimiento detallado en el Ejemplo 1:*

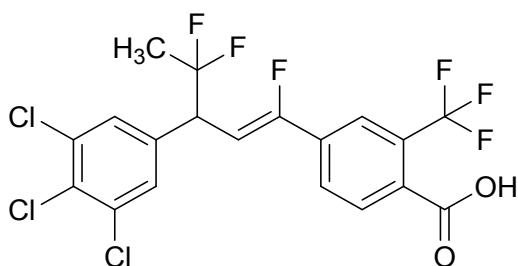
Ácido (Z)-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C2)



Aislado como un aceite amarillo (7.6 g, 68%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 8.04 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.99 - 7.94 (m, 1H), 7.84 (dd, J = 8.2, 1.8 Hz, 1H), 7.44 (s, 2H), 5.90 (dd, J = 32.4, 9.6 Hz, 1H), 4.62 (p, J = 8.9 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) δ -59.60, -69.28 (d, J = 2.3 Hz),

5 -112.11; ESIMS m/z 493 ($[\text{M}-\text{H}]^-$).

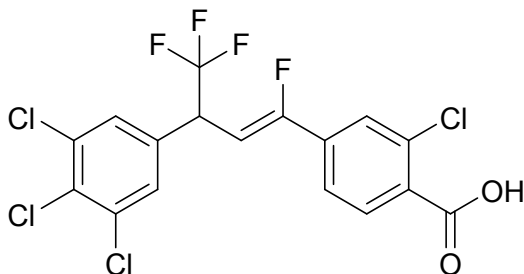
Ácido (Z)-4-(1,4,4-trifluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)pent-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C3)



Aislado como una espuma amarilla (0.628 g, 60%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 8.00 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.95 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.81 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.42 (s, 2H), 5.96 (dd, J = 33.6, 9.8 Hz, 1H), 4.29 (td, J = 14.3, 9.8 Hz, 1H), 1.65 (t, J = 18.4 Hz, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) δ -59.61, -92.97 - -97.35 (m), -114.82; ESIMS m/z 491 ($[\text{M}-\text{H}]^-$).

10

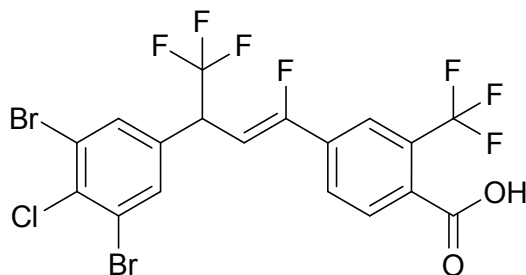
Ácido (Z)-2-Cloro-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)benzoico (C4)



Aislado como un sólido blanco (4.27 g, 88%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 8.07 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.68 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 7.54 (dd, J = 8.3, 1.8 Hz, 1H), 7.43 (s, 2H), 5.85 (dd, J = 32.4, 9.6 Hz, 1H), 4.60 (p, J = 8.8 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) δ -69.33 (d, J = 2.2 Hz), -112.18 (d, J = 2.4 Hz); ESIMS m/z 461 ($[\text{M}-\text{H}]^-$).

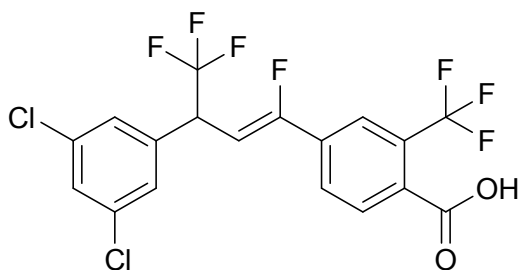
15

Ácido (Z)-4-(3-(3,5-dibromo-4-clorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C5)



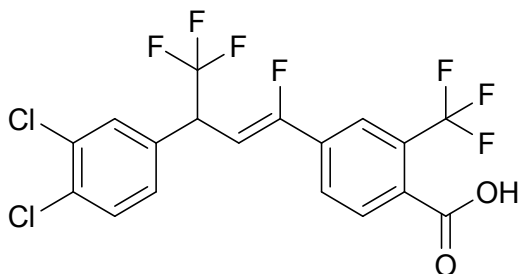
5 Aislado como una goma marrón (2.00 g, 37%): ESIMS m/z 583 ($[M-H]^-$).

Ácido (Z)-4-(3-(3,5-diclorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C6)



Aislado como una goma marrón (0.50 g, 43%): ^1H NMR (400 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ 13.9 (br s, 1H), 8.16 (s, 1H), 8.09 (d, $J = 8.0$ Hz, 1H), 7.92 (d, $J = 8.0$ Hz, 1H), 7.82 (s, 2H), 7.64 (t, $J = 6.0$ Hz, 1H), 6.90 (dd, $J = 36.0, 10.4$ Hz, 1H), 5.26 - 5.17 (m, 1H); IR (película delgada) 3416, 2926, 1716, 1119 cm^{-1} ; ESIMS m/z 449 ($[M+H]^+$).

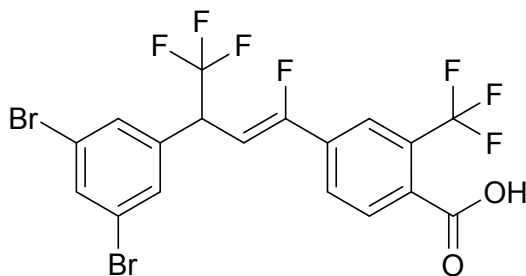
Ácido (Z)-4-(3-(3,4-diclorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C7)



Aislado como una goma marrón (2.50 g, 56%): ^1H NMR (300 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ 13.9 (br s, 1H), 8.16 (s, 1H), 8.09 (d, $J = 10.8$ Hz, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.92 (d, $J = 8.1$ Hz, 1H), 7.75 - 7.65 (m, 2H),

6.90 (dd, $J = 36.0, 10.4$ Hz, 1H), 5.22 - 5.16 (m, 1H); IR (película delgada) 3440, 2927, 1716, 1175 cm^{-1} ; ESIMS m/z 459 ($[\text{M-H}]^-$).

Ácido (Z)-4-(3-(3,5-dibromofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C8)

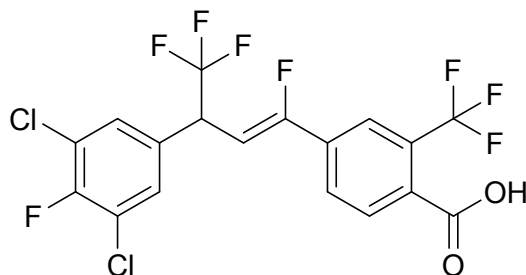


5

Aislado como una goma marrón (2.20 g, 39%): ^1H NMR (300 MHz, CDCl_3) δ 8.05 - 7.95 (m, 2H), 7.84 (d, $J = 7.2$ Hz, 1H), 7.69 - 7.68 (m, 1H), 7.49 (s, 2H), 5.95 (dd, $J = 32.7, 9.6$ Hz, 1H), 4.64 - 4.58 (p, 1H); IR (película delgada) 3439, 2925, 1714, 1118, 746 cm^{-1} ; ESIMS m/z 549 ($[\text{M-H}]^-$).

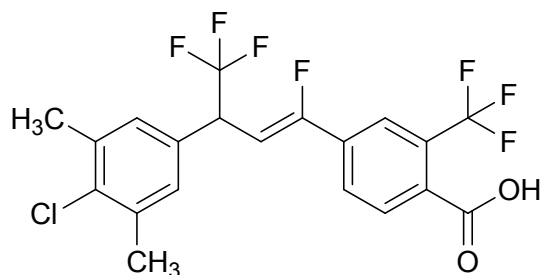
Ácido (Z)-4-(3-(3,5-dicloro-4-fluorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C9)

10



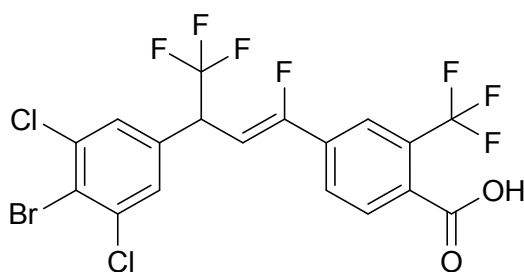
Aislado como una goma marrón (1.20 g, 54%): ^1H NMR (300 MHz, CDCl_3) δ 7.88 (s, 2H), 7.76 - 7.75 (m, 1H), 7.37 (d, $J = 6.0$ Hz, 2H), 5.90 (dd, $J = 32.1, 9.0$ Hz, 1H), 4.62 - 4.56 (p, 1H); IR (película delgada) 3445, 2926, 1698, 1260, 750 cm^{-1} ; ESIMS m/z 477 ($[\text{M-H}]^-$).

15 Ácido (Z)-4-(3-(4-cloro-3,5-dimetilfenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C10)



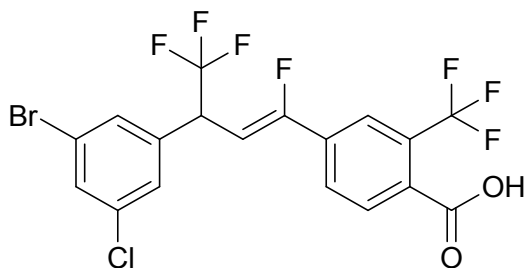
Aislado como una goma amarilla (2.20 g, 53%): ^1H NMR (300 MHz, CDCl_3) δ 8.01 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.94 (s, 1H), 7.83 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.11 (s, 2H), 6.00 (dd, J = 33.0, 9.9 Hz, 1H), 4.58 - 4.55 (m, 1H), 2.40 (s, 6H); IR (película delgada) 3445, 1713, 852 cm^{-1} ; ESIMS m/z 453 ($[\text{M}-\text{H}]^-$).

- 5 Ácido (Z)-4-(3-(4-bromo-3,5-diclorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C11)



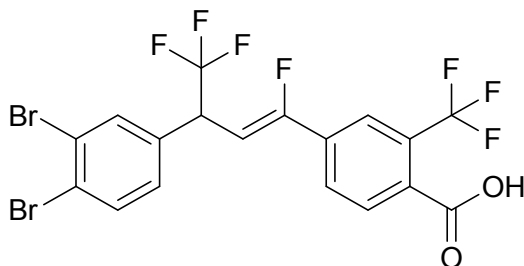
- 10 Aislado como un sólido marrón (1.50 g, 65%): mp 78-81 $^{\circ}\text{C}$; ^1H NMR (300 MHz, CDCl_3) δ 8.09 - 7.99 (m, 2H), 7.83 - 7.81 (m, 1H), 7.42 (s, 2H), 5.95 (dd, J = 32.4 Hz, 9.6 Hz, 1H), 4.63 - 4.57 (m, 1H); IR (película delgada) 3445, 1713, 852 cm^{-1} ; ESIMS m/z 538 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

Ácido (Z)-4-(3-(3-bromo-5-clorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C12)



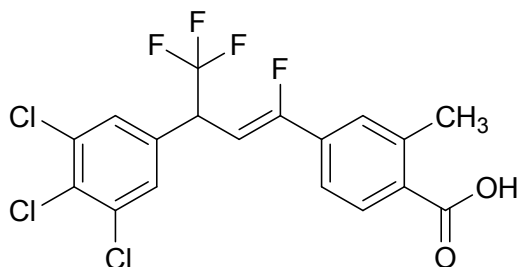
- 15 Aislado como una goma marrón (2.0 g, 62%): ^1H NMR (300 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ 13.80 (br s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.09 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.93 - 7.78 (m, 4H), 6.91 (dd, J = 35.7, 10.2 Hz, 1H), 5.27 - 5.14 (m, 1H); IR (película delgada) 3081, 2927, 1714, 776 cm^{-1} ; ESIMS m/z 503 ($[\text{M}-\text{H}]^-$).

Ácido (Z)-4-(3-(3,4-dibromofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C13)



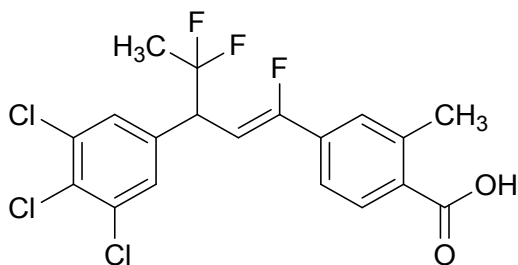
Aislado como una goma amarilla (2.1 g, 78%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 8.02 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.94 (s, 1H), 7.83 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.66 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.26 - 7.21 (m, 1H), 5.96 (dd, J = 32.4, 9.2 Hz, 1H), 4.67 - 4.58 (p, 1H); IR (película delgada) 3426, 2925, 1714, 1115 cm^{-1} ; ESIMS m/z 547 ($[\text{M}-\text{H}]^-$).

Ácido (Z)-2-Metil-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)benzoico (C14)



Aislado como un aceite naranja (0.94 g, 61%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 8.09 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.49 - 7.45 (m, 2H), 7.44 (s, 2H), 5.80 (dd, J = 32.7, 9.6 Hz, 1H), 4.60 (p, J = 8.9 Hz, 1H), 2.69 (s, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) δ -69.40 (d, J = 2.3 Hz), -108.40 - -115.65 (m); ESIMS m/z 441 ($[\text{M}-\text{H}]^-$).

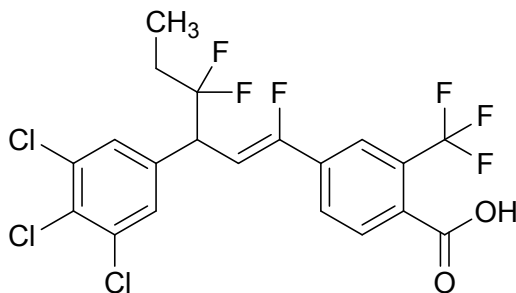
Ácido (Z)-2-Metil-4-(1,4,4-trifluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)pent-1-en-1-il)benzoico (C15)



Aislado como una espuma naranja (0.204 g, 51%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 8.07 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.49 - 7.40 (m, 4H), 5.86 (dd, J = 33.9, 9.9 Hz, 1H), 4.27 (td, J = 14.3, 9.7 Hz, 1H), 2.68 (s, 3H),

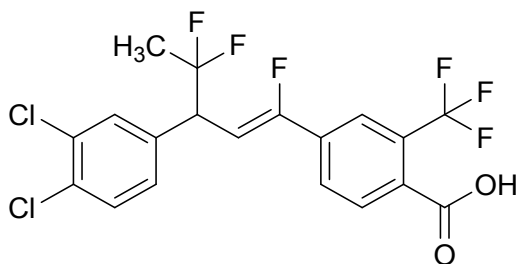
1.65 (t, $J = 18.4$ Hz, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) δ -95.11, -95.18, -114.57; ESIMS m/z 437 ($[\text{M}-\text{H}]^-$).

Ácido (Z)-4-(1,4,4-Trifluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)hex-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C16)



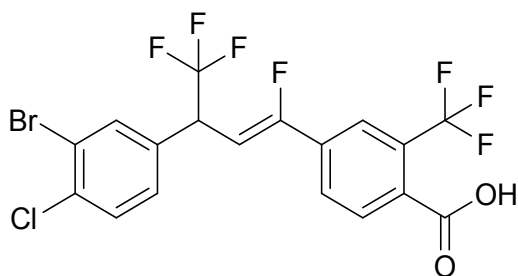
5 Aislado como una espuma naranja (0.136 g, 63%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 7.99 (dd, $J = 8.4$, 4.0 Hz, 1H), 7.93 (s, 1H), 7.80 (d, $J = 7.9$ Hz, 1H), 7.42 (d, $J = 2.6$ Hz, 2H), 6.08 - 5.87 (m, 1H), 4.32 (td, $J = 14.6$, 9.8 Hz, 1H), 1.87 (ddt, $J = 21.6$, 15.4, 8.0 Hz, 2H), 1.07 (t, $J = 7.4$ Hz, 3H); ^{13}C NMR (101 MHz, CDCl_3) δ 170.72, 156.96 (d, $J_{\text{CF}} = 253.0$ Hz), 136.85, 135.06, 134.53, 133.75, 131.90, 131.19, 130.18, 129.17, 128.60, 128.05, 127.29, 124.11, 123.36 - 122.67 (m), 121.39, 104.66 (d, $J_{\text{CF}} = 18.0$ Hz), 46.46, 29.70 - 27.14 (m), 6.40 - 5.44 (m); ESIMS m/z 503 ($[\text{M}-\text{H}]^-$).

Ácido (Z)-4-(3-(3,4-diclorofenil)-1,4,4-trifluoropent-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C17)



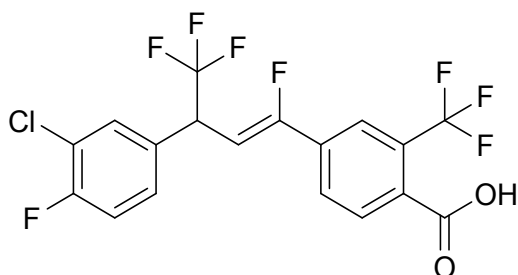
15 Aislado como un vidrio naranja (0.495 g, 51%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 8.01 (d, $J = 8.2$ Hz, 1H), 7.94 (d, $J = 1.6$ Hz, 1H), 7.80 (dd, $J = 8.2$, 1.8 Hz, 1H), 7.49 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.45 (d, $J = 8.3$ Hz, 1H), 7.26 7.22 (m, 1H), 6.00 (dd, $J = 33.9$, 9.8 Hz, 1H), 4.32 (ddd, $J = 15.8$, 13.0, 9.8 Hz, 1H), 1.62 (t, $J = 18.4$ Hz, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) δ -59.58, -89.79 - -99.81 (m), -115.63; IR (película delgada) 3008, 1711 cm^{-1} ; ESIMS m/z 455 ($[\text{M}-\text{H}]^-$).

20 Ácido (Z)-4-(3-(3,4-diclorofenil)-1,4,4-trifluoropent-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C18)



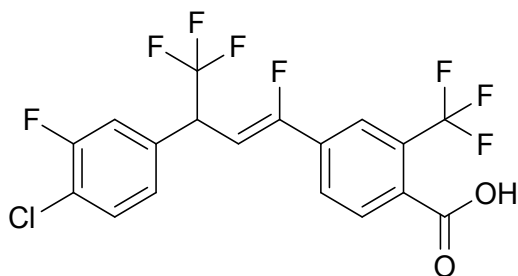
Aislado como una goma marrón (2.5 g, 46%): ^1H NMR (300 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ 13.79 (br s, 1H), 8.15 - 8.06 (m, 3H), 7.91 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.71 (s, 2H), 6.90 (dd, J = 36.0, 10.2 Hz, 1H), 5.21 - 5.15 (m, 1H); IR (película delgada) 3431, 2924, 1623, 597 cm^{-1} ; ESIMS m/z 503 ($[\text{M}-\text{H}]^-$).

Ácido (Z)-4-(3-(3-cloro-4-fluorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C19)



Aislado como una goma amarilla (1.50 g, 57%): ^1H NMR (300 MHz, CDCl_3) δ 8.01 (d, J = 8.1 Hz, 2H) 7.94 (s, 2H), 7.76 - 7.75 (m, 1H), 7.37 (d, J = 6.0 Hz, 2H), 5.90 (dd, J = 32.1, 9.0 Hz, 1H); IR (película delgada) 3445, 2926, 1698, 1260, 750 cm^{-1} ; ESIMS m/z 443 ($[\text{M}-\text{H}]^-$).

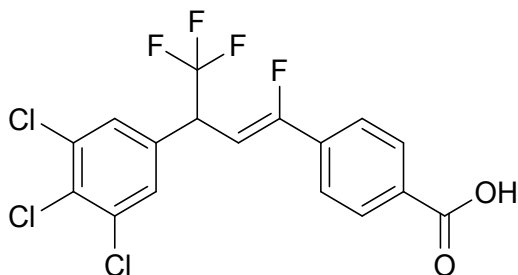
Ácido (Z)-4-(3-(4-cloro-3-fluorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C20)



Aislado como una goma marrón (0.50 g, 48%): ^1H NMR (300 MHz, CDCl_3) δ 8.03 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.94 (s, 1H), 7.83 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.46 - 7.44 (m, 1H), 7.23 - 7.13 (m, 2H), 5.98 (dd, J =

34.2, 9.9 Hz, 1H), 4.69 - 4.63 (m, 1H); IR (película delgada) 3092, 1751, 750 cm^{-1} ; ESIMS m/z 443 ($[\text{M}-\text{H}]^-$).

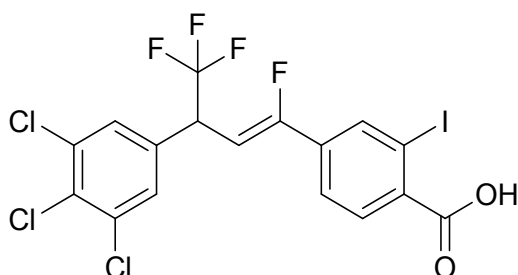
Ácido (Z)-4-(1,4,4,4-Tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)benzoico (CC1)



- 5 Aislado como una goma amarilla (1.1 g, 56%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 8.15 (d, J = 8.2 Hz, 2H), 7.67 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 7.44 (s, 2H), 5.84 (dd, J = 32.6, 9.6 Hz, 1H), 4.61 (p, J = 8.9 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) δ -69.38 (d, J = 2.2 Hz), -109.75 – -116.47 (m); ESIMS m/z 427 ($[\text{M}-\text{H}]^-$).

Ejemplo 2: Preparación de ácido (Z)-2-yodo-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-

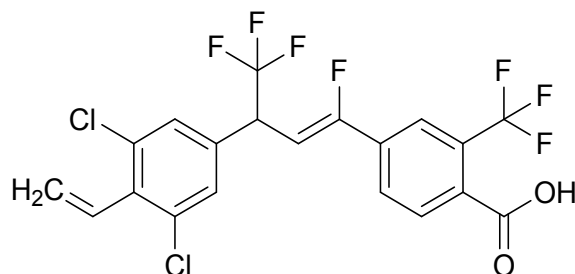
10 1-il)benzoico (C21)



- A un vial de 25 mL se añadieron ácido (Z)-2-bromo-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)benzoico (C1) (0.500 g, 0.987 mmol), yoduro de cobre(I) (0.00940 g, 0.0490 mmol), y 1,4-dioxano (4.9 mL) para formar una suspensión amarilla. Yoduro de sodio (0.296 g, 1.97 mmol) y *trans*-*N,N'*-dimetilciclohexano-1,2-diamina (0.0140 g, 0.0990 mmol) se añadieron, y la mezcla de reacción se agitó a 110 °C por 3.5 horas. La mezcla de reacción se concentró y se purificó por cromatografía en columna rápida para proporcionar el compuesto del título como un aceite marrón (0.247 g, 43%): ^1H NMR (300 MHz, CDCl_3) δ 8.21 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 8.02 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 8.3, 1.7 Hz, 1H), 7.43 (s, 2H), 5.82 (dd, J = 32.5, 9.6 Hz,
- 15

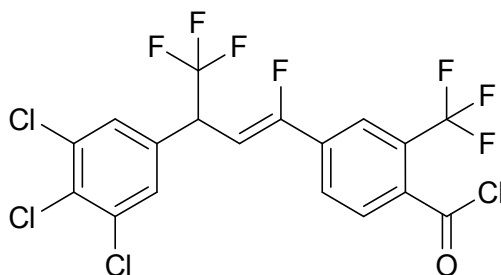
1H), 4.59 (p, $J = 8.9$ Hz, 1H); ^{19}F NMR (471 MHz, CDCl_3) δ -69.32, -112.14 (d, $J = 20.8$ Hz); ESIMS m/z 553 ($[\text{M}-\text{H}]^-$).

Ejemplo 3: Preparación de ácido (Z)-2-yodo-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)benzoico (C22)



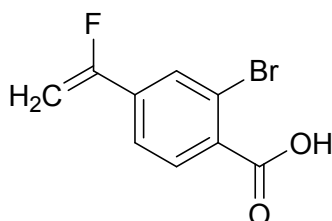
Tetrakis(trifenilfosfina)paladio(0) (0.30 g, 0.26 mmol) se añadió a una solución de ácido (Z)-4-(3-(4-bromo-3,5-diclorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C11) (1.4 g, 2.6 mmol) en tolueno (10 mL) a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se desgasificó purgando con nitrógeno (3 x 10 minutos). Tributil vinil estannano (0.82 g, 2.6 mmol) se añadió a la mezcla de reacción. La mezcla de reacción se desgasificó nuevamente purgando con nitrógeno (3 x 10 minutos) y se agitó a 120 °C por 3 horas. La mezcla de reacción se apagó con agua y después se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio, se filtró y se concentró. La purificación por cromatografía en columna rápida usando 30 % acetato de etilo/hexanos proporcionó el compuesto del título como una goma amarilla pálida (0.80 g, 63%): ^1H NMR (300 MHz, CDCl_3) δ 7.85 (s, 1H), 7.82 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.74 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 7.42 (s, 1H), 7.37 (s, 1H), 6.72 - 6.65 (dd, $J = 17.6$ Hz, 11.6 Hz, 1H), 5.86 - 5.73 (m, 3H), 4.61 - 4.56 (m, 1H); IR (película delgada) 3445, 2925, 1646, 1275, 749 cm^{-1} ; ESIMS m/z 488 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

Ejemplo 4: Preparación de cloruro de (Z)-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoilo (C23)



A un vial de 25 mL se añadió ácido (Z)-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C2) (0.200 g, 0.404 mmol), cloruro de oxalilo (0.095 mL, 1.09 mmol), y *N,N*-dimetilformamida (cantidad catalítica) en diclorometano (1.3 mL) para dar una solución amarilla. La reacción se agitó por 15 horas a temperatura ambiente. El solvente se retiró bajo vacío proporcionando el compuesto del título como una goma amarilla (0.220 g, 95%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 7.99 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.92 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 7.81 (dd, J = 8.2, 1.8 Hz, 1H), 7.44 (s, 2H), 5.88 (dd, J = 32.5, 9.6 Hz, 1H), 4.73 - 4.50 (m, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) δ -59.58, -69.32, -109.75 - -113.19 (m); IR (película delgada) 3445, 2925, 1646, 1275, 749 cm^{-1} ; ESIMS m/z 476 ($[\text{M}-\text{Cl}]^+$).

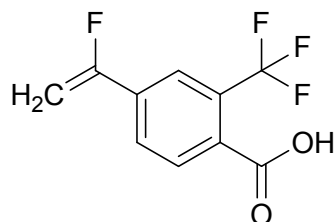
Ejemplo 5: Preparación de ácido 2-bromo-4-(1-fluorovinil)benzoico (C24)



A un matraz de fondo redondo de 250 mL se añadieron metil 2-bromo-4-(1-fluorovinil)benzoato (C29) (1.8 g, 7.0 mmol), hidrato de hidróxido de litio (0.88 g, 21 mmol), metanol (7.0 mL), tetrahidrofurano (21 mL), y agua (7.0 mL), y la mezcla de reacción se agitó durante toda la noche a temperatura ambiente. La mezcla se concentró, se apagó con un amortiguador de pH 4, y se extrajo con acetato de etilo para proporcionar el compuesto del título como un sólido blanco (1.0 g, 56%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 8.01 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.89 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.57 (dd, J = 8.3, 1.8 Hz, 1H), 5.21 (dd, J = 48.6, 4.0 Hz, 1H), 5.06 (dd, J = 17.3, 3.9 Hz, 1H); ^{19}F NMR (471 MHz, CDCl_3) δ -108.71 (d, J = 1.4 Hz); ESIMS m/z 244 ($[\text{M}-\text{H}]^-$).

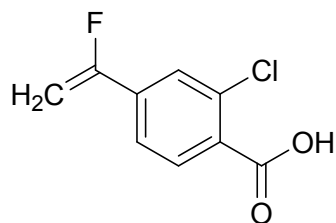
Los siguientes compuestos se prepararon de la misma manera que el procedimiento detallado en el Ejemplo 5:

Ácido 4-(1-Fluorovinil)-2-(trifluorometil)benzoico (C25)



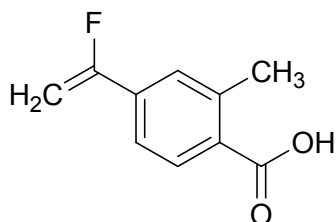
- 5 Aislado como un sólido blanco (1.9 g, 93%): ^1H NMR (400 MHz, metanol- d_4) δ 7.95 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 7.95 - 7.91 (m, 1H), 7.90 - 7.86 (m, 1H), 5.46 (dd, J = 50.0, 4.1 Hz, 1H), 5.09 (dd, J = 18.0, 4.1 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, metanol- d_4) δ -61.04 (d, J = 1.1 Hz), -110.93; ESIMS m/z 233 ($[\text{M}-\text{H}]^-$).

Ácido 2-cloro-4-(1-fluorovinil)benzoico (C26)



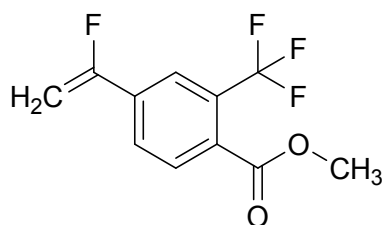
- 10 Aislado como un sólido blanco (3.5 g, 75%): ^1H NMR (400 MHz, acetona- d_6) δ 7.97 (dd, J = 8.2, 0.9 Hz, 1H), 7.76 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 7.70 (dd, J = 8.2, 1.7 Hz, 1H), 5.68 - 5.45 (m, 1H), 5.11 (dd, J = 18.2, 4.1 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, acetona- d_6) δ -108.71; ESIMS m/z 200 ($[\text{M}-\text{H}]^-$).

