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

REFERENCIA CRUZADA A SOLICITUDES RELACIONADAS

Esta solicitud reivindica el beneficio de prioridad de las solicitudes de patente provisionales de Estados Unidos núms. 62/286684 y 62/286690 presentadas ambas el 25 de enero de 2016, cuyo contenido se incorpora en la presente descripción como referencia.

CAMPO DE LA INVENCIÓN

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, aracnicidas, molusquicidas y nematicidas.

ANTECEDENTES DE LA INVENCIÓN

“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, el tifus trasmitido por piojos, la tripanosomiasis, la leishmaniasis y otras enfermedades trasmitidas 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 trasmitidas por vectores son responsables de aproximadamente el 17 % de las enfermedades parasitarias e infecciosas globales. Solamente la malaria provoca más de 800,000 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).

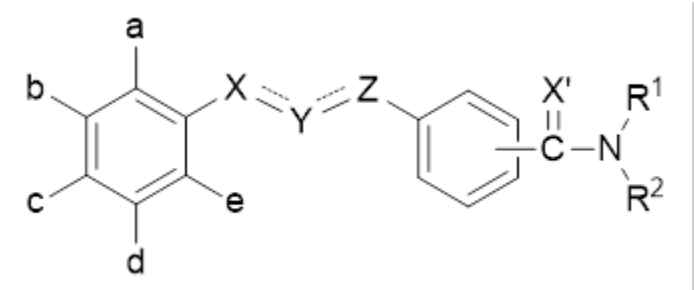
Los nemátodos parásitos de las plantas se encuentran entre las plagas más extendidas y frecuentemente son de las más insidiosas y costosas. Se ha estimado que las pérdidas atribuibles a los nemátodos son de aproximadamente 9 % en los países desarrollados a aproximadamente 15 % en los países subdesarrollados. 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 trasmitir 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.



ALGUNAS REFERENCIAS CITADAS EN LA INVENCIÓN

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

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 y Other Insect Vector Borne Diseases,** Cap. 1, pág. 1- 2011.

Nicol, J., Turner S., Coyne, L., den Nijs, L., Hocksland, 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: When is Insect Resistance a Problem?** *Public Library of Science Pathogens*, Vol. 6, núm. 8, págs. 1–9, 2010.

Speiser, B., Molluscicides, **Encyclopedia of Pest Management**, *Cap.* 219, págs. 506–508, 2002.

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

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, nematicidas, 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, afidopyropen, 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, ametoctradina, ametridiona, ametrina, ametrina, amibuzin, amicarbazona, amicartiazol, amidition, amidoflumet, amidosulfurón, aminocarb, aminociclopraclor, aminopiralid, aminotriazol, amiprofos-metilo, amiprofos, amiprofos-metilo, amisulbrom, amiton, amitraz, amitrol, sulfamato de amonio, amobam, gel de sílice amorfo, dióxido de silicio amorfo, ampropilfós, AMS, anabasina, ancimidol, anilazina, anilofos, anisuron, antraquinona, antio, apolola, aramita, arprocarb, óxido arsenioso, asomato, aspirina, asulam, athidathion, atraton, atrazina, aureofungina, avermectina B1, AVG, aviglicina, azaconazol, azadiractina, azafenidina, azametifos, azidition, azimsulfuron, azinfosetilo, azinfosetilo, azinfos metilo, azinfos metilo, aziprotrina, aziprotrina, azithiram, azobenceno, azociclotina, azotoato, azoxistrobina, bachmedesh, Barban, barbanato, hexafluorosilicato de bario, polisulfuro de bario, silicofluoruro de bario, bartrina, carbonato básico de cobre, cloruro de cobre básico, sulfato de cobre básico, CMPC, beflubutamida, benalaxil, benalaxil-M, benazolina, bencarbazona, benclotiaz,

bendaqingbingzhi, bendiocarb, bendióxido, benefina, benfluralina, benfuracarb, benfuresato, benmihuangcaoan, benodanil, benomil, benoxacor, benoxafos, benquinox, bensulfuron, bensulide, bensultap, bentaluron, bentazon, bentazona, bentiavalicarb, bentiazol, bentiocarb, bentranil, benzadox, cloruro de benzalkonio, benzamacril, benzamizol, benzamorf, hexacloruro de benceno, benzfendizona, benzimina, benzipram, benzobiciclón, benzoepina, benzofenap, benzofluor, ácido benzohidroxámico, benzomato, benzofosfato, benzotiadiazol, benzovindiflupir, benzoximato, benzoilprop, benztiazurón, benzuocaotong, benzoato de bencilo, benciladenina, berberina, ciflutrina *beta*, cipermetrina *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, bistriflurón, bisultap, bitercanol, bitionol, bixafen, blasticidin-S, bórax, mezcla de Burdeos, ácido bórico, boscalid, BPPS, brassinolida, brassinolida-etilo, brevicomina, 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, cliodinato, 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, oxicloruro de cobre, silicato de cobre, sulfato de cobre, sulfato de cobre básico, cromato de cobre y cobre, coumacloro, coumafeno, coumafurilo, coumafós, coumatetralilo, coumetoxistrobina, coumioato, coumoxistrobina, CPMC, CPMF, CPPC, credazina, cresol, ácido cresílico, crimidina, crotamiton, crotoxifos, crotoxifos, crufomato,

criolita, cuelure, cufraneb, cumileron, cumiluron, cuprobam, óxido cuproso, curcumenol, CVMP, cianamida, cianatrina, cianazina, cianofenfos, cianógeno, cianofos, ciantoato, ciantraniliprol, ácido cianúrico, ciazofamida, cibutrina, ciclafuramid, ciclanilida, ciclaniliprol, cicletrina, cicloato, cicloheximida, cicloprato, cicloprotrin, ciclopirimorato, ciclosulfamuron, cicloxidim, cicluron, cienopirafeno, ciflufenamida, ciflumetofeno, ciflutrina, cihalofop, cihalotrina, cihexatina, cimiazol, cimoxanil, ciometrinil, cipendazol, cipermetrina, ciperquat, cifenotrina, ciprazina, ciprazol, ciproconazol, ciprodinil, ciprofuram, cipromid, ciprosulfamida, ciromazina, citioato, citrex, daimon, dalapon, 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*-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, diclocimet, diclofop, diclomezina, dicloran, diclosulm, dicofol, dicofano, dicumarol, dicresilo, dicrotofos, dicrilo, dicumarol, diciclanilo, diciclocloclon, 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, 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, dipropalina, dipropetría, dípteros, dipimetitrona, dipiritiona, diquat, tetraborato de disodio, 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, 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, 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, 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, fenitrotion, fenizonto, fenjuntong, fenobucarb, fenolovo, fenoprop, fenotiocarb, fenoxacrim, fenoxanil, fenoxaprop, fenoxaprop-P, fenoxas ulfone, fenoxicarb, fenpiclonil, fenpiritrina, fenpropatrina, fenpropidin, fenpropimorf, fenpirazamina,

fenpiroximato, fenquinotriona, fenridazon, fenson, fensulfotion, fenteracol, fentiaprop, fentión, fention-etilo, fentiaprop, fentin, fentrazamida, fentrifanil, fenurón, fenurón-TCA, fenvalerato, ferbam, ferimona, fosfato férrico, sulfato ferroso, fipronil, flamprop, flamprop-M, flazasulfuron, flocoumafen, flometoquin, flonicamid, florasulam, fluacripirim, fluazifop, fluazifop-P, fluazinam, fluazolato, fluazurón, flubendiamida, flubenzimina, flubrocitinato, flucarbazona, flucetosulfuron, flucloralin, flucofuron, flucicloxuron, flucitinato, fludioxonil, fluenetilo, fluenetilo, fluensulfone, flufenacet, flufenerim, flufenican, flufenoxuron, flufenoxistrobina, flufenprox, flufenpir, 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, fluoronitrofeno, fluoroxipir, fluotiuron, fluotrimazol, fluoxastrobina, flupoxam, flupropacil, flupropadina, flupropanato, flupiradifurona, flupirsulfurón, fluquinconazol, fluralaner, flurazol, flurecol, flurenol, fluridona, flurocloridona, fluromidina, fluroxipir, flurprimidol, flursulamida, flurtamona, flusilazol, flusulfamida, flutenzina, flutiacet, flutiamida, flutianilo, flutolanil, flutriafol, fluvalinato, fluxapiroxad, fluxofenim, folpel, folpet, fomesafen, fonofos, foramsulfurón, forclorfenurón, formaldehído, formetanato, formotión, formparanate, fosamina, fosetilo, fosmetilan, fospirato, fostiazato, fostietan, 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, glifosato, glifosina, gossiplur, grandlur, griseofulvin, guanoctina, 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, hidroxiisoxazol, himexazol, hiquincarb, IAA, IBA, IBP, icaridina, imazalpina, 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, IPX, isamidofos, isazofos, isobenzan, isocarbamida, isocarbamida, isocarbofos, isocilo, isodrina, isofenfos, isofenfos-metilo, isofetamida, isolan, isometiozina, isonoruron, esopamfos, isopolinato, isoprocarb, isoprocil, isopropalina, isopropazol, isoprotiolano, isoproturon, isopirazam, isopirimol, isotioato, isotianil, isouron, isovalediona, isoxaben, isoxaclortol, isoxadifen, isoxaflutol, isoxapirifop, isoxation, isuron, ivermectina, ixoxaben, izopamfos, izopamphos, japonilur, japotrins, 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 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, matrina, mazidox, MCC, MCP, MCPA, MCPA-tioetilo, MCPB, MCPP, mebenil, mecarbam, 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, metasulfocarb, metazol, metfuroxam, metibenzuron, metidation, metiobencarb, metiocarb, metiopirisulfuron, meti-scopa, metiozolin, metiuron, metocrotofos, metohetrol, metometon, metomil, metopreno, metoprotrina, metoprotrina, metoquin-butilo, metotrina, metoxicloro, metoxifenozida, metoxifenona, metil afolato, bromuro de metilo, metil eugenol, yoduro de metilo, isotiocianato de metilo, metil paration, metilacetofos, metilcloroformo, ácido metilditiocarbámico, metildimron, cloruro de metileno, metil-isofenfos, metilmercaptofos, óxido de metilmercaptofos, metilmercaptofos tiol, benzoato de metilmercurio, metilmercurio diciandiamida, metilmercurio pentaclorofenóxido, metilneodecanamida, metilnitrofos, metiltriazotion, metiozolin, metiram, metiram-zinc, metobenzuron, metobromuron, metoflutrina, metolaclor, metolcarb, metometuron, metominostrobina, metosulam, 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, 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,

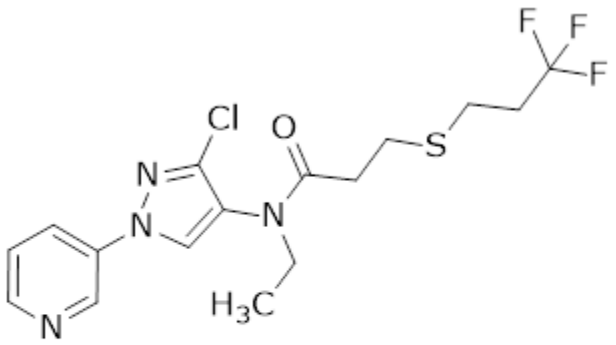
napropamida-M, naptalam, natamicina, NBPOS, neburea, neburon, nendrina, neonicotina, niclorfos, niclofen, niclosamida, nicobifen, nicosulfuron, nicotina, sulfato de nicotina, nifluridida, nikkomicinas, NIP, nipir aclofeno, nipiralofen, nitenpiram, nitiazina, nitralina, nitrapirina, nitrilacarb, nitrofen, nitrofluorfen, nitroestireno, nitrotal-isopropilo, nobormide, nonanol, norbormide, norea, norflurazon, nornicotina, 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, ostramona, ovatron, Ovex, oxabetrinilo, oxadiargilo, oxadiazon, oxadixilo, oxamato, oxamil, oxapirazon, oxapirazona, oxasulfuron, oxatiapiprolina, oxaziclomefona, oxina-cobre, oxina-Cu, ácido oxolínico, oxpoconazol, oxicarboxina, oxidemeton-metilo, oxideprofos, oxidisulfoton, oxienadenina, oxifluorfen, oximatrina, oxitetraciclina, oxitioquinox, 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, penciclórico, pendiftalínico, penfenato, penfluorfeno, 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, 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, phthhalthrin, picarbutrazox, picaridin, picloram, picolinafen, picoxistrobina, pimaricina, pindona, pinoxaden, 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, tiocianato de potasio, pp'-DDT, praletrina, 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, protidatión, protiocarb, protioconazol, protofos, prothoato, protrifenbuto, proxan, primidofos, prinaclor, psoralen, psoraleno, pidanon, piflubumida, pimetrozina, piracarbolid, piraclofos, piraclonil, piraclostrobina, piraflufen, pirafluprol, piramat, pirametostrobina, piraoxistrobina, pirosulfotol, 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, 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, quinconazol, quinmerac, quinoclamina, quinometionato, quinonamid, quinotion, 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-bioaletrina, scradan, scillirosida, sebutilazina, secbumeton, 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, 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, tavron, tazimcarb, TBTO, TBZ, TCA, TCBA, TCMTB, TCNB, TDE, tebuconazol, 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, tetrafluron, tetrametilrin, tetrametilflutrin, tetramina, tetranactin, tetraniliprol, tetrapion, tetrasul, sulfato de talio, sulfato de talio, tenilclor, *theta*-cipermetrina, tiabendazol, tiacloprid, tiadiazina, tiadifluor, tiametoxam, tiameturon, tiapronil, Tiazafluron, tiazfluron, tiazona, tiazopir, ticrofos, ticiofeno, tidiazimina, tidiazurón, tiencarbazona, tifensulfurón, tifluzamida, timerosal, timet, tiobencarb, tiocarboxima, tioclorfenfim, tioclorfenfime, tiocianatodinitrobencenos, 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, tolilfluanida, acetato de tolilmercurio, tomarina, topramezona, toxafeno, TPN, tralcoxidim, tralocitrina, tralometrina, 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, tricamba, triclamida, tricloro, triclorfon, triclormetafos-3, tricloronat, tricloronato, triclorotrinitrobencenos, 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, tritialan, 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, zuoanjunzhi, zuocaoan, zuojunzhi, zuomihuanglong, α-clorohidrina, α-ecdisona, α-multistriatina, α- naftalenoacéticos, y β-ecdisona;

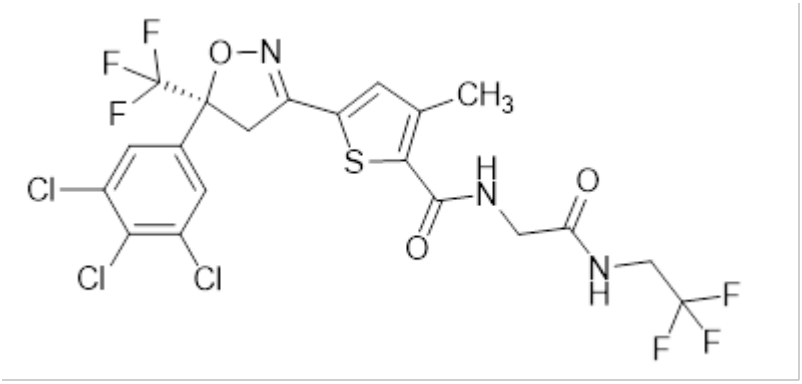
(2) la siguiente molécula



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

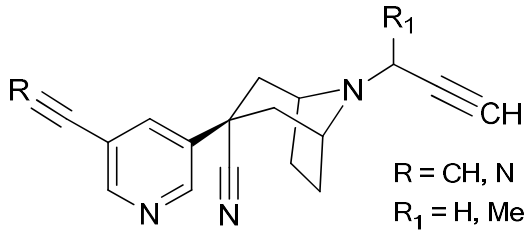
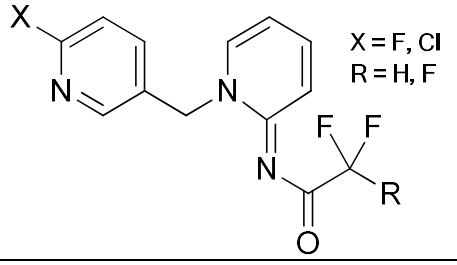
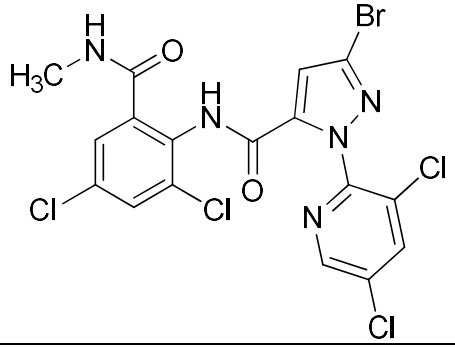
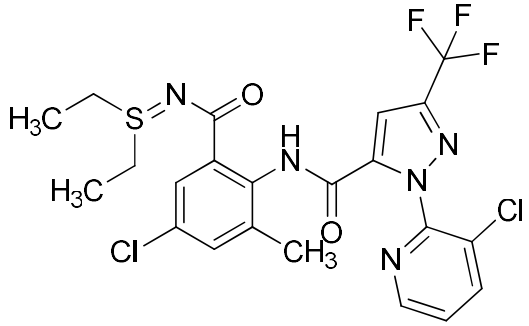
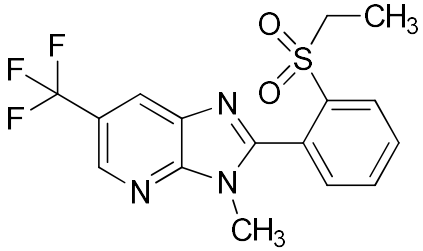
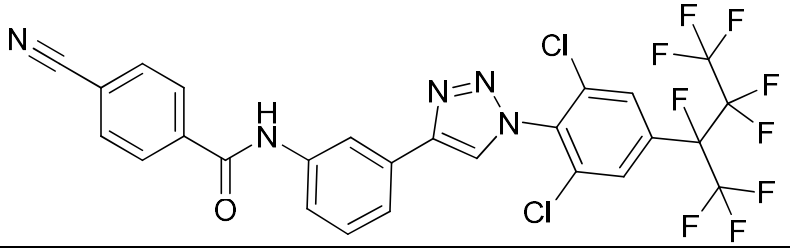


; y

(4) las siguientes moléculas en la Tabla A

Tabla A. Estructura de ingredientes activos – M

Nombre	**Estructura**

M1	
M2	
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.

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 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, 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, 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 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 fluoro, 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.

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.

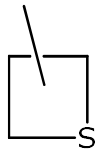
El término “**heterociclilo**” significa un sustituyente cíclico que puede ser aromático, completamente saturado, o parcialmente o completamente insaturado, donde la estructura cíclica contiene al menos un carbono y al menos un heteroátomo, donde dicho heteroátomo es nitrógeno, azufre, u oxígeno. Los 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, oxadiazolilo, oxazolinilo, oxazolilo, ftalazinilo, pirazinilo, pirazolinilo, pirazolilo, piridazinilo, piridilo, pirimidinilo, pirrolilo, quinazolinilo, quinolinilo, quinoxalinilo, tetrazolilo, tiazolinilo, tiazolilo, tienilo, triazinilo y triazolilo;

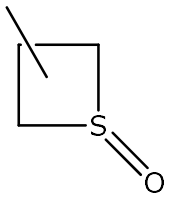
(2) sustituyentes heterociclilo completamente saturados incluyen, sin limitarse a, piperazinilo, piperidinilo, morfolinilo, pirrolidinilo, tetrahidrofuranilo, y tetrahidropiranilo;

(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

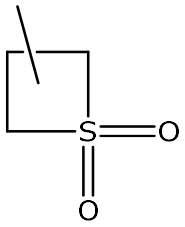
(4) Ejemplos adicionales de heterociclos incluyen los siguientes:



tietanilo



tietanilo–óxido y



tietanilo–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;

(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 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, 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-metilo, diafentiurón, diazinon, diclorvos/DDVP, dicrotofos, diflovidazin, diflubenzurón, dimetoato, dimetilvinfos, dinotefurano, disulfotonsulfona, DNOC, *d-trans*-aletrina, benzoato de emamectina, empentrina, endosulfán, EPN, esfenvalerato, etiofencarb, etión, etoprofos, etofenprox, etoxazol, famfur, fenamifos, fenazaquin, óxido de fenbutatin, fenitrotion, fenobucarb, fenoxicarb, fenpropatrin, fenpiroximato, fention, fenvalerato, flonicamid, 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, metoxifenozida, metilbromuro, metolcarb, mevinfos, milbemectina, monocrotofos, naled, nicotina, nitenpiram, novalurón, noviflumurón, oxamilo, oxidemetón-metilo, paratión, paratión-metilo, permetrina, fenotrina, fentoato, forato, fosalona, fosmet, fosfamidon, fosfina, foxim, pirimicarb, pirimifos-metilo, praletrina, profenofos, propargita, propetamfos, propoxur, protiofos, pimetrozina, piraclofos, piretrina, piridaben, piridafention, pirimidifeno, piriproxifen, quinalfos, resmetrina, rotenona, silafluofeno, spinetoram, spinosad, spirodiclofen, spiromesifen, spirotetramat, sulfluramid, sulfotep, sulfoxaflor, fluoruro de sulfurilo, tártaro emético, *tau*-fluvalinato, tebufenozida, tebufenpirad, tebupirimfos, teflubenzurón, teflutrina, temefós, 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.

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, 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, *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 joliveti, 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 obliqa, Bactrocera cucurbitae*, *Bactrocera dorsalis*, *Bactrocera invadens, Bactrocera zonata, Ceratitis capitata*, *Dasineura brassicae*, *Delia platura*, *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 sin limitarse a, *Acrosternum hilare*, *Acyrthosiphon 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*, *Brevennia rehi, Brevicoryne brassicae*, *Calocoris norvegicus*, *Ceroplastes rubens*, *Cimex hemipterus*, *Cimex lectularius*, *Dagbertus fasciatus*, *Dichelops furcatus, Diuraphis noxia, Diaphorina citri, Dysaphis plantaginea*, *Dysdercus suturellus*, *Edessa meditabunda, 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*, *Pilloxera vitifoliae*, *Physokermes piceae*, *Phytocoris californicus, Phytocoris relativus, Piezodorus guildinii, Poecilocapsus lineatus*, *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 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 richtery, 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., *Kalotermes* spp., *Incisitermes* spp.*, Macrotermes* spp., *Marginitermes* spp., *Microcerotermes* spp., *Procornitermes* spp.*, Reticulitermes* spp., *Schedorhinotermes* spp.*,* y *Zootermopsis* spp. Una lista no exhaustiva 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 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 sin limitarse 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*, *Heliothis 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*, *Schistocerca gregaria,* y *Scudderia 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 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 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, *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, *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 perseaflorae, Tetranychus urticae*, y *Varroa destructor*.

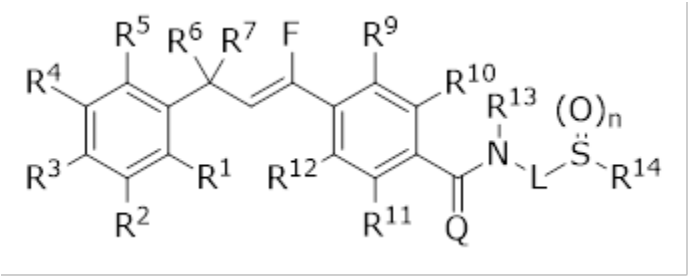
(19) Orden Symphyla. Una lista no exhaustiva de especies particulares incluye, pero sin limitarse a, *Scutigerella immaculata*.

(20) Filo Nematoda. Una lista no exhaustiva de géneros particulares incluye, pero sin limitarse a, *Aphelenchoides* spp., *Belonolaimus* spp., *Criconemella* 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 zeae, 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 a aproximadamente 5000 gramos por hectárea, preferentemente de aproximadamente 0.0001 gramos por hectárea a aproximadamente 500 gramos por hectárea e incluso con mayor preferencia de aproximadamente 0.0001 gramos por hectárea a aproximadamente 50 gramos por hectárea.

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}**, **R^{12}**, y **R^{13}** se seleccionan cada uno independientemente del grupo que consiste en H, F, Cl, Br, I, CN, $(C_1\text{-}C_4)$alquilo, $(C_1\text{-}C_4)$haloalquilo, $(C_1\text{-}C_4)$alcoxi, y $(C_1\text{-}C_4)$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, $(C_1\text{-}C_4)$alquilo, $(C_2\text{-}C_4)$alquenilo, $(C_2\text{-}C_4)$alquinilo, $(C_1\text{-}C_4)$haloalquilo, $(C_1\text{-}C_4)$alcoxi, y $(C_1\text{-}C_4)$haloalcoxi;

(C) **R^7** es $(C_1\text{-}C_6)$haloalquilo;

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

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

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

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

(G) **Q** se selecciona del grupo que consiste en O o S;

(H) **L** es $(C_1\text{-}C_6)$alquilo;

(I) **n** es 0, 1, o 2;

(J) $\mathbf{R^{14}}$ se selecciona del grupo que consiste en $(C_1\text{-}C_4)$alquilo, $(C_2\text{-}C_4)$alquenilo, $(C_3\text{-}C_4)$cicloalquilo, $(C_1\text{-}C_4)$haloalquilo, $(C_1\text{-}C_4)$alcoxi, $(C_1\text{-}C_4)$haloalcoxi, y fenilo,

en donde cada alquilo, alquenilo, cicloalquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, y fenilo puede sustituirse opcionalmente con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, CN y OH; 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 $\mathbf{R^1}$, $\mathbf{R^3}$, $\mathbf{R^4}$, $\mathbf{R^5}$, $\mathbf{R^6}$, $\mathbf{R^9}$, $\mathbf{R^{11}}$, $\mathbf{R^{12}}$, y $\mathbf{R^{13}}$, son H. Esta modalidad puede usarse en combinación con las otras modalidades de $\mathbf{R^2}$, $\mathbf{R^7}$, $\mathbf{R^{10}}$, **Q**, **L**, **n**, y $\mathbf{R^{14}}$.

En otra modalidad $\mathbf{R^2}$ es Cl, Br, o CH_3. Esta modalidad puede usarse en combinación con las otras modalidades de $\mathbf{R^1}$, $\mathbf{R^3}$, $\mathbf{R^4}$, $\mathbf{R^5}$, $\mathbf{R^6}$, $\mathbf{R^7}$, $\mathbf{R^9}$, $\mathbf{R^{10}}$, $\mathbf{R^{11}}$, $\mathbf{R^{12}}$, **Q**, $\mathbf{R^{13}}$, **L**, **n**, y $\mathbf{R^{14}}$.

En otra modalidad $\mathbf{R^3}$ es F, Cl, Br, o $CH{=}CH_2$. Esta modalidad puede usarse en combinación con las otras modalidades de $\mathbf{R^1}$, $\mathbf{R^2}$, $\mathbf{R^4}$, $\mathbf{R^5}$, $\mathbf{R^6}$, $\mathbf{R^7}$, $\mathbf{R^9}$, $\mathbf{R^{10}}$, $\mathbf{R^{11}}$, $\mathbf{R^{12}}$, **Q**, $\mathbf{R^{13}}$, **L**, **n**, y $\mathbf{R^{14}}$.

En otra modalidad $\mathbf{R^4}$ es Cl, Br, o CH_3. Esta modalidad puede usarse en combinación con las otras modalidades de $\mathbf{R^1}$, $\mathbf{R^2}$, $\mathbf{R^3}$, $\mathbf{R^5}$, $\mathbf{R^6}$, $\mathbf{R^7}$, $\mathbf{R^9}$, $\mathbf{R^{10}}$, $\mathbf{R^{11}}$, $\mathbf{R^{12}}$, **Q**, $\mathbf{R^{13}}$, **L**, **n**, y $\mathbf{R^{14}}$.

En otra modalidad $\mathbf{R^2}$, $\mathbf{R^3}$, y $\mathbf{R^4}$ son Cl. Esta modalidad puede usarse en combinación con las otras modalidades de $\mathbf{R^1}$, $\mathbf{R^5}$, $\mathbf{R^6}$, $\mathbf{R^7}$, $\mathbf{R^9}$, $\mathbf{R^{10}}$, $\mathbf{R^{11}}$, $\mathbf{R^{12}}$, **Q**, $\mathbf{R^{13}}$, **L**, **n**, y $\mathbf{R^{14}}$.

En otra modalidad $\mathbf{R^7}$ es $(C_1\text{-}C_6)$haloalquilo. Esta modalidad puede usarse en combinación con las otras modalidades de $\mathbf{R^1}$, $\mathbf{R^2}$, $\mathbf{R^3}$, $\mathbf{R^4}$, $\mathbf{R^5}$, $\mathbf{R^6}$, $\mathbf{R^9}$, $\mathbf{R^{10}}$, $\mathbf{R^{11}}$, $\mathbf{R^{12}}$, **Q**, $\mathbf{R^{13}}$, **L**, **n**, y $\mathbf{R^{14}}$.

En otra modalidad $\mathbf{R^7}$ es CF_3 o CF_2CH_3. Esta modalidad puede usarse en combinación con las otras modalidades de $\mathbf{R^1}$, $\mathbf{R^2}$, $\mathbf{R^3}$, $\mathbf{R^4}$, $\mathbf{R^5}$, $\mathbf{R^6}$, $\mathbf{R^9}$, $\mathbf{R^{10}}$, $\mathbf{R^{11}}$, $\mathbf{R^{12}}$, **Q**, $\mathbf{R^{13}}$, **L**, **n**, y $\mathbf{R^{14}}$.

En otra modalidad $\mathbf{R^{10}}$ es Cl, Br, CH_3, o CF_3. Esta modalidad puede usarse en combinación con las otras modalidades de $\mathbf{R^1}$, $\mathbf{R^2}$, $\mathbf{R^3}$, $\mathbf{R^4}$, $\mathbf{R^5}$, $\mathbf{R^6}$, $\mathbf{R^7}$, $\mathbf{R^9}$, $\mathbf{R^{11}}$, $\mathbf{R^{12}}$, **Q**, $\mathbf{R^{13}}$, **L**, **n**, y $\mathbf{R^{14}}$.

En otra modalidad **Q** es O. Esta modalidad puede usarse en combinación con las otras modalidades de $\mathbf{R^1}$, $\mathbf{R^2}$, $\mathbf{R^3}$, $\mathbf{R^4}$, $\mathbf{R^5}$, $\mathbf{R^6}$, $\mathbf{R^7}$, $\mathbf{R^9}$, $\mathbf{R^{10}}$, $\mathbf{R^{11}}$, $\mathbf{R^{12}}$, $\mathbf{R^{13}}$, **L**, **n**, y $\mathbf{R^{14}}$.

En otra modalidad **L** es CH_2CH_2 o $CH(CH_3)CH_2$. Esta modalidad puede usarse en combinación con las otras modalidades de $\mathbf{R^1}$, $\mathbf{R^2}$, $\mathbf{R^3}$, $\mathbf{R^4}$, $\mathbf{R^5}$, $\mathbf{R^6}$, $\mathbf{R^7}$, $\mathbf{R^9}$, $\mathbf{R^{10}}$, $\mathbf{R^{11}}$, $\mathbf{R^{12}}$, **Q**, $\mathbf{R^{13}}$, **n**, y $\mathbf{R^{14}}$.

En otra modalidad **n** es 0, 1, o 2. Esta modalidad puede usarse en combinación con las otras modalidades de $\mathbf{R^1}$, $\mathbf{R^2}$, $\mathbf{R^3}$, $\mathbf{R^4}$, $\mathbf{R^5}$, $\mathbf{R^6}$, $\mathbf{R^7}$, $\mathbf{R^9}$, $\mathbf{R^{10}}$, $\mathbf{R^{11}}$, $\mathbf{R^{12}}$, **Q**, $\mathbf{R^{13}}$, **L**, y $\mathbf{R^{14}}$.

En otra modalidad $\mathbf{R^{14}}$ es CH_2CH_3 o CH_2CF_3. Esta modalidad puede usarse en combinación con las otras modalidades de $\mathbf{R^1}$, $\mathbf{R^2}$, $\mathbf{R^3}$, $\mathbf{R^4}$, $\mathbf{R^5}$, $\mathbf{R^6}$, $\mathbf{R^7}$, $\mathbf{R^9}$, $\mathbf{R^{10}}$, $\mathbf{R^{11}}$, $\mathbf{R^{12}}$, **Q**, $\mathbf{R^{13}}$, **L**, y **n**.

En otra modalidad:

(A) $\mathbf{R^1}$, $\mathbf{R^5}$, $\mathbf{R^6}$, $\mathbf{R^{11}}$, $\mathbf{R^{12}}$, y $\mathbf{R^{13}}$ son H;

(B) $\mathbf{R^2}$, $\mathbf{R^3}$, y $\mathbf{R^4}$ se seleccionan cada uno independientemente del grupo que consiste en H, F, Cl, Br, $(C_1\text{-}C_4)$alquilo, y $(C_2\text{-}C_4)$alquenilo;

(C) $\mathbf{R^7}$ es $(C_1\text{-}C_6)$haloalquilo;

(D) $\mathbf{R^9}$ es H;

(E) $\mathbf{R^{10}}$ se selecciona del grupo que consiste en Cl, Br, $(C_1\text{-}C_4)$alquilo, y $(C_1\text{-}C_4)$haloalquilo;

(G) **Q** es O;

(H) **L** es $(C_1\text{-}C_6)$alquilo;

(I) **n** es 0, 1, o 2;

(J) $\mathbf{R^{14}}$ se selecciona del grupo que consiste en $(C_1\text{-}C_4)$alquilo y $(C_1\text{-}C_4)$haloalquilo,

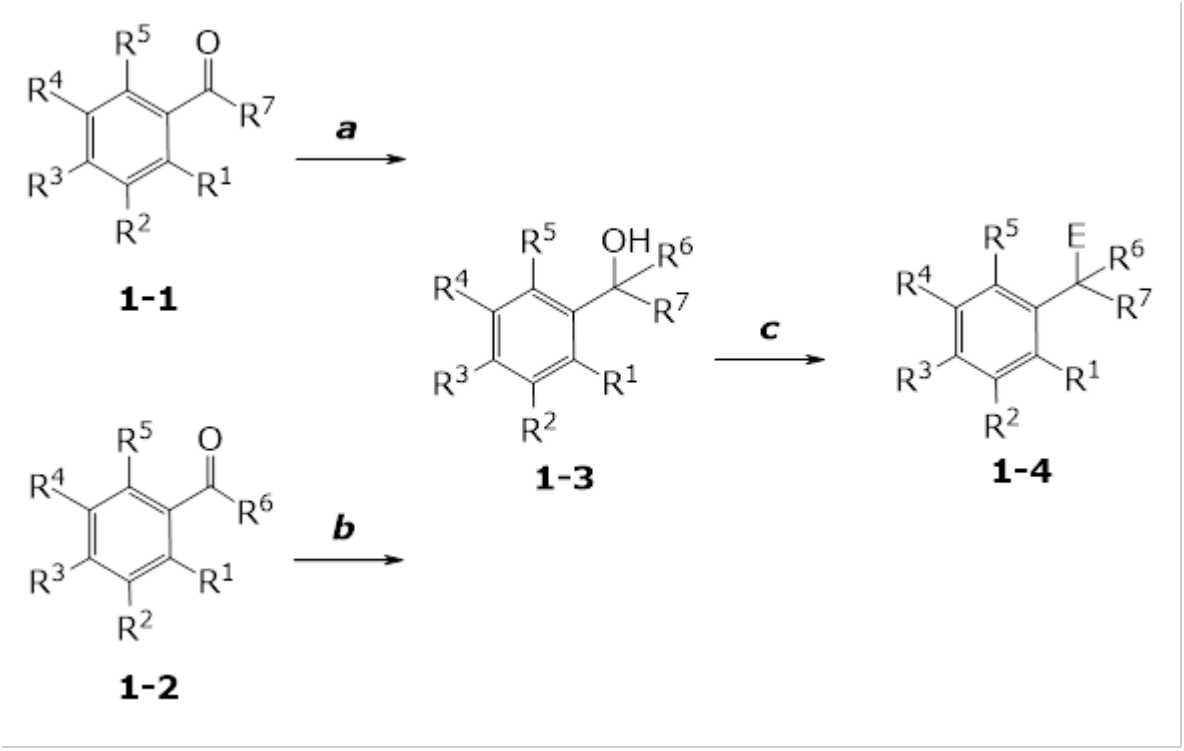
en donde cada alquilo o haloalquilo puede sustituirse opcionalmente con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, CN y OH.

PREPARACIÓN DE HALUROS DE BENCILO

El alcohol de bencilo **1-3**, en donde $\mathbf{R^1}$, $\mathbf{R^2}$, $\mathbf{R^3}$, $\mathbf{R^4}$, $\mathbf{R^5}$, $\mathbf{R^6}$, y $\mathbf{R^7}$ 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 solvente aprótico polar preferentemente éter dietílico a temperaturas de aproximadamente −78 °C a aproximadamente 0 °C seguido del tratamiento con ésteres $\mathbf{R^7}C(O)O(C_1\text{-}C_4)$alquilo, en

donde $\mathbf{R^7}$ es como se describió anteriormente, tal como 2,2-difluoropropanoato de etilo (no mostrado). El tratamiento de cetonas **1-1**, en donde $\mathbf{R^1}$, $\mathbf{R^2}$, $\mathbf{R^3}$, $\mathbf{R^4}$, $\mathbf{R^5}$, y $\mathbf{R^7}$ son como se describió anteriormente, con un agente reductor tal como borohidruro de sodio, en presencia de una base, tal como hidróxido de sodio acuoso, en un solvente prótico polar preferentemente metanol a aproximadamente −10 °C a aproximadamente 10 °C puede proporcionar alcoholes de bencilo **1-3** (Esquema 1, etapa ***a***). Alternativamente, los aldehídos **1-2**, en donde $\mathbf{R^6}$ es H y $\mathbf{R^1}$, $\mathbf{R^2}$, $\mathbf{R^3}$, $\mathbf{R^4}$, y $\mathbf{R^5}$ son como se describió anteriormente, pueden dejarse reaccionar con trifluorotrimetilsilano en presencia de una cantidad catalítica de fluoruro de tetrabutilamonio en un solvente aprótico polar preferentemente tetrahidrofurano (Esquema 1, etapa ***b***) para proporcionar alcoholes de bencilo **1-3**, en donde $\mathbf{R^7}$ 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 $\mathbf{R^1}$, $\mathbf{R^2}$, $\mathbf{R^3}$, $\mathbf{R^4}$, $\mathbf{R^5}$, $\mathbf{R^6}$, y $\mathbf{R^7}$ 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 los reactivos preferentemente diclorometano a aproximadamente 40 °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 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 n solvente de hidrocarburo tal como tolueno a aproximadamente 110 °C puede proporcionar haluros de bencilo **1-4**, donde **E** es Cl (Esquema 1, etapa ***c***).

Esquema 1

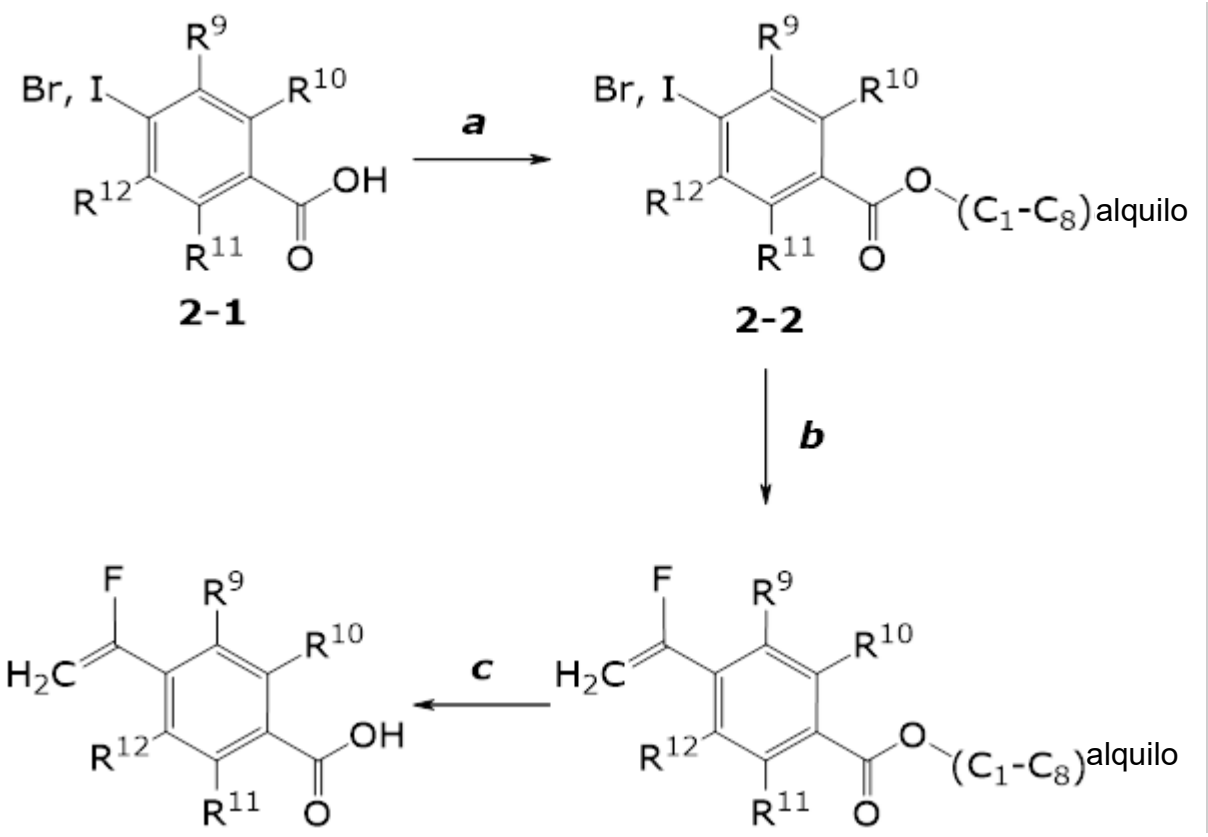


PREPARACIÓN DE ÉSTERES Y ÁCIDOS VINILBENZOICOS FLUORADOS

Los ácidos halobenzoicos **2-1**, en donde **R^9**, **R^{10}**, **R^{11}**, y **R^{12}** son como se describió anteriormente 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 sinalo de vinilo fluorado en 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 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***).

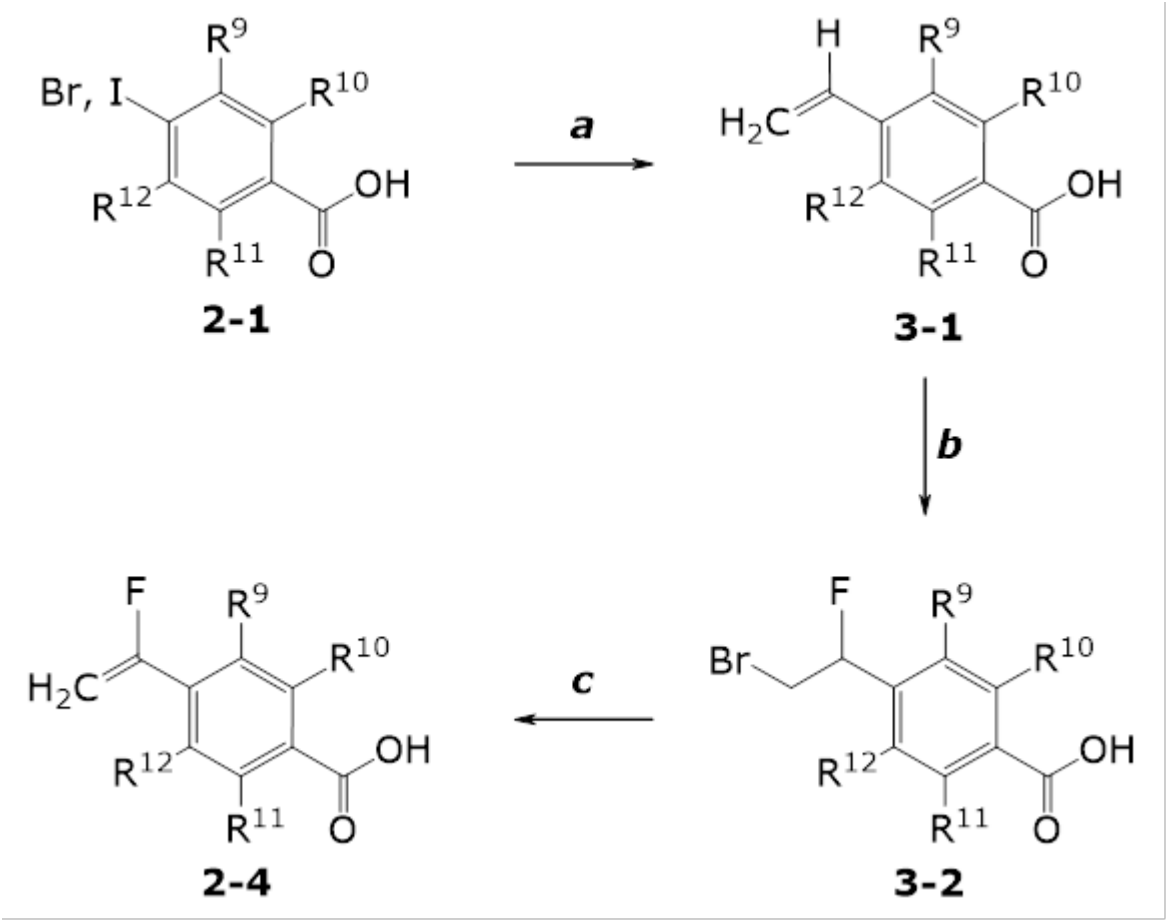
Esquema 2



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 aproximadamente 80 °C a aproximadamente 140 °C, para proporcionar ácidos vinilbenzoicos **3-1**, en donde $\mathbf{R^9}$, $\mathbf{R^{10}}$, $\mathbf{R^{11}}$, y $\mathbf{R^{12}}$ 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 proporcionar ácidos benzoicos de bromofluoroalquilo **3-2**, en donde **R^9**, **R^{10}**, **R^{11}**, y **R^{12}** son como se describió anteriormente (Esquema 3, etapa ***b***). Los ácidos benzoicos de bromofluoroalquilo **3-2** pueden tratarse con una base tal como *terc*-butóxido 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***).

Esquema 3

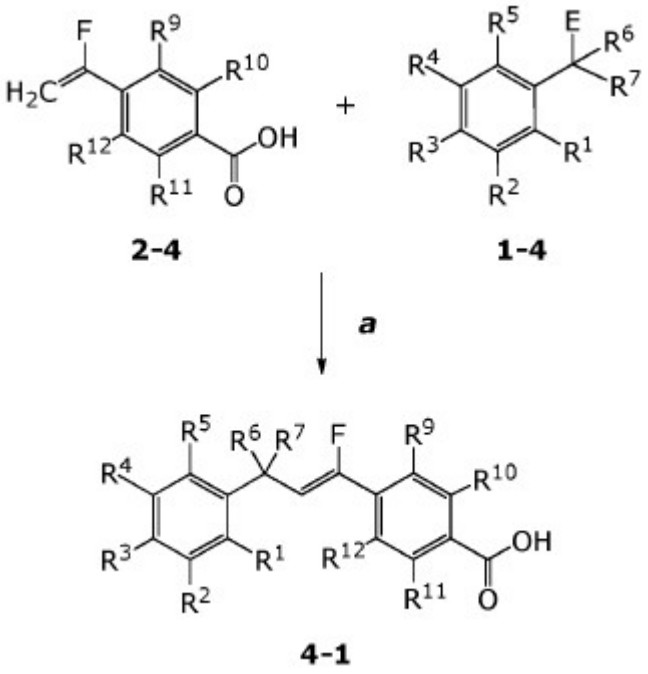


PREPARACIÓN DE ÁCIDOS FENIL ALILBENZOICOS FLUORADOS

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 $\mathbf{R^1}$, $\mathbf{R^2}$, $\mathbf{R^3}$, $\mathbf{R^4}$, $\mathbf{R^5}$, $\mathbf{R^6}$, $\mathbf{R^7}$, $\mathbf{R^9}$, $\mathbf{R^{10}}$, $\mathbf{R^{11}}$, y $\mathbf{R^{12}}$ son como se describió anteriormente (Esquema 4, etapa ***a***).

Esquema 4



PREPARACIÓN DE FENIL ALILBENZAMIDAS

Las fenil alibenzamidas **5-3**, en donde $\mathbf{R^1}$, $\mathbf{R^2}$, $\mathbf{R^3}$, $\mathbf{R^4}$, $\mathbf{R^5}$, $\mathbf{R^6}$, $\mathbf{R^7}$, $\mathbf{R^9}$, $\mathbf{R^{10}}$, $\mathbf{R^{11}}$, $\mathbf{R^{12}}$, $\mathbf{R^{13}}$, **L**, **n**, y $\mathbf{R^{14}}$ son como se describió anteriormente, pueden prepararse mediante el tratamiento con aminas o sales de amina **5-2**, en donde $\mathbf{R^{13}}$, **L**, **n**, y $\mathbf{R^{14}}$ son como se describió anteriormente, y ácidos carboxílicos activados **5-1**, en donde **A** es un grupo de activación, y $\mathbf{R^1}$, $\mathbf{R^2}$, $\mathbf{R^3}$, $\mathbf{R^4}$, $\mathbf{R^5}$, $\mathbf{R^6}$, $\mathbf{R^7}$, $\mathbf{R^9}$, $\mathbf{R^{10}}$, $\mathbf{R^{11}}$, y $\mathbf{R^{12}}$ 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*-dimetilformamida, o cualquier combinación de estos, a temperaturas entre aproximadamente 0 °C y aproximadamente 120 °C (Esquema 5, etapa ***a***).

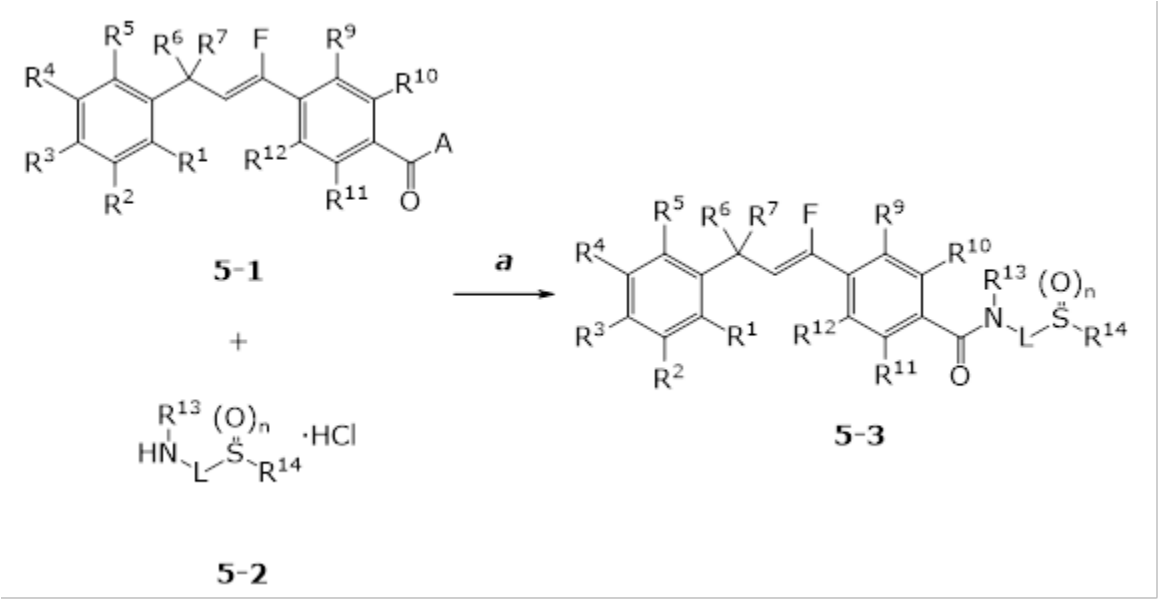
Los ácidos carboxílicos activados **5-1** pueden ser un haluro ácido, tal como un cloruro ácido, un bromuro ácido, o un fluoruro ácido; un éster carboxílico, tal como un *para*-nitrofenil éster, un

pentafluorofenil éster, un etil (hidroxiiminio)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; un *O*-acilisourea; un anhidruro 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]-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-oxoetilidenaminooxi)dimetilamino-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 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, o diciclohexilcarbodiimida en presencia de un triazol tal como hidroxibenzotriazol·monohidrato (HOBt) o 1-hidroxi-7-azabenzotriazol (HOAt). *Las O*-acilisoureas pueden prepararse con una carbodimida deshidratante tal como 1-(3-dimetilamino propil)-3-etilcarbodiimida o diciclohexilcarbodiimida. Los ácidos carboxílicos activados **5-1** pueden prepararse además a partir de ácidos carboxílicos *in situ* con un reactivo de acoplamiento tal como 2-cloro-1,3-dimetil imidazolidinio hexafluorofosfato (CIP) en presencia de un triazol tal como 1-hidroxi-7-azabenzotriazol (HOAt).

Las fenil alilbenzamidas **5-3**, en donde **n** es 0 (sulfuro), pueden oxidarse al sulfóxido correspondiente, en donde **n** es 1, o sulfona, en donde **n** es 2, mediante el tratamiento con un equivalente de perborato de sodio en un solvente prótico tal como ácido acético (sulfóxido) o dos equivalentes de perborato de sodio (sulfona). Preferentemente, la oxidación se llevará a cabo a temperaturas entre aproximadamente 40 °C a aproximadamente 100 °C con el uso de

1.5 equivalentes de perborato de sodio para proporcionar mezclas separables por cromatografía de sulfóxido y sulfona ciclopropil amidas y alilbenzamidas de sulfona difenilo**5-3**.

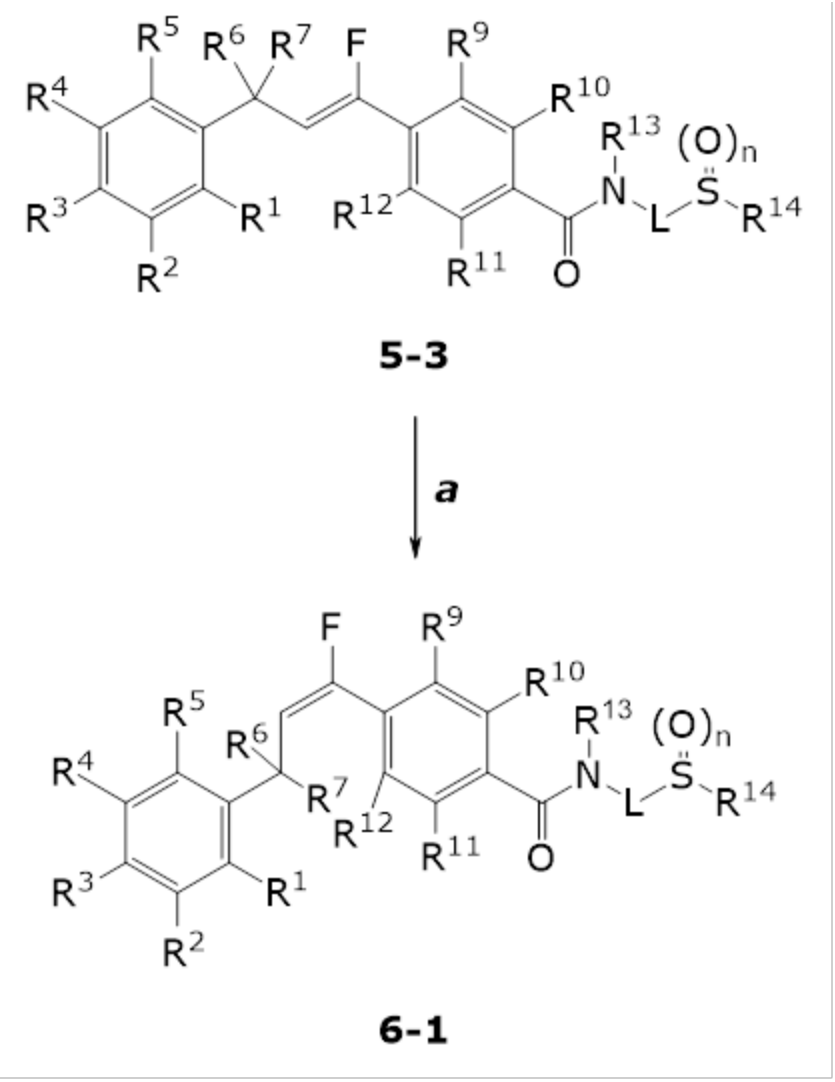
Esquema 5



Alternativamente, las fenil alilbenzamidas **5-3**, en donde **n** es 0 (sulfuro), pueden oxidarse al sulfóxido correspondiente mediante el tratamiento con peróxido de hidrógeno en un solvente prótico tal como metanol o preferentemente hexafluoroisopropanol. Preferentemente, la oxidación se realizará a temperaturas entre aproximadamente 10 °C a aproximadamente 100 °C.

Las sales de amina **5-2** pueden generarse *in situ* a partir de las aminas de *N-terc*-butoxicarbonilo mediante el tratamiento con un ácido tal como cloruro de hidrógeno. Además, las sales de amina **5-2** pueden estar libres de base *in situ* en presencia de una base tal como bicarbonato de sodio, trietilamina, o 4-metilmorfolina durante la reacción con ácidos carboxílicos activados **5-1** para proporcionar amidas de fenil alilbenzoico **5-3**.

Esquema 6



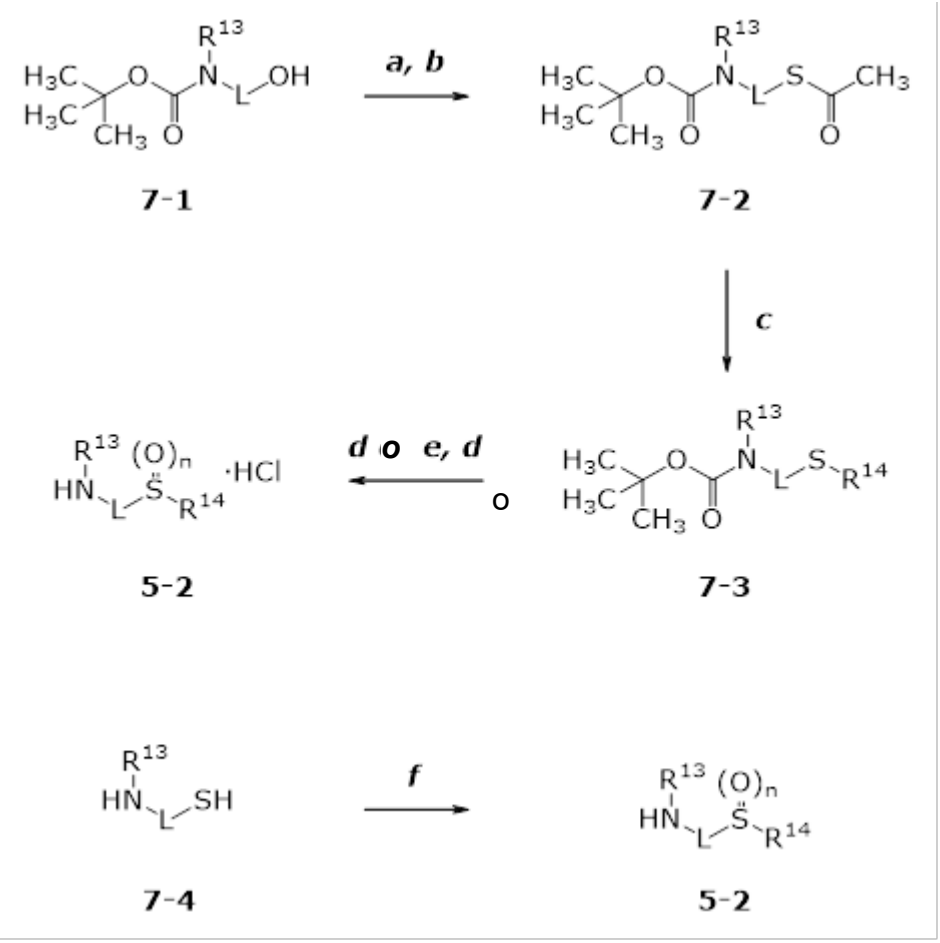
Las fenil alilbenzamidas **5-3** pueden exponerse a radiación ultravioleta en un solvente deuterado o no deuterado tal como acetone para proporcionar fenil alilbenzamidas **6-1** (Esquema 6, etapa ***a***).

PREPARACIÓN DE AMINAS Y SALES DE AMINAS

Las aminas y sales de aminas **5-2** pueden prepararse como se explicó en el Esquema 7. *Los* aminoalcoholes *de N-terc*-Butoxicarbonilo **7-1**, en donde $\mathbf{R^{13}}$ y **L** son como se describió anteriormente, pueden tratarse con un cloruro de sulfonilo tal como cloruro de metansulfonilo o un sulfonilo anhídrido tal como metanosulfonil anhídrido en presencia de una base tal como trietilamina en un solvente tal como diclorometano a temperaturas de aproximadamente -20 °C

a aproximadamente 40 °C (Esquema 7, etapa ***a***). Los sulfonatos de amino *N-terc*-butoxicarbonilo después pueden tratarse con tioacetato de sodio, preparado mediante el tratamiento de ácido acético con una base tal como hidruro de sodio, en un solvente aprótico polar tal como *N*,*N*-dimetilformamida a temperaturas de aproximadamente 10 °C a aproximadamente 40 °C para proporcionar tioésteres de amino *N-terc*-butoxicarbonilo **7-2**, en donde $\mathbf{R^{13}}$ y **L** son como se describió anteriormente (Esquema 7, etapa ***b***). La alquilación de los tioésteres de amino *N-terc*-butoxicarbonilo **7-2** puede realizarse en un ambiente libre de oxígenoprimero mediante la eliminación del acetato del azufre mediante el tratamiento con una base de hidróxido metálico tal como hidróxido de sodio seguido del tratamiento con haluros $\mathbf{R^{14}}$**-halo**, en donde $\mathbf{R^{14}}$ es alquilo, o triflatos $\mathbf{R^{14}}$**-OTf**, en donde $\mathbf{R^{14}}$ es alquilo, en un solvente prótico polar tal como metanol a temperaturas de aproximadamente -10 °C a aproximadamente 40 °C para proporcionar *N-terc*-butoxicarbonilo amino sulfides **7-3**, en donde $\mathbf{R^{13}}$, **L**, y $\mathbf{R^{14}}$ son como se describió anteriormente (Esquema 7, etapa ***c***). *Los sulfuros de N-terc*-butoxicarbonilo amino **7-3** después pueden tratarse con un ácido tal como cloruro de hidrógeno para proporcionar sales de amina **5-2**, en donde **n** es 0 (Esquema 7, etapa ***d***). Opcionalmente, las sales de amina **5-2** pueden ser libres de base en presencia de una base tal como bicarbonato de sodio o trietilamina antes del uso en reacciones posteriores.

Esquema 7



Alternativamente, los sulfuros de *N-terc*-butoxicarbonilo amino **7-3**, pueden oxidarse al sulfoxido o sulfona correspondiente mediante el tratamiento con un equivalente de perborato de sodio en un solvente prótico tal como ácido acético para proporcionar el sulfóxido; o dos equivalentes de perborato de sodio para proporcionar la sulfona (Esquema 7, etapa ***e***). Las sulfonas resultantes después pueden tratarse con un ácido tal como cloruro de hidrógeno para proporcionar sales de amina **5-2** (Esquema 7, etapa ***d***). Opcionalmente, las sales de amina **5-2** pueden ser libres de base en presencia de una base tal como bicarbonato de sodio o trietilamina antes del uso en reacciones posteriores.

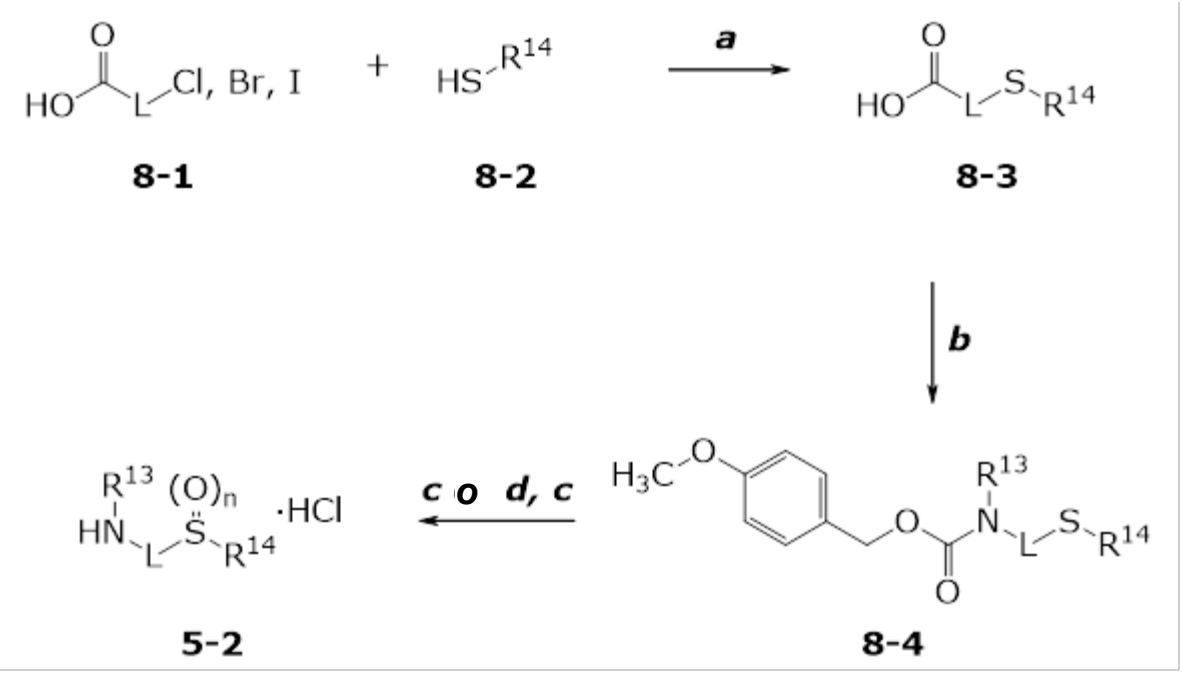
Las aminas **5-2** pueden prepararse alternativamente mediante el tratamiento de aminotioles **7-4**, en donde $\mathbf{R^{13}}$ y **L** son como se describió anteriormente con una base tal como hidruro de sodio seguido de el tratamiento con haluros $\mathbf{R^{14}}$**-halo**, en donde $\mathbf{R^{14}}$ es alquilo, o triflatos $\mathbf{R^{14}}$**-OTf**, en

donde $\mathbf{R^{14}}$ es alquilo, en un solvente aprótico polar tal como *N*,*N*-dimetilformamida a temperaturas de aproximadamente 15 °C a aproximadamente 50 °C (Esquema 7, etapa ***f***).

Los tioles **8-2**, en donde $\mathbf{R^{14}}$ es como se describió anteriormente, pueden tratarse con una base tal como hidruro de sodio seguido del tratamiento con ácidos **8-1**, en donde **L** es como se describió anteriormente, en un solvente aprótico polar tal como *N*,*N*-dimetilformamida a temperaturas de aproximadamente -10 °C a aproximadamente 30 °C para proporcionar tioácidos **8-3**, en donde **L** y $\mathbf{R^{14}}$ son como se describió anteriormente (Esquema 8, etapa ***a***). Los tioácidos **8-3** después pueden tratarse con una fuente de azida tal como difenil fosforazidato en presencia de una base tal como trietilamina en un solvente tal como 1,2-dicloroetano a temperaturas de aproximadamente 60 °C a aproximadamente 90 °C para ejercer un reordenamiento de Curtius. El isocianato resultante puede tratarse con un acohol bencílico tal como (4-metoxifenil)metanol para proporcionar carbamatos de bencilo **8-4**, en donde $\mathbf{R^{13}}$ es H, **L**, y $\mathbf{R^{14}}$ son como se describió anteriormente (Esquema 8, etapa ***b***). Los carbamatos de bencilo **8-4** pueden tratarse con un ácido tal como ácido trifluoroacético seguido de metátesis de sales con ácido clorhídrico para proporcionar sales de amina **5-2**, en donde $\mathbf{R^{13}}$ es H y **n** es 0 (Esquema 8, etapa ***c***)**.** Opcionalmente, las sales de amina **5-2** pueden ser libres de base en presencia de una base tal como bicarbonato de sodio o trietilamina antes del uso en reacciones posteriores.

Alternativamente, los carbamatos de bencilo **8-4** pueden oxidarse a la sulfona correspondiente mediante el tratamiento con dos equivalentes de perborato de sodio (Esquema 8, etapa ***d***). Las sulfonas resultantes después pueden tratarse con un ácido tal como cloruro de hidrógeno para proporcionar sales de amina **5-2** (Esquema 8, etapa ***c***)**.** Opcionalmente, las sales de amina **5-2** pueden ser libres de base en presencia de una base tal como bicarbonato de sodio o trietilamina antes del uso en reacciones posteriores.

Esquema 8



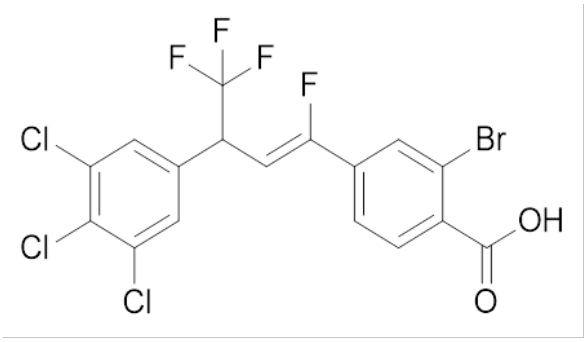
EJEMPLOS

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.

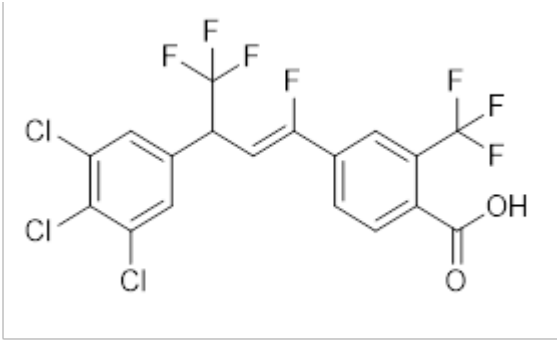
Ejemplo 1: Preparación de ácido (*Z*)-2-bromo-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)benzoico (C1)



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 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 ($[M-H]^-$).

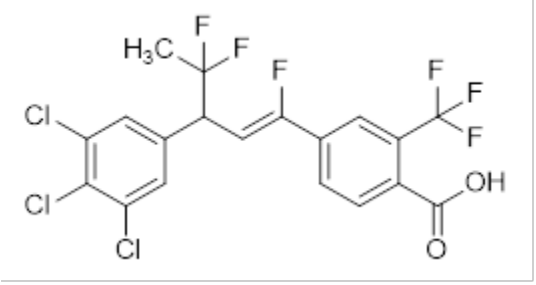
*Los siguientes compuestos se prepararon de la misma manera que el procedimiento detallado en el **Ejemplo 1***:

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



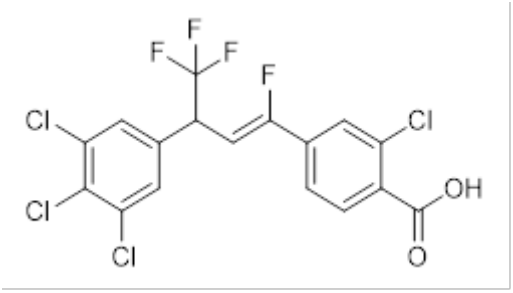
Aislado como un aceite amarillo (7.6 g, 68 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.04 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 7.99 - 7.94 (m, 1H), 7.84 (dd, *J* = 8.2, 1.8 Hz, 1H), 7.44 (s, 2H), 5.90 (dd, *J* = 32.4, 9.6 Hz, 1H), 4.62 (p, *J* = 8.9 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -59.60, -69.28 (d, *J* = 2.3 Hz), -112.11; ESIMS *m/z* 493 ($[M-H]^-$).

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



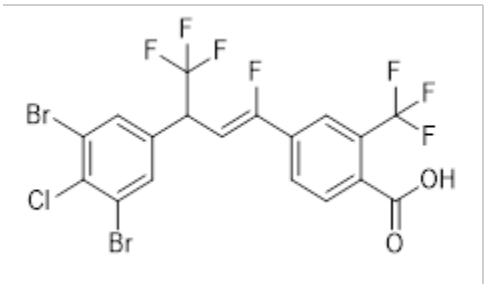
Aislado como una espuma amarilla (0.628 g, 60 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.00 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 7.95 (d, *J* = 8.8 Hz, 1H), 7.81 (d, *J* = 8.3 Hz, 1H), 7.42 (s, 2H), 5.96 (dd, *J* = 33.6, 9.8 Hz, 1H), 4.29 (td, *J* = 14.3, 9.8 Hz, 1H), 1.65 (t, *J* = 18.4 Hz, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$)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

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



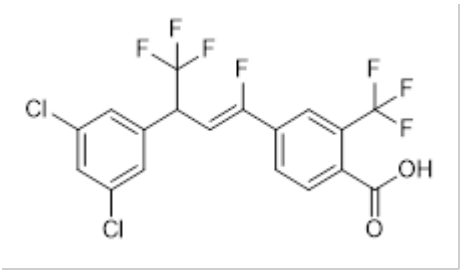
Aislado como un sólido blanco (4.27 g, 88 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.07 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 7.68 (d, *J* = 1.7 Hz, 1H), 7.54 (dd, *J* = 8.3, 1.8 Hz, 1H), 7.43 (s, 2H), 5.85 (dd, *J* = 32.4, 9.6 Hz, 1H), 4.60 (p, *J* = 8.8 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -69.33 (d, *J* = 2.2 Hz),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

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



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

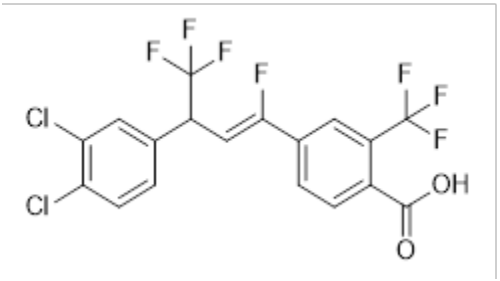
Ácido (*Z*)-4-(3-(3,5-diclorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C6)



Aislado como una goma marrón (0.50 g, 43 %): ^{1}H NMR (400 MHz, 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,

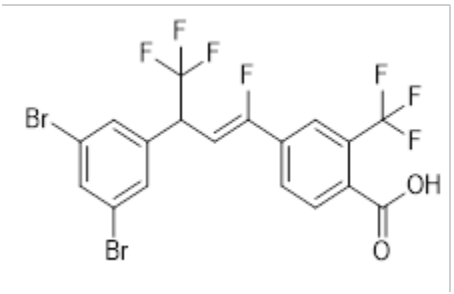
1H), 6.90 (dd, *J* = 36.0, 10.4 Hz, 1H), 5.26 - 5.17 (m, 1H); IR (película delgada) 3416, 2926, 1716, 1119 cm^{-1}; ESIMS *m/z* 449 ($[M+H]^+$).

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



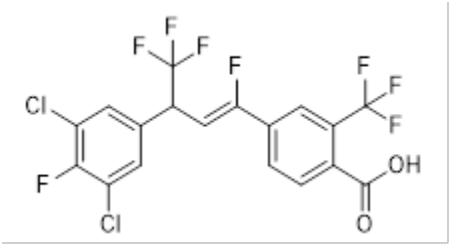
Aislado como una goma marrón (2.50 g, 56 %): ^1H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 13.9 (br s, 1H), 8.16 (s, 1H), 8.09 (d, *J* = 10.8 Hz, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.92 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.75 - 7.65 (m, 2H), 6.90 (dd, *J* = 36.0, 10.4 Hz, 1H), 5.22 - 5.16 (m, 1H); IR (película delgada) 3440, 2927, 1716, 1175 cm^{-1}; ESIMS *m/z* 459 ($[M-H]^-$).

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



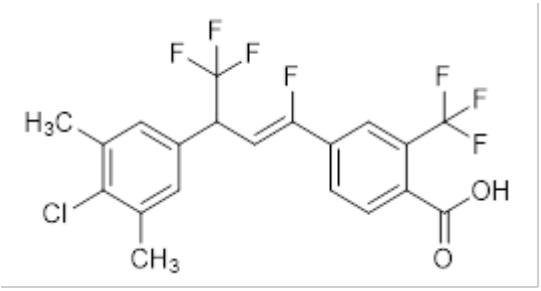
Aislado como una goma marrón (2.20 g, 39 %): ^1H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 8.05 - 7.95 (m, 2H), 7.84 (d, *J* = 7.2 Hz, 1H), 7.69 - 7.68 (m, 1H), 7.49 (s, 2H), 5.95 (dd, *J* = 32.7, 9.6 Hz, 1H), 4.64 - 4.58 (p, 1H); IR (película delgada) 3439, 2925, 1714, 1118, 746 cm^{-1}; ESIMS *m/z* 549 ($[M-H]^-$).