Ácido 4-(1-fluorovinil)-2-metilbenzónico (C27)



- 15 Aislado como un sólido blanco (0.550 g, 89%): ^1H NMR (400 MHz, metanol- d_4) δ 7.92 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.59 - 7.52 (m, 1H), 7.52 - 7.44 (m, 1H), 5.29 (dd, J = 50.1, 3.7 Hz, 1H), 4.93 (dd, J = 18.1, 3.7 Hz, 1H), 2.60 (s, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, metanol- d_4) δ -110.32 (d, J = 2.1 Hz); ESIMS m/z 181 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

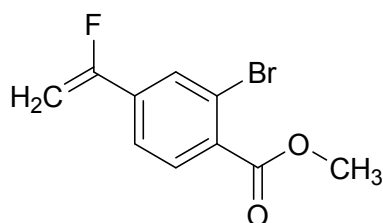
Ejemplo 6: Preparación de metil 4-(1-fluorovinil)-2-(trifluorometil)benzoato (C28)



A un matraz de fondo redondo de 100 mL se añadió metil 4-bromo-2- (trifluorometil)benzoato (2.25 g, 8.00 mmol), (1-fluorovinil)(metil)difenilsilano (3.58 g, 14.8 mmol), y 1,3-dimetilimidazolidin-2-ona (40 mL). Tetrakis(trifenilfosfina)paladio(0) (0.459 g, 0.400 mmol), yoduro de cobre(I) (0.0760 mg, 0.400 mmol), y fluoruro de cesio (3.62 g, 23.9 mmol) se añadieron y la reacción se agitó a temperatura ambiente por 24 horas bajo una atmósfera de nitrógeno. Se añadió agua a la mezcla y la mezcla se diluyó con 3:1 hexanos/éter de dietilo. La capa se separó, y la capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio, se concentró, y el residuo se purificó por cromatografía en columna rápida proporcionó el compuesto del título como un aceite incoloro (2.00 g, 96%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 7.96 - 7.87 (m, 1H), 7.83 (dq, J = 8.1, 0.7 Hz, 1H), 7.77 (dd, J = 8.2, 1.7 Hz, 1H), 5.23 (dd, J = 48.6, 4.0 Hz, 1H), 5.07 (dd, J = 17.4, 4.0 Hz, 1H), 3.95 (s, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) δ -59.92, -108.73 (d, J = 1.4 Hz); EIMS m/z 248 ($[\text{M}]^+$).

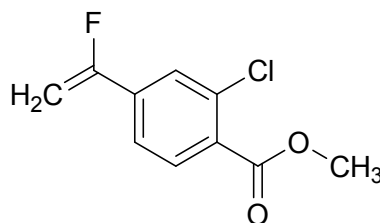
Los siguientes compuestos se prepararon de la misma manera que el procedimiento detallado en el Ejemplo 6:

Metil 2-bromo-4-(1-fluorovinil)benzoato (C29)



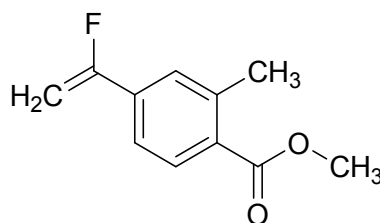
Aislado como un aceite incoloro (1.8 g, 93%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 7.84 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 7.82 (dd, J = 8.2, 0.9 Hz, 1H), 7.50 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 5.16 (dd, J = 48.7, 3.9 Hz, 1H), 5.01 (dd, J = 17.3, 3.9 Hz, 1H), 3.94 (d, J = 2.2 Hz, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) δ -108.61 (d, J = 1.5 Hz); ESIMS m/z 258 ($[\text{M}-\text{H}]^-$).

Metil 2-cloro-4-(1-fluorovinil)benzoato (C30)



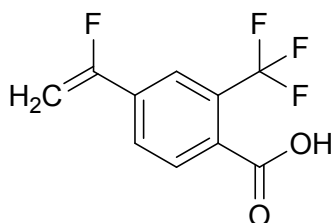
Aislado como un aceite incoloro (2.1 g, 99%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 7.86 (dd, $J = 8.2, 0.9$ Hz, 1H), 7.64 (d, $J = 1.7$ Hz, 1H), 7.48 (dd, $J = 8.3, 1.8$ Hz, 1H), 5.17 (dd, $J = 48.7, 3.8$ Hz, 1H), 5.02 (dd, $J = 17.3, 3.9$ Hz, 1H), 3.94 (s, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) δ -108.63 (d, $J = 1.4$ Hz); ESIMS m/z 214 ($[\text{M}-\text{H}]^-$).

Metil 2-cloro-4-(1-fluorovinil)benzoato (C31)



Aislado como un aceite incoloro (0.5 g, 85%): ^1H NMR (400 MHz, metanol- d_4) δ 7.90 (d, $J = 8.2$ Hz, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.49 (dd, $J = 8.0, 1.6$ Hz, 1H), 5.30 (dd, $J = 50.1, 3.7$ Hz, 1H), 4.95 (dd, $J = 18.0, 3.7$ Hz, 1H), 3.88 (d, $J = 5.9$ Hz, 3H), 2.59 (s, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, metanol- d_4) δ -110.41 (d, $J = 1.3$ Hz); ESIMS m/z 195 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

Ejemplo 7: Preparación de ácido 4-(1-fluorovinil)-2-(trifluorometil)benzoico (C25)



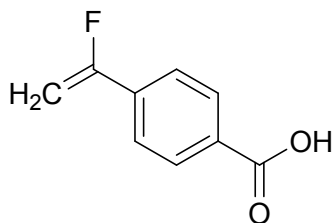
Etapa 1: Ácido 4-(2-bromo-1-fluoroetil)-2-(trifluorometil)benzoico (C32) Ácido 2-(trifluorometil)-4-vinilbenzoico (5.3 g, 24 mmol) se disolvió en diclorometano (123 mL) a 0 °C, se añadió trihidrofluoruro trietilamina (8.0 mL, 49 mmol) seguido por *N*-bromosuccinimida (8.7 g, 49 mmol). La mezcla de reacción se agitó por 16 horas mientras se calentó a temperatura ambiente. Se añadió luego agua a la mezcla, se lavó con diclorometano, se secó sobre sulfato de

sodio, se filtró y se concentró proporcionando el compuesto del título como un aceite amarillo que se usó sin purificación adicional (5.0 g, 65%).

Etapa 2: Ácido 4-(1-fluorovinil)-2-(trifluorometil)benzóico (C25) Ácido 4-(2-Bromo-1-fluoroetil)-2-(trifluorometil)benzóico (4.3 g, 14 mmol) se disolvió en metanol (68 mL) a 0 °C y *tert*-butóxido de potasio (4.6 g, 41 mmol) se añadió como sólido blanco en agitación. La mezcla de reacción se dejó calentar lentamente hasta 23 °C y luego se agitó por 4 horas. El ácido clorhídrico (1 N) se añadió lentamente, y la mezcla se extrajo con acetato de etilo. La purificación por cromatografía en columna rápida usando 0 - 40 % acetona/hexanos proporcionó el compuesto del título como un sólido blancuzco (1.7 g, 53%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 8.02 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.00 - 7.93 (m, 1H), 7.82 (dd, J = 8.2, 1.8 Hz, 1H), 5.27 (dd, J = 48.5, 4.1 Hz, 1H), 5.11 (dd, J = 17.3, 4.1 Hz, 1H).

Los siguientes compuestos se prepararon de la misma manera que el procedimiento detallado en el Ejemplo 7:

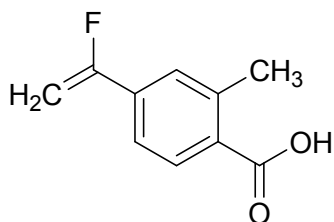
Ácido 4-(1-Fluorovinil)benzóico (C33)



Aislado como un sólido blanco (6.5 g, 86%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 8.13 (d, J = 8.2 Hz, 2H), 7.69 - 7.62 (m, 2H), 5.21 (dd, J = 49.0, 3.7 Hz, 1H), 5.02 (dd, J = 17.5, 3.7 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) δ

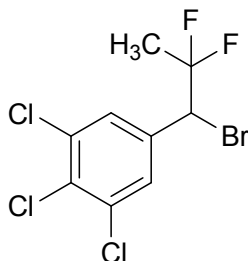
-108.35; ESIMS m/z 165 ($[\text{M}-\text{H}]^-$).

Ácido 4-(1-fluorovinil)-2-metilbenzóico (C27)



Aislado como un aceite incoloro (0.165 g, 89%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 8.12 - 8.03 (m, 1H), 7.46 (dd, J = 5.8, 2.1 Hz, 2H), 5.17 (dd, J = 49.1, 3.7 Hz, 1H), 4.98 (dd, J = 17.5, 3.7 Hz, 1H), 2.68 (s, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) δ -108.50.

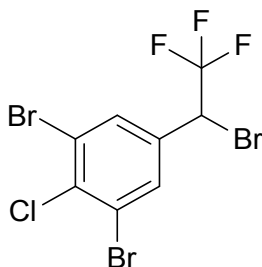
Ejemplo 8: Preparación de 5-(1-bromo-2,2-difluoropropil)-1,2,3-triclorobenceno (C34)



N -Bromosuccinimida (12.0 g, 67.5 mmol) se añadió a una solución de 2,2-difluoro-1-(3,4,5-triclorofenil)propan-1-ol (C43) (6.00 g, 21.8 mmol) en diclorometano (72.6 mL). A esta solución agitada se añadió fosfito de trifenilo (17.1 mL, 65.3 mmol) lentamente, en forma de porciones, y la mezcla de reacción se puso marrón oscuro. La mezcla de reacción se calentó después a reflujo por 3 horas. El solvente se concentró, y el residuo se trituró con éter de dietilo. El sólido se filtró, el filtrado se concentró y el aceite resultante se purificó por cromatografía en columna rápida usando hexanos como eluyente para proporcionar el compuesto del título como un aceite incoloro y claro (2.20 g, 25%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 7.52 (s, 2H), 4.85 (dd, J = 12.3, 10.4 Hz, 1H), 1.77 (t, J = 18.2 Hz, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) δ -92.14 – -95.01 (m); EIMS m/z 338 ($[\text{M}]^+$).

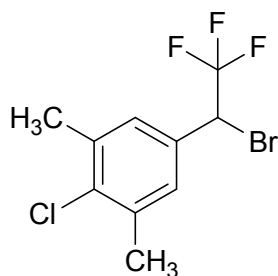
Los siguientes compuestos se prepararon de la misma manera que el procedimiento detallado en el Ejemplo 8:

1,3-Dibromo-5-(1-bromo-2,2,2-trifluoroetil)-2-clorobenceno (C35)



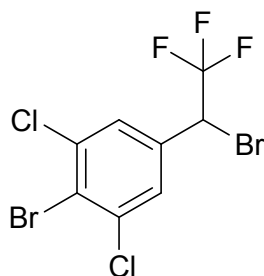
Aislado como un aceite claro (28 g, 56%): ^1H NMR (400 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ 8.01 - 7.97 (m, 2H), 6.26 - 6.20 (m, 1H); IR (película delgada) 1168, 736, 557 cm^{-1} ; ESIMS m/z 428 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

5-(1-Bromo-2,2,2-trifluoroetil)-2-cloro-1,3-dimetilbenceno (C36)



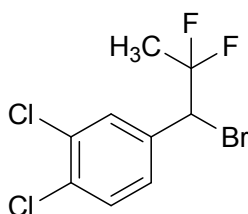
Aislado como un aceite claro (6.32 g, 89%): ^1H NMR (300 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ 7.39 (s, 2H), 6.17-6.09 (m, 1H), 2.35 (s, 6H); IR (película delgada) 1114, 754 cm^{-1} ; ESIMS m/z 302 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

5 2-Bromo-5-(1-bromo-2,2,2-trifluoroetil)-1,3-diclorobenceno (C37)



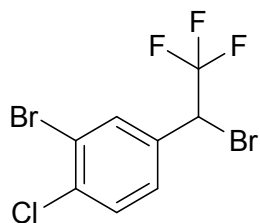
Aislado como un aceite claro (19 g, 46%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 7.54 - 7.51 (m, 2H), 5.03 - 4.98 (m, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) δ -70.38.

4-(1-Bromo-2,2-difluoropropil)-1,2-diclorobenceno (C38)



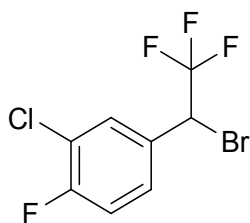
Aislado como un líquido incoloro (1.40 g, 65%): ^1H NMR (300 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ 7.76 - 7.70 (m, 2H), 7.54 (dd, J = 8.4, 1.8 Hz, 1H), 5.81 - 5.73 (m, 1H), 1.67 (d, J = 18.9 Hz, 3H); IR (película delgada) 1118, 800, 499 cm^{-1} ; EIMS m/z 304 ($[\text{M}]^+$).

2-Bromo-4-(1-bromo-2,2,2-trifluoroetil)-1-clorobenceno (C39)



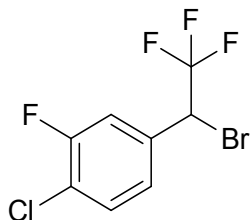
Aislado como un líquido incoloro (10.5 g, 54%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 7.76 (d, $J = 1.2$ Hz, 1H), 7.49 - 7.47 (m, 1H), 7.41 - 7.39 (m, 1H), 5.07 - 5.02 (m, 1H); IR (película delgada) 3437, 2924, 1631, 1114 cm^{-1} ; EIMS m/z 350 ($[\text{M}]^+$).

5 4-(1-Bromo-2,2,2-trifluoroetil)-2-cloro-1-fluorobenceno (C40)



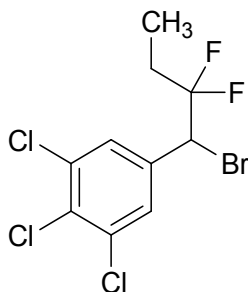
Aislado como un aceite incoloro (8.0 g, 73%): ^1H NMR (300 MHz, CDCl_3) δ 7.59 - 7.57 (m, 1H), 7.42 - 7.33 (m, 1H), 7.20 - 7.14 (m, 1H), 5.10 - 5.03 (m, 1H); IR (película delgada) 3429, 2926, 1502, 750 cm^{-1} ; ESIMS m/z 292 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

10 4-(1-Bromo-2,2,2-trifluoroetil)-1-cloro-2-fluorobenceno (C41)



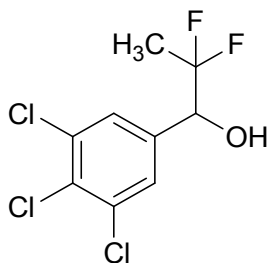
Aislado como un aceite amarillo (1.1 g, 45%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 7.44 (dd, $J = 8.3, 7.5$ Hz, 1H), 7.34 (dd, $J = 9.5, 1.9$ Hz, 1H), 7.26 - 7.22 (s, 1H), 5.08 (q, $J = 7.1$ Hz, 1H); EIMS m/z 291 ($[\text{M}]^+$).

15 Ejemplo 9: Preparación de 5-(1-bromo-2,2-difluorobutil)-1,2,3-triclorobenceno (C42)



Trietilamina (2.46 mL, 17.6 mmol) y cloruro de metanosulfonilo (1.10 mL, 14.1 mmol) se añadieron a una solución de 2,2-difluoro-1-(3,4,5-triclorofenil)butan-1-ol (C44) (3.40 g, 11.7 mmol) en diclorometano (58.7 mL). La mezcla de reacción se agitó por 1 hora, y luego se añadió pentano. La filtración seguida de la concentración del filtrado bajo vacío proporcionó un sólido blanco. El sólido se disolvió en diclorometano (58.7 mL) a lo que se añadió bromuro de hierro(III) (6.94 g, 23.5 mmol). La mezcla de reacción se agitó durante toda la noche. La mezcla se vertió en agua y luego se extrajo con diclorometano. Los componentes orgánicos se lavaron con salmuera, se secaron sobre sulfato de sodio, se filtraron y se concentraron. La purificación por cromatografía en columna rápida usando hexanos como eluyente proporcionó el compuesto del título como un sólido blanco (3.52 g, 72%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 7.51 (s, 2H), 4.85 (t, J = 12.1 Hz, 1H), 2.14 - 1.91 (m, 2H), 1.06 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ^{13}C NMR (101 MHz, CDCl_3) δ 135.55, 134.39, 132.52, 129.48, 120.25 (t, J = 249.0 Hz), 49.76 (t, J = 30.3 Hz), 28.03 (t, J = 25.2 Hz), 6.06 (t, J = 5.1 Hz); ESIMS m/z 351 ($[\text{M}-\text{H}]^-$).

Ejemplo 10: Preparación de 2,2-difluoro-1-(3,4,5-triclorofenil)propan-1-ol (C43)

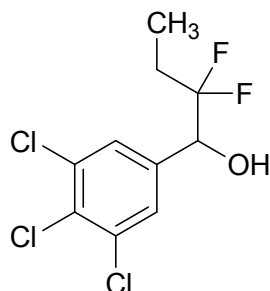


2,2-Difluoro-1-(3,4,5-triclorofenil)propan-1-ona (C52) (1.75 g, 6.40 mmol) se disolvió en metanol (64.0 mL) a temperatura ambiente y se añadió borohidruro de sodio (0.290 g, 7.68 mmol). La reacción agitada a temperatura ambiente por 1 hora, hasta que cesó la evolución del gas. La mezcla de reacción se vertió en agua y se extrajo con éter de dietilo. La capa orgánica se lavó

con salmuera, se secó sobre sulfato de sodio, se filtró y se concentró. La purificación por cromatografía en columna rápida usando 0 - 30 % acetona/hexanos como eluyente proporcionó el compuesto del título como un aceite incoloro claro (1.60 g, 91%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 7.50 (d, J = 0.9 Hz, 2H), 4.81 (td, J = 8.7, 3.8 Hz, 1H), 1.65 – 1.41 (m, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) δ -98.54 – -101.73 (m); IR (película delgada) 3405, 1555, 1389 cm^{-1} .

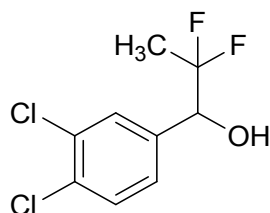
Los siguientes compuestos se prepararon de la misma manera que el procedimiento detallado en el Ejemplo 10:

2,2-Difluoro-1-(3,4,5-triclorofenil)butan-1-ol (C44)



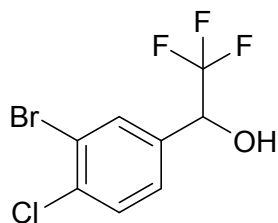
Aislado como un aceite incoloro y claro (3.4 g, 48%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 7.48 (d, J = 0.9 Hz, 2H), 4.87 - 4.70 (m, 1H), 2.54 (dt, J = 4.0, 1.0 Hz, 1H), 2.06 - 1.82 (m, 1H), 1.82 - 1.63 (m, 1H), 1.02 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ^{13}C NMR (101 MHz, CDCl_3) δ 136.85, 134.20, 131.60, 127.54, 123.19 (t, J = 248.0 Hz), 73.71 (t, J = 30.0 Hz), 25.05 (t, J = 24.6 Hz), 5.35 (t, J = 5.2 Hz); EIMS m/z 287 ($[\text{M}]^+$).

1-(3,4-Diclorofenil)-2,2-difluoropropan-1-ol (C45)



Aislado como un aceite incoloro y claro (2.78 g, 89%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 7.57 (dd, J = 2.0, 0.9 Hz, 1H), 7.46 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.33 - 7.27 (m, 1H), 4.83 (td, J = 8.9, 3.7 Hz, 1H), 2.55 (dt, J = 3.8, 1.1 Hz, 1H), 1.50 (t, J = 18.9 Hz, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) δ -99.52 (d, J = 249.6 Hz), -101.09 (d, J = 249.4 Hz); IR (película delgada) 3417 cm^{-1} .

Ejemplo 11: Preparación de 1-(3-bromo-4-clorofenil)-2,2,2-trifluoroetanol (C46)

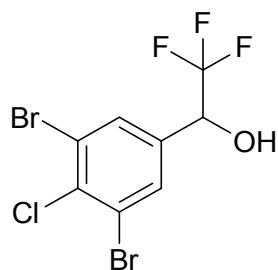


Trimetil(trifluorometil)silano (10.1 mL, 68.4 mmol) y fluoruro de tetrabutilamonio (1.44 g, 4.56 mmol) se añadieron a una solución agitada de 3-bromo-4-cloro-benzaldehído (10.0 g, 45.6 mmol) en tetrahidrofurano (150 mL) a temperatura ambiente y la mezcla de reacción se agitó por 2 horas. La mezcla de reacción se diluyó con diclorometano y se lavó con ácido clorhídrico (2 N). La capa orgánica separada se lavó con salmuera, se secó sobre sulfato de sodio, se filtró y se concentró para proporcionar el compuesto del título como un líquido marrón que se usó sin purificación adicional (13.2 g, 94%):

^1H NMR (300 MHz, CDCl_3) δ 7.76 (s, 1H), 7.50 - 7.48 (m, 1H), 7.38 - 7.35 (m, 1H), 5.03 - 4.97 (m, 1H), 2.95 (br s, 1H); IR (película delgada) 3406, 2881, 1469, 814 cm^{-1} ; EIMS m/z 288 ($[\text{M}]^+$).

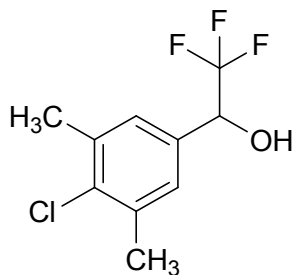
Los siguientes compuestos se prepararon de la misma manera que el procedimiento detallado en el Ejemplo 11:

1-(3,5-Dibromo-4-clorofenil)-2,2,2-trifluoroetanol (C47)



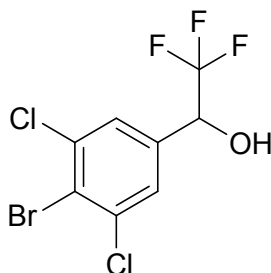
Aislado como un líquido amarillo pálido (7.4 g, 85%): ^1H NMR (400 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ 7.90 (s, 2H), 7.24 (d, $J = 5.2$ Hz, 1H), 5.33 (d, $J = 6.4$ Hz, 1H); IR (película delgada) 3370, 1175, 735, 541 cm^{-1} ; EIMS m/z 366 ($[\text{M}]^+$).

1-(4-cloro-3,5-dimetilfenil)-2,2,2-trifluoroetanol (C48)



Aislado como un líquido claro (5.0 g, 70%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 7.18 (s, 2H), 4.95 - 4.92 (m, 1H), 2.40 (s, 6H); IR (película delgada) 3378, 1124, 833 cm^{-1} ; EIMS m/z 238 ($[\text{M}]^+$).

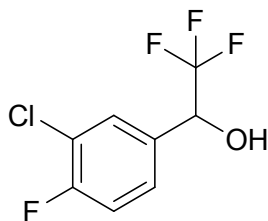
1-(4-Bromo-3,5-diclorofenil)-2,2,2-trifluoroetanol (C49)



5

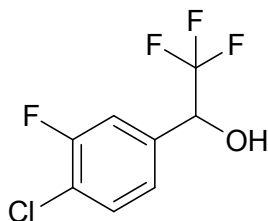
Aislado como un aceite claro (33 g, 86%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 7.51 (s, 2H), 5.01 - 4.96 (m, 1H), 4.14 - 4.09 (m, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) δ -78.32.

1-(3-cloro-4-fluorofenil)-2,2,2-trifluoroetanol (C50)



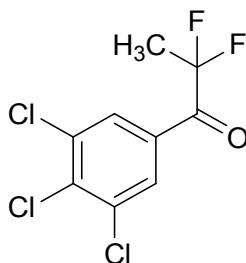
10 Aislado como una goma marrón clara (7.0 g, 97%): ^1H NMR (300 MHz, CDCl_3) δ 7.58 - 7.55 (m, 1H), 7.38 - 7.33 (m, 1H), 7.20 - 7.15 (m, 1H), 5.03 - 4.97 (m, 1H); EIMS m/z 228 ($[\text{M}]^+$).

1-(4-cloro-3-fluorofenil)-2,2,2-trifluoroetanol (C51)



Aislado como un aceite incoloro y claro (1.97 g, 75%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 7.52 - 7.37 (m, 1H), 7.32 (d, J = 9.6 Hz, 1H), 7.21 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 5.03 (dd, J = 6.3, 3.6 Hz, 1H), 2.62 (d, J = 4.0 Hz, 1H); ^{13}C NMR (101 MHz, CDCl_3) δ 158.06 (J_{CF} = 188.9 Hz), 134.40 (d, J_{CF} = 6.6 Hz), 130.79, 123.83 (d, J_{CF} = 3.5 Hz), 122.4 (q, J_{CF} = 188.9 Hz), 115.8 (d, J = 25.3 Hz), 71.65 (q, J_{CF} = 31.6 Hz);
5 EIMS m/z 228 ($[\text{M}]^+$).

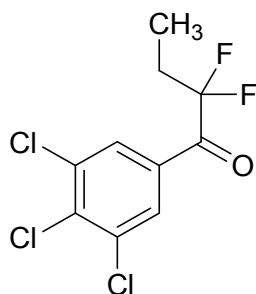
Ejemplo 12: Preparación de 2,2-difluoro-1-(3,4,5-triclorofenil)propan-1-ona (C52)



A 5-bromo-1,2,3-triclorobenceno (2.28 g, 8.76 mmol) disuelto en éter de dietilo (39.8 mL) a -78
10 $^{\circ}\text{C}$ bajo nitrógeno se añadió *n*-butilitio (3.50 mL, 8.76 mmol). La solución se agitó durante 30 minutos. A esto se añadió etil 2,2-difluoropropanoato (1.10 g, 7.96 mmol, as a 20 % p/p solución en tolueno) en forma de gotas durante 10 minutos, y la mezcla de reacción se agitó por una hora adicional. La solución de cloruro de amonio acuoso saturado se añadió a la mezcla y la agitación continuó cuando el matraz de reacción se calentó a temperatura ambiente. La mezcla
15 de reacción luego se extrajo con éter de dietilo, se lavó con agua y salmuera, se secó sobre sulfato de sodio, se filtró y se concentró. La purificación por cromatografía en columna rápida proporcionó el compuesto del título como un aceite amarillo pálido (1.76 g, 73%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 8.11 (d, J = 0.9 Hz, 2H), 1.89 (t, J = 19.6 Hz, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) δ -92.66; ESIMS m/z 271 ($[\text{M}-\text{H}]^-$).

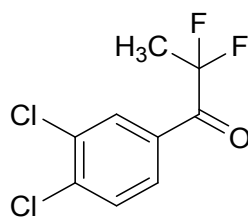
20 *Los siguientes compuestos se prepararon de la misma manera que el procedimiento detallado en el Ejemplo 12:*

2,2-Difluoro-1-(3,4,5-triclorofenil)butan-1-ona (C53)



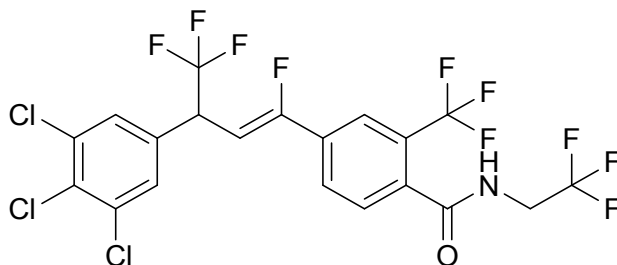
Aislado como un aceite (2.3 g, 68%) y se usó sin purificación o caracterización adicional.

1-(3,4-Diclorofenil)-2,2-difluoropropan-1-ona (C54)



- 5 Aislado como un aceite incoloro (3.89 g, 71%): ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 8.21 - 8.18 (m, 1H), 7.99 - 7.93 (m, 1H), 7.59 (dd, J = 8.4, 4.2 Hz, 1H), 1.89 (t, J = 19.6 Hz, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, CDCl_3) δ -92.08 – -93.21 (m); EIMS m/z 238/240 ($[\text{M}]^+$).

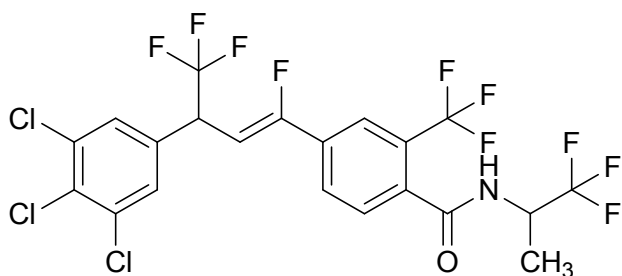
Ejemplo 13: Preparación de (Z)-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-N-(2,2,2-trifluoroetil)-2-(trifluorometil)benzamida (F1)



- 10 A un vial 25 mL se añadieron ácido (Z)-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzónico (C2) (0.062 g, 0.13 mmol), 2,2,2-trifluoroetanamina (0.019 g, 0.19 mmol), ((1*H*-benzo[d][1,2,3]triazol-1-il)oxi)tri(pirrolidin-1-il)fosfonio hexafluorofosfato(V) (0.098 g, 0.19 mmol), y diclorometano (2.5 mL) para dar una suspensión naranja. Se añadió trietilamina
- 15 (0.070 mL, 0.50 mmol), y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante toda la noche. La reacción se concentró y el residuo se purificó por cromatografía en columna rápida para proporcionar el compuesto del título como un aceite amarillo (0.024 g, 31%).

Los siguientes compuestos se prepararon de la misma manera que el procedimiento detallado en el Ejemplo 13:

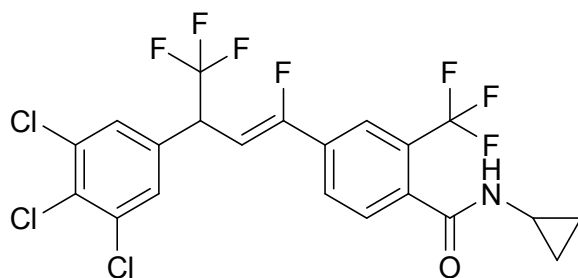
(Z)-4-(1,4,4,4-Tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)-N-(1,1,1-trifluoropropan-2-il)benzamida (F2)



5

Aislado como un aceite amarillo (0.021 g, 22%).

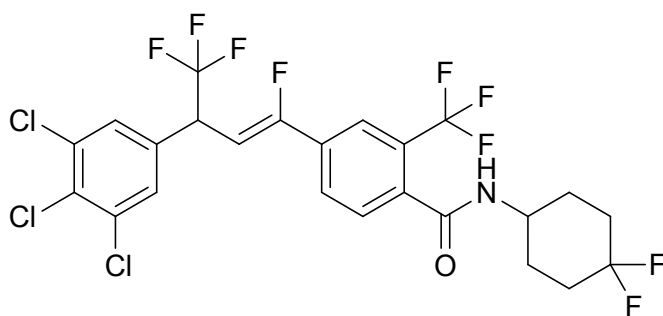
(Z)-N-ciclopropil-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F3)



10

Aislado como un aceite amarillo (0.036 g, 49%).

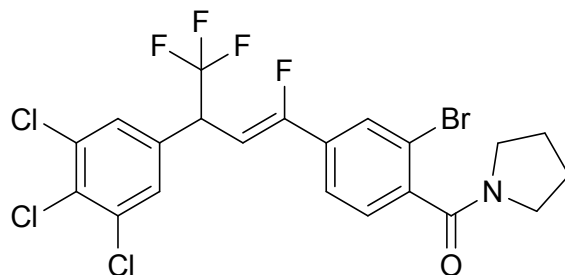
(Z)-N-(4,4-Difluorociclohexil)-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F4)



Aislado como un aceite amarillo (0.025 g, 54%).

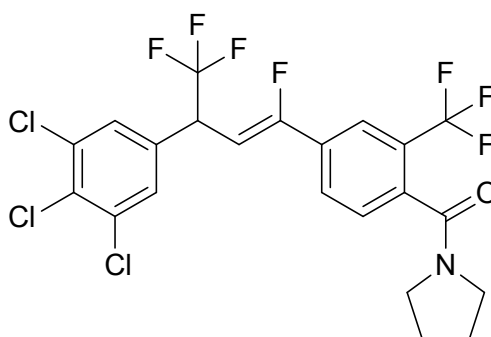
15

(Z)-(2-Bromo-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)fenil)(pirrolidin-1-il)metanona (F5)



Aislado como un aceite amarillo (0.010 g, 11%).

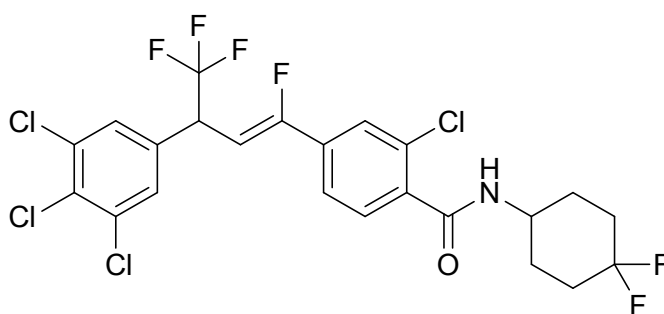
(Z)-pirrolidin-1-il(4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)fenil) metanona (F6)



5

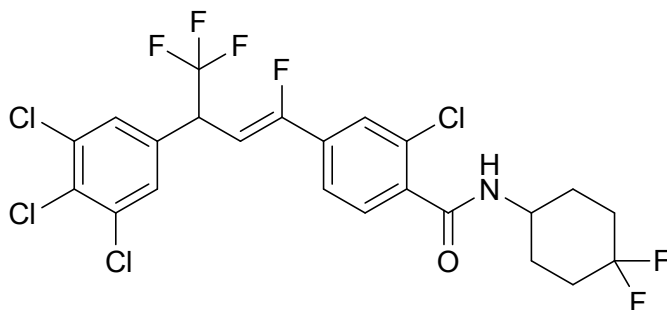
Aislado como un aceite amarillo (0.013 g, 10%).

(Z)-2-cloro-N-(4,4-difluorociclohexil)-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)benzamida (F9)



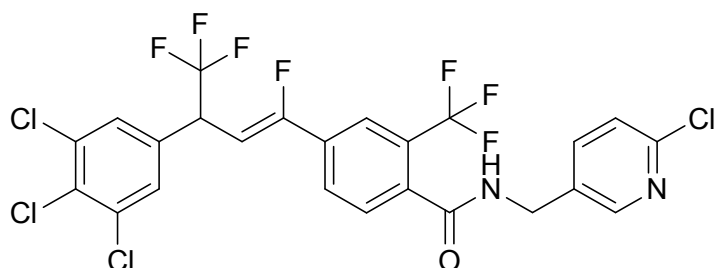
10 Aislado como una goma blanca (0.119 g, 90%).

(Z)-2-Bromo-N-(4,4-difluorociclohexil)-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)benzamida (F10)



Aislado como una goma amarilla (0.104 g, 80%).

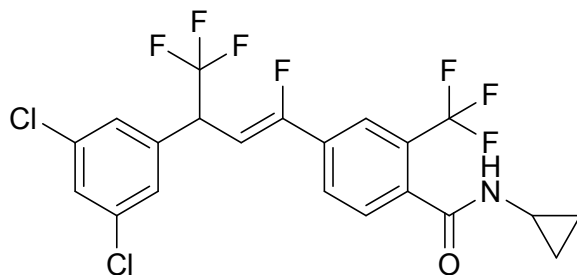
(Z)-N-((6-cloropiridin-3-il)metil)-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F11)



5

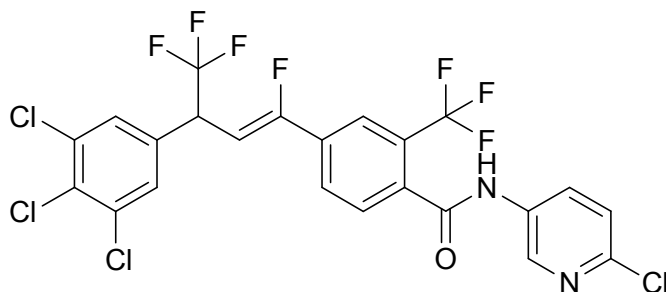
Aislado como un sólido amarillo pálido (0.115 g, 45%).

(Z)-N-ciclopropil-4-(3-(3,5-diclorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F23)



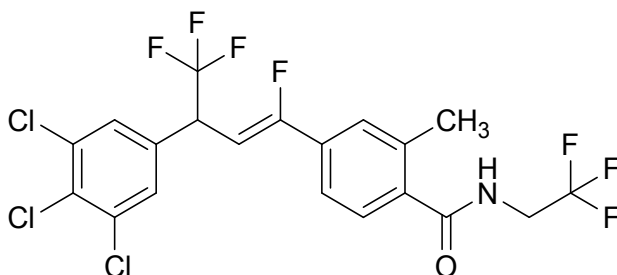
10 Aislado como un sólido marrón (0.110 g, 47%).

(Z)-N-(6-cloropiridin-3-il)-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F26)



Aislado como un sólido amarillo pálido (0.105 g, 37%).

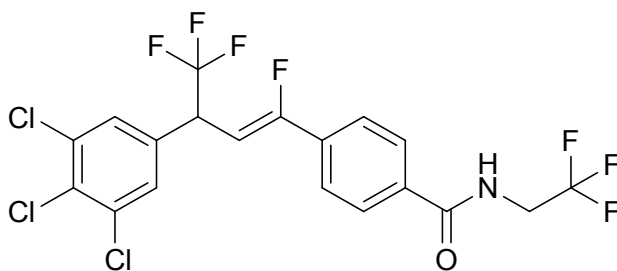
(Z)-2-Metil-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-N-(2,2,2-trifluoroetil)benzamida (F39)



5

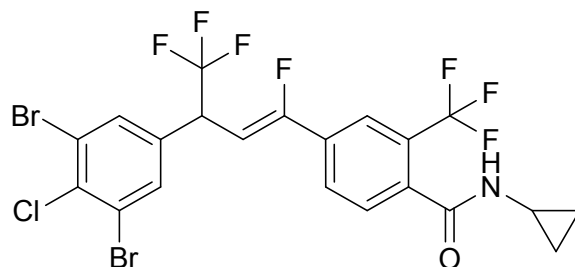
Aislado como una goma amarilla (0.070 g, 70%).

(Z)-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-N-(2,2,2-trifluoroetil)benzamida (FC1)



10 Aislado como una goma amarilla (0.045 g, 72%).

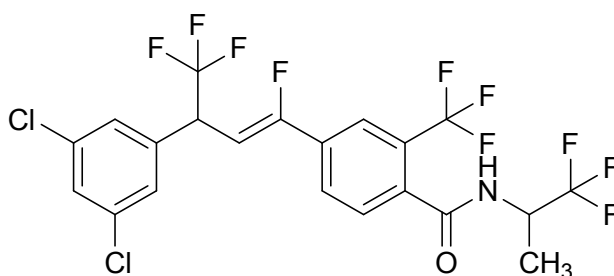
Ejemplo 14: Preparación de (Z)-N-ciclopropil-4-(3-(3,5-dibromo-4-clorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F12)



Se añadieron diisopropiletilamina (0.22 mL, 1.3 mmol), 2-cloro-1,3-dimetilimidazolidinio hexafluorofosfato (0.12 g, 0.43 mmol), 1-hidroxi-7-azabenzotriazolo (0.058 g, 0.43 mmol), y ciclopropanamina (0.026 g, 0.47 mmol) a una solución agitada de ácido (Z)-4-(3-(3,5-dibromo-4-clorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzóico (C5) (0.25 g, 0.43 mmol) en diclorometano (5.0 mL), y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente por 6 horas. La mezcla de reacción se vertió en agua y se lavó con diclorometano. La capa orgánica separada se lavó con water, salmuera, se secó sobre sulfato de sodio, se filtró, y se concentró. El producto crudo se purificó por cromatografía en columna rápida usando 30% acetato de etilo/éter de petróleo como eluyente para proporcionar el compuesto del título como una goma amarilla (0.11 g, 36%).

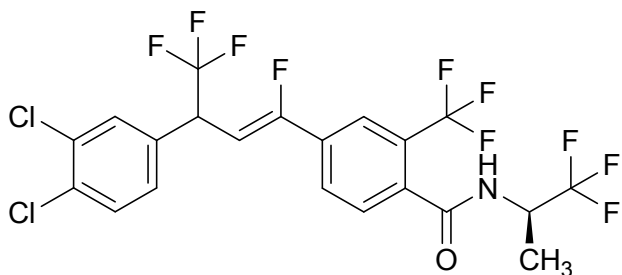
Los siguientes compuestos se prepararon de la misma manera que el procedimiento detallado en el Ejemplo 14:

4-((Z)-3-(3,5-Diclorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)-N-(1,1,1-trifluoropropan-2-il)benzamida (F15)



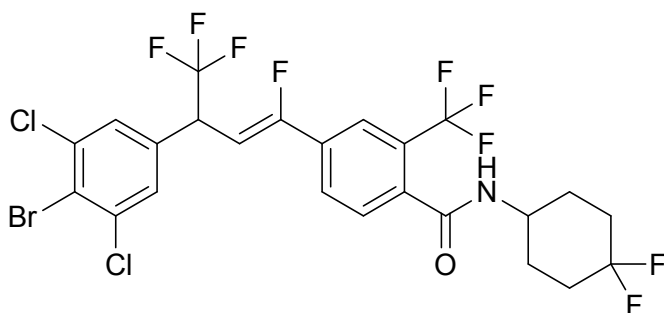
Aislado como una goma amarilla (0.170 g, 77%).

4-((Z)-3-(3,4-Diclorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)-N-((R)-1,1,1-trifluoropropan-2-il)benzamida (F16)



Aislado como una goma amarilla (0.130 g, 58%).

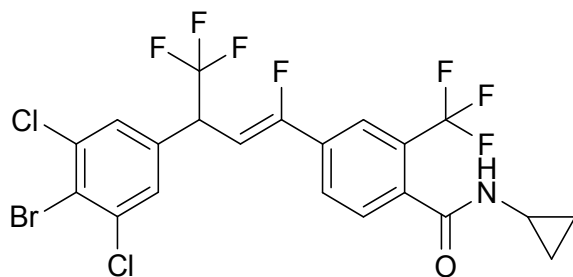
(Z)-4-(3-(4-Bromo-3,5-diclorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-N-(4,4-difluorociclohexil)-2-(trifluorometil)benzamida (F21)



5

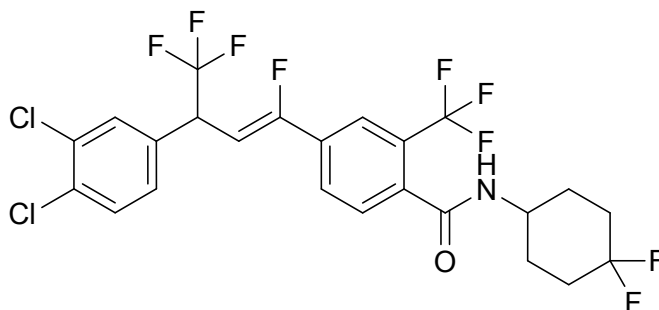
Aislado como un sólido amarillo pálido (0.110 g, 45%).

(Z)-4-(3-(4-Bromo-3,5-diclorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-N-ciclopropil-2-(trifluorometil)benzamida (F22)



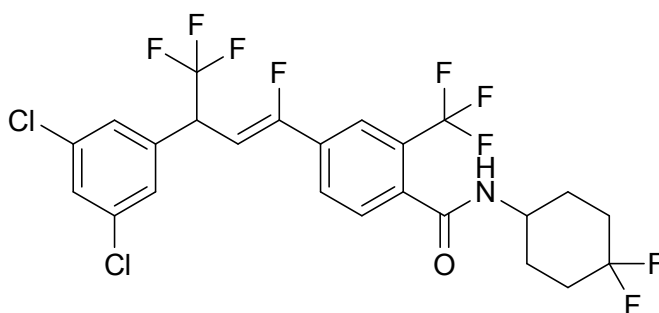
10 Aislado como un sólido amarillo pegajoso (0.125 g, 64%).

(Z)-4-(3-(3,4-Diclorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-N-(4,4-difluorociclohexil)-2-(trifluorometil)benzamida (F24)



Aislado como una goma amarilla pálida (0.164 g, 61%).

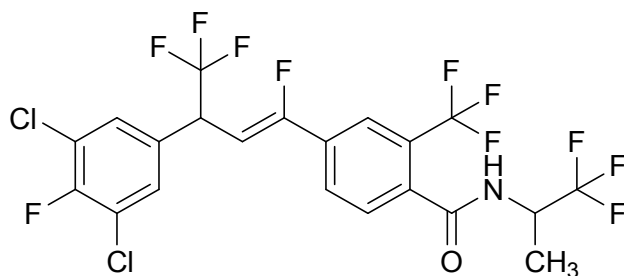
(Z)-4-(3-(3,5-Diclorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-N-(4,4-difluorociclohexil)-2-(trifluorometil)benzamida (F25)



5

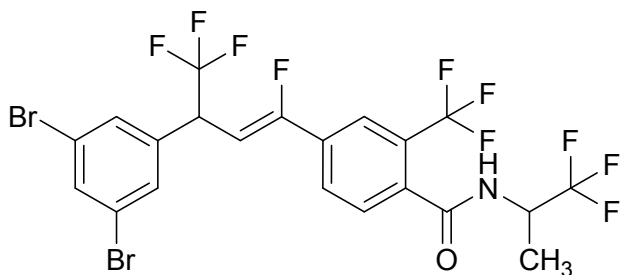
Aislado como una goma marrón (0.170 g, 63%).

(Z)-4-(3-(3,5-Dicloro-4-fluorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)-N-(1,1,1-trifluoropropan-2-il)benzamida (F27)



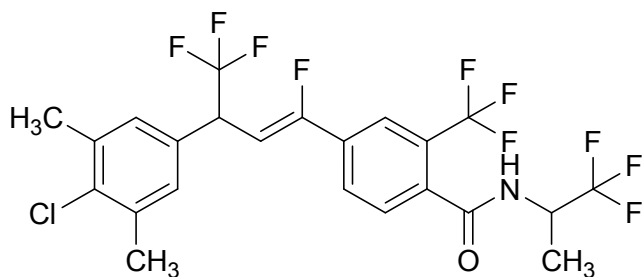
10 Aislado como una goma amarilla (0.125 g, 49%).

(Z)-4-(3-(3,5-Dibromofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)-N-(1,1,1-trifluoropropan-2-il)benzamida (F28)



Aislado como una goma amarilla (0.140 g, 62%).

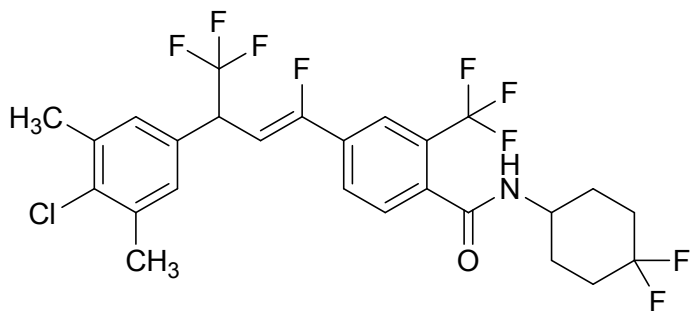
4-((Z)-3-(4-cloro-3,5-dimetilfenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)-N-(1,1,1-trifluoropropan-2-il)benzamida (F30)



5

Aislado como una goma amarilla (0.150 g, 55%).

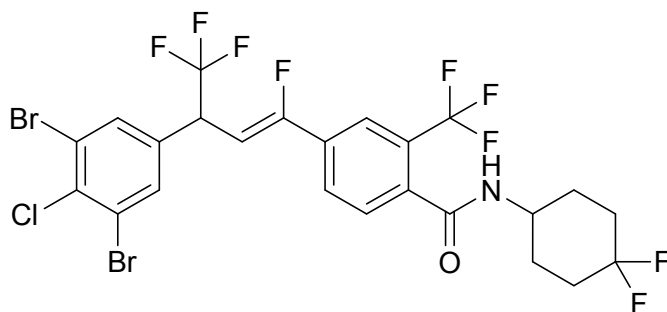
(Z)-4-(3-(4-cloro-3,5-dimetilfenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-N-(4,4-difluorociclohexil)-2-(trifluorometil)benzamida (F31)



10

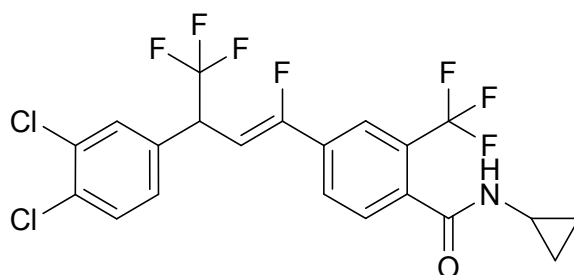
Aislado como una goma amarilla (0.110 g, 38%).

(Z)-4-(3-(3,5-Dibromo-4-clorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-N-(4,4-difluorociclohexil)-2-(trifluorometil)benzamida (F32)



Aislado como una goma marrón (0.110 g, 33%).

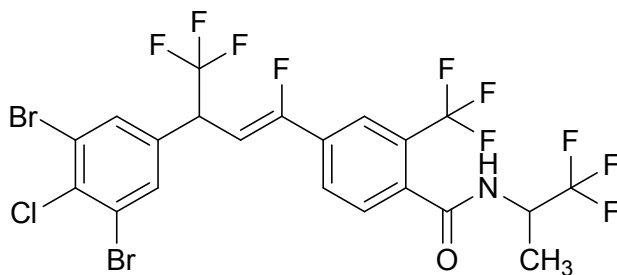
(Z)-N-ciclopropil-4-(3-(3,4-diclorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F35)



5

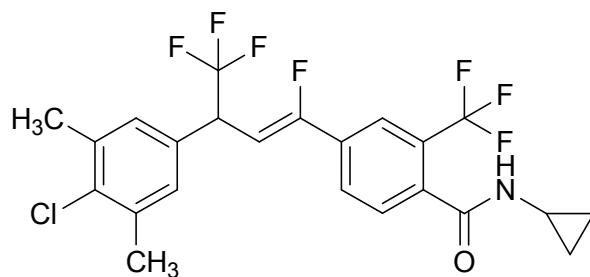
Aislado como una goma amarilla (0.080 g, 34%).

4-((Z)-3-(3,5-Dibromo-4-clorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)-N-(1,1,1-trifluoropropan-2-il)benzamida (F36)



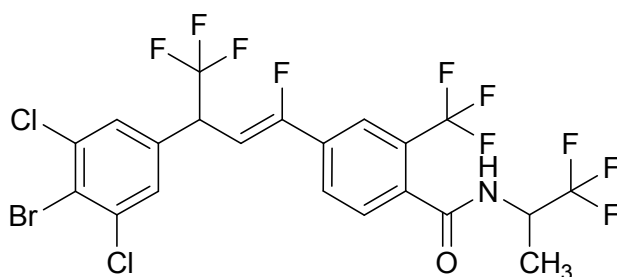
10 Aislado como un sólido marrón pegajoso (0.080 g, 28%).

(Z)-4-(3-(4-cloro-3,5-dimetilfenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-N-ciclopropil-2-(trifluorometil)benzamida (F37)



Aislado como una goma amarilla (0.110 g, 46%).

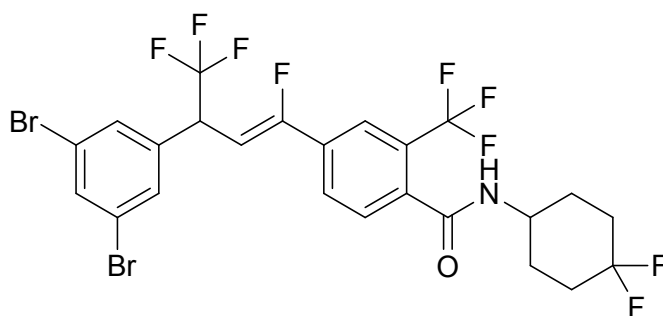
4-((Z)-3-(4-Bromo-3,5-diclorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)-N-(1,1,1-trifluoropropan-2-il)benzamida (F38)



5

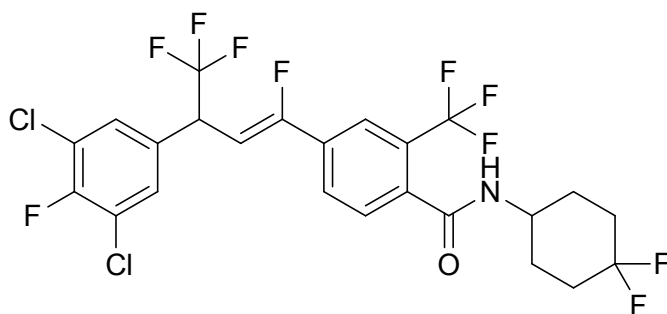
Aislado como una goma amarilla (0.075 g, 26%).

(Z)-4-(3-(3,5-Dibromofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-N-(4,4-difluorociclohexil)-2-(trifluorometil)benzamida (F40)



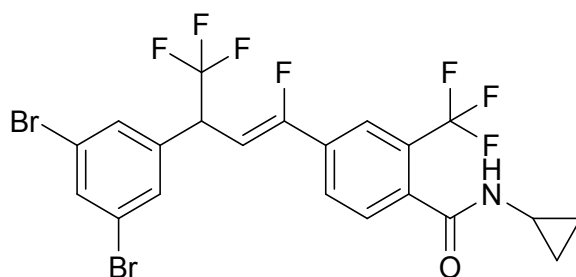
10 Aislado como una goma marrón (0.155 g, 61%).

(Z)-4-(3-(3,5-Dicloro-4-fluorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-N-(4,4-difluorociclohexil)-2-(trifluorometil)benzamida (F41)



Aislado como una goma marrón (0.128 g, 53%).

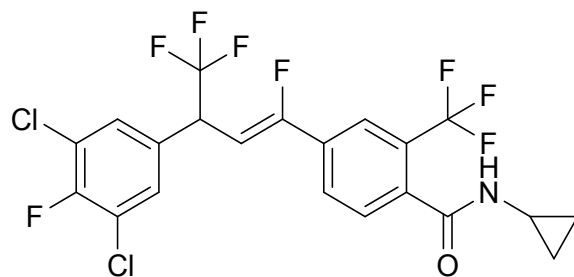
(Z)-N-ciclopropil-4-(3-(3,5-dibromofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F42)



5

Aislado como una goma amarilla (0.115 g, 53%).

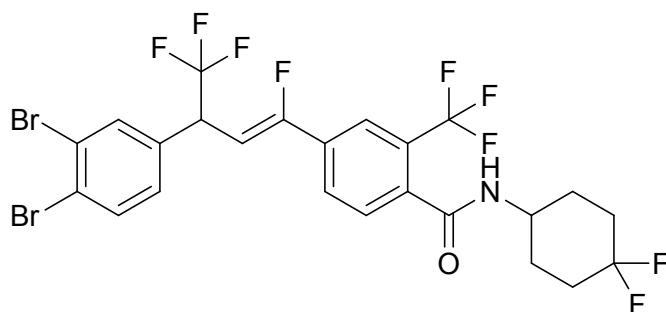
(Z)-N-ciclopropil-4-(3-(3,5-dicloro-4-fluorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F43)



10

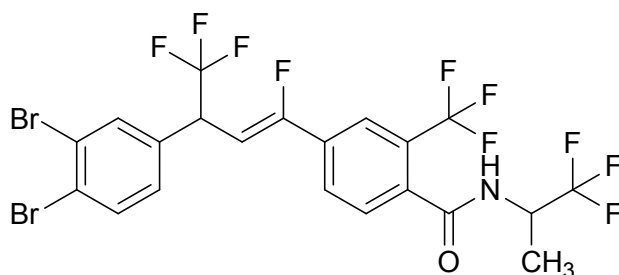
Aislado como una goma amarilla (0.125 g, 53%).

(Z)-4-(3-(3,4-Dibromofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-N-(4,4-difluorociclohexil)-2-(trifluorometil)benzamida (F44)



Aislado como una goma amarilla (0.115 g, 49%).

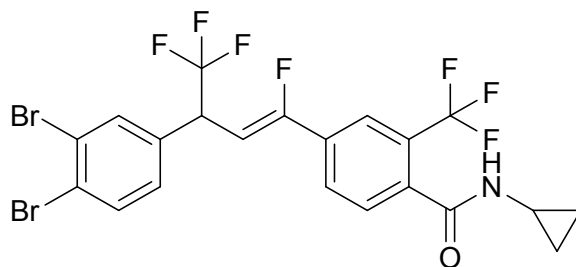
4-((*Z*)-3-(3,4-Dibromofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)-*N*-(1,1,1-trifluoropropan-2-il)benzamida (F45)



5

Aislado como una goma amarilla (0.110 g, 48%).

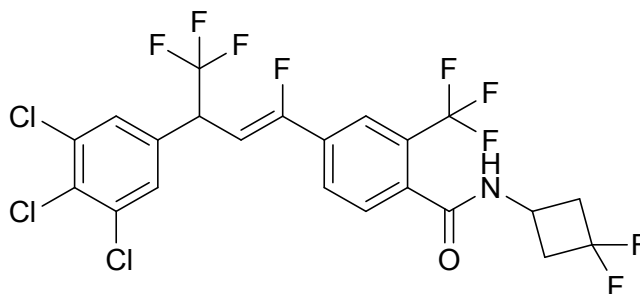
(*Z*)-*N*-ciclopropil-4-(3-(3,4-dibromofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F46)



10

Aislado como una goma amarilla (0.120 g, 53%).

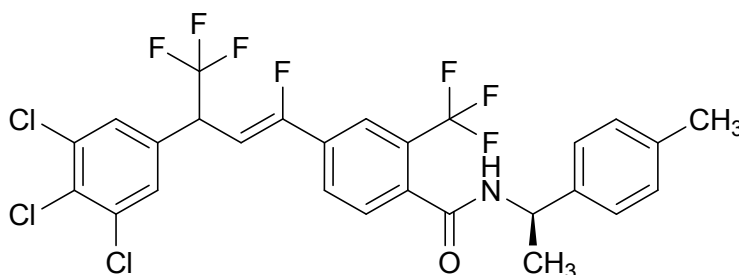
Ejemplo 15: Preparación de (*Z*)-*N*-(3,3-difluorociclobutil)-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F7)



Ácido (Z)-4-(1,4,4,4-Tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzóico (C2) (0.100 g, 0.202 mmol), cloruro de tionilo (0.0240 g, 0.202 mmol), y 1,2-dicloroetano (5 mL) se agitaron a reflujo por 1.5 horas. La mezcla de reacción se concentró, y el residuo se puso en diclorometano y se añadió en forma de gotas a una solución fría de 3,3-difluorociclobutanamina hidroc্লoruro (0.0304 g, 0.212 mmol), trietilamina (0.0429 g, 0.424 mmol), y diclorometano (10 mL). La reacción se agitó a temperatura ambiente toda la noche. La mezcla de reacción se diluyó con diclorometano y se lavó con ácido clorhídrico (1 N). Las capas se separaron y la capa orgánica se lavó con bicarbonato de sodio acuoso, salmuera, se secó sobre sulfato de magnesio, se filtró y se concentró para proporcionar el compuesto del título como una espuma amarilla clara (0.096 g, 81%).

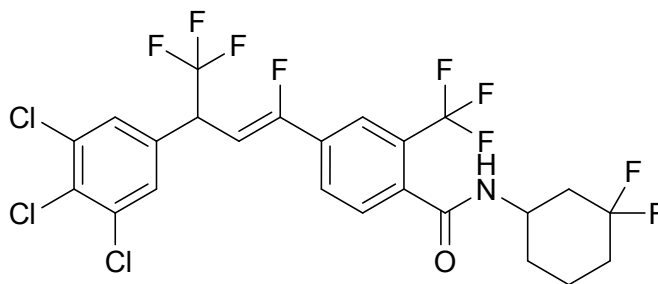
Los siguientes compuestos se prepararon de la misma manera que el procedimiento detallado en el Ejemplo 15:

4-((Z)-1,4,4,4-Tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-N-((R)-1-(p-tolil)etil)-2-(trifluorometil)benzamida (F8)



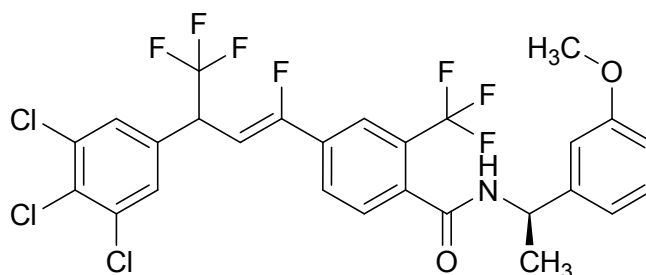
Aislado como un aceite amarillo (0.065 g, 66%).