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



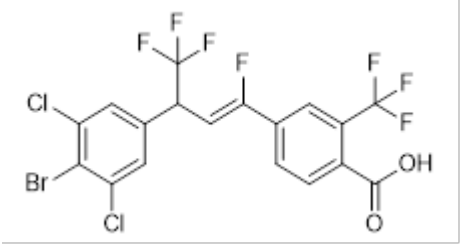
Aislado como una goma marrón (1.20 g, 54 %): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7.88 (s, 2H), 7.76 - 7.75 (m, 1H), 7.37 (d, *J* = 6.0 Hz, 2H), 5.90 (dd, *J* = 32.1, 9.0 Hz, 1H), 4.62 - 4.56 (p, 1H); IR (película delgada) 3445, 2926, 1698, 1260, 750 cm^{-1}; ESIMS *m/z* 477 ([M-H]$^-$).

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



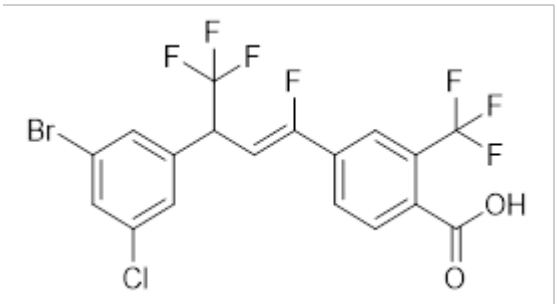
Aislado como una goma amarilla (2.20 g, 53 %): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 8.01 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.94 (s, 1H), 7.83 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.11 (s, 2H), 6.00 (dd, *J* = 33.0, 9.9 Hz, 1H), 4.58 - 4.55 (m, 1H), 2.40 (s, 6H); IR (película delgada) 3445, 1713, 852 cm^{-1}; ESIMS *m/z* 453 ([M-H]$^-$).

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



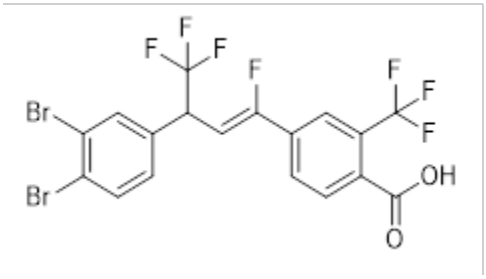
Aislado como un sólido marrón (1.50 g, 65%): mp 78-81 °C; ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 8.09 - 7.99 (m, 2H), 7.83 - 7.81 (m, 1H), 7.42 (s, 2H), 5.95 (dd, *J* = 32.4 Hz, 9.6 Hz, 1H), 4.63 - 4.57 (m, 1H); IR (película delgada) 3445, 1713, 852 cm^{-1}; ESIMS *m/z* 538 ([M+H]$^+$).

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



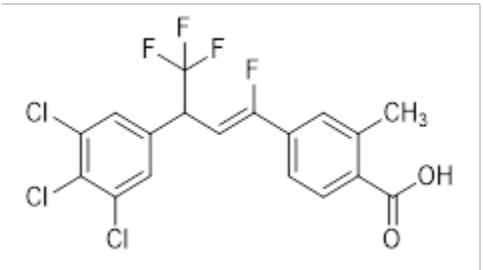
Aislado como una goma marrón (2.0 g, 62 %): ^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 13.80 (br s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.09 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.93 - 7.78 (m, 4H), 6.91 (dd, *J* = 35.7, 10.2 Hz, 1H), 5.27 - 5.14 (m, 1H); IR (película delgada) 3081, 2927, 1714, 776 cm^{-1}; ESIMS *m/z* 503 ([M-H]$^-$).

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



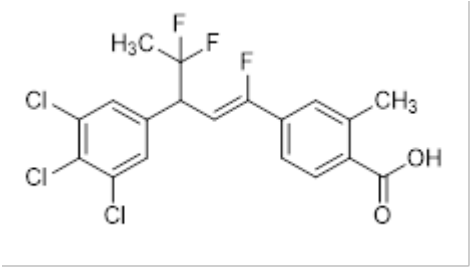
Aislado como una goma amarilla (2.1 g, 78 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.02 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 7.94 (s, 1H), 7.83 (d, *J* =8.4 Hz, 1H), 7.66 (d, *J* = 8.4 Hz, 2H), 7.26 - 7.21 (m, 1H), 5.96 (dd, *J* = 32.4, 9.2 Hz, 1H), 4.67 - 4.58 (p, 1H); IR (película delgada) 3426, 2925, 1714, 1115 cm^{-1};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

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



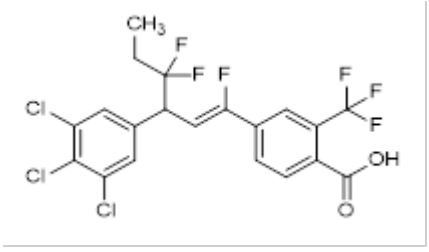
Aislado como un aceite naranja (0.94 g, 61 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.09 (d, *J* = 8.8 Hz, 1H), 7.49 - 7.45 (m, 2H), 7.44 (s, 2H), 5.80 (dd, *J* = 32.7, 9.6 Hz, 1H), 4.60 (p, J = 8.9 Hz, 1H), 2.69 (s, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -69.40 (d, *J* = 2.3 Hz), -108.40 – -115.65 (m); ESIMS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

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



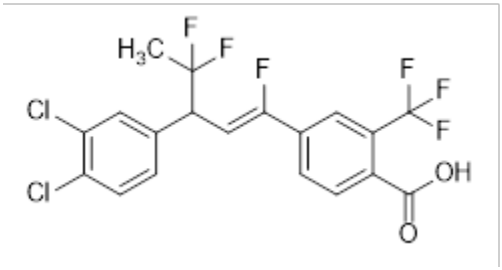
Aislado como una espuma naranja (0.204 g, 51 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.07 (d, *J* = 8.8 Hz, 1H), 7.49 - 7.40 (m, 4H), 5.86 (dd, *J* = 33.9, 9.9 Hz, 1H), 4.27 (td, *J* = 14.3, 9.7 Hz, 1H), 2.68 (s, 3H), 1.65 (t, *J* = 18.4 Hz, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -95.11, -95.18, -114.57; ESIMS *m/z* 437 ($[M-H]^-$).

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



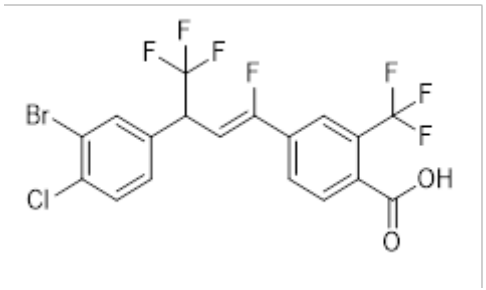
Aislado como una espuma naranja (0.136 g, 63 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.99 (dd, *J* = 8.4, 4.0 Hz, 1H), 7.93 (s, 1H), 7.80 (d, *J* = 7.9 Hz, 1H), 7.42 (d, *J* = 2.6 Hz, 2H), 6.08 - 5.87 (m, 1H), 4.32 (td, *J* = 14.6, 9.8 Hz, 1H), 1.87 (ddt, *J* = 21.6, 15.4, 8.0 Hz, 2H), 1.07 (t, *J* = 7.4 Hz, 3H); ^{13}C NMR (101 MHz, $CDCl_3$) δ 170.72, 156.96 (d, J_{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_{CF} = 18.0 Hz), 46.46, 29.70 – 27.14 (m), 6.40 – 5.44 (m); ESIMS *m/z* 503 ([M-H]$^-$).

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



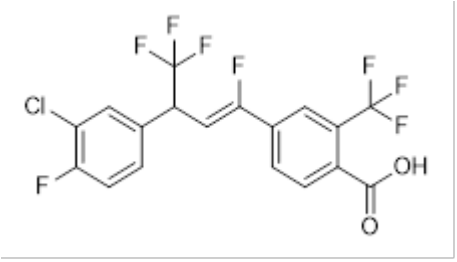
Aislado como un vidrio naranja (0.495 g, 51 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.01 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 7.94 (d, *J* = 1.6 Hz, 1H), 7.80 (dd, *J* = 8.2, 1.8 Hz, 1H), 7.49 (d, *J* = 2.1 Hz, 1H), 7.45 (d, *J* = 8.3 Hz, 1H), 7.26 7.22 (m, 1H), 6.00 (dd, *J* = 33.9, 9.8 Hz, 1H), 4.32 (ddd, *J* = 15.8, 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 ([M-H]$^-$).

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



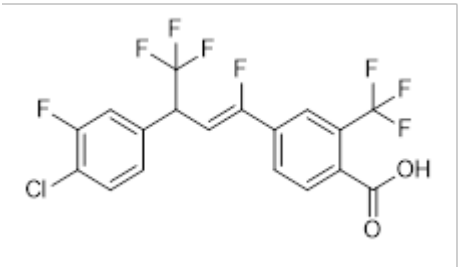
Aislado como una goma marrón (2.5 g, 46 %): ^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 13.79 (br s, 1H), 8.15 - 8.06 (m, 3H), 7.91 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.71 (s, 2H), 6.90 (dd, *J* = 36.0, 10.2 Hz, 1H), 5.21 - 5.15 (m, 1H); IR (película delgada) 3431, 2924, 1623, 597 cm^{-1}; ESIMS *m/z* 503 ([M-H]$^-$).

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



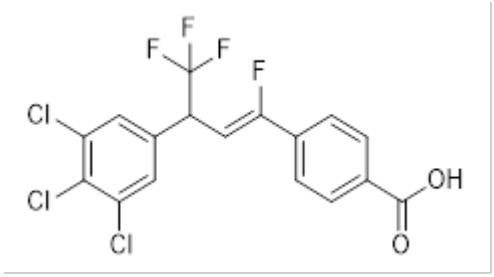
Aislado como una goma amarilla (1.50 g, 57 %): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 8.01 (d, *J* = 8.1 Hz, 2H) 7.94 (s, 2H), 7.76 - 7.75 (m, 1H), 7.37 (d, *J* = 6.0 Hz, 2H), 5.90 (dd, *J* = 32.1, 9.0 Hz, 1H); IR (película delgada) 3445, 2926, 1698, 1260, 750 cm^{-1}; ESIMS *m/z* 443 ([M-H]$^-$).

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



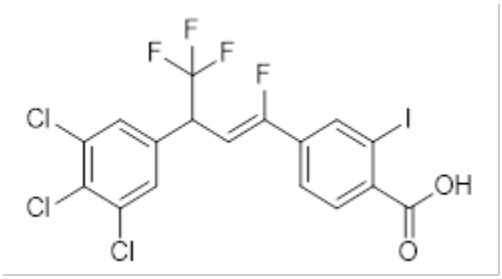
Aislado como una goma marrón (0.50 g, 48 %): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 8.03 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.94 (s, 1H), 7.83 (d, *J* = 7.8 Hz, 1H), 7.46 - 7.44 (m, 1H), 7.23 - 7.13 (m, 2H), 5.98 (dd, *J* = 34.2, 9.9 Hz, 1H), 4.69 - 4.63 (m, 1H); IR (película delgada) 3092, 1751, 750 cm^{-1}; ESIMS *m/z* 443 ([M-H]$^-$).

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



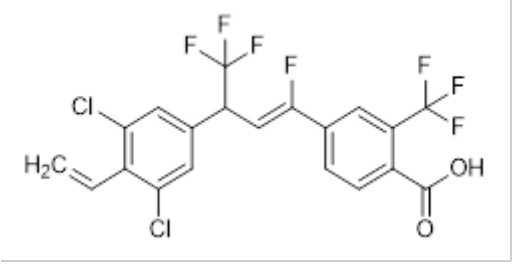
Aislado como una goma amarilla (1.1 g, 56 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.15 (d, *J* = 8.2 Hz, 2H), 7.67 (d, *J* = 8.3 Hz, 2H), 7.44 (s, 2H), 5.84 (dd, *J* = 32.6, 9.6 Hz, 1H), 4.61 (p, *J* = 8.9 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -69.38 (d, *J* = 2.2 Hz), -109.75 – -116.47 (m); ESIMS *m/z*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

Ejemplo 2: Preparación de ácido (*Z*)-2-yodo-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)benzoico (C21)



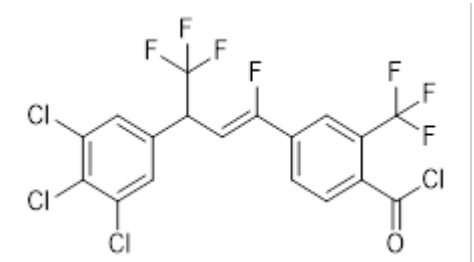
A un vial de 25 mL se añadieron ácido (*Z*)-2-bromo-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)benzoico **(C1)** (0.500 g, 0.987 mmol), yoduro de cobre(I) (0.0094 g, 0.049 mmol), y 1,4-dioxano (4.9 mL) para formar una suspensión amarilla. Yoduro de sodio (0.296 g, 1.97 mmol) y *trans*-*N*,*N*'-dimetilciclohexano-1,2-diamina (0.0140 g, 0.099 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 %): ^{1}H 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, 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 ([M-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)



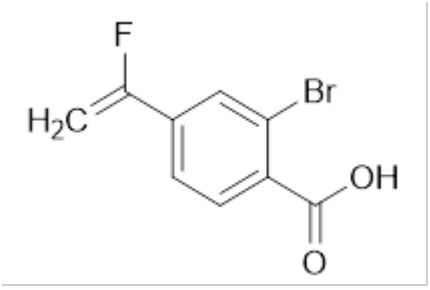
Tetrakis(trifenilfosfina)paladio(0) (0.30 g, 0.26 mmol) se añadió a una solución de ácido (*Z*)-4-(3-(4-bromo-3,5-diclorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico **(C11)** (1.4 g, 2.6 mmol) en tolueno (10 mL) a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se desgasificó purgando con nitrógeno (3 x 10 minutos). Tributil vinil stannano (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 luego 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 %): ^{1}H 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 ([M+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%): ^{1}H 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 ($[M-Cl]^+$).

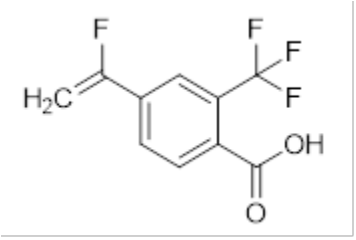
Ejemplo 5: Preparación de ácido 2-bromo-4-(1-fluorovinil)benzoico (C24)



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 %): ^{1}H 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 ($[M-H]^-$).

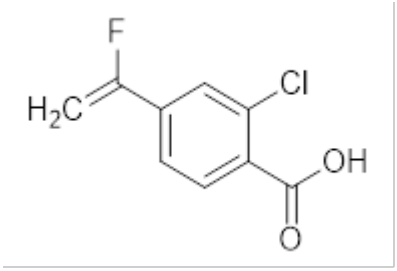
Los siguientes compuestos se prepararon de la misma manera que el procedimiento detallado en el ***Ejemplo 5***:

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



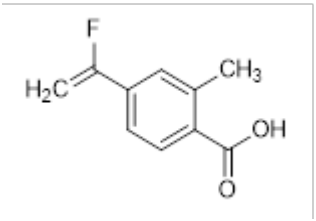
Aislado como un sólido blanco (1.9 g, 93 %): ^{1}H NMR (400 MHz, metanol-d_4) δ 7.95 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 7.95 - 7.91 (m, 1H), 7.90 - 7.86 (m, 1H), 5.46 (dd, J = 50.0, 4.1 Hz, 1H), 5.09 (dd, J = 18.0, 4.1 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, metanol-d_4) δ -61.04 (d, J = 1.1 Hz), -110.93; ESIMS m/z 233 ([M-H]$^-$).

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



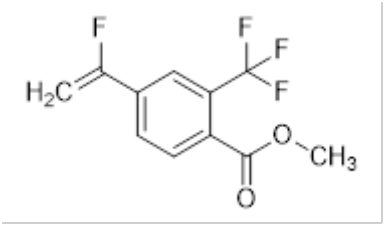
Aislado como un sólido blanco (3.5 g, 75 %): ^{1}H NMR (400 MHz, acetona-d_6) δ 7.97 (dd, J = 8.2, 0.9 Hz, 1H), 7.76 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 7.70 (dd, J = 8.2, 1.7 Hz, 1H), 5.68 - 5.45 (m, 1H), 5.11 (dd, J = 18.2, 4.1 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, acetona-d_6) δ -108.71; ESIMS m/z 200 ([M-H]$^-$).

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



Aislado como un sólido blanco (0.550 g, 89 %): ^{1}H 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 ([M+H]$^+$).

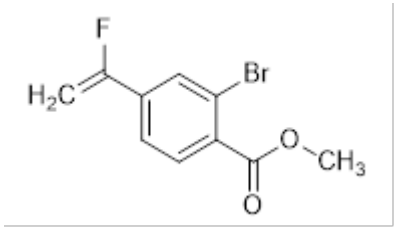
Ejemplo 6: Preparación de metil 4-(1-fluorovinil)-2-(trifluorometil)benzoato (C28)



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 purificado por cromatografía en columna rápida proporcionó el compuesto del título como un aceite incoloro (2.00 g, 96 %): ^{1}H 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, CDCl3) δ -59.92, -108.73 (d, *J* = 1.4 Hz); EIMS *m/z* 248 ($[M]^+$).

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

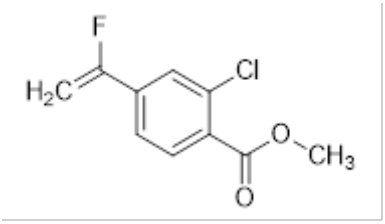
Metil 2-bromo-4-(1-fluorovinil)benzoato (C29)



Aislado como un aceite incoloro (1.8 g, 93 %): ^{1}H 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

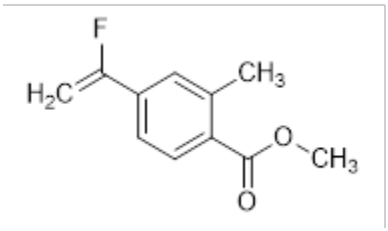
(dd, *J* = 17.3, 3.9 Hz, 1H), 3.94 (d, *J* = 2.2 Hz, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -108.61 (d, *J* = 1.5 Hz); ESIMS *m/z* 258 ($[M-H]^-$).

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



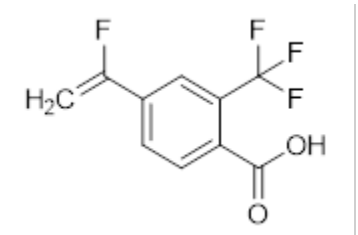
Aislado como un aceite incoloro (2.1 g, 99 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.86 (dd, *J* = 8.2, 0.9 Hz, 1H), 7.64 (d, *J* = 1.7 Hz, 1H), 7.48 (dd, *J* = 8.3, 1.8 Hz, 1H), 5.17 (dd, *J* = 48.7, 3.8 Hz, 1H), 5.02 (dd, *J* = 17.3, 3.9 Hz, 1H), 3.94 (s, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -108.63 (d,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

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



Aislado como un aceite incoloro (0.5 g, 85 %): ^{1}H 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 ($[M+H]^+$).

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

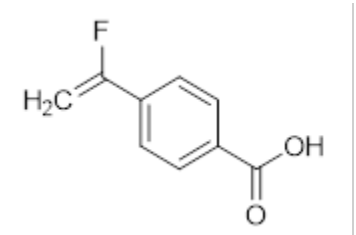


Etapa 1: Ácido 4-(2-bromo-1-fluoroetil)-2-(trifluorometil)benzoico (C32) Ácido 2-(trifluorometil)-4-vinilbenzoico (5.3 g, 24 mmol) se disolvió en diclorometano (123 mL) a 0 °C, se añadió trihidrofluoruro trietilamina (8.0 mL, 49 mmol) seguido por *N*-bromosuccinimida (8.7 g, 49 mmol). La mezcla de reacción 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 as a aceite amarillo que se usó sin purificación adicional (5.0 g, 65 %).

Etapa 2: Ácido 4-(1-fluorovinil)-2-(trifluorometil)benzoico (C25) Ácido 4-(2-Bromo-1-fluoroetil)-2-(trifluorometil)benzoico (4.3 g, 14 mmol) se disolvió en metanol (68 mL) at 0 °C y *terc*-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 hidroclórico (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 en hexanos proporcionó el compuesto del título como un sólido blancuzco (1.7 g, 53 %): ^{1}H 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);

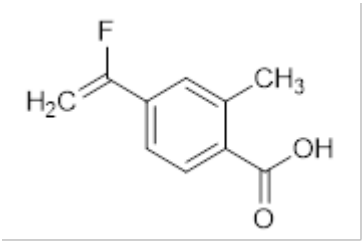
Los siguientes compuestos se prepararon de la misma manera que el procedimiento detallado en el ***Ejemplo 7***:

Ácido 4-(1-Fluorovinil)benzoico (C33)



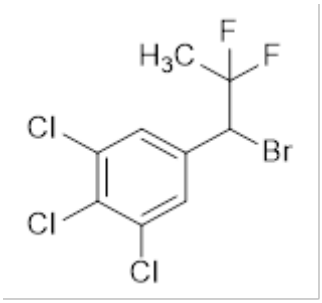
Aislado como un sólido blanco (6.5 g, 86 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.13 (d, *J* = 8.2 Hz, 2H), 7.69 - 7.62 (m, 2H), 5.21 (dd, *J* = 49.0, 3.7 Hz, 1H), 5.02 (dd, *J* = 17.5, 3.7 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -108.35; ESIMS *m/z* 165 ($[M-H]^-$).

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



Aislado como un aceite incoloro (0.165 g, 89 %): ^{1}H 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.

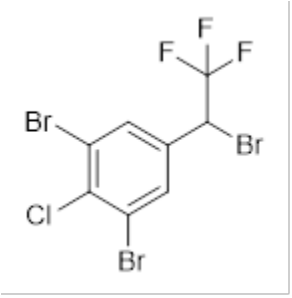
Ejemplo 8: Preparación de 5-(1-bromo-2,2-difluoropropil)-1,2,3-triclorobenceno (C34)



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 gotas, y la mezcla de reacción se puso marrón oscuro. La mezcla de reacción se calentó luego 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 %): ^{1}H 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 ([M]$^{+}$).

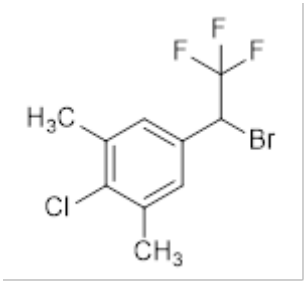
Los siguientes compuestos se prepararon de la misma manera que el procedimiento detallado en el ***Ejemplo 8***:

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



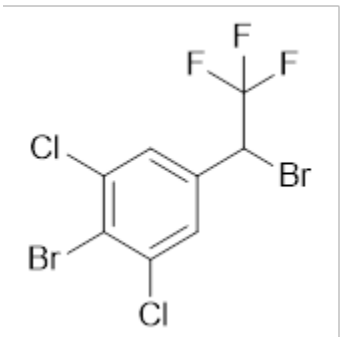
Aislado como un aceite claro (28 g, 56 %): ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 8.01 - 7.97 (m, 2H), 6.26 - 6.20 (m, 1H); IR (película delgada) 1168, 736, 557 cm^{-1}; ESIMS *m/z* 428 ([M+H]$^+$).

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



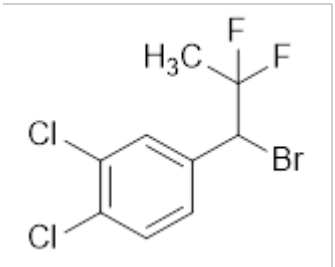
Aislado como un aceite claro (6.32 g, 89 %): ^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 7.39 (s, 2H), 6.17-6.09 (m, 1H), 2.35 (s, 6H); IR (película delgada) 1114, 754 cm^{-1}; ESIMS *m/z* 302 ([M+H]$^+$).

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



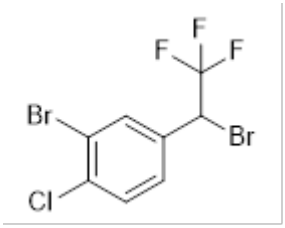
Aislado como un aceite claro (19 g, 46 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.54 - 7.51 (m, 2H), 5.03 - 4.98 (m, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -70.38.

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



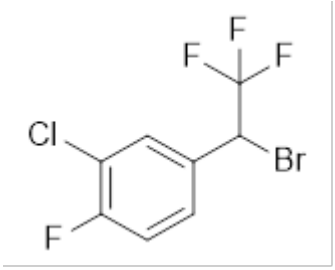
Aislado como un líquido incoloro (1.40 g, 65 %): ^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 7.76 - 7.70 (m, 2H), 7.54 (dd, J = 8.4, 1.8 Hz, 1H), 5.81 - 5.73 (m, 1H), 1.67 (d, J = 18.9 Hz, 3H); IR (película delgada) 1118, 800, 499 cm^{-1}; EIMS *m/z* 304 ([M]$^+$).

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



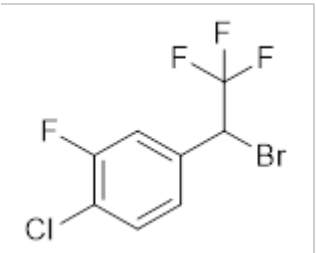
Aislado como un líquido incoloro (10.5 g, 54 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.76 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.49 - 7.47 (m, 1H), 7.41 - 7.39 (m, 1H), 5.07 - 5.02 (m, 1H); IR (película delgada) 3437, 2924, 1631, 1114 cm^{-1}; EIMS *m/z* 350 ([M]$^+$).

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



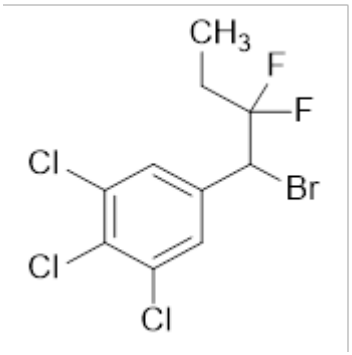
Aislado como un aceite incoloro (8.0 g, 73 %): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7.59 - 7.57 (m, 1H), 7.42 - 7.33 (m, 1H), 7.20 -7.14 (m, 1H), 5.10 - 5.03 (m, 1H); IR (película delgada) 3429, 2926, 1502, 750 cm^{-1}; ESIMS *m/z* 292 ([M+H]$^+$).

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



Aislado como un aceite amarillo (1.1 g, 45 %): ^{1}H 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 (m, 1H), 5.08 (q, *J* = 7.1 Hz, 1H); EIMS *m/z* 291 ($[M]^+$).

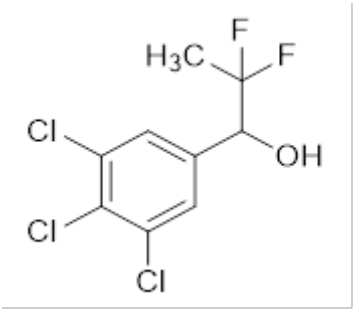
Ejemplo 9: Preparación de 5-(1-bromo-2,2-difluorobutil)-1,2,3-triclorobenceno (C42)



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 %): ^{1}H 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 ([M-H]$^-$).

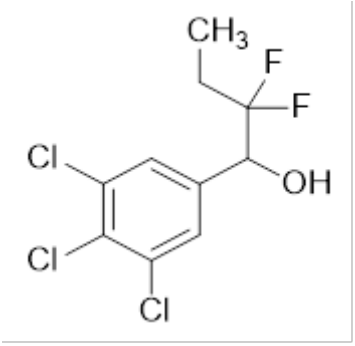
Ejemplo 10: Preparación de 2,2-difluoro-1-(3,4,5-triclorofenil)propan-1-ol (C43)



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 se agitó 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 en hexanos como eluyente proporcionó el compuesto del título como un aceite incoloro claro (1.60 g, 91 %): ^{1}H 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}.

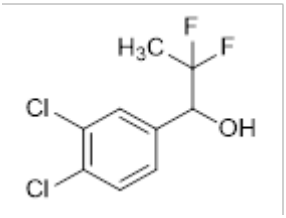
*Los siguientes compuestos se prepararon de la misma manera que el procedimiento detallado en el **Ejemplo 10***:

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



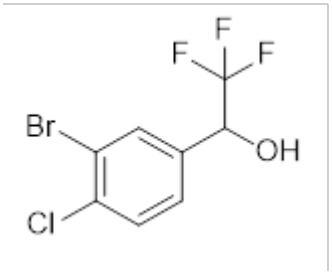
Aislado como un aceite incoloro y claro (3.4 g, 48 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.48 (d, *J* = 0.9 Hz, 2H), 4.87 - 4.70 (m, 1H), 2.54 (dt, *J* = 4.0, 1.0 Hz, 1H), 2.06 - 1.82 (m, 1H), 1.82 - 1.63 (m, 1H), 1.02 (t, *J* = 7.5 Hz, 3H); ^{13}C NMR (101 MHz, $CDCl_3$) δ 136.85, 134.20, 131.60, 127.54,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

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



Aislado como un aceite incoloro y claro (2.78 g, 89 %): ^{1}H 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)

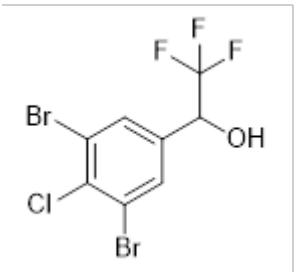


Trimetil(trifluorometil)silano (10.1 mL, 68.4 mmol) y fluoruro de tetrabutilamonio (1.44 g, 4.56 mmol) se añadieron a una solución agitada de 3-bromo-4-cloro-benzaldehído (10.0 g, 45.6 mmol) en tetrahidrofurano (150 mL) a temperatura ambiente y la mezcla de reacción se agitó por 2 horas. La mezcla de reacción se diluyó con diclorometano y se lavó con ácido hidroclórico (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 %):

^{1}H 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 ([M]$^+$).

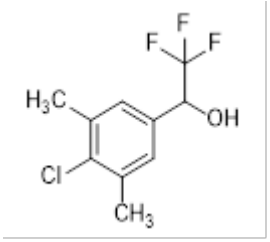
Los siguientes compuestos se prepararon de la misma manera que el procedimiento detallado en el ***Ejemplo 11***:

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



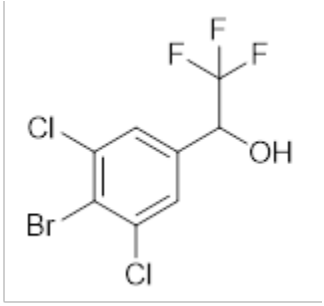
Aislado como un líquido amarillo pálido (7.4 g, 85 %): ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 7.90 (s, 2H), 7.24 (d, *J* = 5.2 Hz, 1H), 5.33 (d, *J* = 6.4 Hz, 1H); IR (película delgada) 3370, 1175, 735, 541 cm^{-1}; EIMS *m/z* 366 ([M]$^+$).

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



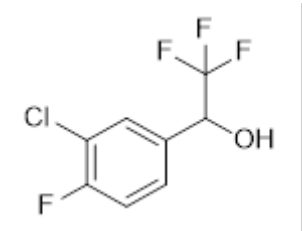
Aislado como un líquido claro (5.0 g, 70 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.18 (s, 2H), 4.95 - 4.92 (m, 1H), 2.40 (s, 6H); IR (película delgada) 3378, 1124, 833 cm^{-1}; EIMS *m/z* 238 ([M]$^+$).

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



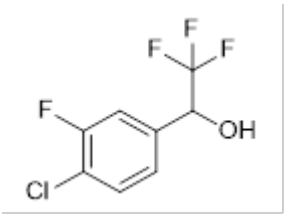
Aislado como un aceite claro (33 g, 86 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.51 (s, 2H), 5.01 - 4.96 (m, 1H), 4.14 - 4.09 (m, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -78.32.

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



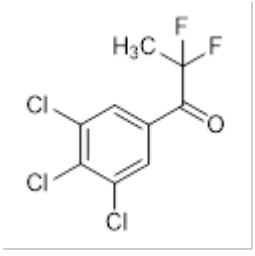
Aislado como una goma marrón clara (7.0 g, 97 %): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7.58 - 7.55 (m, 1H), 7.38 - 7.33 (m, 1H), 7.20 - 7.15 (m, 1H), 5.03 - 4.97 (m, 1H); EIMS *m/z* 228 ($[M]^+$).

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



Aislado como un aceite incoloro y claro (1.97 g, 75 %): ^{1}H 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} = 250.4 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); EIMS *m/z* 228 ($[M]^+$).

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

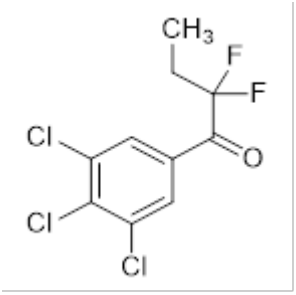


A 5-bromo-1,2,3-triclorobenceno (2.28 g, 8.76 mmol) disuelto en éter de dietilo (39.8 mL) a −78 °C bajo nitrógeno se añadió *n*-butillitio (3.50 mL, 8.76 mmol). La solución se agitó durante 30

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 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 as a pale aceite amarillo (1.76 g, 73 %): ^{1}H 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 ($[M-H]^-$).

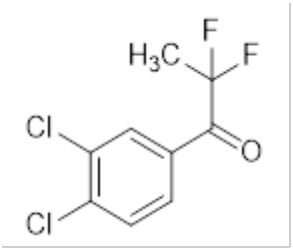
Los siguientes compuestos se prepararon de la misma manera que el procedimiento detallado en el ***Ejemplo 12***:

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



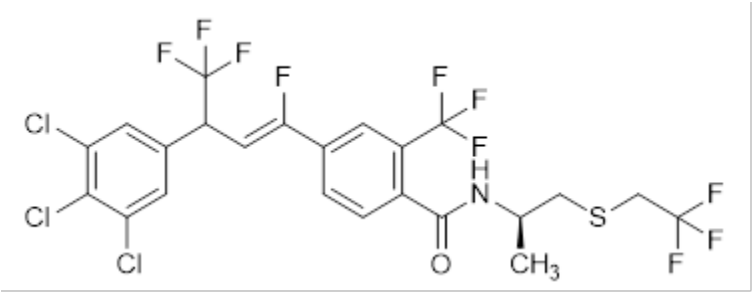
Aislado como un aceite (2.3 g, 68 %) y se usó sin purificación o caracterización adicional.

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



Aislado como un aceite incoloro (3.89 g, 71 %): ^{1}H 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 ($[M]^+$).

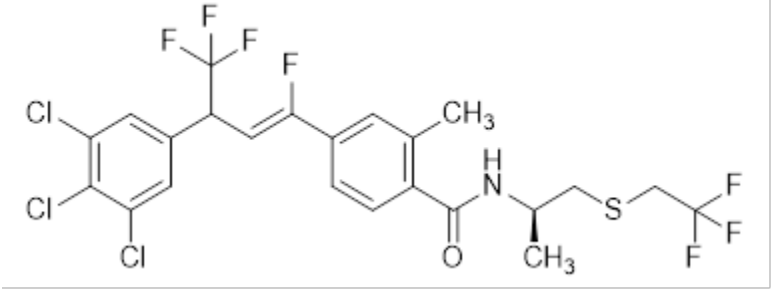
Ejemplo 13: Preparación de 4-((*Z*)-1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)tio)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F1)



A un vial de 25 mL se añadieron ácido (*Z*)-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico **(C2)** (0.100 g, 0.202 mmol), hidrocloruro de (*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)tio)propan-2-amina (0.0635 g, 0.303 mmol), benzotriazol-1-il-oxitripirrolidinofosfonio hexafluorofosfato (0.158 g, 0.303 mmol), y diclorometano (4.0 mL). Trietilamina (0.113 mL, 0.807 mmol) se añadió, y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante toda la noche. La mezcla de reacción se concentró y se purificó por cromatografía en columna rápida para proporcionar el compuesto del título como un aceite amarillo (0.104 g, 75 %).

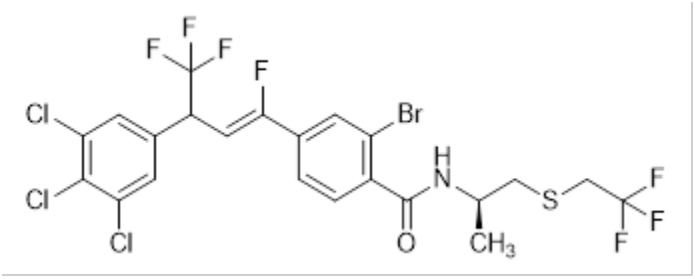
*Los siguientes compuestos se prepararon de la misma manera que el procedimiento detallado en el **Ejemplo 13***:

2-Metil-4-((*Z*)-1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)tio)propan-2-il)benzamida (F4)



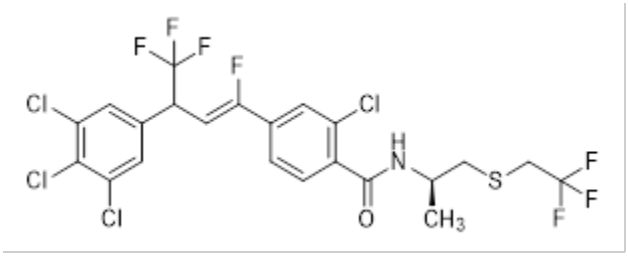
Aislado como un aceite amarillo (0.120 g, 84 %).

2-Bromo-4-((*Z*)-1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)tio)propan-2-il)benzamida (F7)



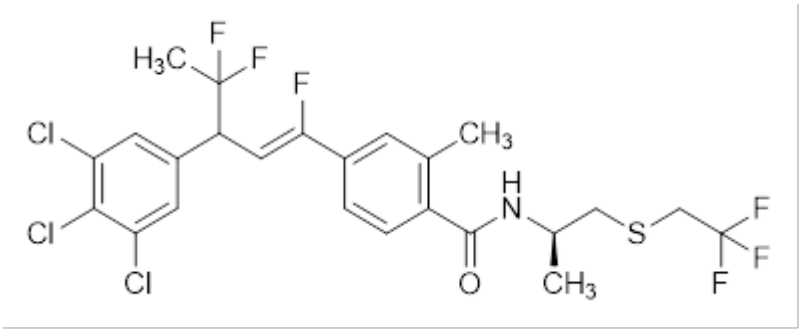
Aislado como un aceite amarillo (0.158 g, 57 %).

2-cloro-4-((*Z*)-1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)tio)propan-2-il)benzamida (F10)



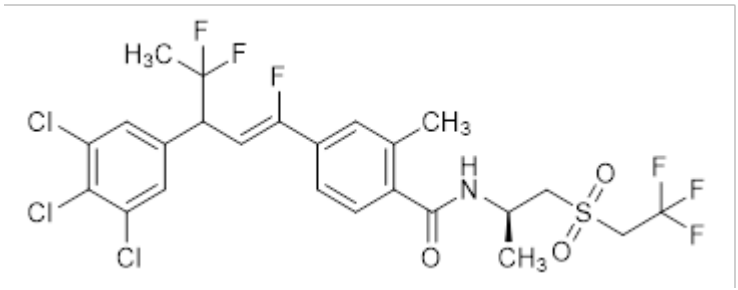
Aislado como una goma incolora (0.281 g, 80 %).

2-Metil-4-((*Z*)-1,4,4-trifluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)pent-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)tio)propan-2-il)benzamida (F13)



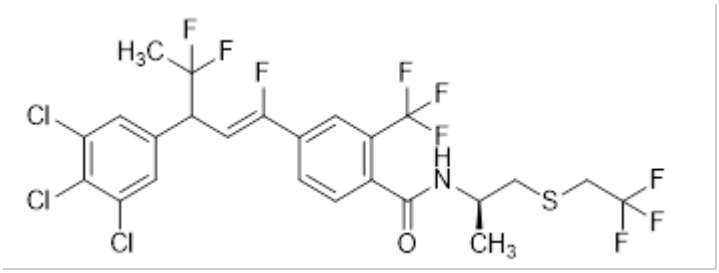
Aislado como un aceite amarillo (0.068 g, 74 %).

2-Metil-4-((*Z*)-1,4,4-trifluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)pent-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)benzamida (F14)



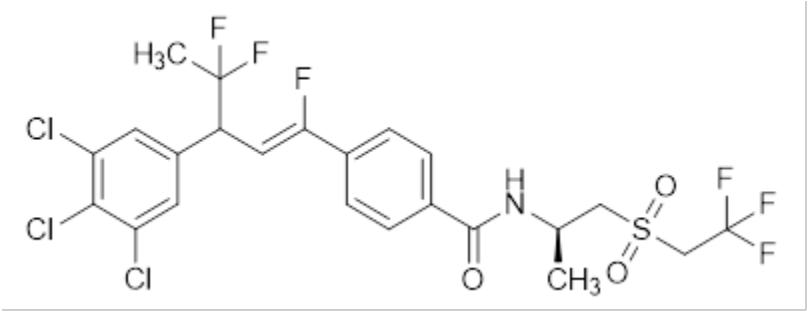
Aislado como una goma blanca (0.039 g, 85 %).

4-((*Z*)-1,4,4-Trifluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)pent-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)tio)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F15)



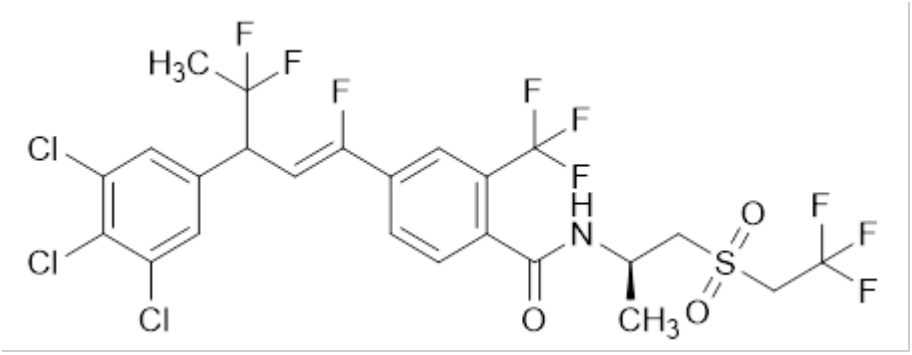
Aislado como una goma amarilla (0.075 g, 68 %).

4-((*Z*)-1,4,4-Trifluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)pent-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)benzamida (FC1)



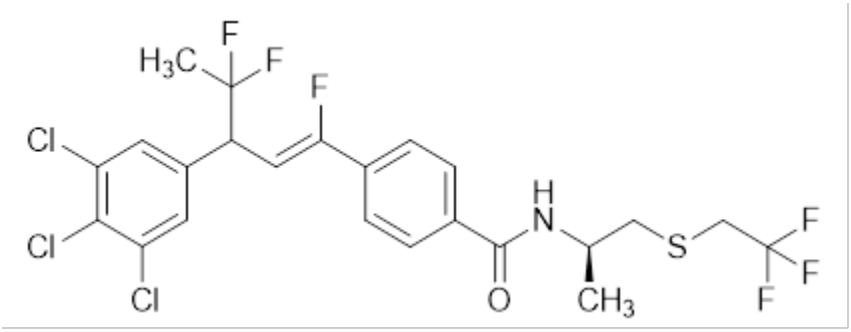
Aislado como una espuma blanca (0.052 g, 60 %).

4-((*Z*)-1,4,4-Trifluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)pent-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F16)



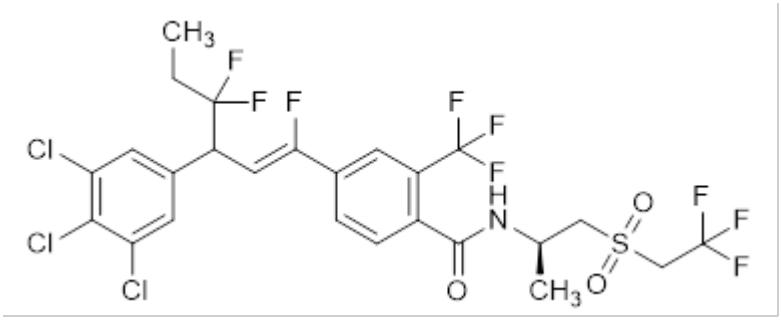
Aislado como una goma blanca (0.070 g, 84 %).

4-((*Z*)-1,4,4-Trifluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)pent-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)tio)propan-2-il)benzamida (FC2)



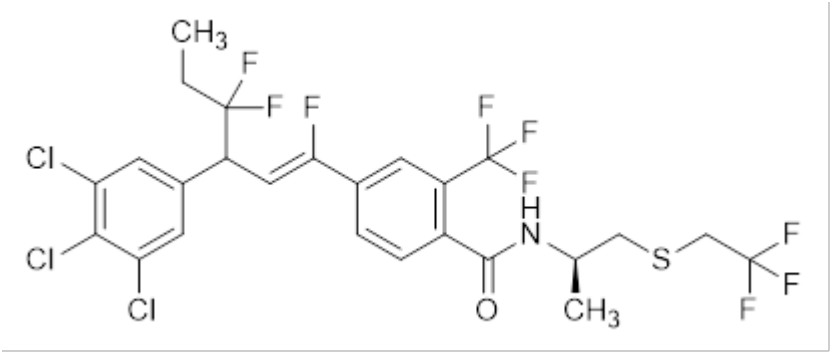
Aislado como un aceite naranja (0.053 g, 64 %).

4-((*Z*)-1,4,4-Trifluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)hex-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F38)



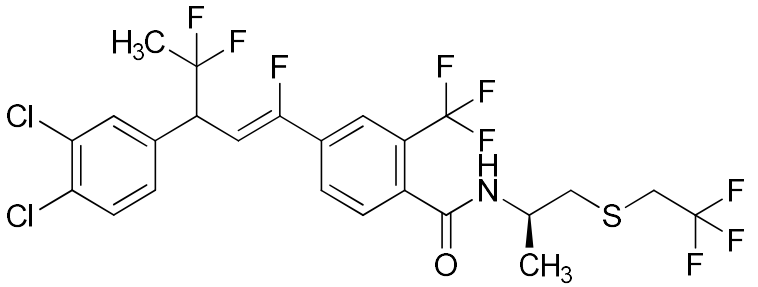
Aislado como una goma blanca (0.052 g, 63 %).

4-((*Z*)-1,4,4-Trifluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)hex-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)tio)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F39)



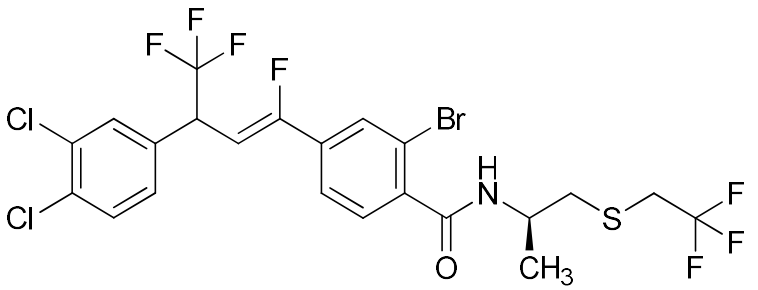
Aislado como un vidrio blanco (0.056 g, 71 %).

4-((*Z*)-3-(3,4-Diclorofenil)-1,4,4-trifluoropent-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)tio)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F57)



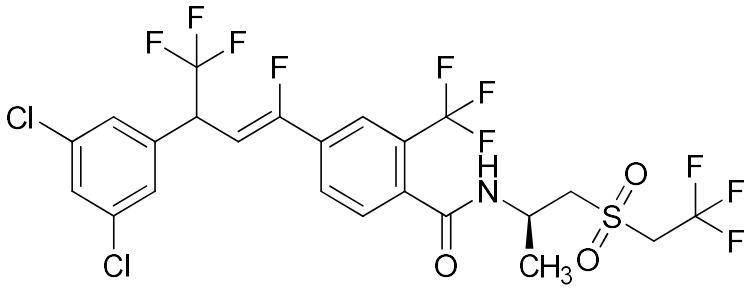
Aislado como una goma blanca (0.060 g, 75 %).

2-Bromo-4-((*Z*)-3-(3,4-diclorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)tio)propan-2-il)benzamida (F58)



Aislado como una goma amarilla (0.180 g, 59 %).

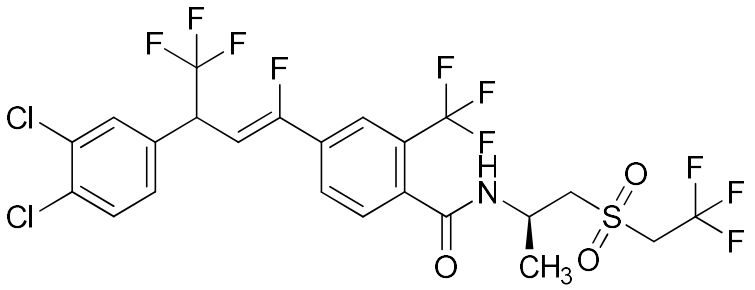
Ejemplo 14: Preparación de 4-((*Z*)-3-(3,5-diclorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F17)



Diisopropiletilamina (0.0560 g, 0.430 mmol), 2-cloro-1,3-dimetil imidazolidinio hexafluorofosfato (0.109 g, 0.390 mmol), e 1-hidroxi-7-azabenzotriazolo (0.089 g, 0.390 mmol) se añadieron a una solución de ácido (*Z*)-4-(3-(3,5-diclorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico **(C6)** (0.180 g, 0.390 mmol), y (*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-amina hidrocloruro **(C56)** (0.0881 g, 0.430 mmol) en diclorometano (5.0 mL). La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 6 horas. La mezcla de reacción se diluyó con diclorometano y se lavó con ácido clorhídrico (2 N) y bicarbonato de sodio acuoso. La capa orgánica se separó, se lavó con agua, 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 sólido blanco (0.110 g, 42 %).

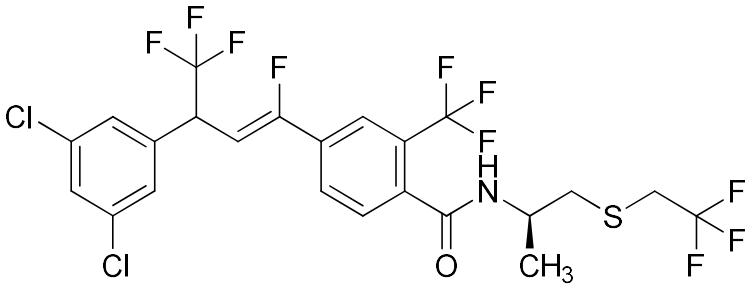
Los siguientes compuestos se prepararon de la misma manera que el procedimiento detallado en el ***Ejemplo 14***:

4-((*Z*)-3-(3,4-Diclorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F18)



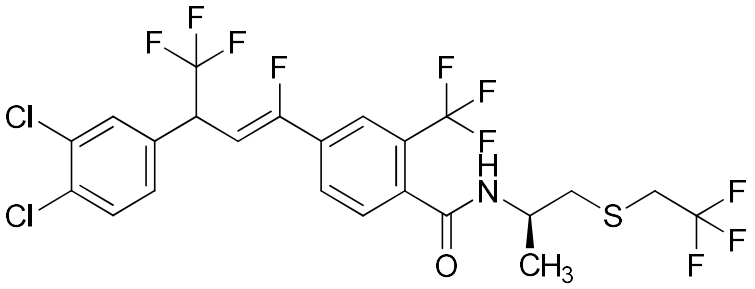
Aislado como un sólido amarillo pálido (0.120 g, 47 %).

4-((*Z*)-3-(3,5-Diclorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)tio)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F19)



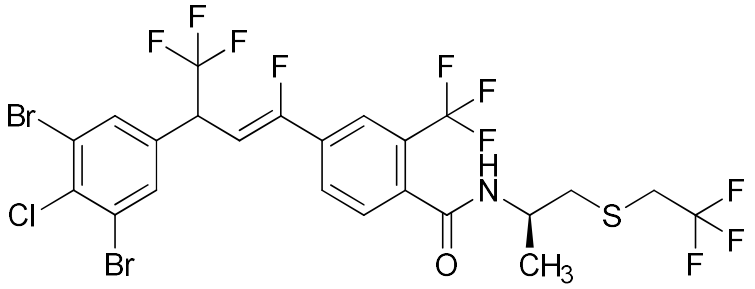
Aislado como una goma marrón (0.250 g, 70 %).

4-((*Z*)-3-(3,4-Diclorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)tio)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F20)



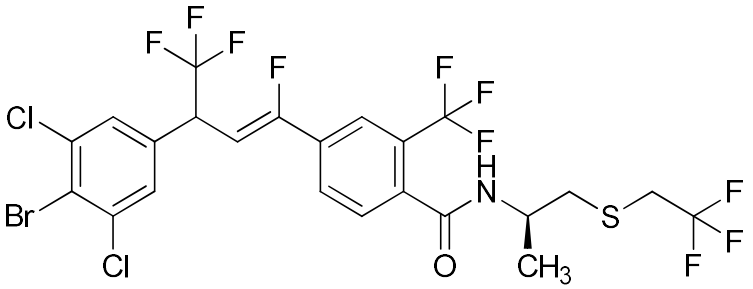
Aislado como una goma marrón (0.250 g, 70 %).

4-((*Z*)-3-(3,5-Dibromo-4-clorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)tio)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F21)



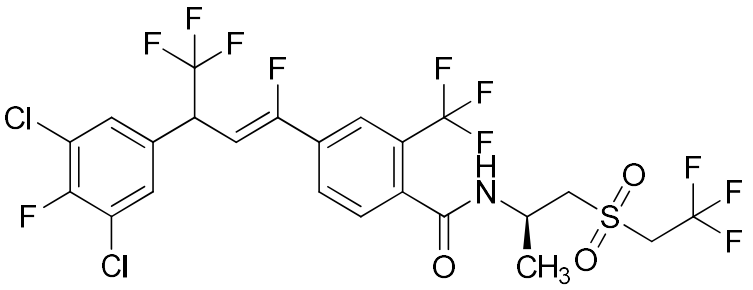
Aislado como una goma amarilla (0.250 g, 57 %).

4-((*Z*)-3-(4-Bromo-3,5-diclorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)tio)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F24)



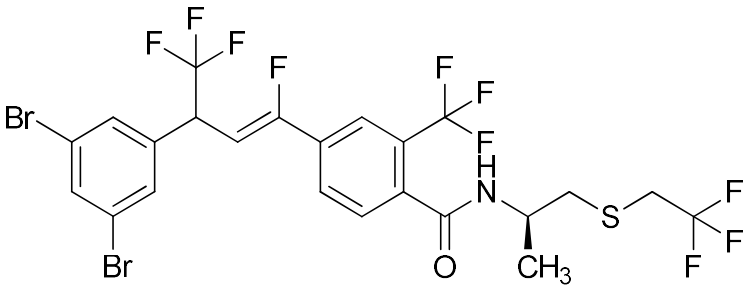
Aislado como una goma amarilla (0.200 g, 49 %).

4-((*Z*)-3-(3,5-Dicloro-4-fluorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F29)



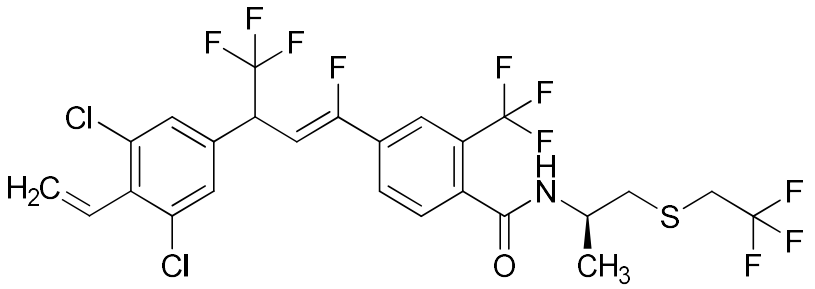
Aislado como un sólido amarillo pálido (0.135 g, 51 %).

4-((*Z*)-3-(3,5-Dibromofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)tio)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F30)



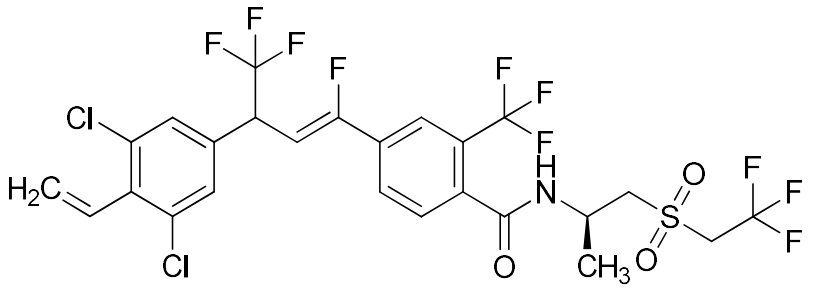
Aislado como una goma amarilla (0.250 g, 57 %).

4-((*Z*)-3-(3,5-Dicloro-4-vinilfenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)tio)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F32)



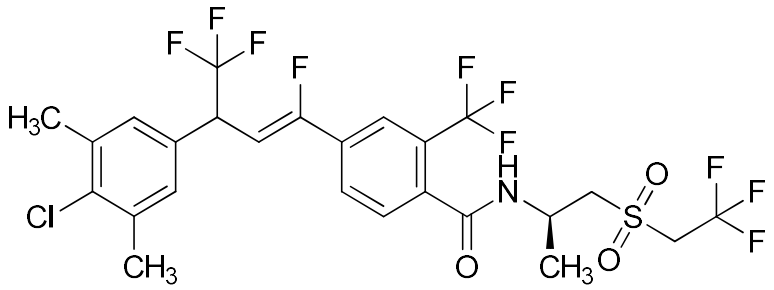
Aislado como un sólido blancuzco (0.250 g, 47 %).

4-((*Z*)-3-(3,5-Dicloro-4-vinilfenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F33)



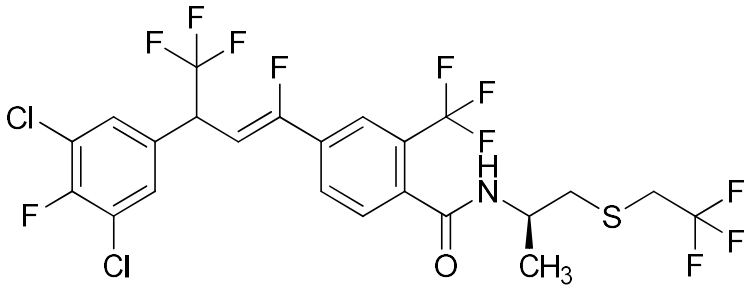
Aislado como un sólido blancuzco (0.120 g, 48 %).

4-((*Z*)-3-(4-cloro-3,5-dimetilfenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F35)



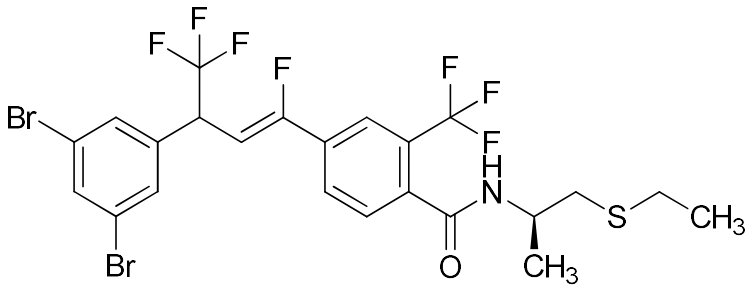
Aislado como un sólido blanco (0.100 g, 35 %).

4-((*Z*)-3-(3,5-Dicloro-4-fluorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)tio)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F36)



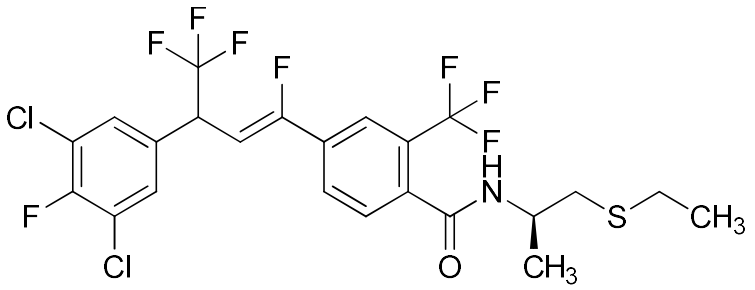
Aislado como una goma amarilla (0.250 g, 59 %).

4-((*Z*)-3-(3,5-Dibromofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-(etiltio)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F40)



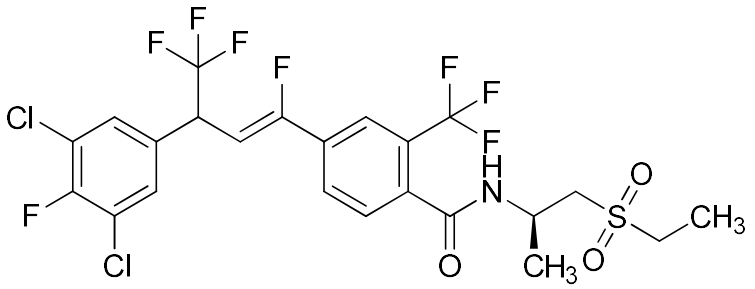
Aislado como una goma amarilla pálida (0.260 g, 74 %).

4-((*Z*)-3-(3,5-Dicloro-4-fluorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-(etiltio)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F41)



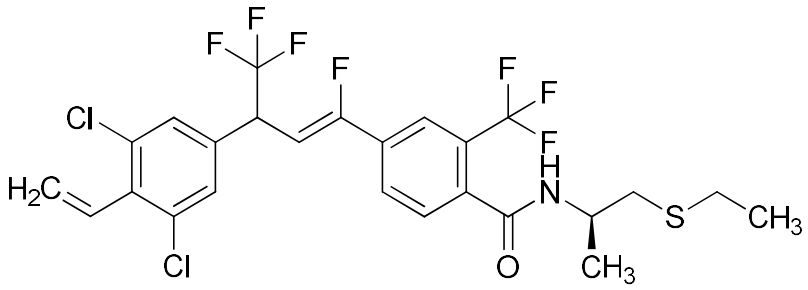
Aislado como una goma amarilla pálida (0.260 g, 80 %).

4-((*Z*)-3-(3,5-Dicloro-4-fluorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-(etilsulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F43)



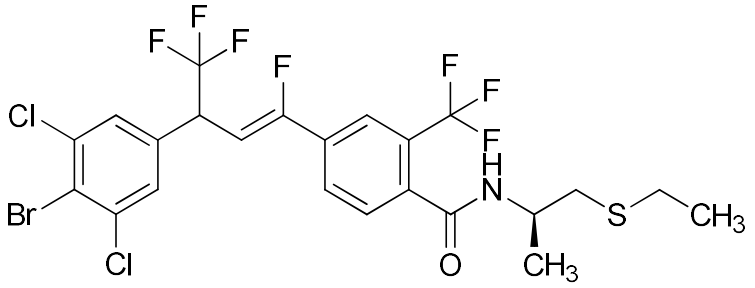
Aislado como un sólido amarillo pálido (0.186 g, 83 %).

4-((*Z*)-3-(3,5-Dicloro-4-vinilfenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-(etiltio)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F47)



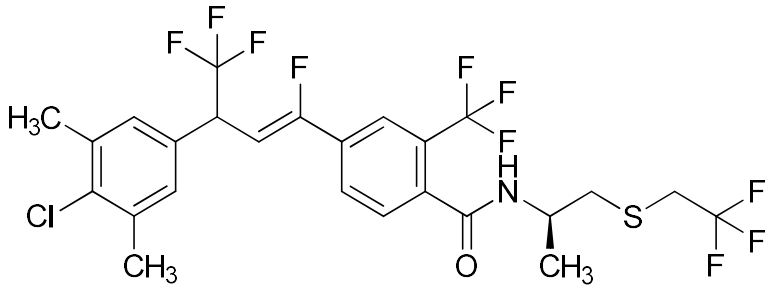
Aislado como una goma amarilla pálida (0.180 g, 37 %).

4-((*Z*)-3-(4-Bromo-3,5-diclorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-(etiltio)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F48)



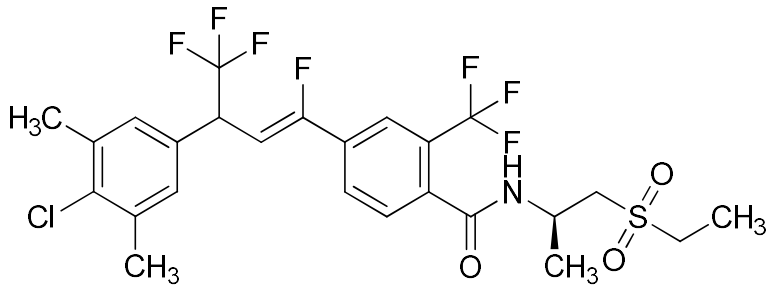
Aislado como un sólido amarillo pegajoso (0.200 g, 63 %).

4-((*Z*)-3-(4-cloro-3,5-dimetilfenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)tio)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F52)



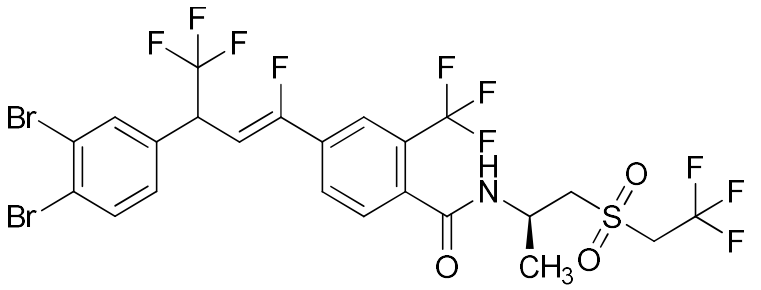
Aislado como una goma amarilla (0.150 g, 45 %).

4-((*Z*)-3-(4-cloro-3,5-dimetilfenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-(etilsulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F53)



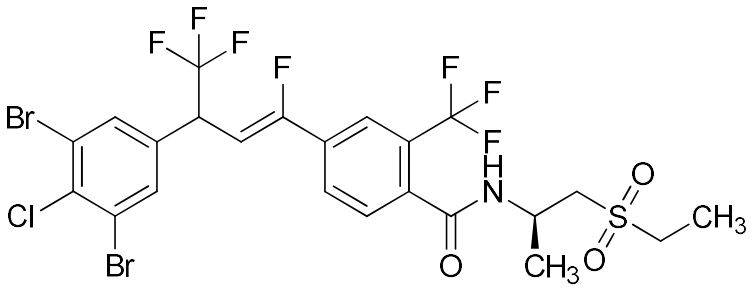
Aislado como una goma amarilla (0.180 g, 86 %).

4-((*Z*)-3-(3,4-Dibromofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F54)



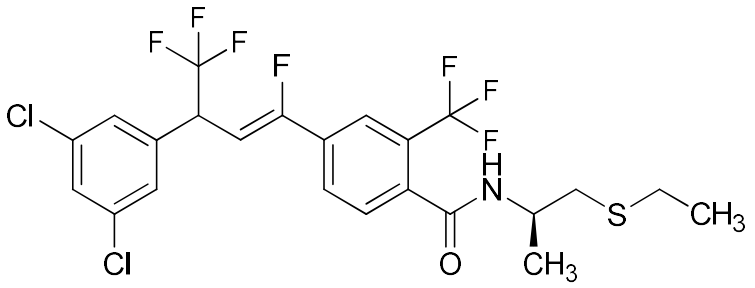
Aislado como un sólido amarillo pálido (0.150 g, 53 %).

4-((*Z*)-3-(3,5-Dibromo-4-clorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-(etilsulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F55)



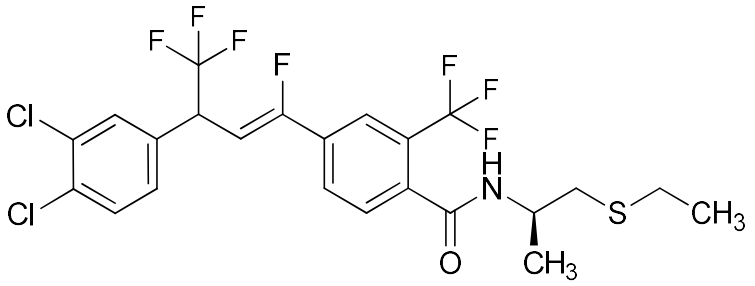
Aislado como un sólido amarillo pegajoso (0.250 g, 44 %).

4-((*Z*)-3-(3,5-Diclorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-(etiltio)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F59)



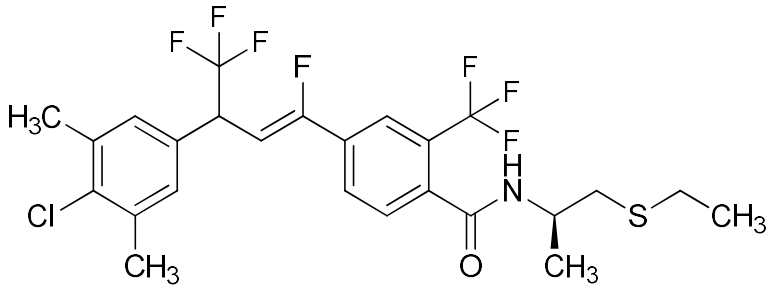
Aislado como una goma amarilla (0.180 g, 52 %).

4-((*Z*)-3-(3,4-Diclorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-(etiltio)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F60)



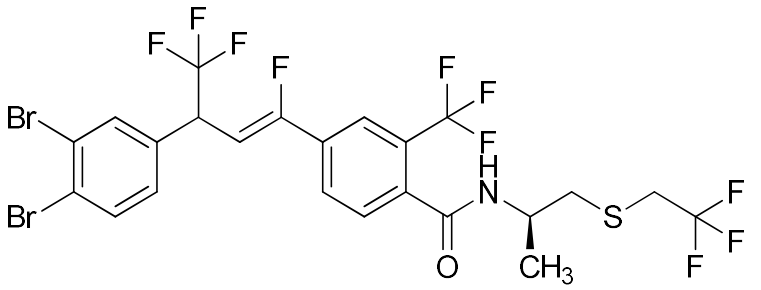
Aislado como una goma amarilla (0.180 g, 47 %).

4-((*Z*)-3-(4-cloro-3,5-dimetilfenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-(etiltio)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F61)



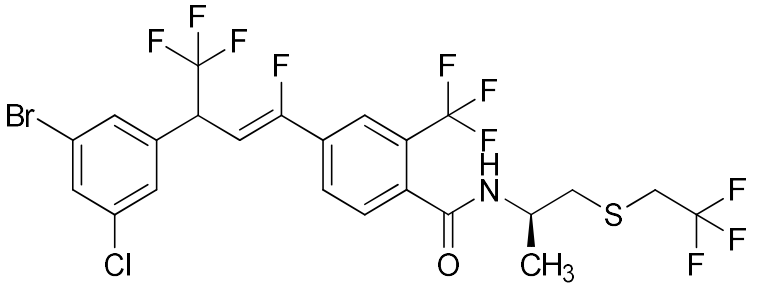
Aislado como una goma amarilla (0.180 g, 55 %).

4-((*Z*)-3-(3,4-Dibromofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)tio)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F62)



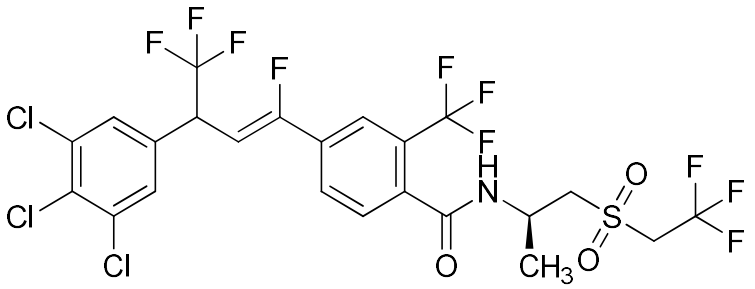
Aislado como una goma amarilla (0.300 g, 69 %).

4-((*Z*)-3-(3-Bromo-5-clorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)tio)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F64)



Aislado como una goma amarilla (0.230 g, 56 %).

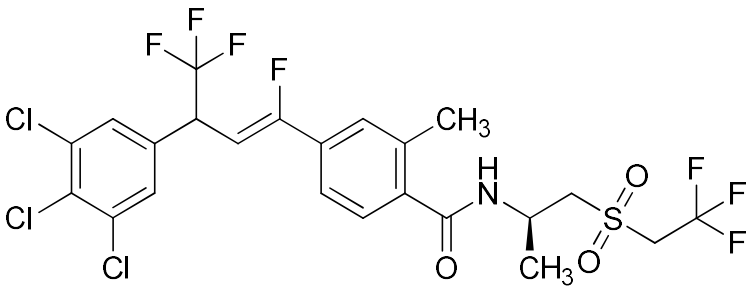
Ejemplo 15: Preparación de 4-((*Z*)-1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F2)



A un matraz de fondo redondo de 100 mL se añadió 4-((*Z*)-1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)tio)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida **(F1)** (0.135 g, 0.207 mmol), perborato de sodio (0.0920 g, 0.415 mmol), y ácido acético (2.1 mL). La reacción se agitó a 50 °C durante toda la noche. La mezcla de reacción se concentró y se purificó por cromatografía en columna rápida para proporcionar el compuesto del título como un sólido blanco (0.110 g, 42 %).

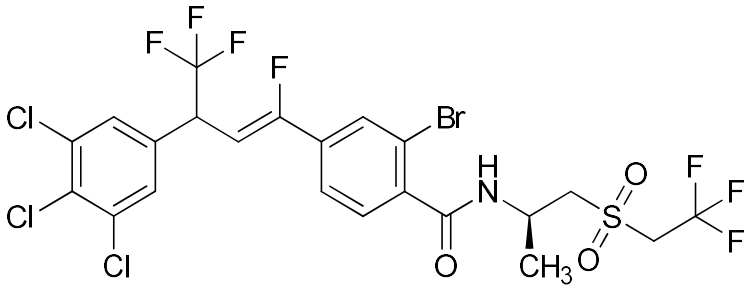
Los siguientes compuestos se prepararon de la misma manera que el procedimiento detallado en el ***Ejemplo 15***:

2-Metil-4-((*Z*)-1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)benzamida (F6)



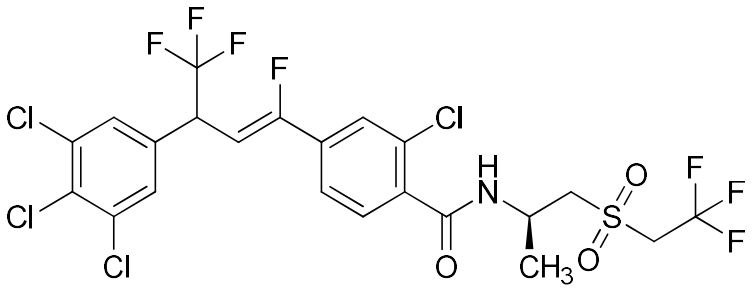
Aislado como un sólido blancuzco (0.056 g, 98 %).

2-Bromo-4-((*Z*)-1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)benzamida (F8)



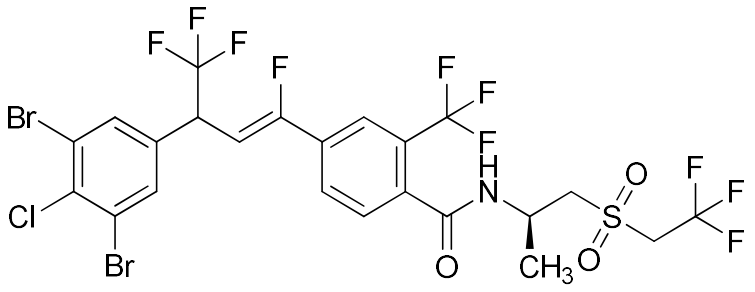
Aislado como un sólido blanco (0.062 g, 69 %).

2-cloro-4-((*Z*)-1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)benzamida (F11)



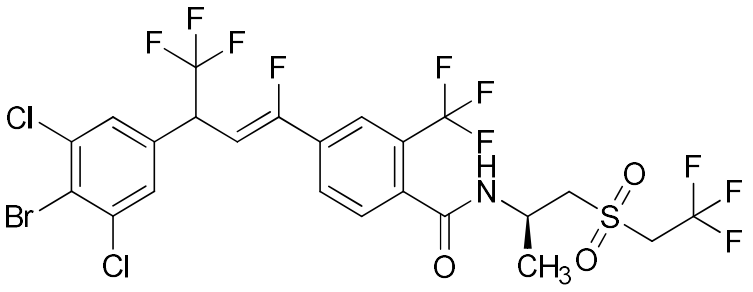
Aislado como un sólido blanco (0.123 g, 74 %).

4-((*Z*)-3-(3,5-Dibromo-4-clorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F22)



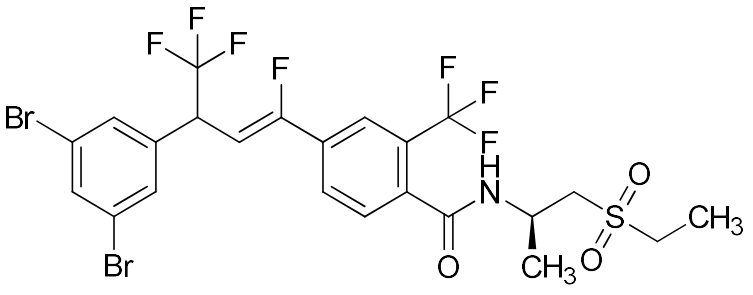
Aislado como un sólido blancuzco (0.108 g, 48 %).

4-((*Z*)-3-(4-Bromo-3,5-diclorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F25)



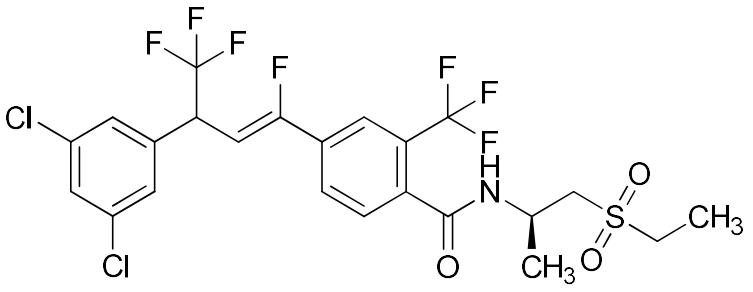
Aislado como un sólido blancuzco (0.107 g, 42 %).

4-((*Z*)-3-(3,5-Dibromofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-(etilsulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F42)



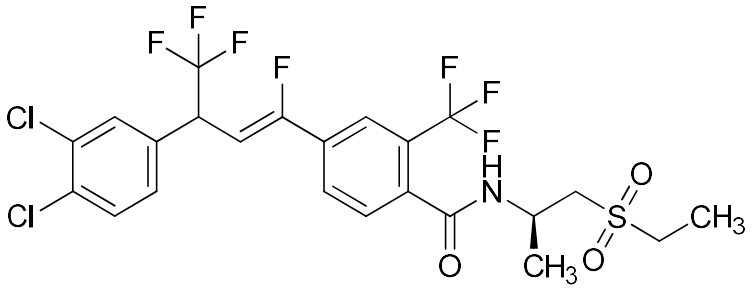
Aislado como una goma amarilla pálida (0.166 g, 71 %).

4-((*Z*)-3-(3,5-Diclorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-(etilsulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F45)



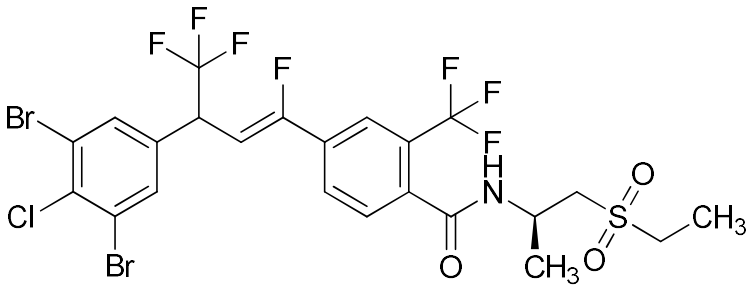
Aislado como un sólido amarillo pálido (0.120 g, 56 %).

4-((*Z*)-3-(3,4-Diclorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-(etilsulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F46)



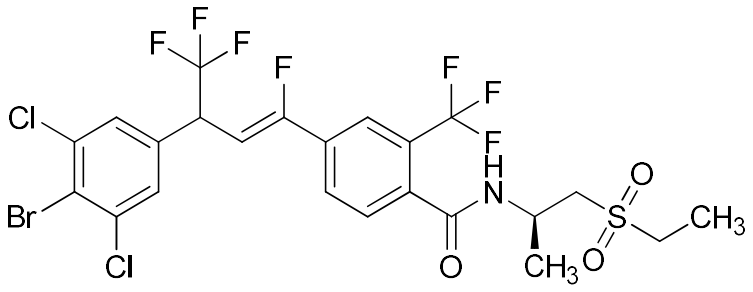
Aislado como una goma amarilla (0.100 g, 55 %).

4-((*Z*)-3-(3,5-Dibromo-4-clorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-(etilsulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F56)



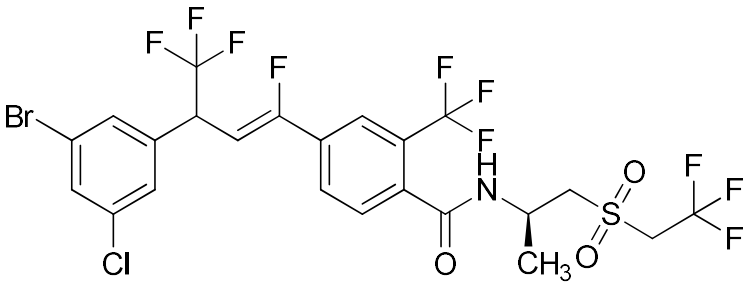
Aislado como un sólido blancuzco (0.115 g, 53 %).

4-((*Z*)-3-(4-Bromo-3,5-diclorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-(etilsulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F63)



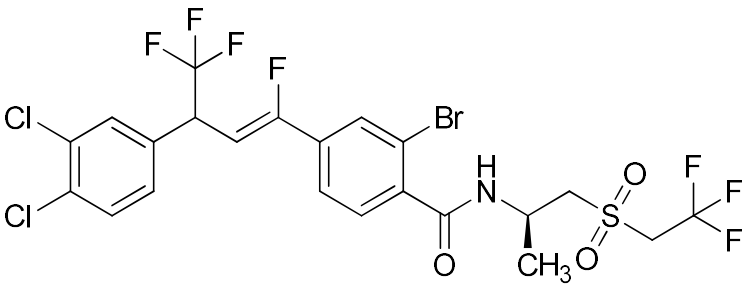
Aislado como una goma amarilla (0.075 g, 41 %).

4-((*Z*)-3-(3-Bromo-5-clorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F65)



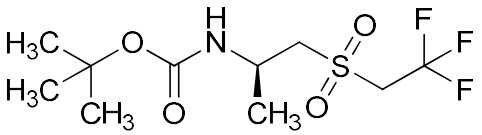
Aislado como un sólido amarillo (0.085 g, 39 %).

2-Bromo-4-((*Z*)-3-(3,4-diclorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)benzamida (F67)



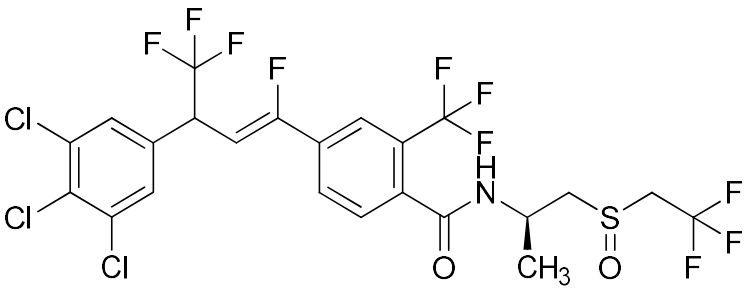
Aislado como una goma blanca (0.071 g, 92 %).

(*R*)-*terc*-butil (1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)carbamato (C55)



Aislado como un sólido blanco (0.600 g, 16 %): ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 7.03 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.12 3.83 (m, 2H), 3.13 2.89 (m, 2H), 1.39 (d, J = 1.4 Hz, 9H), 1.18 (d, J = 6.7 Hz, 3H).

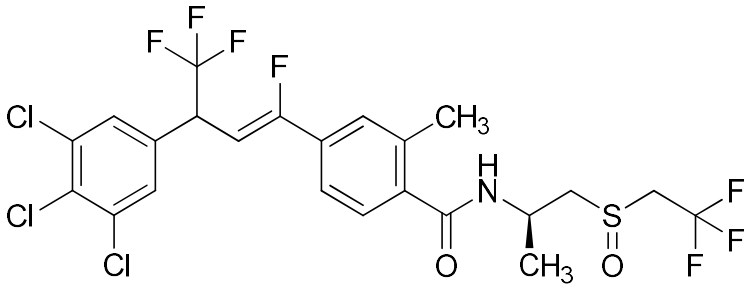
Ejemplo 16: Preparación de 4-((*Z*)-1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-*N*-((2*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfinil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F3)



A un vial de 25 mL se añadió 4-((*Z*)-1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)tio)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida **(F1)** (0.044 g, 0.068 mmol), peróxido de hidrógeno (0.0092 g, 0.081 mmol), y hexafluoropropanol (0.38 mL). La reacción se agitó por 48 horas. La mezcla de reacción se apagó con tiosulfato de sodio, se extrajo con diclorometano, se secó sobre sulfato de magnesio, se filtró y se concentró. La purificación mediante cromatografía en columna rápida proporcionó el compuesto del título como un sólido blancuzco (0.046 g, 97 %).

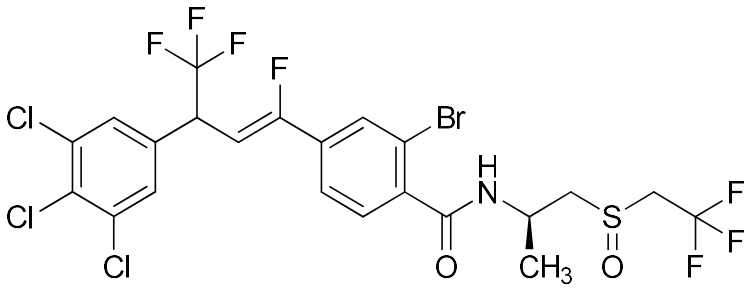
Los siguientes compuestos se prepararon de la misma manera que el procedimiento detallado en el ***Ejemplo 16***:

2-Metil-4-((*Z*)-1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-*N*-((2*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfinil)propan-2-il)benzamida (F5)



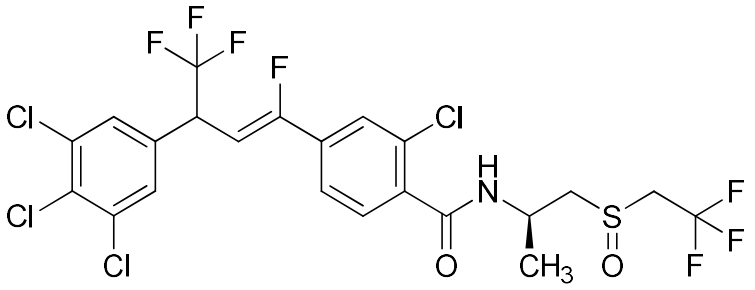
Aislado como un sólido blancuzco (0.034 g, 61 %).

2-Bromo-4-((*Z*)-1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-*N*-((2*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfinil)propan-2-il)benzamida (F9)



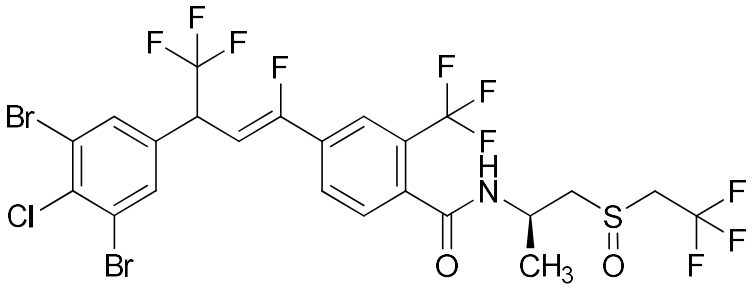
Aislado como un sólido blanco (0.043 g, 79 %).

2-Cloro-4-((*Z*)-1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-*N*-((2*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfinil)propan-2-il)benzamida (F12)



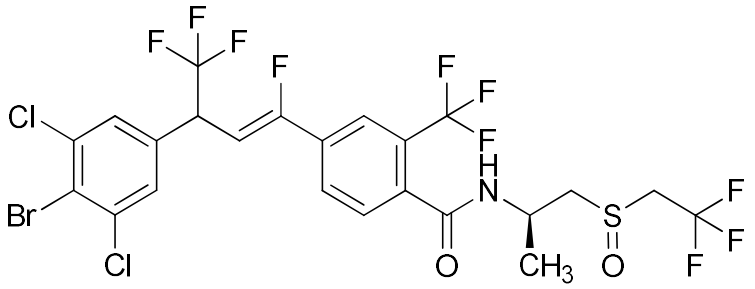
Aislado como un sólido blanco (0.098 g, 76 %).

4-((*Z*)-3-(3,5-Dibromo-4-clorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((2*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfinil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F23)



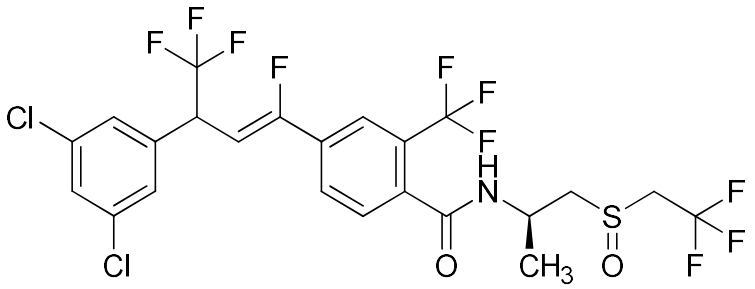
Aislado como un sólido amarillo (0.106 g, 51 %).

4-((*Z*)-3-(4-Bromo-3,5-diclorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((2*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfinil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F26)



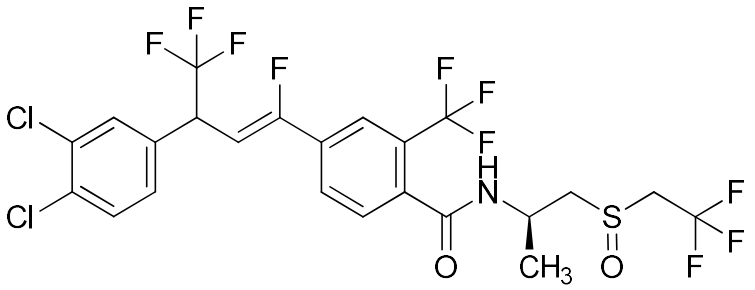
Aislado como un sólido blancuzco (0.115 g, 56 %).

4-((*Z*)-3-(3,5-Diclorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((2*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfinil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F27)



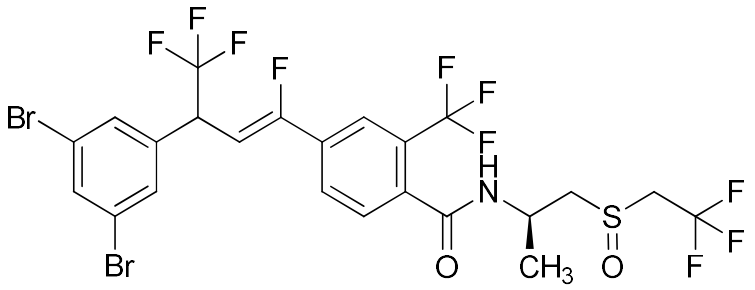
Aislado como un sólido amarillo pálido (0.100 g, 47 %).

4-((*Z*)-3-(3,4-Diclorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((2*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfinil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F28)



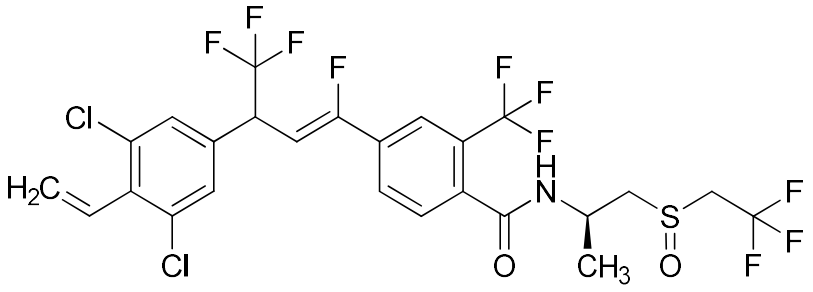
Aislado como un sólido blanco (0.160 g, 75 %).

4-((*Z*)-3-(3,5-Dibromofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((2*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfinil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F31)



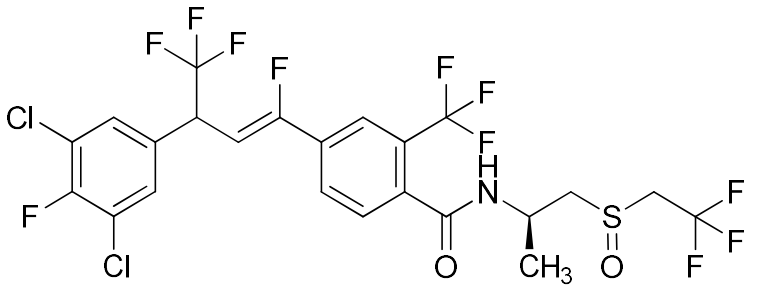
Aislado como una goma amarilla (0.128 g, 71 %).

4-((*Z*)-3-(3,5-Dicloro-4-vinilfenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((2*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfinil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F34)



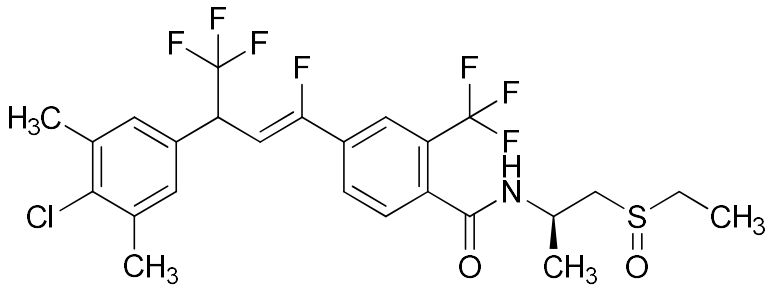
Aislado como un sólido blancuzco (0.121 g, 69 %).

4-((*Z*)-3-(3,5-Dicloro-4-fluorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((2*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfinil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F37)



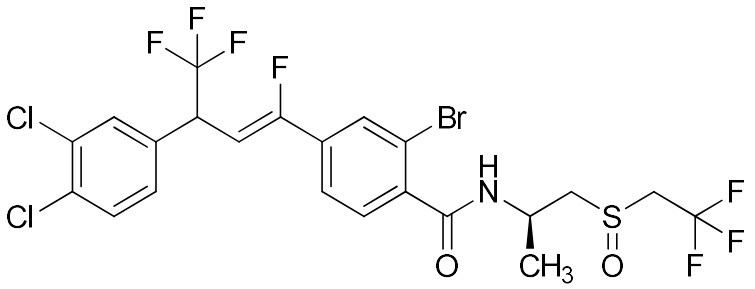
Aislado como un sólido amarillo pálido (0.150 g, 71 %).

4-((*Z*)-3-(4-cloro-3,5-dimetilfenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((2*R*)-1-(etilsulfinil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F44)



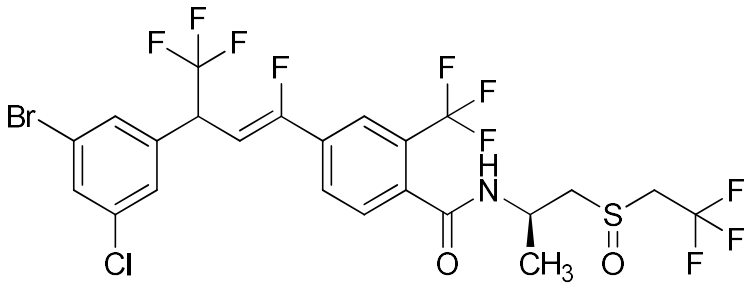
Aislado como un sólido blancuzco (0.100 g, 59 %).

2-Bromo-4-((*Z*)-3-(3,4-diclorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((2*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfinil)propan-2-il)benzamida (F66)



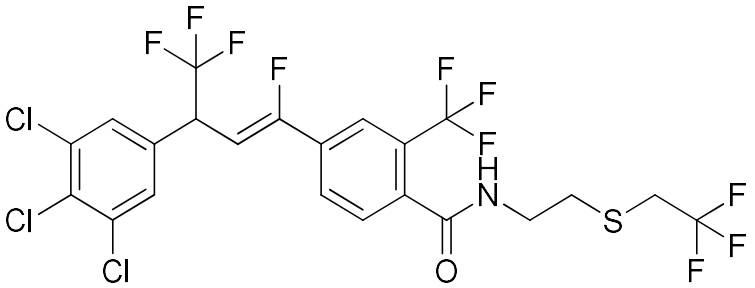
Aislado como una goma blanca (0.023 g, 34 %).

4-((*Z*)-3-(3-Bromo-5-clorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((2*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfinil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F68)



Aislado como una goma amarilla (0.107 g, 48 %).

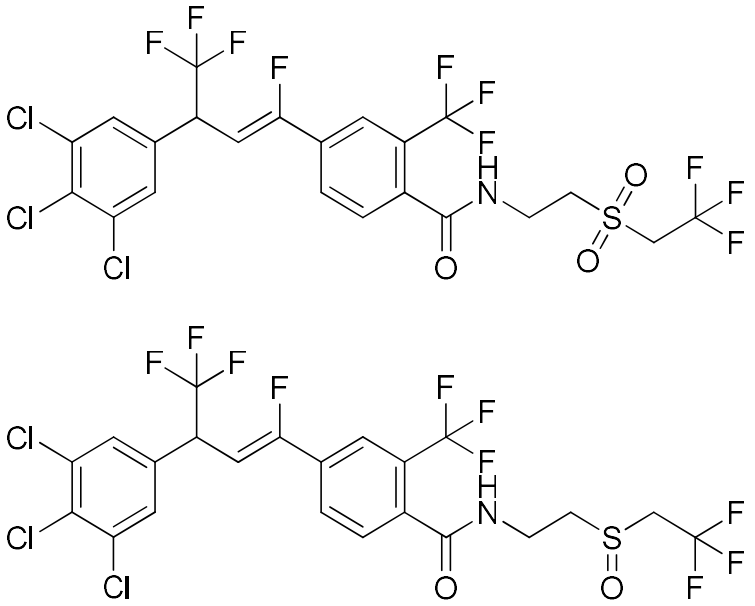
Ejemplo 17: Preparación de (*Z*)-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-*N*-(2-((2,2,2-trifluoroetil)tio)etil)-2-(trifluorometil)benzamida (F51)



A un vial de 25 mL se añadieron ácido (*Z*)-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico **(C2)** (0.800 g, 1.61 mmol) y diclorometano (4.0 mL). Luego se añadió cloruro de oxalilo (1.00 mL, 1.61 mmol) seguido por *N*,*N*-dimetilformamida (0.005 mL). Después de horas, la reacción se concentró, se diluyó con diclorometano, y se concentró. El material se colocó en un horno al vacío (temperatura ambiente) durante toda la noche. A un vial

separado de 25 mL se añadió hidrocloruro de 2-((2,2,2-trifluoroetil)tio)etanamina (0.484 g, 2.47 mmol) en tetrahidrofurano (10 mL). Se añadieron carbonato de litio (0.167 g, 2.26 mmol) y agua (2 mL) y el vial se revolvió seguido por agitación por 1 hora. El cloruro de ácido preparado se disolvió en tetrahidrofurano (5 mL) y la solución de amina se añadió con agitación. La reacción se concentró, se diluyó con acetato de etilo, y se lavó con ácido cítrico, agua, y salmuera. La solución orgánica resultante se secó sobre sulfato de magnesio, se filtró y se concentró. La purificación por cromatografía en columna rápida usando 50 % acetato de etilo en hexanos como eluyente proporcionó el compuesto del título como un aceite marrón (0.868 g, 76 %).

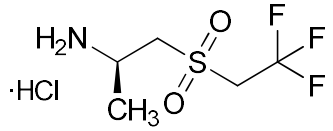
Ejemplo 18: Preparación de (*Z*)-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-*N*-(2-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)etil)-2-(trifluorometil)benzamida (F49) y (*Z*)-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-*N*-(2-((2,2,2-trifluoroetil)sulfinil)etil)-2-(trifluorometil)benzamida (F50)



A un vial de 25 mL se añadió (*Z*)-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-*N*-(2-((2,2,2-trifluoroetil)tio)etil)-2-(trifluorometil)benzamida **(F51)** (0.795 g, 1.25 mmol) y ácido acético (8.32 mL). Perborato de sodio (0.288 g, 1.87 mmol) se añadió y la reacción se calentó a 55 °C. La mezcla de reacción se concentró con heptanos a 40 °C hasta hacer azeótropo el ácido

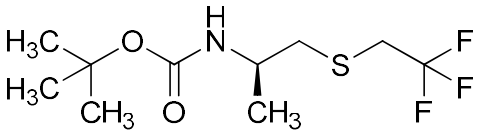
acético. La purificación por cromatografía en columna rápida usando 0-100 % acetato de etilo en hexanos como eluyente proporcionó el compuesto del título **(F49)** como un aceite incoloro (0.113 g, 12 %) y el compuesto del título **(F50)** como un aceite incoloro (0.190 g, 21 %).

Ejemplo 19: Preparación de hidrocloruro (*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-amina (C56)



(*R*)-*terc*-butil (1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)carbamato **(C57)** (0.300 g, 0.983 mmol) se trató con cloruro de hidrógeno (4 M en dioxano, 5.00 mL, 20.0 mmol) y se agitó durante toda la noche. La suspensión resultante se concentró para proporcionar el compuesto del título como un sólido marrón (0.232 g, 93 %): ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 8.44 (s, 3H), 4.93 (qd, J = 10.1, 2.7 Hz, 2H), 3.86 - 3.69 (m, 2H), 3.66 - 3.55 (m, 1H), 1.41 (d, J = 6.3 Hz, 3H); ^{13}C NMR (101 MHz, DMSO-d_6) δ 122.13 (q, J_{CF} = 277.1 Hz), 57.08, 54.66 (q, J_{CF} = 29.7 Hz), 41.39, 18.51; ^{19}F NMR (376 MHz, DMSO-d_6) δ -59.43.

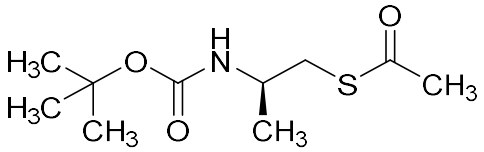
Ejemplo 20: Preparación de (*R*)-*terc*-butil (1-((2,2,2-trifluoroetil)tio)propan-2-il)carbamato (C57)



A un matraz de fondo redondo de 100 mL se añadió hidróxido de potasio (0.465 g, 8.29 mmol) en metanol desgasificado (16.0 mL). (*R*)-*S*-(2-((*terc*-Butoxicarbonil)amino)propil) etanotioato **(C58)** (1.50 g, 5.53 mmol) se añadió seguido por 2,2,2-trifluoroetil trifluorometanosulfonato (2.57 g, 11.1 mmol). La reacción se agitó a temperatura ambiente durante toda la noche. La mezcla de reacción se concentró. El residuo se diluyó con agua y acetato de etilo. Las capas se separaron y la capa orgánica se lavó con bicarbonato de sodio acuoso saturado, se secó sobre sulfato de magnesio, se filtró y se concentró. La purificación por cromatografía en columna

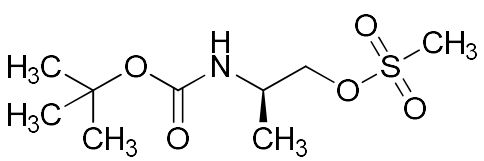
rápida usando 0-30 % acetato de etilo en hexanos proporcionó el compuesto del título como un líquido incoloro (1.07 g, 60 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 4.54 (s, 1H), 3.86 (s, 1H), 3.13 (qd, *J* = 9.9, 2.6 Hz, 2H), 2.77 (d, *J* = 5.9 Hz, 2H), 1.45 (s, 9H), 1.22 (dd, *J* = 6.7, 1.4 Hz, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -66.56; IR (película delgada) 3340, 2978, 2934, 1687, 1505 cm^{-1}.

Ejemplo 21: Preparación de (*R*)-S-(2-((*terc*-butoxicarbonil)amino)propil) etanotioato (C58)



A un matraz de fondo redondo de 100 mL se añadió S-ácido etanotioico (2.23 mL, 31.6 mmol) y *N*,*N*-dimetilformamida (22.6 mL) que se colocó bajo una atmósfera de nitrógeno. Se añadió hidruro de sodio (60 % en aceite, 1.14 g, 28.4 mmol) en forma de porciones y la solución naranja se agitó por 15 minutos. Se añadió (*R*)-2-((*terc*-Butoxicarbonil)amino)propil metanosulfonato **(C59)** (4.00 g, 15.8 mmol) y la mezcla de reacción se agitó. La reacción se diluyó con acetato de etilo y agua. Las capas se separaron y la capa acuosa se extrajo con acetato de etilo (2x). Las capas orgánicas combinadas se lavó con agua (2x), salmuera, se secó sobre sulfato de magnesio, se filtró y se concentró. La purificación por cromatografía en columna rápida usando 0-50 % acetato de etilo en hexanos proporcionó el compuesto del título como un sólido blancuzco (1.29 g, 33 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 4.61 (s, 1H), 4.04 - 3.65 (m, 1H), 3.13 - 2.92 (m, 2H), 2.36 (s, 3H), 1.44 (s, 9H), 1.17 (d, *J* = 6.7 Hz, 3H); ^{13}C NMR (101 MHz, $CDCl_3$) δ 195.55, 155.15, 79.32, 46.35, 35.08, 30.57, 28.38, 20.06; IR (película delgada) 3350, 2976, 2931, 1686, 1513 cm^{-1}.

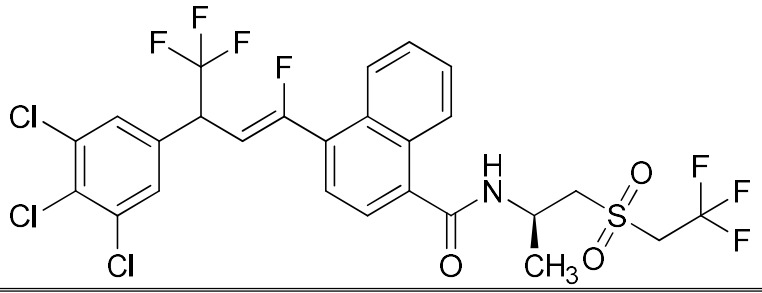
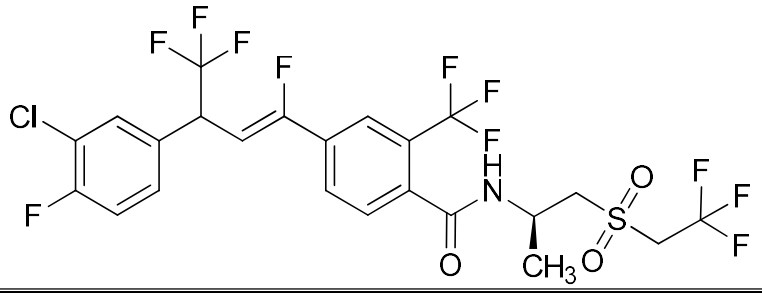
Ejemplo 22: Preparación de (*R*)-2-((*terc*-butoxicarbonil)amino)propil metanosulfonato (C59)

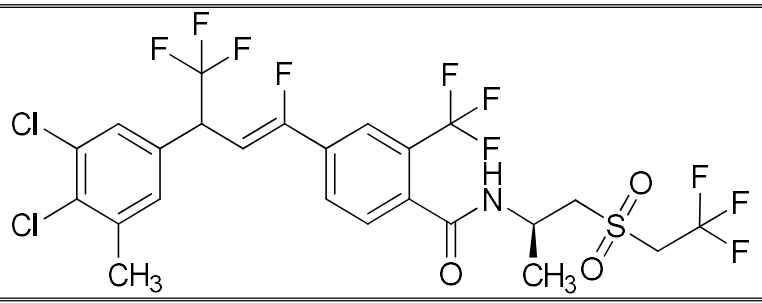
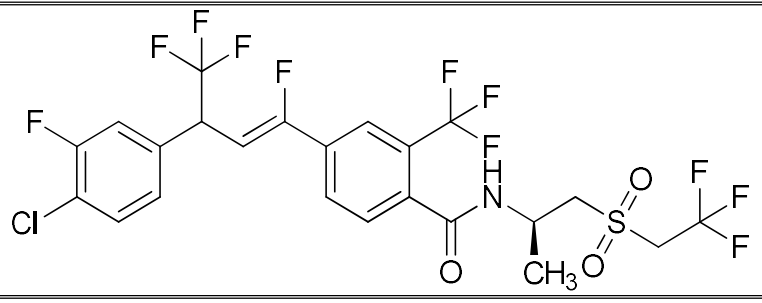
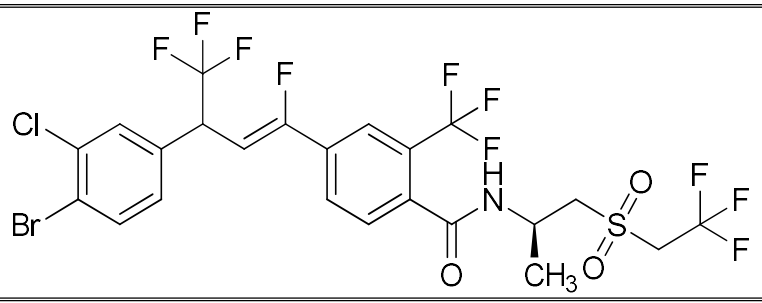
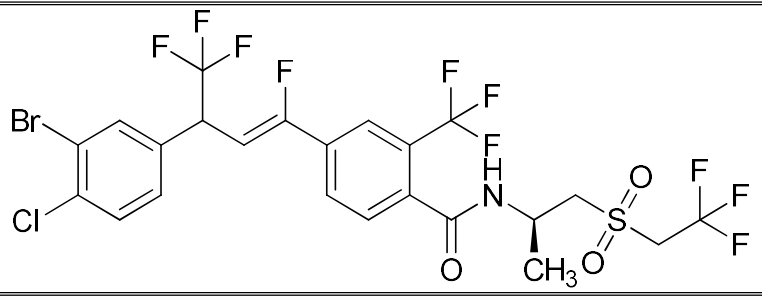
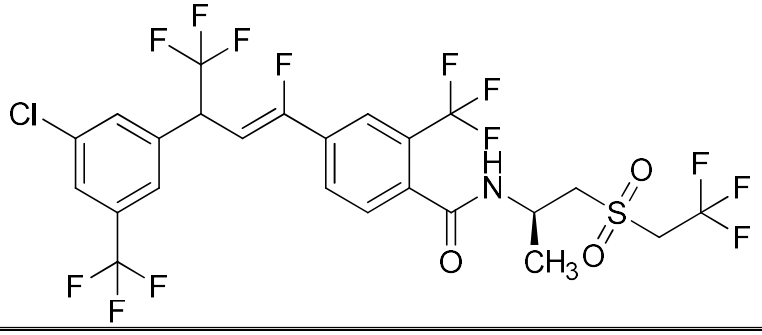


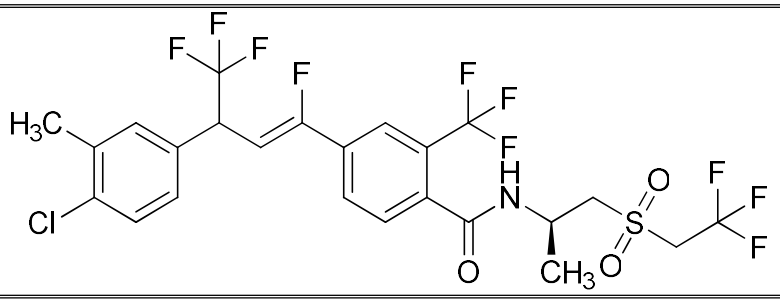
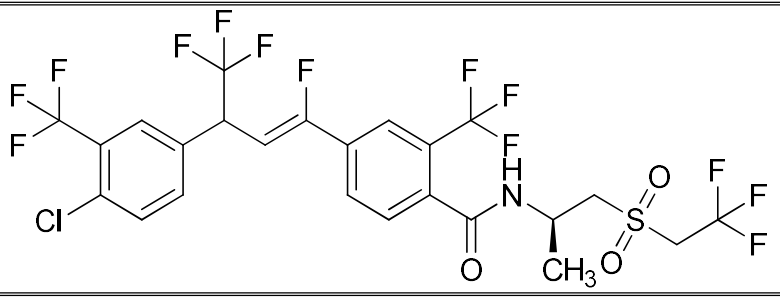
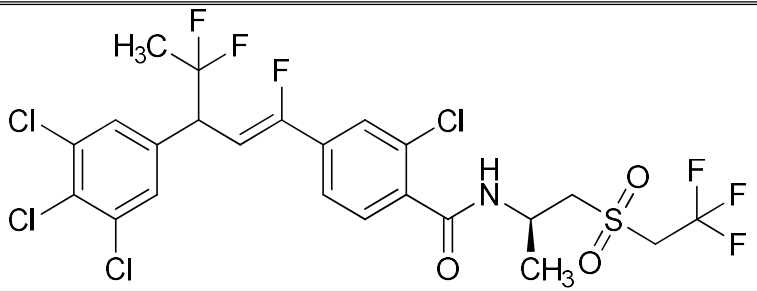
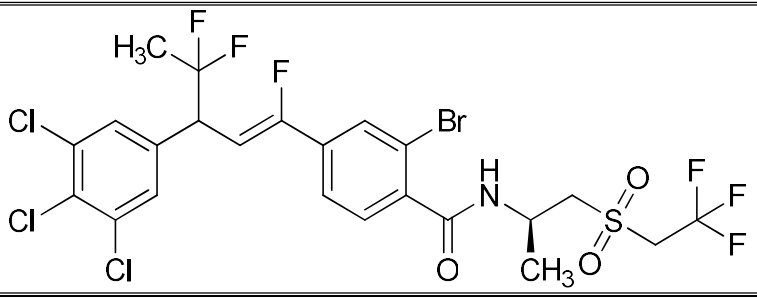
A un matraz de fondo redondo de 250 mL se añadió (*R*)-*terc*-butil (1-hidroxipropan-2-il)carbamato (1.15 g, 6.56 mmol) y diclorometano (26.3 mL). Se añadió trietilamina (2.74 mL, 19.7 mmol), y la solución se enfrió hasta 1 °C utilizando a baño agua/hielo. Se añadió cloruro de metanosulfonilo (0.559 mL, 7.22 mmol) en porciones durante 1 hora, y la mezcla de reacción se agitó durante toda la noche. La mezcla de reacción se diluyó con agua, y las capas se separaron. La capa acuosa se extrajo con diclorometano. Los extractos combinados se secaron sobre sulfato de magnesio, se filtró y se concentró para proporcionar el compuesto del título como un sólido blancuzco (1.30 g, 78 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 4.91 - 4.59 (m, 1H), 4.38 - 4.10 (m, 2H), 3.97 (ddd, *J* = 13.9, 10.1, 5.5 Hz, 1H), 3.04 (s, 3H), 1.45 (s, 9H), 1.24 (d, *J* = 6.9 Hz, 3H); ^{13}C NMR (101 MHz, CDCl3) δ 155.08, 79.79, 72.07, 45.49, 37.27, 28.31, 17.12.

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,** *y* **P11**

Tabla 1. Estructura y método de preparación de moléculas proféticas

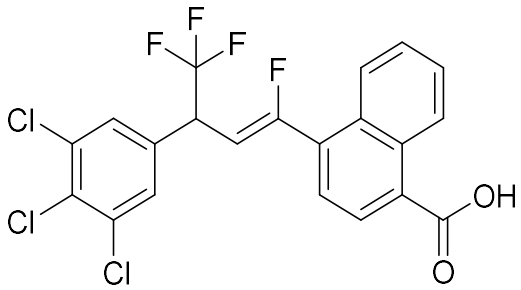
No.	Estructura
P1	
P2	

P3	
P4	
P5	
P6	
P7	

P8	
P9	
P10	
P11	

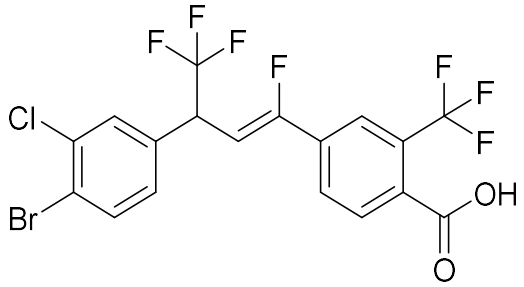
*Los siguientes compuestos se prepararon de la misma manera que el procedimiento detallado en el **Ejemplo 1**:*

Ácido (*Z*)-4-(1,4,4,4-Tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-1-naftóico (C60)



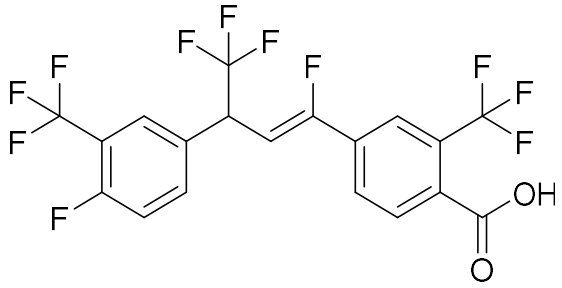
Aislado como un sólido amarillo (0.85 g, 53 %): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 8.30 (d, *J* = 7.5 Hz, 1H), 8.07 - 8.05 (m, 1H), 7.70 - 7.61 (m, 4H), 7.49 (s, 2H), 5.69 (dd, *J* = 9.9, 31.2 Hz, 1H), 4.75 - 4.69 (m, 1H); IR (película delgada) 3445, 1684, 1260, 750 cm^{-1}; ESIMS *m/z* 475 ([M]$^-$).

Ácido (*Z*)-4-(3-(4-Bromo-3-clorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C61)



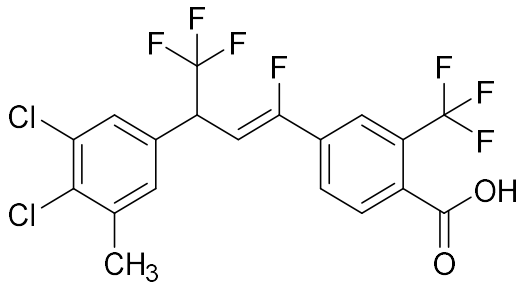
Aislado como una goma marrón (2.5 g, 68 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.02 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 7.94 (s, 1H), 7.83 (d, *J* = 7.2 Hz, 1H), 7.66 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 7.50 (s, 1H), 7.17 (dd, *J* = 2.0, 8.4 Hz, 1H), 5.96 (dd, *J* = 9.2, 32.0 Hz, 1H), 4.65 - 4.61 (m, 1H); IR (película delgada) 3447, 2927, 1715, 750 cm^{-1}; ESIMS *m/z* 504 ([M-H]$^-$).

Ácido (*Z*)-4-(1,4,4,4-Tetrafluoro-3-(4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C62)



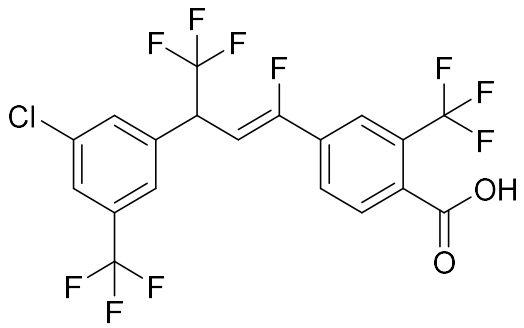
Aislado como una goma marrón (1.0 g, 42 %): ^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 13.80 (br s, 1H), 8.16 (s, 1H), 8.12 - 8.07 (m, 3H), 7.92 (d, *J* = 8.7 Hz, 1H), 7.66 (d, *J* = 10.2 Hz, 1H), 6.96 (dd, *J* = 9.9, 35.4 Hz, 1H), 5.36 - 5.29 (m, 1H); IR (película delgada) 2926, 1715, 765 cm^{-1}; ESIMS *m/z* 477 ([M-H]$^-$).

Ácido (*Z*)-4-(3-(3,4-Dicloro-5-metilfenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C63)



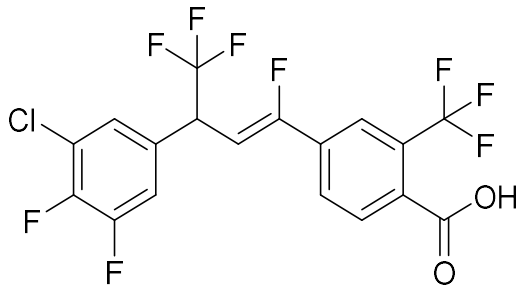
Aislado como una goma marrón (1.7 g, 42 %): ^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 13.80 (s, 1H), 8.14 (s, 1H), 8.09 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.91 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.83 (s, 1H), 7.65 (s, 1H), 6.87 (dd, *J* = 9.9, 36.0 Hz, 1H), 5.13 - 5.07 (m, 1H), 2.42 (s, 3H); IR (película delgada) 3446, 2928, 1716 cm^{-1}; ESIMS *m/z* 473 ([M-H]$^-$).

Ácido (*Z*)-4-(3-(3-cloro-5-(trifluorometil)fenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C64)



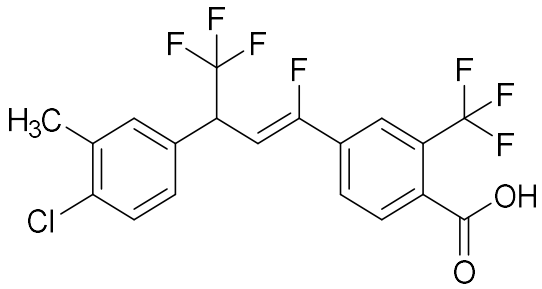
Aislado como un sólido marrón (1.0 g, 47 %): ^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 13.80 (s, 1H), 8.17 - 8.12 (m, 3H), 7.91 - 7.86 (m, 3H), 6.87 (dd, *J* = 9.9, 36.0 Hz, 1H), 5.39 - 5.32 (m, 1H); ESIMS *m/z* 493 ([M-H]$^-$).

Ácido (*Z*)-4-(3-(3-cloro-4,5-difluorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C65)



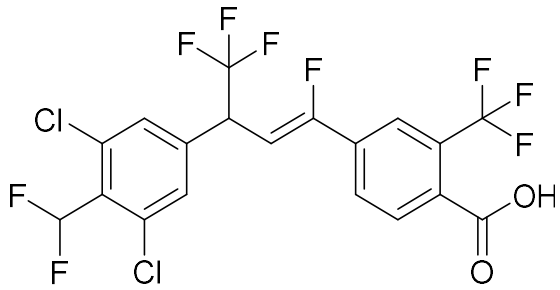
Aislado como una goma marrón (0.55 g, 56 %): ^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 13.92 (br s, 1H), 8.14 (s, 1H), 8.08 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.92 - 7.85 (s, 3H), 6.87 (dd, *J* = 9.9, 35.4 Hz, 1H), 5.24 - 5.18 (m, 1H); IR (película delgada) 3085, 1715, 659 cm^{-1}; ESIMS *m/z* 461 ([M-H]$^-$).

Ácido (*Z*)-4-(3-(4-cloro-3-metilfenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C66)



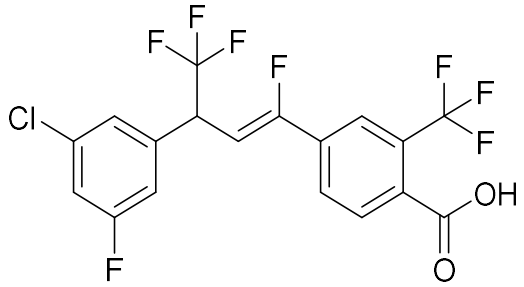
Aislado como un aceite gomoso marrón (0.45 g, 75 %): ^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 13.60 (br s, 1H), 7.98 (s, 1H) 7.92 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.90 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.53 - 7.38 (m, 2H), 7.04 (dd, *J* = 8.4, 15.6 Hz, 1H), 6.89 (d, *J* = 15.9 Hz, 1H), 4.76 - 4.63 (m, 1H), 2.35 (s, 3H); IR (película delgada) 3436, 1727, 1150, 765 cm^{-1}; ESIMS *m/z* 421 ([M-H]$^-$).

Ácido (*Z*)-4-(3-(3,5-Dicloro-4-(difluorometil)fenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C67)



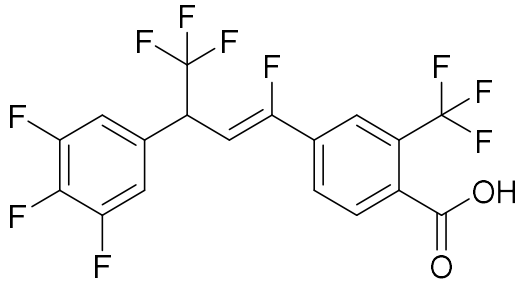
Aislado como una goma amarilla (0.45 g, 25 %): ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 13.80 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.09 (dd, *J* = 8.0 Hz, 1H), 8.00 (s, 2H), 7.92 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 7.45 (t, *J* = 12.9 Hz, 1H), 6.90 (dd, *J* = 10.0, 35.6 Hz, 1H), 5.33 - 5.31 (m, 1H); ESIMS *m/z* 509 ([M-H]$^-$).

Ácido (*Z*)-4-(3-(3-cloro-5-fluorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C68)



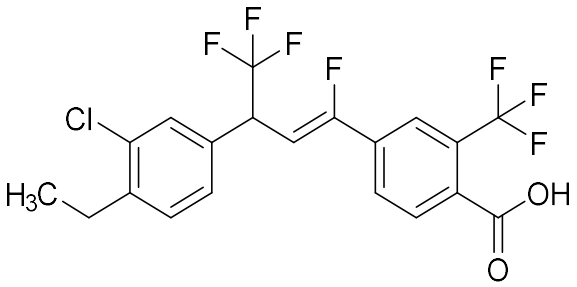
Aislado como una goma marrón (0.40 g, 63 %): ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 13.89 (br s, 1H), 8.16 (s, 1H), 8.09 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 7.93 - 7.86 (m, 1H), 7.69 (s, 1H), 7.63 (d, *J* = 9.6 Hz, 1H), 7.52 - 7.49 (m, 1H), 6.87 (dd, *J* = 10.4, 35.6 Hz, 1H), 5.23 - 5.18 (m, 1H); IR (película delgada) 2924, 1698, 1258 cm^{-1}; ESIMS *m/z* 443 ([M-H]$^-$).

Ácido (*Z*)-4-(1,4,4,4-Tetrafluoro-3-(3,4,5-trifluorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C69)



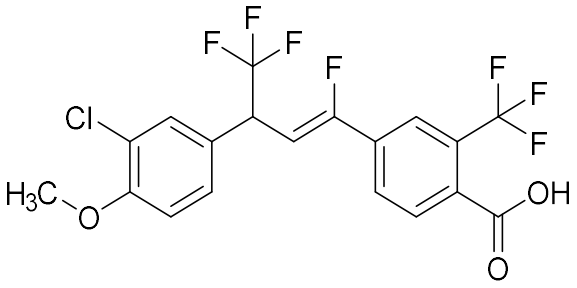
Aislado como una goma marrón (0.8 g, 56 %): ^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 13.98 (br s, 1H), 8.14 (br s, 1H), 8.08 - 8.05 (m, 1H), 7.92 - 7.89 (m, 1H), 7.77 - 7.72 (m, 2H), 6.85 (dd, *J* = 9.9, 35.4 Hz, 1H), 5.23 - 5.16 (m, 1H); IR (película delgada) 3100, 1715 cm^{-1}; ESIMS *m/z* 445 ([M-H]$^-$).

Ácido (*Z*)-4-(3-(3-cloro-4-etilfenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C70)



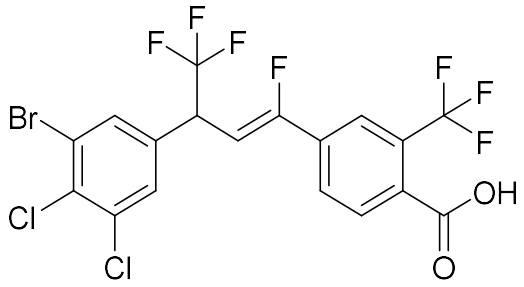
Aislado como una goma amarilla (0.60 g, 53 %): ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 13.75 (br s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.01 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 7.90 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 7.78 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 7.55 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 7.41 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 6.87 (dd, *J* = 9.6, 35.6 Hz, 1H), 5.08 - 5.04 (m, 1H), 2.73 - 2.67 (m, 2H), 1.17 (t, *J* = 6.0 Hz, 3H); ESIMS *m/z* 453 ([M-H]$^-$).

Ácido (*Z*)-4-(3-(3-cloro-4-metoxifenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C71)



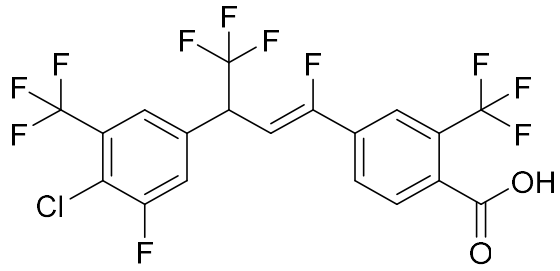
Aislado como una goma amarilla (0.46 g, 66 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.98 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 7.93 (s, 1H), 7.81 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 7.42 (s, 1H), 7.26 (s, 1H), 6.95 (d, *J* = 8.8 Hz, 1H), 5.96 (dd, *J* = 10.0, 32.8 Hz, 1H), 4.62 - 4.57 (m, 1H), 3.91 (s, 3H); ESIMS *m/z* 455 ([M-H]$^-$).

Ácido (*Z*)-4-(3-(3-Bromo-4,5-diclorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C72)



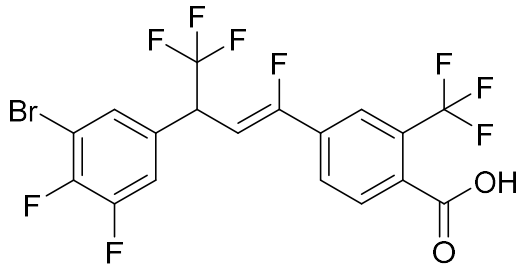
Aislado como una goma amarilla (2.6 g, 27 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 11.66 (s, 1H), 8.04 (d, *J* = 7.3 Hz, 1H), 7.97 (d, *J* = 1.7 Hz, 1H), 7.84 (dd, *J* = 8.2, 1.8 Hz, 1H), 7.60 (d, *J* = 2.0 Hz, 1H), 7.49 (d, *J* = 2.1 Hz, 1H), 5.91 (dd, *J* = 32.4, 9.6 Hz, 1H), 4.62 (p, *J* = 8.8 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -57.06, -66.85, -110.35; ESIMS *m/z* 540 ($[M-H]^-$).

Ácido (*Z*)-4-(3-(4-cloro-3-fluoro-5-(trifluorometil)fenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C73)



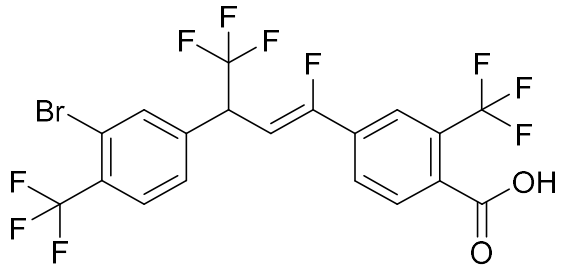
Aislado como una goma amarilla (1.1 g, 54 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.03 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 7.98 - 7.93 (m, 2H), 7.84 (dd, *J* = 8.1, 1.8 Hz, 1H), 7.54 (s, 1H), 7.44 (d, *J* = 8.7 Hz, 1H), 5.91 (dd, *J* = 32.4, 9.5 Hz, 1H), 4.72 (p, *J* = 8.8 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -59.64, -62.52, -69.35 (d, *J* = 2.1 Hz), -109.31, -111.51 (d, *J* = 2.3 Hz); ESIMS *m/z* 512 ($[M-H]^-$).

Ácido (*Z*)-4-(3-(3-Bromo-4,5-difluorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C74)



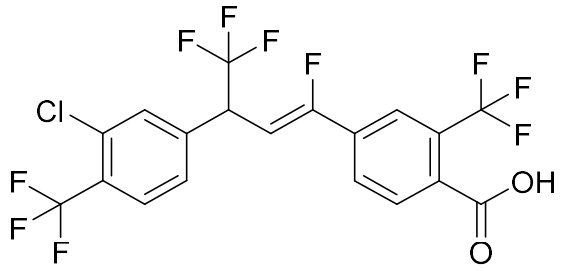
Aislado como una goma amarilla (1.3 g, 54 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 9.76 (s, 1H), 8.05 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 8.01 - 7.91 (m, 1H), 7.84 (dd, *J* = 8.2, 1.8 Hz, 1H), 7.39 (dt, *J* = 4.9, 2.1 Hz, 1H), 7.22 (ddd, *J* = 10.1, 6.6, 2.2 Hz, 1H), 5.90 (dd, *J* = 32.5, 9.6 Hz, 1H), 4.62 (q, *J* = 8.9 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -59.58, -69.53 (d, *J* = 2.3 Hz), -110.42, -129.11 (d, *J* = 21.5 Hz), -132.15 (d, *J* = 21.4 Hz); ESIMS *m/z* 505 ($[M-H]^-$).

Ácido (*Z*)-4-(3-(3-Bromo-4-(trifluorometil)fenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C75)



Aislado como un aceite naranja (0.749 g, 65 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.03 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 7.96 (d, *J* = 1.6 Hz, 1H), 7.86 - 7.80 (m, 1H), 7.77 (d, *J* = 1.7 Hz, 1H), 7.73 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 7.51 - 7.44 (m, 1H), 5.94 (dd, *J* = 32.5, 9.6 Hz, 1H), 4.72 (p, *J* = 8.9 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -59.59, -62.85, -69.07 (d, *J* = 2.3 Hz), -112.26; IR (película delgada) 3084, 1709 cm^{-1}; ESIMS *m/z* 539 ($[M-H])^-$).

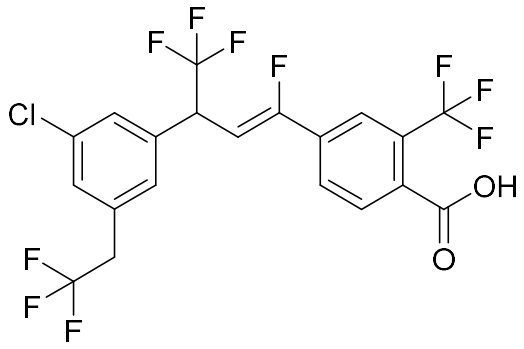
Ácido (*Z*)-4-(3-(3-cloro-4-(trifluorometil)fenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C76)



Aislado como un aceite naranja (1.22 g, 58 %): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 8.04 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 7.96 (d, *J* = 1.7 Hz, 1H), 7.84 (dd, *J* = 8.3, 1.8 Hz, 1H), 7.74 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 7.57 (d, *J* =

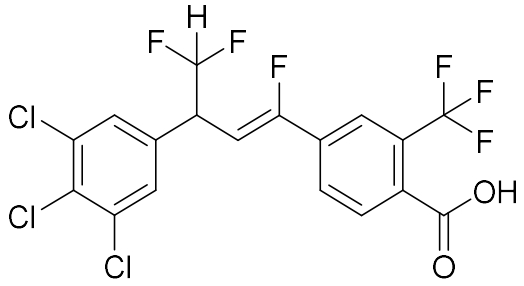
1.6 Hz, 1H), 7.43 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 5.94 (dd, *J* = 32.5, 9.6 Hz, 1H), 4.73 (p, *J* = 8.9 Hz, 1H); IR (película delgada) 3022, 1710 cm^{-1}; ESIMS *m/z* 493 ($[M-H]^-$).

Ácido (*Z*)-4-(3-(3-cloro-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C77)



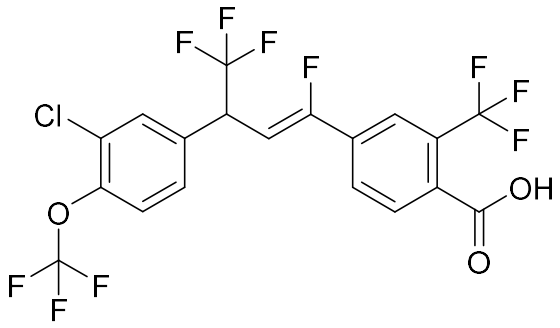
Aislado como un aceite naranja (0.513 g, 59 %): ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.03 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 7.96 (s, 1H), 7.83 (dd, *J* = 8.2, 1.3 Hz, 1H), 7.40 (s, 1H), 7.33 (s, 1H), 7.22 (s, 1H), 5.93 (dd, *J* = 32.6, 9.7 Hz, 1H), 4.67 (p, *J* = 8.9 Hz, 1H), 3.39 (q, *J* = 10.5 Hz, 2H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -59.60, -65.69, -69.25 (d, *J* = 2.3 Hz), -112.97; IR (película delgada) 3018, 1710 cm^{-1}; ESIMS *m/z* 507 ($[M-H]^-$).

Ácido (*Z*)-4-(1,4,4-Trifluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C78)



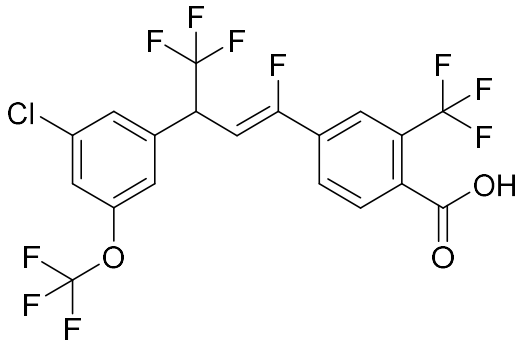
Aislado como una espuma marrón (1.8 g, 49 %): ^1H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 8.04 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.97 (s, 1H), 7.84 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 7.42 (s, 2H), 6.25 - 5.80 (m, 2H), 4.55 - 4.23 (m, 1H); IR (película delgada) 2979, 1706, 1615, 1573, 1404 cm^{-1}; ESIMS *m/z* 475 ($[M-H]^-$).

Ácido **(*Z*)-4-(3-(3-cloro-4-(trifluorometoxi)fenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C79)**



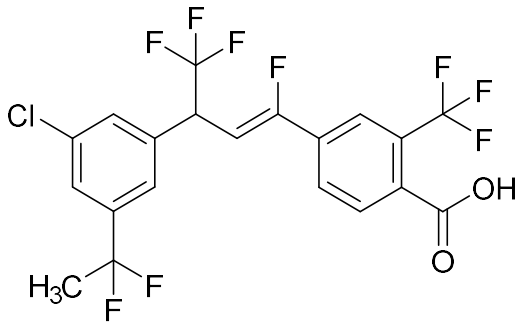
Aislado como un aceite naranja (0.428 g, 56 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.04 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 7.99 - 7.94 (m, 1H), 7.84 (dd, *J* = 8.2, 1.8 Hz, 1H), 7.54 (s, 1H), 7.36 (q, *J* = 1.0 Hz, 2H), 5.93 (dd, *J* = 32.5, 9.7 Hz, 1H), 4.68 (p, *J* = 8.9 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -57.82, -59.60, -69.36 (d, *J* = 2.2 Hz), -112.78 (d, *J* = 2.7 Hz); IR (película delgada) 3010, 1711, 1497, 1412 cm^{-1}; ESIMS *m/z* 509 ([M-H]$^-$).

Ácido (*Z*)-4-(3-(3-cloro-5-(trifluorometoxi)fenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C80)



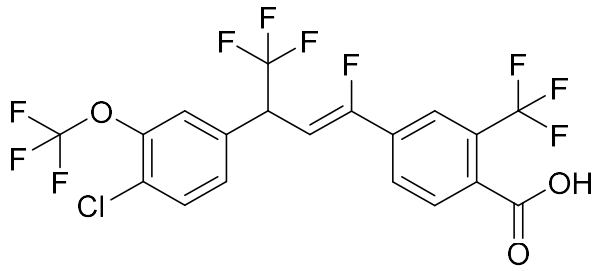
Aislado como un aceite naranja (0.744 g, 68 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.04 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 8.01 - 7.94 (m, 1H), 7.84 (dd, *J* = 8.2, 1.7 Hz, 1H), 7.36 (d, *J* = 1.6 Hz, 1H), 7.27 (dt, *J* = 2.3, 1.1 Hz, 1H), 7.17 (s, 1H), 5.91 (dd, *J* = 32.4, 9.6 Hz, 1H), 4.68 (p, *J* = 8.8 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -57.93, -59.60, -69.24 (d, *J* = 2.5 Hz), -112.31 (d, *J* = 2.6 Hz); IR (película delgada) 3005, 1712, 1605, 1507, 1408 cm^{-1}; ESIMS *m/z* 509 ([M-H]$^-$).

Ácido **(*Z*)-4-(3-(3-cloro-5-(1,1-difluoroetil)fenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C81)**



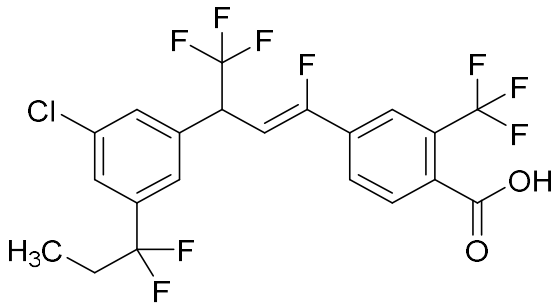
Aislado como una espuma marrón (0.190 g, 62.1 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.99 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.78 (s, 1H), 7.66 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 7.52 (s, 1H), 7.46 (s, 1H), 7.40 (s, 1H), 6.67 (d, *J* = 15.9 Hz, 1H), 6.56 (dd, *J* = 15.9, 7.7 Hz, 1H), 4.23 (p, *J* = 8.7 Hz, 1H), 1.93 (t, *J* = 18.2 Hz, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -59.56, -69.23, -88.19, -112.74; IR (película delgada) 3006, 1706 cm^{-1}; ESIMS *m/z* 471 ([M-H]$^-$).

Ácido (*Z*)-4-(3-(4-cloro-3-(trifluorometoxi)fenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C82)



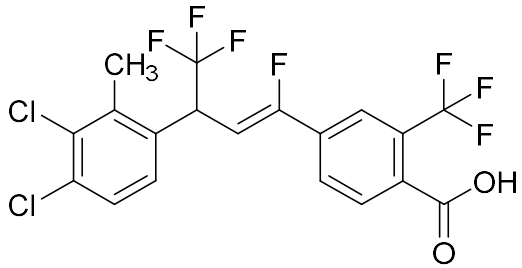
Aislado como un aceite naranja (0.712 g, 65 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.03 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.95 (d, *J* = 1.6 Hz, 1H), 7.83 (dd, *J* = 8.2, 1.8 Hz, 1H), 7.53 (d, *J* = 8.3 Hz, 1H), 7.37 (s, 1H), 7.32 (dd, *J* = 8.5, 2.1 Hz, 1H), 5.92 (dd, *J* = 32.5, 9.6 Hz, 1H), 4.69 (p, *J* = 8.9 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -57.85, -59.63, -69.49 (d, *J* = 2.2 Hz), -112.48 (t, *J* = 2.7 Hz; IR (película delgada) 3089, 1713, 1490 cm^{-1}; ESIMS *m/z* 509 ([M-H]$^-$).

Ácido (*Z*)-4-(3-(3-cloro-5-(1,1-difluoropropil)fenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C83)



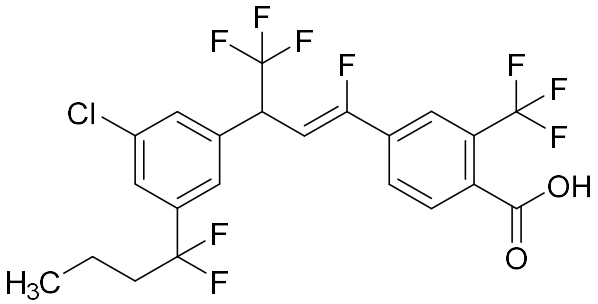
Aislado como una espuma roja (0.365 g, 56 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.03 (t, *J* = 7.3 Hz, 1H), 7.96 (s, 1H), 7.87 - 7.79 (m, 1H), 7.47 (s, 1H), 7.38 (s, 1H), 7.26 (s, 1H), 5.94 (dd, *J* = 32.5, 9.7 Hz, 1H), 4.70 (p, *J* = 8.9 Hz, 1H), 2.14 (td, *J* = 16.3, 7.6 Hz, 2H), 1.01 (t, *J* = 7.5 Hz, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -59.60 (d, *J* = 6.4 Hz), -69.27 (d, *J* = 2.3 Hz), -98.03 (d, *J* = 2.7 Hz), -112.71; ESIMS *m/z* 503 ([M-H]$^-$).

Ácido (*Z*)-4-(3-(3,4-Dicloro-2-metilfenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C84)



Aislado como una espuma naranja (0.412 g, 58 %); ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.02 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 7.97 - 7.93 (m, 1H), 7.88 (d, *J* = 8.3 Hz, 1H), 7.83 - 7.78 (m, 1H), 7.38 (d, *J* = 8.5 Hz, 1H), 7.29 (d, *J* = 8.6 Hz, 1H), 5.94 (dd, *J* = 33.0, 9.3 Hz, 1H), 5.03 (p, *J* = 8.9 Hz, 1H), 2.59 (s, 3H; ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -59.63 (d, *J* = 18.7 Hz), -69.01 (d, *J* = 2.2 Hz), -112.72; ESIMS *m/z* 473 ([M-H]$^-$).

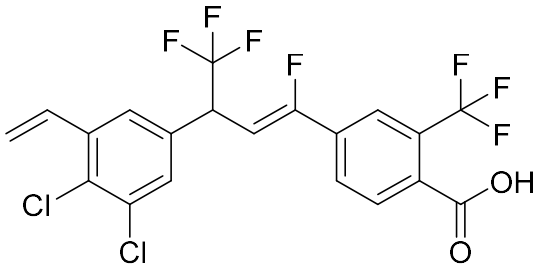
Ácido (*Z*)-4-(3-(3-cloro-5-(1,1-difluorobutil)fenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C85)



Aislado como una espuma roja (0.361 g, 57 %); ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.03 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.96 (s, 1H), 7.86 - 7.82 (m, 1H), 7.46 (s, 1H), 7.38 (s, 1H), 7.26 (s, 1H), 5.94 (dd, *J* = 32.5, 9.7 Hz, 1H), 4.70 (p, *J* = 8.8 Hz, 1H), 2.17 - 1.99 (m, 2H), 1.47 (dq, *J* = 15.1, 7.5 Hz, 2H), 0.95 (t, *J* = 7.4 Hz, 3H);^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -59.62 (d, *J* = 6.3 Hz), -69.26 (d, *J* = 2.3 Hz), -95.97 (d, *J* = 2.8 Hz), -112.70; ESIMS *m/z* 517 ([M-H]$^-$).

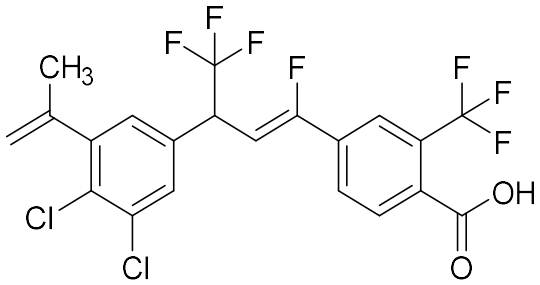
Los siguientes compuestos se prepararon de la misma manera que el procedimiento detallado en el ***Ejemplo 3****:*

Ácido (*Z*)-4-(3-(3,4-Dicloro-5-vinilfenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C86)



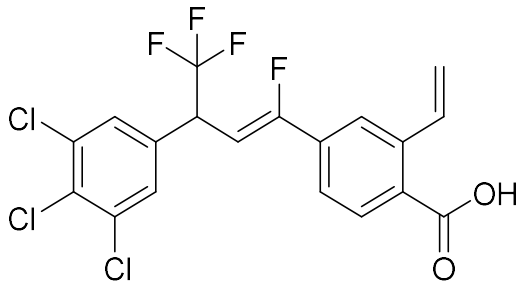
Aislado como una cera amarilla (0.19 g, 65 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 9.76 (s, 1H), 8.02 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 7.95 (s, 1H), 7.82 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 7.52 - 7.39 (m, 2H), 7.09 (dd, *J* = 17.5, 11.0 Hz, 1H), 6.04 - 5.85 (m, 1H), 5.76 (dd, *J* = 17.5, 13.8 Hz, 1H), 5.55 - 5.45 (m, 1H), 4.65 (p, *J* = 8.9 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -59.56, -67.15, -113.15; ESIMS *m/z* 487 ([M-H]$^-$).

Ácido (*Z*)-4-(3-(3,4-Dicloro-5-(prop-1-en-2-il)fenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C87)



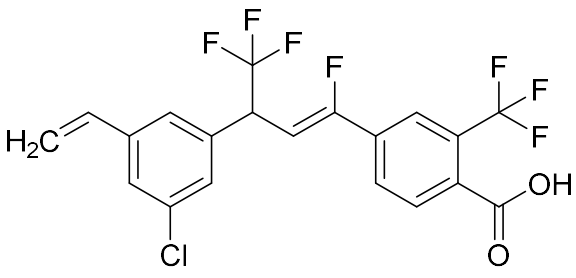
Aislado como una goma marrón (0.041 g, 90 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.98 (s, 1H), 7.93 (s, 1H), 7.81 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 7.70 (ddt, *J* = 12.3, 7.0, 1.4 Hz, 1H), 7.44 (d, *J* = 2.2 Hz, 1H), 7.14 (d, *J* = 2.2 Hz, 1H), 5.90 (dd, *J* = 32.6, 9.8 Hz, 1H), 5.28 (q, *J* = 1.5 Hz, 1H), 4.99 (t, *J* = 1.2 Hz, 1H), 4.62 (p, *J* = 8.9 Hz, 1H), 2.10 (t, *J* = 1.2 Hz, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -59.57, -68.49, -112.88; ESIMS *m/z* 501 ([M-H]$^-$).

Ácido (*Z*)-4-(1,4,4,4-Tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-vinilbenzoico (C88)



Aislado como una goma amarilla (0.3 g, 86 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.06 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 7.81 - 7.64 (m, 2H), 7.61 - 7.49 (m, 2H), 7.44 (s, 2H), 5.95 - 5.67 (m, 2H), 5.47 (dd, *J* = 15.5, 11.0 Hz, 1H), 4.63 (dp, *J* = 13.9, 8.9 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -69.35, -112.10; ESIMS *m/z* 451 ([M-H]$^-$).

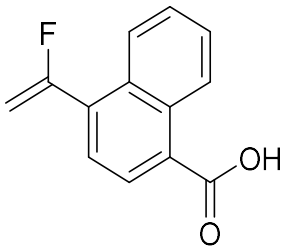
Ácido (*Z*)-4-(3-(3-cloro-5-vinilfenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico (C89)



Aislado como una goma amarilla (0.065 g, 58 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.95 - 7.92 (m, 2H), 7.81 (dd, *J* = 8.2, 1.8 Hz, 1H), 7.57 (dd, *J* = 7.5, 1.7 Hz, 1H), 7.41 (t, *J* = 1.8 Hz, 1H), 7.30 (s, 1H), 7.30 (s, 1H), 6.67 (dd, *J* = 17.6, 10.9 Hz, 1H), 5.94 (s, 1H), 5.80 (d, *J* = 17.5 Hz, 1H), 5.37 (d, *J* = 10.9 Hz, 1H), 4.77 - 4.55 (m, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -59.66, -69.30, -112.51; ESIMS *m/z* 452 ($[M-H]^-$).

El siguiente compuesto se prepararó de la misma manera que el procedimiento detallado en el ***Ejemplo 7****:*

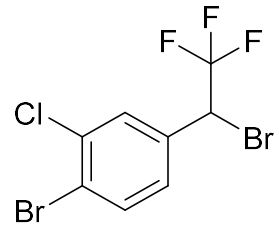
Ácido (4-(1-Fluorovinil)-1-naftóico (C90)



Aislado como un sólido blancuzco (0.70 g, 52 %): mp 154 – 156 °C; ^{1}H 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 ($[M-H]^-$).

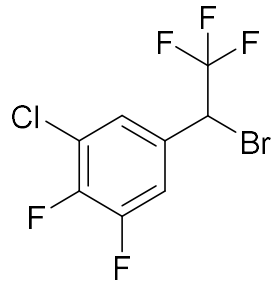
Los siguientes compuestos se prepararon de la misma manera que el procedimiento detallado en el ***Ejemplo 8****:*

1-Bromo-4-(1-bromo-2,2,2-trifluoroetil)-2-clorobenceno (C91)



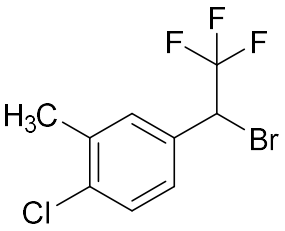
Aislado como un aceite amarillo ligero (7.0 g, 51 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.65 - 7.62 (m, 1H), 7.61 - 7.59 (m, 1H), 7.29 - 7.25 (m, 1H), 5.08 - 5.02 (m, 1H); EIMS *m/z* 352 ($[M]^+$).