(Z)-N-(3,3-Difluorociclohexil)-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F13)



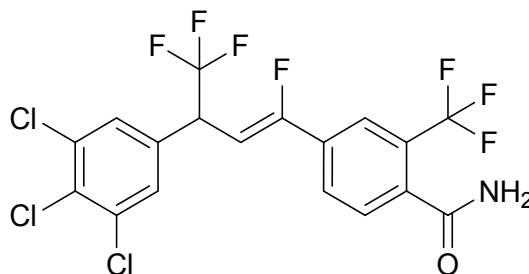
Aislado como un aceite marrón (0.072 g, 58%).

N-((*R*)-1-(3-Metoxifenil)etil)-4-((*Z*)-1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F14)



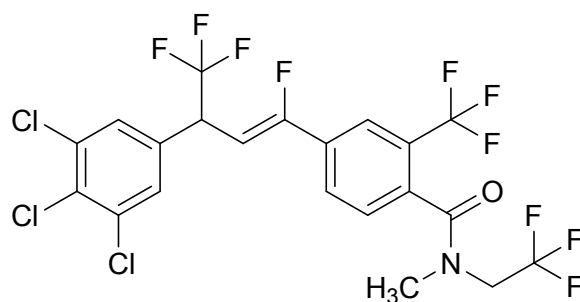
Aislado como una espuma marrón (0.108 g, 85%).

(*Z*)-4-(1,4,4,4-Tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F17)



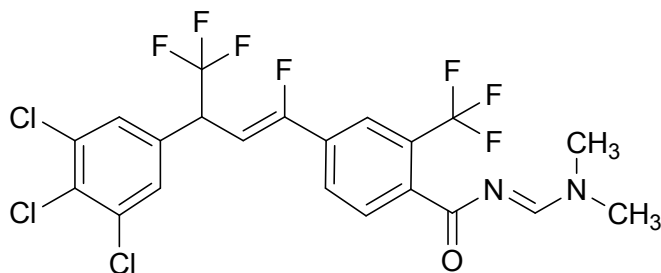
Aislado como un aceite marrón (0.390 g, 98%).

(*Z*)-*N*-Metil-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-*N*-(2,2,2-trifluoroetil)-2-(trifluorometil)benzamida (F29)



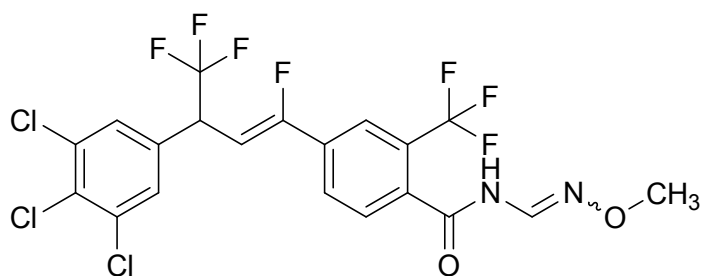
Aislado como una espuma/vidrio marrón (0.180 g, 66%).

Ejemplo 16: Preparación de (*E*)-*N*-((dimetilamino)metileno)-4-((*Z*)-1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F18)



5 A un matraz de fondo redondo de 25 mL se añadieron (*Z*)-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F17) (0.384 g, 0.776 mmol), *N,N*-dimetilformamida dimetil acetal (0.208 mL, 1.55 mmol), y tolueno (15 mL). La mezcla de reacción se agitó a 110 °C por 1 hora. La reacción se concentró para dar un residuo oscuro. La purificación por cromatografía en columna rápida usando 30-50% acetato de etilo/hexanos
10 proporcionó el compuesto del título como un aceite marrón grueso (0.330 g, 77%).

Ejemplo 17: Preparación de *N*-((*E/Z*)-(methoxiimino)metil)-4-((*Z*)-1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F19)

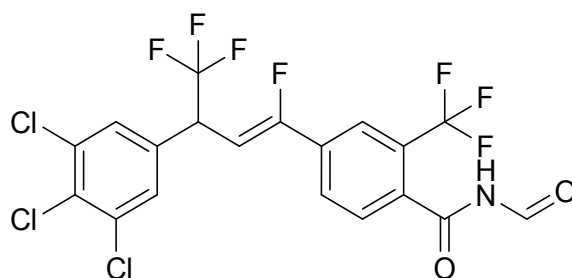


A una solución de *O*-metilhidroxilamina hidrocloreto (0.0425 g, 0.509 mmol), agua (0.8 mL), y
15 ácido acético (1.6 mL) se añadió una solución de hidróxido de sodio (0.0387 g, 0.968 mmol) en agua (0.8 mL) seguid por la adición en forma de gotas de una solución de (*E*)-*N*-((dimetilamino)metileno)-4-((*Z*)-1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F18) (0.140 g, 0.255 mmol) en dioxano (1.0 mL). La reacción se agitó a temperatura ambiente por 15 minutos. La mezcla de reacción se diluyó con éter de dietilo y se
20 añadió cuidadosamente a una solución acuosa de bicarbonato de sodio. Las capas se separaron y la capa acuosa se extrajo con éter de dietilo. El capas de éter de dietilo combinadas se lavaron

con salmuera, se secaron sobre sulfato de magnesio, se filtraron y se concentraron. La purificación por cromatografía en columna rápida usando 30% éter de dietilo/hexanos para proporcionar el compuesto del título como una espuma amarilla clara (0.106 g, 75%).

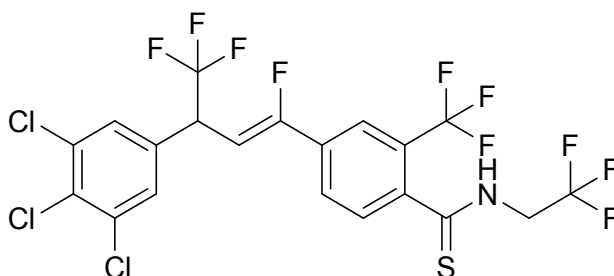
Los siguientes compuestos se prepararon de la misma manera que el procedimiento detallado en el Ejemplo 17:

(Z)-N-Formil-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F20)



Aislado como a beige foam (0.128 g, 84%) usando 3,3,3-trifluoropropan-1-amina y bicarbonato de sodio acuoso.

Ejemplo 18: Preparación de (Z)-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-N-(2,2,2-trifluoroetil)-2-(trifluorometil)benzotioamida (F33)



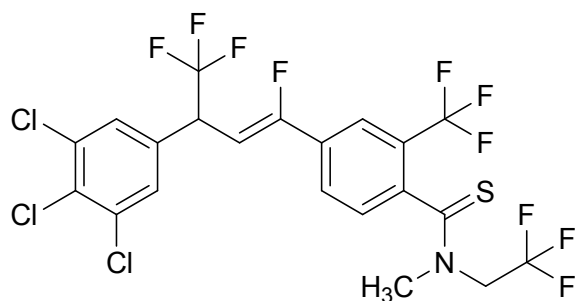
(Z)-4-(1,4,4,4-Tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-N-(2,2,2-trifluoroetil)-2-

(trifluorometil)benzamida (F1) (0.084 g, 0.15 mmol), 2,4-bis(4-metoxifenil)-1,3,2,4-ditiadifosfetano 2,4-disulfuro (0.15 g, 0.38 mmol), y 1,2-dicloroetano (3 mL) se taparon en un vial de 5 mL y se calentaron a 130 °C por 4 horas en un reactor de microondas Biotage Initiator® con monitoreo de la temperatura con un sensor IR externo desde el exterior del frasco. El material se diluyó con diclorometano y bicarbonato de sodio acuoso saturado. La capa orgánica se separó y se lavó con bicarbonato de sodio acuoso saturado (3x), se secó sobre sulfato de

sodio, y se filtró. La purificación de residuo crudo obtenido por cromatografía en columna rápida usando 0-100% acetato de etilo/hexanos proporcionó el compuesto del título como una película amarilla (0.057 g, 59%).

Los siguientes compuestos se prepararon de la misma manera que el procedimiento detallado en el Ejemplo 18:

(Z)-N-Metil-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-N-(2,2,2-trifluoroetil)-2-(trifluorometil)benzotioamida (F34)



Aislado como una espuma/vidrio amarillo (0.100 g, 74%).

Las siguientes moléculas en la Tabla 1 pueden prepararse de acuerdo con los procedimientos descritos: P1, P2, P3, P4, P5, P6, P7, P8, P9, P10, P11, P12, P13, P14, P15, P16, P17, P18, P19, P20, P21, P22, P23, P24, P25, P26, P27, P28, y P29.

Tabla 1. Estructura y método de preparación de moléculas proféticas

No.	Estructura
P1	

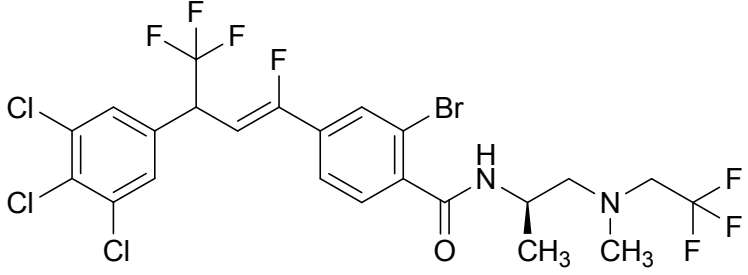
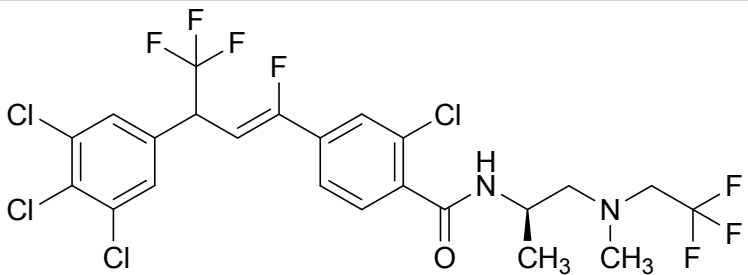
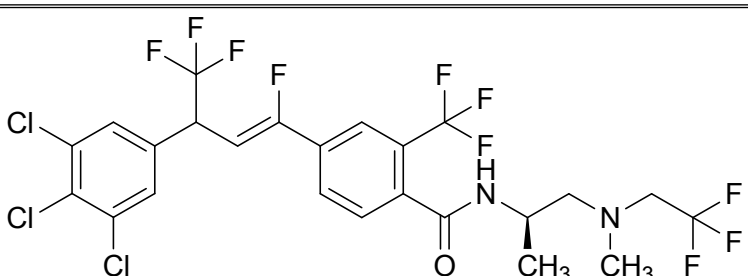
P2	
P3	
P4	
P5	
P6	

P7	
P8	
P9	
P10	
P11	

P12	
P13	
P14	
P15	
P16	

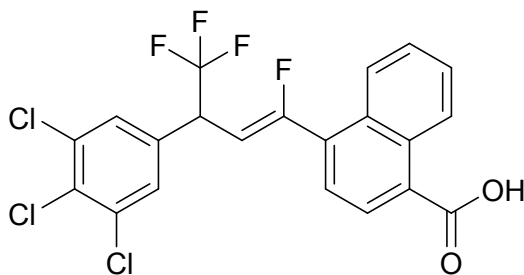
P17	
P18	
P19	
P20	
P21	

P22	
P23	
P24	
P25	
P26	

P27	
P28	
P29	

Los siguientes compuestos se prepararon de la misma manera que el procedimiento detallado en el Ejemplo 1:

Ácido (Z)-4-(1,4,4,4-Tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-1-naftóico (C55)

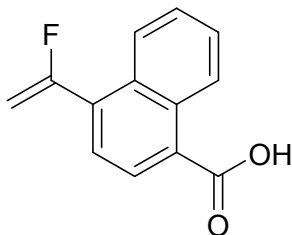


5

Aislado como un sólido amarillo (0.85 g, 53%): ^1H NMR (300 MHz, CDCl_3) δ 8.30 (d, $J = 7.5$ Hz, 1H), 8.07 - 8.05 (m, 1H), 7.70 - 7.61 (m, 4H), 7.49 (s, 2H), 5.69 (dd, $J = 9.9, 31.2$ Hz, 1H), 4.75 - 4.69 (m, 1H); IR (película delgada) 3445, 1684, 1260, 750 cm^{-1} ; ESIMS m/z 475.23 ($[\text{M}]^-$).

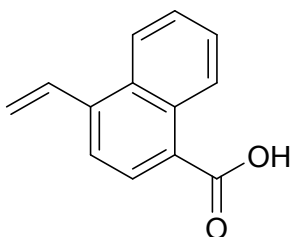
Los siguientes compuestos se prepararon de la misma manera que el procedimiento detallado en el Ejemplo 7:

Ácido 4-(1-Fluorovinil)-1-naftóico (C56)



- 5 Aislado como un sólido blancuzco (0.70 g, 52 %): mp 154 – 156 °C; ^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ 13.40 (br s, 1H), 8.88 - 8.84 (m, 1H), 8.17 - 8.10 (m, 2H), 7.75 - 7.66 (m, 3H), 5.39 (dd, J = 3.6, 17.2 Hz, 1H), 5.23 (dd, J = 36.0, 50.4 Hz, 1H); ESIMS m/z 215.20 ($[\text{M}-\text{H}]^-$).

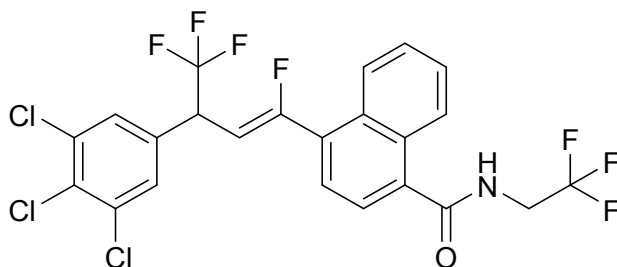
Ejemplo 19: Preparación de ácido 4-vinil-1-naftóico (C57)



- 10 A una solución agitada de ácido 4-bromo-1-naftóico (2.50 g, 9.98 mmol) en sulfóxido de dimetilo (32.3 mL) se añadió viniltrifluoroborato de potasio (1.33 g, 9.96 mmol), carbonato de potasio (3.85 g, 27.9 mmol) y [1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno]-dicloropaladio(II) (0.364 g, 0.498 mmol). La mezcla de reacción se calentó en un baño de 80 °C por 18 horas. La mezcla de reacción se enfrió hasta temperatura ambiente y se diluyó con solución de ácido clorhídrico 1 N
- 15 acuoso (150 mL) y agua (150 mL). La mezcla se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con salmuera, se secó sobre sulfato de sodio y se concentró bajo presión reducida para proporcionar el compuesto crudo. El compuesto crudo se purificó por cromatografía en columna (SiO_2 , que eluye con 0-100% de acetato de etilo en hexanos) para proporcionar el compuesto del título como un sólido amarillo brillante (1.36 g, 62%): mp 147 – 155 °C; ^1H NMR (300 MHz, acetona- d_6) δ 11.42 (s, 1H), 9.16 – 9.03 (m, 1H), 8.31 – 8.25 (m, 2H), 7.77 (dd, J = 7.7, 0.7 Hz, 1H), 7.70 – 7.57 (m, 3H), 5.95 (dd, J = 17.2, 1.5 Hz, 1H), 5.62 (dd, J = 11.1, 1.5 Hz, 1H); ESIMS m/z 197.1 ($[\text{M}-\text{H}]^-$).
- 20

Los siguientes compuestos se prepararon de la misma manera que el procedimiento detallado en el Ejemplo 13:

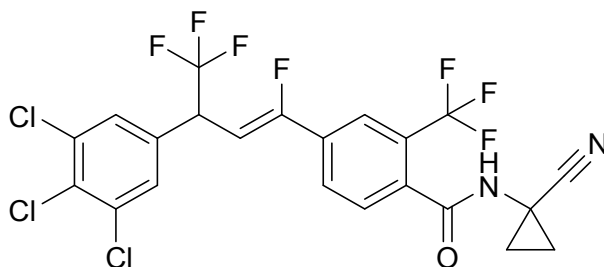
(Z)-4-(1,4,4,4-Tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-N-(2,2,2-trifluoroetil)-1-naftamida (PF1)



5

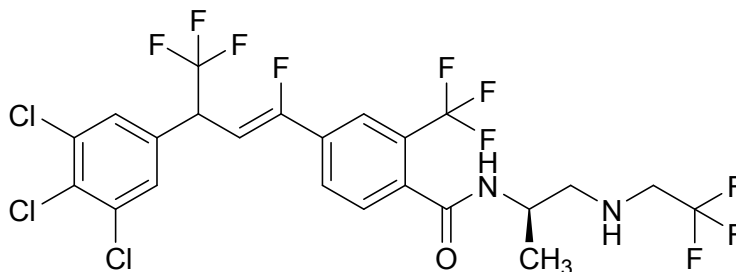
Aislado como una goma marrón (0.115 g, 53%).

(Z)-N-(1-Cianociclopropil)-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F62)



10 Aislado como un aceite amarillo (0.061 g, 51%).

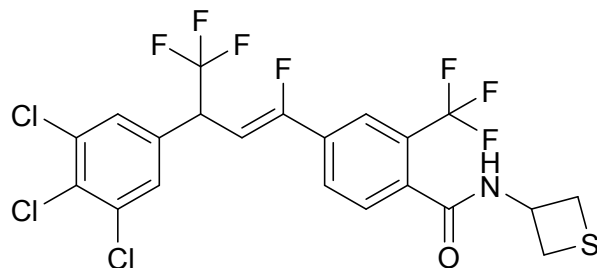
4-((Z)-1,4,4,4-Tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-N-((R)-1-((2,2,2-trifluoroetil)amino)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F61)



Aislado como un aceite amarillo (0.022 g, 83%).

15 Los siguientes compuestos se prepararon de la misma manera que el procedimiento detallado en el Ejemplo 14:

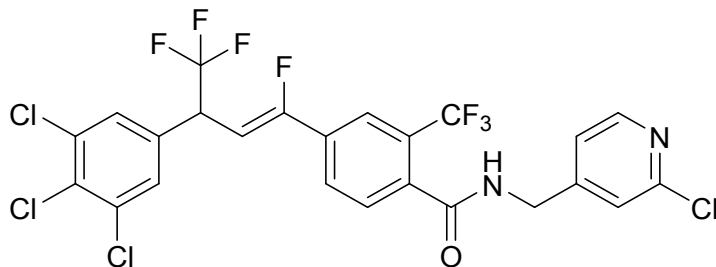
(Z)-4-(1,4,4,4-Tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-N-(tietan-3-il)-2-(trifluorometil)benzamida (PF2)



Aislado como un sólido marrón pálido (0.250 g, 73%).

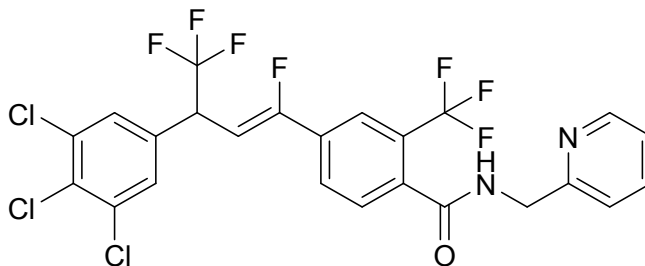
5 *Los siguientes compuestos se prepararon de la misma manera que el procedimiento detallado en el Ejemplo 15:*

(Z)-N-((2-cloropiridin-4-il)metil)-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F47)



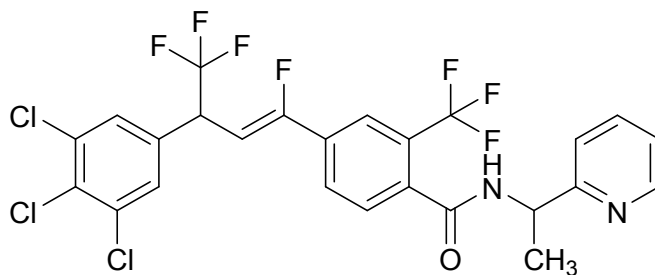
10 Aislado como un vidrio blanco (0.036 g, 26%).

(Z)-N-(piridin-2-ilmetil)-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F51)



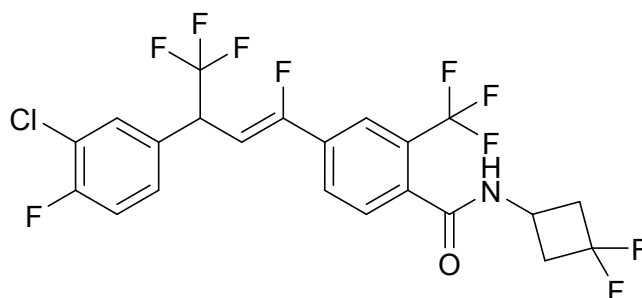
Aislado como un aceite marrón (0.158 g, 78%).

15 (Z)-N-(1-(piridin-2-il)etil)-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F52)



Aislado como un aceite marrón (0.163 g, 81%).

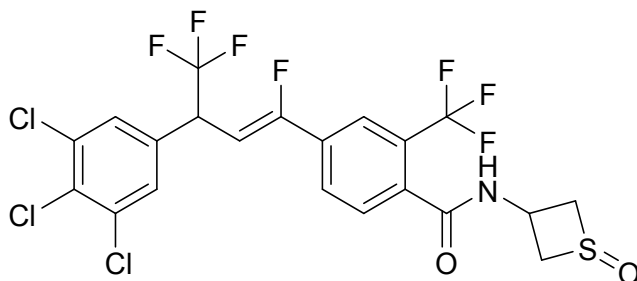
(Z)-4-(3-(3-cloro-4-fluorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-N-(3,3-difluorociclobutil)-2-(trifluorometil)benzamida (F63)



5

Aislado como un residuo amarillo (0.051 g, 29%).

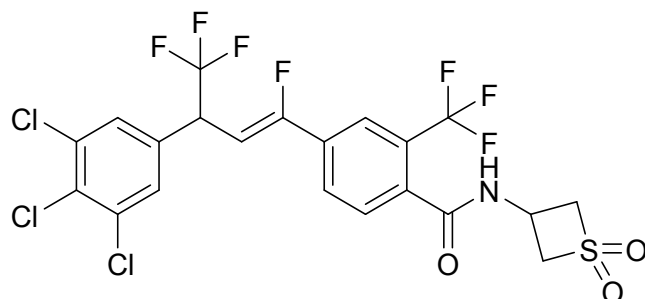
Ejemplo 20: Preparación de (Z)-N-(1-Oxidotietan-3-il)-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (PF3)



10 A una solución agitada de (Z)-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-N-(tietan-3-il)-2-(trifluorometil)benzamida (PF2) (0.100 g, 0.18 mmol) en diclorometano (5.0 mL) enfriada en un baño de hielo se añadió ácido 3-cloroperbenzóico (0.050 g, 0.29 mmol). La mezcla de reacción se agitó por 30 minutos, luego se concentró bajo presión reducida para proporcionar el compuesto crudo. La purificación por cromatografía en columna (SiO₂, 100-200 mesh, eluyendo con 20% acetato de etilo en hexanos) proporcionó el compuesto del título como un sólido

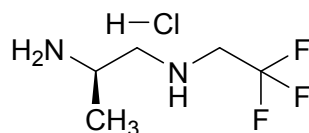
15 blancuzco (0.040 g, 33%).

Ejemplo 21: Preparación de (Z)-N-(1,1-Dioxidotietan-3-il)-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (PF4)



A una solución agitada de (Z)-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-N-(tietan-3-il)-2-(trifluorometil)benzamida (PF2) (0.180 g, 0.32 mmol) en diclorometano (5.0 mL) enfriada en un baño de hielo se añadió ácido 3-cloroperbenzóico (0.110 g, 0.64 mmol). La mezcla de reacción se dejó calentar hasta la temperatura ambiente y agitar por 1 hora. La mezcla de reacción se concentró bajo presión reducida para proporcionar el compuesto crudo. La purificación por cromatografía en columna (SiO₂, 100-200 mesh, eluyendo con 20% acetato de etilo en hexanos) proporcionó el compuesto del título como un sólido blancuzco (0.116 g, 61%).

Ejemplo 25: Preparación de (R)-N¹-(2,2,2-trifluoroetil)propano-1,2-diamina hidrocloreto (C58)



Se añadió borano en tetrahidrofurano (1.0 M, 5.3 mL, 4.3 mmol) a una solución de (R)-2-amino-N-(2,2,2-trifluoroetil)propanamida (0.3 g, 1.763 mmol) en tetrahidrofurano (1.7 mL). La mezcla de reacción se agitó por 15 horas a 70 °C, y luego el solvente se retiró para proporcionar una cera blanca. La cera se disolvió en diclorometano (10 mL) a lo que se añadió cloruro de hidrógeno en dioxano (4.0 M, 2.0 mL, 8.0 mmol). La purificación por filtración y lavado con hexanos proporcionó el compuesto del título como un sólido blanco (0.28 g, 82%): ¹H NMR (400 MHz, metanol-*d*₄) δ 4.91 (s, 3H), 4.00 (q, *J* = 9.1 Hz, 2H), 3.72 (q, *J* = 6.6 Hz, 1H), 3.62 - 3.51 (m, 1H), 3.42 - 3.33 (m, 2H), 1.50 - 1.30 (m, 3H); ¹⁹F NMR (376 MHz, metanol-*d*₄) δ -70.07; ESIMS *m/z* 156 ([M-HCl]⁻).

ENSAYOS BIOLÓGICOS

Los siguientes bioensayos contra el gusano soldado de la remolacha (*Spodoptera exigua*), el gusano falso medidor de la col (*Trichoplusia ni*), gusano del maíz (*Helicoverpa zea*), pulgón verde del melocotonero (*Myzus persicae*) y el mosquito de la fiebre amarilla (*Aedes aegypti*), se incluyen en la presente debido al daño que provocan. Además, el gusano soldado de la remolacha, gusano del maíz, y el gusano falso medidor de la col son tres especies que son buenas indicadoras de una amplia variedad de plagas masticadoras. Adicionalmente, el pulgón verde del melocotonero es una especie buena indicadora para una amplia variedad de plagas que se alimentan de savia. Los resultados con estas cuatro especies indicadoras junto con el Mosquito de la Fiebre Amarilla demostraron la utilidad de las moléculas de la Fórmula Uno para controlar plagas en los filos Arthropoda, Mollusca, y Nematoda (Para información adicional ver Methods for the Design y Optimization de New Active Ingredients, *Modern Methods in Crop Protection Research*, Editado por Jeschke, P., Kramer, W., Schirmer, U., y Matthias W., p. 1-20, 2012).

Ejemplo A: BIOENSAYOS EN GUSANO SOLDADO DE LA REMOLACHA (*Spodoptera exigua*, LAfeG) (“BAW”), GUSANO DEL MAÍZ (*Helicoverpa zea*, HELIZE) (“CEW”), y gusano falso medidor de la col (*Trichoplusia ni*, TRIPNI) (“CL”)

El gusano soldado de la remolacha es una plaga importante de interés económico para la alfalfa, espárragos, remolacha, cítricos, maíz, algodón, cebollas, guisantes, pimientos, papas, soya, remolacha azucarera, girasoles, tabaco, tomates, entre otros cultivos. Es nativo de Asia suroriental pero ahora se encuentra en África, Australia, Japón, Norteamérica y Europa meridional. Las larvas pueden alimentarse en grandes enjambres causando devastadoras pérdidas de cultivos. Se sabe que es resistente a varios plaguicidas.

El gusano falso medidor de la col es una plaga importante que se encuentra en todo el mundo. Ataca la alfalfa, frijoles, remolacha, brócoli, coles de Bruselas, repollo, melón, coliflor, apio, berzas, algodón, pepinos, berenjena, col rizada, lechuga, melones, mostaza, perejil, guisantes, pimientos, papas, soya, espinaca, calabaza, tomates, nabos y sandías, entre otros cultivos. Esta especie es muy destructiva para las plantas debido a su apetito voraz. Las larvas consumen tres veces su peso en alimentos al día. Los sitios de alimentación están marcados por grandes

acumulaciones de material pegajoso, húmedo y fecal. Se sabe que es resistente a varios plaguicidas.

El gusano del maíz es considerado por algunos como la plaga de cultivos más costosa en América del Norte. Este frecuentemente ataca cultivos valiosos y la parte del cultivo cosechada.

5 Esta plaga daña la alfalfa, alcachofa, espárragos, repollo, cantalupo, col rizada, maíz, algodón, caupí, pepino, berenjena, lechuga, frijol de lima, melón, okra, guisante, pimienta, patata, calabaza, ejotes, soya, espinacas, calabacín, caña de azúcar, camote, tomate, y sandía, entre otros cultivos. Además, esta plaga también se conoce por ser resistente a determinados insecticidas.

10 En consecuencia, debido a los factores anteriores, el control de estas plagas es importante. Además, las moléculas que controlan estas plagas (BAW, CEW y CL), que se conocen como plagas masticadoras, son útiles en el control de otras plagas que mastican plantas.

Determinadas moléculas descritas en este documento se analizaron contra BAW, CEW y CL con el uso de los procedimientos descritos en los siguientes ejemplos. En el informe de los
15 resultados, se usó la “Tabla de Calificación de BAW, CEW, & CL” (Ver la Sección de Tablas).

BIOENSAYOS EN BAW

Los bioensayos en el BAW se llevaron a cabo con el uso de un ensayo en bandeja de dieta de 128 pocillos. Se colocaron de una a cinco larvas de BAW en la segunda fase en cada pocillo (3
20 ml) de la bandeja de dieta que se había llenado previamente con 1 ml de dieta artificial a la que se había aplicado 50 µg/cm² de la molécula de prueba (disuelta en 50 µl de mezcla de acetona–agua 90:10) (a cada uno de los ocho pocillos) y después se dejó secar. Las bandejas se cubrieron con una cubierta autoadhesiva transparente, y se mantuvieron a 25 °C, 14:10 de luz–oscuridad durante cinco a siete días. El porcentaje de mortalidad se registró para las larvas en cada pocillo;
25 después se promedió la actividad en los ocho pocillos. Los resultados se indican en la tabla titulada “Tabla ABC: Resultados biológicos” (Ver la sección de tablas).