5-(1-Bromo-2,2,2-trifluoroetil)-1-cloro-2,3-difluorobenceno (C92)



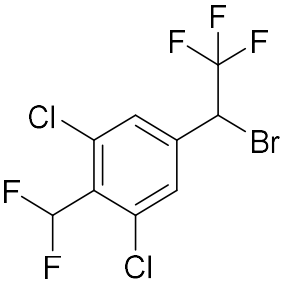
Aislado como un aceite incoloro (2.5 g, 31 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.35 - 7.28 (m, 2H), 5.05 - 4.99 (m, 1H); IR (película delgada) 2965, 1508, 758 cm^{-1}; EIMS *m/z* 308 ([M]$^+$).

4-(1-Bromo-2,2,2-trifluoroetil)-1-cloro-2-metilbenceno (C93)



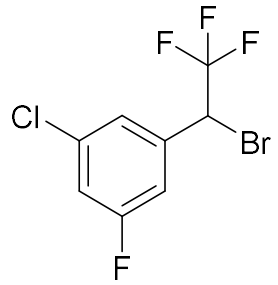
Aislado como un aceite incoloro (5.0 g, 44 %): ^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 7.55 - 7.50 (m, 2H), 7.44 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 6.24 - 6.16 (m, 1H), 2.36 (s, 3H); IR (película delgada) 1112, 749, 564 cm^{-1}; EIMS *m/z* 286 ([M]$^+$).

5-(1-Bromo-2,2,2-trifluoroetil)-1,3-dicloro-2-(difluorometil)benceno (C94)



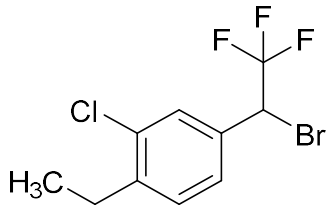
Aislado como un sólido marrón (2.2 g, 60 %): ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 7.71 (s, 2H), 7.46 (t, *J* = 51.6 Hz, 1H), 6.32 - 6.26 (m, 1H); EIMS *m/z* 336 ([M]$^+$).

1-(1-Bromo-2,2,2-trifluoroetil)-3-cloro-5-fluorobenceno (C95)



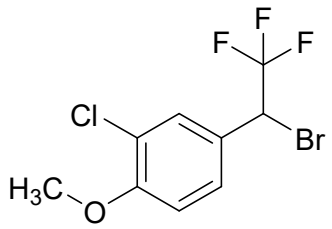
Aislado como un aceite incoloro (1.3 g, 32 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.29 (s, 1H), 7.17 - 7.13 (m, 2H), 5.07 - 5.01 (m, 1H); IR (película delgada) 3419, 1265, 746 cm^{-1}; EIMS *m/z* 290 ([M]$^+$).

4-(1-Bromo-2,2,2-trifluoroetil)-2-cloro-1-etilbenceno (C96)



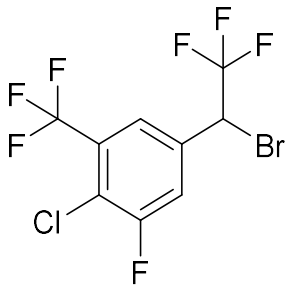
Aislado como un aceite amarillo (3.5 g, 57 %): ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 7.59 (s, 1H), 7.53 - 7.45 (m, 2H), 6.25 - 6.17 (m, 1H), 2.75 - 2.69 (m, 2H), 1.19 (t, *J* = 7.6 Hz, 3H); IR (película delgada) 3444, 2926, 1627, 750 cm^{-1}; EIMS *m/z* 300 ([M]$^+$).

4-(1-Bromo-2,2,2-trifluoroetil)-2-cloro-1-metoxibenceno (C97)



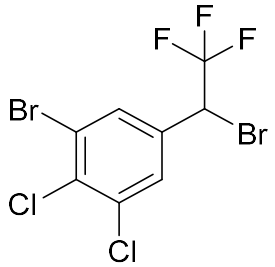
Aislado como un aceite amarillo pálido (2.5 g, 33 %): ^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 7.61 (s, 1H), 7.55 (d, *J* = 8.7 Hz, 1H), 7.26 (d, *J* = 8.7 Hz, 1H), 6.22 - 6.14 (m, 1H), 3.89 (s, 3H); EIMS *m/z* 302 ([M]$^+$).

5-(1-Bromo-2,2,2-trifluoroetil)-2-cloro-1-fluoro-3-(trifluorometil)benceno (C98)



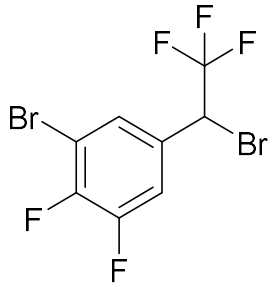
Aislado como una goma amarilla (2.5 g, 49 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.62 (t, *J* = 1.6 Hz, 1H), 7.57 (dd, *J* = 8.7, 2.1 Hz, 1H), 5.12 (q, *J* = 7.0 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -62.69, -70.52, -108.76; ESIMS *m/z* 359 ($[M-H]^-$).

1-Bromo-5-(1-bromo-2,2,2-trifluoroetil)-2,3-diclorobenceno (C99)



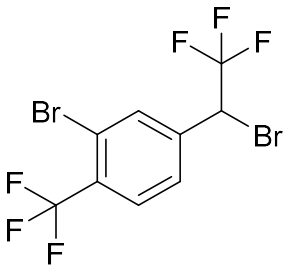
Aislado como un aceite amarillo (4.5 g, 46 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.58 (d, *J* = 2.1 Hz, 1H), 7.46 (d, *J* = 2.1 Hz, 1H), 4.35 (q, *J* = 6.9 Hz 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -70.40; ESIMS *m/z* 386 ($[M-H]^-$).

1-Bromo-5-(1-bromo-2,2,2-trifluoroetil)-2,3-difluorobenceno (C100)



Aislado como un aceite amarillo pálido (1.8 g, 64 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.52 - 7.44 (m, 1H), 7.36 (td, *J* = 7.4, 7.0, 3.4 Hz, 1H), 5.03 (q, *J* = 7.0 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -70.63, -126.49 (d, *J* = 21.3 Hz), -131.58 (dd, *J* = 21.3, 0.9 Hz); ESIMS *m/z* 336 ($[M-H]^-$).

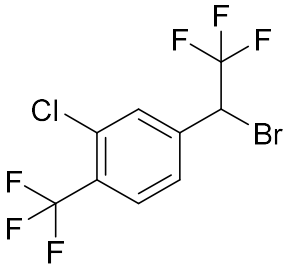
2-Bromo-4-(1-bromo-2,2,2-trifluoroetil)-1-(trifluorometil)benceno (C101)



Aislado como un aceite amarillo pálido (3.88 g, 61 %); ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.93 - 7.80 (m, 1H), 7.73 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 7.57 (d, *J* = 8.3 Hz, 1H), 5.10 (q, *J* = 7.1 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -63.02,

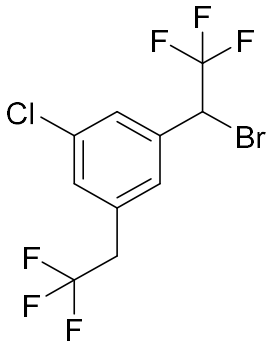
-70.25; IR (película delgada) 1609 cm^{-1}; ESIMS *m/z* 386 ($[M+H]^+$).

4-(1-Bromo-2,2,2-trifluoroetil)-2-cloro-1-(trifluorometil)benceno (C102)



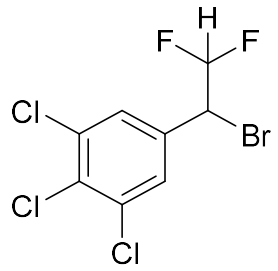
Aislado como un aceite incoloro (3.33 g, 46 %); ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7.73 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 7.68 (s, 1H), 7.52 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 5.11 (q, *J* = 7.1 Hz, 1H); ^{13}C NMR (75 MHz, $CDCl_3$) δ 137.94, 133.06 (q, *J* = 1.9 Hz), 132.10, 129.93 (q, *J* = 32.0 Hz), 128.10 (q, *J* = 5.3 Hz), 127.47, 124.46, 120.81, 44.84 (q, *J* = 34.8 Hz); ESIMS *m/z* 342 ($[M+H]^+$).

1-(1-Bromo-2,2,2-trifluoroetil)-3-cloro-5-(2,2,2-trifluoroetil)benceno (C103)



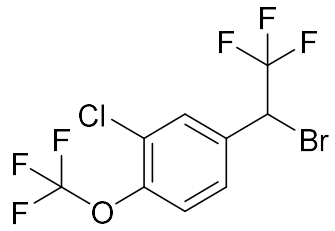
Aislado como un aceite claro (0.930 g, 73 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.51 (s, 1H), 7.35 (s, 1H), 7.32 (s, 1H), 5.07 (q, *J* = 7.2 Hz, 1H), 3.38 (q, *J* = 10.5 Hz, 2H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -65.71, -70.43; IR (película delgada) 1113 cm^{-1}; EIMS *m/z* 356 ([M]$^+$).

5-(1-Bromo-2,2-difluoroetil)-1,2,3-triclorobenceno (C104)



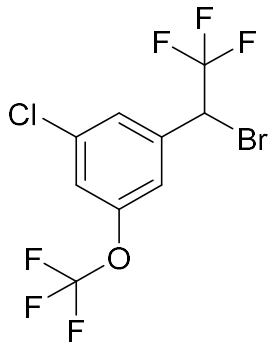
Aislado como un aceite claro (8.3 g, 67 %): ^{1}H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 7.49 (s, 2H), 6.00 (td, *J* = 55.4, 3.8 Hz, 1H), 4.85 (ddd, *J* = 13.7, 10.4, 3.8 Hz, 1H); ^{19}F NMR (471 MHz, $CDCl_3$) δ -116.16 (ddd, *J* = 278.0, 55.2, 10.4 Hz), -119.84 (ddd, *J* = 278.1, 55.6, 13.4 Hz); IR (película delgada) 1552, 1431 cm^{-1}; ESIMS *m/z* 324 ([M+H]$^+$).

4-(1-Bromo-2,2,2-trifluoroetil)-2-cloro-1-(trifluorometoxi)benceno (C105)



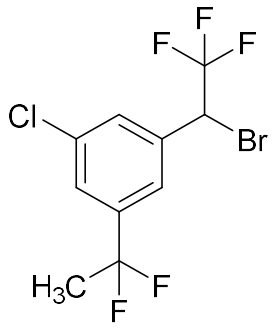
Aislado como un aceite incoloro ((2.83 g, 62 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.65 (d, *J* = 2.2 Hz, 1H), 7.45 (dd, *J* = 8.6, 2.3 Hz, 1H), 7.36 (dd, *J* = 8.6, 1.5 Hz, 1H), 5.09 (q, *J* = 7.1 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -57.75, -70.52; IR (película delgada) 1497 cm^{-1}; EIMS *m/z* 356 ([M]$^+$).

1-(1-Bromo-2,2,2-trifluoroetil)-3-cloro-5-(trifluorometoxi)benceno (C106)



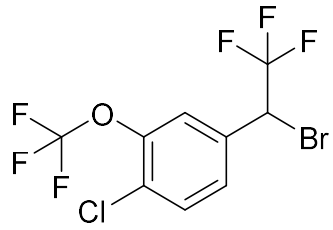
Aislado como un aceite incoloro (2.27 g, 60 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.45 (d, *J* = 1.7 Hz, 1H), 7.30 (s, 1H), 7.28 (s, 1H), 5.07 (q, *J* = 7.1 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -58.02, -70.44; IR (película delgada) 1588, 1450 cm^{-1}; EIMS *m/z* 358 ([M]$^+$).

1-(1-Bromo-2,2,2-trifluoroetil)-3-cloro-5-(1,1-difluoroetil)benceno (C107)



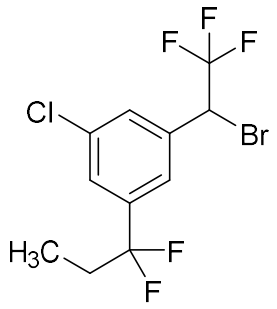
Aislado como un aceite claro (0.665 g, 68 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.59 (s, 1H), 7.53 (s, 1H), 7.50 (s, 1H), 5.10 (q, *J* = 7.2 Hz, 1H), 1.92 (t, *J* = 18.2 Hz, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -70.39, -88.36 (d, *J* = 1.6 Hz); IR (película delgada) 1588 cm^{-1}; ESIMS *m/z* 336 ([M+H]$^+$).

4-(1-Bromo-2,2,2-trifluoroetil)-1-cloro-2-(trifluorometoxi)benceno (C108)



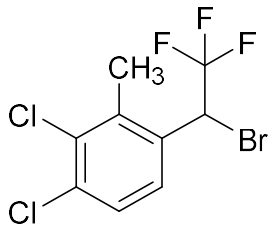
Aislado como un aceite claro (2.50 g, 56 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.52 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 7.48 (s, 1H), 7.41 (dd, *J* = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 5.10 (q, *J* = 7.1 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -57.94, -70.63; IR (película delgada) 1492, 1423 cm^{-1}; EIMS *m/z* 356 ([M]$^+$).

1-(1-Bromo-2,2,2-trifluoroetil)-3-cloro-5-(1,1-difluoropropil)benceno (C109)



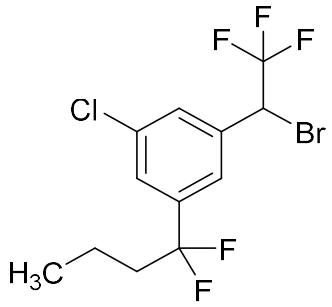
Aislado como un aceite claro (0.670 g, 64 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.58 (s, 1H), 7.50 (s, 1H), 7.46 (s, 1H), 5.10 (q, *J* = 7.1 Hz, 1H), 2.13 (ddt, *J* = 23.7, 16.1, 7.5 Hz, 2H), 1.00 (t, *J* = 7.5 Hz, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -70.43, -98.11; IR (película delgada) 1111 cm^{-1}; ESIMS *m/z* 352 ($[M+H]^+$).

1-(1-Bromo-2,2,2-trifluoroetil)-3,4-dicloro-2-metilbenceno (C110)



Aislado como un aceite amarillo pálido (0.721 g, 79 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.58 (d, *J* = 8.6 Hz, 1H), 7.40 (d, *J* = 8.6 Hz, 1H), 5.46 (q, *J* = 7.2 Hz, 1H), 2.51 (s, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -69.49; IR (película delgada) 1159, 1105 cm^{-1}.

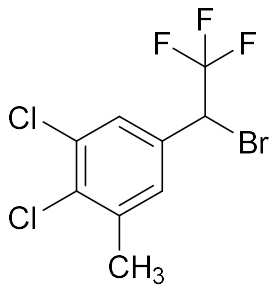
1-(1-Bromo-2,2,2-trifluoroetil)-3-cloro-5-(1,1-difluorobutil)benceno (C111)



Aislado como un aceite claro (0.670 g, 72 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.58 (s, 1H), 7.49 (s, 1H), 7.46 (s, 1H), 5.10 (q, J = 7.2 Hz, 1H), 2.15 - 2.01 (m, 2H), 1.52 - 1.41 (m, 2H), 0.95 (t, J =

7.4 Hz, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -70.42, -96.06. IR (película delgada) 1254, 1164, 1111 cm^{-1}.

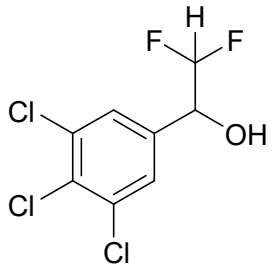
5-(1-Bromo-2,2,2-trifluoroetil)-1,2-dicloro-3-metilbenceno (C171)



Aislado como un aceite claro (6.7 g, 67 %): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7.46 (s, 1H), 7.28 (s, 1H), 5.02 (q, *J* = 7.2 Hz, 1H), 2.45 (s, 3H); IR (película delgada) 1260, 1113, 750 cm^{-1}; EIMS *m/z* 322 ($[M]^+$).

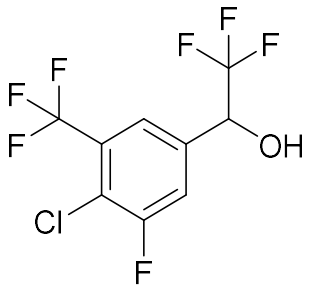
El siguiente compuesto se prepararó de la misma manera que el procedimiento detallado en el ***Ejemplo 10****:*

2,2-Difluoro-1-(3,4,5-triclorofenil)etan-1-ol (C112)



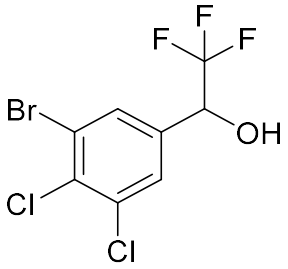
Aislado como un sólido amarillo pálido (9.4 g, 98 %): ^{1}H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 7.48 (s, 2H), 5.72 (td, *J* = 55.7, 4.7 Hz, 1H), 4.80 (tt, *J* = 9.3, 4.2 Hz, 1H), 2.65 (s, 1H); ^{19}F NMR (471 MHz, $CDCl_3$) δ -127.41 (m); IR (película delgada) 3381 cm^{-1}; ESIMS *m/z* 260 ($[M+H]^+$).

1-(4-cloro-3-fluoro-5-(trifluorometil)fenil)-2,2,2-trifluoroetan-1-ol (C113)



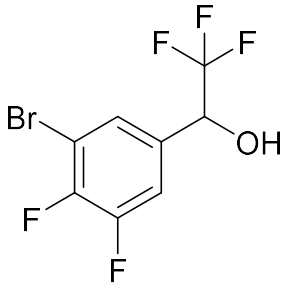
Aislado como una goma amarilla (5.0 g, 73 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.63 (s, 1H), 7.54 (dd, *J* = 8.9, 1.7 Hz, 1H), 5.16 - 5.02 (m, 1H), 2.95 - 2.74 (m, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -62.56, -78.52, -110.00; ESIMS *m/z* 296 ([M-H]$^-$).

1-(3-Bromo-4,5-diclorofenil)-2,2,2-trifluoroetan-1-ol (C114)



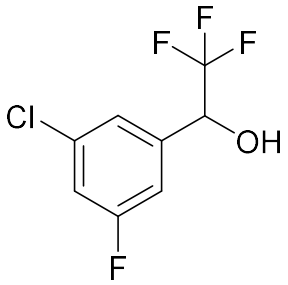
Aislado como un aceite amarillo (5.5 g, 86 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.68 (s, 1H), 7.57 (s, 1H), 5.00 (q, *J* = 11.5 Hz, 1H), 4.75 (s, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -78.32; ESIMS *m/z* 323 ([M-H]$^-$).

1-(3-Bromo-4,5-difluorofenil)-2,2,2-trifluoroetan-1-ol (C115)



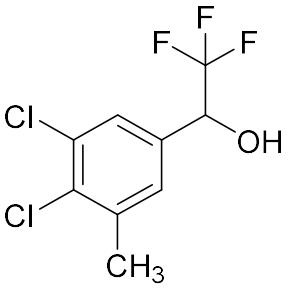
Aislado como un aceite amarillo (5.5 g, 90 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.44 (dd, *J* = 17.9, 5.5 Hz, 2H), 5.02 (q, *J* = 6.5 Hz, 1H), 1.55 (br, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -78.63, -128.47 (d, *J* = 21.3 Hz), -135.58 (dd, *J* = 21.3, 0.9 Hz); ESIMS *m/z* 291 ([M-H]$^-$).

1-(3-cloro-5-fluorofenil)-2,2,2-trifluoroetan-1-ol (C116)



Aislado como un sólido blancuzco (3.0 g, 83 %): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7.28 - 7.26 (m, 1H), 7.15 - 7.12 (m, 2H), 5.04 - 4.97 (m, 1H), 3.64 - 3.58 (m, 1H); IR (película delgada) 3421, 1266, 742 cm^{-1}; EIMS *m/z* 228 ([M]$^+$).

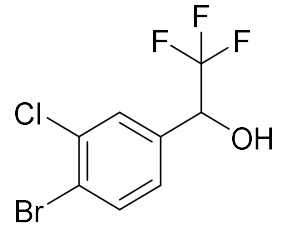
1-(3,4-Dicloro-5-metilfenil)-2,2,2-trifluoroetan-1-ol (C172)



Aislado como un aceite amarillo pálido (4.6 g, 79 %): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7.44 (s, 1H), 7.26 (s, 1H), 4.97 (q, *J* = 6.6 Hz, 1H), 2.44 (s, 3H); IR (película delgada) 3428, 1275, 1262, 750 cm^{-1}; EIMS *m/z* 258 ([M]$^+$).

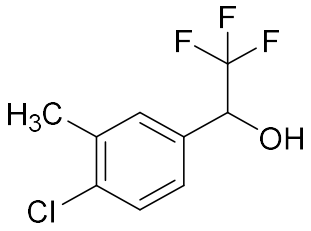
Los siguientes compuestos se prepararon de la misma manera que el procedimiento detallado en el ***Ejemplo 11****:*

1-(4-Bromo-3-clorofenil)-2,2,2-trifluoroetan-1-ol (C117)



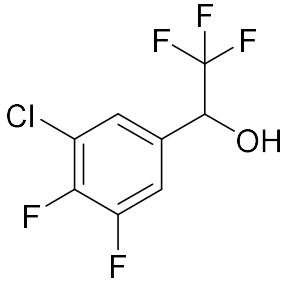
Aislado como una goma marrón (12 g, 77 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.65 - 7.60 (m, 1H), 7.59 (s, 1H), 7.23 - 7.19 (m, 1H), 5.09 - 5.01 (m, 1H), 2.86 (br s, 1H); EIMS *m/z* 290 ([M]$^+$).

1-(4-cloro-3-metilfenil)-2,2,2-trifluoroetan-1-ol (C118)



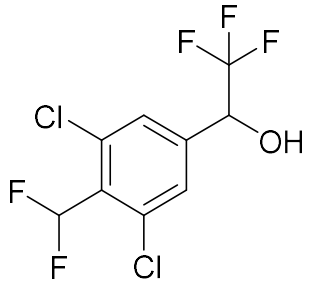
Aislado como un aceite marrón (7.2 g, 95 %): ^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 7.46 (m, 2H), 7.34 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 5.19 - 5.10 (m, 1H), 3.62 - 3.58 (m, 1H), 2.34 (s, 3H); IR (película delgada) 3400, 1128, 720 cm^{-1}; EIMS *m/z* 242 ([M]$^+$).

1-(3-cloro-4,5-difluorofenil)-2,2,2-trifluoroetan-1-ol (C119)



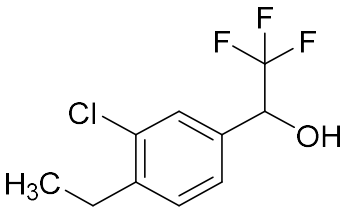
Aislado como un aceite incoloro (4.6 g, 33 %): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7.34 - 7.30 (m, 2H), 5.01 - 4.95 (m, 1H), 3.21 (br s, 1H); IR (película delgada) 3302, 1709, 750 cm^{-1}; EIMS *m/z* 246 ([M]$^+$).

1-(3,5-Dicloro-4-(difluorometil)fenil)-2,2,2-trifluoroetan-1-ol (C120)



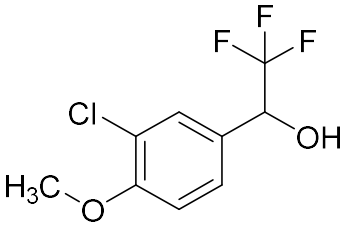
Aislado como una goma amarilla pálida (2.6 g, 62 %): ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 7.73 (s, 2H), 7.45 (t, *J* = 52.0 Hz, 1H), 7.30 (d, *J* = 6.4 Hz, 1H), 5.39 (m, 1H); IR (película delgada) 3418, 1562, 1135 cm^{-1}; EIMS *m/z* 294 ([M]$^+$).

1-(3-cloro-4-etilfenil)-2,2,2-trifluoroetan-1-ol (C121)



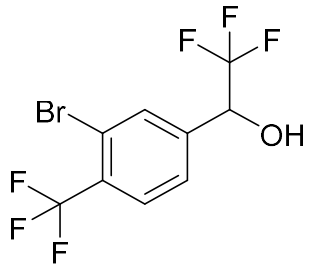
Aislado como una goma amarilla (5.0 g, 36 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.42 (s, 1H), 7.38 - 7.31(m, 2H), 5.02 - 4.95 (m, 1H), 2.81 - 2.74 (m, 2H), 2.61 (br s, 1H), 1.24 (t, *J* = 8.0 Hz, 3H); IR (película delgada) 3420, 2973, 1565, 1131 cm^{-1}; EIMS *m/z* 238 ([M]$^+$).

1-(3-cloro-4-metoxifenil)-2,2,2-trifluoroetan-1-ol (C122)



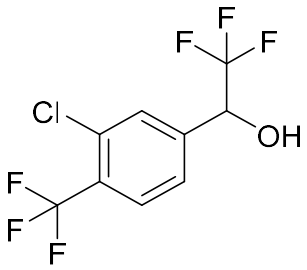
Aislado como un aceite viscoso marrón (4.0 g, 79 %): ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 7.51 (s, 1H), 7.43 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.19 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 6.85 (d, *J* = 5.2 Hz, 1H), 5.16 - 5.12 (m, 1H), 3.86 (s, 3H); IR (película delgada) 3445, 2952, 1606, 1262 cm^{-1}; EIMS *m/z* 240 ([M]$^+$).

1-(3-Bromo-4-(trifluorometil)fenil)-2,2,2-trifluoroetan-1-ol (C123)



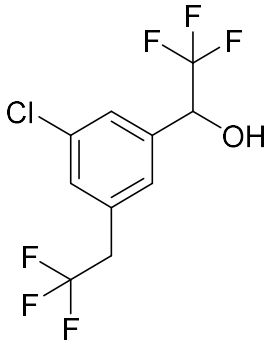
Aislado como un aceite amarillo pálido (3.88 g, 61 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.87 (d, *J* = 1.6 Hz, 1H), 7.74 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 7.59 - 7.50 (m, 1H), 5.09 (qd, *J* = 6.4, 3.8 Hz, 1H), 2.88 (d, *J* = 4.3 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -62.86, -78.24; IR (película delgada) 3392 cm^{-1}; ESIMS *m/z* 322 ([M-H]$^-$).

1-(3-cloro-4-(trifluorometil)fenil)-2,2,2-trifluoroetan-1-ol (C124)



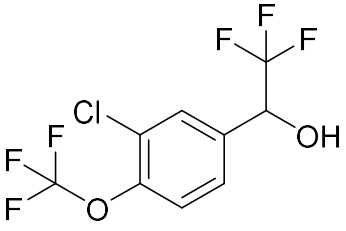
Aislado como un aceite incoloro (5.90 g, 88 %): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7.74 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 7.68 (s, 1H), 7.50 (ddt, *J* = 8.1, 2.0, 0.9 Hz, 1H), 5.25 - 4.95 (m, 1H), 3.14 (s, 1H); ^{13}C NMR (75 MHz, $CDCl_3$) δ 139.39, 132.66, 130.35, 129.23 (q, *J* = 31.8 Hz), 127.67 (q, *J* = 5.3 Hz), 125.76, 124.39, 120.78, 71.40 (q, *J* = 32.4 Hz); ESIMS *m/z* 278 ($[M+H]^+$).

1-(3-cloro-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenil)-2,2,2-trifluoroetan-1-ol (C125)



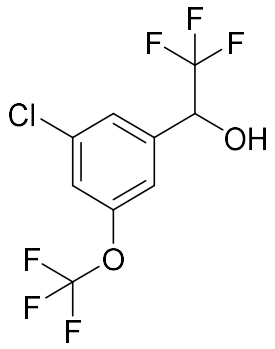
Aislado como un aceite amarillo pálido (1.05 g, 61 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.49 (s, 1H), 7.35 (s, 1H), 7.31 (s, 1H), 5.07 - 5.00 (m, 1H), 3.38 (q, *J* = 10.5 Hz, 2H), 2.64 (d, *J* = 4.4 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -65.75, -78.39; IR (película delgada) 3562 cm^{-1}; EIMS *m/z* 292.

1-(3-cloro-4-(trifluorometoxi)fenil)-2,2,2-trifluoroetan-1-ol (C126)



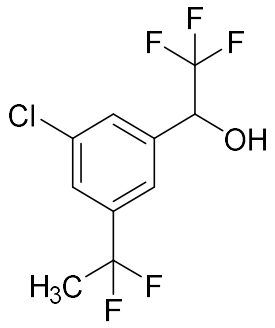
Aislado como un aceite claro (3.4 g, 86 %): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7.64 (dq, *J* = 1.9, 0.6 Hz, 1H), 7.47 - 7.33 (m, 2H), 5.04 (qd, *J* = 6.5, 4.4 Hz, 1H), 2.98 (d, *J* = 4.1 Hz, 1H); IR (película delgada) 3392, 1496 cm^{-1}; EIMS *m/z* 294 ($[M]^+$).

1-(3-cloro-5-(trifluorometoxi)fenil)-2,2,2-trifluoroetan-1-ol (C127)



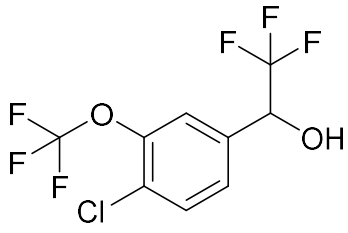
Aislado como un aceite claro (3.15 g, 80 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.45 (s, 1H), 7.30 - 7.26 (m, 2H), 5.04 (q, *J* = 6.4 Hz, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -58.01, -78.40; IR (película delgada) 3305, 1587, 1442 cm^{-1}; EIMS *m/z* 294 ([M]$^+$).

1-(3-cloro-5-(1,1-difluoroetil)fenil)-2,2,2-trifluoroetan-1-ol (C128)



Aislado como un aceite claro (0.800 g, 90 %); ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.56 (s, 1H), 7.54 (s, 1H), 7.51 (s, 1H), 5.14 - 5.01 (m, 1H), 2.77 (s, 1H), 1.92 (t, *J* = 18.2 Hz, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -78.37, -88.20 (d, *J* = 9.9 Hz); IR (película delgada) 3422 cm^{-1}; EIMS *m/z* 274 ([M]$^+$).

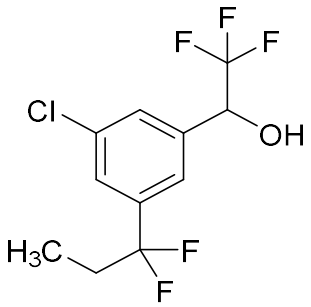
1-(4-cloro-3-(trifluorometoxi)fenil)-2,2,2-trifluoroetan-1-ol (C129)



Aislado como un aceite claro (3.72 g, 95 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.53 (d, *J* = 8.3 Hz, 1H), 7.49 (s, 1H), 7.38 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 5.06 (dd, *J* = 6.6, 3.4 Hz, 1H), 3.80 - 3.70 (m, 1H),

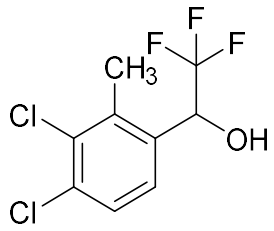
2.92 (s, 1H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -57.90, -78.59; IR (película delgada) 3396, 1489 cm^{-1}; EIMS *m/z* 294 ($[M]^+$).

1-(3-cloro-5-(1,1-difluoropropil)fenil)-2,2,2-trifluoroetan-1-ol (C130)



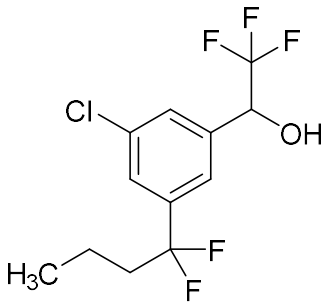
Aislado como un aceite amarillo claro (0.850 g, 92 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.56 (s, 1H), 7.50 (s, 1H), 7.46 (s, 1H), 5.07 (d, *J* = 4.4 Hz, 1H), 2.77 (s, 1H), 2.27 - 2.04 (m, 2H), 0.99 (t, *J* = 7.5 Hz, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -78.40, -97.91 (d, *J* = 3.7 Hz); IR (película delgada) 3407 cm^{-1}.

1-(3,4-Dicloro-2-metilfenil)-2,2,2-trifluoroetan-1-ol (C131)



Aislado como un sólido blanco (0.734 g, 30 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.51 (d, *J* = 8.5 Hz, 1H), 7.41 (d, *J* = 8.6 Hz, 1H), 5.41 - 5.31 (m, 1H), 2.78 (d, *J* = 4.6 Hz, 1H), 2.46 (s, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -77.78; IR (película delgada) 3370 cm^{-1}. ESIMS *m/z* 257 ($[M-H]^-$).

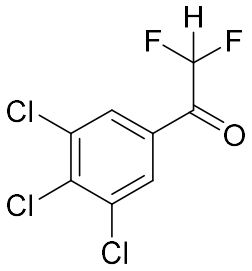
1-(3-cloro-5-(1,1-difluorobutil)fenil)-2,2,2-trifluoroetanol (C132)



Aislado como un aceite amarillo claro (0.870 g, 97 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.56 (s, 1H), 7.50 (s, 1H), 7.46 (s, 1H), 5.06 (dt, *J* = 10.8, 5.4 Hz, 1H), 2.77 (s, 1H), 2.15 - 2.00 (m, 2H), 1.53 - 1.38 (m, 2H), 0.94 (t, *J* = 7.4 Hz, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -78.39, -95.86 (d, *J* = 8.2 Hz); IR (película delgada) 3407 cm^{-1}; EIMS *m/z* 302.1 ([M]$^+$).

*El siguiente compuesto se prepararó de la misma manera que el procedimiento detallado en el **Ejemplo 12**:*

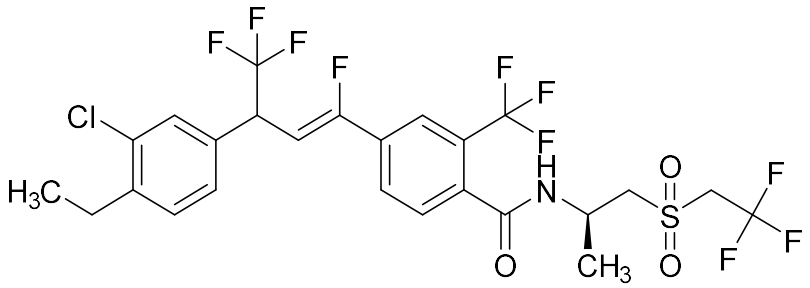
2,2-Difluoro-1-(3,4,5-triclorofenil)etan-1-ona (C133)



Aislado como un sólido blancuzco (9.25 g, 88 %): mp 45-48 °C; ^{1}H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 7.71 (s, 2H), 6.21 (t, *J* = 53.5 Hz, 1H); ^{19}F NMR (471 MHz, $CDCl_3$) δ -126.71 (d, *J* = 53.4 Hz); IR (película delgada) 1743, 1559 cm^{-1}; ESIMS *m/z* 260 ([M+H]$^+$).

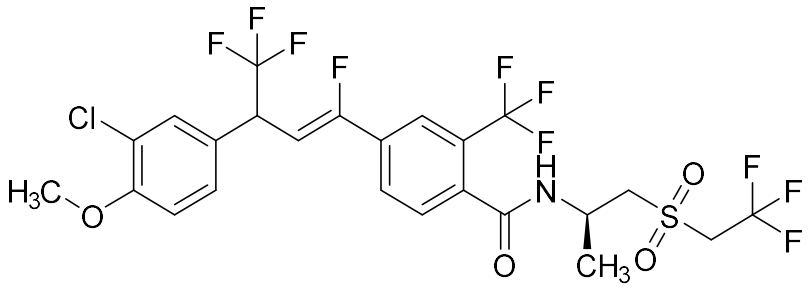
*Los siguientes compuestos se prepararon de la misma manera que el procedimiento detallado en el **Ejemplo 13**:*

4-((*Z*)-3-(3-cloro-4-etilfenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F141)



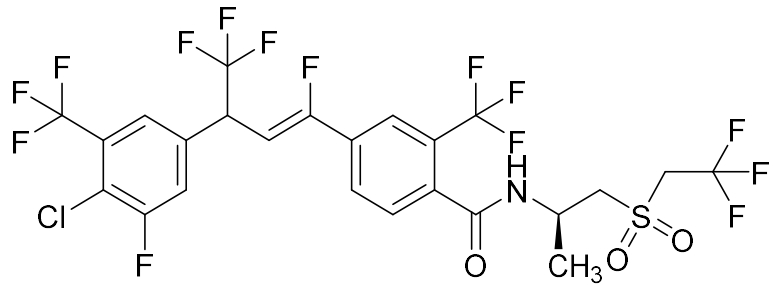
Aislado como un sólido amarillo pálido (0.110 g, 43 %).

4-((*Z*)-3-(3-cloro-4-metoxifenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F142)



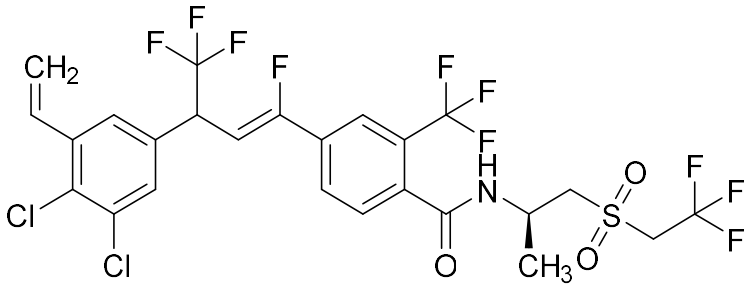
Aislado como un sólido amarillo pálido (0.140 g, 55 %).

4-((*Z*)-3-(4-cloro-3-fluoro-5-(trifluorometil)fenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F71)



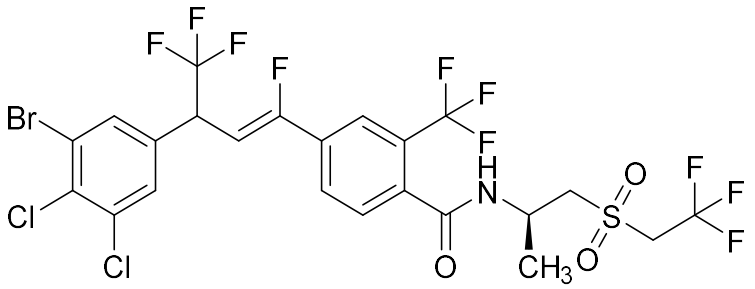
Aislado como una cera blanca (0.106 g, 91 %).

4-((*Z*)-3-(3,4-Dicloro-5-vinilfenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F73)



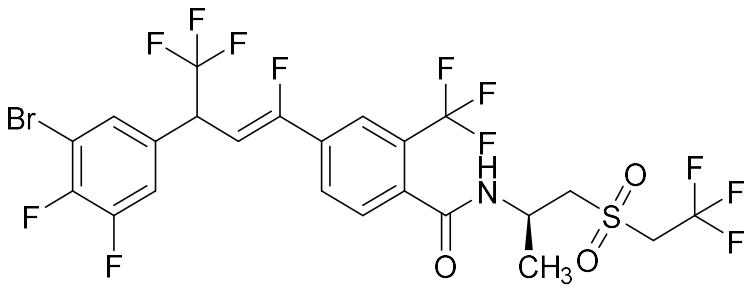
Aislado como una cera blanca (0.024 g, 41 %).

4-((*Z*)-3-(3-Bromo-4,5-diclorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F80)



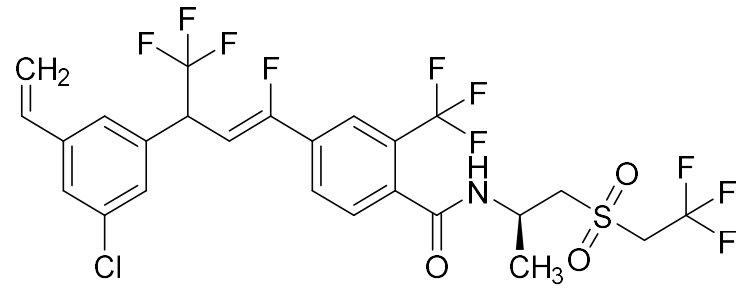
Aislado como una cera amarilla (0.108 g, 16 %).

4-((*Z*)-3-(3-Bromo-4,5-difluorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F94)



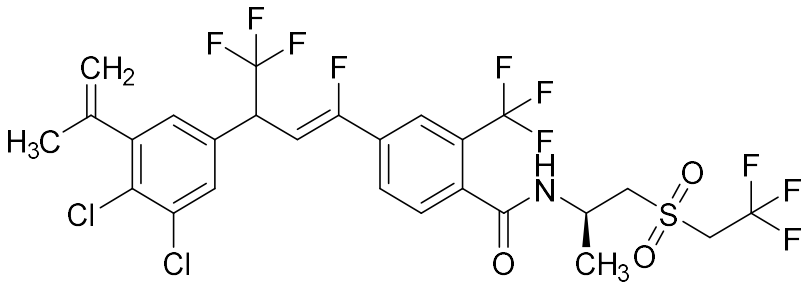
Aislado como una cera amarilla (0.015 g, 21 %).

4-((*Z*)-3-(3-cloro-5-vinilfenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F112)



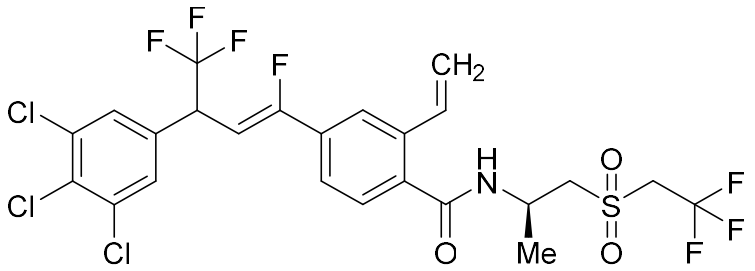
Aislado como una cera blanca (0.027 g, 36 %).

4-((*Z*)-3-(3,4-Dicloro-5-(prop-1-en-2-il)fenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F114)



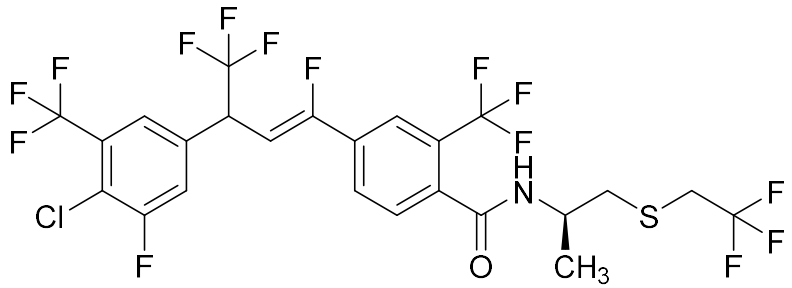
Aislado como una cera amarilla (0.036 g, 59 %).

4-((*Z*)-1,4,4,4-Tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-vinilbenzamida (F116)



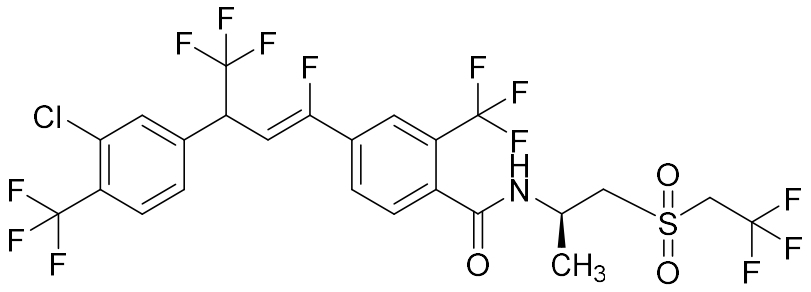
Aislado como una goma amarilla (0.016 g, 12 %).

4-((*Z*)-3-(4-cloro-3-fluoro-5-(trifluorometil)fenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)tio)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F117)



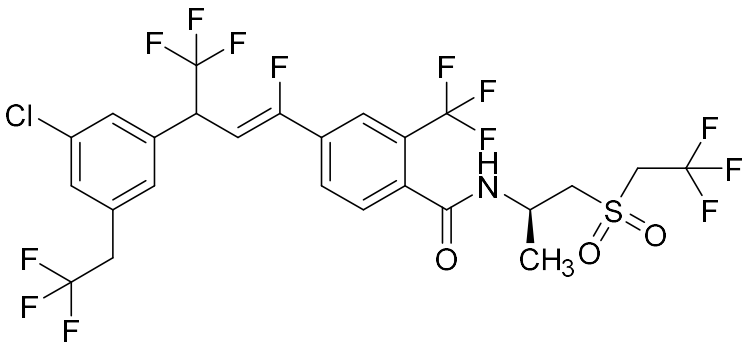
Aislado como una goma amarilla (0.177 g, 86 %).

4-((*Z*)-3-(3-cloro-4-(trifluorometil)fenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F91)



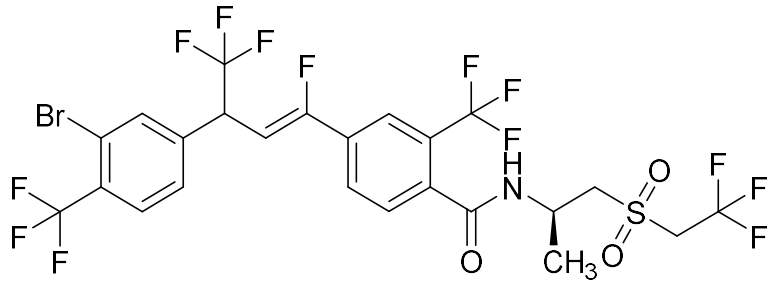
Aislado como una espuma blanca (0.109 g, 56 %).

4-((*Z*)-3-(3-cloro-5-(2,2,2-trifluoroetil)fenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F93)



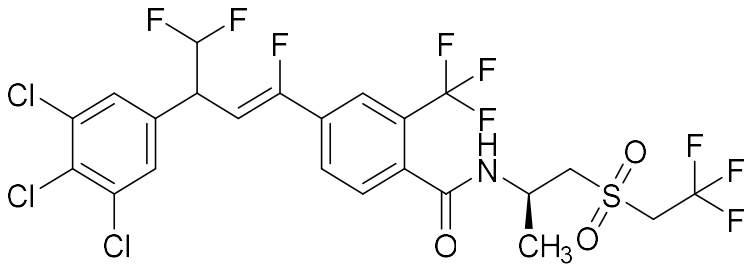
Aislado como una espuma blancuzca (0.100 g, 73 %).

4-((*Z*)-3-(3-Bromo-4-(trifluorometil)fenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F95)



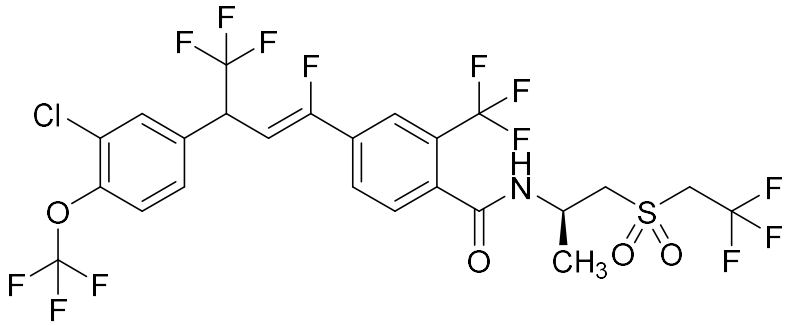
Aislado como una espuma naranja (0.140 g, 69 %).

4-((*Z*)-1,4,4-Trifluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F98)



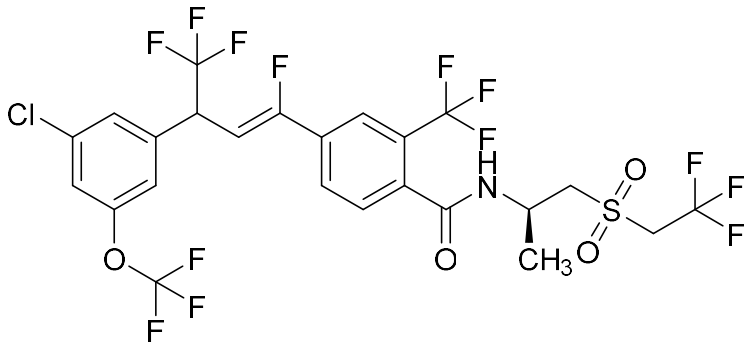
Aislado como un sólido blancuzco (0.145 g, 51 %).

4-((*Z*)-3-(3-cloro-4-(trifluorometoxi)fenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F109)



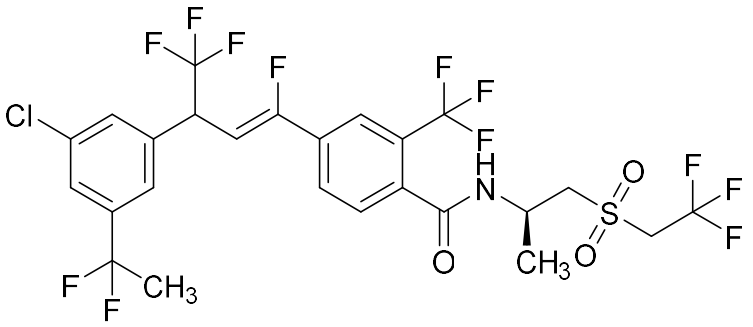
Aislado como un vidrio amarillo pálido (0.070 g, 77 %).

4-((*Z*)-3-(3-cloro-5-(trifluorometoxi)fenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F110)



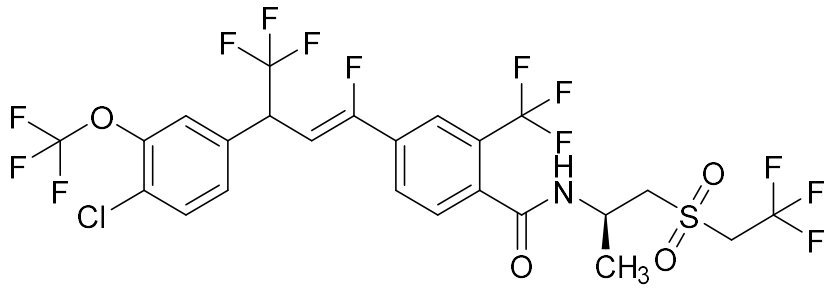
Aislado como un vidrio amarillo pálido (0.083 g, 68 %).

4-((*Z*)-3-(3-cloro-5-(1,1-difluoroetil)fenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F120)



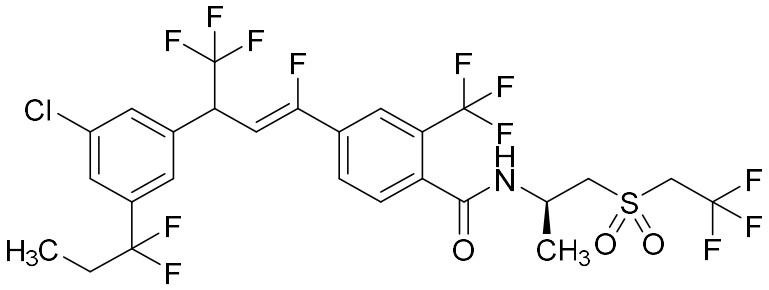
Aislado como un vidrio amarillo espumoso (0.077 g, 66 %).

4-((*Z*)-3-(4-cloro-3-(trifluorometoxi)fenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F127)



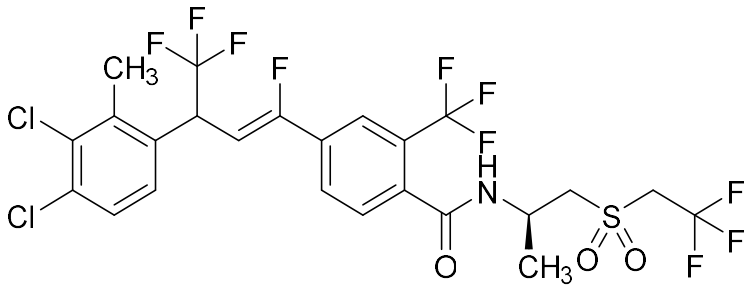
Aislado como un vidrio amarillo pálido (0.095 g, 68 %).

4-((*Z*)-3-(3-cloro-5-(1,1-difluoropropil)fenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F131)



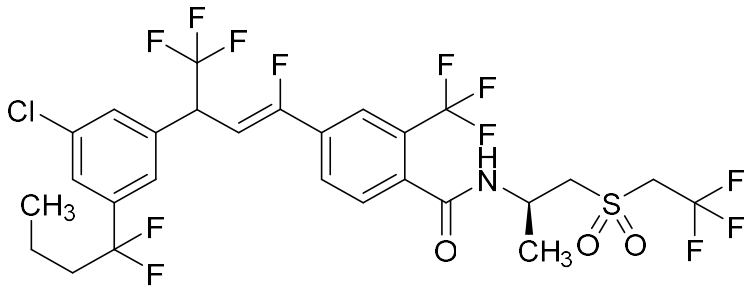
Aislado como una espuma blancuzca (0.090 g, 55 %).

4-((*Z*)-3-(3,4-Dicloro-2-metilfenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F132)



Aislado como un sólido espumoso blanco (0.080 g, 57 %).

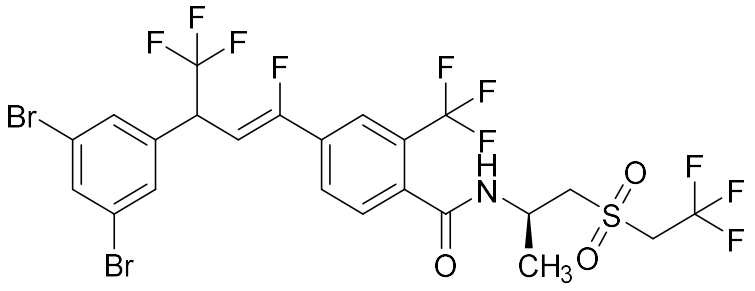
4-((*Z*)-3-(3-cloro-5-(1,1-difluorobutil)fenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F143)



Aislado como una espuma blancuzca (0.086 g, 53 %).

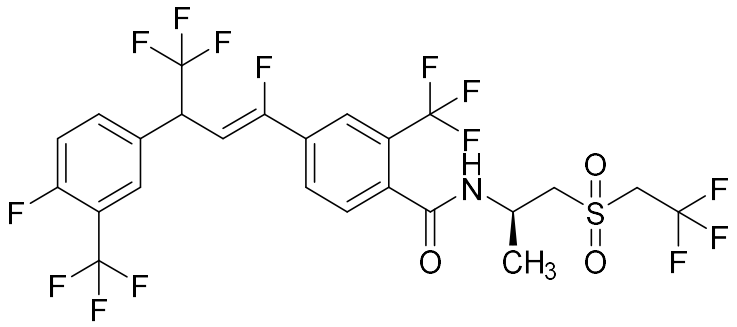
*Los siguientes compuestos se prepararon de la misma manera que el procedimiento detallado en el **Ejemplo 14**:*

4-((*Z*)-3-(3,5-Dibromofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F69)



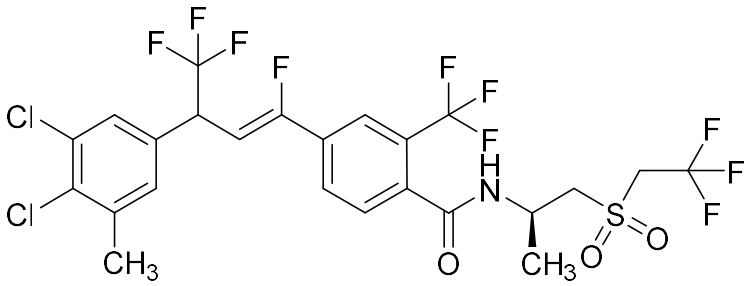
Aislado como un sólido amarillo (0.150 g, 62 %).

4-((*Z*)-1,4,4,4-Tetrafluoro-3-(4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil)but-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F77)



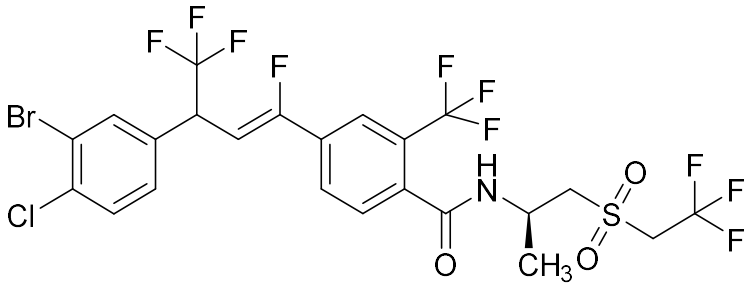
Aislado como un sólido amarillo pálido (0.100 g, 48 %).

4-((*Z*)-3-(3,4-Dicloro-5-metilfenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F78)



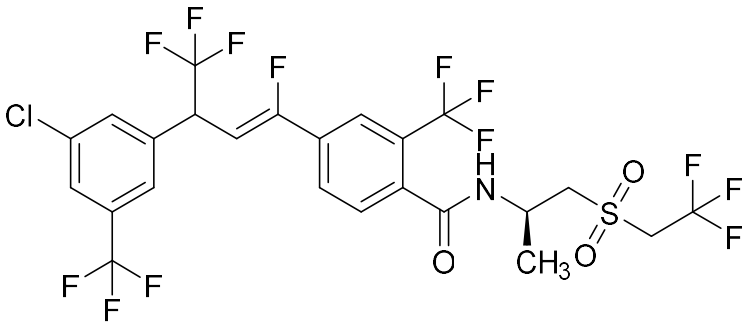
Aislado como un sólido amarillo pálido (0.170 g, 57 %).

4-((*Z*)-3-(3-Bromo-4-clorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F79)



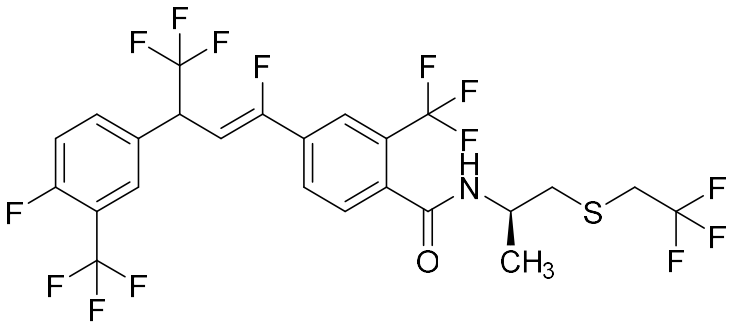
Aislado como una goma amarilla (0.095 g, 29 %).

4-((*Z*)-3-(3-cloro-5-(trifluorometil)fenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F81)



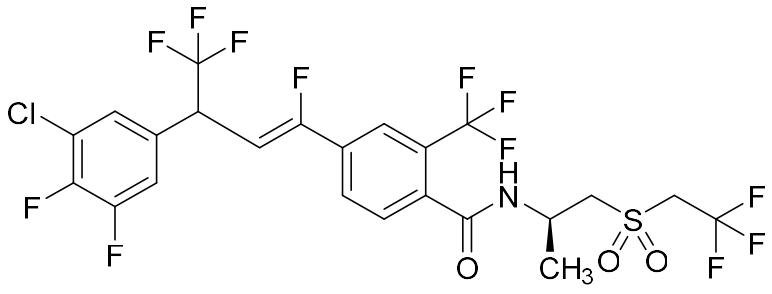
Aislado como un sólido blancuzco (0.060 g, 24 %).

4-((*Z*)-1,4,4,4-Tetrafluoro-3-(4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil)but-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)tio)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F102)



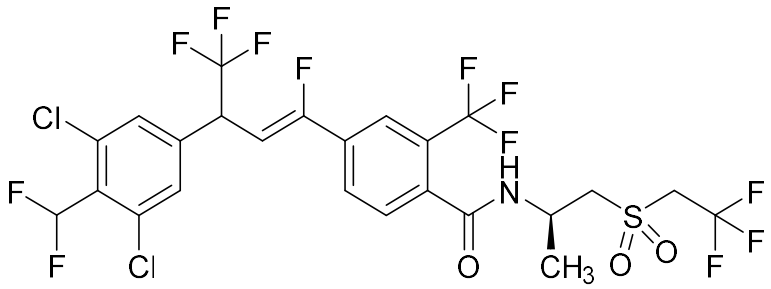
Aislado como una goma amarilla (0.090 g, 34 %).

4-((*Z*)-3-(3-cloro-4,5-difluorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F103)



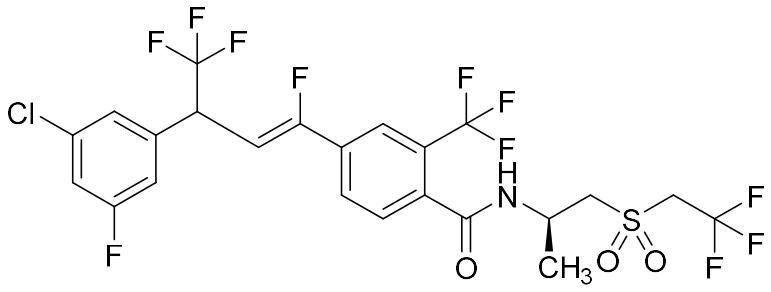
Aislado como una goma amarilla pálida (0.135 g, 46 %).

4-((*Z*)-3-(3,5-Dicloro-4-(difluorometil)fenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F104)



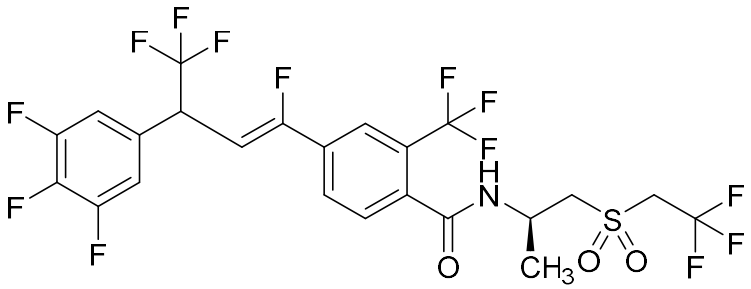
Aislado como un sólido amarillo pálido (0.106 g, 40 %).

4-((*Z*)-3-(3-cloro-5-fluorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F126)



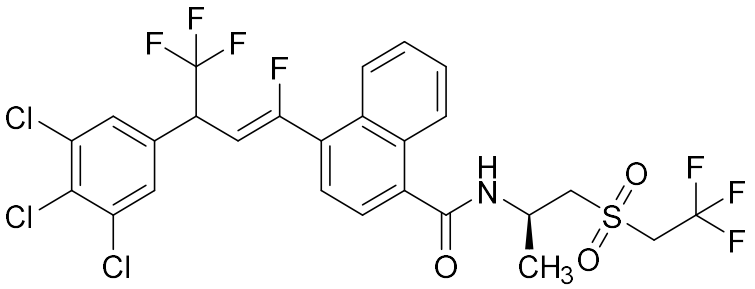
Aislado como una goma amarilla pálida (0.095 g, 46 %).

4-((*Z*)-1,4,4,4-Tetrafluoro-3-(3,4,5-trifluorofenil)but-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F133)



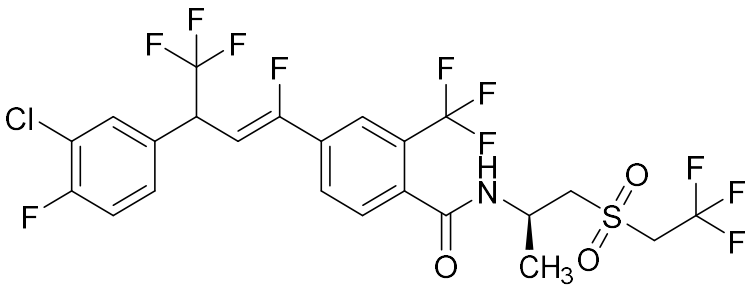
Aislado como una goma amarilla pálida (0.100 g, 33 %).

4-((*Z*)-1,4,4,4-Tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-1-naphthamida (PF1)



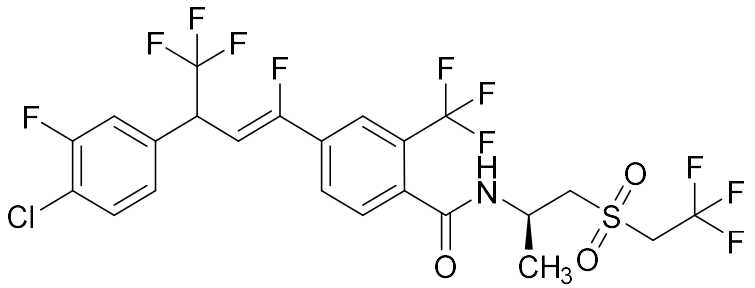
Aislado como un sólido marrón (0.120 g, 51 %).

4-((*Z*)-3-(3-cloro-4-fluorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (PF2)



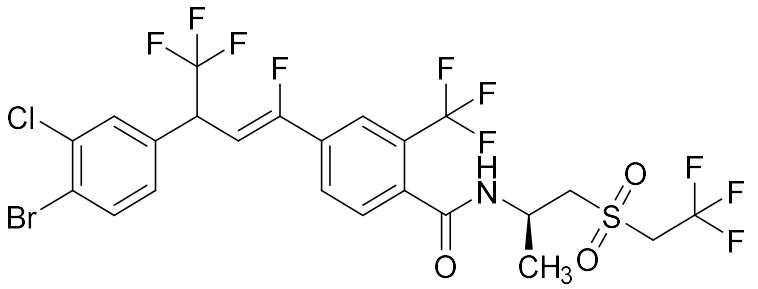
Aislado como un sólido amarillo (0.130 g, 46 %).

4-((*Z*)-3-(4-cloro-3-fluorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (PF4)



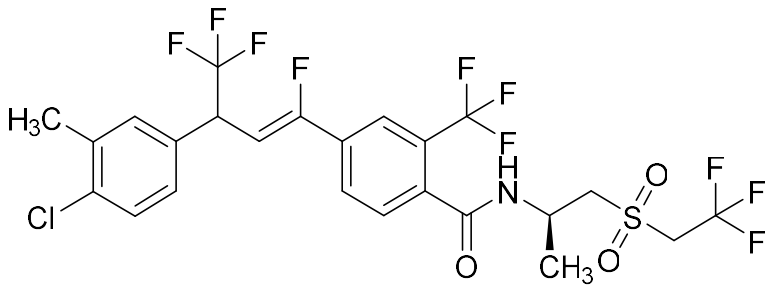
Aislado como un sólido blanco (0.070 g, 26 %).

4-((*Z*)-3-(4-Bromo-3-clorofenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (PF5)



Aislado como un sólido blancuzco (0.131 g, 48 %).

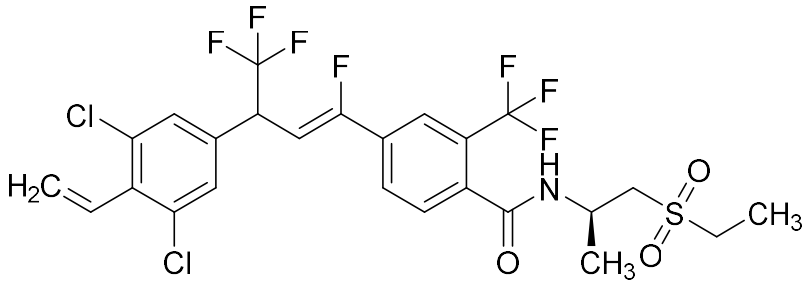
4-((*Z*)-3-(4-cloro-3-metilfenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (PF8)



Aislado como un sólido amarillo pálido (0.037 g, 14 %).

*El siguiente compuesto se prepararó de la misma manera que el procedimiento detallado en el **Ejemplo 15**:*

4-((*Z*)-3-(3,5-Dicloro-4-vinilfenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-(etilsulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F119)

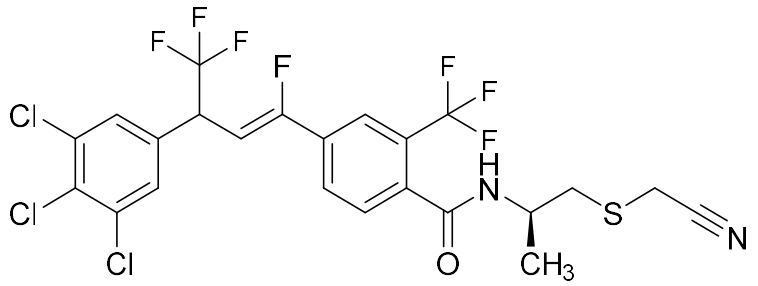


Aislado como un sólido blancuzco (0.075 g, 59 %).

*El siguiente compuesto se prepararó de la misma manera que el procedimiento detallado en el **Ejemplo 16**:*

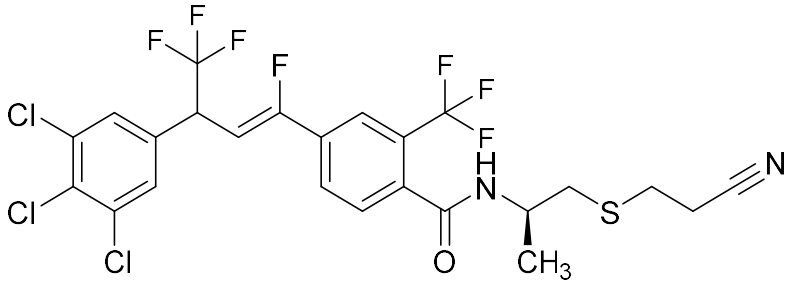
Los siguientes compuestos se prepararon de la misma manera que el procedimiento detallado en el ***Ejemplo 17****:*

N-((*R*)-1-((Cyanometil)tio)propan-2-il)-4-((*Z*)-1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F83)



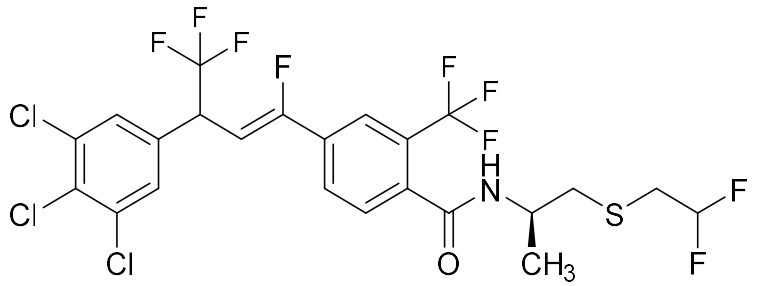
Aislado como un vidrio naranja (0.540 g, 57 %).

N-((*R*)-1-((2-cianoetil)tio)propan-2-il)-4-((*Z*)-1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F128)



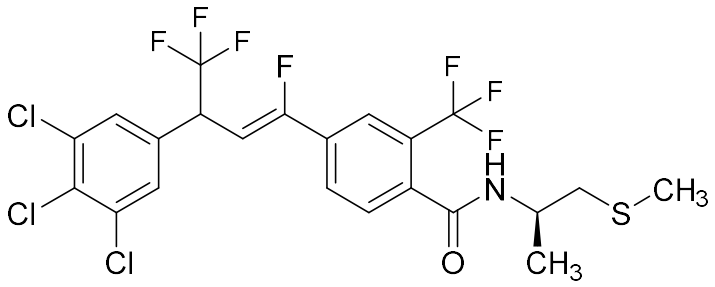
Aislado como una espuma beige (0.386 g, 59 %).

N-((*R*)-1-((2,2-Difluoroetil)tio)propan-2-il)-4-((*Z*)-1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F82)



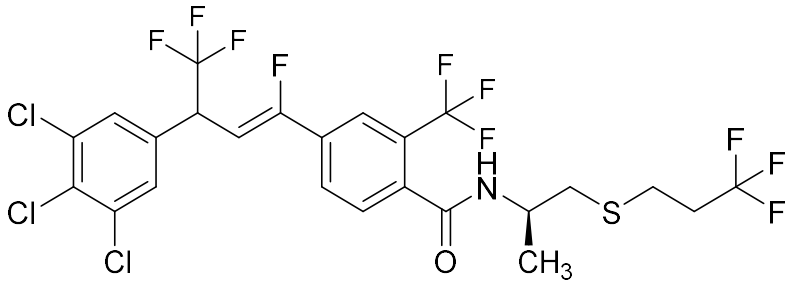
Aislado como un vidrio amarillo (0.306 g, 51 %).

***N*-((*R*)-1-(Metiltio)propan-2-il)-4-((*Z*)-1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F75)**



Aislado como una espuma blancuzca (0.357 g, 62 %).

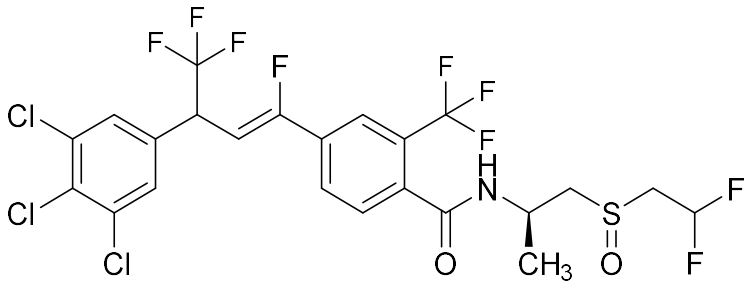
4-((*Z*)-1,4,4,4-Tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)-*N*-((*R*)-1-((3,3,3-trifluoropropil)tio)propan-2-il)benzamida (F137)



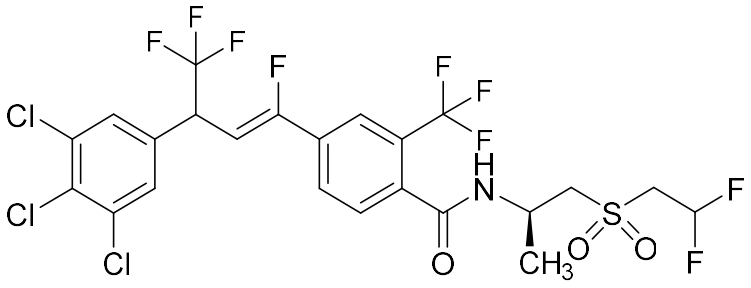
Aislado como una espuma amarilla (0.479 g, 78 %).

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

***N*-((2*R*)-1-((2,2-Difluoroetil)sulfinil)propan-2-il)-4-((*Z*)-1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F86) y *N*-((*R*)-1-((2,2-difluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-4-((*Z*)-1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F129)**

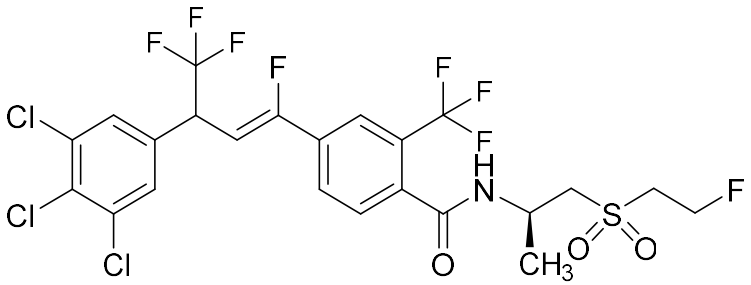


Aislado como una espuma amarilla (0.096 g, 33 %).



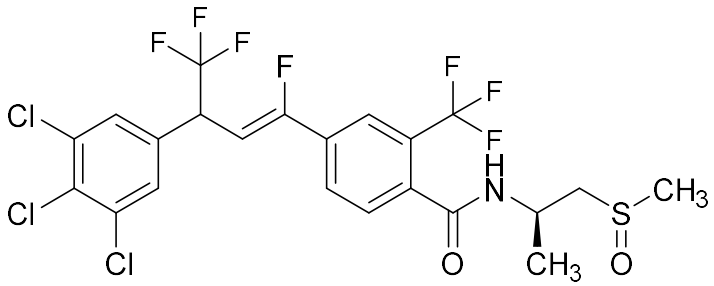
Aislado como una espuma amarilla (0.074 g, 27 %).

_N_-((_R_)-1-((2-Fluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-4-((_Z_)-1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F85)

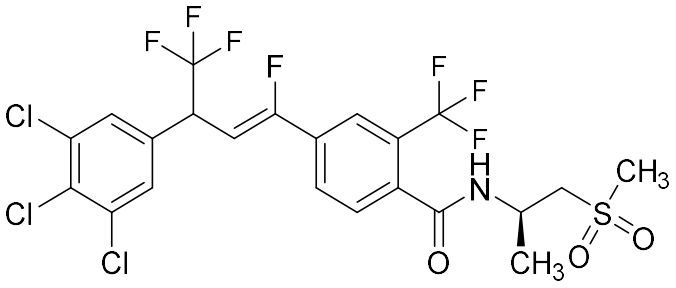


Aislado como una espuma blanca (0.027 g, 21 %).

_N_-((2_R_)-1-(Metilsulfinil)propan-2-il)-4-((_Z_)-1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F88) y _N_-((_R_)-1-(metilsulfonil)propan-2-il)-4-((_Z_)-1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F87)

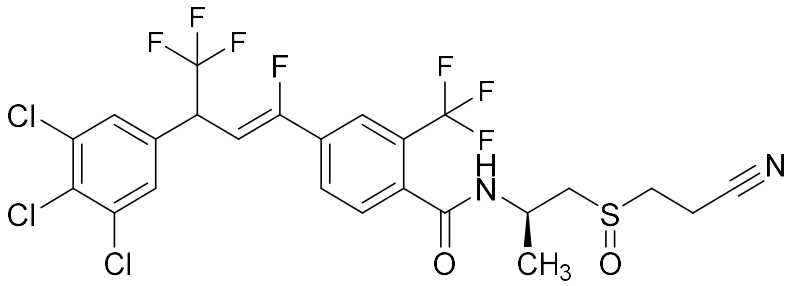


Aislado como una espuma de color amarillo pálido (0.066 g, 25 %).

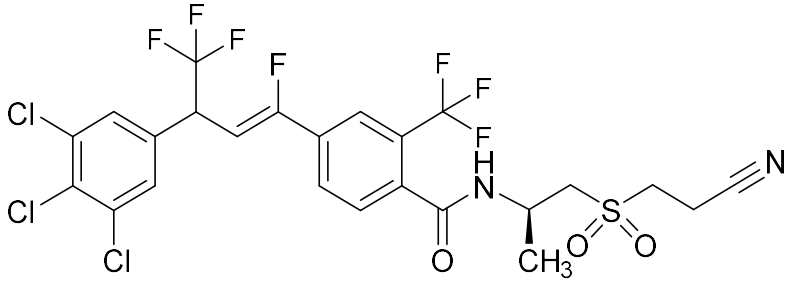


Aislado como un vidrio incoloro (0.087 g, 35 %).

***N*-((2*R*)-1-((2-cianoetil)sulfinil)propan-2-il)-4-((*Z*)-1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F122) y *N*-((*R*)-1-((2-cianoetil)sulfonil)propan-2-il)-4-((*Z*)-1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F123)**

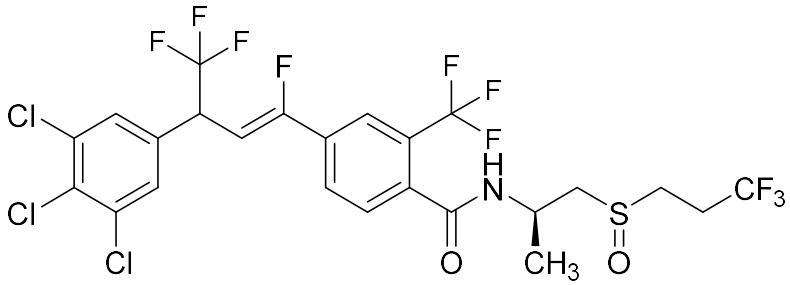


Aislado como una espuma amarilla (0.090 g, 35 %).

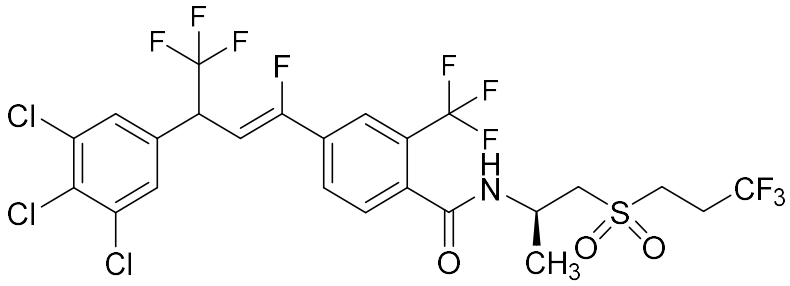


Aislado como un sólido blanco amorfo (0.085 g, 32 %).

4-((*Z*)-1,4,4,4-Tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)-*N*-((2*R*)-1-((3,3,3-trifluoropropil)sulfinil)propan-2-il)benzamida (F121) y 4-((*Z*)-1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)-*N*-((*R*)-1-((3,3,3-trifluoropropil)sulfonil)propan-2-il)benzamida (F130)

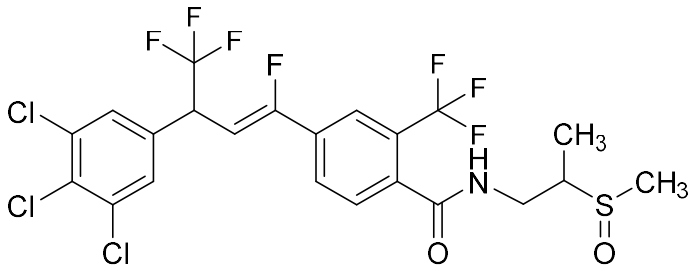


Aislado como una espuma amarilla (0.085 g, 32 %).

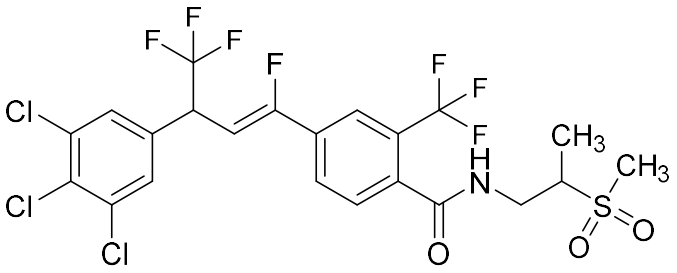


Aislado como un sólido blanco amorfo (0.099 g, 35 %).

(*Z*)-*N*-(2-(Metilsulfinil)propil)-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F90) y (*Z*)-*N*-(2-(metilsulfonil)propil)-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F124)

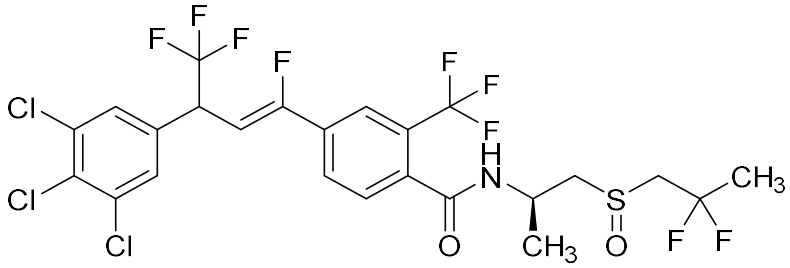


Aislado como una espuma blanca (0.068 g, 41 %).

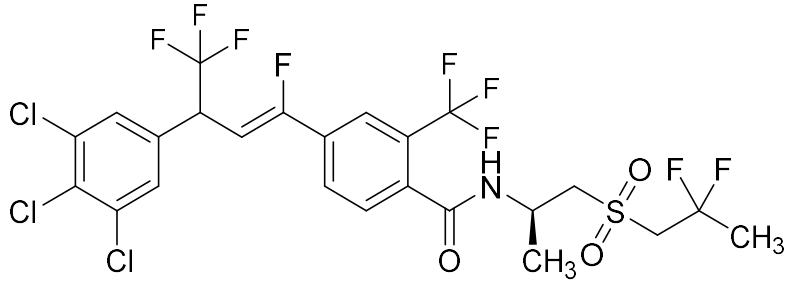


Aislado como una espuma blanca (0.079 g, 47 %).

_N_-((2_R_)-1-((2,2-Difluoropropil)sulfinil)propan-2-il)-4-((_Z_)-1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F96) y _N_-((_R_)-1-((2,2-difluoropropil)sulfonil)propan-2-il)-4-((_Z_)-1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F97)

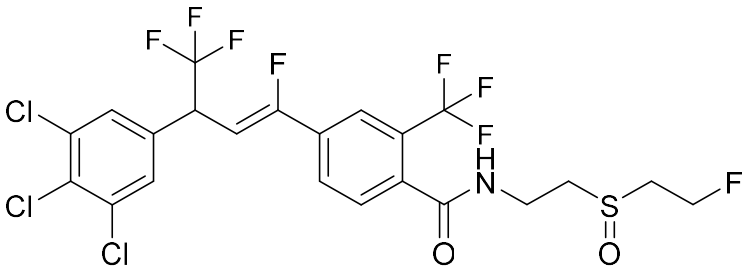


Aislado como un vidrio incoloro (0.102 g, 53 %) usando 1.4 equivalentes de perborato de sodio.



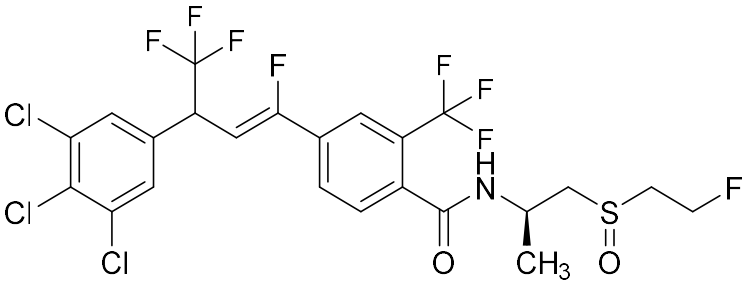
Aislado como una espuma blanca (0.079 g, 40 %) usando 1.4 equivalentes de perborato de sodio.

(_Z_)-_N_-(2-((2-Fluoroetil)sulfinil)etil)-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F138)



Aislado como una espuma blanca (0.100 g, 82 %) usando un equivalente de perborato de sodio.

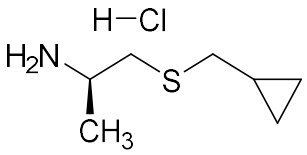
_N_-((2_R_)-1-((2-Fluoroetil)sulfinil)propan-2-il)-4-((_Z_)-1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F99)



Aislado como un vidrio incoloro (0.102 g, 53 %) usando un equivalente de perborato de sodio.

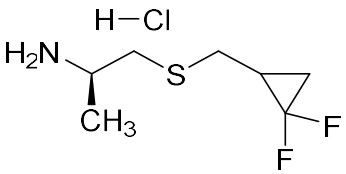
*Los siguientes compuestos se prepararon de la misma manera que el procedimiento detallado en el **Ejemplo 19**:*

(_R_)-1-((ciclopropilmetil)tio)propan-2-amina hidrocloruro (C134)



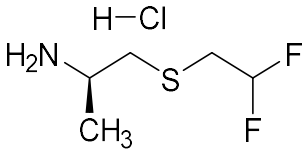
Aislado como un sólido blanco amorfo (0.339 g, 89 %): ^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 8.18 (s, 3H), 3.28 (dt, J = 7.6, 6.1 Hz, 1H), 2.85 (dd, J = 13.7, 5.8 Hz, 1H), 2.67 (dd, J = 13.7, 7.8 Hz, 1H), 2.55 - 2.45 (m, 2H), 1.26 (d, J = 6.5 Hz, 3H), 1.04 - 0.90 (m, 1H), 0.57 - 0.47 (m, 2H), 0.29 - 0.15 (m, 2H); IR (película delgada) 3384, 2912, 1623, 1513 cm^{-1}; HRMS-ESI (*m/z*) $[M+H]^+$ calculado para $C_7H_{15}NS$, 146.0998; encontrado, 146.1000.

(2_R_)-1-(((2,2-Difluorociclopropil)metil)tio)propan-2-amina hidrocloruro (C135)



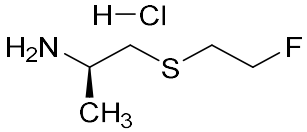
Aislado como un sólido amarillo/naranja amorfo (0.592 g, 81 %):^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 8.28 (s, 3H), 3.34 - 3.23 (m, 1H), 2.95 - 2.86 (m, 1H), 2.77 - 2.61 (m, 3H), 2.00 (dtq, *J* = 13.7, 11.4, 7.5 Hz, 1H), 1.69 - 1.58 (m, 1H), 1.37 - 1.21 (m, 4H); IR (película delgada) 3392, 2923, 1610, 1510 cm^{-1}; HRMS-ESI (*m/z*) $[M+H]^+$ calculado para $C_7H_{13}F_2NS$, 182.0810; encontrado, 182.0808.

(*R*)-1-((2,2-Difluoroetil)tio)propan-2-amina hidrocloruro (C136)



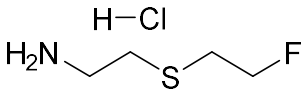
Aislado como un sólido amarillo/blanco amorfo (0.228 g, 89 %): ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 8.28 (s, 3H), 6.20 (tt, *J* = 56.3, 4.2 Hz, 1H), 3.38 - 3.24 (m, 1H), 3.07 (td, *J* = 16.8, 4.2 Hz, 2H), 2.92 (dd, *J* = 13.8, 5.8 Hz, 1H), 2.75 (dd, *J* = 13.8, 7.5 Hz, 1H), 1.27 (d, *J* = 6.5 Hz, 3H); IR (película delgada) 2896, 1585, 1502 cm^{-1}.

(*R*)-1-((2-Fluoroetil)tio)propan-2-amina hidrocloruro (C137)



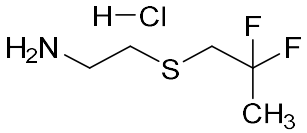
Aislado como un aceite amarillo (0.475 g, 99 %):^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 8.15 (s, 3H), 4.64 (t, *J* = 6.1 Hz, 1H), 4.52 (t, *J* = 6.1 Hz, 1H), 3.30 (dq, *J* = 12.4, 6.2 Hz, 1H), 2.92 (t, *J* = 6.1 Hz, 1H), 2.90 - 2.80 (m, 2H), 2.71 (dd, *J* = 13.8, 7.4 Hz, 1H), 1.26 (d, *J* = 6.6 Hz, 3H); IR (película delgada) 3386, 2938, 1617, 1509 cm^{-1}.

2-((2-Fluoroetil)tio)etan-1-amina hidrocloruro (C138)



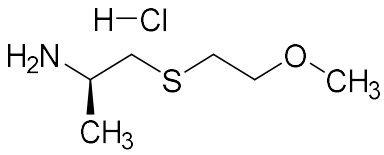
Aislado como un aceite incoloro (0.357 g, 95 %):^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 8.13 (s, 3H), 4.62 (t, J = 6.0 Hz, 1H), 4.52 (t, J = 6.1 Hz, 1H), 2.97 (t, J = 7.3 Hz, 2H), 2.90 (t, J = 6.1 Hz, 1H), 2.86 (t, J = 6.0 Hz, 1H), 2.80 (t, J = 7.2 Hz, 2H); ^{19}F NMR (471 MHz, DMSO-d_6) δ -212.81 (tt, J = 46.9, 22.8 Hz); IR (película delgada) 3385, 2959, 2898 cm^{-1}; HRMS-ESI (*m/z*) [M+H]$^{+}$ calculado para $C_4H_{10}FNS$, 124.0591; encontrado, 124.0594.

2-((2,2-Difluoropropil)tio)etan-1-amina hidrocloruro (C139)



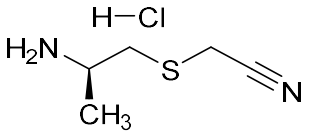
Aislado como un sólido beige amorfo (0.323 g, 94 %): ^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 8.30 (s, 3H), 3.31 (q, J = 6.7 Hz, 1H), 3.14 (td, J = 15.1, 1.8 Hz, 2H), 2.94 (dd, J = 13.7, 5.8 Hz, 1H), 2.75 (dd, J = 13.6, 7.6 Hz, 1H), 1.70 (t, J = 18.8 Hz, 3H), 1.27 (d, J = 6.5 Hz, 3H); ^{19}F NMR (471 MHz, DMSO-d_6) δ -87.66 - -87.95 (m); IR (película delgada) 3390, 2924 cm^{-1}; HRMS-ESI (*m/z*) [M+H]$^{+}$ calculado para $C_6H_{13}F_2NS$, 170.0810; encontrado, 170.0812.

(*R*)-1-((2-Metoxietil)tio)propan-2-amina hidrocloruro (C140)



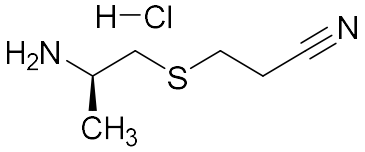
Aislado como un aceite color oro (0.276 g, 92 %):^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 8.18 (s, 3H), 3.49 (t, J = 6.4 Hz, 2H), 3.26 (s, 3H), 2.82 (dd, J = 13.8, 5.9 Hz, 1H), 2.74 - 2.61 (m, 3H), 1.26 (d, J = 6.5 Hz, 3H); IR (película delgada) 3385, 2926, 1628, 1517 cm^{-1}; HRMS-ESI (*m/z*) [M+H]$^{+}$ calculado para $C_6H_{15}NOS$, 150.0947; encontrado, 150.0947.

(*R*)-2-((2-Aminopropil)tio)acetonitrilo hidrocloruro (C141)



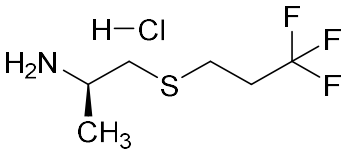
Aislado como un sólido amorfo color salmón (0.315 g, 78 %): ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 8.27 (s, 3H), 3.90 - 3.79 (m, 2H), 3.47 - 3.35 (m, 1H), 3.00 (dd, *J* = 13.9, 5.9 Hz, 1H), 2.83 (dd, *J* = 13.9, 7.6 Hz, 1H), 1.29 (d, *J* = 6.5 Hz, 3H); IR (película delgada) 2841, 2241 cm^{-1}; HRMS-ESI (*m/z*) $[M+H]^+$ calculado para $C_5H_{10}N_2S$, 131.0637; encontrado, 131.0636.

(*R*)-3-((2-Aminopropil)tio)propanenitrilo hidrocloruro (C142)



Aislado como un aceite naranja (0.350 g, 90 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.88 - 7.83 (m, 1H), 7.78 (dd, *J* = 8.1, 1.8 Hz, 1H), 7.61 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.43 (s, 2H), 5.90 - 5.74 (m, 2H), 4.60 (p, *J* = 8.8 Hz, 1H), 4.46 - 4.32 (m, 1H), 2.89 - 2.68 (m, 4H), 2.49 - 2.34 (m, 2H), 1.35 (d, *J* = 6.7 Hz, 3H); HRMS-ESI (*m/z*) $[M+H]^+$ calculado para $C_6H_{12}N_2S$, 145.0794; encontrado, 145.0793.

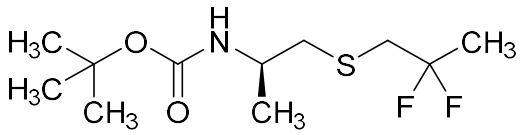
(*R*)-1-((3,3,3-Trifluoropropil)tio)propan-2-amina hidrocloruro (C143)



Aislado como un aceite naranja (0.345 g, 89 %):^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 8.15 (s, 3H), 3.30 - 3.19 (m, 1H), 2.84 (dd, *J* = 13.9, 6.0 Hz, 1H), 2.78 - 2.52 (m, 5H), 1.26 (d, *J* = 6.5 Hz, 3H); IR (película delgada) 2899 cm^{-1}; HRMS-ESI (*m/z*) $[M+H]^+$ calculado para $C_6H_{12}F_3NS$, 188.0715; encontrado, 188.0715.

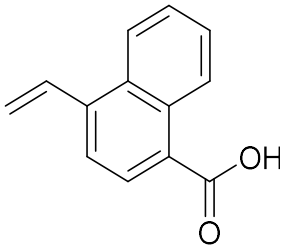
El siguiente compuesto se prepararó de la misma manera que el procedimiento detallado en el ***Ejemplo 20****:*

***terc*-Butil (*R*)-(1-((2,2-difluoropropil)tio)propan-2-il)carbamato (C144)**



Aislado como un aceite amarillo pálido (0.562 g, 19 %):^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$ δ 4.62 (s, 1H), 3.99 - 3.74 (m, 1H), 2.91 (t, *J* = 14.1 Hz, 2H), 2.82 - 2.66 (m, 2H), 1.71 (t, *J* = 18.3 Hz, 3H), 1.45 (s, 9H), 1.21 (d, *J* = 6.7 Hz, 3H); ^{19}F NMR (471 MHz, $CDCl_3$) δ -87.83 - -89.54 (m); ^{13}C NMR (126 MHz, $CDCl_3$) δ 155.14, 123.89 (t, *J* = 239.8 Hz), 79.45, 45.97, 40.09, 39.01 (t, *J* = 29.1 Hz), 28.39, 22.33 (t, *J* = 27.1 Hz), 19.95; HRMS-ESI (*m/z*) $[M+H]^+$ calculado para $C_{11}H_{21}F_2NO_2S$, 292.1153; encontrado, 292.1152.

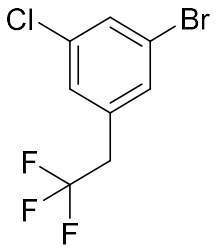
Ejemplo 23: Preparación de ácido 4-vinil-1-naftóico (C145)



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 hidroclórico 1 N 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 % acetato de etilo en hexanos) para proporcionar el compuesto del título como un sólido amarillo brillante (1.36 g, 62 %): mp 147 – 155 °C; ^{1}H 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,

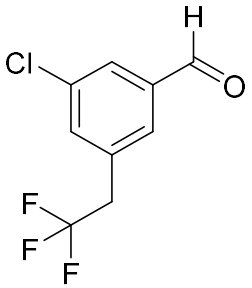
1H), 7.70 – 7.57 (m, 3H), 5.95 (dd, *J* = 17.2, 1.5 Hz, 1H), 5.62 (dd, *J* = 11.1, 1.5 Hz, 1H); ESIMS *m/z* 197 ([M-H]$^-$).

Ejemplo 24: Preparación de 1-bromo-3-cloro-5-(2,2,2-trifluoroetil)benceno (C146)



Ácido (3-Bromo-5-clorofenil)borónico (4 g, 17.00 mmol) se añadió a un matraz con 2,2,2-trifluoroetan-1-amina hidrocloruro (9.22 g, 68.0 mmol), nitrito de sodio (5.87 g, 85 mmol), y cloruro de amonio (3.64 g, 68.0 mmol). La reacción se calentó hasta 100 °C durante toda la noche. En este punto, el solvente se retiró, y el residuo se disolvió en sulfóxido de dimetilo (20 mL). Se añadió fluoruro de potasio (1.976 g, 34.0 mmol), y la mezcla se calentó hasta 100 °C por 2 horas. Después del enfriamiento, la mezcla se diluyó con agua y se extrajo con diclorometano. Después de la extracción y la retirada del solvente, el residuo se purificó por cromatografía de gel de sílice que eluye con hexanos. El compuesto del título se recuperó como un aceite incoloro claro que se cristalizó después de que se detuvo (3.00 g, 64.5 %): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7.52 (t, *J* = 1.8 Hz, 1H), 7.35 (s, 1H), 7.24 (s, 1H), 3.32 (q, *J* = 10.5 Hz, 2H). ^{19}F NMR (471 MHz, $CDCl_3$) δ -65.64. ESIMS *m/z* 274 ([M+H]$^+$).

Ejemplo 25: Preparación de 3-cloro-5-(2,2,2-trifluoroetil)benzaldehído (C147)



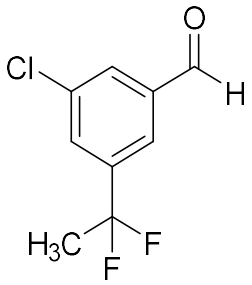
1-Bromo-3-cloro-5-(2,2,2-trifluoroetil)benceno **(C146)** (2 g, 7.31 mmol) se disolvió en tetrahidrofurano a 0 °C, y complejo de cloruro de isopropilmagnesio-cloruro de litio (solución 1.3

M en tetrahidrofurano; 6.75 mL, 8.78 mmol) se añadió en forma de gotas. La mezcla de reacción se agitó por 4 horas con calentamiento hasta temperatura ambiente, y se añadió *N,N*-dimetilformamida (0.680 mL, 8.78 mmol) en forma de gotas. La mezcla de reacción se agitó por 30 minutos, luego se añadió ácido hidroclórico 1 N acuoso, y la mezcla se extrajo con éter de dietilo. Las capas orgánicas combinadas se lavaron con salmuera, se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron hasta un aceite amarillo. La purificación por cromatografía de gel de sílice que eluye 0-20 % acetona en hexanos dio el compuesto del título como un aceite amarillo pálido (1.33 g, 82 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 9.98 (s, 1H), 7.90 - 7.78 (m, 1H), 7.71 (s, 1H), 7.56 (s, 1H), 3.45 (q, *J* = 10.5 Hz, 2H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -65.67; IR (película delgada) 1704

cm^{-1}; EIMS *m/z* 221 ($[M]^+$).

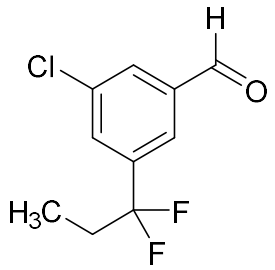
Los siguientes compuestos se prepararon de la misma manera que el procedimiento detallado en el ***Ejemplo 25****:*

3-cloro-5-(1,1-difluoroetil)benzaldehído (C154)



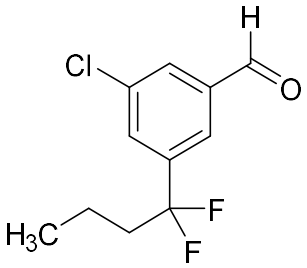
Aislado como un aceite amarillo (0.665 g, 62 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 10.01 (s, 1H), 7.96 - 7.85 (m, 2H), 7.75 (s, 1H), 1.96 (t, *J* = 18.2 Hz, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -88.26; IR (película delgada) 1705 cm^{-1}; ESIMS *m/z* 205 ($[M+H]^+$).

3-cloro-5-(1,1-difluoropropil)benzaldehído (C155)



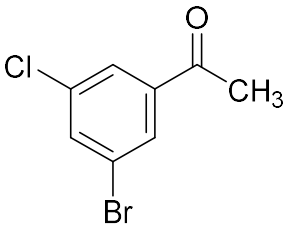
Aislado como un aceite amarillo claro (0.700 g, 86 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 10.01 (s, 1H), 7.92 (d, *J* = 1.7 Hz, 1H), 7.86 (s, 1H), 7.71 (t, *J* = 1.8 Hz, 1H), 2.27 - 2.06 (m, 2H), 1.02 (t, *J* = 7.5 Hz, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -97.93; IR (película delgada) 1705 cm^{-1}; EIMS *m/z* 218 ([M]$^+$).

3-cloro-5-(1,1-difluorobutil)benzaldehído (C156)



Aislado como un aceite amarillo claro (0.690 g, 89 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 10.01 (s, 1H), 7.91 (d, *J* = 1.5 Hz, 1H), 7.86 (s, 1H), 7.71 (d, *J* = 1.6 Hz, 1H), 2.20 - 2.03 (m, 2H), 1.53 - 1.41 (m, 2H), 0.96 (t, *J* = 7.4 Hz, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -95.90; IR (película delgada) 1704 cm^{-1}; EIMS *m/z* 232 ([M]$^+$).

Ejemplo 26: Preparación de 1-(3-bromo-5-clorofenil)etan-1-ona (C148)

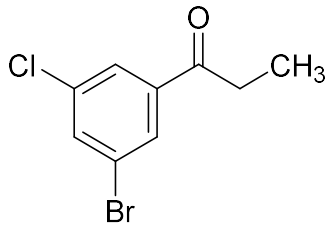


1,3-Dibromo-5-clorobenceno (5.0 g, 18.5 mmol) se disolvió en éter de dietilo (61.6 mL) y se enfrió hasta -78 °C. Debido a que el compuesto salí de una solución, la mezcla se retiró del baño de enfriamiento. Tan pronto como la agitación fue visible nuevamente a partir de la

temperatura de calentamiento, *n*-butillitio (8.14 mL, 20.34 mmol) se añadió en forma de gotas, y la solución se sumergió nuevamente en el baño frío. La solución tomó un color amarillo brillante, y la mezcla se agitó por 30 minutos. En este punto se observó un precipitado amarillo ligero. *N*-Metoxi-*N*-metilacetamida (2.359 mL, 22.19 mmol) se añadió en forma de gotas, y la mezcla de reacción se agitó por 10 minutos, luego se calentó lentamente hasta temperatura ambiente. La mezcla de reacción se apagó con 1 N ácido hidroclórico y se extrajo con éter de dietilo. Los extractos orgánicos combinados se lavaron con salmuera, se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron. El aceite resultante se purificó en una corrida de sílice a 0-15 % gradiente de acetona en hexanos. El compuesto del título se aisló como un sólido blanco (3.7 g, 86 %): mp 33 – 36 ^{o}C; ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7.97 - 7.95 (m, 1H), 7.85 (dd, *J* = 1.5 Hz, 1H), 7.71 (t, *J* = 1.8 Hz, 1H), 2.59 (s, 3H); IR (película delgada) 1687 cm^{-1}; ESIMS *m/z* 233 ($[M+H]^+$).

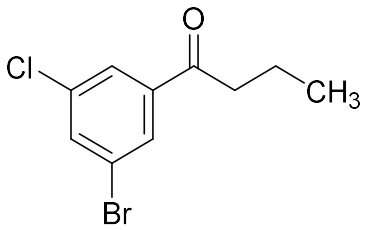
Los siguientes compuestos se prepararon de la misma manera que el procedimiento detallado en el ***Ejemplo 26****:*

1-(3-Bromo-5-clorofenil)propan-1-ona (C149)



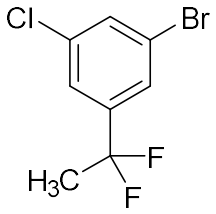
Aislado como un sólido blanco (1.71 g, 62 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.96 (t, *J* = 1.6 Hz, 1H), 7.90 - 7.81 (m, 1H), 7.69 (t, *J* = 1.8 Hz, 1H), 2.96 (q, *J* = 7.2 Hz, 2H), 1.22 (t, *J* = 7.2 Hz, 3H); ^{13}C NMR (101 MHz, $CDCl_3$) δ 198.01, 139.51, 135.78, 135.33, 129.38, 126.91, 123.25, 32.06, 7.98; ESIMS *m/z* 248 ($[M+H]^+$).

1-(3-Bromo-5-clorofenil)butan-1-ona (C150)



Aislado como aceite incoloro claro (1.65 g, 57 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.95 (t, *J* = 1.6 Hz, 1H), 7.84 (t, *J* = 1.7 Hz, 1H), 7.69 (t, *J* = 1.8 Hz, 1H), 2.90 (t, *J* = 7.2 Hz, 2H), 1.76 (h, *J* = 7.4 Hz, 2H), 1.00 (t, *J* = 7.4 Hz, 3H); ^{13}C NMR (101 MHz, $CDCl_3$) δ 197.53, 139.67, 135.75, 135.28, 129.40, 126.93, 123.22, 40.61, 17.47, 13.72; IR (película delgada) 1693, 1559, 1203 cm^{-1}; ESIMS *m/z* 262 ($[M+H]^+$).

Ejemplo 27: Preparación de 1-bromo-3-cloro-5-(1,1-difluoroetil)benceno (C151)

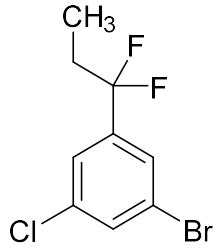


1-(3-Bromo-5-clorofenil)etan-1-ona **(C148)** (1.6 g, 6.85 mmol) se disolvió en diclorometano (34.3 mL) a lo que se añadieron secuencialmente Deoxo-Fluor® (bis(2-metoxietil)aminoazufre trifluoruro; 4.42 mL, 10.28 mmol) y una gota de metanol. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante toda la noche. Se añadieron 1.5 equivalentes adicionales de Deoxo-Fluor®, y la mezcla de reacción se calentó hasta 40 °C por 24 horas. La mezcla de reacción se concentró bajo vacío ligero (300 mbar) para retirar el diclorometano y se calentó hasta 70 °C por 3 horas. La reacción se apagó por adición lenta de solución de bicarbonato de sodio acuoso saturado con agitación. Las capas se separaron y la capa acuosa se extrajo con diclorometano. Los extractos orgánicos combinados se lavaron con salmuera, se secaron sobre sulfato de sodio, y se concentraron. La purificación por cromatografía de gel de sílice que eluye con hexanos proporcionó el compuesto del título como un aceite incoloro claro (1.34 g, 77 %):

^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.57 (d, *J* = 1.7 Hz, 1H), 7.53 (s, 1H), 7.43 (s, 1H), 1.89 (t, *J* = 18.2 Hz, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -88.39; ESIMS *m/z* 255 ($[M+H]^+$).

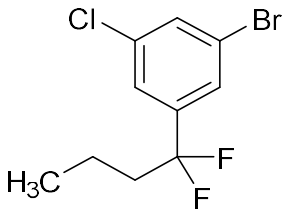
Los siguientes compuestos se prepararon de la misma manera que el procedimiento detallado en el ***Ejemplo 27****:*

1-Bromo-3-cloro-5-(1,1-difluoropropil)benceno (C152)



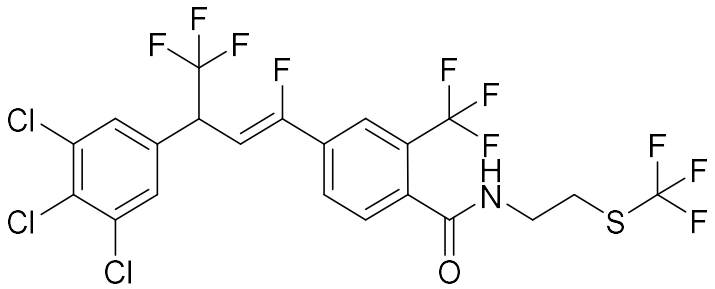
Aislado como un aceite amarillo claro (1.00 g, 83 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.57 (t, *J* = 1.8 Hz, 1H), 7.50 (s, 1H), 7.39 (s, 1H), 2.11 (ddt, *J* = 23.7, 16.2, 7.5 Hz, 2H), 0.99 (t, *J* = 7.5 Hz, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -97.97; IR (película delgada) 1566 cm^{-1}; ESIMS *m/z* 268 ($[M+H]^+$).

1-Bromo-3-cloro-5-(1,1-difluorobutil)benceno (C153)



Aislado como un aceite amarillo claro (0.940 g, 96 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.57 (t, *J* = 1.8 Hz, 1H), 7.49 (s, 1H), 7.39 (s, 1H), 2.14 - 1.98 (m, 2H), 1.51 - 1.39 (m, 2H), 0.95 (t, *J* = 7.4 Hz, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -95.94; IR (película delgada) 1565 cm^{-1}; ESIMS *m/z* 282 ($[M+H]^+$).

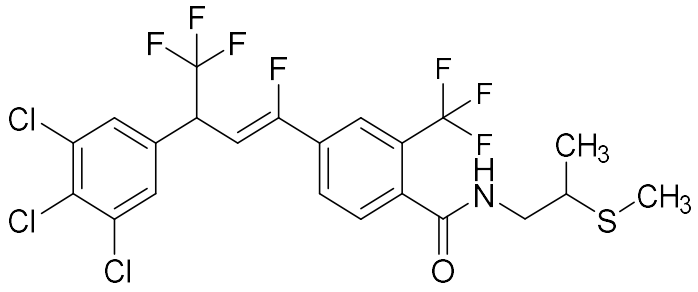
Ejemplo 29: Preparación de (*Z*)-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)-*N*-(2-((trifluorometil)tio)etil)benzamida (F92)



Cloruro de (*Z*)-4-(1,4,4,4-Tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoilo **(C23)** (1.0 mL, 0.45 M, 0.45 mmol) en diclorometano se añadió a una solución incoloro de 2-((trifluorometil)tio)etan-1-amina (100 mg, 0.689 mmol) y 4-metilmorfolina (0.148 mL, 1.350 mmol) en *N,N*-dimetilformamida (2 mL). La mezcla de reacción se agitó por dos horas. La mezcla de reacción se diluyó con acetato de etilo y ácido cítrico 5 % acuoso, y las capas se separaron. La solución orgánica se lavó con agua, se secó con sulfato de magnesio, se filtró y se concentró. El residuo resultante se purificó por cromatografía en SiO_2 con un gradiente lineal de acetato de etilo 0 – 50 % en hexanos proporcionando el compuesto del título como un aceite amarillo (0.204 g, 69 %).

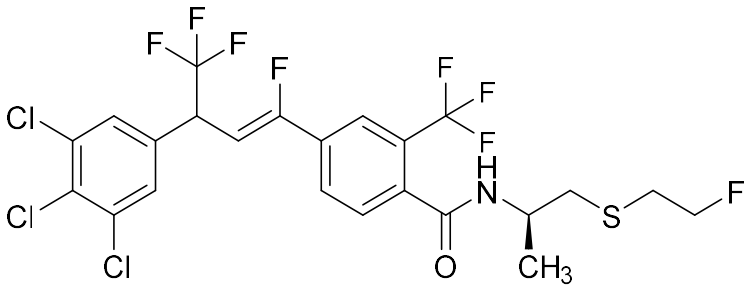
Los siguientes compuestos se prepararon de la misma manera que el procedimiento detallado en el ***Ejemplo 29****:*

(*Z*)-*N*-(2-(Metiltio)propil)-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F89)



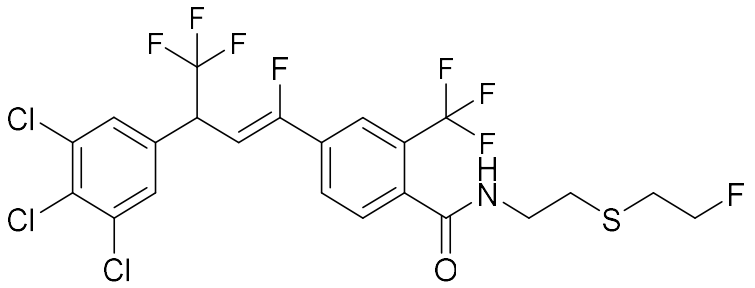
Aislado como un vidrio amarillo (0.20 g, 34 %).

***N*-((*R*)-1-((2-Fluoroetil)tio)propan-2-il)-4-((*Z*)-1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F84)**



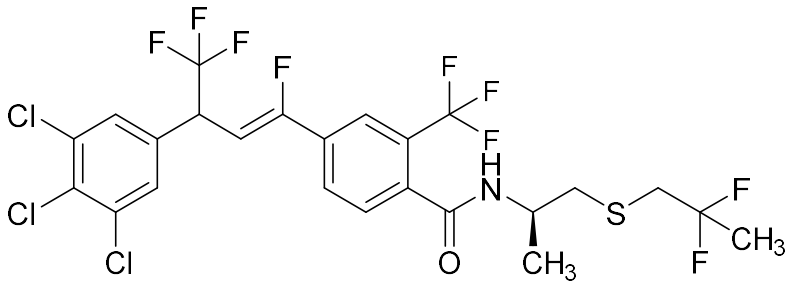
Aislado como un vidrio amarillo pálido (0.273 g, 35 %).

(*Z*)-*N*-(2-((2-Fluoroetil)tio)etil)-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F125)



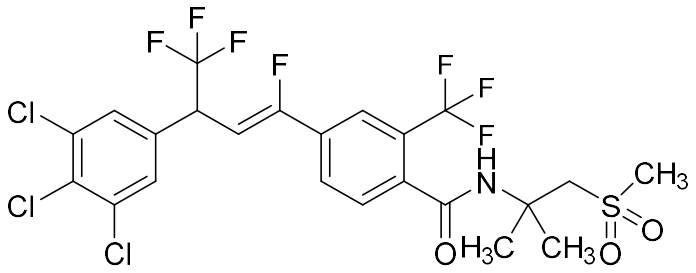
Aislado como un aceite incoloro (0.249 g, 34 %).

***N*-((*R*)-1-((2,2-Difluoropropil)tio)propan-2-il)-4-((*Z*)-1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F113)**



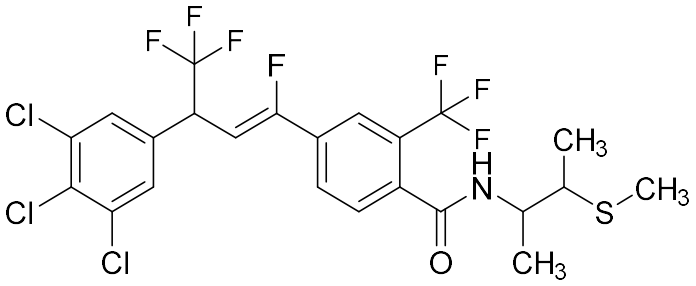
Aislado como una espuma amarilla (0.300 g, 45 %).

(*Z*)-*N*-(2-Metil-1-(metilsulfonil)propan-2-il)-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F100)



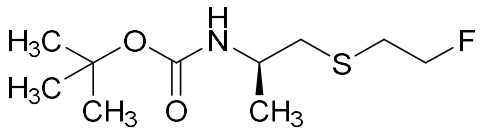
Aislado como una espuma amarilla (0.089 g, 23 %) usando diisopropiletil amina en lugar de *N*-metil morfolina.

Ejemplo 30: Preparación de (*Z*)-*N*-(3-(metiltio)butan-2-il)-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F101)



2-(3*H*-[1,2,3]Triazolo[4,5-*b*]piridin-3-il)-1,1,3,3-tetrametilisouronio hexafluorofosfato(V) (460 mg, 1.211 mmol) se añadió a una solución naranja de ácido (*Z*)-4-(1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-2-(trifluorometil)benzoico **(C2)** (400 mg, 0.807 mmol), *N*-etil-*N*-isopropilpropan-2-amina (324 µL, 1.856 mmol), y 3-(metiltio)butan-2-amina (115 mg, 0.969 mmol) en *N,N*-dimetilformamida (2.7 mL). La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante toda la noche. La mezcla de reacción se diluyó con agua y acetato de etilo. La solución orgánica se lavó con ácido cítrico 5 %, agua, y salmuera, se secó con sulfato de sodio, se filtró y se concentró. El residuo resultante se purificó por cromatografía rápida de sílice. El compuesto del título se aisló como un vidrio amarillo (0.37 g, 69 %).

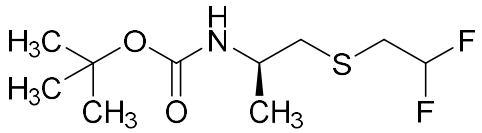
Ejemplo 31: Preparación de *terc*-butil (*R*)-(1-((2-fluoroetil)tio)propan-2-il)carbamato (C157)



Se añadió hidróxido de sodio acuoso (2.0 M, 8.5 mL, 17 mmol) a una solución de (*R*)-*S*-(2-((*terc*-butoxicarbonil)amino)propil) etanotioato **(C58)** (2.0 g, 8.5 mmol) en isopropanol at 0 °C. Después de agitar 2 horas, 1-fluoro-2-yodoetano (1.76 g, 10.1 mmol) se añadió y la mezcla de reacción se dejó agitar durante toda la noche. La mezcla de reacción se particionó entre acetato de etilo y agua. Los compuestos orgánicos se separaron, se lavaron con bicarbonato de sodio saturado y salmuera, se secaron con sulfato de magnesio, y se concentraron. El residuo resultante se purificó por cromatografía rápida de sílice. El compuesto del título se aisló como un líquido amarillo pálido (1.55 g 72 %): ^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 6.80 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 4.53 (dt, *J* = 47.3, 6.4 Hz, 2H), 3.54 (h, *J* = 6.9 Hz, 1H), 2.81 (dt, *J* = 21.2, 6.4 Hz, 2H), 2.63 - 2.51 (m, 2H), 1.38 (s, 9H), 1.07 (d, *J* = 6.7 Hz, 3H); ^{19}F NMR (471 MHz, DMSO-d_6) δ -211.55 (tt, *J* = 46.9, 21.3 Hz); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 155.41, 83.20 (d, *J* = 167.3 Hz), 78.02, 46.51, 38.34, 31.84 (d, *J* = 20.5 Hz), 28.72, 20.19; IR (película delgada) 3340, 2975, 2931, 1687, 1504 cm^{-1}.

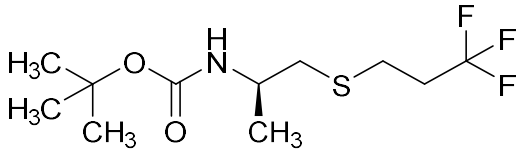
Los siguientes compuestos se prepararon de la misma manera que el procedimiento detallado en el ***Ejemplo 31****:*

***terc*-butil (*R*)-(1-((2,2-difluoroetil)tio)propan-2-il)carbamato (C158)**



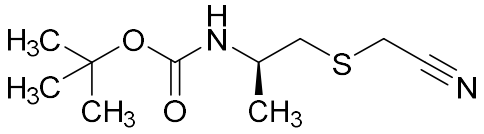
Aislado como un aceite amarillo pálido (0.323 g, 39 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 5.89 (tt, *J* = 56.5, 4.5 Hz, 1H), 4.54 (s, 1H), 3.84 (s, 1H), 2.89 (tdd, *J* = 15.4, 4.5, 1.4 Hz, 2H), 2.79 - 2.62 (m, 2H), 1.45 (s, 10H), 1.21 (d, *J* = 6.7 Hz, 3H); IR (película delgada) 1688 cm^{-1}; HRMS-ESI (*m/z*) $[M+Na]^+$ calculado para $C_{10}H_{19}F_2NO_2S$, 278.0997; encontrado, 278.1009.

***terc*-butil (*R*)-(1-((3,3,3-trifluoropropil)tio)propan-2-il)carbamato (C159)**



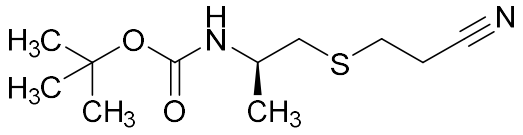
Aislado como un sólido amorfo blancuzco/amarillo (1.03 g, 31 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 4.59 (s, 1H), 3.86 (dd, *J* = 13.6, 7.3 Hz, 1H), 2.77 - 2.66 (m, 3H), 2.66 - 2.57 (m, 1H), 2.46 - 2.31 (m, 2H), 1.45 (s, 9H), 1.21 (d, *J* = 6.7 Hz, 3H); IR (película delgada) 1692 cm^{-1}; HRMS-ESI (*m/z*) $[M+Na]^+$ calculado para $C_{11}H_{20}F_3NO_2S$, 310.1059; encontrado, 310.1060.

***terc*-butil (*R*)-(1-((cianometil)tio)propan-2-il)carbamato (C160)**



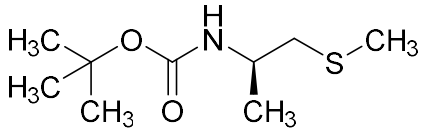
Aislado como un sólido blanco (2.1 g, 55 %): mp 61 - 62 °C; ^{1}H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 4.52 (s, 1H), 3.90 (dt, *J* = 13.7, 7.4 Hz, 1H), 3.47 (d, *J* = 17.2 Hz, 1H), 3.32 (d, *J* = 17.1 Hz, 1H), 2.82 (ddd, *J* = 52.8, 13.7, 6.0 Hz, 2H), 1.45 (s, 9H), 1.26 (d, *J* = 6.7 Hz, 3H); IR (película delgada) 2244, 1683 cm^{-1}; HRMS-ESI (*m/z*) $[M+H]^+$ calculado para $C_{10}H_{18}N_2O_2S$, 253.0981; encontrado, 253.0979.

***terc*-butil (*R*)-(1-((2-cianoetil)tio)propan-2-il)carbamato (C161)**



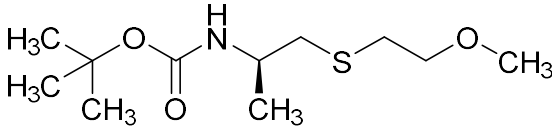
Aislado como un sólido amorfo blancuzco/beige (2.5 g, 59 %): mp 63 - 65 °C; ^{1}H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 4.58 (d, *J* = 9.2 Hz, 1H), 3.91 - 3.70 (m, 1H), 2.89 - 2.58 (m, 7H), 1.45 (s, 9H), 1.22 (d, *J* = 6.7 Hz, 3H); IR (película delgada) 1688 cm^{-1}; HRMS-ESI (*m/z*) $[M+Na]^+$ calculado para $C_{11}H_{20}N_2O_2S$, 267.1138; encontrado, 267.1142.

***terc*-butil (*R*)-(1-(metiltio)propan-2-il)carbamato (C162)**



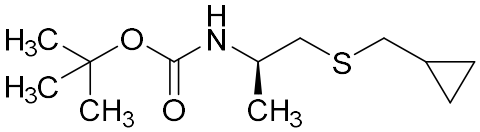
Aislado como un aceite naranja (2.8 g, 79 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 4.61 (s, 1H), 3.84 (d, *J* = 12.5 Hz, 1H), 2.65 (dd, *J* = 13.4, 5.2 Hz, 1H), 2.55 (dd, *J* = 13.4, 6.6 Hz, 1H), 2.14 (s, 3H), 1.45 (s, 9H), 1.22 (d, *J* = 6.6 Hz, 3H); IR (película delgada) 1686 cm^{-1}; HRMS-ESI (*m/z*) $[M+Na]^+$ calculado para $C_9H_{19}NO_2S$, 228.1029; encontrado, 228.1039.

terc-butil (*R*)-(1-((2-metoxietil)tio)propan-2-il)carbamato (C163)



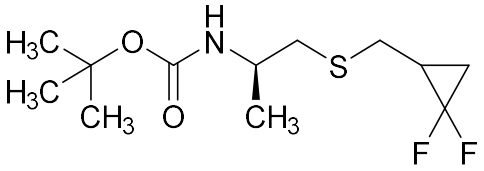
Aislado como un aceite amarillo pálido (0.558 g, 58 %) usando 2-metoxietil 4-metilbencenosulfonato: ^{1}H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 4.76 (s, 1H), 3.84 (s, 1H), 3.56 (t, *J* = 6.4 Hz, 2H), 3.38 (s, 3H), 2.80 - 2.69 (m, 3H), 2.64 (dd, *J* = 14.0, 5.9 Hz, 1H), 1.45 (s, 9H), 1.21 (d, *J* = 6.7 Hz, 3H); IR (película delgada) 3333, 2975, 2928, 1691 cm^{-1}; HRMS-ESI (*m/z*) $[M+Na]^+$ calculado para $C_{11}H_{23}NO_3S$, 272.1291 encontrado, 272.1296.

terc-butil (*R*)-(1-((ciclopropilmetil)tio)propan-2-il)carbamato (C164)



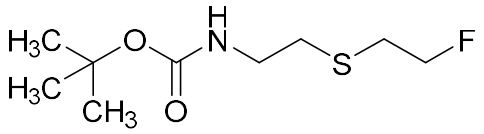
Aislado como un aceite amarillo (0.600 g, 60 %) usando (bromometil)ciclopropano: ^{1}H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 4.65 (s, 1H), 3.85 (s, 1H), 2.73 (dd, *J* = 13.3, 5.1 Hz, 1H), 2.64 (dd, *J* = 13.8, 6.5 Hz, 1H), 2.53 - 2.45 (m, 2H), 1.44 (s, 9H), 1.21 (d, *J* = 6.7 Hz, 3H), 1.04 - 0.93 (m, 1H), 0.56 (dtd, *J* = 8.2, 2.8, 1.6 Hz, 2H), 0.30 - 0.15 (m, 2H); IR (película delgada) 3341, 3079, 2975, 2930, 1688, 1501 cm^{-1}; HRMS-ESI (*m/z*) $[M+Na]^+$ calculado para $C_{12}H_{23}NO_2S$, 268.1342; encontrado, 268.1340.

terc-butil ((2*R*)-1-(((2,2-difluorociclopropil)metil)tio)propan-2-il)carbamato (C165)



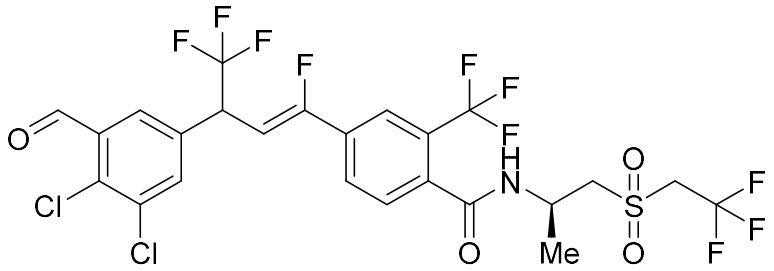
Aislado como un aceite naranja (1.0 g, 82 %) usando 2-(bromometil)-1,1-difluorociclopropano: ^{1}H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 4.59 (s, 1H), 3.85 (s, 1H), 2.79 - 2.49 (m, 4H), 1.84 - 1.73 (m, 1H), 1.55 - 1.47 (m, 1H), 1.44 (s, 9H), 1.21 (d, *J* = 6.7 Hz, 3H), 1.09 (dddd, *J* = 15.3, 13.1, 7.7, 3.8 Hz, 1H); IR (película delgada) 3339, 2976, 2931, 1688, 1502 cm^{-1}; HRMS-ESI (*m/z*) $[M+Na]^+$ calculado para $C_{12}H_{21}F_2NO_2S$, 304.1153; encontrado, 304.1150.

Ejemplo 32: Preparación de *terc*-butil (2-((2-fluoroetil)tio)etil)carbamato (C166)



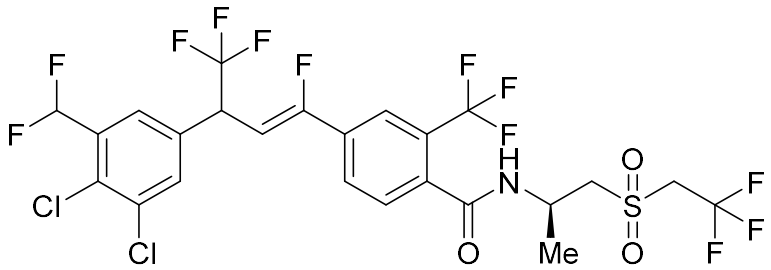
Se añadió hidruro de sodio (60 % dispersión en parafina, 1.0 g, 25 mmol) a *terc*-butil (2-mercaptoetil)carbamato (4.0 g, 22.6 mmol) en *N,N*-dimetilformamida (59.8 mL) a 0 °C. Después de agitar 20 minutos, 1-fluoro-2-yodoetano (2.6 g, 15.0 mmol) se añadió y la mezcla de reacción se dejó agitar durante toda la noche. La mezcla de reacción se diluyó con agua y se extrajo con éter de dietilo (2x). La capa orgánica se lavó con agua y salmuera, se secó con sulfato de magnesio, se filtró y se concentró. El líquido resultante se purificó por cromatografía rápida de sílice. El compuesto del título se aisló como un líquido incoloro (1.5 g, 43 %): ^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 6.98 - 6.86 (m, 1H), 4.53 (dt, *J* = 47.3, 6.3 Hz, 2H), 3.08 (dt, *J* = 7.6, 6.1 Hz, 2H), 2.81 (dt, *J* = 21.7, 6.3 Hz, 2H), 2.57 (dd, *J* = 7.9, 6.4 Hz, 2H), 1.38 (s, 9H); ^{13}C NMR (126 MHz, DMSO-d_6) δ 155.96, 83.26 (d, *J* = 167.6 Hz), 78.17, 40.40, 31.66, 31.27 (d, *J* = 20.7 Hz), 28.69; ^{19}F NMR (471 MHz, DMSO-d_6) δ -211.77 (tt, *J* = 47.3, 21.7 Hz); IR (película delgada) 1689 cm^{-1}; HRMS-ESI (*m/z*) $[M+Na]^+$ calculado para $C_9H_{18}FNO_2S$, 246.0934; encontrado, 246.0937.

Ejemplo 33: Preparación de 4-((*Z*)-3-(3,4-dicloro-5-formilfenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (C167)



Se añadió tetróxido de osmio (2.5 % in *terc*-butanol, 60 mg, 0.006 mmol) a una solución de 4-((*Z*)-3-(3,4-dicloro-5-vinilfenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida **(F73)** (0.08 g, 0.12 mmol) en tetrahidrofuran-agua (2:1, 1.0 mL) a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se agitó por 5 minutos. Se añadió peryodato de sodio (0.076 g, 0.356 mmol) a la mezcla de reacción. La mezcla de reacción se agitó a 20 °C por 12 horas. La mezcla de reacción se apagó con bisulfato de sodio (100 mg) y luego se extrajo con acetato de etilo (10 mL). La capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio, se filtró y se concentró. La purificación por cromatografía en columna rápida usando 40 % acetato de etilo en hexanos proporcionó el compuesto del título como una goma amarilla pálida (0.055 g, 65 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 10.47 (d, *J* = 1.2 Hz, 1H), 7.92 - 7.80 (m, 2H), 7.75 (dd, *J* = 8.8, 1.6 Hz, 2H), 7.61 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 6.39 (dd, *J* = 8.1, 3.0 Hz, 1H), 6.04 - 5.79 (m, 1H), 4.79 - 4.62 (m, 2H), 4.17 - 4.03 (m, 1H), 3.96 (dt, *J* = 15.5, 9.3 Hz, 1H), 3.54 (dd, *J* = 14.5, 6.6 Hz, 1H), 3.40 (dd, *J* = 14.5, 5.0 Hz, 1H), 1.52 (d, *J* = 6.9 Hz, 3H); ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -59.11 (d, *J* = 2.4 Hz), -61.14, -67.67, -107.51; ESIMS *m/z* 674 ([M-H]$^-$).

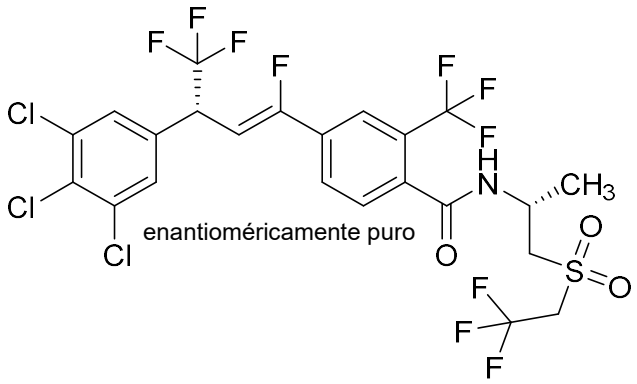
Ejemplo 34: Preparación de 4-((*Z*)-3-(3,4-dicloro-5-(difluorometil)fenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F70)



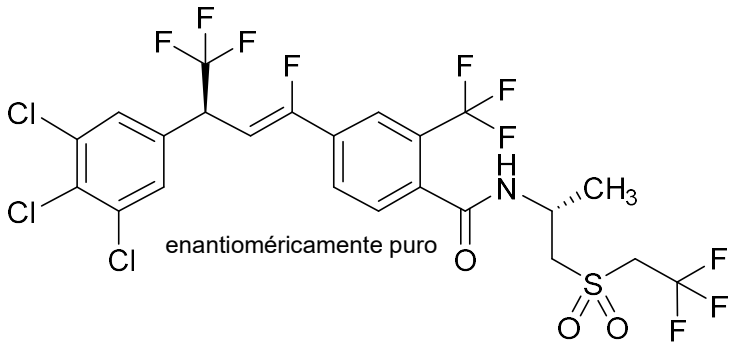
Se añadió bis(2-metoxietil)aminoazufre trifluoruro (114 mg, 0.517 mmol) a una solución de 4-((*Z*)-3-(3,4-dicloro-5-formilfenil)-1,4,4,4-tetrafluorobut-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida **(C167)** (0.07 g, 0.103 mmol) en diclorometano (0.5 mL) a temperatura ambiente. Se añadió una gota de metanol y la mezcla de reacción se agitó a 20 °C por 12 horas. La mezcla de reacción se apagó con agua (5 mL) y luego se extrajo con acetato de etilo (15 mL). La capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio, se filtró y se concentró. La purificación por cromatografía en columna rápida usando 35 % acetato de etilo en hexanos proporcionó el compuesto del título como una cera blanca (0.030 g, 38 %).

Ejemplo 35: Separación de 4-((*R,Z*)-1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F72) y 4-((*S,Z*)-1,4,4,4-tetrafluoro-3-(3,4,5-triclorofenil)but-1-en-1-il)-*N*-((*R*)-1-((2,2,2-trifluoroetil)sulfonil)propan-2-il)-2-(trifluorometil)benzamida (F136)

Las moléculas del título se prepararon como una mezcla como se describió en el Ejemplo 15. Los pares diastereoméricos se separaron mediante cromatografía de fluido supercrítico (SCF) mediante el uso de Chiralpak AD-H (250 X 21 mm), columna de 5µ mediante el uso de metanol como la fase móvil (isocrático 70:30, CO_2 y metanol respectivamente) con un régimen de flujo de 60 g/min a temperatura ambiente. El diastereómero **F72** se recolectó en un tiempo de retención de 1.78 minutos y poseía una rotación óptica de $[\alpha]_D^{25}$ = + 41,8 (*c,* 0,29 % en MeOH). El diastereómero **F136** se recolectó en 2.60 minutos y poseía una rotación óptica de $[\alpha]_D^{25}$ = -73,3 (*c,* 0,28 % en MeOH).

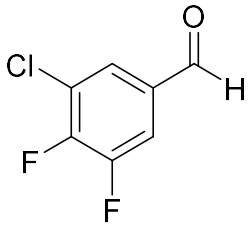


F72 se aisló como un sólido blancuzco.



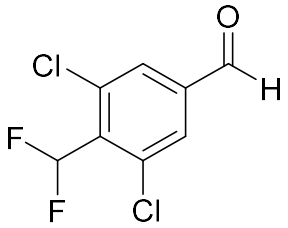
F136 se aisló como un sólido blancuzco.

Ejemplo 36: Preparación de 3-cloro-4,5-difluorobenzaldehído (C168)



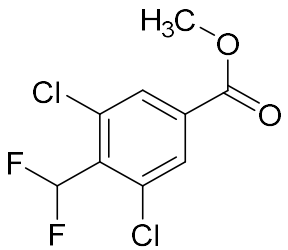
A una solución agitada de metil (3-cloro-4,5-difluorofenil)metanol (4.00 g, 22.4 mmol) en cloruro de metileno (150 mL) se añadió dióxido de manganeso (15.0 g, 179 mmol). Después de agitar por 12 horas a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se filtró a través de Celite®. El filtrado se concentró bajo presión reducida para proporcionar el compuesto del título como un aceite incoloro (3.5 g, 86 %): ^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 9.89 (s, 1H), 7.77 - 7.74 (m, 1H), 7.66 - 7.61 (m, 1H); IR (película delgada) 3302, 1709, 750 cm^{-1}; EIMS *m/z* 176 ($[M]^+$).

Ejemplo 37: Preparación de 3,5-dicloro-4-(difluorometil)benzaldehído (C169)



A una solución agitada de metil 3,5-dicloro-4-(difluorometil)benzoato **(C170)** (5.00 g, 19.6 mmol) en cloruro de metileno (20 mL) enfriado en un baño de -78 °C se añadió en forma de gotas hidruro de diisobutilaluminio (1 M in THF; 39.2 mL, 39.2 mmol). Después de 2 horas, la mezcla de reacción se trató con agua fría y se extrajo con cloruro de metileno. La capa orgánica se lavó con salmuera, se secó sobre sulfato de sodio y se concentró bajo presión reducida para proporcionar el compuesto crudo**.** La purificación por cromatografía en columna (SiO_2, 100-200 mesh, que eluye con 5 % acetato de etilo en éter de petróleo) proporcionó el compuesto del título como un sólido marrón pálido (3.0 g, 66 %): ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 10.00 (s, 1H), 8.05 (s, 2H), 7.52 (t, *J* = 52.0 Hz, 1H); IR (película delgada) 1709, 1362, 1057 cm^{-1}; EIMS *m/z* 224 ([M]$^+$).

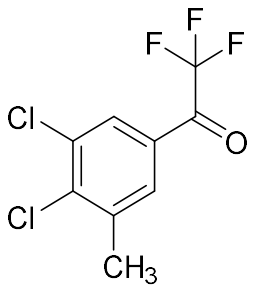
Ejemplo 38: Preparación de metil 3,5-dicloro-4-(difluorometil)benzoato (C170)



Se añadió bis(2-metoxietil)aminoazufre trifluoruro (1.93 g, 8.80 mmol) a una solución metil 3,5-dicloro-4-formilbenzoato (1.00 g, 4.29 mmol) en diclorometano (10 mL) a temperatura ambiente. Se añadió una gota de metanol y la mezcla de reacción se agitó a 20 °C por 12 horas. La mezcla de reacción se apagó con agua (100 mL) y luego se extrajo con acetato de etilo (300 mL). La capa orgánica 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 sólido

amarillo pálido (0.70 g, 63 %): ^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 8.02 (s, 2H), 7.50 (t, J = 52.2 Hz, 1H), 3.99 (s, 3H); EIMS m/z 254 ([M]$^+$).

Ejemplo 39: Preparación de 1-(3,4-dicloro-5-metilfenil)-2,2,2-trifluoroetan-1-ona (C173)



A 5-bromo-1,2-dicloro-3-metilbenceno (6.9 g, 29 mmol) en tetrahidrofurano (65 mL) frío en un baño de hielo bajo nitrógeno se añadió complejo de cloruro de isopropilmagnesio-cloruro de litio en tetrahidrofurano (26.8 mL, 34.8 mmol). Después de 1 hora se añadió metil 2,2,2-trifluoroacetato (3.79 mL, 37.7 mmol). Después de 30 minutos, el baño de hielo se retiró, y la solución se agitó por 1 hora. La mezcla de reacción se apagó con ácido hidroclórico acuoso (2 N). La mezcla se concentró y se extrajo con diclorometano. La capa orgánica se lavó con salmuera, se secó sobre sulfato de sodio, se filtró y se concentró. La purificación por cromatografía en columna (SiO_2, éter de petróleo) proporcionó el compuesto del título como un sólido blanco (5.9 g, 80 %): ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.00 (s, 1H), δ 7.83(s, 1H), 2.51 (s, 3H); EIMS m/z 256 ([M]$^+$).

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 and Optimization of New ingrediente activos**, *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*, LAPHEG) ("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. 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.

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 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 ml) de la bandeja de dieta que se había llenado anteriormente con aproximadamente 1 ml de dieta artificial a la que se había aplicado 50 $\mu g/cm^2$ de la molécula de prueba (disuelta en 50 µl de una 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).

Bioensayos en CL

Los bioensayos en 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 anteriormente con aproximadamente 1 ml de dieta artificial a la que se había aplicado 50 $\mu g/cm^2$ de la molécula de prueba (disuelta en 50 µL de

una 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 útil 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 por ciento 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.

% 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 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 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 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 acomplejado. 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.

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 importancia son las moléculas que tienen ^{2}H (conocido además como deuterio) o ^{3}H (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

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 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 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

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 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, nematicida, 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 de 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 de peso puede ser de aproximadamente 50:1 a aproximadamente 1:50; en otro ejemplo, la relación de peso puede ser de aproximadamente 20:1 a aproximadamente 1:20; en otro ejemplo, la relación de peso puede ser de aproximadamente 10:1 a aproximadamente 1:10; en otro ejemplo, la relación de peso puede ser de aproximadamente 5:1 a 1:5; en otro ejemplo, la relación de peso puede ser de aproximadamente 3:1 a aproximadamente 1:3; en otro ejemplo, la relación de peso puede ser de aproximadamente 2:1 a aproximadamente 1:2; y en un ejemplo final la relación de 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.

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.

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.

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

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 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 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 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 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 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 trituración fina del plaguicida y su mezcla vigorosa hasta obtener un portador compuesto por agua y tensoactivos. 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 triturar 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.

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 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 triturarla y secarla para obtener el tamaño de partícula granular deseado.

Los polvos que contienen un plaguicida se preparan por mezclado estrecho del plaguicida en 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 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 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 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 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 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 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; dioctil 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 dodecilbencenosulfónico. 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 C_9 y C_{10}. 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; metil celulosa; carboximetil celulosa sódica (SCMC); e hidroxietil 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–benzisotiazolin–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 dimetil 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 reduce 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

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 azucarero, girasoles, tabaco, tomate, trigo y otros cultivos valiosos o sus semillas van a plantarse.

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 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 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 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.

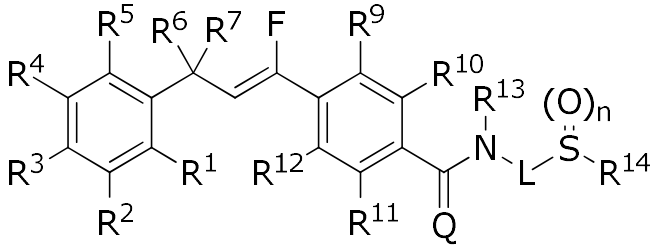
Las moléculas de la Fórmula Uno también pueden usarse para controlar gusanos parásitos, especialmente del intestino, en los animales mencionados anteriormente.

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.

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.

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:

(A) **R[1]**, **R[5]**, **R[6]**, **R[11]**, **R[12]**, y **R[13]** se seleccionan cada uno independientemente del grupo que consiste en 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[1]**, **R[5]**, **R[6]**, **R[11]**, **R[12]**, y **R[13]** son H;

(B) **R[2]**, **R[3]**, y **R[4]** se seleccionan cada uno independientemente del grupo que consiste en H, 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[2]**, es Cl, Br, o CH_3, **R[3]** es F, Cl, Br o $CH{=}CH_2$, y **R[4]** es Cl, Br, o CH_3,

con mayor preferencia, **R[2]**, **R[3]**, y **R[4]** es Cl ;

(C) **R[7]** es (C_1-C_6)haloalquil

preferentemente **R[7]** es CF_3 o CF_2CH_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 Cl, Br, CH_3, o CF_3;

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

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

(G) **Q** se selecciona del grupo que consiste en **O** o S

preferentemente **Q** es O;

(H) **L** es $(C_1\text{-}C_6)$alquilo

preferentemente **L** es CH_2CH_2 o $CH(CH_3)CH_2$;

(I) **n** es 0, 1, o 2;

(J) $\mathbf{R^{14}}$ se selecciona del grupo que consiste en $(C_1\text{-}C_4)$alquilo, $(C_2\text{-}C_4)$alquenilo, $(C_3\text{-}C_4)$cicloalquilo, $(C_1\text{-}C_4)$haloalquilo, $(C_1\text{-}C_4)$alcoxi, $(C_1\text{-}C_4)$haloalcoxi, y fenilo,

en donde cada alquilo, alquenilo, cicloalquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, y fenil puede sustituirse opcionalmente con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, CN, y OH

preferentemente $\mathbf{R^{14}}$ es CH_2CH_3 o CH_2CF_3; 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.

2. Una molécula de acuerdo con 1 en donde

(A) $\mathbf{R^1}$, $\mathbf{R^5}$, $\mathbf{R^6}$, $\mathbf{R^{11}}$, $\mathbf{R^{12}}$, y $\mathbf{R^{13}}$ son H;

(B) $\mathbf{R^2}$, $\mathbf{R^3}$, y $\mathbf{R^4}$ se seleccionan cada uno independientemente del grupo que consiste en H, F, Cl, Br, $(C_1\text{-}C_4)$alquilo, y $(C_2\text{-}C_4)$alquenilo;

(C) $\mathbf{R^7}$ es $(C_1\text{-}C_6)$haloalquilo;

(D) $\mathbf{R^9}$ es H;

(E) $\mathbf{R^{10}}$ se selecciona del grupo que consiste en Cl, Br, $(C_1\text{-}C_4)$alquilo, y $(C_1\text{-}C_4)$haloalquilo;

(G) **Q** es O;

(H) **L** es (C_1-C_6)alquilo;

(I) **n** es 0, 1, o 2;

(J) $\mathbf{R^{14}}$ se selecciona del grupo que consiste en (C_1-C_4)alquilo y (C_1-C_4)haloalquilo,

en donde cada alquilo o haloalquilo puede sustituirse opcionalmente con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en F, Cl, Br, I, CN y OH.

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

4. Una molécula de acuerdo con 1 en donde dicha molécula se selecciona del grupo que consiste en una de las moléculas en 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-dicoloropropeno, clorpirifos, clorpirifos-metilo, hexaflumuron, metoxifenozida, noviflumuron, spinetoram, spinosad, sulfoxaflor, y fluoruro de sulfurilo.

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, nematicidas, 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 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.

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 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 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 respecto a 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 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 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, 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.

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.

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.

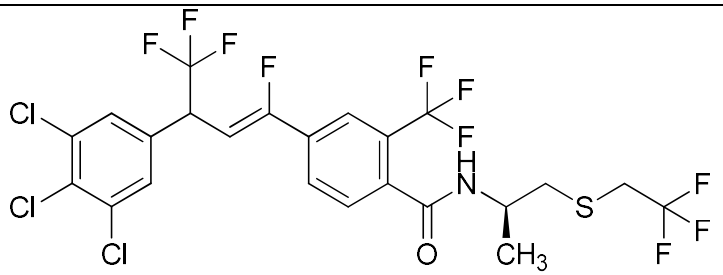
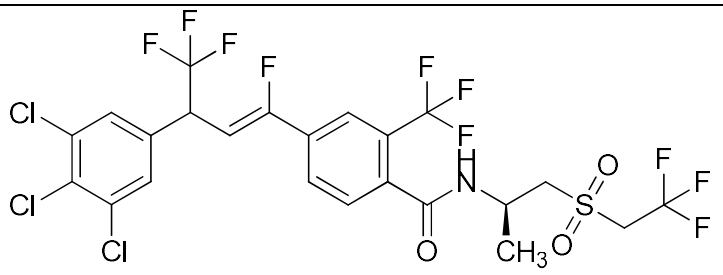
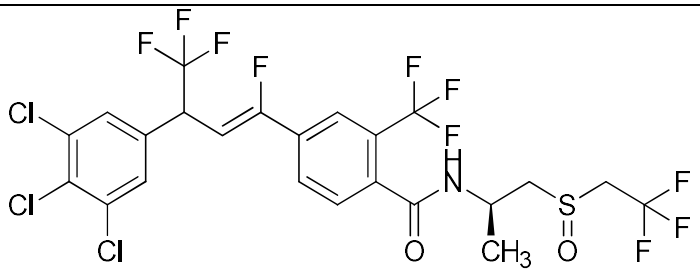
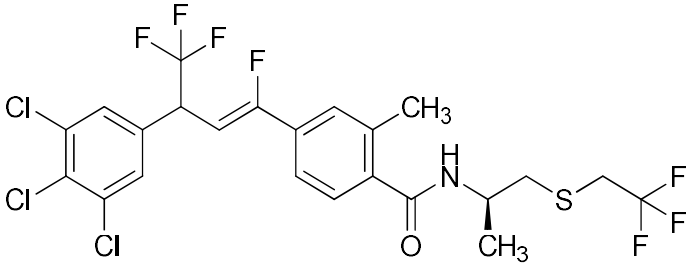
53. Un proceso que comprende aplicar una molécula de acuerdo con 1, 2, 3, o 4, a un locus que incluye un animal no humano para controlar endoparásitos, ectoparásitos y/o ambos.

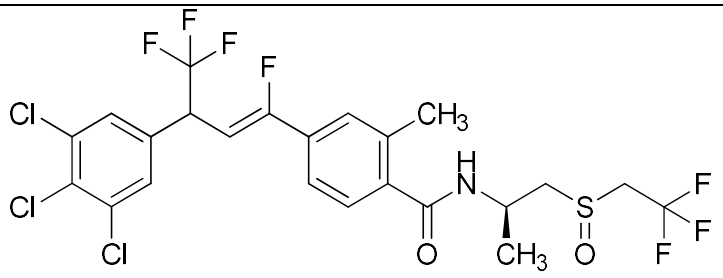
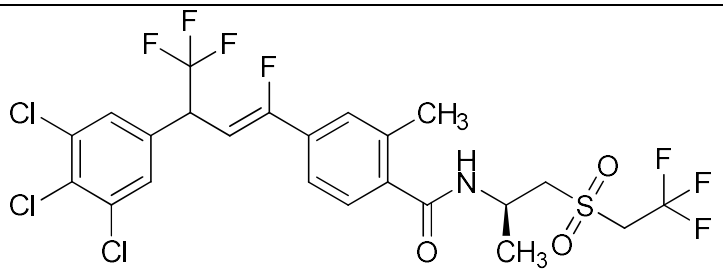
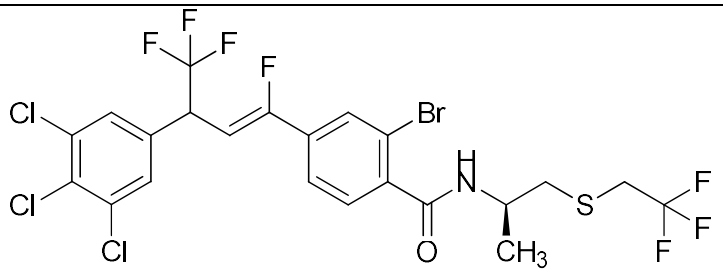
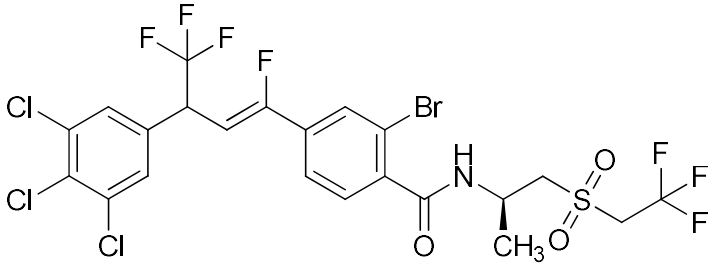
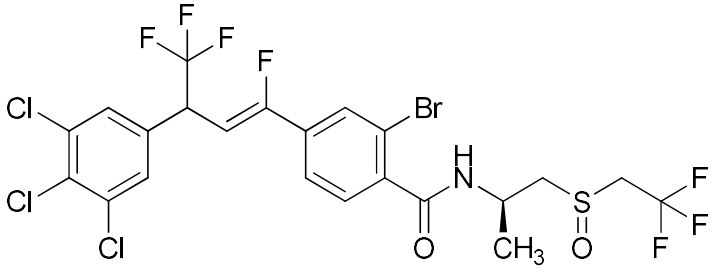
54. Un proceso para producir una composición plaguicida, dicho proceso comprende mezclar una molécula de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1, 2, 3, o 4, con uno o más ingrediente activos.