BIOENSAYOS EN EL CL

Los bioensayos en el CL se llevaron a cabo con el uso de un ensayo en bandeja de dieta de 128 pocillos. Se colocaron de una a cinco larvas de CL en la segunda fase en cada pocillo (3 ml) de la bandeja de dieta que se había llenado previamente con 1 ml de dieta artificial a la que se había aplicado 50 µg/cm² de la molécula de prueba (disuelta en 50 µl de mezcla de acetona-agua 90:10) (a cada uno de los ocho pocillos) y después se dejó secar. Las bandejas se cubrieron con una cubierta autoadhesiva transparente, y se mantuvieron a 25 °C, 14:10 de luz-oscuridad durante cinco a siete días. El porcentaje de mortalidad se registró para las larvas en cada pocillo; después se promedió la actividad en los ocho pocillos. Los resultados se indican en la tabla titulada “Tabla ABC: Resultados biológicos” (Ver la sección de tablas).

Ejemplo B: BIOENSAYOS EN EL PULGÓN VERDE DEL MELOCOTONERO (*Myzus persicae*, MYZUPE) (“GPA”).

El GPA es la plaga de áfido más significativa de los melocotoneros, que provoca un crecimiento disminuido, el encogimiento de las hojas y la muerte de diversos tejidos. Además es peligroso porque actúa como un vector para el transporte de virus de plantas, como el virus Y de la papa y el virus de la hoja de la papa a miembros de la familia de la hierba mora/papa *Solanaceae* y varios virus del mosaico a muchos otros cultivos alimenticios. El GPA ataca tales plantas como el brócoli, bardana, repollo, zanahoria, coliflor, rábano, berenjena, judías verdes, lechuga, macadamia, papaya, pimientos, batatas, tomates, berros y calabacines, entre otros cultivos. El GPA ataca además a muchos cultivos ornamentales tales como clavel, crisantemo, flor blanca floreciente, poinsettia y rosas. El GPA ha desarrollado resistencia a muchos plaguicidas. En consecuencia, en base a los factores anteriores el control de esta plaga es importante. Además, las moléculas que controlan esta plaga (GPA), que se conoce como una plaga que se alimenta de savia, son útiles para controlar otras plagas que se alimentan de la savia de las plantas.

Determinadas moléculas descritas en este documento se analizaron contra el GPA con el uso de los procedimientos descritos en el siguiente ejemplo. En el informe de los resultados, se usó la “Tabla de puntuación de GPA y YFM” (Ver la Sección de Tablas).

Las plántulas de col cultivadas en macetas de 3 pulgadas, con 2-3 hojas verdaderas pequeñas (3–5 cm), se usaron como sustrato de prueba. Las plántulas se infestaron con 20–50 GPA (en etapas de ninfas y adultos sin alas) un día antes de la aplicación de los productos químicos. Cuatro macetas con plántulas individuales se usaron por cada tratamiento. Las moléculas de

prueba (2 mg) se disolvieron en 2 mL de disolvente de acetona/metanol (1:1), para formar las soluciones madre de la molécula de prueba de 1000 ppm. Las soluciones madre se diluyeron 5X con Tween 20 0.025% en agua para obtener la solución a 200 ppm de la molécula de prueba. Se utilizó un rociador de tipo aspirador manual para rociar una solución a ambos lados de las hojas de col hasta el escurrimiento. Las plantas de referencia (verificación del disolvente) se rociaron con el diluyente que contenía solamente 20% en volumen del disolvente acetona/metanol (1:1). Las plantas tratadas se mantuvieron en una sala de espera durante tres días a aproximadamente 25 °C y humedad relativa ambiental (HR) antes de la calificación. La evaluación se realizó mediante el conteo de áfidos vivos por planta bajo un microscopio. El porcentaje del control se midió con el uso de la fórmula de corrección de Abbott (W. S. Abbott, "A Method of Computing the Effectiveness of an Insecticide" J. Econ. Entomol. 18 (1925), pp.265–267) de la siguiente manera.

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

donde

X = núm. de áfidos vivos en plantas de control de solventes y

Y = núm. de áfidos vivos en plantas tratadas

Los resultados se indican en la tabla titulada "Tabla ABC: Resultados biológicos" (Ver la sección de tablas).

Ejemplo C: BIOENSAYOS EN EL Mosquito de la Fiebre Amarilla (*Aedes aegypti*, AEDSAE) ("YFM").

El YFM prefiere alimentarse de seres humanos durante el día y se encuentra con mayor frecuencia en las viviendas humanas o cerca de ellas. El YFM es un vector que transmite varias enfermedades. Es un mosquito que puede propagar el dengue y los virus de la fiebre amarilla. La fiebre amarilla es la segunda enfermedad más peligrosa transmitida por mosquitos después de la malaria. La fiebre amarilla es una enfermedad hemorrágica viral aguda y hasta el 50% de las personas gravemente afectadas sin tratamiento morirán de fiebre amarilla. Existe un estimado de 200,000 casos de fiebre amarilla, que provocan 30,000 muertes en todo el mundo cada año. El dengue es una enfermedad viral desagradable; a veces se denomina "fiebre rompehuesos" o "fiebre del corazón" debido al intenso dolor que puede producir. El dengue produce una mortalidad de aproximadamente 20.000 personas al año. En consecuencia, en

base a los factores anteriores el control de esta plaga es importante. Además, las moléculas que controlan esta plaga (YFM), que es conocida como una plaga succionadora, son útiles en el control de otras plagas que provocan sufrimiento humano y animal.

Determinadas moléculas descritas en este documento se probaron contra YFM con el uso de los procedimientos descritos en el párrafo siguiente. En el informe de los resultados, se usó la “Tabla de puntuación de GPA y YFM” (Ver la Sección de Tablas).

Se usan placas madres que contienen 400 µg de una molécula disuelta en 100 µL de sulfóxido de dimetilo (DMSO) (equivalente a una solución de 4000 ppm). Una placa madre de moléculas ensambladas contiene 15 µL por pocillo. A esta placa, se añaden 135 µl de una mezcla de agua/acetona 90:10 a cada pocillo. Se programa un robot (Estación de Trabajo de Laboratorio Automatizada Biomek® NXP) para dispensar aspiraciones de 15 µL desde la placa madre hacia una placa llana de 96 pocillos vacía (placa “hija”). Se crean 6 representantes (placas “hijas”) por cada madre. Después las placas “hijas” creadas se infestan inmediatamente con larvas de YFM.

El día antes del tratamiento de las placas, los huevos de mosquito se colocan en agua Millipore que contiene polvo de hígado para comenzar la eclosión (4 g. en 400 mL). Después de crear las placas “hijas” con el uso del robot, éstas se infestan con 220 µl del polvo de hígado/mezcla larval de mosquitos (aproximadamente larvas de 1 día de edad). Después de infestar las placas con larvas de mosquito, se usa una tapa no evaporativa para cubrir la placa para reducir el secado. Las placas se mantienen a temperatura ambiente durante 3 días antes de la puntuación. Después de 3 días, se observa y se puntúa cada placa en función de la mortalidad. Los resultados se indican en la tabla titulada “Tabla ABC: Resultados biológicos” (Ver la sección de tablas).

SALES DE ADICIÓN DE ÁCIDOS, DERIVADOS DE SALES, SOLVATOS, DERIVADOS DE ÉSTERES, POLIMORFOS, ISÓTOPOS Y RADIONÚCLIDOS ACEPTABLES EN LA AGRICULTURA.

Las moléculas de la Fórmula Uno pueden formularse en sales de adición de ácidos aceptables en la agricultura. A manera de ejemplo no limitante, una función amina puede formar sales con los ácidos clorhídrico, bromhídrico, sulfúrico, fosfórico, acético, benzoico, cítrico, malónico, salicílico, málico, fumárico, oxálico, succínico, tartárico, láctico, glucónico, ascórbico, maleico,

aspártico, bencenosulfónico, metanosulfónico, etanosulfónico, hidroxilmetanosulfónico e hidroxietanosulfónico. Adicionalmente, a manera de ejemplo no limitante, una función ácida puede formar sales que incluyen las derivadas de metales alcalinos o alcalinotérreos y las derivadas de amoníaco y aminas. Los ejemplos de cationes preferidos incluyen sodio, potasio y

5 magnesio.

Las moléculas de la Fórmula Uno pueden formularse en derivados de sales. A manera de ejemplo no limitante, un derivado de sal puede prepararse al poner en contacto una base libre con una cantidad suficiente del ácido deseado para producir una sal. Una base libre puede regenerarse mediante el tratamiento de la sal con una solución base acuosa diluida adecuada

10 como hidróxido sódico, carbonato potásico, amoníaco y bicarbonato sódico acuosos diluidos. Como un ejemplo, en muchos casos, un plaguicida, tal como 2,4-D, se vuelve más soluble en agua cuando se convierte a su sal de dimetilamina.

Las moléculas de la Fórmula Uno pueden formularse en complejos estables con un disolvente, de manera que el complejo permanece intacto después que se elimina el disolvente no

15 acomplexado. Estos complejos se denominan a menudo "solvatos". Sin embargo, es particularmente conveniente formar hidratos estables con el agua como disolvente.

Las moléculas de la Fórmula Uno pueden convertirse a derivados de ésteres. Después estos derivados de ésteres pueden aplicarse de la misma manera en que se aplican las moléculas descritas en este documento.

20 Las moléculas de la Fórmula Uno pueden producirse como varios polimorfos cristalinos. El polimorfismo es importante en el desarrollo de compuestos agroquímicos ya que diferentes polimorfos cristalinos o estructuras de la misma molécula pueden tener propiedades físicas y desempeños biológicos muy diferentes.

Las moléculas de la Fórmula Uno pueden producirse con diferentes isótopos. De particular

25 importancia son las moléculas que tienen ^2H (conocido además como deuterio) o ^3H (conocido además como tritio) en lugar de ^1H . Las moléculas de la Fórmula Uno pueden obtenerse con diferentes radionúclidos. De particular importancia son las moléculas que tienen ^{14}C . Las moléculas de la Fórmula Uno que tienen deuterio, tritio o ^{14}C pueden usarse en estudios

biológicos para permitir el rastreo en procesos químicos y fisiológicos y estudios del tiempo de vida media, así como estudios del MoA.

ESTEREOISÓMEROS

5 Las moléculas de la Fórmula Uno pueden existir como uno o más estereoisómeros. Por lo tanto, pueden producirse determinadas moléculas como mezclas racémicas. Los expertos en la técnica apreciarán que un estereoisómero puede ser más activo que los otros estereoisómeros. Los estereoisómeros individuales pueden obtenerse mediante procedimientos conocidos de síntesis selectiva, mediante procedimientos de síntesis convencionales con el uso de materiales de
10 partida resueltos, o mediante procedimientos de resolución convencionales. Determinadas moléculas descritas en este documento pueden existir como uno o más isómeros. Los diversos isómeros incluyen isómeros geométricos, diastereómeros y enantiómeros. Por lo tanto, las moléculas descritas en este documento incluyen isómeros geométricos, mezclas racémicas, estereoisómeros individuales y mezclas ópticamente activas. Los expertos en la técnica
15 apreciarán que un isómero puede ser más activo que los otros. Las estructuras descritas en la presente descripción se representan en una sola forma geométrica para claridad, pero pretenden representar todas las formas geométricas de la molécula.

COMBINACIONES

20 En otra modalidad de esta invención, las moléculas de la Fórmula Uno pueden usarse en combinación (tal como, en una mezcla de composiciones, o una aplicación simultánea o secuencial) con uno o más ingredientes activos.

En otra modalidad de esta invención, las moléculas de la Fórmula Uno pueden usarse en combinación (tal como, en una mezcla de composiciones, o una aplicación simultánea o
25 secuencial) con uno o más ingredientes activos cada uno de los cuales tiene un MoA que es el mismo, similar a, pero más probablemente diferente del MoA de las moléculas de la Fórmula Uno.

En otra modalidad, las moléculas de la Fórmula Uno pueden usarse en combinación (tal como, en una mezcla de composiciones, o una aplicación simultánea o secuencial) con una o más

moléculas que tienen propiedades acaricida, algicida, avicida, bactericida, fungicida, herbicida, insecticida, molusquicida, nematocida, rodenticida y/o virucida.

En otra modalidad, las moléculas de la Fórmula Uno pueden usarse en combinación (tal como, en una mezcla de composiciones, o una aplicación simultánea o secuencial) con una o más moléculas que son inhibidores de la alimentación, repelentes de aves, quimioesterilizantes, protectores de herbicidas, atrayentes de insectos, repelentes de insectos, repelentes de mamíferos, disruptores del apareamiento, activadores de plantas, reguladores del crecimiento vegetal y/o sinergistas.

En otra modalidad, las moléculas de la Fórmula Uno pueden además usarse en combinación (tales como en una mezcla de composiciones, o una aplicación simultánea o secuencial) con uno o más bioplaguicidas.

En otra modalidad, en una composición plaguicida pueden usarse combinaciones de una molécula de la Fórmula Uno y un ingrediente activo en una amplia variedad de relaciones de peso. Por ejemplo, en una mezcla de dos componentes, la relación en peso de una molécula de Fórmula Uno con respecto a un ingrediente activo, puede ser de aproximadamente 100:1 a aproximadamente 1:100; en otro ejemplo, la relación en peso puede ser de aproximadamente 50:1 a aproximadamente 1:50; en otro ejemplo, la relación en peso puede ser de aproximadamente 20:1 a aproximadamente 1:20; en otro ejemplo, la relación en peso puede ser de aproximadamente 10:1 a aproximadamente 1:10; en otro ejemplo, la relación en peso puede ser de aproximadamente 5:1 a 1:5; en otro ejemplo, la relación en peso puede ser de aproximadamente 3:1 a aproximadamente 1:3; en otro ejemplo, la relación en peso puede ser de aproximadamente 2:1 a aproximadamente 1:2; y en un ejemplo final la relación en peso puede ser de aproximadamente 1:1 (Ver la Tabla B). Sin embargo, en general, se prefieren las relaciones de peso inferiores a aproximadamente 10: 1 a aproximadamente 1:10. Además se prefiere a veces el uso de una mezcla de tres, o cuatro componentes, que comprende una molécula de la Fórmula Uno y uno o más ingredientes activos.

TABLA B

Relaciones de peso
Molécula de la Fórmula Uno : ingrediente activo
100:1 a 1:100
50:1 a 1:50
20:1 a 1:20
10:1 a 1:10
5:1 a 1:5
3:1 a 1:3
2:1 a 1:2
1:1

Las relaciones de peso de una molécula de la Fórmula Uno con respecto a un ingrediente activo también pueden representarse como $X:Y$; en donde X son las partes en peso de una molécula de la Fórmula Uno y Y son las partes en peso del ingrediente activo. El intervalo numérico de las partes en peso para X es $0 < X \leq 100$ y las partes en peso para Y es $0 < Y \leq 100$ y se muestra gráficamente en la Tabla C. A manera de ejemplo no limitante, la relación de peso de una molécula de la Fórmula Uno con respecto a un ingrediente activo puede ser 20:1.

TABLA C

ingrediente activo (Y) Partes por peso	100	X,Y		X,Y			X,Y			
	50	X,Y	X,Y	X,Y			X,Y	X,Y		
	20	X,Y		X,Y	X,Y		X,Y		X,Y	
	15	X,Y	X,Y					X,Y	X,Y	X,Y
	10	X,Y		X,Y						
	5	X,Y	X,Y	X,Y				X,Y		
	3	X,Y	X,Y		X,Y	X,Y		X,Y	X,Y	X,Y
	2	X,Y		X,Y	X,Y		X,Y		X,Y	
	1	X,Y	X,Y	X,Y	X,Y	X,Y	X,Y	X,Y	X,Y	X,Y

		1	2	3	5	10	15	20	50	100
	molécula de Fórmula Uno (X) Partes por peso									

Los intervalos de relaciones de peso de una molécula de la Fórmula uno con respecto a un ingrediente activo puede representarse como $X_1:Y_1$ a $X_2:Y_2$, en donde X y Y se definen como anteriormente.

- 5 En una modalidad, el intervalo de relaciones de peso puede ser $X_1:Y_1$ a $X_2:Y_2$, en donde $X_1 > Y_1$ y $X_2 < Y_2$. A manera de ejemplo no limitante, el intervalo de una relación de peso de una molécula de la Fórmula Uno con respecto a un ingrediente activo puede estar entre 3:1 y 1:3, incluidos los valores extremos.

- 10 En otra modalidad, el intervalo de relaciones de peso puede ser $X_1:Y_1$ a $X_2:Y_2$, en donde $X_1 > Y_1$ y $X_2 > Y_2$. A manera de ejemplo no limitante, el intervalo de la relación de peso de una molécula de la Fórmula Uno con respecto a un ingrediente activo puede estar entre 15:1 y 3:1, incluidos los valores extremos.

- 15 En otra modalidad, el intervalo de relaciones de peso puede ser $X_1:Y_1$ a $X_2:Y_2$, en donde $X_1 < Y_1$ y $X_2 < Y_2$. A manera de ejemplo no limitante, el intervalo de relaciones en peso de una molécula de la Fórmula Uno con respecto a un ingrediente activo puede estar entre aproximadamente 1:3 y aproximadamente 1:20, incluidos los valores extremos.

FORMULACIONES

- 20 Un plaguicida es raramente adecuado para la aplicación en su forma pura. Generalmente es necesario añadir otras sustancias de manera que el plaguicida pueda usarse a la concentración requerida y en una forma adecuada, lo que permite una fácil aplicación, manipulación, transporte, almacenamiento y actividad plaguicida máxima. Por lo tanto, los plaguicidas se formulan, por ejemplo, como cebos, emulsiones concentradas, polvos, concentrados

emulsionables, fumigantes, geles, gránulos, microencapsulaciones, tratamientos para semillas, concentrados en suspensión, suspoemulsiones, tabletas, líquidos solubles en agua, gránulos dispersables en agua o fluidos secos, polvos humectables y soluciones con volumen ultra-bajo.

Los plaguicidas se aplican comúnmente como suspensiones o emulsiones acuosas preparadas a

5 partir de formulaciones concentradas de dichos plaguicidas. Tales formulaciones hidrosolubles, emulsionables o que pueden suspenderse en agua, son ya sea sólidas, generalmente conocidas como polvos humectables, o gránulos dispersables en agua, líquidas generalmente conocidas como concentrados emulsionables, o suspensiones acuosas. Los polvos humectables, que se pueden compactar para formar gránulos dispersables en agua, comprenden una mezcla
10 estrecha del plaguicida, un portador y tensoactivos. La concentración del plaguicida es normalmente de aproximadamente 10% a aproximadamente 90% en peso. El portador generalmente se selecciona de entre las arcillas de atapulgita, las arcillas de montmorillonita, las tierras de diatomeas, o los silicatos purificados. Los tensoactivos eficaces, que comprenden de aproximadamente 0.5% a aproximadamente 10% del polvo humectable se encuentran entre
15 ligninas sulfonadas, naftalenosulfonatos condensados, naftalenosulfonatos, alquilbencenosulfonatos, alquilsulfatos y tensoactivos no iónicos tales como los aductos de óxido de etileno de los alquilfenoles.

Los concentrados emulsionables de plaguicidas comprenden una concentración conveniente de un plaguicida, tal como de aproximadamente 50 a aproximadamente 500 gramos por litro de
20 líquido disuelto en un vehículo que es un disolvente miscible en agua o una mezcla de disolvente orgánico inmiscible en agua y emulsionantes. Los disolventes orgánicos útiles incluyen compuestos aromáticos, especialmente xilenos y fracciones de petróleo, especialmente las porciones del petróleo naftalénicas y olefínicas de alto punto de ebullición tales como nafta aromática pesada. También pueden usarse otros disolventes orgánicos, tales
25 como los disolventes terpénicos que incluyen derivados de colofonia, cetonas alifáticas tales como ciclohexanona y alcoholes complejos tales como 2-etoxietanol. Los emulsionantes adecuados para los concentrados emulsionables se seleccionan de tensoactivos aniónicos y no iónicos convencionales.

Las suspensiones acuosas comprenden suspensiones de plaguicidas insolubles en agua dispersos en un vehículo acuoso a una concentración en el intervalo de aproximadamente 5% a aproximadamente 50% en peso. Se preparan suspensiones mediante la tritución fina del plaguicida y su mezcla vigorosa hasta obtener un portador compuesto por agua y tensoactivos.

5 También se pueden añadir ingredientes tales como sales inorgánicas y gomas sintéticas o naturales, para aumentar la densidad y la viscosidad del vehículo acuoso. A menudo es más eficaz tritutar y mezclar el pesticida al mismo tiempo mediante la preparación de la mezcla acuosa y homogeneizarla en un instrumento tal como un molino de arena, un molino de bolas o un homogeneizador de tipo pistón.

10 También pueden aplicarse plaguicidas como composiciones granulares que son particularmente útiles para las aplicaciones a la tierra. Las composiciones granulares normalmente contienen de aproximadamente 0,5 % a aproximadamente 10 % en peso del plaguicida, dispersado en un portador que comprende arcilla o una sustancia similar. Tales composiciones se preparan usualmente mediante la disolución del plaguicida en un disolvente adecuado y su aplicación a
15 un vehículo granular, que se ha preformado con el tamaño de partícula apropiado, en el intervalo de aproximadamente 0.5 a aproximadamente 3 mm. Dichas composiciones también pueden formularse mediante la obtención de una masa o pasta del vehículo y la molécula, y tritutarla y secarla para obtener el tamaño de partícula granular deseado.

Los polvos que contienen un plaguicida se preparan por mezclado estrecho del plaguicida en
20 forma de polvo con un portador agrícola en polvo adecuado, como arcilla caolín, tierra de roca volcánica y similares. Los polvos pueden contener adecuadamente de aproximadamente 1 % a aproximadamente 10 % del plaguicida. Los polvos pueden aplicarse como recubrimiento de semillas o como una aplicación al follaje con una máquina de soplado de polvo.

Es igualmente práctico aplicar un plaguicida en forma de una solución en un disolvente orgánico
25 apropiado, normalmente aceite de petróleo, como los aceites en aerosol, que se usan ampliamente en la química agrícola.

Los plaguicidas también pueden aplicarse en forma de una composición de aerosol. En tales composiciones, el plaguicida se disuelve o dispersa en un vehículo, que es una mezcla

propulsora que genera presión. La composición de aerosol se empaqueta en un recipiente desde el cual la mezcla se dispensa a través de una válvula de pulverización.

Los cebos de plaguicidas se forman cuando el plaguicida se mezcla con alimento o un atrayente o ambos. Cuando las plagas ingieren el cebo, también consumen el pesticida. Los cebos pueden
5 tomar la forma de gránulos, geles, polvos fluidos, líquidos o sólidos. Los cebos pueden usarse en refugios de plagas.

Los fumigantes son plaguicidas que tienen una presión de vapor relativamente alta y por tanto pueden existir como un gas en concentraciones suficientes para eliminar plagas en el suelo o espacios cerrados. La toxicidad del fumigante es proporcional a su concentración y al tiempo de
10 exposición. Están caracterizados por una buena capacidad de difusión y actúan penetrando el sistema respiratorio de la plaga o siendo absorbidos a través de la cutícula de la plaga. Los fumigantes se aplican para controlar plagas de productos almacenados bajo láminas a prueba de gas, en habitaciones o edificios sellados para gas o en cámaras especiales.

Los plaguicidas pueden microencapsularse mediante la suspensión de las partículas o gotitas de
15 pesticida en polímeros plásticos de varios tipos. Con la alteración de la química del polímero o el cambio de factores en el procesamiento, pueden formarse microcápsulas de varios tamaños, solubilidad, espesores de pared y grados de penetrabilidad. Estos factores rigen la velocidad con la cual se libera el ingrediente activo adentro, que a su vez afecta el rendimiento residual, la velocidad de acción y el olor del producto.

Los concentrados de solución oleosa se realizan disolviendo plaguicida en un disolvente que
20 mantendrá el plaguicida en la solución. Las soluciones oleosas de un plaguicida normalmente proporcionan mayor reducción y eliminación de plagas que otras formulaciones debido a que los mismos disolventes tienen acción plaguicida y que la disolución de la cobertura de cera del tegumento aumenta la velocidad de absorción del plaguicida. Otras ventajas de las soluciones
25 oleosas incluyen mejor estabilidad de almacenamiento, mejor penetración de grietas y mejor adhesión a superficies grasas.

Otra modalidad es una emulsión de aceite en agua, en donde la emulsión comprende glóbulos oleosos cada uno de los cuales está provisto de un recubrimiento cristalino líquido laminar y se dispersan en una fase acuosa, en donde cada glóbulo oleoso comprende al menos una molécula

que es activa desde un punto de vista agrícola y se recubre individualmente con una capa monolaminar u oligolaminar que comprende: (1) al menos un agente tensoactivo lipófilo no iónico, (2) al menos un agente tensoactivo hidrófilo no iónico, y (3) al menos un agente tensoactivo iónico, en donde los glóbulos tienen un diámetro medio de partícula inferior a 800 nanómetros.

OTROS COMPONENTES DE LA FORMULACIÓN

Generalmente, cuando las moléculas descritas en la Fórmula Uno se usan en una formulación, dicha formulación también puede contener otros componentes. Estos componentes incluyen, pero sin limitarse a, (esto es una lista no exhaustiva y no exclusiva mutuamente) humectantes, esparcidores, adhesivos, penetrantes, tampones, agentes secuestrantes, agentes de reducción de la deriva, agentes de compatibilidad, agentes antiespuma, agentes de limpieza y emulsionantes. A continuación algunos componentes.

Un agente humectante es una sustancia que, cuando se agrega a un líquido, aumenta el poder de penetración o dispersión del líquido reduciendo la tensión interfacial entre el líquido y la superficie sobre la cual se dispersa. Los agentes humectantes se utilizan para dos funciones principales en las formulaciones agroquímicas: durante el procesamiento y la fabricación para aumentar la velocidad de humectación de los polvos en agua para obtener concentrados para líquidos solubles o concentrados en suspensión; y durante la mezcla de un producto con agua en un tanque de rociado para reducir el tiempo de humectación de los polvos humectables y para mejorar la penetración del agua en los gránulos dispersables en agua. Ejemplos de agentes humectantes usados en formulaciones de polvos humectables, concentrados en suspensión y gránulos dispersables en agua son: laurilsulfato sódico; dioctilo sulfosuccinato sódico; etoxilatos de alquilfenoles; y etoxilatos de alcoholes alifáticos.

Un agente dispersante es una sustancia que se adsorbe sobre la superficie de las partículas y ayuda a preservar el estado de dispersión de las partículas e impide su reagregación. Los agentes de dispersión se agregan a formulaciones agroquímicas para facilitar la dispersión y suspensión durante la fabricación, y para asegurar que las partículas se vuelvan a dispersar en el agua en un tanque de rocío. Se usan ampliamente en polvos humectables, concentrados en

suspensión y gránulos dispersables en agua. Los tensoactivos que se usan como agentes de dispersión tienen la capacidad de adsorberse fuertemente en una superficie de partícula y proporcionar una barrera estérica o cargada para la nueva agregación de las partículas. Los tensoactivos más comúnmente usados son aniónicos, no iónicos o mezclas de los dos tipos. Para las formulaciones de polvo humectable, los agentes de dispersión más comunes son los lignosulfonatos de sodio. Para los concentrados en suspensión se obtiene una adsorción y estabilidad muy buenas con el uso de polielectrolitos, tales como sodio-naftaleno-sulfonato-formaldehído-condensados. También se usan ésteres de fosfato de etoxilato de tristirilfenol. Los no iónicos tales como los condensados de óxido de alquilariletileno y copolímeros de bloque de EO-PO se combinan a veces con agentes aniónicos como dispersantes para los concentrados en suspensión. En los últimos años, se han desarrollado como agentes de dispersión nuevos tipos de tensoactivos poliméricos de muy alto peso molecular. Estos tienen "estructuras principales" hidrofóbicas muy largas y una gran cantidad de cadenas de óxido de etileno que forman los "dientes" de un tensoactivo "peine". Estos polímeros de alto peso molecular pueden proporcionar una estabilidad a largo plazo muy buena a los concentrados en suspensión porque las cadenas principales hidrófobas tienen muchos puntos de anclaje sobre las superficies de las partículas. Ejemplos de agentes dispersantes utilizados en las formulaciones agroquímicas son: lignosulfonatos sódicos; condensados de naftaleno sulfonato de sodio y formaldehído; ésteres de triestiril-fenol-etoxilato-fosfato; etoxilatos de alcoholes alifáticos; etoxilatos de alquilo; copolímeros de bloque EO-PO; y copolímeros de injerto.

Un agente emulsionante es una sustancia que estabiliza una suspensión de gotitas de una fase líquida en otra fase líquida. Sin el agente emulsionante, los dos líquidos se separarían en dos fases líquidas inmiscibles. Las mezclas emulsionantes más comunes contienen alquilfenol o alcohol alifático con doce o más unidades de óxido de etileno y la sal de calcio soluble en aceite del ácido dodecylbencenosulfónico. Un intervalo de valores del equilibrio hidrófilo-lipófilo ("HLB") de aproximadamente 8 a 18 proporcionará normalmente emulsiones con buena estabilidad. La estabilidad de la emulsión puede mejorarse a veces mediante la adición de una pequeña cantidad de un tensoactivo de copolímero de bloques EO-PO.

Un agente solubilizante es un tensoactivo que formará micelas en agua a concentraciones por encima de la concentración micelar crítica. Entonces las micelas son capaces de disolver o solubilizar los materiales insolubles en agua dentro de la parte hidrófoba de la micela. Los tipos de tensoactivos usados usualmente para la solubilización son no iónicos, monooleatos de sorbitán, etoxilatos de monooleato de sorbitán y ésteres de oleato de metilo.

A veces se usan tensoactivos, ya sea solos o con otros aditivos tales como aceites minerales o vegetales como adyuvantes para mezclas de tanques de rociado para mejorar el rendimiento biológico del pesticida sobre el blanco. Los tipos de tensoactivos usados para la mejora biológica dependen generalmente de la naturaleza y el modo de acción del plaguicida. Sin embargo, con frecuencia son no iónicos tales como: etoxilatos de alquilo; etoxilatos de alcoholes alifáticos lineales; etoxilatos de aminas alifáticas.

Un portador o diluyente en una formulación agrícola es un material agregado al plaguicida para dar un producto de la fuerza necesaria. Los portadores suelen ser materiales con alta capacidad de absorción, mientras que los diluyentes suelen ser materiales con baja capacidad de absorción. Los vehículos y diluyentes se usan en la formulación de polvos, polvos humectables, gránulos y gránulos dispersables en agua.

Los disolventes orgánicos se utilizan principalmente en la formulación de concentrados emulsionables, emulsiones de aceite en agua, suspoemulsiones, y formulaciones de volumen ultra bajo, y en menor grado, formulaciones granulares. Algunas veces se usan mezclas de disolventes. El primer grupo principal de disolventes es el de aceites parafínicos alifáticos como keroseno o parafinas refinadas. El segundo grupo principal (y el más común) comprende los disolventes aromáticos como xileno y fracciones de peso molecular más alto de disolventes aromáticos de C9 y C10. Los hidrocarburos clorados son útiles como cosolventes para evitar la cristalización de plaguicidas cuando la formulación se emulsiona en agua. Los alcoholes algunas veces se usan como cosolventes para aumentar el poder del disolvente. Otros disolventes pueden incluir aceites vegetales, aceites de semillas y ésteres de aceites vegetales y de semillas. Los espesantes o agentes gelificantes se usan principalmente en la formulación de concentrados en suspensión, emulsiones y suspoemulsiones para 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, gelificantes y anti-sedimentación generalmente se dividen en dos categorías, específicamente, los particulados insolubles en agua y los polímeros hidrosolubles. Es posible producir formulaciones de concentrados en suspensión con el uso de arcillas y sílices. Los ejemplos de estos tipos de materiales incluyen, sin limitarse a, montmorillonita, bentonita, silicato de aluminio y magnesio y atapulgita. Los polisacáridos solubles en agua se han utilizado como agentes espesantes-gelificantes durante muchos años. Los tipos de polisacáridos más comúnmente usados son extractos naturales de semillas y algas o son derivados sintéticos de celulosa. Los ejemplos de estos tipos de materiales incluyen, pero sin limitarse a, goma de guar; goma de algarrobo; carragenano; alginatos; metilo celulosa; carboximetilo celulosa sódica (SCMC); e hidroxietilo celulosa (HEC). Otros tipos de agentes anti-sedimentación se basan en almidones modificados, poliacrilatos, alcohol polivinílico y óxido de polietileno. Otro buen agente anti-sedimentación es la goma de xantano.

Los microorganismos pueden causar el deterioro de los productos formulados. Por lo tanto, se usan agentes de conservación para eliminar o reducir su efecto. Los ejemplos de tales agentes incluyen, pero sin limitarse a: ácido propiónico y su sal sódica; ácido sórbico y sus sales de sodio o potasio; ácido benzoico y su sal sódica; sal sódica del ácido *p*-hidroxibenzoico; *p*-hidroxibenzoato de metilo; y 1,2-bencisotiazolin-3-ona (BIT).

La presencia de tensoactivos provoca frecuentemente que las formulaciones acuosas produzcan espuma durante las operaciones de mezclado en la producción y en la aplicación mediante un tanque de rociado. Para reducir la tendencia a la espuma, frecuentemente se añaden agentes antiespumantes durante la etapa de producción o antes de llenar las botellas. Generalmente, hay dos tipos de agentes antiespumantes, específicamente siliconas y no siliconas. Las siliconas son normalmente emulsiones acuosas de dimetilo polisiloxano, mientras que los agentes antiespumantes no silicónicos son aceites insolubles en agua, tales como octanol y nonanol, o sílice. En ambos casos, la función del agente antiespumante es desplazar el tensoactivo de la interfase aire-agua.

Los agentes “verdes” (*por ejemplo.*, adyuvantes, tensoactivos, disolventes) pueden reducir la huella ambiental global de las formulaciones para la protección de los cultivos. Los agentes verdes son biodegradables y generalmente se originan de fuentes naturales y/o sostenibles, *por*

ejemplo plantas y animales. Ejemplos específicos son: aceites vegetales, aceites de semillas y ésteres de estos, también poliglucósidos de alquilo alcoxilados.

APLICACIONES

- 5 Las moléculas de la Fórmula Uno pueden aplicarse a cualquier locus. Los locus de cultivos particulares para aplicar tales moléculas incluyen el locus donde crecen alfalfa, almendras, manzanas, cebada, frijoles, canola, maíz, algodón, crucíferas, lechuga, avenas, naranjas, peras, pimientos, papas, arroz, sorgo, soya, fresas, caña de azúcar, remolacha azucarera, girasoles, tabaco, tomate, trigo y otros cultivos valiosos o sus semillas van a plantarse.
- 10 Las moléculas de la Fórmula Uno pueden aplicarse, además, donde se cultivan plantas, tales como cultivos, y donde existen niveles bajos (o incluso donde hay ausencia real) de plagas que puedan dañar comercialmente tales plantas. La aplicación de tales moléculas en tales locus es beneficiosa para las plantas que se cultivan en tales locus. Estos beneficios pueden incluir, pero sin limitarse a: ayudar a que la planta desarrolle un mejor sistema de raíces; ayudar a que la
- 15 planta soporte mejor las condiciones de cultivo estresantes; mejorar la salud de una planta; mejorar el rendimiento de una planta (*por ejemplo* aumento de la biomasa y/o aumento del contenido de ingredientes valiosos); mejorar el vigor de una planta (*por ejemplo* mejora del crecimiento de la planta y/u hojas más verdes); mejorar la calidad de una planta (*por ejemplo* mejora del contenido o la composición de determinados ingredientes); y mejorar la tolerancia al
- 20 estrés abiótico y/o biótico de la planta.
- Las moléculas de la Fórmula Uno pueden aplicarse con sulfato de amonio cuando se cultivan diversas plantas ya que este puede proporcionar beneficios adicionales.
- Las moléculas de la Fórmula Uno pueden aplicarse sobre, en, o alrededor de las plantas modificadas genéticamente para expresar rasgos especializados, tales como *Bacillus*
- 25 *thuringiensis* u otras toxinas insecticidas o aquellos que expresan resistencia a herbicidas, o aquellos con genes extraños “apilados” que expresan toxinas insecticidas, resistencia a herbicidas, mejora de la nutrición, o cualquier otro rasgo beneficioso.

Las moléculas de la Fórmula Uno pueden aplicarse a las partes foliares y/o de los frutos de las plantas para controlar las plagas. Tales moléculas entrarán en contacto directo con la plaga, o la plaga consumirá tales moléculas cuando ingiere la planta o mientras extrae la savia de la planta. Las moléculas de la Fórmula Uno pueden aplicarse, además, al suelo y cuando se aplican de esta manera, pueden controlarse las plagas que se alimentan de los tallos y las raíces. Las raíces pueden absorber tales moléculas, llevándolas así a las partes foliares de la planta para controlar las plagas masticadoras y que se alimentan de la savia, encima del suelo.

El movimiento sistémico de los plaguicidas en las plantas puede utilizarse para controlar las plagas en una porción de la planta mediante la aplicación (por ejemplo el rociado en un locus) de una molécula de la Fórmula Uno a una porción diferente de la planta. Por ejemplo, el control de los insectos que se alimentan de las hojas puede lograrse mediante riego por goteo o aplicación en los surcos, mediante el tratamiento del suelo con, por ejemplo, la impregnación del suelo antes o después de la siembra, o mediante el tratamiento de las semillas de una planta antes de sembrar.

Las moléculas de la Fórmula Uno pueden usarse con cebos. Generalmente, con cebos, los cebos se colocan en el suelo donde, por ejemplo, las termitas pueden entrar en contacto con el cebo, y/o sentirse atraídas hacia él. Los cebos pueden aplicarse, además, a una superficie de un edificio (superficie horizontal, vertical o inclinada) donde, por ejemplo, las hormigas, las termitas, las cucarachas y las moscas pueden entrar en contacto con el cebo y/o sentirse atraídos hacia él.

Las moléculas de la Fórmula Uno pueden encapsularse dentro de una cápsula, o colocarse en la superficie de ésta. El tamaño de las cápsulas puede variar desde un tamaño nanométrico (aproximadamente 100-900 nanómetros de diámetro) hasta un tamaño micrométrico (aproximadamente 10-900 micrómetros de diámetro).

Las moléculas de la Fórmula Uno pueden aplicarse a los huevos de las plagas. Debido a la capacidad única de los huevos de algunas plagas para resistir determinados pesticidas, pueden ser convenientes aplicaciones repetidas de tales moléculas para controlar las larvas recién emergidas.

Las moléculas de la Fórmula Uno pueden aplicarse como tratamientos para semillas. El tratamiento de las semillas puede aplicarse a todos los tipos de semillas, incluidas aquellas de las que germinarán plantas modificadas genéticamente para expresar rasgos especializados. Los ejemplos representativos incluyen las que expresan proteínas tóxicas para plagas de invertebrados, tales como *Bacillus thuringiensis* u otras toxinas insecticidas, las que expresan resistencia a herbicidas, tales como las semillas “Roundup Ready”, o aquellas con genes foráneos “apilados” que expresan toxinas insecticidas, tolerancia a herbicidas, mejora de la nutrición, resistencia a la sequía, o cualquier otro rasgo beneficioso. Además, tales tratamientos para semillas con moléculas de la Fórmula Uno pueden aumentar adicionalmente la capacidad de una planta para soportar mejor condiciones de cultivo estresantes. Esto da como resultado una planta más sana y vigorosa, lo que puede llevar a mayores rendimientos en época de cosecha. Generalmente, se espera que aproximadamente 1 gramo de tales moléculas a aproximadamente 500 gramos por 100,000 semillas proporcione buenos beneficios, se espera que cantidades de aproximadamente 10 gramos a aproximadamente 100 gramos por 100,000 semillas proporcionen mejores beneficios y se espera que cantidades de aproximadamente 25 gramos a aproximadamente 75 gramos por 100,000 semillas proporcionen beneficios aún mejores.

Las moléculas de la Fórmula Uno pueden aplicarse con uno o más ingredientes activos en una enmienda del suelo.

Las moléculas de la Fórmula Uno pueden usarse para controlar endoparásitos y ectoparásitos en el sector de la medicina veterinaria o en el campo de la conservación de animales no humanos. Tales moléculas pueden aplicarse mediante administración oral en forma de, por ejemplo, tabletas, cápsulas, bebidas, gránulos, mediante aplicación dérmica en forma de, por ejemplo, inmersión, atomización, vertido, localización y espolvoreo, y mediante administración parenteral, por ejemplo, en forma de una inyección.

Las moléculas de la Fórmula Uno también pueden emplearse ventajosamente en la cría de ganado, por ejemplo, ganado vacuno, pollos, gansos, cabras, cerdos, ovejas y pavos. También pueden emplearse ventajosamente en animales domésticos como caballos, perros y gatos. Plagas particulares para su control serían pulgas y garrapatas que son molestos para estos

animales. Las formulaciones adecuadas se administran por vía oral a los animales con el agua para beber o el alimento. Las dosis y formulaciones adecuadas dependen de la especie.

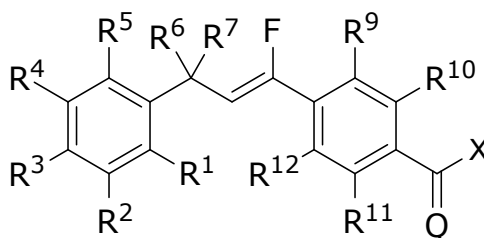
Las moléculas de la Fórmula Uno también pueden usarse para controlar gusanos parásitos, especialmente del intestino, en los animales mencionados anteriormente.

- 5 Las moléculas de la Fórmula Uno pueden emplearse, además, en métodos terapéuticos para la atención de la salud humana. Tales métodos incluyen, pero están limitados a, administración oral, por ejemplo, en forma de tabletas, cápsulas, bebidas, gránulos y mediante aplicación dérmica.

- 10 Las moléculas de la Fórmula Uno pueden aplicarse, además, a plagas invasoras. Las plagas en todo el mundo han estado migrando a nuevos ambientes (para dicha plaga) y después se convierten en una nueva especie invasora en ese ambiente nuevo. Tales moléculas también pueden usarse en tales nuevas especies invasoras para controlarlas en tales ambientes nuevos.

- 15 En consecuencia, a la luz de lo anterior y las Tablas en la Sección de Tablas, se proporcionan los siguientes elementos.

1.Una molécula que tiene la siguiente fórmula



Fórmula Uno

en donde:

- 20 (A) R¹, R⁵, R⁶, R¹¹, y R¹² se seleccionan cada uno independientemente del grupo que consiste en H, F, Cl, Br, I, CN, (C₁-C₄)alquilo, (C₁-C₄)haloalquilo, (C₁-C₄)alcoxi, y (C₁-C₄)haloalcoxi;
preferentemente, R¹, R⁵, R⁶, R¹¹, y R¹² son H;
- (B) R², R³, y R⁴ se seleccionan cada uno independientemente del grupo que consiste en H, F, Cl, Br, I, CN, (C₁-C₄)alquilo, (C₂-C₄)alquenilo, (C₂-C₄)alquinilo, (C₁-C₄)haloalquilo, (C₁-C₄)alcoxi, y (C₁-
25 C₄)haloalcoxi

preferentemente, R^2 , R^3 , y R^4 son H, F, Cl, Br, o CH_{32} ;

(C) R^7 es (C_1-C_6) haloalquilo

preferentemente R^7 es CF_3 ;

(D) R^9 se selecciona del grupo que consiste en (F), H, F, Cl, Br, I, CN, (C_1-C_4) alquilo, (C_1-C_4) haloalquilo, (C_1-C_4) alcoxi, y (C_1-C_4) haloalcoxi

preferentemente R^9 es H;

(E) R^{10} se selecciona del grupo que consiste en (F), F, Cl, Br, I, CN, (C_1-C_4) alquilo, (C_2-C_4) alquenilo, (C_2-C_4) alquinilo, (C_1-C_4) haloalquilo, (C_1-C_4) alcoxi, y (C_1-C_4) haloalcoxi

preferentemente R^{10} es Br, CH_3 , o CF_3 ;

(F) R^9 y R^{10} pueden, opcionalmente, formar juntos un enlace hidrocarbilo de 3 a 5 miembros saturados o no saturados,

en donde dicho enlace hidrocarbilo puede sustituirse opcionalmente con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, y CN;

(G)X es

(1) $NR^{13}R^{14}$ en donde R^{13} y R^{14} se seleccionan cada uno independientemente del grupo que consiste en H, CHO, (C_1-C_4) alquilo, (C_2-C_4) alquenilo, (C_1-C_4) haloalquilo, (C_1-C_4) alcoxi, (C_1-C_4) haloalcoxi, (C_3-C_8) cicloalquilo, (C_1-C_4) alquil fenilo, (C_1-C_4) alquil piridilo, piridilo, $CH=NO(C_1-C_4)$ alquilo, (C_1-C_4) alquil $CH=NO(C_1-C_4)$ haloalquilo, (C_1-C_4) alquil $NH(C_1-C_4)$ haloalquilo, (C_1-C_4) alquil $N((C_1-C_4)$ alquil) (C_1-C_4) haloalquilo, tietanilo, tietanil-óxido, y tietanil-dióxido,

en donde cada alquilo, alquenilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, cicloalquilo, fenilo, piridilo, tietanilo, tietanil-óxido, y tietanil-dióxido puede sustituirse opcionalmente con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, CN, OH, (C_1-C_4) alquilo, y (C_1-C_4) alcoxi,

(2) $N=CHN((C_1-C_4)$ alquil) $_2$, o

(3)Z donde Z es un heterociclilo que comprende 3- a 7-átomos, en donde al menos uno de dichos átomos es un nitrógeno, y en donde dicho nitrógeno tiene un enlace a $C(=Q)$, en donde dicho heterociclilo puede sustituirse opcionalmente con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, y CN

preferentemente X es

NR¹³R¹⁴ en donde R¹³ y R¹⁴ son H, CHO, CH₃, CH₂CF₃, CH(CH₃)CF₃, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclohexilo, CH(CH₃)fenilo, CH₂piridilo, piridilo, y CH=NOCH₃, en donde dicho ciclohexilo y fenilo puede sustituirse opcionalmente con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en F, Cl, CH₃, y OCH₃, o

5 N=CHN(CH₃)₂, o

pirrolidina;

(H)Q se selecciona del grupo que consiste en O y S;

2.Una molécula de acuerdo con 1 en donde

(A)R¹, R⁵, R⁶, R¹¹, y R¹² son H;

10 (B)R², R³, y R⁴ se seleccionan cada uno independientemente del grupo que consiste en H, F, Cl, Br, y (C₁-C₄)alquilo;

(C)R⁷ es (C₁-C₆)haloalquilo;

(D)R⁹ es H;

(E)R¹⁰ se selecciona del grupo que consiste en Br, (C₁-C₄)alquilo, y (C₁-C₄)haloalquilo;

15 (G)X es

(1)NR¹³R¹⁴ en donde R¹³ y R¹⁴ se seleccionan cada uno independientemente del grupo que consiste en H, CHO, (C₁-C₄)alquilo, (C₁-C₄)haloalquilo, (C₃-C₈)cicloalquilo, (C₁-C₄)alquil fenilo, (C₁-C₄)alquil piridilo, piridilo, y CH=NO(C₁-C₄)alquilo,

20 en donde cada alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, fenilo, y piridil puede sustituirse opcionalmente con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en F, Cl, (C₁-C₄)alquilo, y (C₁-C₄)alcoxi,

(2)N=CHN((C₁-C₄)alquil)₂, o

(3)Z donde Z es un heterociclilo que comprende 3- a 7-átomos, en donde al menos uno de dichos átomos es un nitrógeno, y en donde dicho nitrógeno tiene un enlace a C(=Q); y

25 (H)Q se selecciona del grupo que consiste en O y S.

3.Una molécula de acuerdo con 1 en donde dicha molécula se selecciona de una de las moléculas de la Tabla 2.

4.Una molécula de acuerdo con 1 en donde dicha molécula se selecciona de una de las moléculas de la Tabla 1.

5. Una composición plaguicida que comprende una molécula de acuerdo con cualquiera de 1, 2, 3, o 4, que comprende además uno o más ingredientes activos.
6. Una composición plaguicida de acuerdo con 5 en donde dicho ingrediente activo es de AIGA.
7. Una composición plaguicida de acuerdo con 5 en donde dicho ingrediente activo se selecciona del grupo que consiste en AI-1, 1,3-dicloropropeno, clorpirifos, clorpirifos-metilo, hexaflumuron, metoxifenoazida, noviflumuron, spinetoram, spinosad, sulfoxaflor, y fluoruro de sulfuro.
8. Una composición plaguicida que comprende una molécula de acuerdo con cualquiera de 1, 2, 3 o 4, que comprende además un Material MoA.
9. Una composición plaguicida de acuerdo con 7 en donde dicho MoA Material es de MoAMGA.
10. Una composición plaguicida de acuerdo con cualquiera de 5, 6, 7, 8, o 9, en donde la relación de peso de la molécula de acuerdo con Fórmula Uno con dicho ingrediente activo se selecciona de la Tabla B.
11. Un proceso para controlar una plaga dicho proceso comprende aplicar a un locus, una cantidad con efecto plaguicida de una molécula de acuerdo con cualquiera de 1, 2, 3, o 4.
12. Un proceso para controlar una plaga dicho proceso comprende aplicar a un locus, una cantidad con efecto plaguicida de una composición plaguicida de acuerdo con 5, 6, 7, 8, 9, o 10.
13. Una molécula de acuerdo con cualquiera de 1, 2, 3, o 4, o una composición plaguicida de acuerdo con cualquiera de 5, 6, 7, 8, 9, o 10, en donde dicha molécula tiene forma de sal de ácido aceptable en la agricultura.
14. Una molécula de acuerdo con cualquiera de 1, 2, 3, o 4, o una composición plaguicida de acuerdo con cualquiera de 5, 6, 7, 8, 9, o 10, en donde dicha molécula tiene forma de un derivado de sal.
15. Una molécula de acuerdo con cualquiera de 1, 2, 3, o 4, o una composición plaguicida de acuerdo con cualquiera de 5, 6, 7, 8, 9, o 10, en donde dicha molécula tiene forma de solvato.
16. Una molécula de acuerdo con cualquiera de 1, 2, 3, o 4, o una composición plaguicida de acuerdo con cualquiera de 5, 6, 7, 8, 9, o 10, en donde dicha molécula tiene forma de un derivado de éter.

- 17.Una molécula de acuerdo con cualquiera de 1, 2, 3, o 4, o una composición plaguicida de acuerdo con cualquiera de 5, 6, 7, 8, 9, o 10, en donde dicha molécula tiene forma de un cristal polimorfo.
- 18.Una molécula de acuerdo con cualquiera de 1, 2, 3, o 4, o una composición plaguicida de acuerdo con cualquiera de 5, 6, 7, 8, 9, o 10, en donde dicha molécula tiene deuterio, tritio, y o ^{14}C .
- 19.Una molécula de acuerdo con cualquiera de 1, 2, 3, o 4, o una composición plaguicida de acuerdo con cualquiera de 5, 6, 7, 8, 9, o 10, en donde dicha molécula tiene forma de uno o más estereoisómeros
- 20.Una molécula de acuerdo con cualquiera de 1, 2, 3, o 4, o una composición plaguicida de acuerdo con cualquiera de 5, 6, 7, 8, 9, o 10, en donde dicha molécula tiene forma de un estereoisómero resuelto.
- 21.Una composición plaguicida de acuerdo con cualquiera de 5, 6, 7, 8, 9, o 10, en donde dicha composición plaguicida comprende además otro ingrediente activo.
- 22.Una composición plaguicida de acuerdo con cualquiera de 5, 6, 7, 8, 9, o 10, en donde dicha composición plaguicida comprende además dos más ingredientes activos.
- 23.Una composición plaguicida de acuerdo con cualquiera de 5, 6, 7, 8, 9, o 10, en donde dicho ingrediente activo tiene un MOA diferente del MOA de dicha molécula de la Fórmula Uno.
- 24.Una composición plaguicida de acuerdo con cualquiera de 5, 6, 7, 8, 9, o 10, en donde dicha composición plaguicida comprende un ingrediente activo que tiene propiedades acaricidas, algicidas, avicidas, bactericidas, fungicidas, herbicidas, insecticidas, molusquicidas, nematocidas, rodenticidas y/o virucidas.
- 25.Una composición plaguicida de acuerdo con cualquiera de 5, 6, 7, 8, 9, o 10, en donde dicha composición plaguicida comprende un ingrediente activo que es un inhibidores de la alimentación, repelentes de aves, quimioesterilizantes, protectores de herbicidas, atrayentes de insectos, repelentes de insectos, repelentes de mamíferos, disruptores del apareamiento, activadores de plantas, reguladores del crecimiento vegetal y sinergistas.
- 26.Una composición plaguicida de acuerdo con cualquiera de 5, 6, 7, 8, 9, o 10, en donde dicha composición plaguicida comprende un ingrediente activo que es un bioplaguicida.

27. Una composición plaguicida de acuerdo con cualquiera de 5, 6, 7, 8, 9, o 10, en donde dicha relación de peso de una molécula de Fórmula Uno con respecto a un ingrediente activo es 100:1 a 1:100.
28. Una composición plaguicida de acuerdo con cualquiera de 5, 6, 7, 8, 9, o 10, en donde dicha
5 relación de peso de una molécula de Fórmula Uno con respecto a un ingrediente activo es 50:1 a 1:50.
29. Una composición plaguicida de acuerdo con cualquiera de 5, 6, 7, 8, 9, o 10, en donde dicha relación de peso de una molécula de Fórmula Uno con respecto a un ingrediente activo es 20:1 a 1:20.
- 10 30. Una composición plaguicida de acuerdo con cualquiera de 5, 6, 7, 8, 9, o 10, en donde dicha relación de peso de una molécula de Fórmula Uno con respecto a un ingrediente activo es 10:1 a 1:10.
31. Una composición plaguicida de acuerdo con cualquiera de 5, 6, 7, 8, 9, o 10, en donde dicha relación de peso de una molécula de Fórmula Uno con respecto a un ingrediente activo es 5:1 a
15 1:5.
32. Una composición plaguicida de acuerdo con cualquiera de 5, 6, 7, 8, 9, o 10, en donde dicha relación de peso de una molécula de Fórmula Uno con respecto a un ingrediente activo es 3:1 a 1:3.
33. Una composición plaguicida de acuerdo con cualquiera de 5, 6, 7, 8, 9, o 10, en donde dicha
20 relación de peso de una molécula de Fórmula Uno con respecto a un ingrediente activo es 2:1 a 1:2.
34. Una composición plaguicida de acuerdo con cualquiera de 5, 6, 7, 8, 9, o 10, en donde dicha relación de peso de una molécula de Fórmula Uno con un ingrediente activo es 1:1
35. Una composición plaguicida de acuerdo con cualquiera de 5, 6, 7, 8, 9, o 10 en donde dicha
25 relación de peso de la molécula de la Fórmula Uno con respecto al ingrediente activo representado como X:Y; en donde X es las partes en peso de la molécula de la Fórmula Uno y Y es las partes en peso del ingrediente activo; además en donde el intervalo numérico de las partes en peso para X es $0 < X \leq 100$ y las partes en peso para Y es $0 < Y \leq 100$; y además en donde X y Y se seleccionan de la Tabla C.

36. Una composición plaguicida de acuerdo con 35 en donde un intervalo de relaciones en peso de una molécula de la Fórmula Uno con respecto al ingrediente activo representado como $X_1:Y_1$ a $X_2:Y_2$; además en donde $X_1 > Y_1$ y $X_2 < Y_2$.
37. Una composición plaguicida de acuerdo con 35 en donde un intervalo de relaciones en peso de una molécula de la Fórmula Uno con respecto al ingrediente activo representado como $X_1:Y_1$ a $X_2:Y_2$; además en donde $X_1 > Y_1$ y $X_2 > Y_2$.
38. Una composición plaguicida de acuerdo con 35 en donde un intervalo de relaciones en peso de una molécula de la Fórmula Uno con respecto al ingrediente activo representado como $X_1:Y_1$ a $X_2:Y_2$; además en donde $X_1 < Y_1$ y $X_2 < Y_2$.
39. Una composición plaguicida de acuerdo con 35 en donde dicha composición plaguicida es sinérgica.
40. Un proceso de acuerdo con 12 en donde dicha plaga es de filo Arthropoda.
41. Un proceso de acuerdo con 12 en donde dicha plaga es de Filo Mollusca.
42. Un proceso de acuerdo con 12 en donde dicha plaga es de
- Filo Nematoda.
43. Un proceso de acuerdo con 12 en donde dichas plagas son hormigas, pulgones, escarabajos, cola de flecos, cucarachas, grillos, tijeretas, pulgas, moscas, saltamontes, piojos (incluidos los piojos de mar), langostas, ácaros, polillas, nematodos, escamas, synfila, termitas, trips, garrapatas, avispas y/o moscas blancas.
44. Un proceso de acuerdo con 12 en donde dicho locus se encuentra cuando se cultivan la alfalfa, almendras, manzanas, cebada, frijoles, canola, maíz, algodón, crucíferas, lechuga, avenas, naranjas, peras, pimientos, patatas, arroz, sorgo, soja, fresas, caña de azúcar, remolacha azucarera, girasoles, tabaco, tomates, trigo, y otros cultivos valiosos o cuando se plantan las semillas de estos.
45. Una composición plaguicida de acuerdo con cualquiera de 5, 6, 7, 8, 9, o 10, en donde dicha composición plaguicida comprende además sulfato de amonio.
46. Un proceso de acuerdo con 12 en donde dicho locus se encuentra cuando se siembran las plantas genéticamente modificadas para expresar rasgos especializados.

47.Un proceso de acuerdo con 12 en donde dicha aplicación se hace a las partes foliares y/o de frutas de las plantas.

48.Un proceso de acuerdo con 12 en donde dicha aplicación se hace al suelo.

5 49.Un proceso de acuerdo con 12 en donde dicha aplicación se hace mediante irrigación por goteo, aplicación en surcos, o empapado del suelo antes o después de la siembra.

50.Un proceso de acuerdo con 12 en donde la aplicación se hace a las partes foliares y/o de frutas de las plantas, o mediante el tratamiento de las semillas de una planta antes de la siembra.

10 51.Una composición plaguicida que comprende una molécula de acuerdo con cualquiera de 1, 2, 3, o 4, y una semilla.

52.Un proceso que comprende aplicar una molécula de acuerdo con cualquiera de 1, 2, 3, o 4, o una composición plaguicida de acuerdo con cualquiera de 5, 6, 7, 8, 9, o 10, a una semilla.

15 53.Un proceso que comprende aplicar una molécula de acuerdo con 1, 2, 3, o 4, a un locus que incluye un animal no humano para controlar endoparásitos, ectoparásitos y/o ambos.

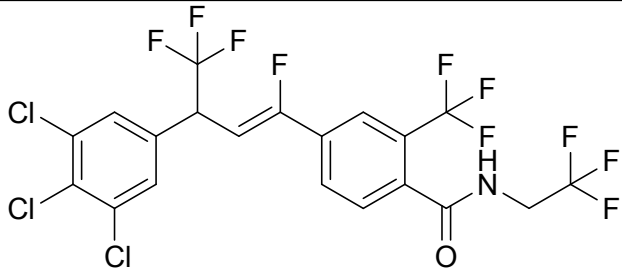
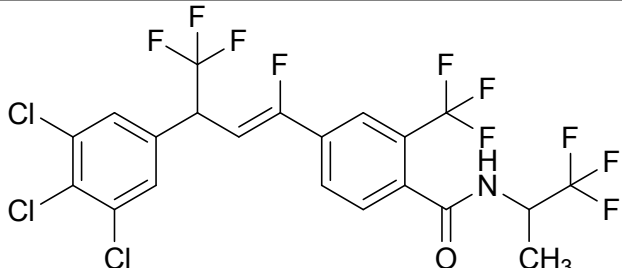
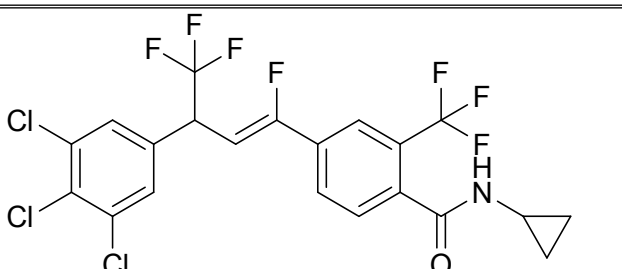
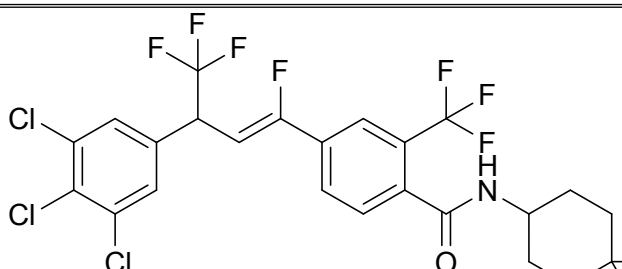
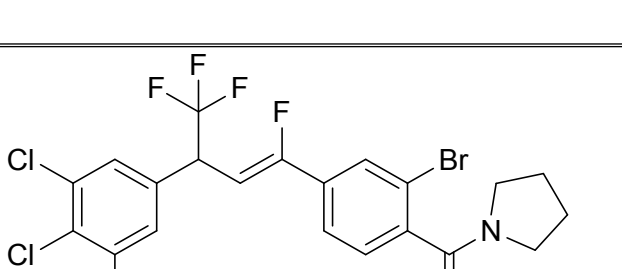
54.Un proceso para producir una composición plaguicida, dicho proceso comprende mezclar una molécula de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1, 2, 3, o 4, con uno o más ingrediente activos.