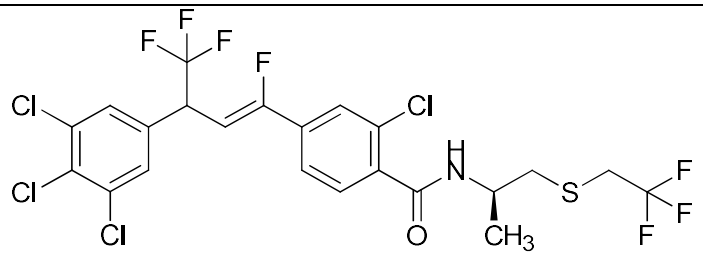
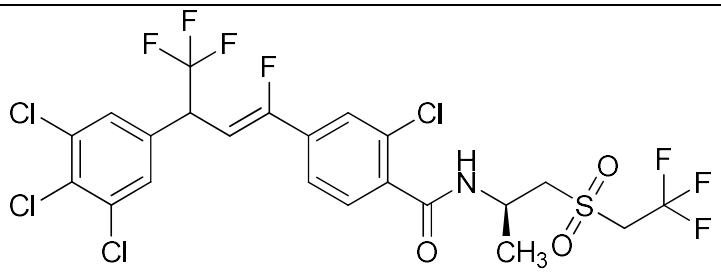
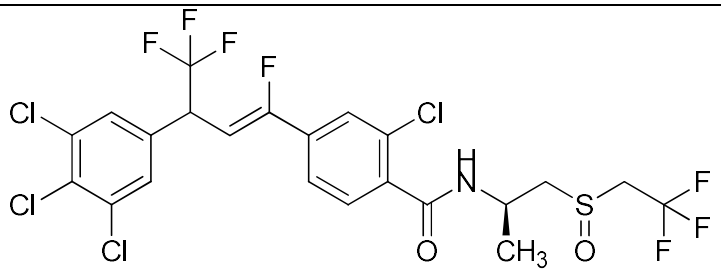
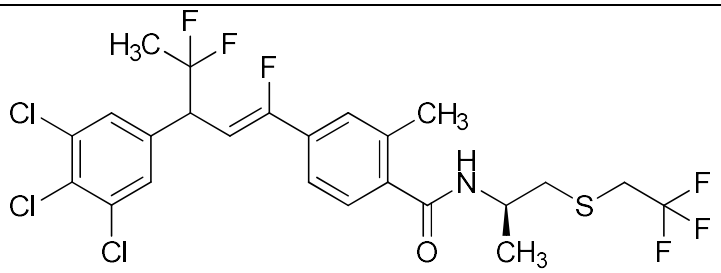
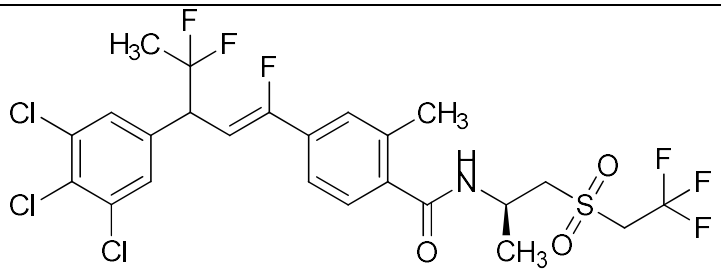
Los encabezados de este documento son sólo por conveniencia y no deben usarse para interpretar ninguna parte del mismo.

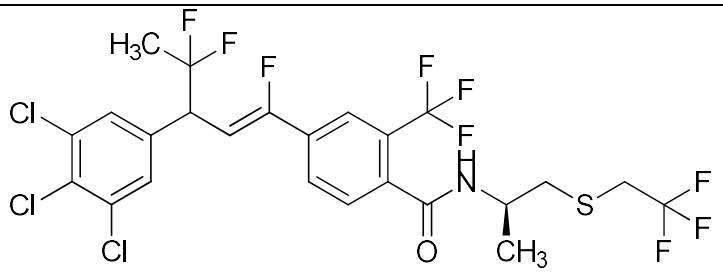
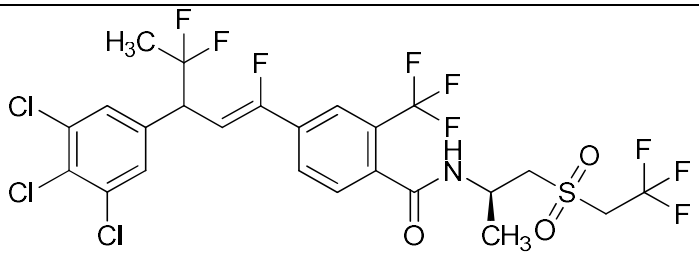
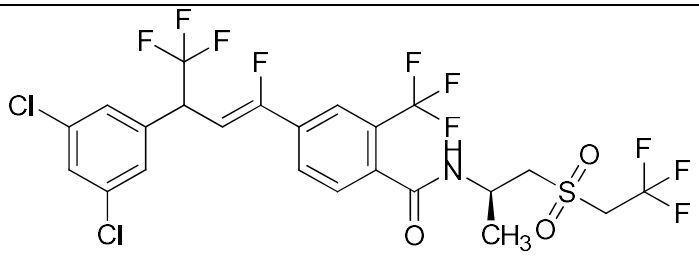
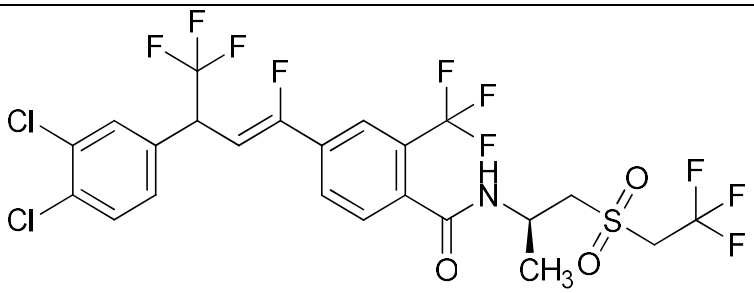
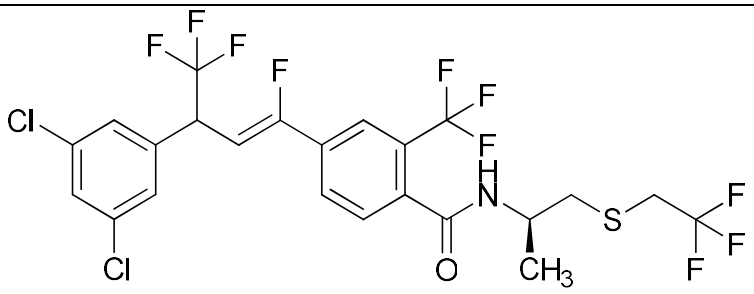
SECCIÓN DE TABLAS

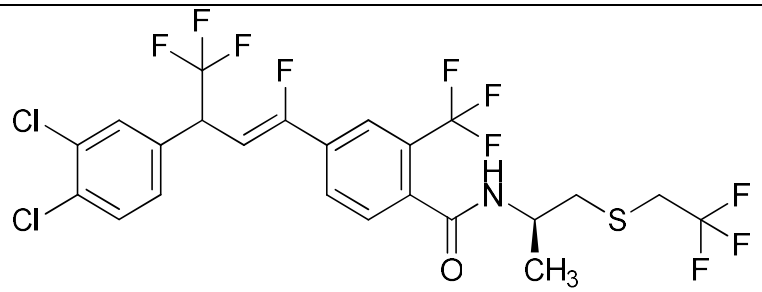
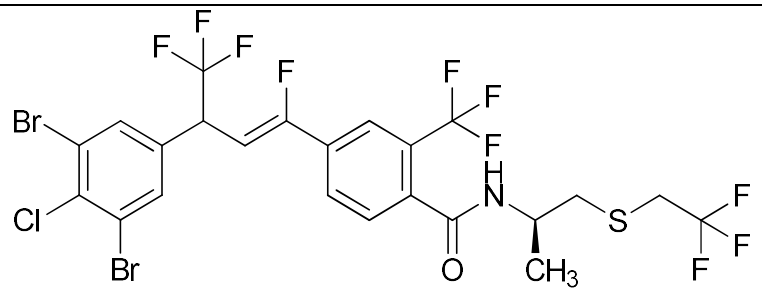
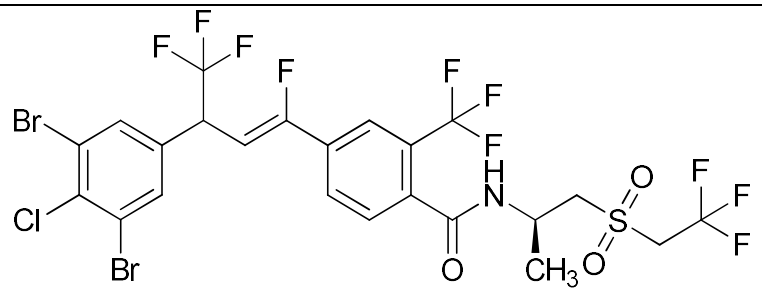
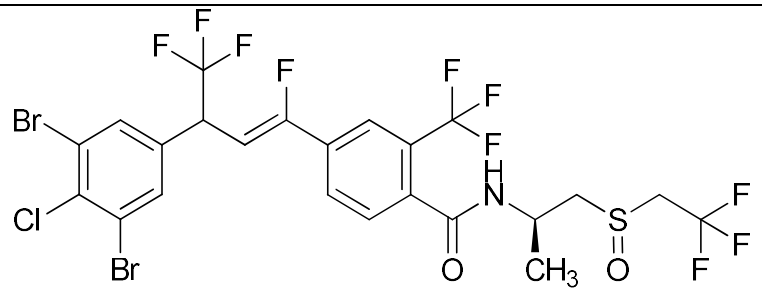
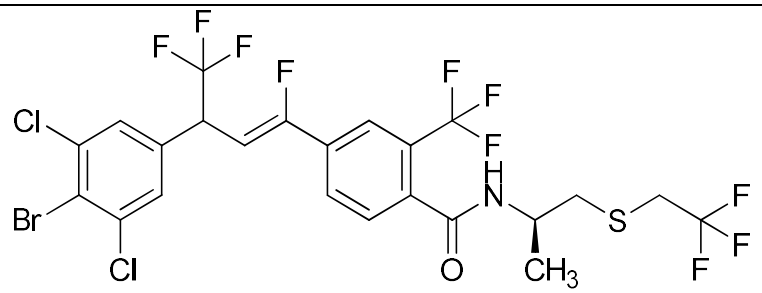
Tabla 2. Estructura y método de preparación para moléculas Serie F

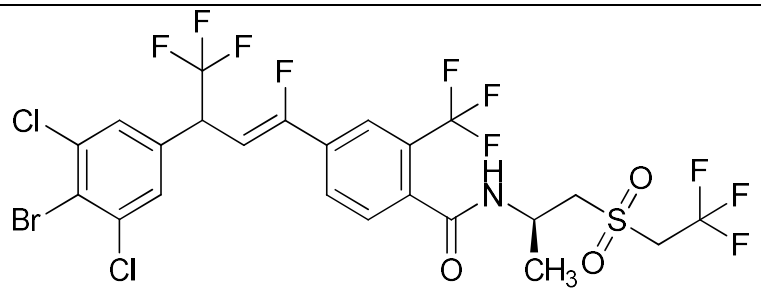
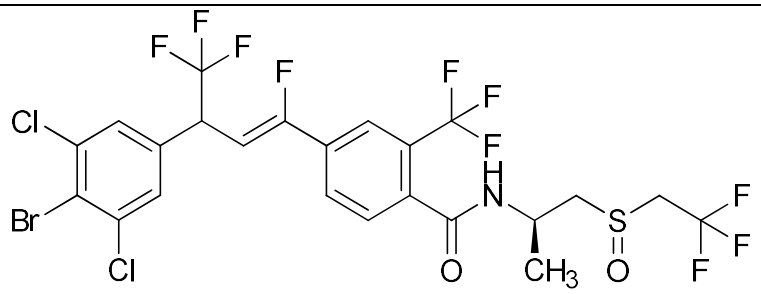
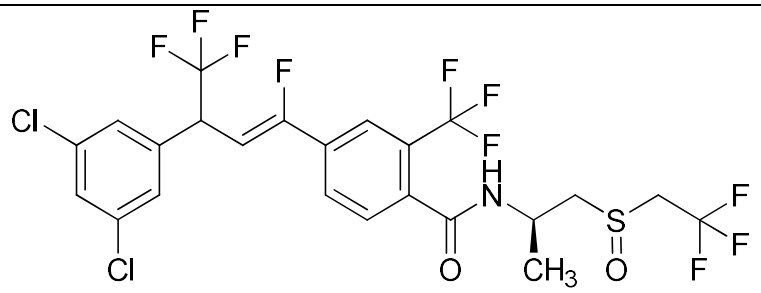
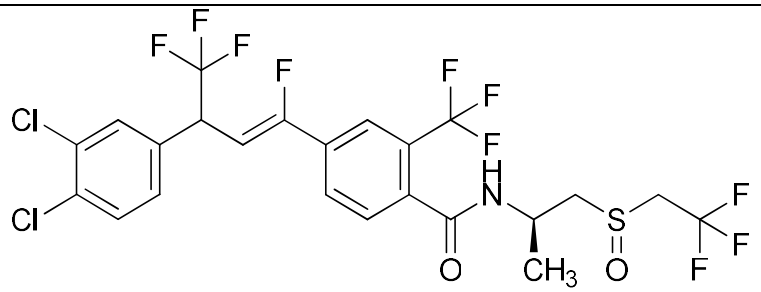
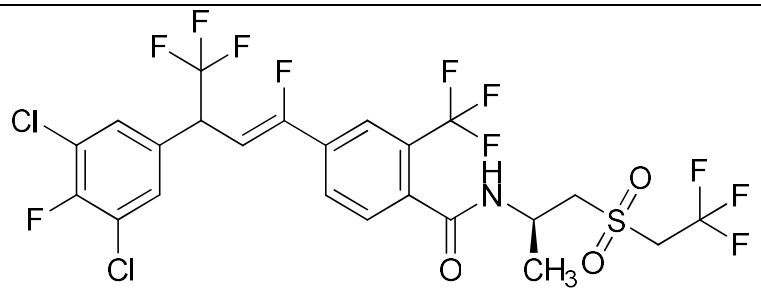
No.	Estructura	Prep.*
F1		**13**
F2		**15**
F3		**16**
F4		**13**

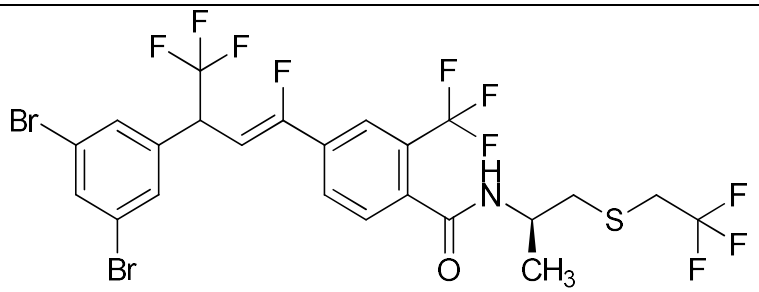
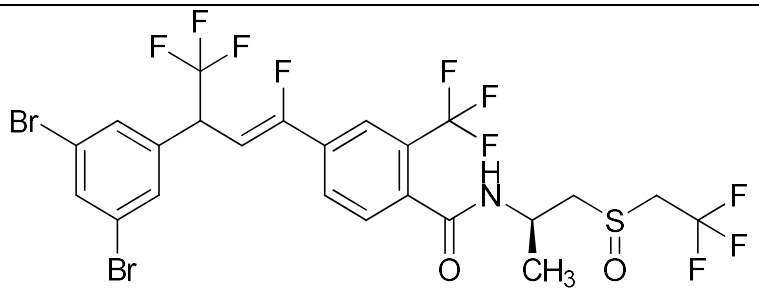
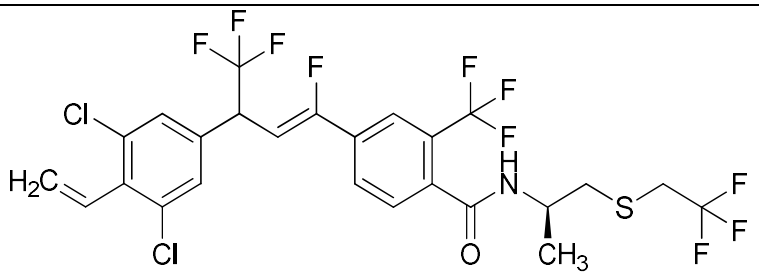
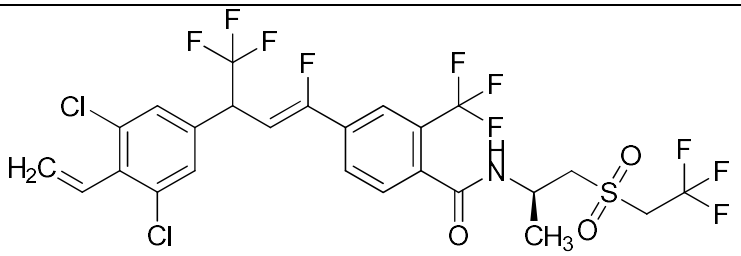
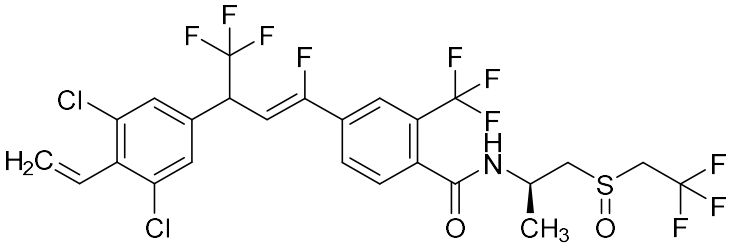
F5		**16**
F6		**15**
F7		**13**
F8		**15**
F9		**16**

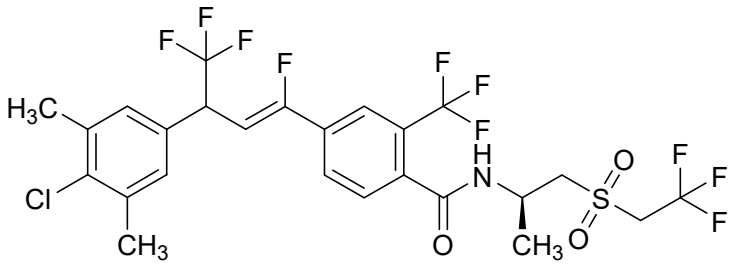
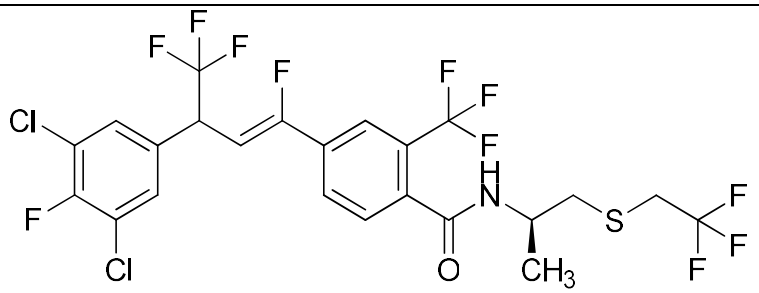
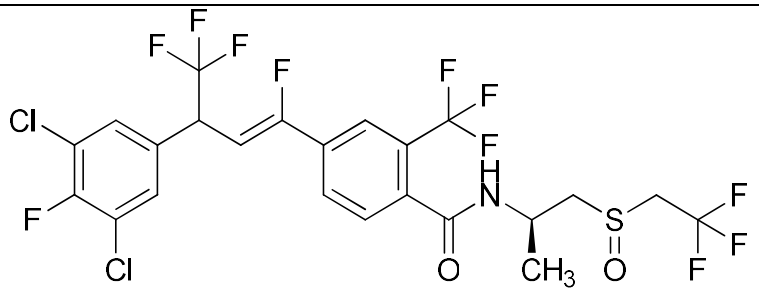
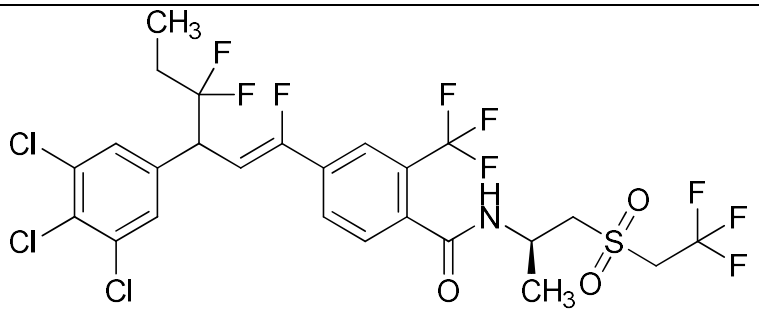
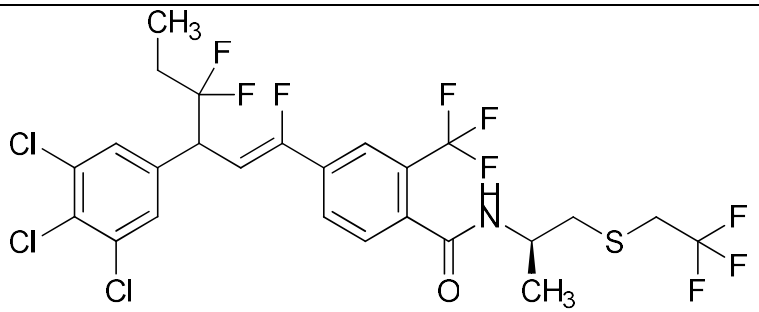
F10		**13**
F11		**15**
F12		**16**
F13		**13**
F14		**13**

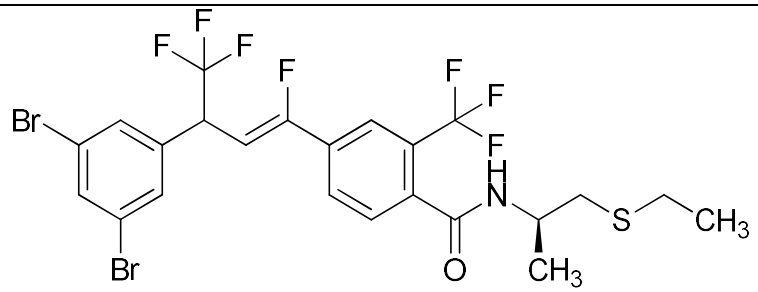
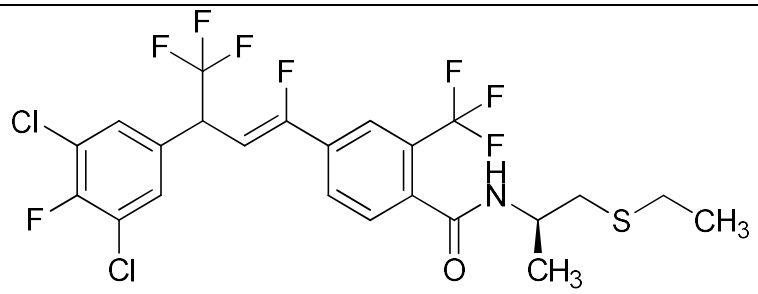
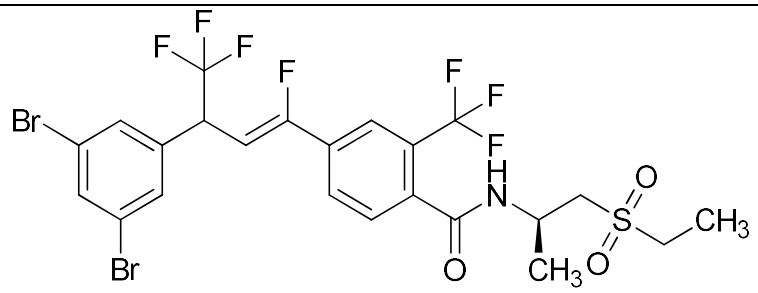
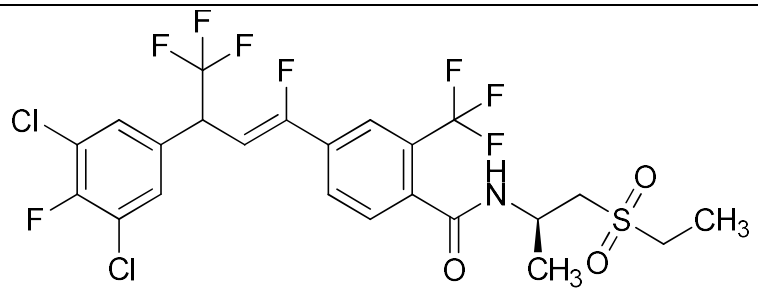
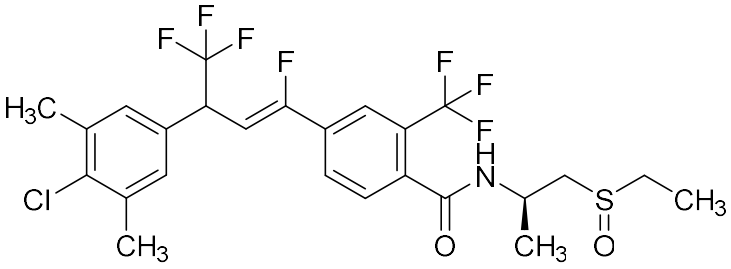
F15		**13**
F16		**13**
F17		**14**
F18		**14**
F19		**14**

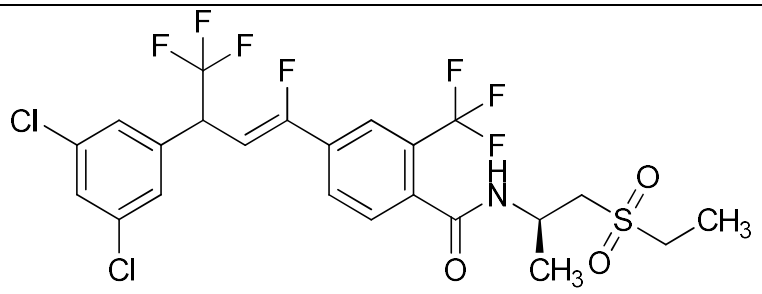
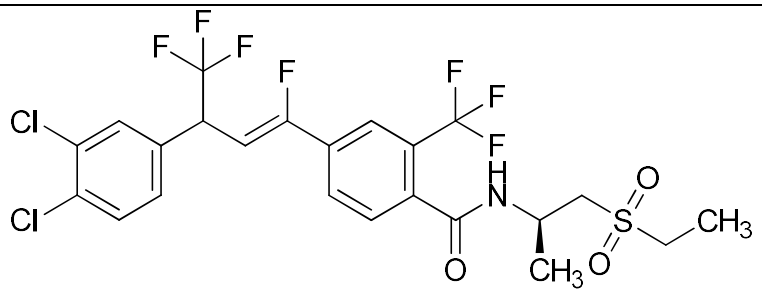
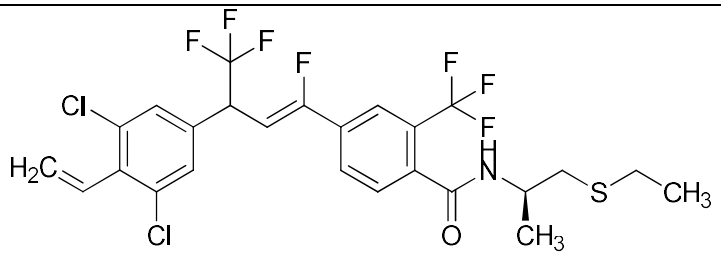
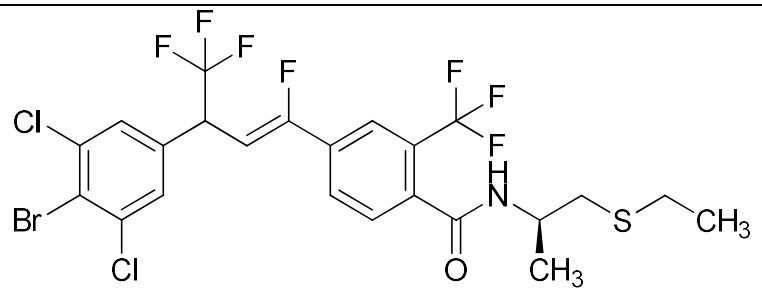
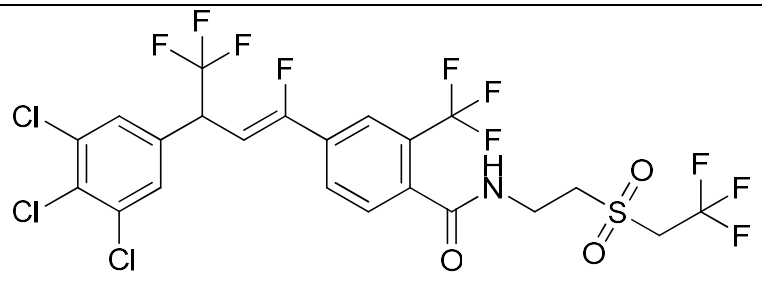
F20		**14**
F21		**14**
F22		**15**
F23		**16**
F24		**14**

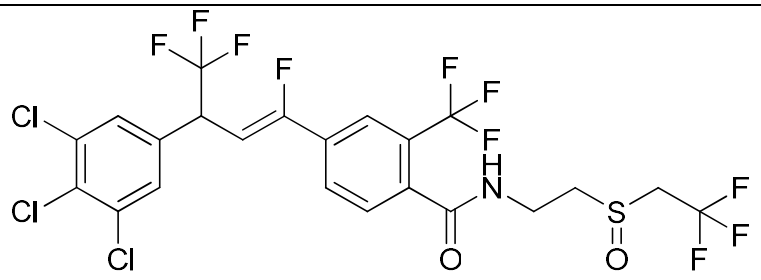
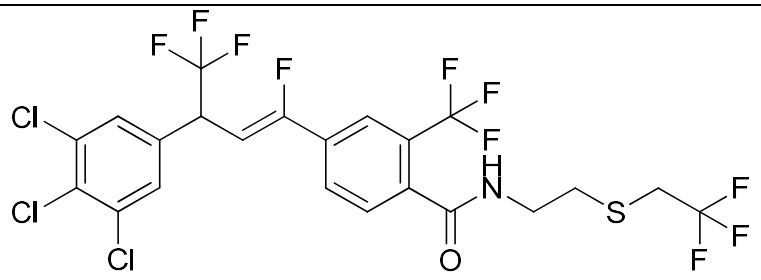
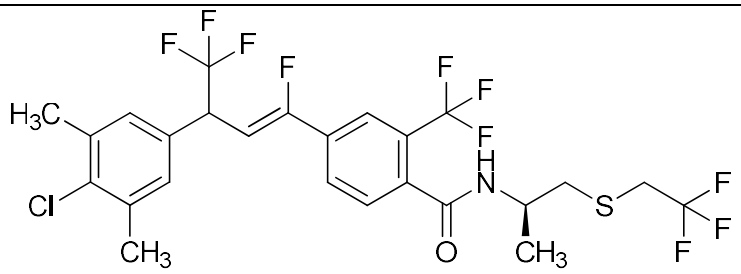
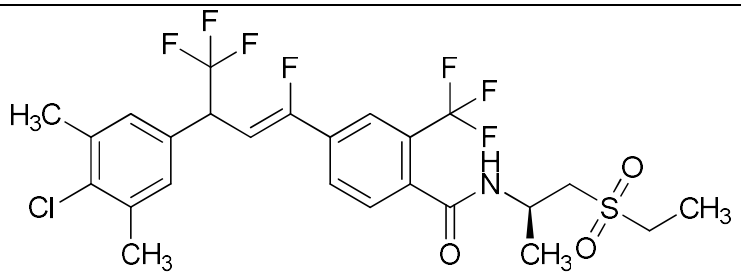
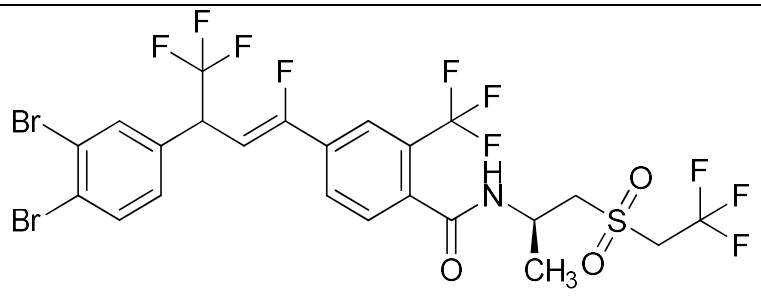
F25		**15**
F26		**16**
F27		**16**
F28		**16**
F29		**14**

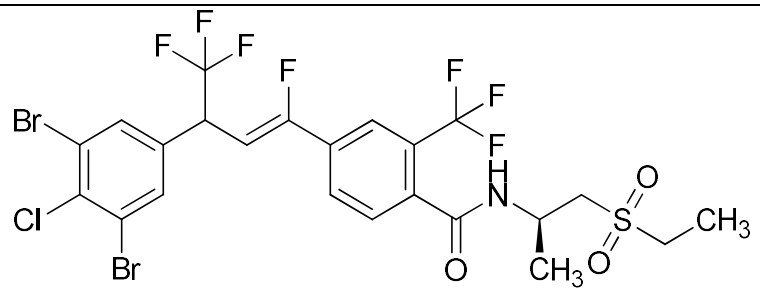
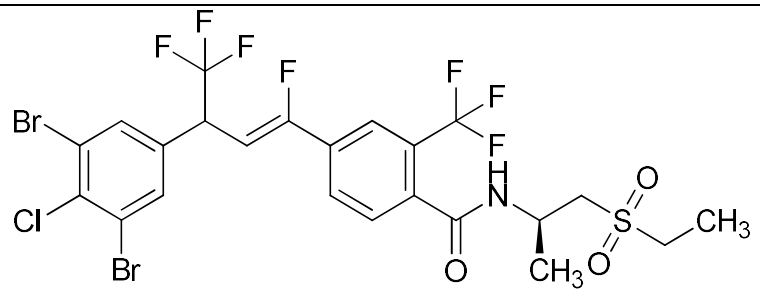
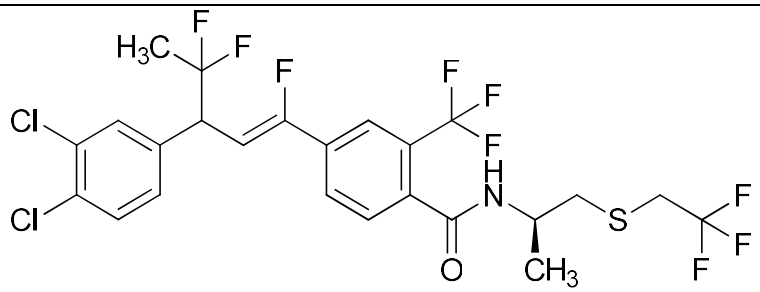
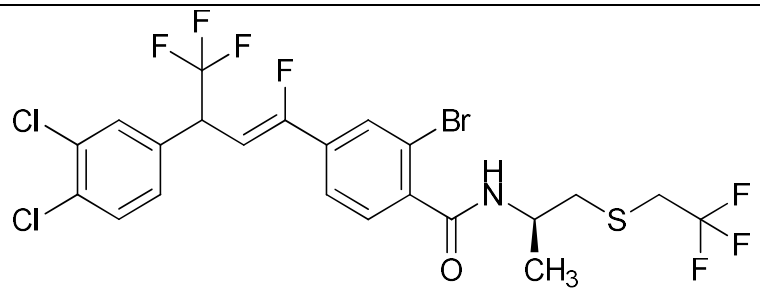
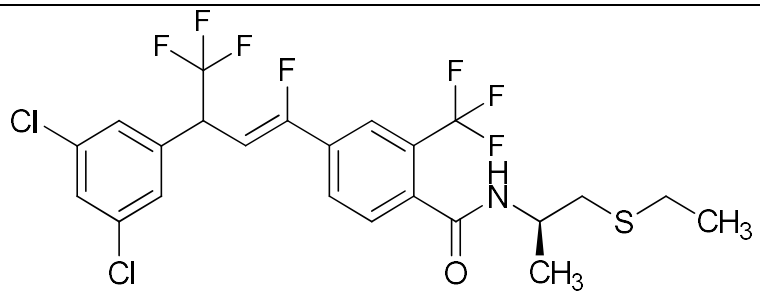
F30		**14**
F31		**16**
F32		**14**
F33		**14**
F34		**16**

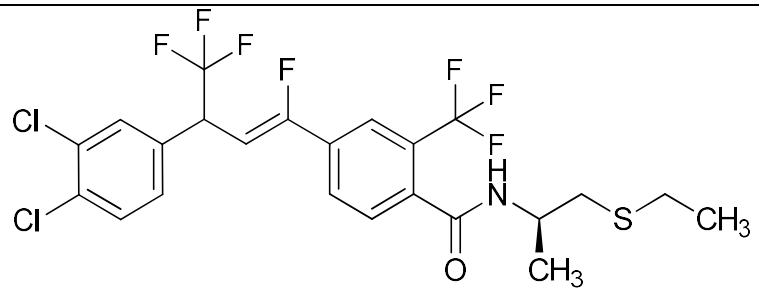
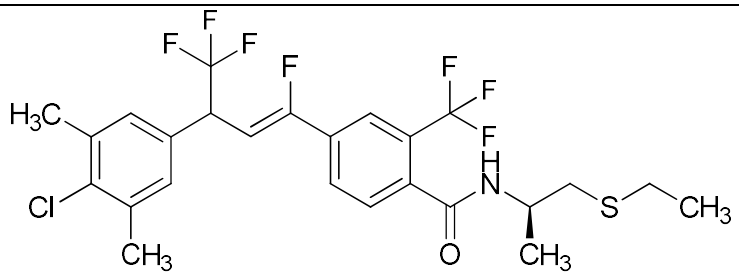
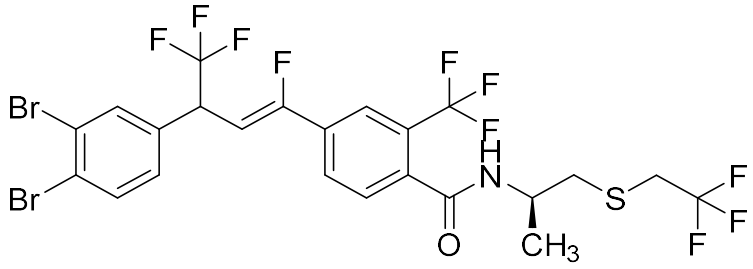
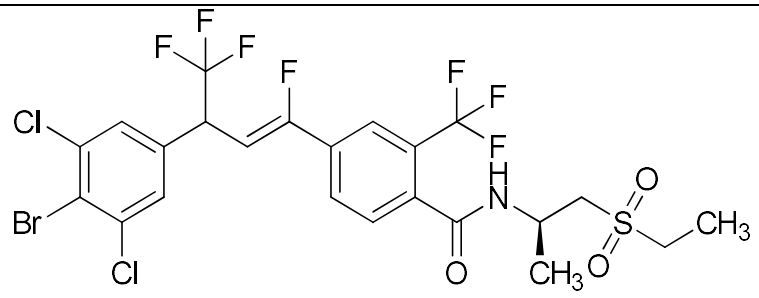
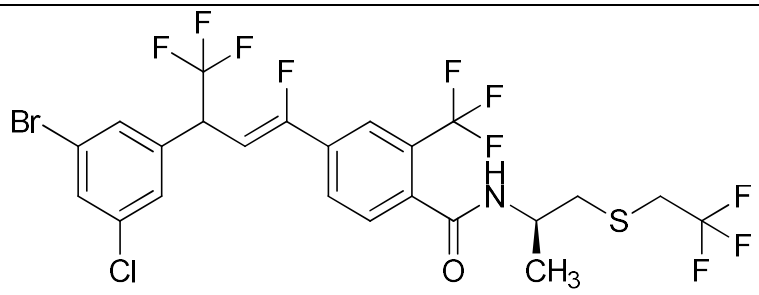
F35		**14**
F36		**14**
F37		**16**
F38		**13**
F39		**13**

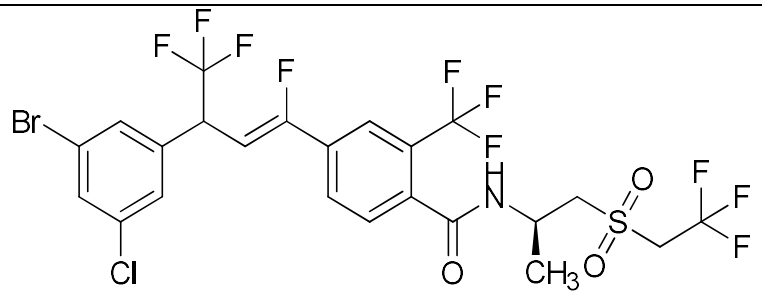
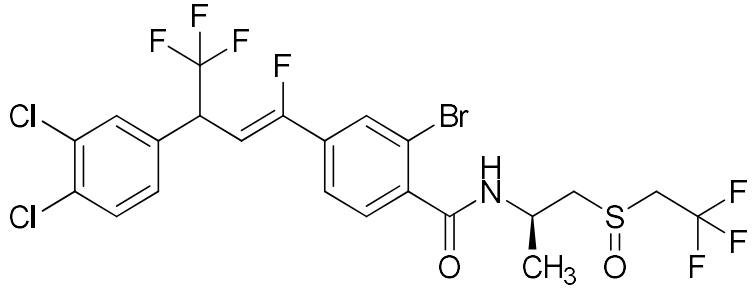
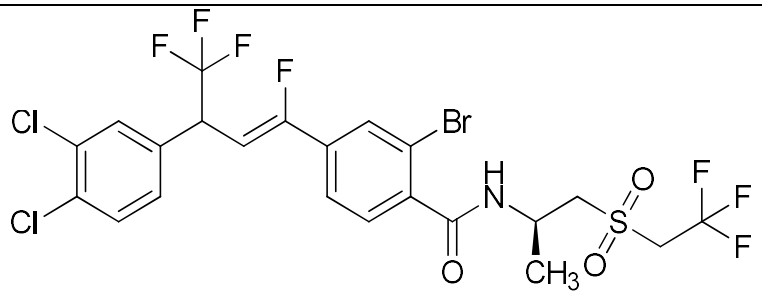
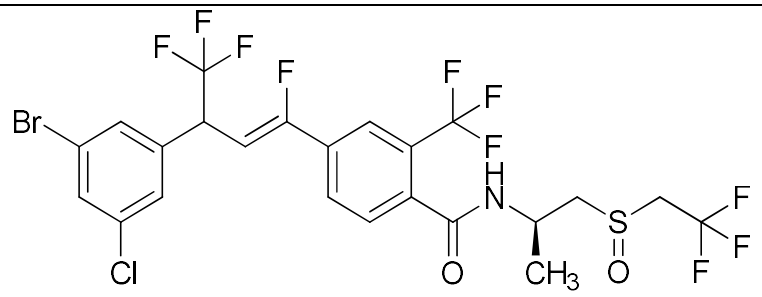
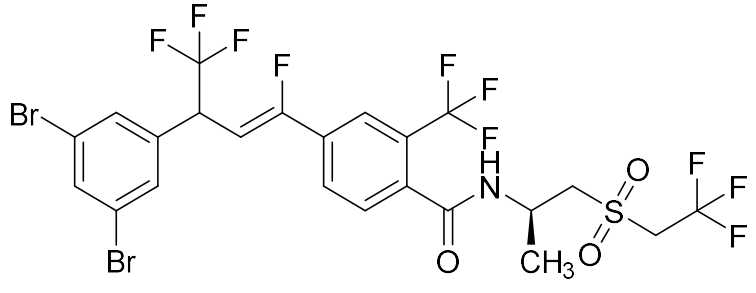
F40		**14**
F41		**14**
F42		**15**
F43		**14**
F44		**16**

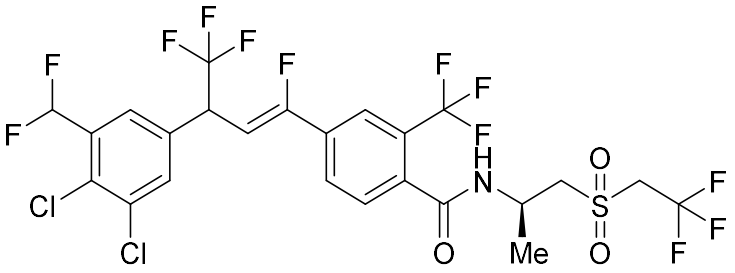
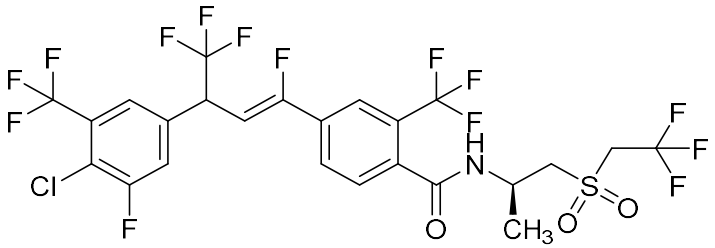
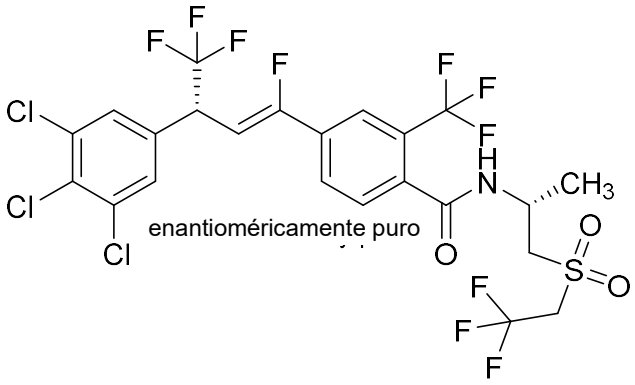
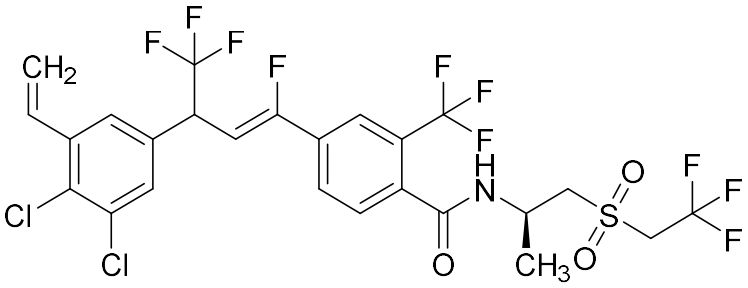
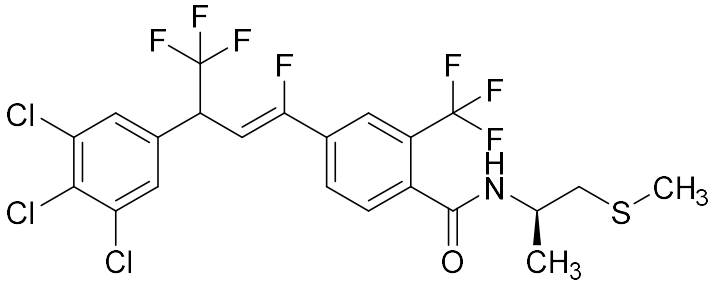
F45		**15**
F46		**15**
F47		**14**
F48		**14**
F49		**18**

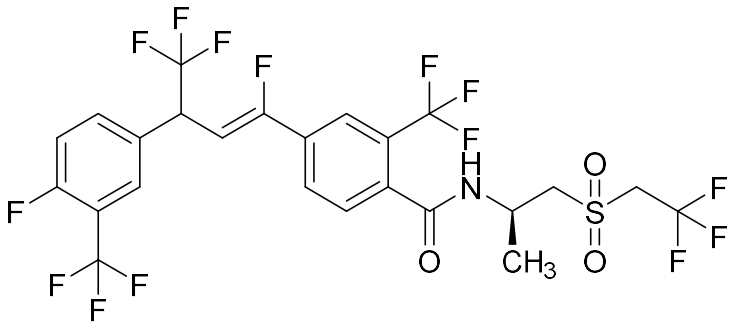
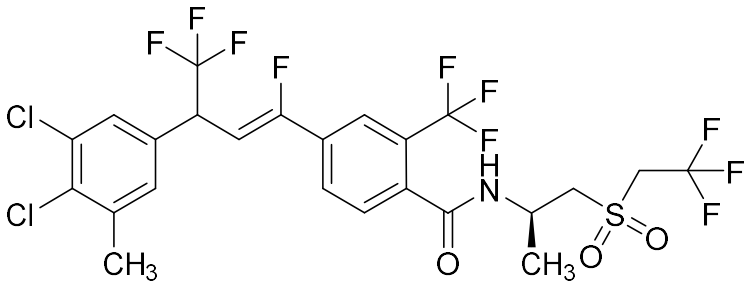
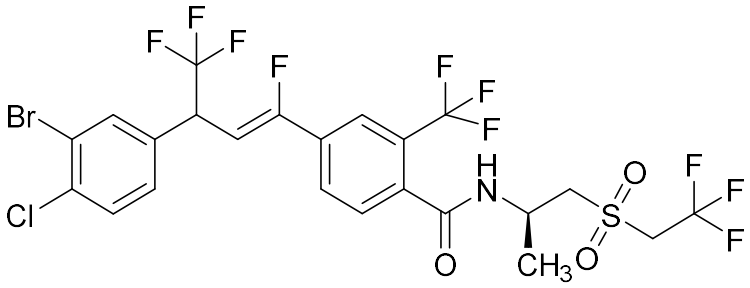
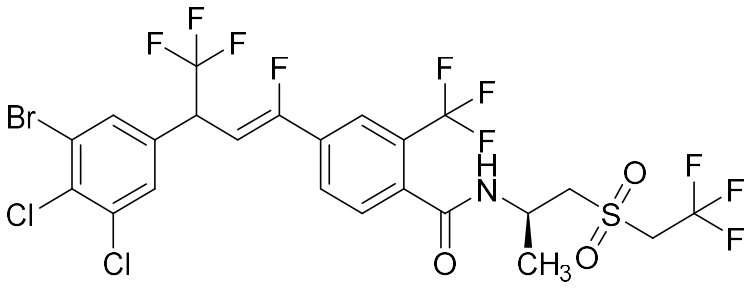
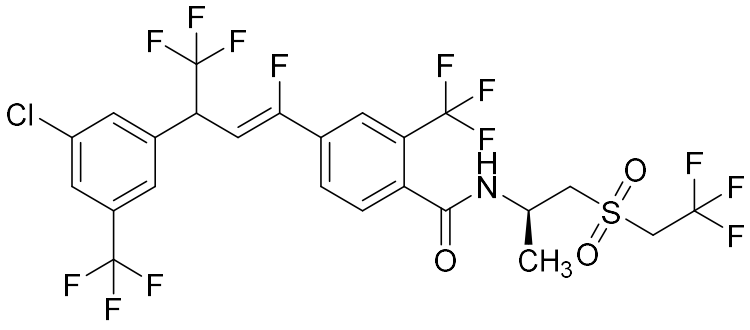
F50		**18**
F51		**17**
F52		**14**
F53		**14**
F54		**14**

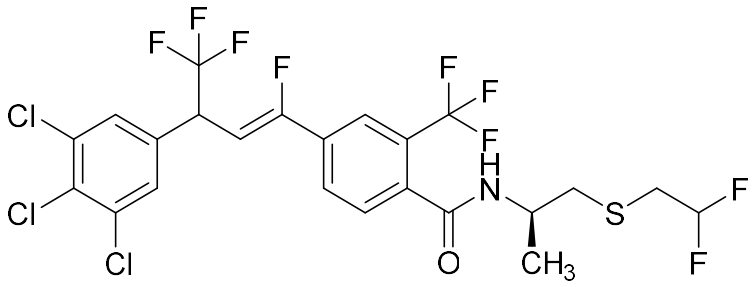
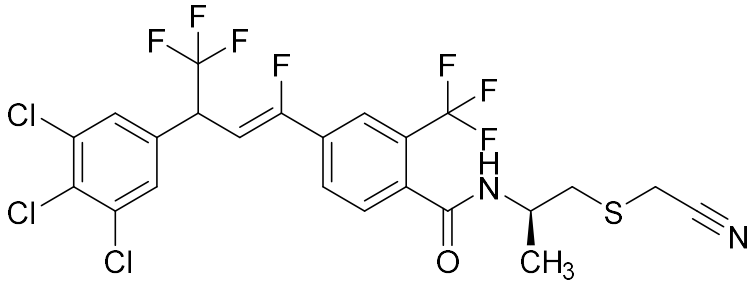
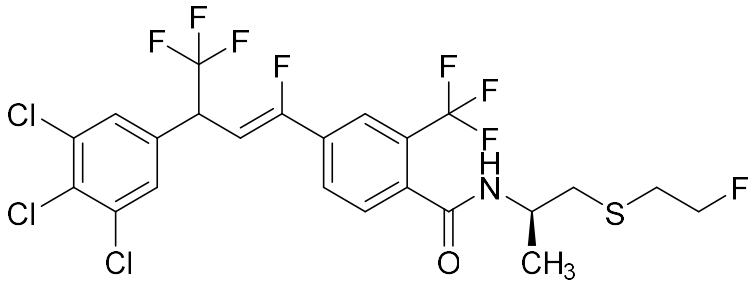
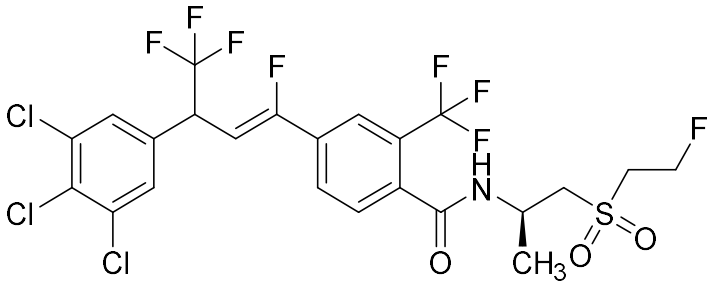
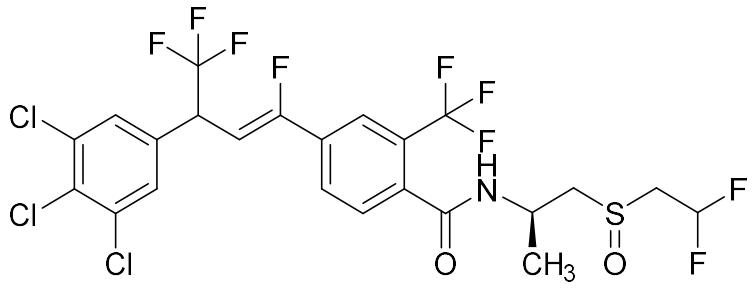
F55		**14**
F56		**15**
F57		**13**
F58		**13**
F59		**14**

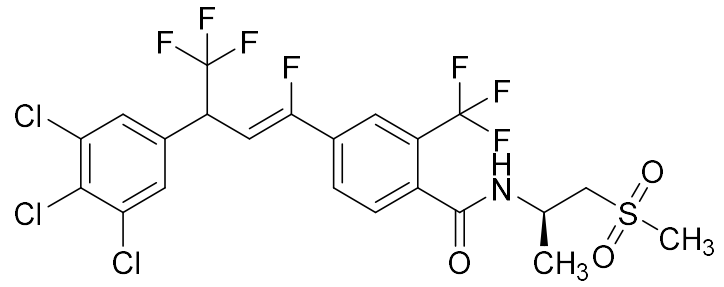
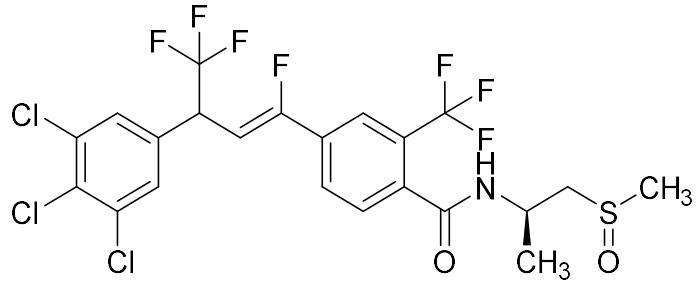
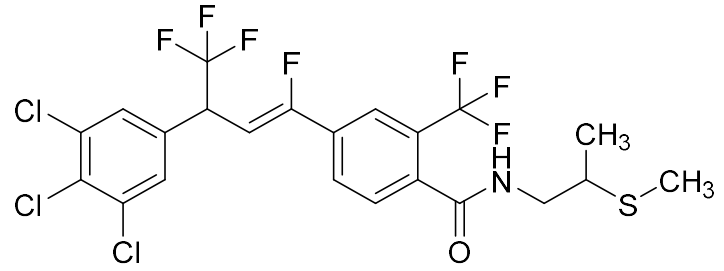
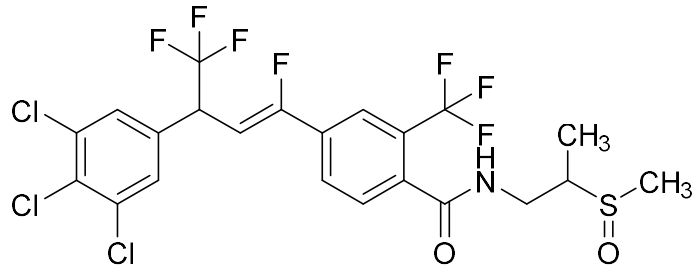
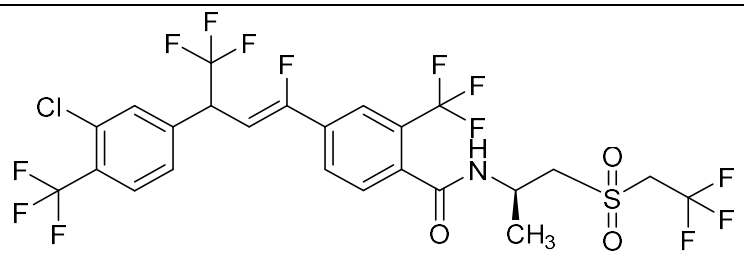
F60		**14**
F61		**14**
F62		**14**
F63		**15**
F64		**14**

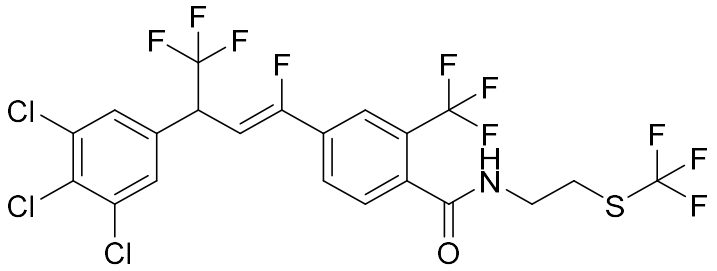
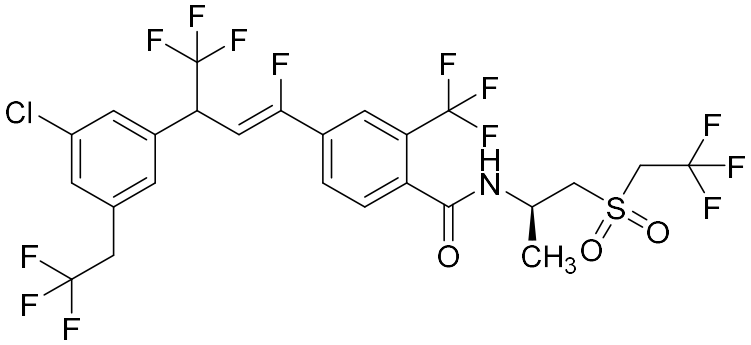
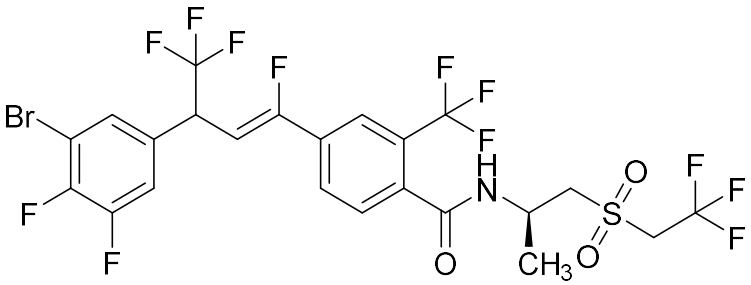
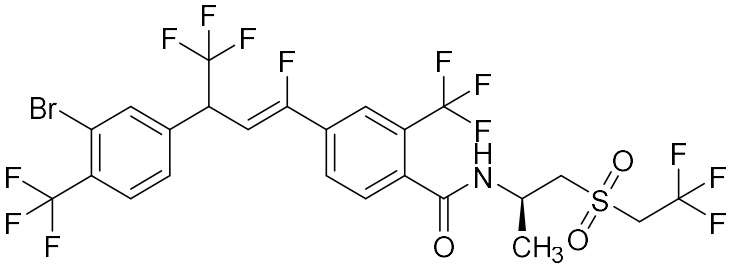
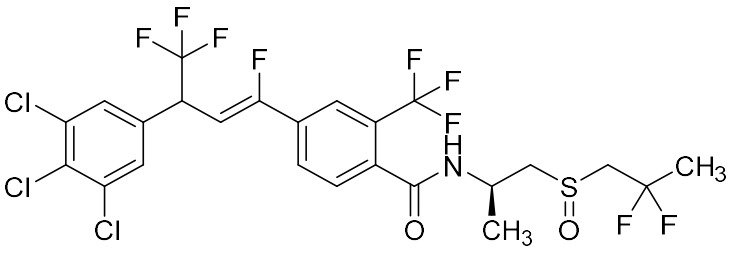
F65		**15**
F66		**16**
F67		**15**
F68		**16**
F69		**14**

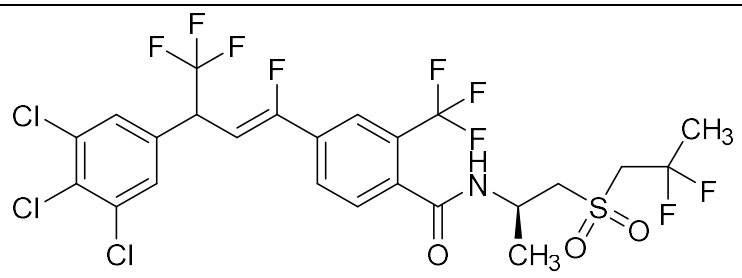
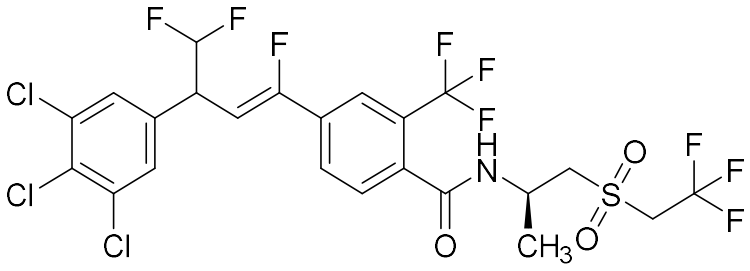
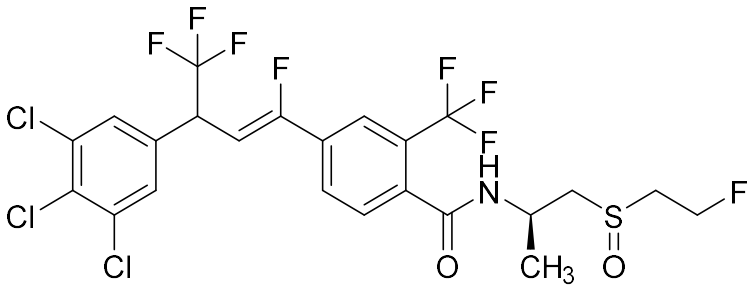
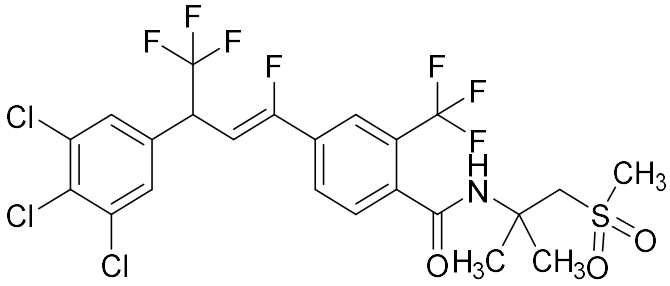
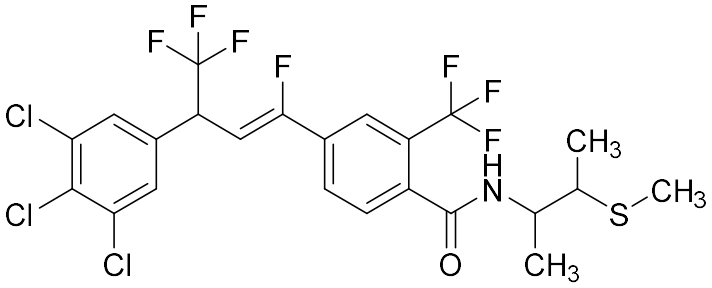
F70		**34**
F71		**13**
F72		**35**
F73		**13**
F75		**17**

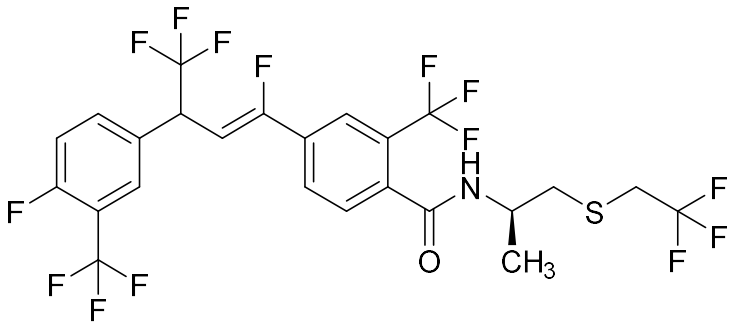
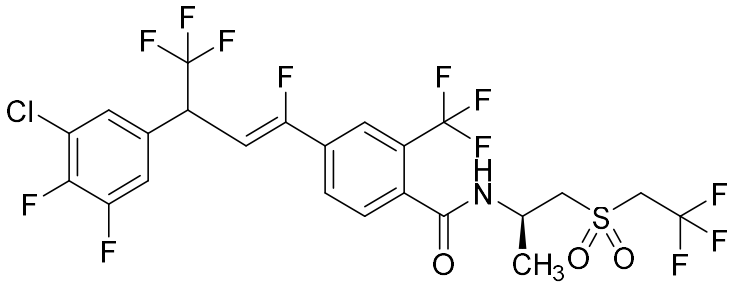
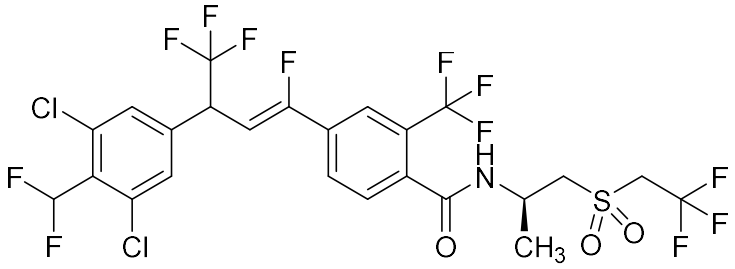
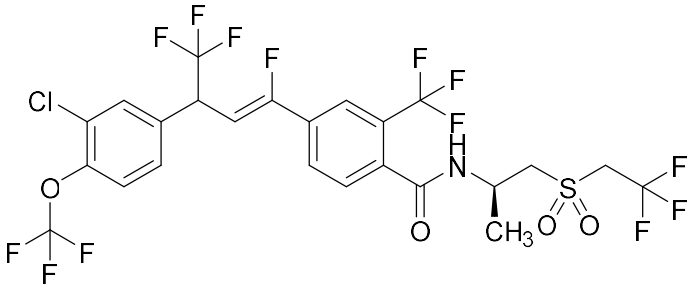
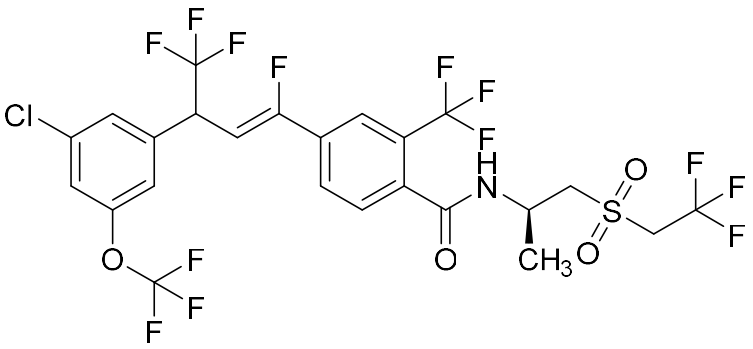
F77		**14**
F78		**14**
F79		**14**
F80		**13**
F81		**14**

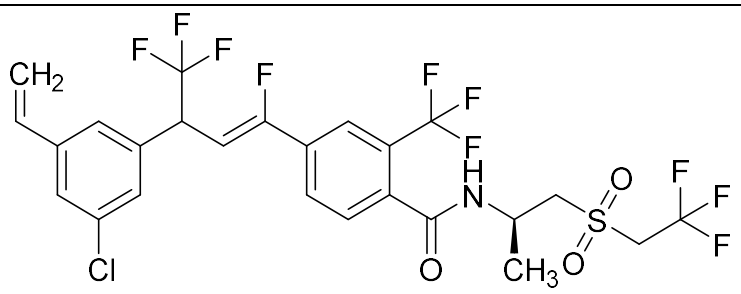
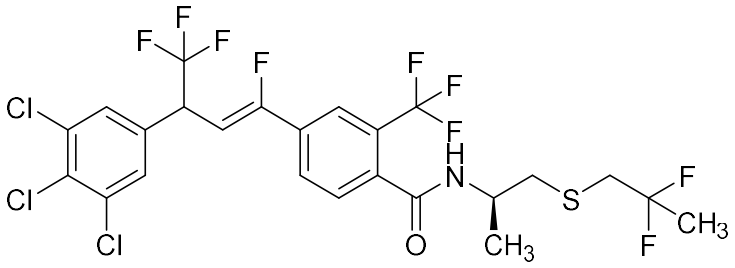
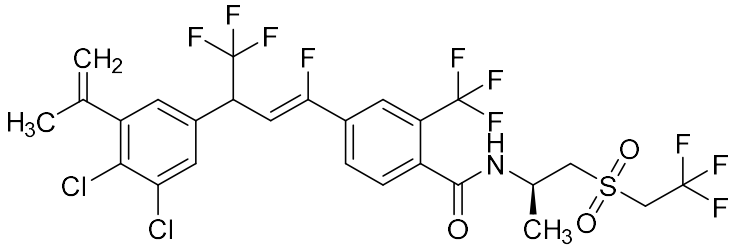
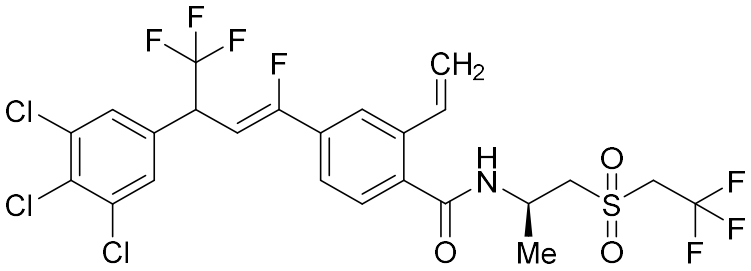
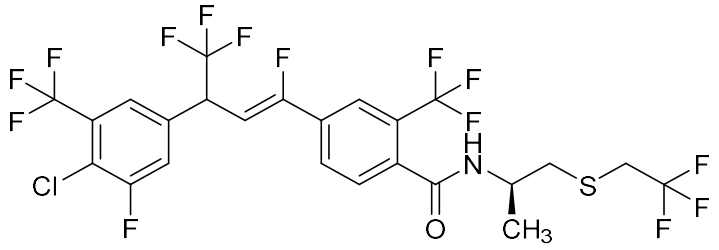
F82		**17**
F83		**17**
F84		**29**
F85		**18**
F86		**18**

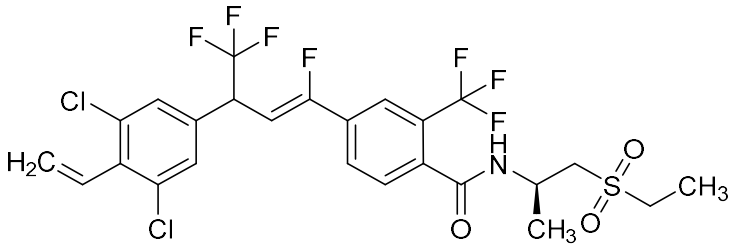
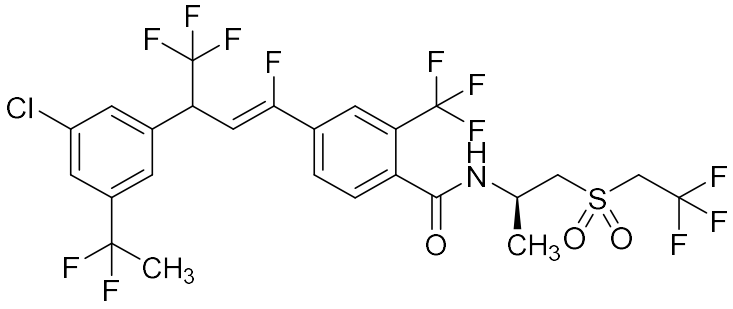
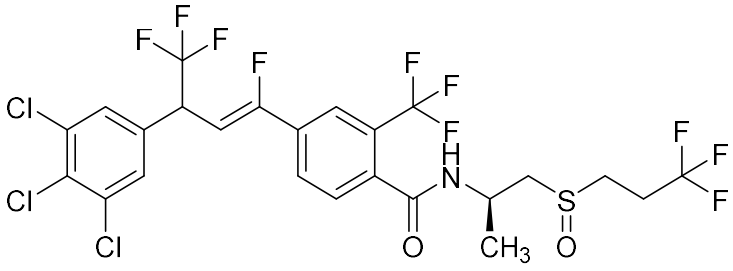
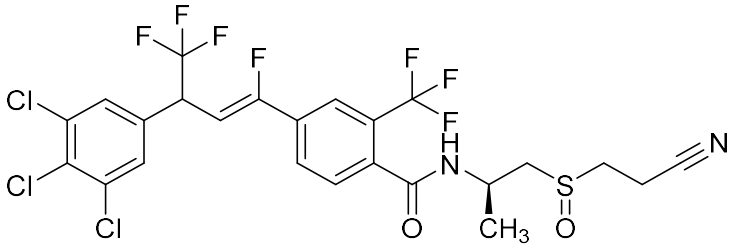
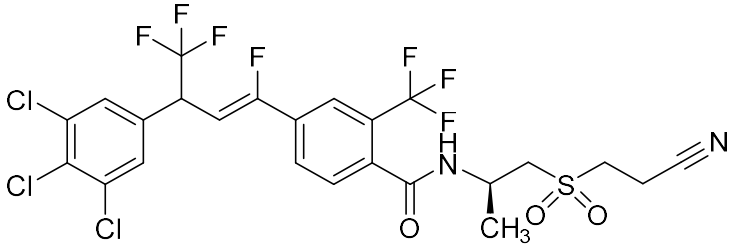
F87		**18**
F88		**18**
F89		**29**
F90		**18**
F91		**13**

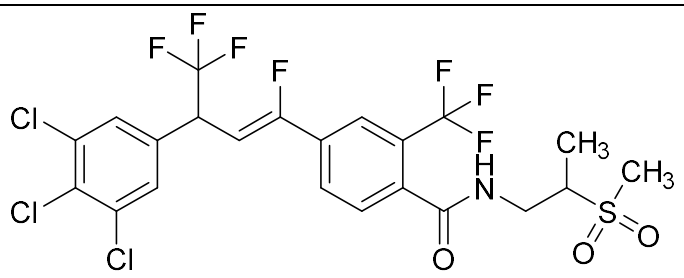
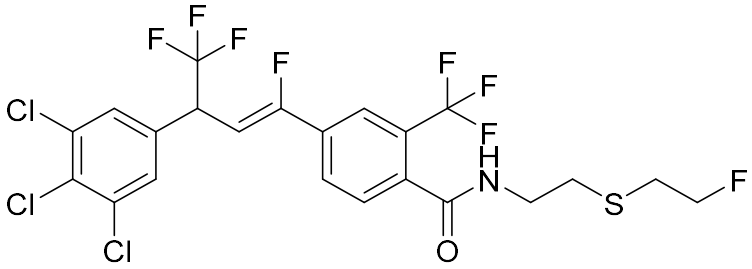
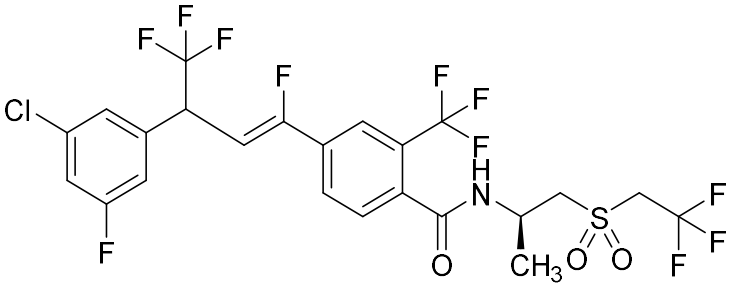
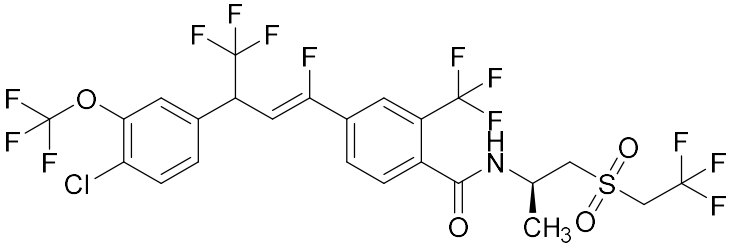
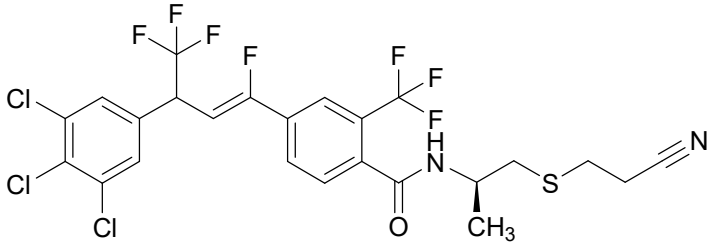
F92		**29**
F93		**13**
F94		**13**
F95		**13**
F96		**18**

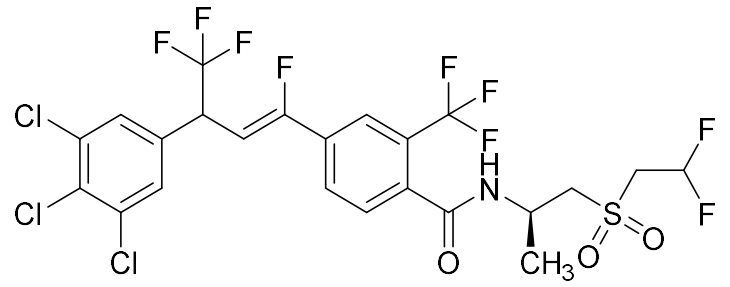
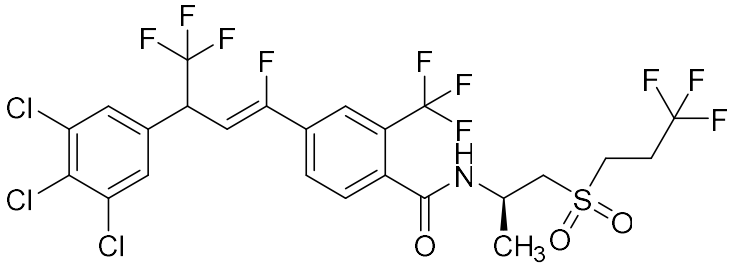
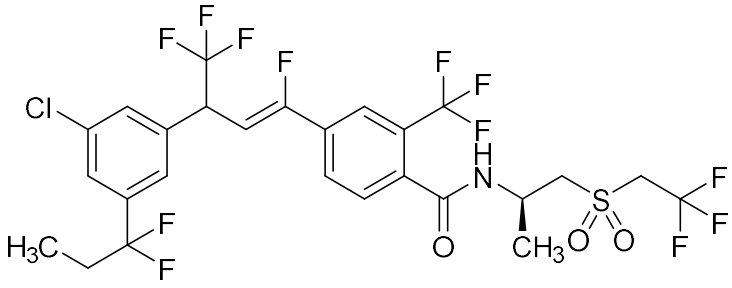
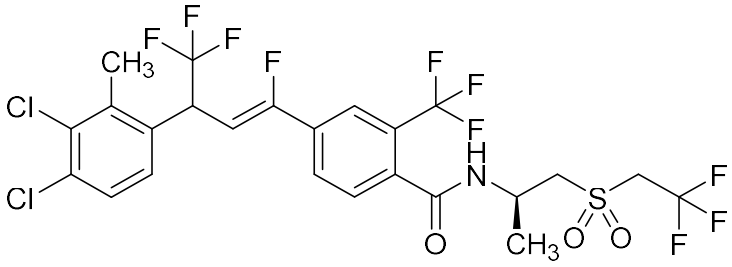
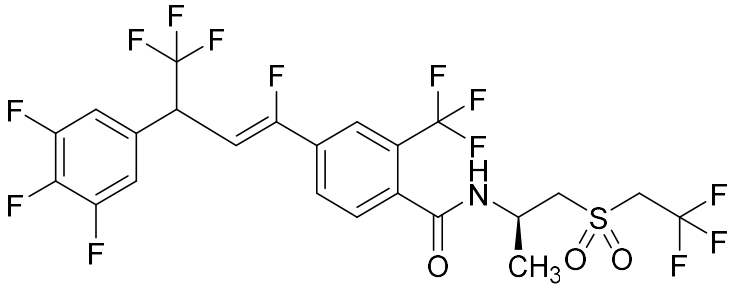
F97		**18**
F98		**13**
F99		**18**
F100		**29**
F101		**30**

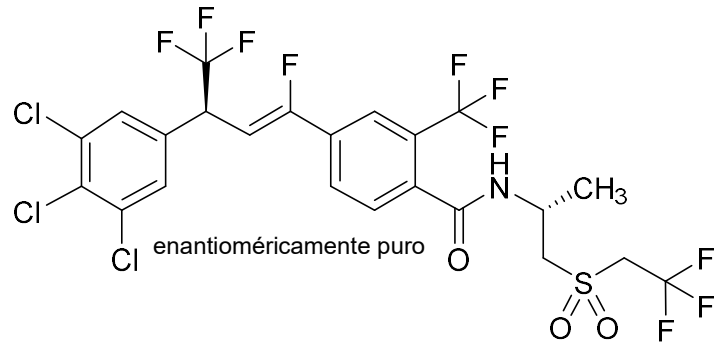
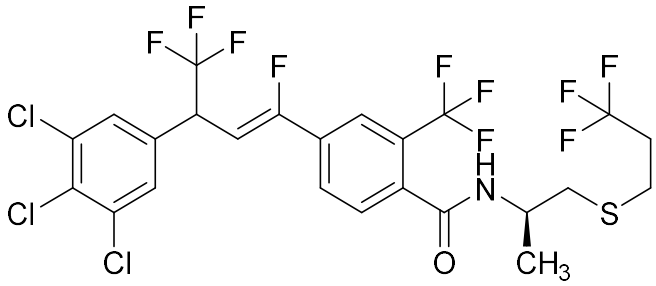
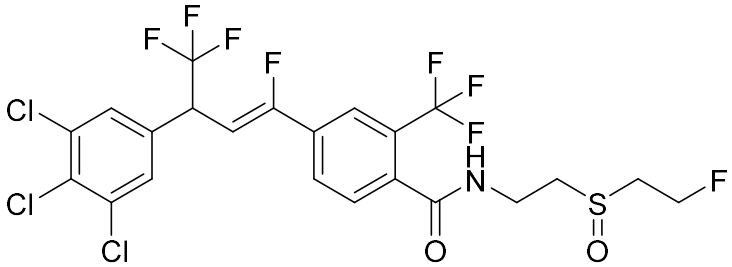
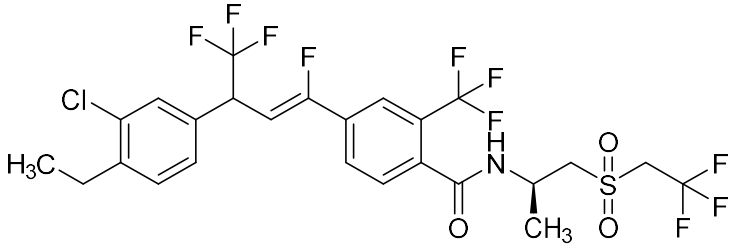
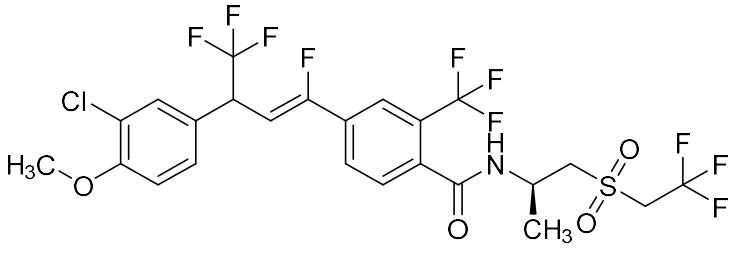
F102		**14**
F103		**14**
F104		**14**
F109		**13**
F110		**13**

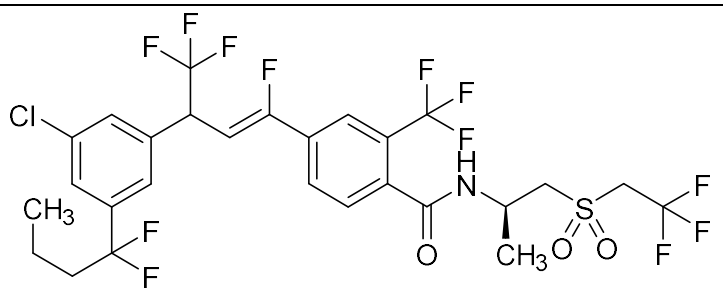
F112		**13**
F113		**29**
F114		**13**
F116		**13**
F117		**13**

F119		**15**
F120		**13**
F121		**18**
F122		**18**
F123		**18**

F124		**18**
F125		**29**
F126		**14**
F127		**13**
F128		**17**

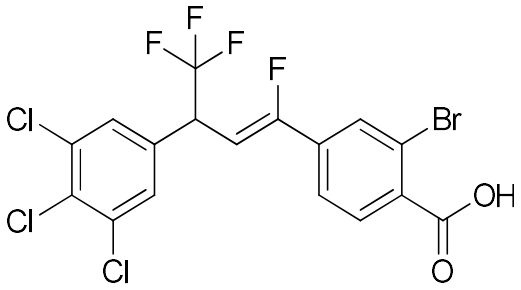
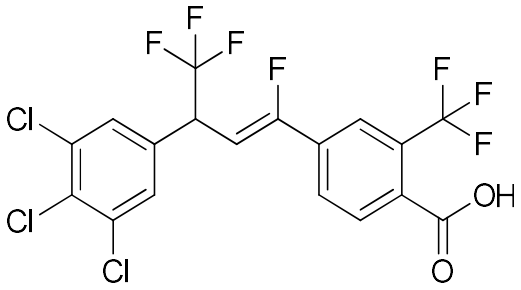
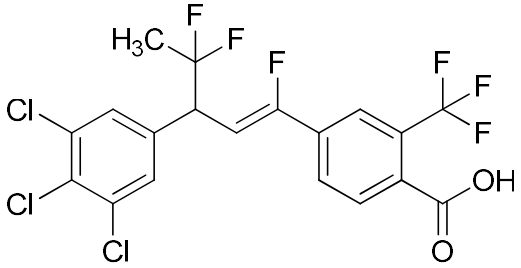
F129		**18**
F130		**18**
F131		**13**
F132		**13**
F133		**14**

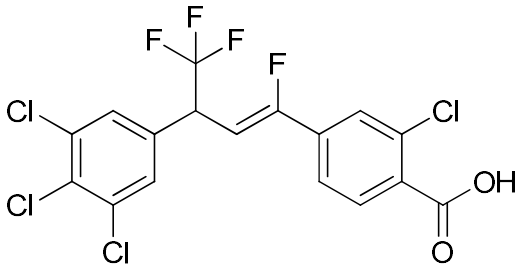
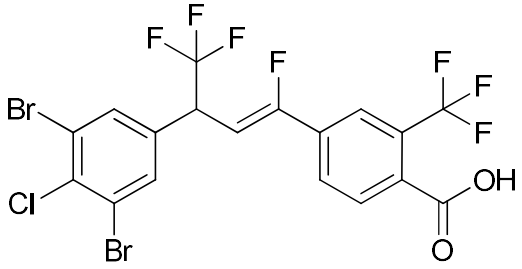
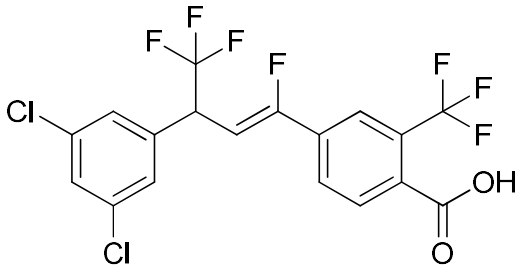
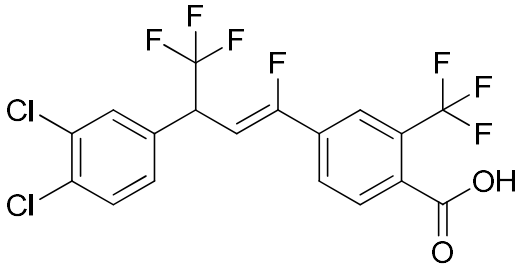
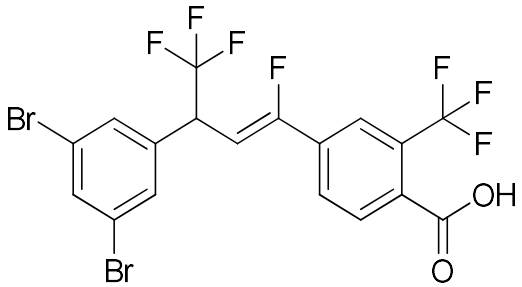
F136	 enantioméricamente puro	**35**
F137		**17**
F138		**18**
F141		**13**
F142		**13**

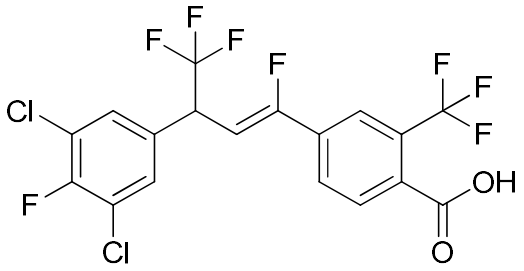
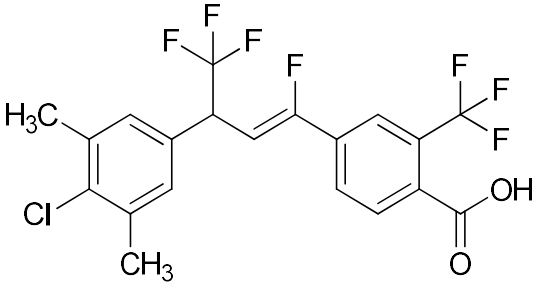
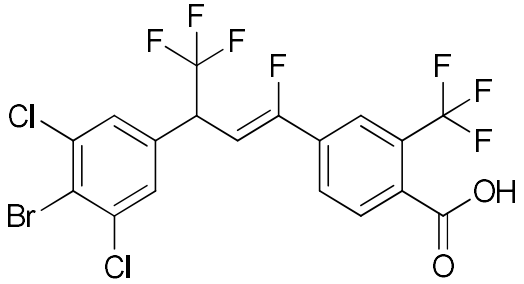
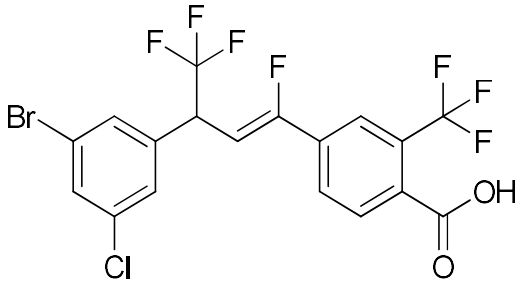
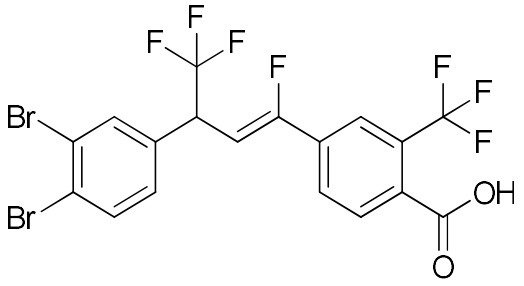
F143		**13**

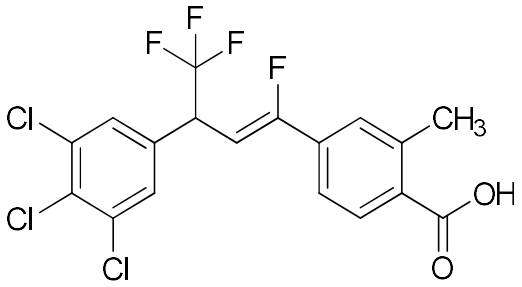
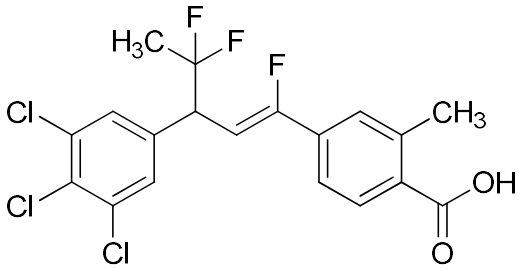
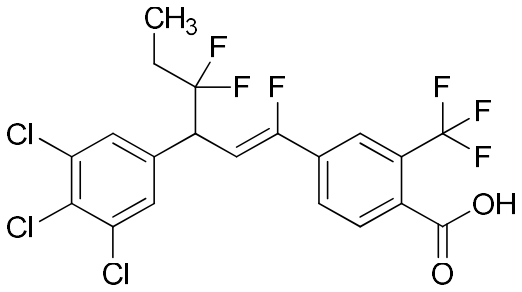
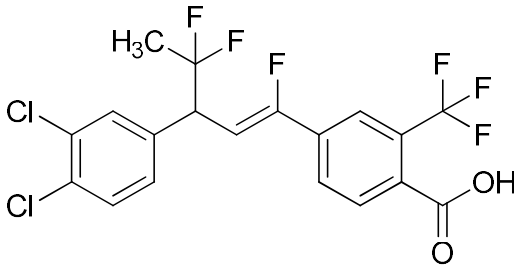
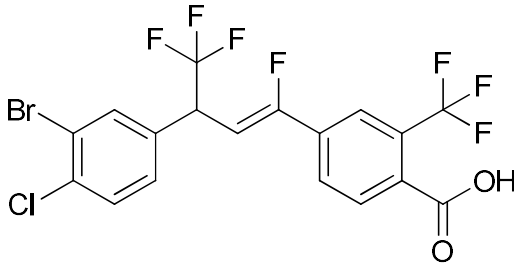
***preparado de acuerdo con el número de ejemplo**

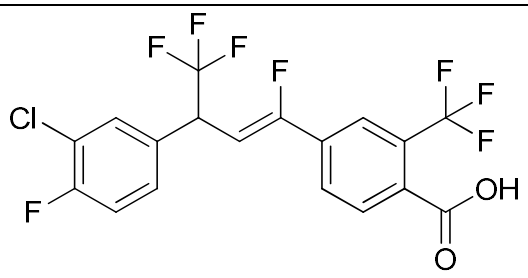
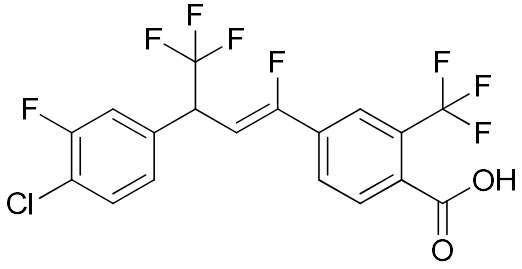
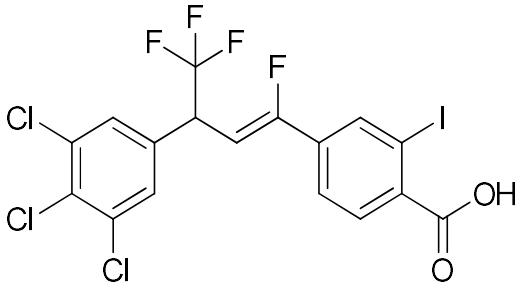
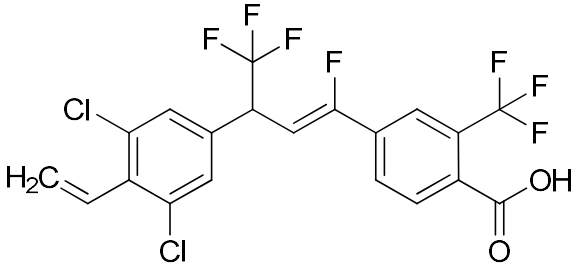
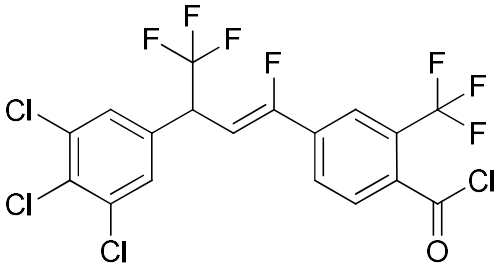
Tabla 3. Estructura y método de preparación para moléculas Serie C

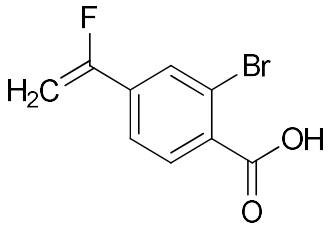
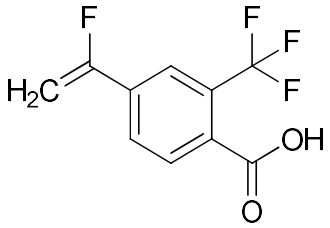
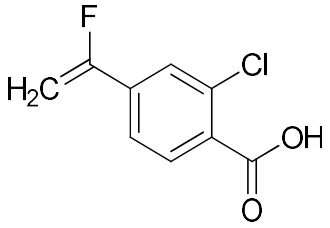
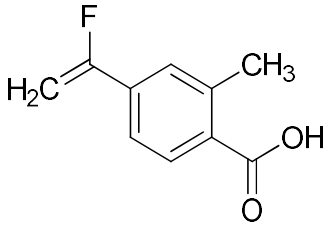
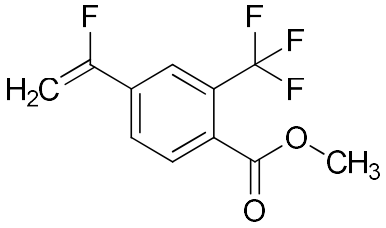
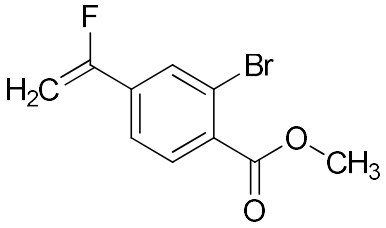
No.	Estructura	Prep.*
C1		**1**
C2		**1**
C3		**1**

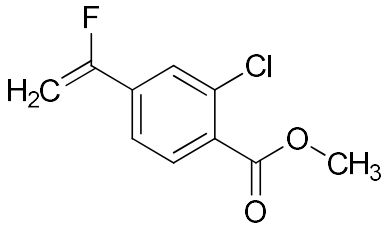
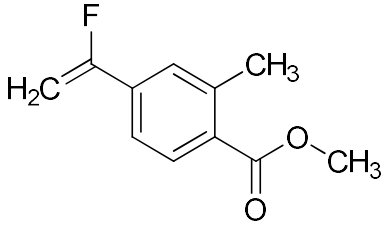
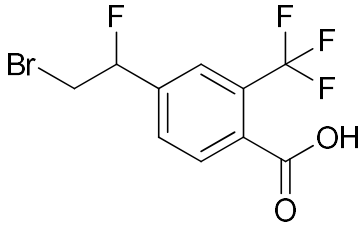
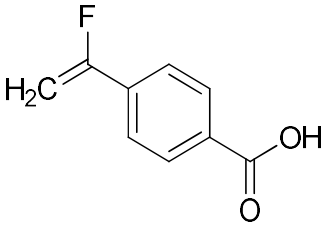
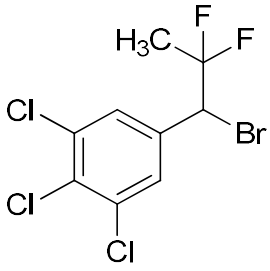
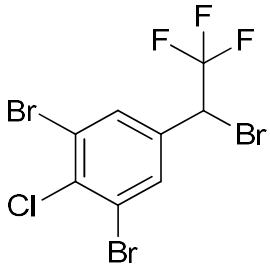
C4		**1**
C5		**1**
C6		**1**
C7		**1**
C8		**1**

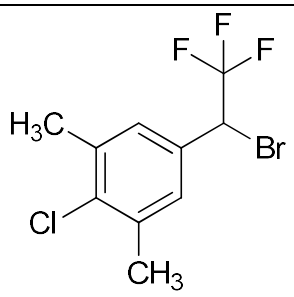
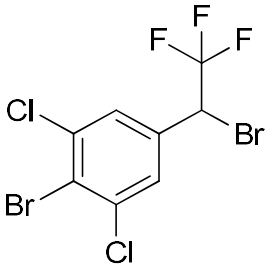
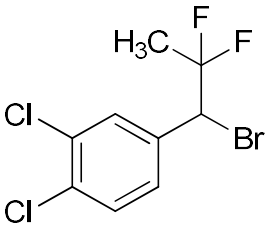
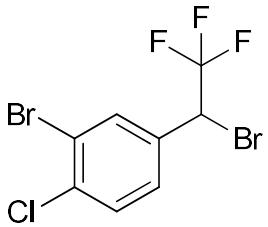
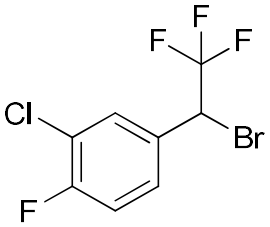
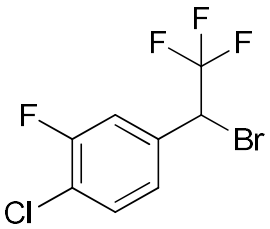
C9		**1**
C10		**1**
C11		**1**
C12		**1**
C13		**1**

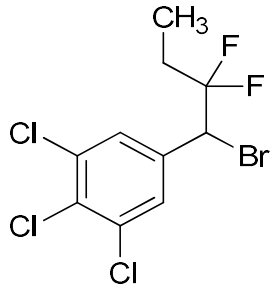
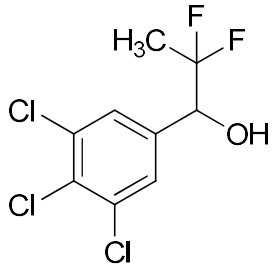
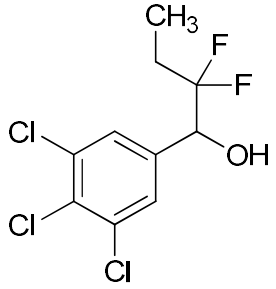
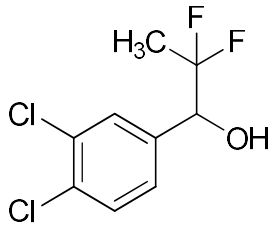
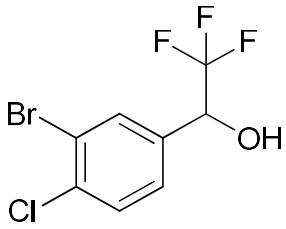
C14		**1**
C15		**1**
C16		**1**
C17		**1**
C18		**1**

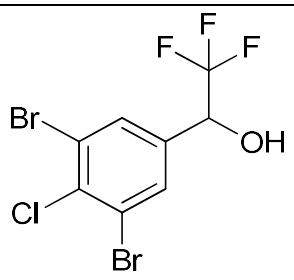
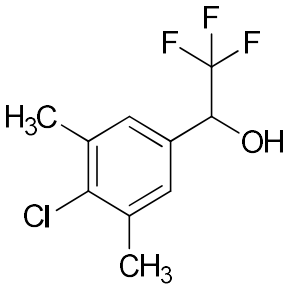
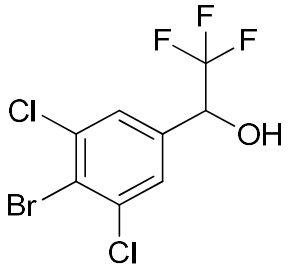
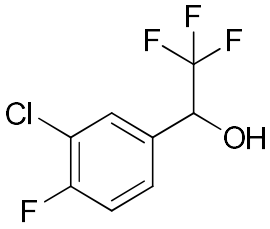
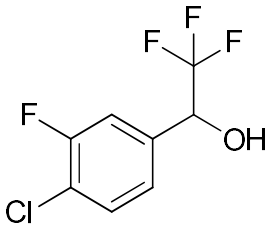
C19		**1**
C20		**1**
C21		**2**
C22		**3**
C23		**4**

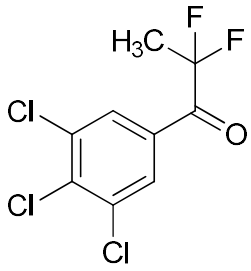
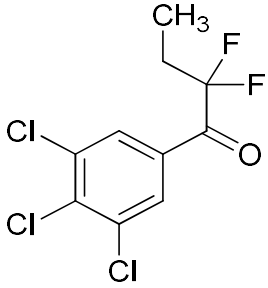
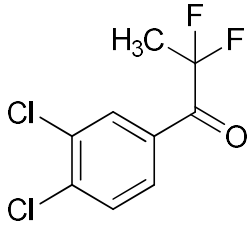
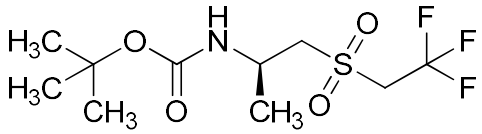
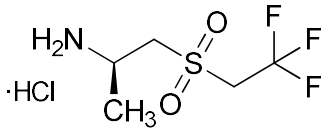
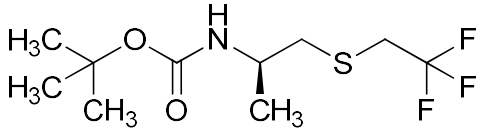
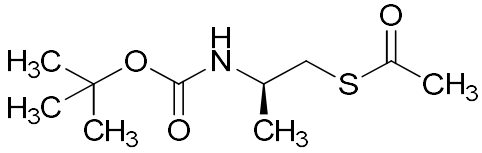
C24		**5**
C25		**5, 7**
C26		**5**
C27		**5, 7**
C28		**6**
C29		**6**

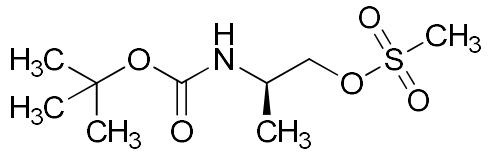
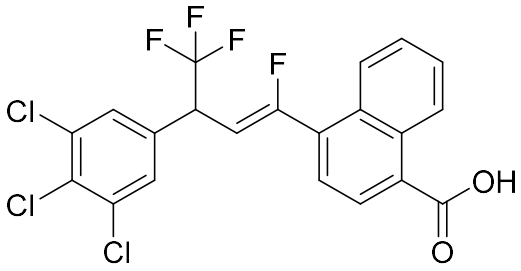
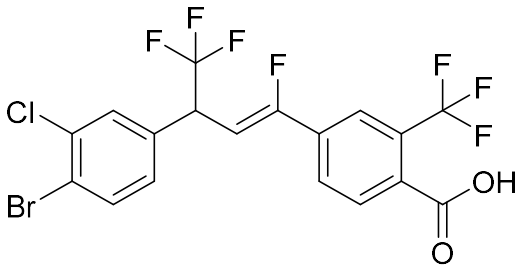
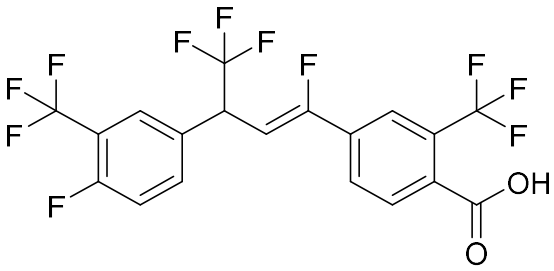
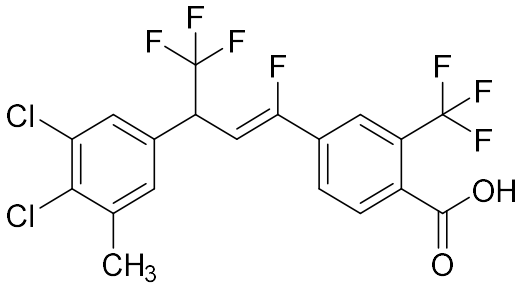
C30		**6**
C31		**6**
C32		**7**
C33		**7**
C34		**8**
C35		**8**

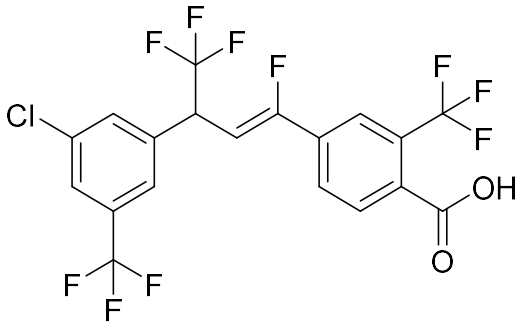
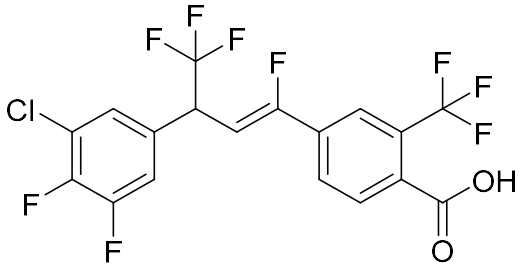
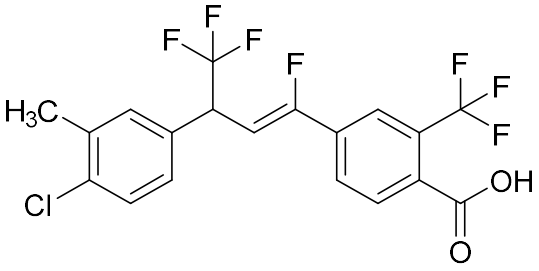
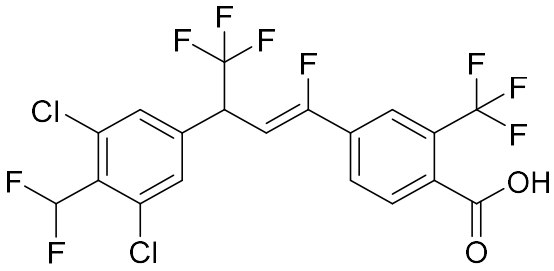
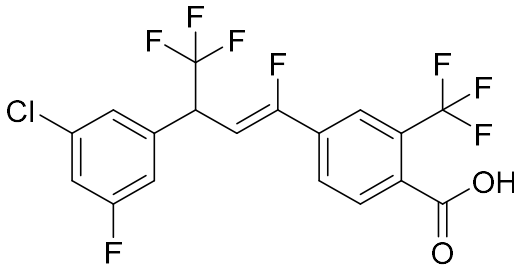
C36		**8**
C37		**8**
C38		**8**
C39		**8**
C40		**8**
C41		**8**

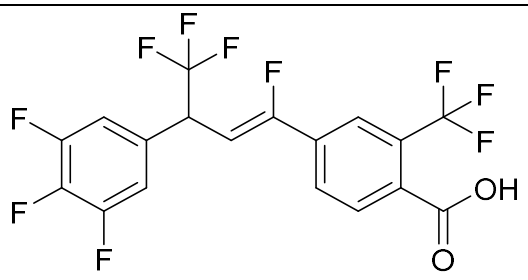
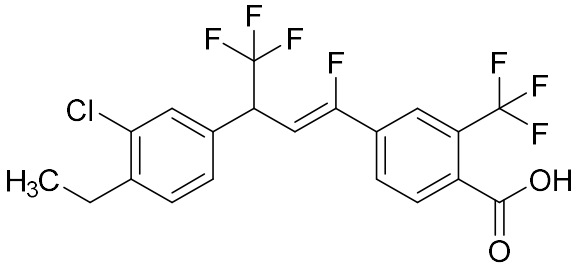
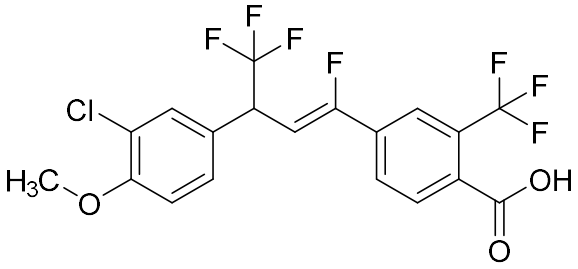
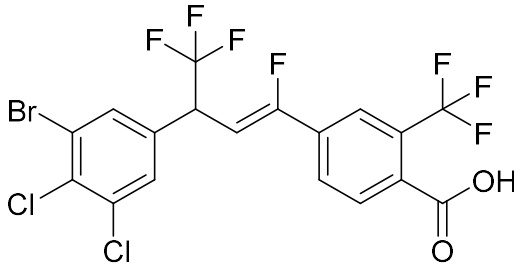
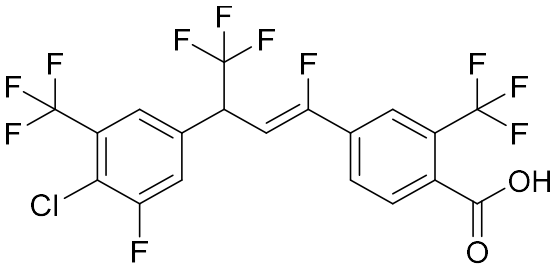
C42		**9**
C43		**10**
C44		**10**
C45		**10**
C46		**11**

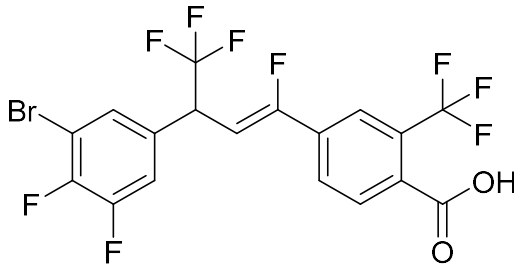
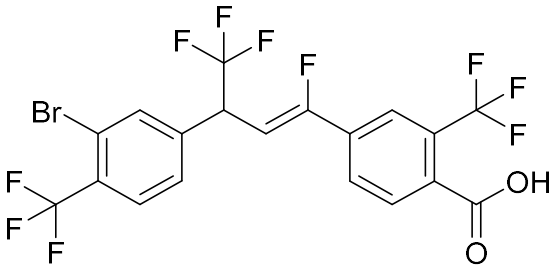
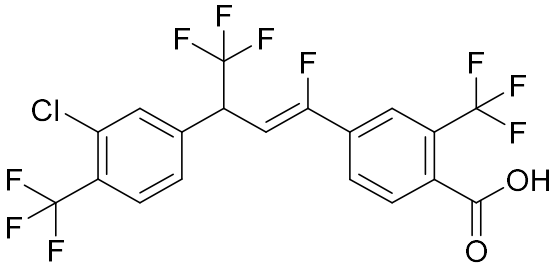
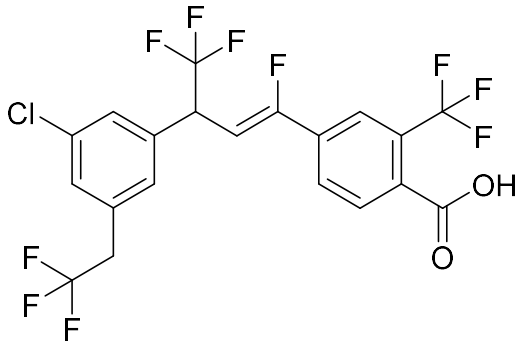
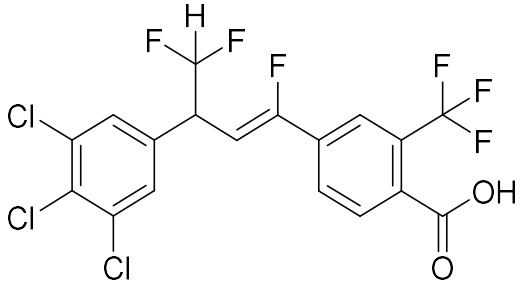
C47		**11**
C48		**11**
C49		**11**
C50		**11**
C51		**11**

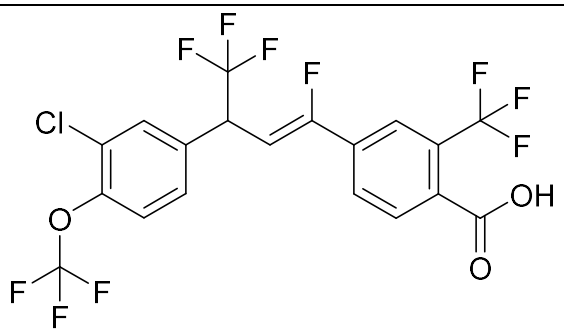
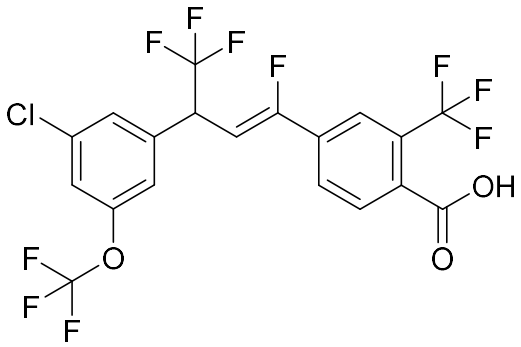
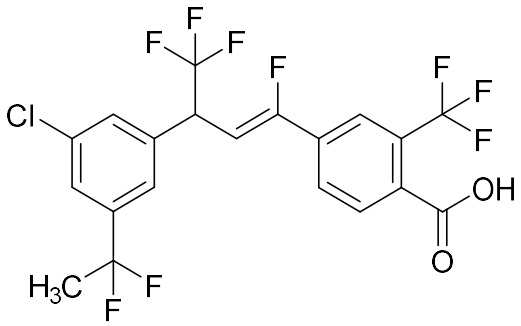
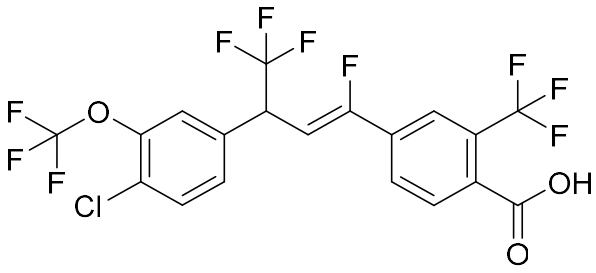
C52		**12**
C53		**12**
C54		**12**
C55		**15**
C56		**19**
C57		**20**
C58		**21**

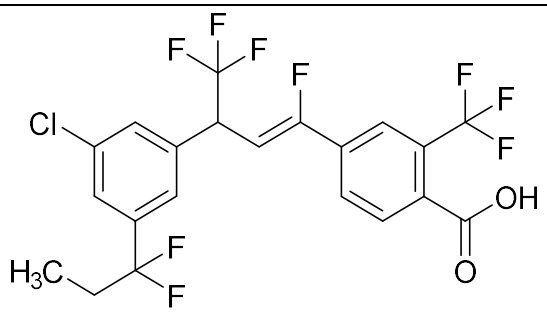
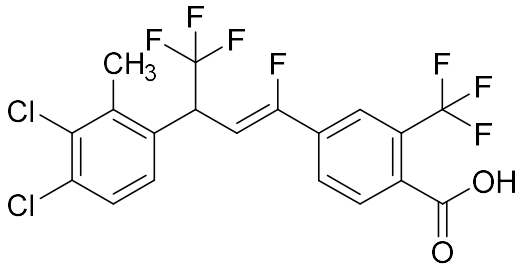
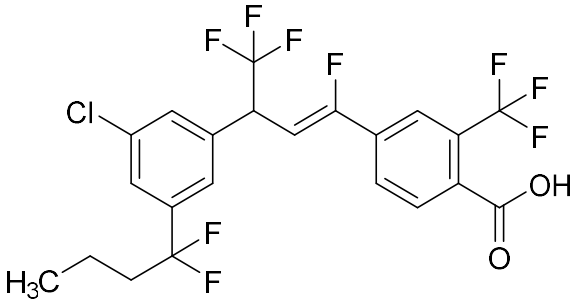
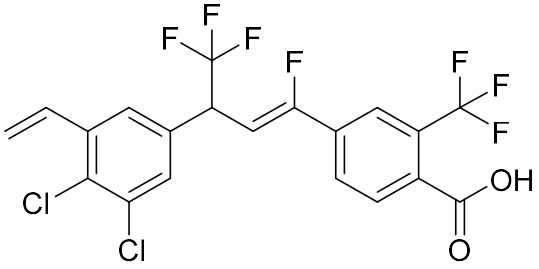
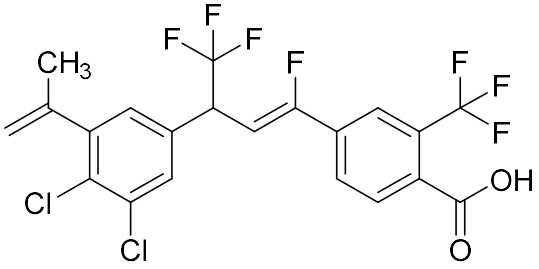
C59		**22**
C60		**1**
C61		**1**
C62		**1**
C63		**1**

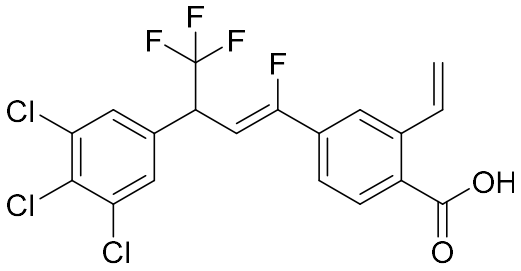
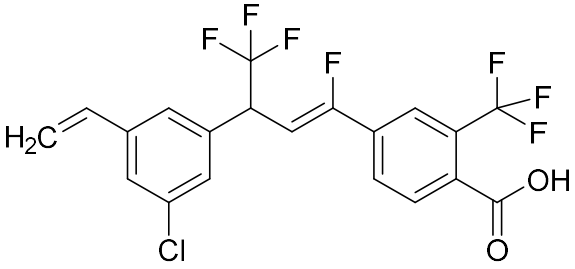
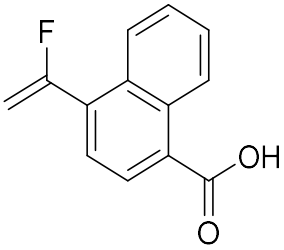
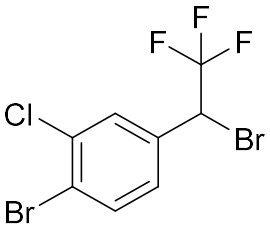
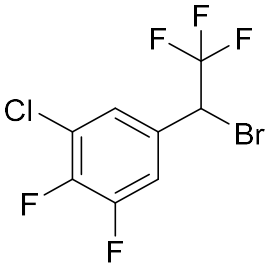
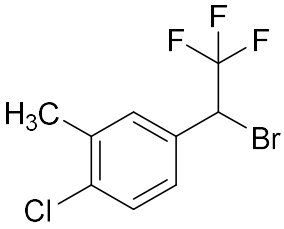
C64		**1**
C65		**1**
C66		**1**
C67		**1**
C68		**1**

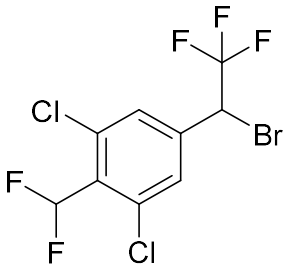
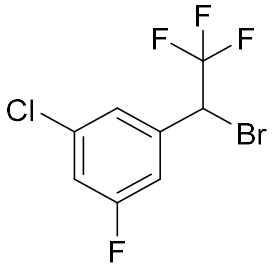
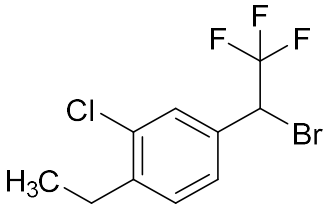
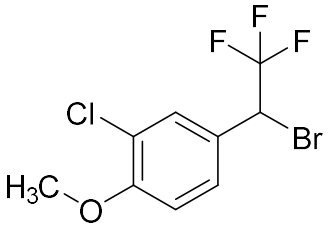
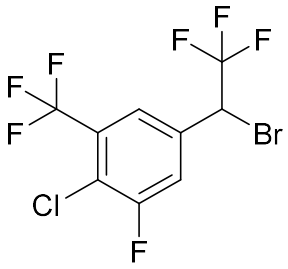
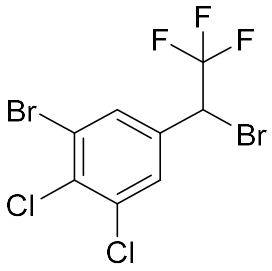
C69		**1**
C70		**1**
C71		**1**
C72		**1**
C73		**1**

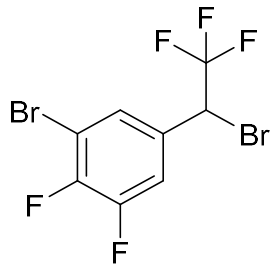
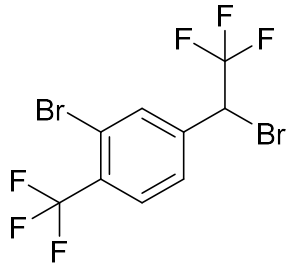
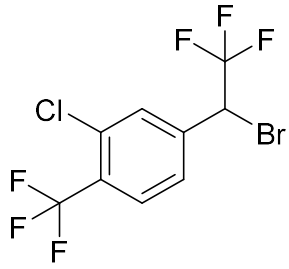
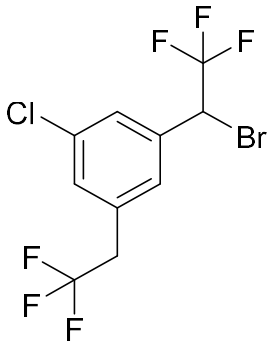
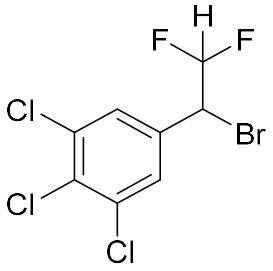
C74		**1**
C75		**1**
C76		**1**
C77		**1**
C78		**1**

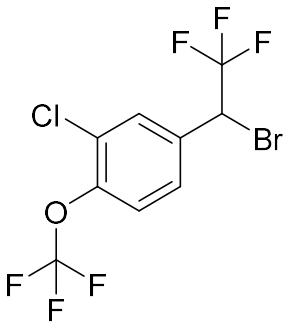
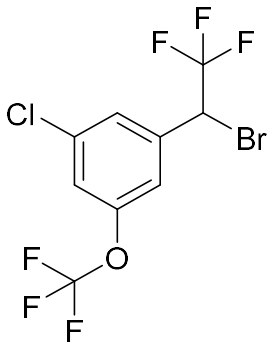
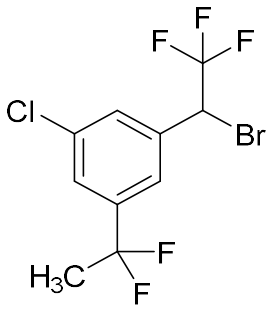
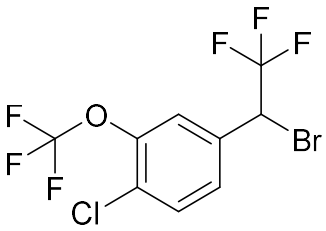
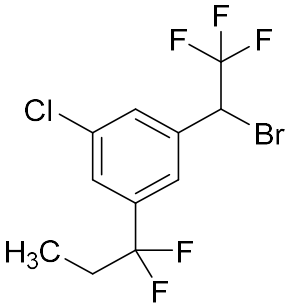
C79		**1**
C80		**1**
C81		**1**
C82		**1**

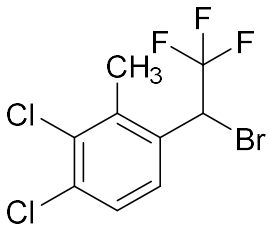
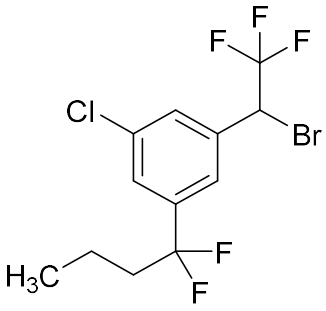
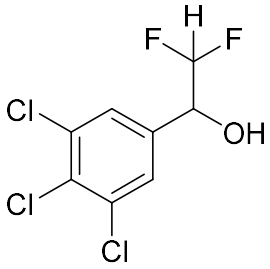
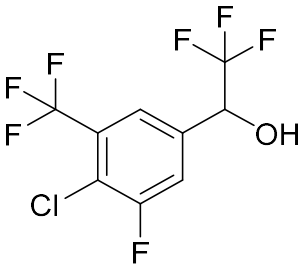
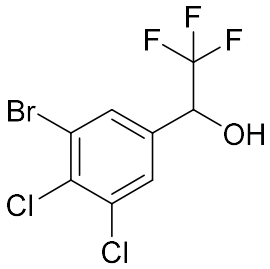
C83		**1**
C84		**1**
C85		**1**
C86		**3**
C87		**3**

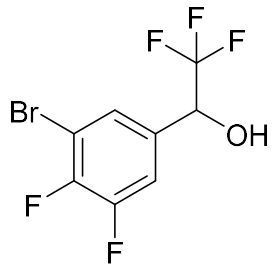
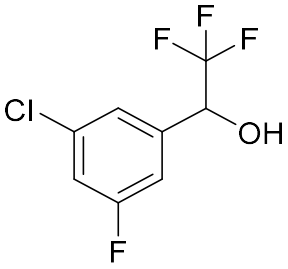
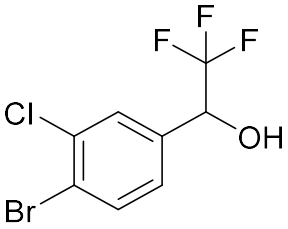
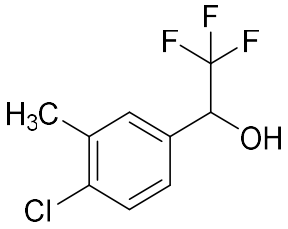
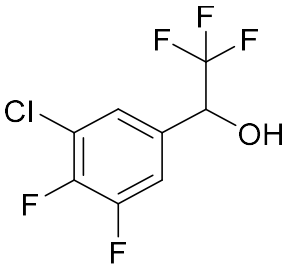
C88		**3**
C89		**3**
C90		**7**
C91		**8**
C92		**8**
C93		**8**

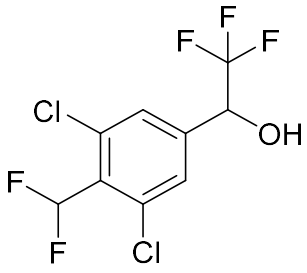
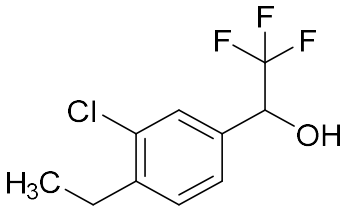
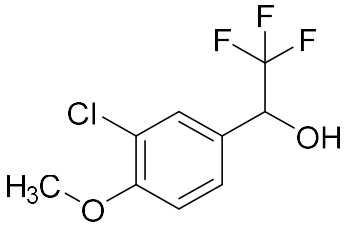
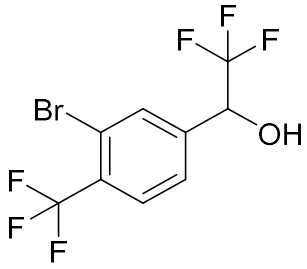
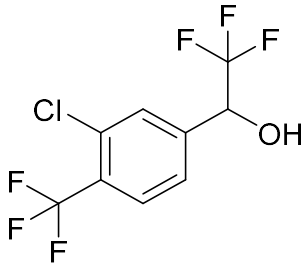
C94		**8**
C95		**8**
C96		**8**
C97		**8**
C98		**8**
C99		**8**

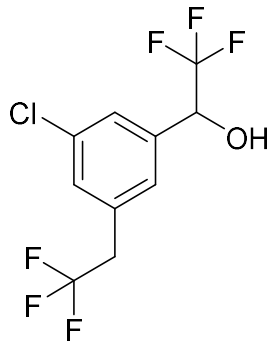
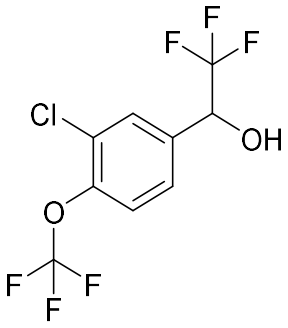
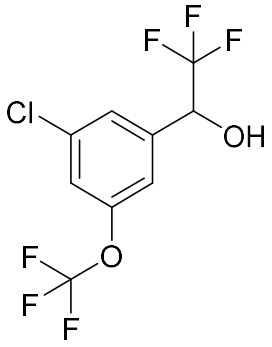
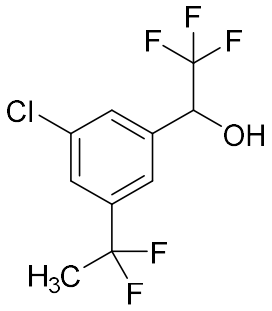
C100		**8**
C101		**8**
C102		**8**
C103		**8**
C104		**8**

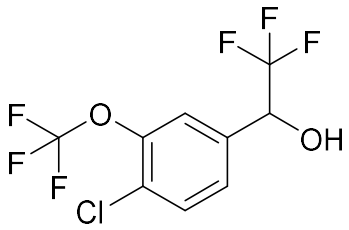
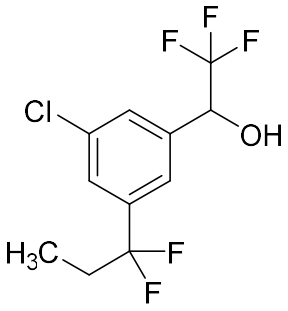
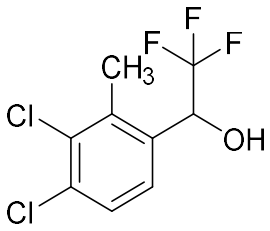
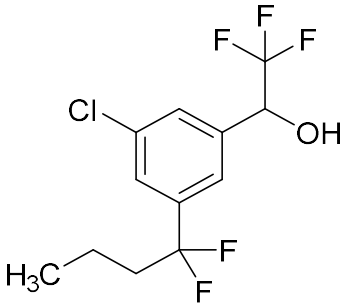
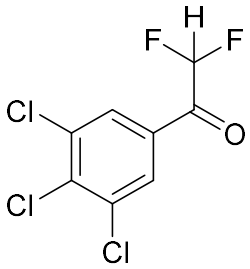
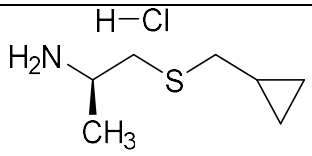
C105		**8**
C106		**8**
C107		**8**
C108		**8**
C109		**8**

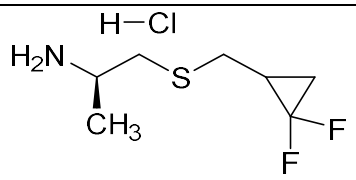
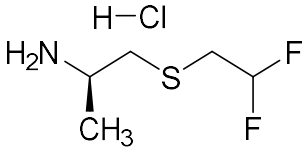
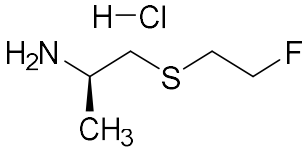
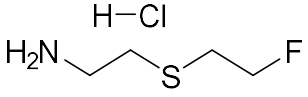
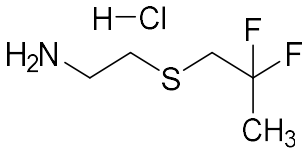
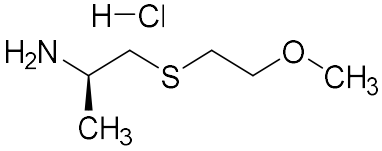
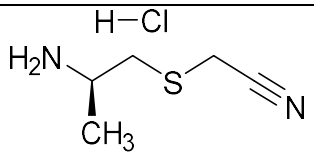
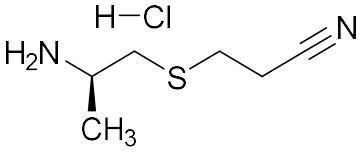
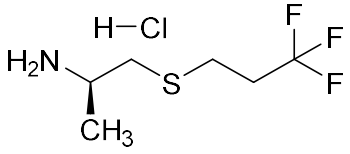
C110		**8**
C111		**8**
C112		**10**
C113		**10**
C114		**10**

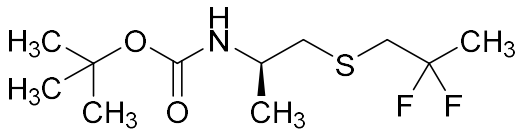
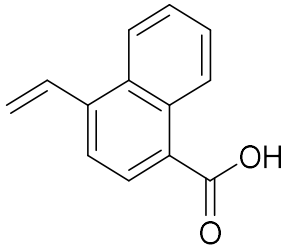
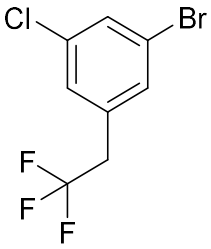
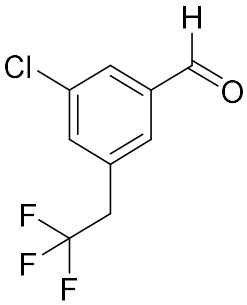
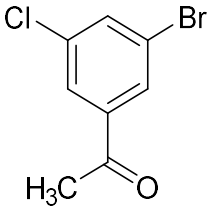
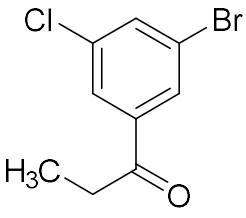
C115		**10**
C116		**10**
C117		**11**
C118		**11**
C119		**11**

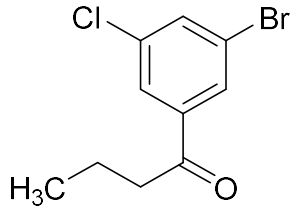
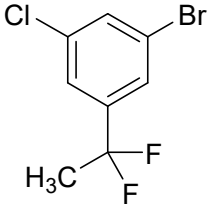
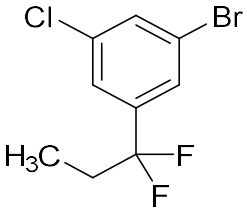
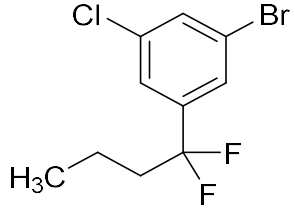
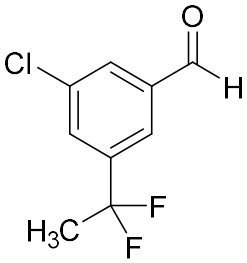
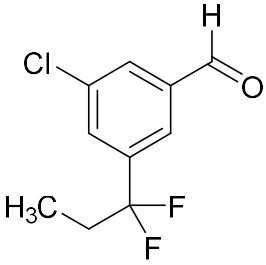
C120		**11**
C121		**11**
C122		**11**
C123		**11**
C124		**11**

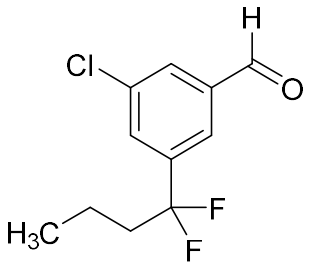
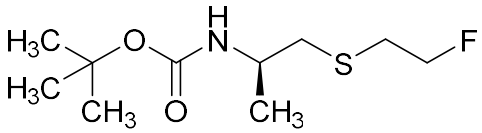
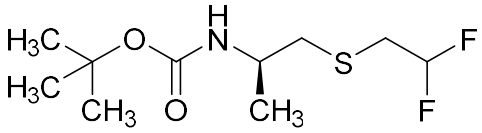
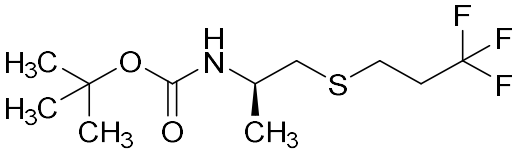
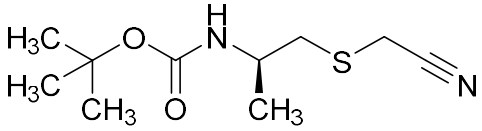
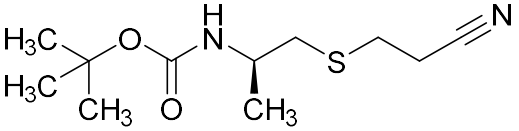
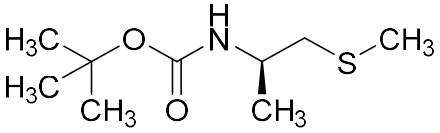
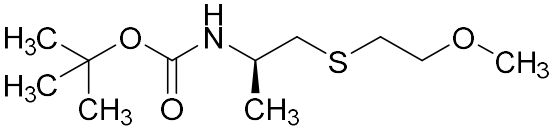
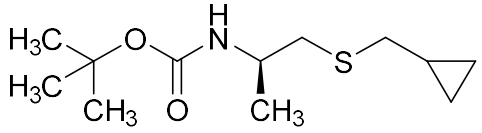
C125		**11**
C126		**11**
C127		**11**
C128		**11**

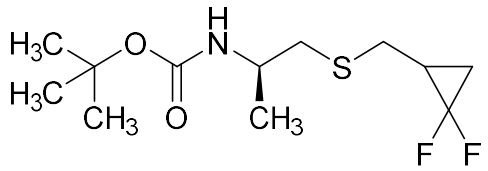
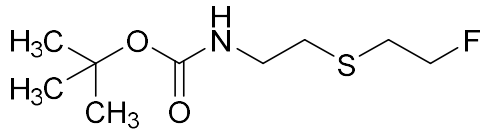
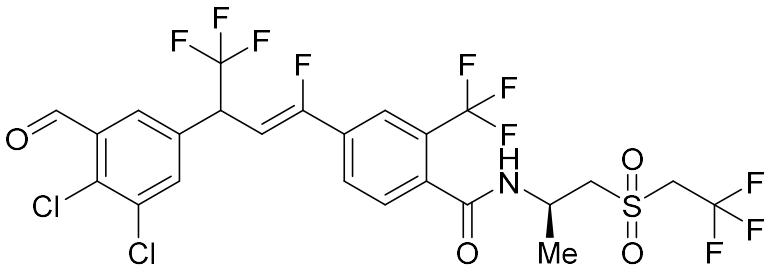
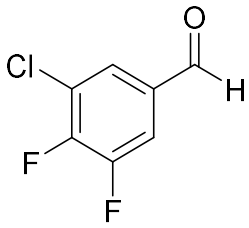
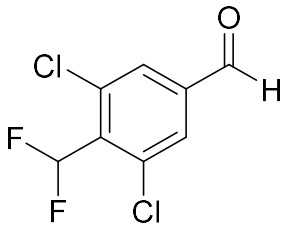
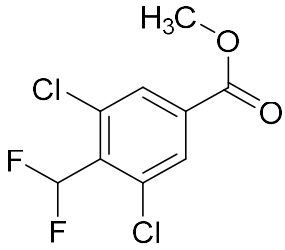
C129		**11**
C130		**11**
C131		**11**
C132		**11**
C133		**12**
C134		**19**

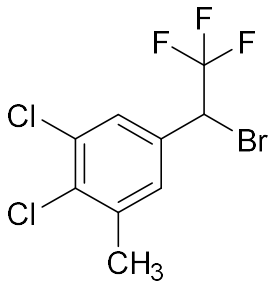
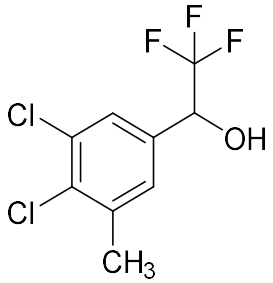
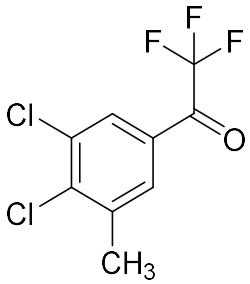
C135		**19**
C136		**19**
C137		**19**
C138		**19**
C139		**19**
C140		**19**
C141		**19**
C142		**19**
C143		**19**

C144		**20**
C145		**23**
C146		**24**
C147		**25**
C148		**26**
C149		**26**

C150		**26**
C151		**27**
C152		**27**
C153		**27**
C154		**25**
C155		**25**

C156		**25**
C157		**31**
C158		**31**
C159		**31**
C160		**31**
C161		**31**
C162		**31**
C163		**31**
C164		**31**

C165		**31**
C166		**32**
C167		**33**
C168		**36**
C169		**37**
C170		**38**

C171		**8**
C172		**10**
C173		**39**

***preparado de acuerdo con el número de ejemplo**

Tabla 4: Datos analíticos para moléculas en la Tabla 2

No.	Mp (°C)	Masa (*m/z*)	^{1}H NMR	^{13}C NMR; ^{19}F NMR; IR
F1		650 ($[M-H]^-$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.85 (d, *J* = 1.6 Hz, 1H), 7.77 (dd, *J* = 8.1, 1.7 Hz, 1H), 7.63 - 7.57 (m, 1H), 7.44 (s, 2H), 5.94 - 5.73 (m, 2H), 4.61 (p, *J* = 8.8 Hz, 1H), 4.49 - 4.31 (m, 1H), 3.29 - 3.06 (m, 2H), 3.00 - 2.78 (m, 2H), 1.34 (d, *J* = 6.7 Hz, 3H)	**^{19}F NMR** (376 MHz, $CDCl_3$) δ -59.01, -66.50, -69.34, -108.70 − -115.58 (m)
F2		682 ($[M-H]^-$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.83 (d, *J* = 1.7 Hz, 1H), 7.75 (dd, *J* = 8.1, 1.7 Hz, 1H), 7.61 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.44 (s, 2H), 6.27 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 5.83 (dd, *J* = 32.6, 9.6 Hz, 1H), 4.69 (dtd, *J* = 8.1, 6.7, 4.9 Hz, 1H), 4.59 (q, *J* = 8.9 Hz, 1H), 4.18 - 3.87 (m, 2H), 3.53 (dd, *J* = 14.5, 6.6 Hz, 1H), 3.40 (dd, *J* = 14.5, 5.0 Hz, 1H), 1.52 (d, *J* = 6.9 Hz, 3H)	**^{19}F NMR** (376 MHz, $CDCl_3$) δ -59.10, -61.14, -66.70 – -73.28 (m), -112.04 (t, *J* = 9.4 Hz)
F3		666 ($[M-H]^-$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.83 (d, *J* = 1.6 Hz, 1H), 7.74 (ddd, *J* = 8.1, 4.6, 1.7 Hz, 1H), 7.58 (dd, *J* = 11.4, 8.0 Hz, 1H), 7.44 (s, 2H), 6.95 - 6.33 (m, 1H), 5.82 (ddd, *J* = 32.5, 9.6, 4.8 Hz, 1H), 4.78 - 4.51 (m, 2H), 3.77 - 3.41 (m, 2H), 3.30 - 3.12 (m, 2H), 1.53 (dd, *J* = 34.9, 6.9 Hz, 3H)	**^{19}F NMR** (376 MHz, $CDCl_3$) δ -59.02 (d, *J* = 4.7 Hz), -60.69 (d, *J* = 65.3 Hz), -67.74 – -70.14 (m), -110.42 − -113.48 (m)

F4		596 ($[M-H]^-$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.43 (s, 2H), 7.41 (d, *J* = 1.6 Hz, 1H), 7.39 (d, *J* = 1.1 Hz, 2H), 5.80 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 5.71 (dd, *J* = 32.9, 9.6 Hz, 1H), 4.58 (p, *J* = 8.9 Hz, 1H), 4.39 (dtd, *J* = 8.4, 6.7, 5.7 Hz, 1H), 3.33 - 3.03 (m, 2H), 2.95 (dd, *J* = 13.3, 5.6 Hz, 1H), 2.85 (dd, *J* = 13.2, 6.5 Hz, 1H), 2.48 (d, *J* = 0.6 Hz, 3H), 1.35 (d, *J* = 6.7 Hz, 3H)	**^{19}F NMR** (376 MHz, $CDCl_3$) δ -66.41, -69.45 (d, *J* = 2.3 Hz), -111.59
F5		614 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.46 - 7.35 (m, 5H), 6.80 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 5.71 (ddd, *J* = 32.9, 9.5, 5.3 Hz, 1H), 4.78 - 4.49 (m, 2H), 3.86 - 3.45 (m, 2H), 3.35 - 3.04 (m, 2H), 2.46 (d, *J* = 3.4 Hz, 3H), 1.54 (dd, *J* = 35.1, 6.8 Hz, 3H)	**^{19}F NMR** (376 MHz, $CDCl_3$) δ -60.61 (d, *J* = 90.0 Hz), -69.45 (dd, *J* = 5.4, 2.2 Hz), -105.94 − -114.23 (m)
F6		626 ($[M-H]^-$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.54 - 7.32 (m, 5H), 6.18 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 5.72 (dd, *J* = 32.9, 9.6 Hz, 1H), 4.70 (p, *J* = 6.7 Hz, 1H), 4.58 (p, *J* = 8.9 Hz, 1H), 4.22 - 3.88 (m, 2H), 3.60 - 3.32 (m, 2H), 2.47 (s, 3H), 1.55 (d, *J* = 6.9 Hz, 3H)	**^{19}F NMR** (376 MHz, $CDCl_3$) δ -61.10, -69.45 (d, *J* = 2.3 Hz), -108.33 − -114.90 (m)
F7		662 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.77 (d, *J* = 1.6 Hz, 1H), 7.66 - 7.49 (m, 2H), 7.42 (s, 2H), 6.07 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 5.76 (dd, *J* = 32.5, 9.6 Hz, 1H), 4.58 (p, *J* = 8.9 Hz, 1H), 4.41 (dq, *J* = 8.2, 6.3 Hz, 1H), 3.29 - 3.07 (m, 2H), 2.92 (d, *J* = 5.9 Hz, 2H), 1.37 (d, *J* = 6.7 Hz, 3H)	**^{19}F NMR** (376 MHz, $CDCl_3$) δ -66.44, -69.37 (d, *J* = 2.3 Hz), -111.87 (d, *J* = 13.2 Hz)