20 Los encabezados de este documento son sólo por conveniencia y no deben usarse para interpretar ninguna parte del mismo.

SECCIÓN DE TABLAS

Tabla 2. Estructura y método de preparación para moléculas Serie F

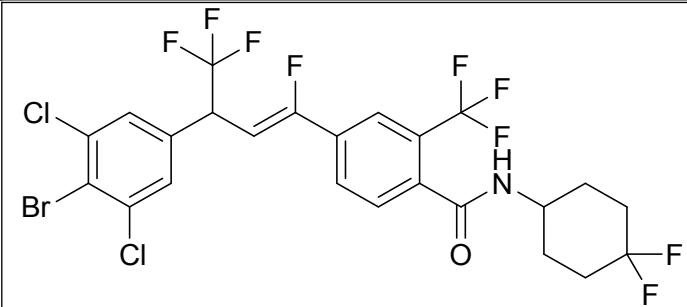
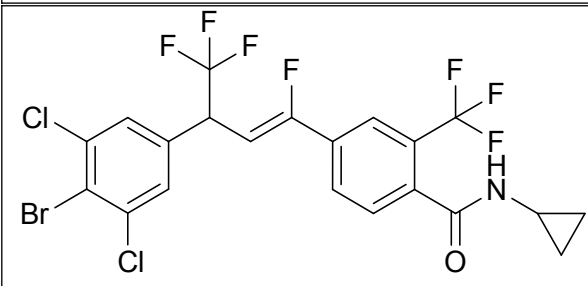
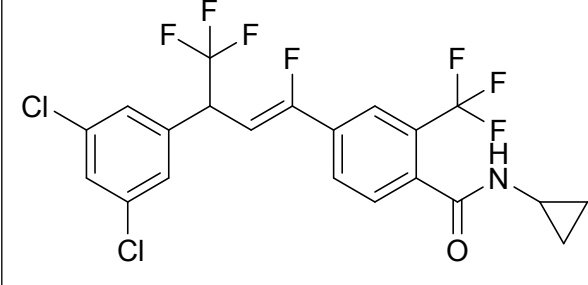
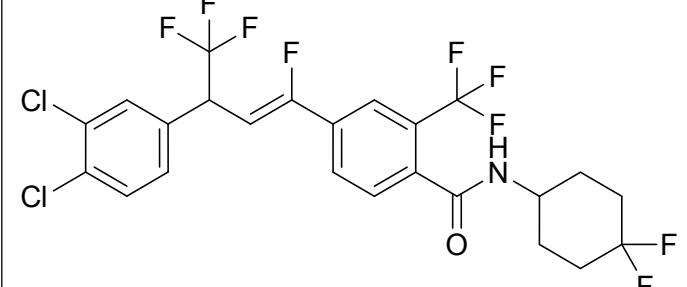
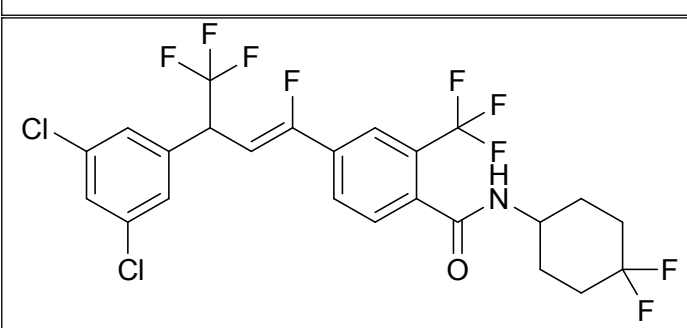
No.	Estructura	Prep.*
-----	------------	--------

F1		13
F2		13
F3		13
F4		13
F5		13

F6		13
F7		15
F8		15
F9		13
F10		13

F11		13
F12		14
F13		15
F14		15
F15		14

F16		14
F17		15
F18		16
F19		17
F20		17

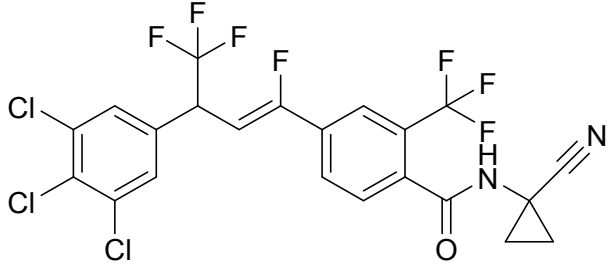
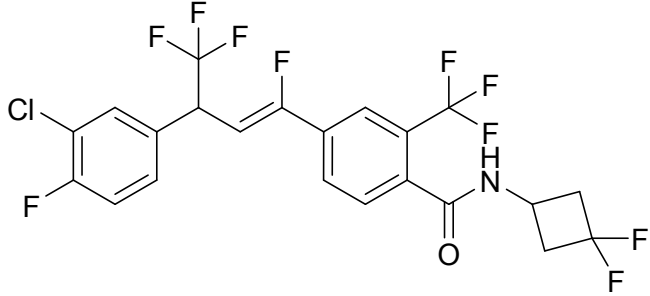
F21		14
F22		14
F23		13
F24		14
F25		14

F26		13
F27		14
F28		14
F29		15
F30		14

F31		14
F32		14
F33		18
F34		18
F35		14

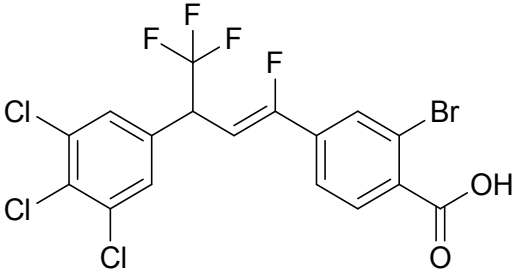
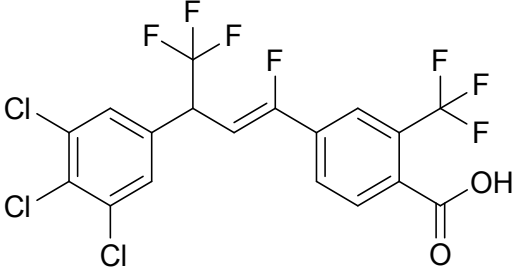
F36		14
F37		14
F38		14
F39		13
F40		14

F46		14
F47		15
F51		15
F52		15
F61		13

F62		13
F63		15

*preparado de acuerdo con el número de ejemplo

Tabla 3. Estructura y método de preparación para moléculas Serie C

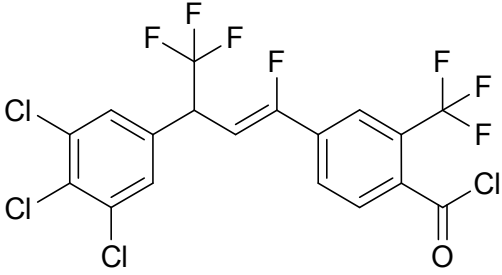
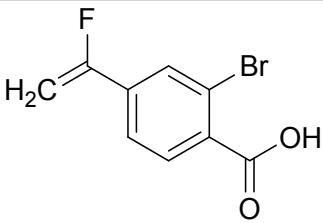
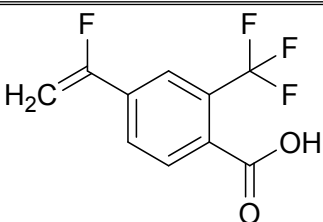
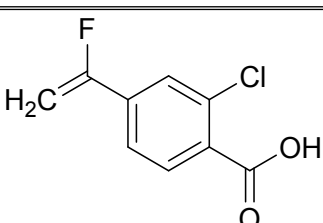
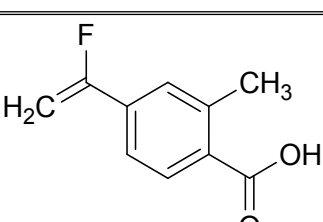
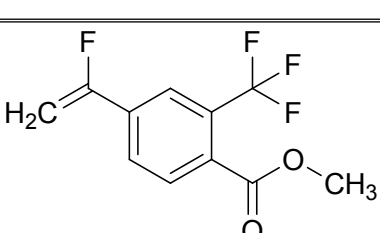
No.	Estructura	Prep.*
C1		1
C2		1

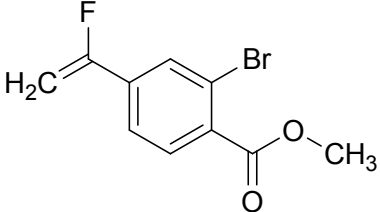
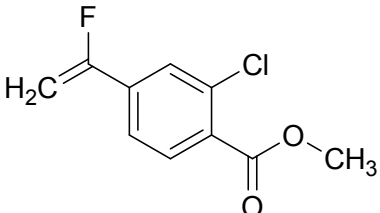
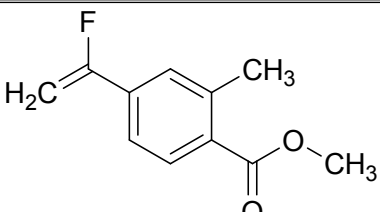
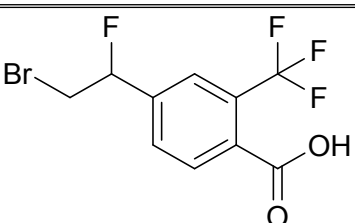
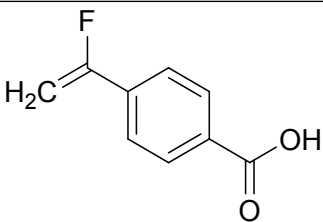
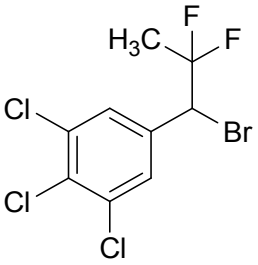
C3		1
C4		1
C5		1
C6		1
C7		1

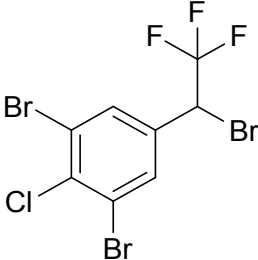
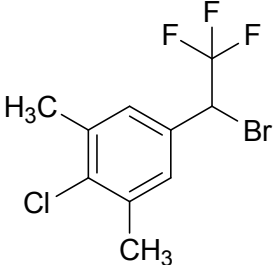
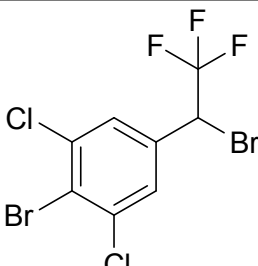
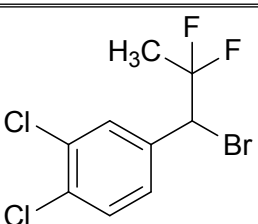
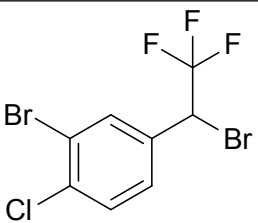
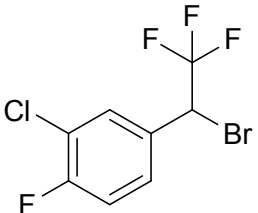
C8		1
C9		1
C10		1
C11		1
C12		1

C13		1
C14		1
C15		1
C16		1
C17		1

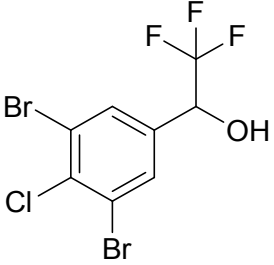
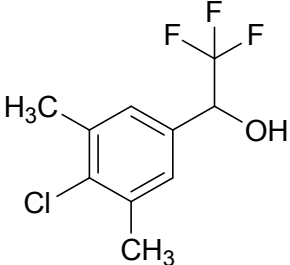
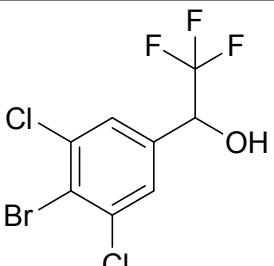
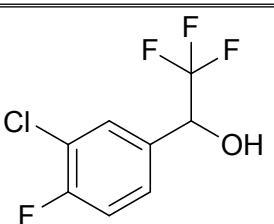
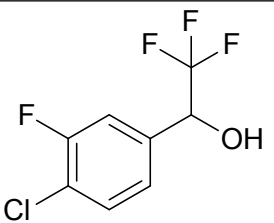
C18		1
C19		1
C20		1
C21		2
C22		3

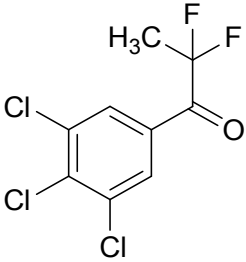
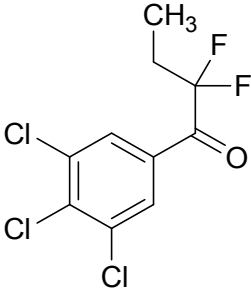
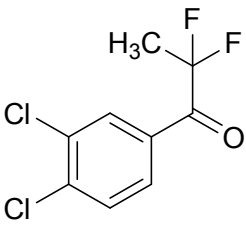
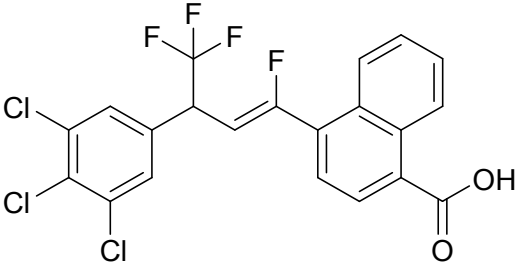
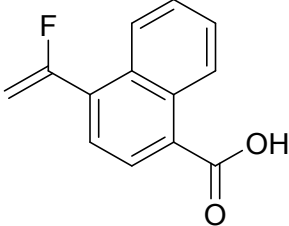
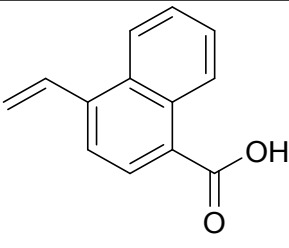
C23		4
C24		5
C25		5, 7
C26		5
C27		5, 7
C28		6

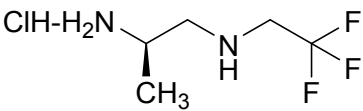
C29	 <chem>COC(=O)/C=C/c1ccc(Br)cc1F</chem>	6
C30	 <chem>COC(=O)/C=C/c1ccc(Cl)cc1F</chem>	6
C31	 <chem>COC(=O)/C=C/c1ccc(C)cc1F</chem>	6
C32	 <chem>OC(=O)C(O)C1=CC=C(C(F)(F)F)C(C1)CBr</chem>	7
C33	 <chem>OC(=O)C(O)C1=CC=C(C=C1)C(F)=C</chem>	7
C34	 <chem>OC(=O)C(Br)C(C(F)(F)F)C1=CC(=C(C(=C1)Cl)Cl)Cl</chem>	8

C35		8
C36		8
C37		8
C38		8
C39		8
C40		8

C41		8
C42		9
C43		10
C44		10
C45		10
C46		11

C47		11
C48		11
C49		11
C50		11
C51		11

C52		12
C53		12
C54		12
C55		1
C56		7
C57		19

C58		25
-----	---	----

*preparado de acuerdo con el número de ejemplo

Tabla 4: Datos analíticos para moléculas en la Tabla 2 y en la Tabla

No.	Mp (°C)	Mass (<i>m/z</i>)	¹ H NMR	¹³ C NMR ¹⁹ F NMR; IR
F1		578 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 7.86 (d, <i>J</i> = 1.6 Hz, 1H), 7.78 (dd, <i>J</i> = 8.2, 1.7 Hz, 1H), 7.59 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 7.44 (s, 2H), 6.20 (t, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 5.84 (dd, <i>J</i> = 32.5, 9.6 Hz, 1H), 4.61 (p, <i>J</i> = 8.9 Hz, 1H), 4.09 (qd, <i>J</i> = 8.9, 6.4 Hz, 2H)	¹⁹ F NMR (471 MHz, CDCl ₃) δ -59.36, -69.33, -72.33, -112.05 (d, <i>J</i> = 33.0 Hz)
F2		592 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 7.87 (d, <i>J</i> = 1.6 Hz, 1H), 7.79 (dd, <i>J</i> = 8.2, 1.7 Hz, 1H), 7.61 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 7.44 (s, 2H), 5.92 (dd, <i>J</i> = 9.5, 2.6 Hz, 1H), 5.83 (dd, <i>J</i> = 23.7, 9.4 Hz, 1H), 4.90 (dp, <i>J</i> = 9.6, 7.2 Hz, 1H), 1.43 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 3H)	¹⁹ F NMR (471 MHz, CDCl ₃) δ -59.60, -69.31, -77.41, -111.93

F3		536 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 7.81 (s, 1H), 7.74 (dd, <i>J</i> = 8.0, 1.7 Hz, 1H), 7.56 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 7.44 (s, 2H), 6.04 (s, 1H), 5.82 (dd, <i>J</i> = 32.6, 9.6 Hz, 1H), 4.60 (p, <i>J</i> = 8.9 Hz, 1H), 2.86 (dq, <i>J</i> = 7.1, 3.5 Hz, 1H), 0.94 - 0.80 (m, 2H), 0.63 (q, <i>J</i> = 3.9, 3.3 Hz, 2H)	¹⁹ F NMR (471 MHz, CDCl ₃) δ -59.06, -69.35, -108.86 - -115.18 (m)
F4		612 ([M-H] ⁻)	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.84 (d, <i>J</i> = 1.7 Hz, 1H), 7.77 (dd, <i>J</i> = 8.1, 1.7 Hz, 1H), 7.58 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 7.43 (s, 2H), 5.82 (dd, <i>J</i> = 32.6, 9.6 Hz, 1H), 5.71 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 4.60 (p, <i>J</i> = 8.8 Hz, 1H), 4.12 (q, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 2.18 - 2.06 (m, 4H), 2.03 - 1.79 (m, 1H), 1.61 (d, <i>J</i> = 12.9 Hz, 3H)	¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ -58.86, -69.33 (d, <i>J</i> = 2.3 Hz), -108.33 - -113.86 (m)
F5		558 ([M-H] ⁻)	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.77 (d, <i>J</i> = 1.6 Hz, 1H), 7.63 - 7.47 (m, 2H), 7.42 (s, 2H), 5.78 (dd, <i>J</i> = 32.5, 9.6 Hz, 1H), 4.57 (p, <i>J</i> = 8.9 Hz, 1H), 4.03 - 3.65 (m, 4H), 1.99 (s, 2H), 1.87 (s, 2H)	¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ -69.35 (d, <i>J</i> = 2.2 Hz), -112.13

F6		550 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.86 (d, <i>J</i> = 1.7 Hz, 1H), 7.78 (dd, <i>J</i> = 8.0, 1.7 Hz, 1H), 7.49 - 7.39 (m, 3H), 5.80 (dd, <i>J</i> = 32.6, 9.6 Hz, 1H), 4.60 (p, <i>J</i> = 8.9 Hz, 1H), 3.65 (t, <i>J</i> = 7.0 Hz, 2H), 3.11 (t, <i>J</i> = 6.7 Hz, 2H), 2.03 - 1.79 (m, 4H)	¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ -60.65, -69.35 (d, <i>J</i> = 2.4 Hz), -111.90
F7		586 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.86 (d, <i>J</i> = 1.7 Hz, 1H), 7.79 (dd, <i>J</i> = 8.1, 1.8 Hz, 1H), 7.60 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 7.43 (s, 2H), 6.00 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 1H), 5.83 (dd, <i>J</i> = 32.5, 9.6 Hz, 1H), 4.60 (p, <i>J</i> = 8.9 Hz, 1H), 4.45 (m, 1H), 3.11 (m, 2H), 2.57 (m, 2H)	¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ -58.89, -69.31 (d, <i>J</i> = 2.3 Hz), -85.56 (d, <i>J</i> = 199.3 Hz), -96.16 (d, <i>J</i> = 199.4 Hz), -111.95 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz)
F8		612 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.84 (m, 1H), 7.74 (dd, <i>J</i> = 8.1, 1.8 Hz, 1H), 7.58 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 7.43 (s, 2H), 7.26 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 2H), 7.18 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 2H), 5.93 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 5.80 (dd, <i>J</i> = 32.6, 9.6 Hz, 1H), 5.29 (m, 1H), 4.59 (p, <i>J</i> = 8.9 Hz, 1H), 2.35 (s, 3H), 1.60 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H)	¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ -58.92, -69.33 (d, <i>J</i> = 2.3 Hz), -111.87 (dd, <i>J</i> = 4.3, 2.3 Hz)

F9		559 ([M-F] ⁻)	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.71 - 7.60 (m, 1H), 7.56 (d, <i>J</i> = 1.7 Hz, 1H), 7.48 (dd, <i>J</i> = 8.2, 1.7 Hz, 1H), 7.43 (s, 2H), 6.31 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 5.78 (dd, <i>J</i> = 32.6, 9.6 Hz, 1H), 4.59 (p, <i>J</i> = 8.9 Hz, 1H), 4.11 (m, 1H), 2.26 - 2.06 (m, 5H), 2.01 - 1.80 (m, 1H), 1.80 - 1.55 (m, 2H)	¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ -69.37 (d, <i>J</i> = 2.3 Hz), -95.24 (d, <i>J</i> = 237.9 Hz), -100.77 (d, <i>J</i> = 238.9 Hz), -110.05 – -114.23 (m)
F10		604 ([M-F] ⁻)	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.74 (d, <i>J</i> = 1.2 Hz, 1H), 7.52 (d, <i>J</i> = 1.6 Hz, 2H), 7.43 (s, 2H), 6.12 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 5.76 (dd, <i>J</i> = 32.6, 9.6 Hz, 1H), 4.58 (p, <i>J</i> = 8.9 Hz, 1H), 4.11 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 2.22 - 2.07 (m, 5H), 2.02 - 1.79 (m, 1H), 1.77 - 1.58 (m, 2H)	¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ -63.63 - -74.62 (m), -95.18 (d, <i>J</i> = 238.7 Hz), -100.86 (d, <i>J</i> = 239.3 Hz), -108.70 – -115.95 (m)
F11	67-70	619 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.19 (t, <i>J</i> = 5.6 Hz, 1H), 8.39 (s, 2H), 8.12 (s, 1H), 8.04 (s, 2H), 7.83 - 7.80 (m, 1H), 7.70 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 7.54 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H), 6.85 (dd, <i>J</i> = 35.6, 10.0 Hz, 1H), 5.26 - 5.25 (m, 1H), 4.48 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 2H)	

F12		623 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.60 (d, <i>J</i> = 3.9 Hz, 1H), 8.18 (s, 2H), 8.09 (s, 1H), 8.03 (dd, <i>J</i> = 8.7 Hz, 1H), 7.61 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 6.86 (dd, <i>J</i> = 35.7, 10.2 Hz, 1H), 5.26 - 5.18 (m, 1H), 2.81 - 2.75 (m, 1H), 0.71 - 0.67 (m, 2H), 0.52 - 0.47 (m, 2H)	IR (película delgada) 3421, 3005, 1275, 750 cm ⁻¹
F13		613 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.85 (m, 1H), 7.78 (dd, <i>J</i> = 8.1, 1.7 Hz, 1H), 7.60 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 7.43 (s, 2H), 5.95 (d, <i>J</i> = 8.3 Hz, 1H), 5.82 (dd, <i>J</i> = 32.5, 9.6 Hz, 1H), 4.60 (p, <i>J</i> = 8.9 Hz, 1H), 4.44 (dt, <i>J</i> = 8.3, 4.3 Hz, 1H), 2.35 (q, <i>J</i> = 12.7, 11.3 Hz, 1H), 1.82 (m, 7H)	¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ -58.88, -62.51 (d, <i>J</i> = 1718.3 Hz), -69.34 (d, <i>J</i> = 2.3 Hz), -111.90 (t, <i>J</i> = 2.6 Hz)

F14		631 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.84 (d, <i>J</i> = 1.7 Hz, 1H), 7.75 (dd, <i>J</i> = 8.2, 1.7 Hz, 1H), 7.59 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 7.43 (s, 2H), 7.29 (t, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 6.96 (m, 1H), 6.91 (t, <i>J</i> = 2.1 Hz, 1H), 6.84 (ddd, <i>J</i> = 8.3, 2.6, 1.0 Hz, 1H), 5.96 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 5.80 (dd, <i>J</i> = 32.6, 9.6 Hz, 1H), 5.30 (m, 1H), 4.59 (p, <i>J</i> = 8.9 Hz, 1H), 3.82 (s, 3H), 1.60 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H)	¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ -58.89, -69.33 (d, <i>J</i> = 2.3 Hz), -111.87 (d, <i>J</i> = 4.0 Hz)
F15		554 ([M-H] ⁻)	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.19 (d, <i>J</i> = 8.8 Hz, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.07 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H), 7.81 (s, 2H), 7.69 (s, 1H), 7.62 (d, <i>J</i> = 7.6 Hz, 1H), 6.87 (dd, <i>J</i> = 35.6, 8.8 Hz, 1H), 5.23 - 5.19 (m, 1H), 4.78 - 4.74 (m, 1H), 1.32 - 1.28 (m, 3H)	IR (película delgada) 3445, 2928, 1661, 1178 cm ⁻¹

F16		554 ([M-H] ⁻)	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.19 (d, <i>J</i> = 8.8 Hz, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.06 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 8.01 (s, 1H), 7.74 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H), 7.72 - 7.62 (m, 1H), 7.62 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H), 6.87 (dd, <i>J</i> = 36.0, 10.0 Hz, 1H), 5.21 - 5.16 (m, 1H), 4.78 - 4.76 (m, 1H), 1.32 - 1.30 (m, 3H)	IR (película delgada) 3275, 2928, 1667, 1142 cm ⁻¹
F17		496 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.88 (m, 1H), 7.79 (dd, <i>J</i> = 8.1, 1.8 Hz, 1H), 7.67 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 7.44 (s, 2H), 5.85 (m, 3H), 4.61 (p, <i>J</i> = 8.9 Hz, 1H)	¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ -59.15, -69.32 (d, <i>J</i> = 2.4 Hz), -111.96 (m)
F18		551 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.61 (s, 1H), 7.87 (m, 2H), 7.73 (dd, <i>J</i> = 8.2, 1.8 Hz, 1H), 7.44 (s, 2H), 5.79 (dd, <i>J</i> = 32.6, 9.6 Hz, 1H), 4.60 (p, <i>J</i> = 8.9 Hz, 1H), 3.18 (m, 6H)	¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ -58.92 (d, <i>J</i> = 172.5 Hz), -69.34 (dd, <i>J</i> = 18.8, 2.3 Hz), -111.76 (m)

F19		553 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 8.53 (dd, <i>J</i> = 29.0, 9.9 Hz, 1H), 7.92 (d, <i>J</i> = 1.9 Hz, 1H), 7.84 (dd, <i>J</i> = 8.2, 1.8 Hz, 1H), 7.76 (d, <i>J</i> = 9.6 Hz, 1H), 7.67 (m, 1H), 7.44 (s, 2H), 5.86 (dd, <i>J</i> = 32.4, 9.6 Hz, 1H), 4.61 (p, <i>J</i> = 8.9 Hz, 1H), 3.85 (d, <i>J</i> = 34.8 Hz, 3H); mezcla de <i>E</i> y <i>Z</i> isómeros	¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ -59.01, -69.30 (d, <i>J</i> = 2.3 Hz), -112.03; mezcla de <i>E</i> y <i>Z</i> isómeros
F20		522 ([M-H] ⁻)	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 9.19 (s, 1H), 8.44 (d, <i>J</i> = 9.7 Hz, 1H), 7.95 (m, 1H), 7.88 (dd, <i>J</i> = 8.1, 1.7 Hz, 1H), 7.67 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 7.44 (s, 2H), 5.90 (dd, <i>J</i> = 32.4, 9.6 Hz, 1H), 4.62 (p, <i>J</i> = 8.9 Hz, 1H)	¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ -59.04 (d, <i>J</i> = 94.3 Hz), -69.26 (d, <i>J</i> = 2.3 Hz), -112.17 (m)
F21	85-88	656 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.57 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 8.11 (s, 1H), 8.04 - 8.00 (m, 3H), 7.62 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 6.86 (dd, <i>J</i> = 36.0, 9.9 Hz, 1H), 5.25 - 5.19 (m, 1H), 3.94 - 3.90 (m, 1H), 2.02 - 1.88 (m, 6H), 1.58 - 1.55 (m, 2H)	

F22		578 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.59 (d, <i>J</i> = 3.6 Hz, 1H), 8.09 (s, 1H), 8.02 - 8.00 (m, 3H), 7.61 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H), 6.83 (dd, <i>J</i> = 35.6, 10.0 Hz, 1H), 5.24 - 5.19 (m, 1H), 2.80 - 2.76 (m, 1H), 0.72 - 0.67 (m, 2H), 0.51 - 0.49 (m, 2H)	IR (película delgada) 3430, 1652 cm ⁻¹
F23		500 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.58 (d, <i>J</i> = 3.9 Hz, 1H), 8.07 (s, 1H), 8.02 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H), 7.79 (d, <i>J</i> = 6.0 Hz, 1H), 7.66 (s, 1H), 7.59 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 6.84 (dd, <i>J</i> = 35.7, 9.9 Hz, 1H), 5.24 - 5.18 (m, 1H), 3.29 - 2.97 (m, 1H), 0.69 - 0.62 (m, 2H), 0.57 - 0.48 (m, 2H)	IR (película delgada) 3431, 1652, 750 cm ⁻¹

F24		578 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.56(d, <i>J</i> = 7.6 Hz, 1H), 8.11 (s, 1H), 8.03 - 8.00 (m, 2H), 7.74 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H), 7.68 - 7.64 (m, 1H), 7.61 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H), 6.83 (dd, <i>J</i> = 35.6, 9.6 Hz, 1H), 5.20 - 5.15 (m, 1H), 3.96 (br s, 1H), 2.01 - 1.98 (m, 2H), 1.93 - 1.86 (m, 2H), 1.57 - 1.52 (m, 2H), 1.23 - 1.19 (m, 2H)	IR (película delgada) 3422, 2926, 1645, 764 cm ⁻¹
F25		578 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.56 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 8.12 (s, 1H), 8.04 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz 1H), 7.81 (d, <i>J</i> = 1.6 Hz, 2H), 7.68 (d, <i>J</i> = 1.6 Hz, 1H), 7.62 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H), 6.83 (dd, <i>J</i> = 36.0, 10.8 Hz, 1H), 5.20 - 5.15 (m, 1H), 3.96 - 3.94 (br s, 1H), 2.09 -1.68 (m, 6H), 1.23 - 1.19 (m, 2H)	IR (película delgada) 3429, 1645, 1119 cm ⁻¹

F26		605 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.68 (s, 1H), 8.20 (s, 2H), 8.18 - 8.17 (m, 1H), 8.12 (s, 1H), 8.05 (s, 2H), 7.91 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H), 7.56 (d, <i>J</i> = 8.8 Hz, 1H), 6.91 (dd, <i>J</i> = 36.0, 10.0 Hz, 1H), 5.27 - 5.25 (m, 1H)	IR (película delgada) 3422, 2925, 1672, 1260, 750 cm ⁻¹
F27		572 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.20 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 8.14 (s, 1H), 8.07 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 8.01 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 7.64 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 6.87 (dd, <i>J</i> = 35.7, 10.2 Hz, 1H), 5.25 - 5.24 (m, 1H), 4.78 - 4.73 (m, 1H), 1.33 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H)	IR (película delgada) 3435, 2927, 1666, 1178, 677 cm ⁻¹
F28		642 ([M-H] ⁻)	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.20 (d, <i>J</i> = 8.8 Hz, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.09 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H), 7.96 (s, 2H), 7.91 - 7.90 (m, 1H), 7.62 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 6.87 (dd, <i>J</i> = 36.0, 10.0 Hz, 1H), 5.22 - 5.19 (m, 1H), 4.78 - 4.73 (m, 1H), 1.32 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 3H)	IR (película delgada) 3440, 2926, 1662, 1260, 749 cm ⁻¹

F29		592 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 7.89 (dd, <i>J</i> = 8.0, 1.9 Hz, 1H), 7.83 (dt, <i>J</i> = 8.1, 2.1 Hz, 1H), 7.45 (s, 2H), 7.41 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 5.87 (ddd, <i>J</i> = 32.6, 9.6, 4.7 Hz, 1H), 4.68 - 4.57 (m, 1H), 4.27 - 4.17 (m, 2H), rotómeros 3.24 (s) & 2.92 (s)(3H)	¹⁹ F NMR (471 MHz, CDCl ₃) δ rotómeros -60.73 & -60.81, rotómeros -69.33 (t, <i>J</i> = 9.0 Hz) & -69.76 (t, <i>J</i> = 8.6 Hz), -69.39 (d, <i>J</i> = 8.7 Hz), rotómeros -112.11 (d, <i>J</i> = 32.5 Hz) & -112.24 (d, <i>J</i> = 32.5 Hz)
F30		551 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.16 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H), 8.12 (s, 1H), 8.06 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 7.62 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 7.45 (s, 2H), 6.79 (dd, <i>J</i> = 35.7, 9.9 Hz, 1H), 4.96 - 4.89 (m, 1H), 4.81 - 4.73 (m, 1H), 2.32 (s, 6H), 1.32 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H)	IR (película delgada) 3452, 2927, 1664, 749 cm ⁻¹

F31		573 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.56 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 8.08 (s, 1H), 8.03 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 7.61 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 7.45 (s, 2H), 6.78 (dd, <i>J</i> = 36.0, 9.9 Hz, 1H), 4.95 - 4.89 (m, 1H), 3.94 (br s, 1H), 2.35 (s, 6H), 2.02 - 1.98 (m, 4H), 1.89 - 1.86 (m, 2H), 1.57 - 1.54 (m, 2H)	IR (película delgada) 3435, 2929, 1653, 749 cm ⁻¹
F32		701 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.57 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 8.17 - 8.01 (m, 4H), 7.62 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 6.86 (dd, <i>J</i> = 36.0, 10.2 Hz, 1H), 5.25 - 5.19 (m, 1H), 4.10 - 3.96 (m, 1H), 2.02 - 1.87 (m, 6H), 1.57 - 1.55 (m, 2H)	IR (película delgada) 3422, 1651 cm ⁻¹
F33		591 ([M-H] ⁻)	¹ H NMR (300 MHz, CDCl ₃) δ 7.83 (d, <i>J</i> = 1.7 Hz, 1H), 7.75 (dd, <i>J</i> = 8.2, 1.8 Hz, 1H), 7.61 (d, <i>J</i> = 8.2 Hz, 1H), 7.47 - 7.38 (m, 3H), 5.82 (dd, <i>J</i> = 32.6, 9.6 Hz, 1H), 4.66 - 4.52 (m, 3H)	¹⁹ F NMR (471 MHz, CDCl ₃) δ -58.54, -69.36 (d, <i>J</i> = 8.7 Hz), -70.53 (t, <i>J</i> = 9.0 Hz), -111.94 (d, <i>J</i> = 32.8 Hz)

F34		605 ([M-H] ⁻)	¹ H NMR (300 MHz, CDCl ₃) δ 7.83 (dd, <i>J</i> = 5.0, 1.7 Hz, 1H), 7.76 (dd, <i>J</i> = 8.1, 1.8 Hz, 1H), 7.43 (s, 2H), 7.30 (d, <i>J</i> = 8.2 Hz, 1H), 5.80 (ddd, <i>J</i> = 32.6, 9.6, 3.4 Hz, 1H), 4.90 (ddq, <i>J</i> = 63.6, 14.7, 8.7 Hz, 1H), 4.61 (p, <i>J</i> = 8.8 Hz, 1H), 4.19-3.70 (m, 1H), rotómeros 3.63 (s) & 3.12 (s)(3H)	¹⁹ F NMR (471 MHz, CDCl ₃) δ rotómeros - 59.82 & -60.15, rotómeros -67.38 (t, <i>J</i> = 8.8 Hz) & -68.83 (t, <i>J</i> = 8.1 Hz), -69.37 (d, <i>J</i> = 8.6 Hz), rotómeros - 112.01 (d, <i>J</i> = 32.7 Hz) & -112.12 (dd, <i>J</i> = 32.5, 10.8 Hz)
F35		500 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.57 (d, <i>J</i> = 3.6 Hz, 1H), 8.07 (s, 1H), 8.01 - 7.97(m, 2H), 7.77 - 7.52 (m, 3H), 6.82 (dd, <i>J</i> = 35.7, 9.9 Hz, 1H), 5.21 - 5.09 (m, 1H), 2.77 - 2.73 (m, 1H), 0.83 - 0.81 (m, 2H), 0.48 - 0.40 (m, 2H)	IR (película delgada) 3273, 2927, 1657, 1127 cm ⁻¹
F36		676 ([M-H] ⁻)	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.17 (d, <i>J</i> = 8.8 Hz, 1H), 8.17 - 8.14 (m, 3H), 8.06 (d, <i>J</i> = 7.6 Hz, 1H), 7.62 (d, <i>J</i> = 7.6 Hz, 1H), 6.86 (dd, <i>J</i> = 35.6, 10.0 Hz, 1H), 5.24 - 5.20 (m, 1H), 4.80 - 4.74 (m, 1H), 1.32 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H)	IR (película delgada) 3419, 1652 cm ⁻¹

F37		494 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.59 (d, <i>J</i> = 4.0 Hz, 1H), 8.06 (s, 1H), 8.02 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 7.59 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 7.45 (s, 2H), 6.75 (dd, <i>J</i> = 36.4, 10.4 Hz, 1H), 4.93 - 4.89 (m, 1H), 2.80 - 2.75 (m, 1H), 2.49 (s, 6H), 0.72 - 0.67 (m, 2H), 0.51- 0.48 (m, 2H)	IR (película delgada) 3434, 2272, 1656 cm ⁻¹
F38		634 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.20 (d, <i>J</i> = 8.7 Hz, 1H), 8.14 (s, 1H), 8.07 - 8.00 (m, 3H), 7.63 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 6.88 (dd, <i>J</i> = 35.4, 9.9 Hz, 1H), 5.26 - 5.20 (m, 1H), 4.78 - 4.73 (m, 1H), 1.32 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H)	IR (película delgada) 3435, 2926, 1663, 1177, 749 cm ⁻¹
F39		522 ([M-H] ⁻)	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.49 - 7.36 (m, 5H), 6.13 (t, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 5.73 (dd, <i>J</i> = 32.8, 9.6 Hz, 1H), 4.59 (p, <i>J</i> = 8.9 Hz, 1H), 4.09 (qd, <i>J</i> = 9.0, 6.9 Hz, 2H), 2.46 (s, 3H)	¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ -69.44 (d, <i>J</i> = 2.3 Hz), -72.38 , -111.69; IR (película delgada) 3300, 1667, 1163, 727 cm ⁻¹

F40		666 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.56 (d, <i>J</i> = 7.5 Hz, 1H), 8.11 (s, 1H), 8.04 (d, <i>J</i> = 9.0 Hz, 1H), 7.96 (s, 2H), 7.91 - 7.90 (m, 1H), 7.62 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 6.86 (dd, <i>J</i> = 35.7, 10.2 Hz, 1H), 5.22 - 5.21 (m, 1H), 3.97 - 3.96 (m, 1H), 2.02 - 1.87 (m, 8H)	IR (película delgada) 3422, 2926, 1645, 1118, 745 cm ⁻¹
F41		596 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.57 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 8.10 (s, 1H), 8.04 (s, 1H), 8.01 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 7.62 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H), 6.85 (dd, <i>J</i> = 36.0, 10.2, Hz, 1H), 5.24 - 5.23 (m, 1H), 4.04 - 3.96 (m, 1H), 2.02 - 1.62 (m, 4H), 1.62 - 1.55 (m, 4H)	IR (película delgada) 3437, 2926, 1651, 1119, 815 cm ⁻¹
F42		589 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.59 (d, <i>J</i> = 4.5 Hz, 1H), 8.09 (s, 1H), 8.03 (d, <i>J</i> = 9.6 Hz, 1H), 7.96 (s, 2H), 7.91 - 7.90 (m, 1H), 7.60 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 6.86 (dd, <i>J</i> = 36.0, 9.9 Hz, 1H), 5.21 - 5.15 (m, 1H), 2.80 - 2.72 (m, 1H), 0.85 - 0.66 (m, 2H), 0.52 - 0.48 (m, 2H)	IR (película delgada) 3431, 2925, 1651, 1119, 748 cm ⁻¹

F43		518 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.59 (d, <i>J</i> = 3.9 Hz, 1H), 8.08 (s, 1H), 8.02 (s, 1H), 8.00 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 2H), 7.61 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H), 6.84 (dd, <i>J</i> = 35.7, 10.2 Hz, 1H), 5.24 - 5.23 (m, 1H), 2.81 - 2.75 (m, 1H), 0.73 - 0.66 (m, 2H), 0.52 - 0.50 (m, 2H)	IR (película delgada) 3431, 2926, 1646, 749 cm ⁻¹
F44		667 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.56 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 8.11 - 8.10 (m, 2H), 8.03 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H), 7.85 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H), 7.61 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 2H), 6.82 (dd, <i>J</i> = 35.6, 9.6 Hz, 1H), 5.17 - 5.16 (m, 1H), 3.96 - 3.95 (m, 1H), 2.05 - 1.98 (m, 3H), 1.93 - 1.87 (m, 3H), 1.61 - 1.52 (m, 2H)	IR (película delgada) 3428, 2926, 1645, 749 cm ⁻¹

F45		642 ([M-H] ⁻)	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.20 (d, <i>J</i> = 8.8 Hz, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.10 (s, 1H), 8.06 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 1H), 7.86 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H), 7.62 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 2H), 6.87 (dd, <i>J</i> = 36.0, 10.0 Hz, 1H), 5.18 - 5.17 (m, 1H), 4.80 - 4.74 (m, 1H), 1.32 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H)	IR (película delgada) 3444, 2926, 1663, 1261, 750 cm ⁻¹
F46		588 ([M-H] ⁻)	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8.59 (d, <i>J</i> = 3.6 Hz, 1H), 8.09 (s, 2H), 8.02 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H), 7.85 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 7.61 - 7.59 (m, 2H), 6.82 (dd, <i>J</i> = 35.6, 9.6 Hz, 1H), 5.17 - 5.12 (m, 1H), 2.80 - 2.51 (m, 1H), 0.72 - 0.67 (m, 2H), 0.51 - 0.48 (m, 2H)	IR (película delgada) 3432, 2925, 1651, 749 cm ⁻¹

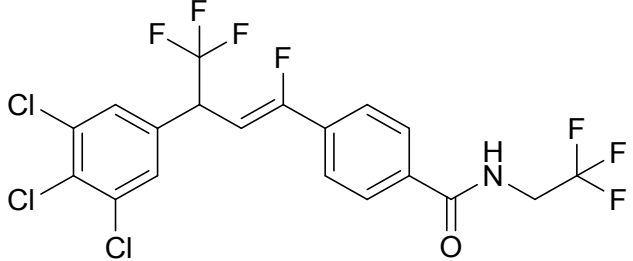
F47	65-85	621.1 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 8.38 (d, <i>J</i> = 5.1 Hz, 1H), 7.89 (d, <i>J</i> = 1.7 Hz, 1H), 7.81 (dd, <i>J</i> = 8.1, 1.7 Hz, 1H), 7.64 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 7.44 (s, 2H), 7.32 (s, 1H), 7.22 (d, <i>J</i> = 5.1 Hz, 1H), 6.24 (t, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 5.84 (dd, <i>J</i> = 32.5, 9.5 Hz, 1H), 4.64 (d, <i>J</i> = 6.1 Hz, 2H), 4.63 - 4.55 (m, 1H)	¹⁹ F NMR (471 MHz, CDCl ₃) δ -58.93, -69.29 (d, <i>J</i> = 9.7 Hz), -111.98 (d, <i>J</i> = 32.4 Hz)
F51		586.9 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 8.51 (ddd, <i>J</i> = 4.9, 1.8, 0.9 Hz, 1H), 7.87 (d, <i>J</i> = 1.6 Hz, 1H), 7.78 (dd, <i>J</i> = 8.1, 1.8 Hz, 1H), 7.71 (td, <i>J</i> = 7.7, 1.8 Hz, 1H), 7.67 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 7.44 (s, 2H), 7.33 (dt, <i>J</i> = 7.9, 0.9 Hz, 1H), 7.23 (ddd, <i>J</i> = 7.6, 4.9, 1.1 Hz, 1H), 5.82 (dd, <i>J</i> = 32.6, 9.6 Hz, 1H), 4.76 (d, <i>J</i> = 4.7 Hz, 2H), 4.61 (p, <i>J</i> = 8.8 Hz, 1H)	¹⁹ F NMR (471 MHz, CDCl ₃) δ -59.28, -69.33 (d, <i>J</i> = 8.7 Hz), -111.85 (d, <i>J</i> = 32.6 Hz); IR (película delgada) 1660, 1248, 1176, 1138, 1119 cm ⁻¹

F52		599.1 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 8.50 (ddd, <i>J</i> = 4.9, 1.8, 0.9 Hz, 1H), 7.89 - 7.83 (m, 1H), 7.76 (dd, <i>J</i> = 8.1, 1.7 Hz, 1H), 7.70 (td, <i>J</i> = 7.7, 1.8 Hz, 1H), 7.62 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 7.44 (s, 2H), 7.44 (br s, 1H), 7.30 (dt, <i>J</i> = 7.8, 1.1 Hz, 1H), 7.23 - 7.18 (m, 1H), 5.80 (dd, <i>J</i> = 32.5, 9.6 Hz, 1H), 5.32 (p, <i>J</i> = 6.8 Hz, 1H), 4.60 (p, <i>J</i> = 8.9 Hz, 1H), 1.58 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H)	¹⁹ F NMR (471 MHz, CDCl ₃) δ -59.10, -69.34 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz), -111.80 (d, <i>J</i> = 32.4 Hz); IR (película delgada) 1656, 1175, 1139, 1119 cm ⁻¹
F61		635.6 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.84 (d, <i>J</i> = 1.7 Hz, 1H), 7.77 (dd, <i>J</i> = 8.1, 1.7 Hz, 1H), 7.59 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 7.44 (s, 2H), 6.11 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 5.82 (dd, <i>J</i> = 32.6, 9.6 Hz, 1H), 4.60 (p, <i>J</i> = 8.8 Hz, 1H), 4.26 (ddd, <i>J</i> = 12.8, 7.2, 5.6 Hz, 1H), 3.22 (qd, <i>J</i> = 9.3, 1.9 Hz, 2H), 2.88 (qd, <i>J</i> = 12.5, 5.2 Hz, 2H), 1.34 - 1.14 (m, 1H), 1.24 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H)	¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ -59.03, -69.35 (d, <i>J</i> = 2.3 Hz), -72.01, -111.91

F62		559 ([M-H] ⁻)	¹ H NMR (300 MHz, CDCl ₃) δ 7.82 (d, <i>J</i> = 1.6 Hz, 1H), 7.78 (dd, <i>J</i> = 8.1, 1.7 Hz, 1H), 7.59 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 7.44 (s, 2H), 6.71 (s, 1H), 5.85 (dd, <i>J</i> = 32.6, 9.6 Hz, 1H), 4.60 (p, <i>J</i> = 8.8 Hz, 1H), 1.68 - 1.58 (m, 2H), 1.40 - 1.32 (m, 2H)	IR (película delgada) 2976, 1711, 1630, 1433, 1284, 1171, 1117, 1055, 701, 667, 654 cm ⁻¹
-----	--	---------------------------	--	---

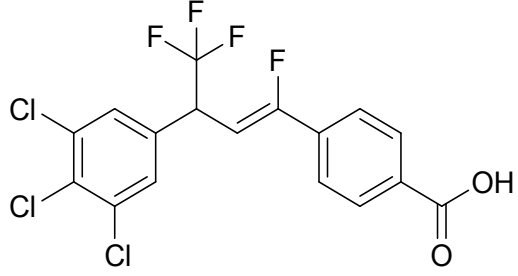
F63		534 ([M+H]⁺); HRMS-ESI (<i>m/z</i>) [M+H]⁺ calcd para C₂₂H₁₄ClF₁₀NO, 534.0604; encontrado, 534.0677	¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 7.82 (d, <i>J</i> = 1.7 Hz, 1H), 7.74 (dd, <i>J</i> = 8.0, 1.7 Hz, 1H), 7.53 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 7.46 (dd, <i>J</i> = 6.8, 2.3 Hz, 1H), 7.29 (ddd, <i>J</i> = 8.6, 4.4, 2.3 Hz, 1H), 7.18 (t, <i>J</i> = 8.6 Hz, 1H), 6.24 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz, 1H), 5.86 (dd, <i>J</i> = 32.8, 9.7 Hz, 1H), 4.63 (p, <i>J</i> = 9.0 Hz, 1H), 4.40 (tdt, <i>J</i> = 6.4, 4.8, 3.2 Hz, 1H), 3.14 - 2.98 (m, 2H), 2.64 - 2.46 (m, 2H)	¹³C NMR (126 MHz, CDCl₃) δ 166.72, 158.97 (d, <i>J</i> = 62.4 Hz), 156.95 (d, <i>J</i> = 66.7 Hz), 136.11 (d, <i>J</i> = 2.1 Hz), 132.71 (d, <i>J</i> = 29.2 Hz), 130.89 (d, <i>J</i> = 20.2 Hz), 129.30 (d, <i>J</i> = 2.0 Hz), 128.49 - 127.30 (m), 126.35, 124.14 (d, <i>J</i> = 8.2 Hz), 122.51 (dd, <i>J</i> = 7.5, 5.0 Hz), 122.15 - 121.40 (m), 120.67, 118.46 (d, <i>J</i> = 6.5 Hz), 117.20 (d, <i>J</i> = 21.4 Hz), 116.26, 102.25 - 100.86 (m), 45.65 - 43.81 (m), 42.79 (dd, <i>J</i> = 24.2, 22.6 Hz), 35.56 (dd, <i>J</i> = 15.7, 8.5 Hz); ¹⁹F NMR (471 MHz, CDCl₃) δ -58.99, -69.65 (d, <i>J</i> = 11.3 Hz), -84.52 - -86.43 (m), -95.64 - -97.55 (m), -112.59 - -113.75 (m), -114.06 - -115.84 (m); IR (película delgada) 3262, 1644, 1500, 1299, 1170, 1114, 907, 732 cm⁻¹
-----	--	---	--	---

Tabla 5. Estructura y método de preparación de los compuestos de las Series FC

No.	Estructura	Prep.*
FC1		13

*preparado de acuerdo con el número de ejemplo

Tabla 6. Estructura y método de preparación de las moléculas de las Series CC

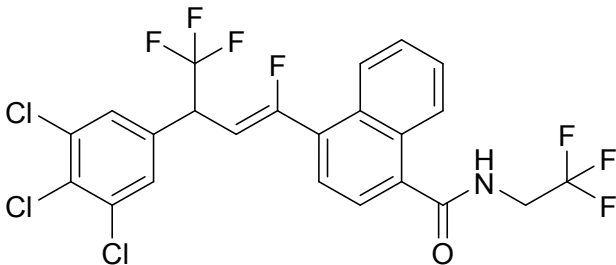
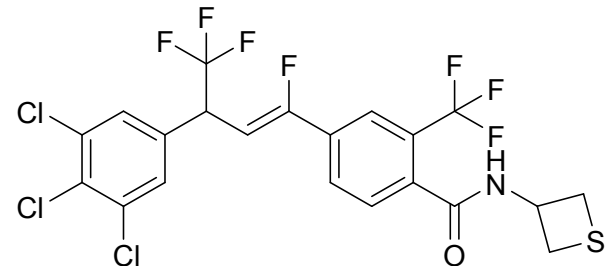
No.	Estructura	Prep.*
CC1		1

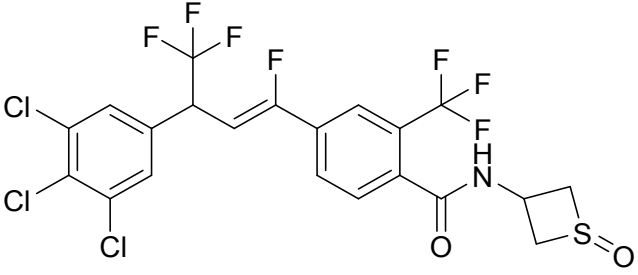
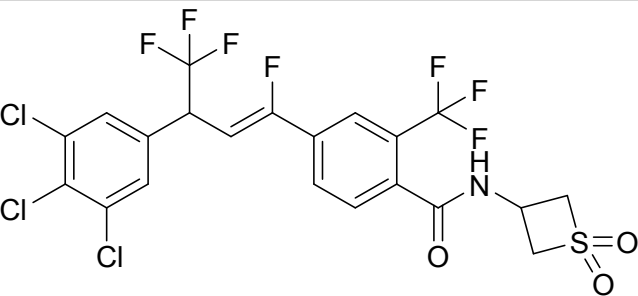
*preparado de acuerdo con el número de ejemplo

Tabla 7: Datos analíticos para Compuestos en la Tabla 5

No.	Mp (°C)	Masa (<i>m/z</i>)	¹ H NMR	¹⁹ F NMR; IR
FC1		508 ([M-H] ⁻)	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 7.83 (d, <i>J</i> = 8.2 Hz, 2H), 7.64 (d, <i>J</i> = 8.3 Hz, 2H), 7.43 (s, 2H), 6.48 (t, <i>J</i> = 6.5 Hz, 1H), 5.80 (dd, <i>J</i> = 32.7, 9.6 Hz, 1H), 4.60 (p, <i>J</i> = 8.9 Hz, 1H), 4.24 - 3.99 (m, 2H)	¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ -69.39 (d, <i>J</i> = 2.3 Hz), -72.24, -111.74 (d, <i>J</i> = 5.0 Hz)

Tabla 8. Estructura y Método de Preparación de Moléculas de la Serie PF

No.	Estructura	Prep.*
PF1		13
PF2		14

PF3		20
PF4		21

*preparado de acuerdo con el número de ejemplo

Tabla 9: Datos analíticos para Compuestos en la Tabla 8

No.	Mp (°C)	Masa (m/z)	^1H NMR	IR
PF1		558.40 ($[\text{M}+\text{H}]^+$)	^1H NMR (300 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ 9.35 (t, $J = 6.3$ Hz, 1H), 8.16 - 8.09 (m, 1H), 8.08 (s, 2H), 8.01 - 7.98 (m, 1H), 7.78 - 7.62 (m, 4H), 6.33 (dd, $J = 10.5, 34.2$ Hz, 1H), 5.36 - 5.29 (m, 1H), 4.22 - 4.13 (m, 2H)	IR (película delgada) 3291, 2927, 1657, 1163, 767 cm^{-1}

PF2	81-84	566.00 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.22 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 8.12 (s, 1H), 8.05 - 8.04 (m, 3H), 7.66 (d, <i>J</i> = 7.6 Hz, 1H), 6.85 (dd, <i>J</i> = 9.6, 35.6 Hz, 1H), 5.26 - 5.22 (m, 1H), 5.17 - 5.10 (m, 1H), 3.45 (t, <i>J</i> = 8.4 Hz, 2H), 3.30 (t, <i>J</i> = 8.4 Hz, 2H)	
PF3	164-165	582.98 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (300 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.20 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 8.18 - 8.04 (m, 4H), 7.71 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 1H), 6.88 (dd, <i>J</i> = 9.9, 35.4 Hz, 1H), 5.27 - 5.21 (m, 1H), 4.41 - 4.32 (m, 1H), 4.13 - 4.07 (m, 2H), 3.31 - 3.14 (m, 2H)	
PF4	111-113	596.00 ([M-H] ⁻)	¹ H NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.49 - 9.38 (m, 1H), 8.15 - 8.04 (m, 3H), 7.90 - 7.88 (m, 1H), 7.73 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H), 6.87 (dd, <i>J</i> = 10.4, 36.0 Hz, 1H), 5.28 - 5.22 (m, 1H), 4.67 - 4.60 (m, 2H), 4.54 - 4.48 (m, 1H), 4.18 - 4.13 (m, 2H)	

Tabla de Puntuación de BAW, CEW, & CL	
% de control (o mortalidad)	Puntuación
50-100	A
Mayor que 0 – Menor que 50	B
No analizado	C
No se observa actividad en este bioensayo	D

Tabla de Puntuación de GPA y YFM	
% de control (o mortalidad)	Puntuación
80-100	A
Mayor que 0 – Menor que 80	B
No analizado	C
No se observa actividad en este bioensayo	D

Tabla ABC: Resultados biológicos

No.	PEST			
	BAW	CL	GPA	YFM
F1	A	A	C	C
F2	A	A	C	C
F3	A	A	B	C
F4	A	A	C	C
F5	A	A	C	C
F6	A	A	C	C
F7	A	A	A	C
F8	A	A	C	C
F9	A	A	C	C

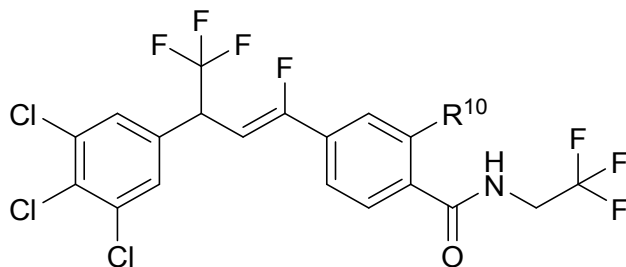
F10	A	A	C	C
F11	A	A	C	A
F12	A	A	C	A
F13	A	A	C	C
F14	A	A	C	C
F15	A	A	C	A
F16	A	A	C	A
F17	A	A	C	C
F18	A	A	C	C
F19	A	A	B	C
F20	A	A	C	C
F21	A	A	C	A
F22	A	A	C	A
F23	A	A	C	A
F24	A	A	C	A
F25	A	A	C	A
F26	A	A	C	A
F27	A	A	C	A
F28	A	A	C	A
F29	A	A	C	A
F30	A	A	C	A
F31	A	A	C	A
F32	A	A	C	A
F33	A	A	C	B
F34	A	A	C	B
F35	A	A	C	C

F36	A	A	C	C
F37	A	A	C	C
F38	A	A	C	C
F39	A	A	C	C
F40	A	A	C	A
F41	A	A	C	A
F42	A	A	C	A
F43	A	A	C	A
F44	A	A	C	A
F45	A	A	C	B
F46	A	A	C	A
F47	A	A	C	C
F51	A	A	C	A
F52	A	A	C	A
F61	A	A	C	C
F62	A	A	C	C
F63	A	A	C	C
PF1	A	A	C	A
PF2	A	A	C	C
PF3	A	A	C	C
PF4	A	A	C	C

DATOS COMPARATIVOS

Los bioensayos en BAW y CL se realizaron de acuerdo con los procedimientos descritos en el Ejemplo A: Los bioensayos en gusano soldado de la remolacha (“BAW”) y el gusano falso medidor de la col (“CL”) mediante el uso de las concentraciones indicadas. Los resultados se indican en la Tabla CD1.

Tabla CD1



No.	R ¹⁰	5 µg/cm ²		0.5 µg/cm ²	
		BAW	CL	BAW	CL
FC1	H	25*	100	0	6
F39	CH ₃	33	100	27	100
F1	CF ₃	100	100	100	100

*Por ciento de control (o mortalidad)