F8		694 ($[M-H]^-$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.74 (d, *J* = 1.4 Hz, 1H), 7.60 - 7.48 (m, 2H), 7.43 (s, 2H), 6.48 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 5.77 (dd, *J* = 32.6, 9.6 Hz, 1H), 4.81 - 4.66 (m, 1H), 4.24 - 3.88 (m, 2H), 3.57 (dd, *J* = 14.5, 6.2 Hz, 1H), 3.40 (dd, *J* = 14.5, 5.2 Hz, 1H), 1.56 (d, *J* = 6.9 Hz, 3H)	**^{19}F NMR** (376 MHz, $CDCl_3$) δ -61.03, -69.36 (d, *J* = 2.3 Hz), -109.75 − -113.19 (m)
F9		676 ($[M-H]^-$)	^{1}H NMR (400 MHz, acetona-d_6) δ 7.98 (t, *J* = 1.8 Hz, 1H), 7.90 (s, 2H), 7.76 (dd, *J* = 8.1, 1.7 Hz, 1H), 7.54 (dd, *J* = 8.0, 5.5 Hz, 1H), 6.56 (dd, *J* = 34.3, 9.9 Hz, 1H), 5.23 - 4.96 (m, 1H), 4.70 - 4.51 (m, 1H), 4.11 - 3.72 (m, 2H), 3.39 - 3.21 (m, 2H), 1.47 (dd, *J* = 10.1, 6.8 Hz, 3H)	**^{19}F NMR** (376 MHz, Acetone-d_6) δ 115.94 (d, *J* = 76.1 Hz), 107.17 (d, *J* = 2.6 Hz), 63.16
F10		616 ($[M-H]^-$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.77 - 7.64 (m, 1H), 7.57 (d, *J* = 1.7 Hz, 1H), 7.49 (dd, *J* = 8.1, 1.7 Hz, 1H), 7.43 (s, 2H), 6.37 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 5.78 (dd, *J* = 32.6, 9.6 Hz, 1H), 4.59 (p, *J* = 8.9 Hz, 1H), 4.40 (dq, *J* = 8.1, 6.3 Hz, 1H), 3.33 - 3.01 (m, 2H), 2.91 (d, *J* = 6.0 Hz, 2H), 1.37 (d, *J* = 6.7 Hz, 3H)	**^{19}F NMR** (376 MHz, $CDCl_3$) δ -66.47, -69.38, -111.97
F11		647 ($[M-H]^-$)	^{1}H NMR (400 MHz, acetona-d_6) δ 7.90 (s, 2H), 7.83 (d, *J* = 1.7 Hz, 1H), 7.73 (dd, *J* = 8.1, 1.7 Hz, 1H), 7.61 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 6.56 (dd, *J* = 34.3, 9.9 Hz, 1H), 5.09 (p, *J* = 9.2 Hz, 1H), 4.84 - 4.62 (m, 1H), 4.53 (q, *J* = 9.9 Hz, 2H), 3.72 (dd, *J* = 14.4, 6.8 Hz, 1H), 3.55 (dd, *J* = 14.4, 5.7 Hz, 1H), 1.50 (d, *J* = 6.8 Hz, 3H)	**^{19}F NMR** (376 MHz, acetona-d_6) δ -61.38, -70.31, -112.29 − -116.17 (m)

F12		634 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, acetona-d_6) δ 7.90 (s, 2H), 7.82 (dd, *J* = 3.1, 1.7 Hz, 1H), 7.77 - 7.67 (m, 1H), 7.58 (dd, *J* = 8.1, 4.4 Hz, 1H), 6.56 (dd, *J* = 34.3, 9.9 Hz, 1H), 5.08 (p, *J* = 9.2 Hz, 1H), 4.63 (dqd, *J* = 8.0, 6.7, 3.6 Hz, 1H), 4.16 - 3.67 (m, 2H), 3.43 - 3.19 (m, 2H), 1.47 (dd, *J* = 9.0, 6.8 Hz, 3H)	**^{19}F NMR** (376 MHz, acetona-d_6) δ -61.55 (d, *J* = 73.3 Hz), -70.29 (d, *J* = 2.6 Hz), -114.30
F13		594 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.43 - 7.37 (m, 5H), 5.86 - 5.67 (m, 2H), 4.39 (dq, *J* = 8.4, 6.5 Hz, 1H), 4.26 (td, *J* = 14.4, 9.9 Hz, 1H), 3.28 - 3.09 (m, 2H), 2.95 (dd, *J* = 13.2, 5.6 Hz, 1H), 2.86 (dd, *J* = 13.3, 6.5 Hz, 1H), 2.47 (s, 3H), 1.65 (t, *J* = 18.4 Hz, 3H), 1.35 (d, *J* = 6.7 Hz, 3H)	**^{19}F NMR** (376 MHz, $CDCl_3$) δ -66.41, -95.19, -114.17
F14		626 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.44 - 7.36 (m, 5H), 6.21 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 5.77 (dd, *J* = 34.0, 9.9 Hz, 1H), 4.70 (dt, *J* = 13.3, 6.6 Hz, 1H), 4.26 (td, *J* = 14.3, 9.8 Hz, 1H), 4.17 - 3.94 (m, 3H), 3.59 - 3.38 (m, 2H), 2.47 (s, 3H), 1.64 (t, *J* = 18.4 Hz, 3H)	**^{19}F NMR** (376 MHz, $CDCl_3$) δ -61.10, -95.18, -114.25
F15		646 ($[M-H]^-$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.83 (d, *J* = 1.7 Hz, 1H), 7.75 (dd, *J* = 8.1, 1.7 Hz, 1H), 7.58 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.42 (s, 2H), 5.96 - 5.82 (m, 2H), 4.39 (dq, *J* = 8.3, 6.3 Hz, 1H), 4.28 (td, *J* = 14.3, 9.8 Hz, 1H), 3.29 - 3.06 (m, 2H), 2.98 - 2.81 (m, 2H), 1.64 (t, *J* = 18.5 Hz, 3H), 1.34 (d, *J* = 6.7 Hz, 3H)	**^{19}F NMR** (376 MHz, $CDCl_3$) δ -58.96, -66.49, -92.97 – -97.94 (m), 114.62, -114.62

F16		681 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.82 (d, *J* = 1.6 Hz, 1H), 7.74 (dd, *J* = 8.1, 1.7 Hz, 1H), 7.60 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.42 (s, 2H), 6.24 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 5.89 (dd, *J* = 33.8, 9.8 Hz, 1H), 4.78 - 4.61 (m, 1H), 4.27 (td, *J* = 14.3, 9.8 Hz, 1H), 4.09 (dq, *J* = 15.5, 9.1 Hz, 1H), 3.97 (dq, *J* = 15.5, 9.3 Hz, 1H), 3.53 (dd, *J* = 14.5, 6.5 Hz, 1H), 3.40 (dd, *J* = 14.5, 5.0 Hz, 1H), 1.64 (t, *J* = 18.6 Hz, 3H), 1.53 (d, *J* = 6.9 Hz, 3H)	**^{19}F NMR** (376 MHz, $CDCl_3$) δ -59.03, -61.13, -93.19 – -96.78 (m), -114.69
F17		648 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-*d_6*) δ 8.83 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 8.14 (s, 1H), 8.08 - 8.07 (m, 1H), 7.81 (s, 2H), 7.69 -7.64 (m, 1H), 7.63 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 6.85 (dd, *J* = 36.0, 10.0 Hz, 1H), 5.23 - 5.18 (m, 1H), 4.78 - 4.70 (m, 2H), 4.56 - 4.53 (m, 1H), 3.59 - 3.49 (m, 2H), 1.13 - 1.09 (m, 3H)	**IR** (película delgada) 3274, 2929, 1655, 1127 cm^{-1}
F18		666 ($[M+H_2O]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-*d_6*) δ 8.83 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 8.13 (s, 1H), 8.08 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 7.79 (s, 1H), 7.74 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 7.68 - 7.61 (m, 2H), 6.82 (dd, *J* = 36.0, 10.0 Hz, 1H), 5.20 - 5.16 (m, 1H), 4.78 - 4.70 (m, 2H), 4.57 - 4.50 (m, 1H), 3.59 - 3.49 (m, 2H), 1.13 -1.09 (m, 3H)	**IR** (película delgada) 3432, 2924, 1657, 1127 cm^{-1}

F19		616 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 8.60 (d, *J* = 7.6 Hz, 1H), 8.12 (s, 1H), 8.06 (d, *J* = 8.8 Hz, 1H), 7.81 (s, 2H), 7.68 (t, *J* = 2.0 Hz, 1H), 7.60 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 6.84 (dd, *J* = 36.4, 10.4 Hz, 1H), 5.23 - 5.18 (m, 1H), 4.11 - 4.08 (m, 1H), 3.57 - 3.49 (m, 2H), 2.82 - 2.79 (m, 2H), 1.23 - 1.19 (m, 3H)	**IR** (película delgada) 3432, 2927, 1645, 1121 cm^{-1}
F20		616 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 8.60 (d, *J* = 7.6 Hz, 1H), 8.12 (s, 1H), 8.06 (d, *J* = 8.8 Hz, 1H), 7.99 (s, 1H), 7.74 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 7.65 (d, *J* = 10.4 Hz, 1H), 7.59 (d, *J* = 7.6 Hz, 1H), 6.82 (dd, *J* = 35.6, 10.4 Hz, 1H), 5.20 - 5.15 (m, 1H), 4.11 - 4.08 (m, 1H), 3.57 - 3.54 (m, 2H), 2.82 - 2.80 (m, 2H), 1.23 - 1.18 (m, 3H)	**IR** (película delgada) 3432, 2928, 1645, 1260 cm^{-1}
F21		738 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 8.61 (d, *J* = 8.1Hz, 1H), 8.17 (s, 2H), 8.12 (s, 1H), 8.06 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 7.61 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 6.87 (dd, *J* = 36.0, 10.2 Hz, 1H), 5.26 - 5.19 (m, 1H), 4.12 - 4.07 (m, 1H), 3.59 - 3.48 (q, 2H), 2.82 - 2.79 (m, 2H), 1.23 (d, *J* = 7.2 Hz, 3H)	**IR** (película delgada) 3422, 2925, 1646, 1260, 749 cm^{-1}
F22	140-142	770 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 8.84 (d, *J* = 8.1Hz, 1H), 8.17 (s, 2H), 8.13 (s, 1H), 8.08 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.64 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 6.87 (dd, *J* = 36.0, 10.2 Hz, 1H), 5.26 - 5.19 (m, 1H), 4.79 - 4.69 (m, 2H), 4.56 - 4.52 (m, 1H), 3.56 - 3.42 (m, 2H), 1.23 (d, *J* = 7.2 Hz, 3H)	**IR** (película delgada) 3422, 2925, 1646, 1260, 749 cm^{-1}

F23	134-136	754 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 8.87 - 8.76 (m, 1H), 8.17 - 8.04 (m, 4H), 7.64 (dd, *J* = 16.0, 8.4 Hz, 1H), 6.85 (dd, *J* = 36.0, 10.4 Hz, 1H), 5.25 - 5.20 (m, 1H), 4.40 - 4.38 (m, 1H), 4.11 - 3.99 (m, 2H), 3.31 - 3.08 (m, 2H), 1.31 (d, *J* = 6.4 Hz, 3H)	
F24		694 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 8.61 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 8.12 - 8.00 (m, 4H), 7.61 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 6.86 (dd, *J* = 35.4, 9.9 Hz, 1H), 5.26 - 5.19 (m, 1H), 4.12 - 4.07 (m, 1H), 3.58 - 3.48 (m, 2H), 2.82 - 2.77 (m, 2H), 1.23 (d, *J* = 7.8 Hz, 3H)	**IR** (película delgada) 3436, 2926, 1645, 1121, 750 cm^{-1}
F25	135-137	726 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 8.83 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 8.16 - 8.00 (m, 4H), 7.64 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 6.84 (dd, *J* = 36.0, 10.4 Hz, 1H), 5.25 - 5.20 (m, 1H), 4.78 - 4.70 (m, 2H), 4.58 - 4.51 (m, 1H), 3.59 - 3.31 (m, 2H), 1.31 (d, *J* = 7.2 Hz, 3H)	
F26	112-114	711 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 8.87 - 8.76 (m, 1H), 8.13 (s, 1H), 8.07 - 8.00 (m, 3H), 7.65 - 7.58 (m, 1H), 6.86 (dd, *J* = 35.7, 9.9 Hz, 1H), 5.26 - 5.19 (m, 1H), 4.42 - 4.35 (m, 1H), 4.11 - 3.99 (m, 2H), 3.22 - 3.04 (m, 2H), 1.30 (d, *J* = 6.6 Hz, 3H)	

F27		633 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 8.87 - 8.76 (m, 1H), 8.14 (s, 1H), 8.07 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 7.81 (s, 2H), 7.68 - 7.64 (m, 1H), 7.62 - 7.58 (m, 1H), 6.82 (dd, *J* = 35.6, 10.0 Hz, 1H), 5.23 - 5.18 (m, 1H), 4.92 - 4.82 (m, 1H), 4.14 - 3.95 (m, 2H), 3.22 -3.02 (m, 2H), 1.31 - 1.28 (m, 3H)	**IR** (película delgada) 3428, 2925, 1651, 1117 cm^{-1}
F28		632 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 8.86 - 8.76 (m, 1H), 8.13 (s, 1H), 8.06 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 7.99 (s, 1H), 7.74 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 7.67 - 7.58 (m, 2H), 6.83 (dd, *J* = 36.6, 10.4 Hz, 1H), 5.20 - 5.15 (m, 1H), 4.39 - 4.38 (m, 1H), 4.11 - 3.98 (m, 2H), 3.19 - 3.05 (m, 2H), 1.23 - 1.18 (m, 3H)	**IR** (película delgada) 3276, 2925, 1651, 816 cm^{-1}
F29	138-141	666 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 8.83 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 8.12 (s, 1H), 8.07 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 8.00 (s, 2H), 7.64 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 6.83 (dd, *J* = 35.6, 10.4 Hz, 1H), 5.24 - 5.23 (m, 1H), 4.78 - 4.70 (m, 2H), 4.56 - 4.53 (m, 1H), 3.59 - 3.46 (m, 2H), 1.31 (d, *J* = 6.4 Hz, 3H)	
F30		702 ($[M-H]^-$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 8.61 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 8.12 (s, 1H), 8.06 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 7.96 (s, 2H), 7.91 - 7.90 (m, 1H), 7.60 (d, *J* = 7.6 Hz, 1H), 6.85 (dd, *J* = 36.0, 10.0 Hz, 1H), 5.21 - 5.20 (m, 1H), 4.11 - 4.08 (m, 1H), 3.57 - 3.50 (m, 2H), 2.85 - 2.77 (m, 2H), 1.20 (d, *J* = 6.4 Hz, 3H)	**IR** (película delgada) 3430, 2927, 1645, 1260, 748 cm^{-1}

F31		720 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 8.87 (dd, *J* = 8.4, 7.8 Hz, 1H), 8.13 (s, 1H), 8.07 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.96 (s, 2H), 7.90 (s, 1H), 7.64 - 7.58 (m, 1H), 6.87 (dd, *J* = 36.0, 9.9 Hz, 1H), 5.22 - 5.20 (m, 1H), 4.42 - 4.37 (m, 1H), 4.11 - 3.99 (m, 2H), 3.19 - 3.08 (m, 2H), 1.31 (d, *J* = 3.0 Hz, 3H)	**IR** (película delgada) 3277, 2926, 1651, 1135, 646 cm^{-1}
F32	70-72	642 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.85 (s, 1H), 7.79 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 7.62 (d, *J* = 7.6 Hz, 1H), 7.42 (s, 1H), 7.37 (s, 1H), 6.72 - 6.62 (dd, *J* = 17.6, 11.6 Hz, 1H), 5.86 - 5.76 (m, 3H), 4.62 - 4.57 (m, 1H), 4.22 - 4.38 (m, 1H), 3.19 - 3.14 (m, 2H), 2.91 - 2.88 (m, 2H), 1.35 (d, *J* = 6.8 Hz, 3H)	
F33	125-128	674 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.86 (s, 1H), 7.79 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 7.66 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 7.41 (s, 1H), 7.37 (s, 1H), 6.71 - 6.63 (dd, *J* = 17.6, 11.6 Hz, 1H), 6.12 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 5.87 - 5.74 (m, 2H), 4.73 - 4.69 (m, 1H), 4.61 - 4.57 (m, 1H), 4.12 - 3.93 (m, 2H), 3.56 - 3.49 (m, 1H), 3.44 - 3.39 (m, 1H), 1.56 (d, *J* =6.8 Hz, 3H)	
F34	88-90	658 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7.85 (s, 1H), 7.80 (d, *J* = 7.8 Hz, 1H), 7.60 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.42 (s, 1H), 7.36 (s, 1H), 6.79 - 6.76 (m, 1H), 6.14 - 6.12 (m, 1H), 5.89 - 5.74 (m, 2H), 4.66 - 4.56 (m, 2H), 3.57 - 3.51 (m, 2H), 3.27 - 3.13 (m, 2H), 1.52 (d, *J* = 6.9 Hz, 3H)	

F35		642 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 8.83 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 8.09 (s, 1H), 8.07 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 7.63 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.44 (s, 2H), 6.78 (dd, *J* = 35.7, 9.9 Hz, 1H), 4.95 - 4.89 (m, 1H), 4.79 - 4.69 (m, 2H), 4.56 - 4.51 (m, 1H), 3.60 - 3.53 (m, 2H), 2.35 (s, 6H), 1.31 (d, *J* = 7.2 Hz, 3H)	**IR** (película delgada) 3278, 2929, 1654, 854 cm^{-1}
F36		635 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 8.61 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 8.11 (s, 1H), 8.05 (d, *J* = 8.4 Hz, 2H), 8.00 (d, *J* = 6.3 Hz, 1H), 7.61 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 6.85 (dd, *J* = 36.0, 10.2 Hz, 1H), 5.24 - 5.23 (m, 1H), 4.12 - 4.07 (m, 1H), 3.58 - 3.48 (m, 2H), 2.82 - 2.80 (m, 2H), 1.28 (d, *J* = 7.5 Hz, 3H)	**IR** (película delgada) 3433, 2926, 1651, 1261, 750 cm^{-1}
F37		650 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 8.87 (dd, *J* = 8.1, 8.1 Hz, 1H), 8.13 (s, 1H), 8.07 (d, *J* = 7.8 Hz, 1H), 8.01 (d, *J* = 6.6 Hz, 2H), 7.61 - 7.58 (m, 1H), 6.85 (dd, *J* = 36.0, 10.2 Hz, 1H), 5.25 - 5.24 (m, 1H), 4.40 - 4.38 (m, 1H), 4.10 - 3.99 (m, 2H), 3.16 - 3.08 (m, 2H), 1.31 (d, *J* = 3.3 Hz, 3H)	**IR** (película delgada) 3271, 2926, 1652, 1140 cm^{-1}

F38		694 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.78 (d, *J* = 1.8 Hz, 1H), 7.70 (dt, *J* = 9.4, 2.5 Hz, 1H), 7.55 (dd, *J* = 8.1, 4.4 Hz, 1H), 7.42 (d, *J* = 4.6 Hz, 2H), 6.44 (dd, *J* = 8.3, 3.6 Hz, 1H), 5.89 (ddd, *J* = 33.9, 9.7, 2.0 Hz, 1H), 4.68 (tdd, *J* = 8.7, 6.9, 3.4 Hz, 1H), 4.30 (td, *J* = 14.6, 9.8 Hz, 1H), 4.10 (dq, *J* = 15.5, 9.1 Hz, 1H), 3.97 (dq, *J* = 15.5, 9.3 Hz, 1H), 3.54 (ddd, *J* = 14.5, 6.7, 1.7 Hz, 1H), 3.38 (ddd, *J* = 14.4, 5.0, 1.7 Hz, 1H), 2.01 - 1.79 (m, 2H), 1.50 (dd, *J* = 6.9, 1.8 Hz, 3H), 1.07 (t, *J* = 7.4 Hz, 3H)	**^{19}F NMR** (471 MHz, $CDCl_3$) δ 58.99, -61.11, -102.40 − -107.19 (m), -114.95
F39		663 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.81 (d, *J* = 1.9 Hz, 1H), 7.72 (ddd, *J* = 5.9, 4.3, 1.6 Hz, 1H), 7.54 (dd, *J* = 8.2, 4.6 Hz, 1H), 7.42 (d, *J* = 4.3 Hz, 2H), 5.99 - 5.80 (m, 2H), 4.44 - 4.23 (m, 2H), 3.23 - 3.09 (m, 2H), 2.97 - 2.81 (m, 2H), 1.97 - 1.78 (m, 2H), 1.32 (dd, *J* = 6.7, 1.4 Hz, 3H), 1.07 (t, *J* = 7.5 Hz, 3H)	**^{19}F NMR** (471 MHz, $CDCl_3$) δ -58.94, -66.49, -102.19 − -107.72 (m), -114.99
F40		650 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 8.55 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 8.11 (s, 1H), 8.05 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 7.96 (s, 2H), 7.91 - 7.90 (m, 1H), 7.61 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 6.84 (dd, *J* = 35.6, 10.4 Hz, 1H), 5.21 - 5.20 (m, 1H), 4.06 - 4.02 (m, 1H), 2.71 - 2.66 (m, 1H), 2.58 - 2.49 (m, 3H), 1.27 - 1.18 (m, 6H)	**IR** (película delgada) 3434, 2997, 1659 cm^{-1}

F41		578 ($[M-H]^-$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 8.55 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 8.11 (s, 1H), 8.04 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 8.00 - 7.99 (m, 2H), 7.61 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 6.83 (dd, *J* = 36.0, 10.4 Hz, 1H), 5.24 - 5.23 (m, 1H), 4.08 - 4.00 (m, 1H), 2.71 - 2.66 (m, 1H), 2.58 - 2.49 (m, 3H), 1.26 - 1.17 (m, 6H)	**IR** (película delgada) 3432, 1654, 1033, 749 cm^{-1}
F42		680 ($[M-H]^-$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 8.73 (d, *J* = 7.6 Hz, 1H), 8.12 (s, 1H), 8.06 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 7.95 (s, 2H), 7.90 - 7.89 (m, 1H), 7.65 (d, *J* = 7.6 Hz, 1H), 6.83 (dd, *J* = 15.6, 10.4 Hz, 1H), 5.20 - 5.19 (m, 1H), 4.50 - 4.43 (m, 1H), 3.34 - 3.33 (m, 1H), 3.29 - 3.26 (m, 1H), 3.17 - 3.12 (m, 2H), 1.29 - 1.22 (m, 6H)	**IR** (película delgada) 3435, 2997, 1660, 1031 cm^{-1}
F43		610 ($[M-H]^-$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 8.73 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 8.11 (s, 1H), 8.06 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 7.99 (d, *J*= 6.4 Hz, 2H), 7.66 (dd, *J* = 7.6 Hz, 1H), 6.82 (dd, *J* = 35.6, 10.4 Hz, 1H), 5.23 - 5.22 (m, 1H), 4.48 - 4.44 (m, 1H), 3.38 - 3.33 (m, 1H), 3.28 - 3.23 (m, 1H), 3.17 - 3.12 (m, 2H), 1.29 - 1.22 (m, 6H)	**IR** (película delgada) 3422, 2926, 1650, 749 cm^{-1}
F44		624 ($[M-H]^-$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 8.86 (dd, *J* = 32.8, 8.0 Hz, 1H), 8.10 (s, 1H), 8.06 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 7.63 - 7.57 (m, 1H), 7.45 (s, 2H), 6.76 (dd, *J* = 36.4, 10.4 Hz, 1H), 4.90 - 4.84 (m, 1H), 4.41 - 4.36 (m, 1H), 4.14 - 3.99 (m, 2H), 3.22 - 3.04 (m, 2H), 2.49 (s, 6H), 1.33 - 1.24 (m, 6H)	IR (película delgada) 3432, 2926, 1651 cm^{-1}

F45		592 ($[M-H]^-$)	^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 8.75 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 8.13 (s, 1H), 8.07 (d, *J* = 7.5 Hz, 1H), 7.81 (s, 2H), 7.69 - 7.63 (m, 2H), 6.86 (dd, *J* = 36.0, 10.2 Hz, 1H), 5.24 - 5.13 (m, 1H), 4.49 - 4.43 (m, 1H), 3.41 - 3.34 (m, 2H), 3.24 - 3.13 (m, 2H), 1.29 - 1.21 (m, 6H)	**IR** (película delgada) 3442, 2922, 1650, 749 cm^{-1}
F46		608 ($[M-H]^-$)	^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 8.75 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 8.12 (s, 1H), 8.06 (d, *J* = 7.5 Hz, 1H), 7.99 (s, 1H), 7.75 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 7.68 - 7.63 (m, 2H), 6.85 (dd, *J* = 35.7, 9.9 Hz, 1H), 5.19 - 5.14 (m, 1H), 4.49 - 4.43 (m, 1H), 3.34 - 3.27 (m, 2H), 3.18 - 3.14 (m, 2H), 1.29 -1.21 (m, 6H)	**IR** (película delgada) 3433, 2922, 1645 cm^{-1}
F47		587 ($[M-H]^-$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.85 (s, 1H), 7.78 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 7.64 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 7.42 (s, 1H), 7.37 (s, 1H), 6.72 - 6.65 (dd, *J* = 17.6, 11.6 Hz, 1H), 5.91 - 5.84 (m, 2H), 5.79 - 5.73 (m, 1H), 4.61 - 4.57 (m, 1H), 4.40 - 4.37 (m, 1H), 2.82 - 2.62 (m, 2H), 2.62 (q, *J* = 8.0 Hz, 2H), 1.29 - 1.25 (m, 6H)	**IR** (película delgada) 3421, 2925, 1643, 1260, 1119, 764 cm^{-1}
F48		638 ($[M-H]^-$)	^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 8.55 (d, *J* = 7.8 Hz, 1H), 8.11 (s, 1H), 8.05 - 8.00 (m, 3H), 7.61 (d, *J* = 7.8 Hz, 1H), 6.87 (dd, *J* = 36.0, 10.2 Hz, 1H), 5.25 - 5.22 (m, 1H), 4.06 - 4.02 (m, 1H), 2.59 - 2.49 (m, 4H), 1.22 (m, 6H)	**IR** (película delgada) 3426, 1651 cm^{-1}

F49		668 ($[M-H]^-$)	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 8.96 (t, *J* = 5.7 Hz, 1H), 8.13 - 8.11 (m, 1H), 8.09 - 8.03 (m, 3H), 7.65 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 6.80 (dd, *J* = 35.7, 10.1 Hz, 1H), 5.25 (p, *J* = 9.4 Hz, 1H), 4.20 - 3.97 (m, 2H), 3.77 - 3.57 (m, 2H), 3.26 - 3.11 (m, 2H)	**^{19}F NMR** (471 MHz, DMSO-d_6) δ -57.98, -59.75 (t, *J* = 11.1 Hz), -68.58 (d, *J* = 9.0 Hz), -113.70 (d, *J* = 35.8 Hz)
F50		652 ($[M-H]^-$)	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 8.97 (t, *J* = 5.7 Hz, 1H), 8.13 (d, *J* = 1.8 Hz, 1H), 8.07 (dd, *J* = 8.2, 1.8 Hz, 1H), 8.05 (s, 2H), 7.65 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 6.80 (dd, *J* = 35.7, 10.1 Hz, 1H), 5.25 (p, *J* = 9.4 Hz, 1H), 4.24 - 3.95 (m, 2H), 3.78 - 3.54 (m, 2H), 3.27 - 3.11 (m, 2H)	**^{19}F NMR** (471 MHz, DMSO-d_6) δ -57.99, -59.76 (t, *J* = 11.0 Hz), -68.59 (d, *J* = 9.1 Hz), -113.71 (d, *J* = 35.8 Hz)
F51		636 ($[M-H]^-$)	^{1}H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 7.86 (d, *J* = 1.7 Hz, 1H), 7.78 (dd, *J* = 8.1, 1.7 Hz, 1H), 7.60 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 7.44 (s, 2H), 6.16 (t, *J* = 6.0 Hz, 1H), 5.82 (dd, *J* = 32.5, 9.6 Hz, 1H), 4.61 (p, *J* = 8.9 Hz, 1H), 3.68 (q, *J* = 6.3 Hz, 2H), 3.14 (q, *J* = 9.8 Hz, 2H), 2.93 (t, *J* = 6.4 Hz, 2H)	**^{19}F NMR** (471 MHz, $CDCl_3$) δ -59.13, -66.46 (t, *J* = 9.8 Hz), -69.33 (dd, *J* = 8.5, 2.1 Hz), -111.95 (d, *J* = 32.6 Hz)
F52		610 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 8.60 (d, *J* = 7.8 Hz, 1H), 8.08 (s, 1H), 8.05 (d, *J* = 9.6 Hz, 1H), 7.59 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.45 (s, 2H), 6.78 (dd, *J* = 36.0, 10.2 Hz, 1H), 4.95 - 4.89 (m, 1H), 4.14 - 4.04 (m, 1H), 3.58 - 3.47 (m, 2H), 2.86 - 2.80 (m, 2H), 2.35 (s, 6H), 1.23 - 1.07 (m, 3H)	**IR** (película delgada) 3429, 2926, 1645 cm^{-1}

F53		588 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 8.75 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 8.09 (s, 1H), 8.06 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 7.65 (d, *J* = 7.8 Hz, 1H), 7.45 (s, 2H), 6.78 (dd, *J* = 36.0, 9.9 Hz, 1H), 4.95 - 4.89 (m, 1H), 4.49 - 4.46 (m, 1H), 3.38 - 3.36 (m, 1H), 3.31 - 3.24 (m, 1H), 3.18 - 3.13 (m, 2H), 2.35 (s, 6H), 1.29 - 1.26 (m, 6H)	**IR** (película delgada) 3286, 2928, 1651, 1130 cm^{-1}
F54		734 ($[M-H]^-$)	^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 8.83 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 8.13 (s, 1H), 8.09 (d, *J* = 9.9 Hz, 2H), 7.86 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 7.63 (d, *J* = 7.8 Hz, 2H), 6.85 (dd, *J* = 36.0, 9.9 Hz, 1H), 5.19 - 5.18 (m, 1H), 4.79 - 4.69 (m, 2H), 4.56 - 4.52 (m, 1H), 3.60 - 3.47 (m, 2H), 1.31 (d, *J* =6.6 Hz, 3H)	**IR** (película delgada) 3274, 2931, 1655, 1127 cm^{-1}
F55		684 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 8.55 (d, *J* = 7.6 Hz, 1H), 8.19 - 8.17 (m, 2H), 8.11 (s, 1H), 8.05 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 7.61 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 6.84 (dd, *J* = 35.6, 10.4 Hz, 1H), 5.24 - 5.19 (m, 1H), 4.06 - 4.02 (m, 1H), 2.59 - 2.49 (m, 4H), 1.26 - 1.18 (m, 6H)	**IR** (película delgada) 3417, 1651 cm^{-1}
F56		716 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 8.75 (d, *J* = 6.9 Hz, 1H), 8.17 - 8.04 (m, 4H), 7.66 (d, *J* = 8.10 Hz, 1H), 6.87 (dd, *J* = 35.4, 10.5 Hz, 1H), 5.22 - 5.19 (m, 1H), 4.46 - 4.35 (m, 1H), 3.31 - 3.14 (m, 4H), 1.27 - 1.24 (m, 6H)	**IR** (película delgada) 3422, 1650, 1260, 749 cm^{-1}

F57		613 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.75 (d, *J* = 7.9 Hz, 1H), 7.58 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.48 (d, *J* = 2.1 Hz, 1H), 7.45 (d, *J* = 8.3 Hz, 1H), 7.23 (dd, *J* = 8.3, 2.1 Hz, 1H), 5.92 (dd, *J* = 34.0, 9.8 Hz, 1H), 5.79 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 4.46 - 4.23 (m, 2H), 3.29 - 3.04 (m, 2H), 2.98 - 2.79 (m, 2H), 1.62 (t, *J* = 18.4 Hz, 3H), 1.35 (dd, *J* = 6.7, 1.8 Hz, 3H)	**^{19}F NMR** (376 MHz, $CDCl_3$) δ -58.93, -66.49, -92.40 – -97.99 (m), -115.38
F58			^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.75 (d, *J* = 1.4 Hz, 1H), 7.68 - 7.35 (m, 4H), 7.28 - 7.20 (m, 1H), 6.12 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 5.78 (dd, *J* = 32.8, 9.6 Hz, 1H), 4.61 (p, *J* = 9.1 Hz, 1H), 4.40 (dq, *J* = 8.0, 6.2 Hz, 1H), 3.29 - 3.08 (m, 2H), 2.92 (d, *J* = 6.0 Hz, 2H), 1.37 (d, *J* = 6.7 Hz, 3H)	**^{19}F NMR** (376 MHz, $CDCl_3$) δ -66.44, -69.48 , -108.63 − -115.35 (m)
F59		560 ($[M-H]^-$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 8.55 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 8.12 (s, 1H), 8.05 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 7.81 (s, 2H), 7.68 (t, *J* = 3.6 Hz, 1H), 7.61 (d, *J* = 7.6 Hz, 1H), 6.84 (dd, *J* = 35.6, 10.0 Hz, 1H), 5.23 - 5.08 (m, 1H), 4.11 - 4.08 (m, 1H), 2.68 - 2.65 (m, 1H), 2.45 - 2.39 (m, 3H), 1.23 - 1.09 (m, 6H)	**IR** (película delgada) 3416, 1648, 1122 cm^{-1}
F60		560 ($[M-H]^-$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 8.55 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 8.04 - 8.00 (m, 2H), 7.74 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 7.68 - 7.65 (m, 1H), 7.60 (d, *J* = 7.6 Hz, 1H), 6.82 (dd, *J* = 36.0, 10.0 Hz, 1H), 5.20 - 5.18 (m, 1H), 4.08 - 4.01 (m, 1H), 2.71 - 2.58 (m, 1H), 2.56 - 2.49 (m, 3H), 1.63 - 1.14 (m, 6H)	**IR** (película delgada) 3435, 2925. 1643, 750 cm^{-1}

F61		556 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 8.55 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 8.07 (s, 1H), 8.04 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 7.06 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 7.45 (s, 2H), 6.74 (dd, *J* = 36.3, 10.2 Hz, 1H), 4.95 - 4.89 (m, 1H), 4.06 - 4.02 (m, 1H), 2.72 - 2.65 (m, 2H), 2.59 - 2.54 (m, 2H), 2.35 (s, 6H), 1.23 - 1.17 (m, 6H)	**IR** (película delgada) 3415, 2929, 1645, 749 cm^{-1}
F62		702 ($[M-H]^-$)	^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 8.61 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 8.12 (d, *J* = 6.6 Hz, 2H), 8.05 (d, *J* = 7.8 Hz, 1H), 7.86 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 7.62 - 7.57 (m ,2H), 6.84 (dd, *J* = 36.0, 9.9 Hz, 1H), 5.19 - 5.18 (m, 1H), 4.14 - 4.07 (m, 1H), 3.58 - 3.48 (m, 2H), 2.86 - 2.72 (m, 2H), 1.21 (d, *J* = 7.2 Hz, 3H)	**IR** (película delgada) 3438, 2926, 1646, 1261, 750 cm^{-1}
F63		670 ($[M-H]^-$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 8.75 (d, *J* = 7.6 Hz, 1H), 8.12 (s, 1H), 8.06 (d, *J* = 9.2 Hz, 1H), 8.00 (s, 2H), 7.66 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 6.84 (dd, *J* = 36.0, 10.0 Hz, 1H), 5.25 - 5.20 (m, 1H), 4.46 - 4.40 (m, 1H), 3.38 - 3.34 (m, 2H), 3.17 - 3.12 (m, 2H), 1.29 - 1.22 (m, 6H)	**IR** (película delgada) 3426, 1651 cm^{-1}
F64		660 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 8.61 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 8.12 (s, 1H), 8.06 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.93 (s, 1H), 7.84 (s, 1H), 7.79 (s, 1H), 7.60 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 6.86 (dd, *J* = 35.4, 10.2 Hz, 1H), 5.23 - 5.16 (m, 1H), 4.12 - 4.07 (m, 1H), 3.59 - 3.48 (m, 2H), 2.82 - 2.79 (m, 2H), 1.23 (d, *J* = 7.2 Hz, 3H)	**IR** (película delgada) 3266, 2928, 1644, 1121 cm^{-1}

F65	142-146	692 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 8.84 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 8.13 (s, 1H), 8.08 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.93 (s, 1H), 7.84 (s, 1H), 7.79 (s, 1H), 7.64 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 6.87 (dd, *J* = 36.0, 10.2 Hz, 1H), 5.23 - 5.17 (m, 1H), 4.79 - 4.69 (m, 2H), 4.56 - 4.52 (m, 1H), 3.58-3.31 (m, 2H), 1.31 (d, *J* = 6.6 Hz, 3H)	
F66		644 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.82 - 7.66 (m, 1H), 7.56 - 7.43 (m, 4H), 7.24 (dd, *J* = 8.3, 2.3 Hz, 1H), 6.90 (d, *J* = 7.9 Hz, 1H), 5.79 (dtd, *J* = 32.8, 9.5, 5.9 Hz, 1H), 4.76 - 4.50 (m, 2H), 3.74 (dq, *J* = 14.2, 10.0 Hz, 1H), 3.63 - 3.45 (m, 1H), 3.23 (pd, *J* = 13.4, 6.4 Hz, 2H), 1.53 (d, *J* = 6.8 Hz, 3H)	**^{19}F NMR** (376 MHz, $CDCl_3$) δ -60.60 (d, *J* = 77.7 Hz), -69.49 (dd, *J* = 6.4, 2.3 Hz), -112.69 (d, *J* = 37.8 Hz)
F67			^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.73 (d, *J* = 1.5 Hz, 1H), 7.54 - 7.43 (m, 4H), 7.24 (dd, *J* = 8.4, 2.3 Hz, 1H), 6.47 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 5.79 (dd, *J* = 32.8, 9.8 Hz, 1H), 4.80 - 4.46 (m, 2H), 4.24 - 3.84 (m, 2H), 3.57 (dd, *J* = 14.6, 6.2 Hz, 1H), 3.40 (dd, *J* = 14.6, 5.3 Hz, 1H), 1.55 (d, *J* = 6.9 Hz, 3H)	**^{19}F NMR** (376 MHz, $CDCl_3$) δ -61.05, -69.50 , -110.35 - -115.88 (m); **IR** (película delgada) 3323, 1649, 1116, 728 cm^{-1}

F68		676 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 8.87 (dd, *J* = 33.2, 7.6 Hz, 1H), 8.13 (s, 1H), 8.07 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 7.93 (s, 1H), 7.84 (s, 1H), 7.80 - 7.79 (m, 1H), 7.64 - 7.58 (m, 1H), 6.85 (dd, *J* = 36.4, 10.4 Hz, 1H), 5.22 - 5.17 (m, 1H), 4.42 - 4.38 (m, 1H), 4.13 - 3.95 (m, 2H), 3.23 - 3.05 (m, 2H), 1.31 (d, *J* = 6.9 Hz, 3H)	**IR** (película delgada) 3395, 2927, 1651, 1139 cm^{-1}
F69	114-116	736 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 8.83 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 8.13 (s, 1H), 8.08 (d, *J* = 7.6 Hz, 1H), 7.96 (s, 2H), 7.91 - 7.90 (m, 1H), 7.63 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 6.85 (dd, *J* = 10.0, 36.0 Hz, 1H), 5.21 (t, *J* = 9.6 Hz, 1H), 4.78 - 4.70 (m, 2H), 4.58 - 4.51 (m, 1H), 3.59 - 3.48 (m, 2H), 1.31 (d, *J* = 2.4 Hz, 3H)	
F70		696 ($[M-H]^-$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.84 (d, *J* = 6.8 Hz, 1H), 7.78 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.63 (d, *J* = 11.6 Hz, 3H), 6.95 (t, *J* = 54.6 Hz, 1H), 6.40 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 5.88 (dd, *J* = 32.6, 9.5 Hz, 1H), 4.70 (p, *J* = 8.6 Hz, 2H), 4.12 (ddd, *J* = 14.2, 8.2, 5.2 Hz, 1H), 3.97 (dt, *J* = 15.5, 9.2 Hz, 1H), 3.54 (dd, *J* = 14.5, 6.7 Hz, 1H), 3.41 (dd, *J* = 14.6, 4.9 Hz, 1H), 1.53 (d, *J* = 6.9 Hz, 3H)	**^{19}F NMR** (376 MHz, $CDCl_3$) δ -59.12, -61.15 , -69.43 (d, *J* = 18.3 Hz), -108.40 – -113.63 (m), -115.94 (d, *J* = 114.6 Hz)

F71		697 ($[M-H]^-$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.80 (d, *J* = 1.6 Hz, 1H), 7.73 (dd, *J* = 8.1, 1.7 Hz, 1H), 7.59 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.54 (s, 1H), 7.44 (dd, *J* = 8.9, 2.0 Hz, 1H), 6.42 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 5.86 (dd, *J* = 32.5, 9.5 Hz, 1H), 4.84 – 4.47 (m, 2H), 4.19 – 3.84 (m, 2H), 3.53 (dd, *J* = 14.5, 6.8 Hz, 1H), 3.39 (dd, *J* = 14.5, 4.9 Hz, 1H), 1.50 (d, *J* = 6.9 Hz, 3H)	**^{19}F NMR** (376 MHz, $CDCl_3$) δ -59.20, -61.17, -62.56, -69.48, -109.49, -111.60
F72		682 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 8.84 (d, *J* = 9.0 Hz, 1H), 8.13 (s, 1H), 8.05 (s, 1H), 8.04 (s, 2H), 7.64 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 6.85 (dd, *J* = 9.9, 35.4 Hz, 1H), 5.27 - 5.21 (m, 1H), 4.79 - 4.69 (m, 2H), 4.57 - 4.51 (m, 1H), 3.61 - 3.31 (m, 2H), 1.31 (d, *J* = 6.6 Hz, 3H)	
F73		673 ($[M-H]^-$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.85 (d, *J* = 1.7 Hz, 1H), 7.77 (dd, *J* = 8.0, 1.7 Hz, 1H), 7.63 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.47 - 7.42 (m, 2H), 7.09 (dd, *J* = 17.5, 11.0 Hz, 1H), 6.22 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 5.86 (dd, *J* = 32.7, 9.7 Hz, 1H), 5.80 (s, 1H), 5.47 (dd, *J* = 18.2, 11.0 Hz, 1H), 4.81 - 4.53 (m, 2H), 4.20 - 3.89 (m, 2H), 3.54 (dd, *J* = 14.5, 6.5 Hz, 1H), 3.41 (dd, *J* = 14.5, 5.0 Hz, 1H), 1.54 (d, *J* = 6.9 Hz, 3H)	**^{19}F NMR** (376 MHz, $CDCl_3$) δ -59.05, -61.13 , -67.37 – -70.21 (m), -110.35 – -113.11 (m)

F75		HRMS-ESI (*m/z*) $[M+H]^+$ calculado para $C_{22}H_{17}Cl_3F_7NOS$, 584.0030; encontrado, 584.0028	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.85 (s, 1H), 7.77 (dd, *J* = 8.2, 1.7 Hz, 1H), 7.62 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.43 (s, 2H), 5.94 – 5.66 (m, 2H), 4.60 (p, *J* = 8.8 Hz, 1H), 4.47 – 4.31 (m, 1H), 2.81 – 2.64 (m, 2H), 2.17 (s, 3H), 1.35 (d, *J* = 6.7 Hz, 3H)	**IR** (película delgada) 3253, 3064, 2974, 1646, 1552 cm^{-1}
F77		666 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 8.82 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 8.13 (s, 2H), 8.08 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.65 - 7.57 (m, 2H), 6.88 (dd, *J* = 10.0, 35.6 Hz, 1H), 5.33 - 5.29 (m, 1H), 4.77 - 4.70 (m, 2H), 4.55 - 4.52 (m, 1H), 3.59 - 3.55 (m, 2H), 1.31 (d, *J* = 6.9 Hz, 3H)	IR(película delgada) 3691, 1657, 1170 cm^{-1}
F78		662 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 8.83 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 8.11 (s, 1H), 8.08 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.83 (s, 1H), 7.64 (s, 1H), 7.61 (s, 1H), 6.82 (dd, *J* = 9.9, 36.0 Hz, 1H), 5.12 - 5.06 (m, 1H), 4.79 - 4.69 (m, 2H), 4.56 - 4.53 (m, 1H), 3.60 - 3.53 (m, 2H), 2.42 (s, 3H), 1.31 (d, *J* = 6.9 Hz, 3H)	**IR**(película delgada) 3285, 2949, 1656 cm^{-1}
F79		692 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 8.83 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 8.13 - 8.06 (m, 3H), 7.73 - 7.68 (m, 2H), 7.63 (d, *J* = 7.6 Hz, 1H), 6.83 (dd, *J* = 10.0, 36.0 Hz, 1H), 5.20 - 5.15 (m, 1H), 4.78 - 4.70 (m, 2H), 4.56 - 4.52 (m, 1H), 3.59 - 3.46 (m, 2H), 1.31 (d, *J* = 6.4 Hz, 3H)	**IR** (película delgada) 3274, 1654, 1127 cm^{-1}

F80		726 ($[M-H]^-$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.83 (d, *J* = 1.6 Hz, 1H), 7.80 (s, 1H), 7.69 - 7.55 (m, 2H), 7.48 (d, *J* = 2.1 Hz, 1H), 6.42 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 5.96 - 5.74 (m, 1H), 4.79 - 4.52 (m, 2H), 4.07 - 3.84 (m, 2H), 3.54 (dd, *J* = 14.5, 6.8 Hz, 1H), 3.49 - 3.33 (m, 1H), 1.51 (d, *J* = 6.9 Hz, 3H)	**^{19}F NMR** (376 MHz, $CDCl_3$) δ -59.11, -61.12 , -69.33 (d, *J* = 1.9 Hz), -112.01 (d, *J* = 21.1 Hz)
F81	133-136	682 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 8.80 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 8.17 (d, *J* = 9.3 Hz, 1H), 8.09 - 8.07 (m, 3H), 7.94 (s, 1H), 7.64 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 6.94 (dd, *J* = 10.2 Hz, 35.1 Hz, 1H), 5.39 - 5.33 (m, 1H), 4.79 (q, *J* = 10.5 Hz, 2H), 4.57 - 4.52 (m, 1H), 3.58 - 3.31 (m, 2H) 1.31 (d, *J* = 6.9 Hz, 3H)	
F82		HRMS-ESI (*m/z*) $[M+H]^+$ calculado para $C_{23}H_{17}Cl_3F_9NOS$, 633.9999; encontrado, 633.9996	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.85 (s, 1H), 7.80 – 7.74 (m, 1H), 7.62 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.43 (s, 2H), 6.10 – 5.73 (m, 3H), 4.60 (p, *J* = 8.8 Hz, 1H), 4.39 (dt, *J* = 13.5, 6.5 Hz, 1H), 3.00 – 2.79 (m, 4H), 1.34 (d, *J* = 6.7 Hz, 3H)	**IR** (película delgada) 3262, 2977, 1643 cm^{-1}
F83		HRMS-ESI (*m/z*) $[M+H]^+$ calculado para $C_{23}H_{16}Cl_3F_7N_2OS$, 608.9983; encontrado, 608.9987	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.87 - 7.82 (m, 1H), 7.76 (dd, *J* = 8.0, 1.8 Hz, 1H), 7.61 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.44 (s, 2H), 5.92 - 5.74 (m, 2H), 4.61 (p, *J* = 8.8 Hz, 1H), 4.43 (dtd, *J* = 8.5, 6.9, 5.6 Hz, 1H), 3.58 - 3.29 (m, 2H), 3.04 - 2.84 (m, 2H), 1.38 (d, *J* = 6.7 Hz, 3H)	**IR** (película delgada) 3275, 3077, 2976, 2246, 1647, 1553 cm^{-1}

F84		HRMS-ESI (*m/z*) $[M+H]^+$ calculado para $C_{23}H_{18}Cl_3F_8NOS$, 616.0093; encontrado, 616.0102	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 8.57 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 8.12 (s, 1H), 8.05 (s, 3H), 7.61 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 6.79 (dd, *J* = 35.8, 10.1 Hz, 1H), 5.24 (p, *J* = 9.4 Hz, 1H), 4.57 (dtd, *J* = 47.3, 6.3, 2.0 Hz, 2H), 4.06 (dt, *J* = 14.4, 7.0 Hz, 1H), 2.87 (dtd, *J* = 21.9, 6.3, 2.0 Hz, 2H), 2.69 (qd, *J* = 13.4, 7.0 Hz, 2H), 1.19 (d, *J* = 6.7 Hz, 3H)	**^{19}F NMR** (471 MHz, DMSO-d_6) δ -57.94, -68.58 (d, *J* = 9.2 Hz), -113.62 (d, *J* = 35.7 Hz), -211.62 – -212.00 (m); **IR** (película delgada) 1645, 1552 cm^{-1}
F85		HRMS-ESI (*m/z*) $[M+H]^+$ calculado para $C_{23}H_{18}Cl_3F_8NO_3S$, 647.9991; encontrado, 647.9996	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.87 - 7.83 (m, 1H), 7.77 (dd, *J* = 8.1, 1.7 Hz, 1H), 7.66 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.43 (s, 2H), 6.30 (d, *J* = 8.3 Hz, 1H), 5.82 (dd, *J* = 32.6, 9.6 Hz, 1H), 4.98 (ddd, *J* = 5.4, 3.8, 1.7 Hz, 1H), 4.86 (ddd, *J* = 5.4, 3.9, 1.6 Hz, 1H), 4.75 (ddd, *J* = 13.3, 9.4, 5.9 Hz, 1H), 4.60 (p, *J* = 8.9 Hz, 1H), 3.58 (dddd, *J* = 23.8, 15.6, 6.5, 4.2 Hz, 1H), 3.46 - 3.30 (m, 3H), 1.53 (d, *J* = 6.9 Hz, 3H)	**^{19}F NMR** (376 MHz, $CDCl_3$) δ 17.23, -59.10 , -69.33 (d, *J* = 2.2 Hz), -111.89 (d, *J* = 2.5 Hz)
F86		650 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 8.90 - 8.68 (m, 1H), 8.15 - 8.01 (m, 4H), 7.63 (dd, *J* = 23.2, 8.0 Hz, 1H), 6.79 (dd, *J* = 35.7, 10.1 Hz, 1H), 6.60 - 6.28 (m, 1H), 5.25 (p, *J* = 9.4 Hz, 1H), 4.39 (dq, *J* = 13.5, 6.8 Hz, 1H), 3.69 - 3.40 (m, 2H), 3.16 - 2.99 (m, 2H), 1.32 - 1.26 (m, 3H)	**IR** (película delgada) 3245, 3060, 1659, 1552 cm^{-1}

F87		HRMS-ESI (*m/z*) $[M+H]^+$ calculado para $C_{22}H_{17}Cl_3F_7NO_3S$, 615.9929; encontrado, 615.9928	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 8.75 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 8.14 – 8.11 (m, 1H), 8.08 – 8.03 (m, 3H), 7.66 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 6.79 (dd, *J* = 35.7, 10.1 Hz, 1H), 5.25 (p, *J* = 9.1 Hz, 1H), 4.48 (hept, *J* = 6.8 Hz, 1H), 3.41 – 3.30 (m, 2H), 3.05 (s, 3H), 1.27 (d, *J* = 6.7 Hz, 3H)	**IR** (película delgada) 3256, 3066, 1665, 1553 cm^{-1}
F88		HRMS-ESI (*m/z*) $[M+H]^+$ calculado para $C_{22}H_{17}Cl_3F_7NO_2S$, 599.9980; encontrado, 599.9990	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 8.84 - 8.66 (m, 1H), 8.16 - 7.97 (m, 4H), 7.68 - 7.58 (m, 1H), 6.79 (dd, *J* = 35.7, 10.1 Hz, 1H), 5.25 (p, *J* = 9.4 Hz, 1H), 4.39 - 4.26 (m, 1H), 3.01 - 2.82 (m, 2H), 2.64 - 2.56 (m, 3H), 1.31 - 1.23 (m, 3H)	**IR** (película delgada) 3252, 3063, 1661, 1552 cm^{-1}
F89		HRMS-ESI (*m/z*) $[M+H]^+$ calculado para $C_{22}H_{17}Cl_3F_7NOS$, 584.0030; encontrado, 584.0029	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 8.74 (t, *J* = 5.9 Hz, 1H), 8.12 (d, *J* = 1.6 Hz, 1H), 8.07 - 8.02 (m, 3H), 7.64 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 6.79 (dd, *J* = 35.7, 10.1 Hz, 1H), 5.25 (p, *J* = 9.4 Hz, 1H), 3.47 (dt, *J* = 13.3, 5.8 Hz, 1H), 3.20 (ddd, *J* = 13.6, 8.0, 5.9 Hz, 1H), 2.93 - 2.81 (m, 1H), 2.09 (s, 3H), 1.23 (d, *J* = 6.8 Hz, 3H)	**IR** (película delgada) 1653, 1553, 1524 cm^{-1}
F90		HRMS-ESI (*m/z*) $[M+H]^+$ calculado para $C_{22}H_{17}Cl_3F_7NO_2S$, 599.9980; encontrado, 599.9990	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 8.95 - 8.76 (m, 1H), 8.13 (d, *J* = 1.7 Hz, 1H), 8.09 - 8.03 (m, 3H), 7.68 - 7.62 (m, 1H), 6.80 (dd, *J* = 35.7, 10.1 Hz, 1H), 5.25 (p, *J* = 9.4 Hz, 1H), 3.73 - 3.34 (m, 2H), 3.02 - 2.85 (m, 1H), 2.57 - 2.52 (m, 3H), 1.22 - 1.15 (m, 3H)	**IR** (película delgada) 3252, 3063, 1661, 1552 cm^{-1}

F91		682 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.86 (d, *J* = 1.4 Hz, 1H), 7.81 – 7.76 (m, 1H), 7.73 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 7.65 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.56 (d, *J* = 1.7 Hz, 1H), 7.42 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 6.14 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 5.87 (dd, *J* = 32.5, 9.6 Hz, 1H), 4.82 – 4.62 (m, 2H), 4.26 – 3.86 (m, 2H), 3.54 (dd, *J* = 14.5, 6.5 Hz, 1H), 3.42 (dd, *J* = 14.5, 5.0 Hz, 1H), 1.55 (d, *J* = 6.9 Hz, 3H)	**^{19}F NMR** (376 MHz, $CDCl_3$) δ -59.06, -61.13, -62.80, -69.11 (d, *J* = 2.3 Hz), -112.06; **IR** (película delgada) 3285, 1650 cm^{-1}
F92		HRMS-ESI (*m/z*) $[M+H]^+$ calculado para $C_{21}H_{12}Cl_3F_{10}NOS$, 623.9591; encontrado, 623.9589	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 8.90 (t, *J* = 5.7 Hz, 1H), 8.14 – 8.11 (m, 1H), 8.05 (s, 3H), 7.65 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 6.80 (dd, *J* = 35.8, 10.1 Hz, 1H), 5.25 (p, *J* = 9.4 Hz, 1H), 3.53 (q, *J* = 6.5 Hz, 2H), 3.18 (t, *J* = 6.8 Hz, 2H)	**IR** (película delgada) 1661, 1553 cm^{-1}
F93		696 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.86 (s, 1H), 7.78 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.64 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.39 (s, 1H), 7.32 (s, 1H), 7.22 (s, 1H), 6.25 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 5.86 (dd, *J* = 32.7, 9.7 Hz, 1H), 4.78 – 4.58 (m, 2H), 4.18 – 4.04 (m, 1H), 4.04 – 3.88 (m, 1H), 3.58 – 3.34 (m, 4H), 1.54 (d, *J* = 6.9 Hz, 3H)	**^{19}F NMR** (376 MHz, $CDCl_3$) δ -59.07, -61.14, -65.70, -69.31 (d, *J* = 2.2 Hz), -112.79; **IR** (película delgada) 3265, 1652 cm^{-1}

F94		692 ($[M-H]^-$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.86 (s, 1H), 7.78 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.65 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 7.40 - 7.35 (m, 1H), 7.24 - 7.18 (m, 1H), 6.16 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 5.82 (dd, *J* = 32.5, 9.6 Hz, 1H), 4.72 (dt, *J* = 13.3, 6.7 Hz, 1H), 4.64 - 4.50 (m, 3H), 3.54 (dd, *J* = 14.5, 6.4 Hz, 1H), 3.42 (dd, *J* = 14.5, 5.1 Hz, 1H), 1.55 (d, *J* = 7.0 Hz, 3H)	**^{19}F NMR** (376 MHz, $CDCl_3$) δ -59.08 (d, *J* = 19.3 Hz), -61.14 (d, *J* = 3.1 Hz), -69.55 (d, *J* = 2.4 Hz), -129.12 (d, *J* = 21.5 Hz), -132.14 (d, *J* = 21.5 Hz)
F95		726 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.86 (s, 1H), 7.79 (d, *J* = 7.8 Hz, 1H), 7.76 (s, 1H), 7.73 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 7.65 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 7.47 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 6.12 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 5.87 (dd, *J* = 32.6, 9.6 Hz, 1H), 4.85 – 4.58 (m, 2H), 4.21 – 3.85 (m, 2H), 3.54 (dd, *J* = 14.5, 6.4 Hz, 1H), 3.42 (dd, *J* = 14.6, 5.1 Hz, 1H), 1.56 (s, 3H)	**^{19}F NMR** (376 MHz, $CDCl_3$) δ -59.05, -61.13, -62.84, -69.09 (d, *J* = 2.3 Hz), -112.03; **IR** (película delgada) 3266, 1652 cm^{-1}
F96		HRMS-ESI (*m/z*) $[M+H]^+$ calculado para $C_{24}H_{19}Cl_3F_9NO_2S$, 664.0112; encontrado, 664.0105	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6, mezcla de diastereómeros) δ 8.87 - 8.69 (m, 1H), 8.19 - 8.11 (m, 1H), 8.09 - 8.02 (m, 3H), 7.67 - 7.58 (m, 1H), 6.79 (dd, *J* = 35.7, 10.1 Hz, 1H), 5.25 (p, *J* = 9.4 Hz, 1H), 4.44 - 4.30 (m, 1H), 3.69 - 3.41 (m, 2H), 3.15 - 3.00 (m, 2H), 1.84 - 1.69 (m, 3H), 1.35 - 1.24 (m, 3H)	**^{19}F NMR** (471 MHz, DMSO-d_6, mezcla de diastereómeros) δ -57.94 (d, *J* = 5.7 Hz, realmente dos singletes), -68.58 (d, *J* = 9.0 Hz), -80.77 – -81.91 (m), -84.39 – -85.73 (m), -113.62 (d, *J* = 35.6 Hz)

F97		HRMS-ESI (*m/z*) $[M+H]^+$ calculado para $C_{24}H_{19}Cl_3F_9NO_3S$, 680.0054; encontrado, 680.0056	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 8.80 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 8.13 (d, *J* = 2.0 Hz, 1H), 8.07 (dd, *J* = 8.1, 1.7 Hz, 1H), 8.05 (d, *J* = 1.0 Hz, 2H), 7.64 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 6.79 (dd, *J* = 35.7, 10.1 Hz, 1H), 5.25 (p, *J* = 9.4 Hz, 1H), 4.54 (hept, *J* = 6.9 Hz, 1H), 4.16 (td, *J* = 14.4, 4.4 Hz, 2H), 3.49 (dd, *J* = 14.1, 7.2 Hz, 1H), 3.41 (dd, *J* = 14.1, 5.8 Hz, 1H), 1.81 (t, *J* = 19.6 Hz, 3H), 1.29 (d, *J* = 6.7 Hz, 3H)	**^{19}F NMR** (471 MHz, DMSO-d_6) δ -57.97, -68.58 (d, *J* = 8.9 Hz), -81.85 – -84.63 (m), -113.60 (d, *J* = 35.6 Hz)
F98		666 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 7.86 (s, 1H), 7.78 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 7.63 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.40 (s, 2H), 6.16 (d, *J* = 7.9 Hz, 1H), 6.00 (td, *J* = 55.8, 2.7 Hz, 1H), 5.82 (dd, *J* = 33.9, 9.4 Hz, 1H), 4.77 – 4.64 (m, 1H), 4.43 – 4.27 (m, 1H), 4.09 (dq, *J* = 18.1, 9.1 Hz, 1H), 4.03 – 3.91 (m, 1H), 3.54 (dd, *J* = 14.5, 6.4 Hz, 1H), 3.42 (dd, *J* = 14.5, 5.0 Hz, 1H), 1.55 (d, *J* = 7.0 Hz, 3H)	**^{19}F NMR** (471 MHz, $CDCl_3$) δ -59.03, -61.13, -112.97, -118.69 – -122.74 (m)

F99		HRMS-ESI (*m/z*) $[M+H]^+$ calculado para $C_{23}H_{18}Cl_3F_8NO_2S$, 632.00342; encontrado, 632.0039	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6, mezcla de diastereómeros) δ 8.84 – 8.67 (m, 1H), 8.20 – 8.11 (m, 1H), 8.09 – 8.01 (m, 3H), 7.64 (dd, *J* = 25.6, 8.1 Hz, 1H), 6.79 (dd, *J* = 35.7, 10.0 Hz, 1H), 5.25 (p, *J* = 9.4 Hz, 1H), 5.00 – 4.70 (m, 2H), 4.50 – 4.30 (m, 1H), 3.31 – 3.20 (m, 1H), 3.18 – 2.92 (m, 3H), 1.36 – 1.24 (m, 3H)	**^{19}F NMR** (471 MHz, DMSO-d_6, mezcla de diastereómeros) δ -57.93, -57.96, -68.57 (d, *J* = 9.1 Hz), -113.60 (d, *J* = 35.6 Hz), -218.82 (tdd, *J* = 47.2, 34.4, 21.3 Hz), -219.20 (tdd, *J* = 46.9, 34.1, 21.7 Hz); **IR** (película delgada) 3245, 3061, 1652, 1552 cm^{-1}
F100		HRMS-ESI (*m/z*) $[M+H]^+$ calculado para $C_{23}H_{19}Cl_3F_7NO_3S$, 630.0086; encontrado, 630.0094	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 8.53 (s, 1H), 8.09 (d, *J* = 1.7 Hz, 1H), 8.07 - 8.01 (m, 3H), 7.67 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 6.77 (dd, *J* = 35.7, 10.1 Hz, 1H), 5.24 (p, *J* = 9.4 Hz, 1H), 3.81 (s, 2H), 3.02 (s, 3H), 1.91 (s, 3H), 1.51 (s, 6H)	**^{19}F NMR** (471 MHz, DMSO-d_6) δ -57.81, -68.60 (d, *J* = 9.2 Hz), -113.52 (d, *J* = 35.7 Hz)
F101		HRMS-ESI (*m/z*) $[M+H]^+$ calculado para $C_{23}H_{19}Cl_3F_7NOS$,598.0187; encontrado, 598.0194	^{1}H NMR (500 MHz, $CDCl_3$, diastereómeros) δ 7.86 (s, 1H), 7.80 – 7.75 (m, 1H), 7.63 – 7.57 (m, 1H), 7.43 (s, 2H), 6.22 – 5.90 (m, 1H), 5.81 (dd, *J* = 32.6, 9.6 Hz, 1H), 4.60 (p, *J* = 8.9 Hz, 1H), 4.43 – 4.31 (m, 1H), 2.96 – 2.88 (m, 1H), 2.19 – 2.10 (m, 3H), 1.40 – 1.22 (m, 6H)	**^{19}F NMR** (471 MHz, $CDCl_3$, diastereómeros) δ -59.03, -59.05, -69.34 (d, *J* = 8.6 Hz), -111.85 (d, *J* = 32.1 Hz)

F102		634 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 8.61 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 8.12 (s, 2H), 8.06 (d, *J* = 8.1 Hz, 2H), 7.67 - 7.60 (m, 2H), 6.90 (dd, *J* = 9.9, 36.0 Hz, 1H), 5.35 - 5.28 (m, 1H), 4.12 - 4.01 (m, 1H), 3.59 - 3.49 (m, 2H), 2.82 - 2.75 (m, 2H), 1.23 (d, *J* = 7.5 Hz, 3H)	**IR** (película delgada) 3444, 2987, 1645, 764 cm^{-1}
F103		650 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 8.84 (d, *J* = 7.8 Hz, 1H), 8.12 (s, 1H), 8.07 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.89 - 7.84 (m, 2H), 7.64 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 6.83 (dd, *J* = 9.9, 35.7 Hz, 1H), 5.23 - 5.17 (m, 1H), 4.79 - 4.69 (m, 2H), 4.56 - 4.52 (m, 1H), 3.54 - 3.45 (m, 2H), 1.31 (d, *J* = 6.6 Hz, 3H)	**IR** (película delgada) 3438, 1652 cm^{-1}
F104		698 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 8.82 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 8.13 (br s, 1H), 8.07 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 8.00 (s, 2H), 7.63 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 6.79 (dd, *J* = 10.4, 36.0 Hz, 1H), 5.30 (t, *J* = 8.0 Hz, 1H), 4.77 - 4.70 (m, 2H), 3.59 - 3.46 (m, 2H), 2.80 (s, 2H), 1.30 (d, *J* = 8.0 Hz, 3H)	**IR**(película delgada) 1731, 1267, 1049 cm^{-1}
F109		698 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.86 (s, 1H), 7.79 (d, *J* = 7.6 Hz, 1H), 7.65 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.53 (s, 1H), 7.35 (s, 2H), 6.13 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 5.86 (dd, *J* = 32.6, 9.6 Hz, 1H), 4.79 – 4.60 (m, 2H), 4.17 – 4.03 (m, 1H), 4.03 – 3.91 (m, 1H), 3.54 (dd, *J* = 14.6, 6.4 Hz, 1H), 3.42 (dd, *J* = 14.6, 5.0 Hz, 1H), 1.55 (d, *J* = 7.2 Hz, 3H)	**^{19}F NMR** (376 MHz, $CDCl_3$) δ -57.82, -59.04, -61.14, -69.40 (d, *J* = 2.2 Hz), -112.56 (d, *J* = 2.7 Hz); **IR** (película delgada) 3256, 2970, 1738, 1714, 1655, 1547 cm^{-1}

F110		698 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.84 (d, *J* = 1.6 Hz, 1H), 7.76 (dd, *J* = 8.1, 1.7 Hz, 1H), 7.63 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 7.35 (d, *J* = 1.6 Hz, 1H), 7.27 (s, 1H), 7.17 (s, 1H), 6.65 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 5.84 (dd, *J* = 32.6, 9.6 Hz, 1H), 4.77 – 4.59 (m, 2H), 4.13 (dq, *J* = 15.4, 9.1 Hz, 1H), 3.98 (dq, *J* = 15.6, 9.3 Hz, 1H), 3.56 (dd, *J* = 14.6, 6.7 Hz, 1H), 3.40 (dd, *J* = 14.6, 4.9 Hz, 1H), 1.53 (d, *J* = 6.9 Hz, 3H)	**^{19}F NMR** (376 MHz, $CDCl_3$) δ -57.95, -59.15, -61.14, -69.31 (d, *J* = 2.2 Hz), -112.17; **IR** (película delgada) 3267, 2979, 2878, 1652, 1535 cm^{-1}
F112		638 ($[M-H]^-$)	^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7.85 (d, *J* = 1.6 Hz, 1H), 7.77 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.63 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.41 (t, *J* = 1.7 Hz, 1H), 7.28 (s, 2H), 6.67 (dd, *J* = 17.6, 10.9 Hz, 1H), 6.30 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 5.99 – 5.74 (m, 2H), 5.37 (d, *J* = 10.9 Hz, 1H), 4.77 – 4.55 (m, 2H), 3.96 (dt, *J* = 15.5, 9.3 Hz, 1H), 3.54 (dd, *J* = 14.5, 6.5 Hz, 1H), 3.41 (dd, *J* = 14.5, 5.1 Hz, 1H), 2.63 (s, 1H), 1.54 (d, *J* = 6.9 Hz, 3H)	**IR** (película delgada) 3210, 2916, 1681, 1363 cm^{-1}
F113		HRMS-ESI (*m/z*) $[M+H]^+$ calculado para $C_{24}H_{19}Cl_3F_9NOS$, 648.0155; encontrado, 648.0159	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 8.59 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 8.13 (s, 1H), 8.08 – 8.01 (m, 3H), 7.61 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 6.79 (dd, *J* = 35.8, 10.1 Hz, 1H), 5.25 (p, *J* = 9.4 Hz, 1H), 4.14 – 4.05 (m, 1H), 3.15 – 3.06 (m, 2H), 2.82 – 2.69 (m, 2H), 1.71 (t, *J* = 18.7 Hz, 3H), 1.20 (d, *J* = 6.7 Hz, 3H)	**^{19}F NMR** (471 MHz, DMSO-d_6) δ -57.96, -68.59 (d, *J* = 9.1 Hz), -86.61 – -88.33 (m), -113.64 (d, *J* = 35.5 Hz); **IR** (película delgada) 1651, 1552 cm^{-1}

F114		688 ($[M-H]^-$)	^{1}H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 7.84 (t, *J* = 2.4 Hz, 1H), 7.76 (dt, *J* = 8.3, 2.6 Hz, 1H), 7.62 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.45 - 7.39 (m, 1H), 7.14 (t, *J* = 2.1 Hz, 1H), 6.32 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 5.84 (ddd, *J* = 32.8, 11.9, 9.7 Hz, 1H), 5.37 - 5.22 (m, 1H), 4.99 (t, *J* = 1.3 Hz, 1H), 4.73 - 4.67 (m, 1H), 4.61 (p, *J* = 9.0 Hz, 1H), 4.19 - 4.04 (m, 1H), 4.04 - 3.90 (m, 1H), 3.54 (dd, *J* = 14.5, 6.6 Hz, 1H), 3.41 (dd, *J* = 14.5, 5.0 Hz, 1H), 2.10 (t, *J* = 1.2 Hz, 3H), 1.53 (d, *J* = 6.9 Hz, 3H)	**^{19}F NMR** (471 MHz, $CDCl_3$) δ -59.07, -60.23 – -62.29 (m), -67.61 – -71.87 (m), -107.95 – -115.02 (m)
F116		640 ($[M-H]^-$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.69 (d, *J* = 1.6 Hz, 1H), 7.53 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 7.47 (dd, *J* = 8.2, 1.6 Hz, 1H), 7.44 (s, 2H), 7.12 - 6.96 (m, 1H), 6.26 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 5.91 - 5.63 (m, 2H), 5.56 - 5.36 (m, 1H), 4.71 (ddd, *J* = 13.2, 9.3, 6.0 Hz, 1H), 4.60 (p, *J* = 8.9 Hz, 1H), 4.21 - 4.05 (m, 1H), 3.98 (dq, *J* = 15.6, 9.3 Hz, 1H), 3.53 (dd, *J* = 14.5, 6.4 Hz, 1H), 3.43 (dd, *J* = 14.5, 5.0 Hz, 1H), 1.54 (d, *J* = 6.9 Hz, 3H)	**^{19}F NMR** (376 MHz, $CDCl_3$) δ -61.08, -69.38, -111.47
F117		667 ($[M-H]^-$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.84 (d, *J* = 1.7 Hz, 1H), 7.77 (dd, *J* = 8.2, 1.8 Hz, 1H), 7.60 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.54 (d, *J* = 2.1 Hz, 1H), 7.44 (dd, *J* = 8.9, 2.0 Hz, 1H), 5.98 – 5.73 (m, 2H), 4.71 (p, *J* = 8.8 Hz, 1H), 4.38 (dh, *J* = 8.0, 6.5 Hz, 1H), 3.29 – 3.01 (m, 2H), 2.97 – 2.79 (m, 2H), 1.34 (d, *J* = 6.7 Hz, 3H)	**^{19}F NMR** (376 MHz, $CDCl_3$) δ -59.06, -62.55, -66.52, -69.45, -109.45, -111.40

F119	100-104	620 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.85 (s, 1H), 7.79 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 7.65 (d, *J* = 7.6 Hz, 1H), 7.41 (s, 1H), 7.37 (s, 1H), 6.72 - 6.65 (m, 1H), 6.36 - 6.34 (m, 1H), 5.88 - 5.74 (m, 2H), 4.69 - 4.57 (m, 2H), 3.41 (dd, *J* = 5.6, 14.4 Hz, 1H), 3.23 (dd, *J* = 4.8, 14.4 Hz, 1H), 3.14 (q, *J* =7.2 Hz, 2H), 1.58 (d, *J* = 6.8 Hz, 3H), 1.45 (t, *J* =7.2 Hz, 3H)	
F120		678 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.85 (s, 1H), 7.78 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.63 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.50 (s, 1H), 7.46 (s, 1H), 7.42 (s, 1H), 6.20 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 5.87 (dd, *J* = 32.6, 9.7 Hz, 1H), 4.79 – 4.60 (m, 2H), 4.16 – 4.03 (m, 1H), 4.03 – 3.89 (m, 1H), 3.54 (dd, *J* = 14.5, 6.5 Hz, 1H), 3.41 (dd, *J* = 14.5, 5.0 Hz, 1H), 1.93 (t, *J* = 18.2 Hz, 3H), 1.54 (d, *J* = 6.9 Hz, 3H)	**^{19}F NMR** (376 MHz, $CDCl_3$) δ -59.05, -61.14, -69.27 (d, *J* = 1.6 Hz), -88.19 (d, *J* = 6.8 Hz), -112.56; **IR** (película delgada) 3278, 1651 cm^{-1}
F121		HRMS-ESI (*m/z*) $[M+H]^+$ calculado para $C_{24}H_{18}Cl_3F_{10}NO_2S$, 682.0010; encontrado, 682.0028	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 8.96 - 8.60 (m, 1H), 8.22 - 7.95 (m, 4H), 7.68 - 7.58 (m, 1H), 6.79 (dd, *J* = 35.7, 10.0 Hz, 1H), 5.25 (p, *J* = 9.4 Hz, 1H), 4.37 (hept, *J* = 7.2 Hz, 1H), 3.18 - 2.86 (m, 4H), 2.80 - 2.60 (m, 2H), 1.34 - 1.24 (m, 3H)	**IR** (película delgada) 3246, 3061, 1659, 1552 cm^{-1}
F122		HRMS-ESI (*m/z*) $[M+H]^+$ calculado para $C_{24}H_{18}Cl_3F_7N_2O_2S$, 639.0089; encontrado, 639.0082	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 8.86 - 8.70 (m, 1H), 8.17 - 8.02 (m, 4H), 7.69 - 7.59 (m, 1H), 6.79 (dd, *J* = 35.7, 10.0 Hz, 1H), 5.25 (p, *J* = 9.3 Hz, 1H), 4.43 - 4.32 (m, 1H), 3.26 - 3.13 (m, 1H), 3.10 - 2.87 (m, 5H), 1.36 - 1.19 (m, 3H)	**IR** (película delgada) 3246, 3060, 2249, 1658, 1552 cm^{-1}

F123		HRMS-ESI (*m/z*) $[M+H]^+$ calculado para $C_{24}H_{18}Cl_3F_7N_2O_3S$, 655.0038; encontrado, 655.0043	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 8.79 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 8.17 - 8.00 (m, 4H), 7.65 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 6.79 (dd, *J* = 35.7, 10.1 Hz, 1H), 5.25 (p, *J* = 9.4 Hz, 1H), 4.50 (hept, *J* = 6.9 Hz, 1H), 3.58 (td, *J* = 7.1, 2.2 Hz, 2H), 3.49 - 3.39 (m, 2H), 3.02 (t, *J* = 7.1 Hz, 2H), 1.28 (d, *J* = 6.6 Hz, 3H)	**IR** (película delgada) 3246, 3059, 2252, 1659, 1552 cm^{-1}
F124		HRMS-ESI (*m/z*) $[M+H]^+$ calculado para $C_{22}H_{17}Cl_3F_7NO_2S$, 599.9980; encontrado, 599.9990	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 8.85 (t, *J* = 5.8 Hz, 1H), 8.14 (d, *J* = 1.7 Hz, 1H), 8.11 - 8.02 (m, 3H), 7.69 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 6.81 (dd, *J* = 35.7, 10.1 Hz, 1H), 5.25 (p, *J* = 9.4 Hz, 1H), 3.78 (dt, *J* = 13.2, 5.4 Hz, 1H), 3.46 - 3.34 (m, 2H), 3.04 (s, 3H), 1.32 (d, *J* = 6.7 Hz, 3H)	**IR** (película delgada) 3252, 3063, 1661, 1552 cm^{-1}
F125		HRMS-ESI (*m/z*) $[M+H]^+$ calculado para $C_{22}H_{16}Cl_3F_8NOS$, 601.9936; encontrado, 601.9946	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 8.74 (t, *J* = 5.7 Hz, 1H), 8.12 (d, *J* = 1.7 Hz, 1H), 8.09 – 8.01 (m, 3H), 7.63 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 6.79 (dd, *J* = 35.7, 10.1 Hz, 1H), 5.25 (p, *J* = 9.4 Hz, 1H), 4.62 (t, *J* = 6.2 Hz, 1H), 4.53 (t, *J* = 6.2 Hz, 1H), 3.42 (dt, *J* = 7.6, 6.1 Hz, 2H), 2.90 (t, *J* = 6.2 Hz, 1H), 2.86 (t, *J* = 6.2 Hz, 1H), 2.73 (t, *J* = 7.1 Hz, 2H)	**^{19}F NMR** (471 MHz, DMSO-d_6) δ -57.97, -68.59 (d, *J* = 9.0 Hz), -113.69 (d, *J* = 35.7 Hz), -212.01 (tt, *J* = 47.1, 22.0 Hz); **IR** (película delgada) 3274, 3077, 1651, 1552 cm^{-1}
F126		632 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 8.86 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 8.14 (s, 1H), 8.08 (d, *J* = 7.5 Hz, 1H), 7.69 - 7.61 (m, 3H), 7.54 - 7.50 (m, 1H), 6.86 (dd, *J* = 10.2, 36.0 Hz, 1H), 5.24 - 5.18 (m, 1H), 4.80 - 4.70 (m, 2H), 4.57 - 4.52 (m, 1H), 3.62 - 3.45 (m, 2H), 1.31 (d, *J* = 6.9 Hz, 3H)	**IR** (película delgada) 3421, 1651 cm^{-1}

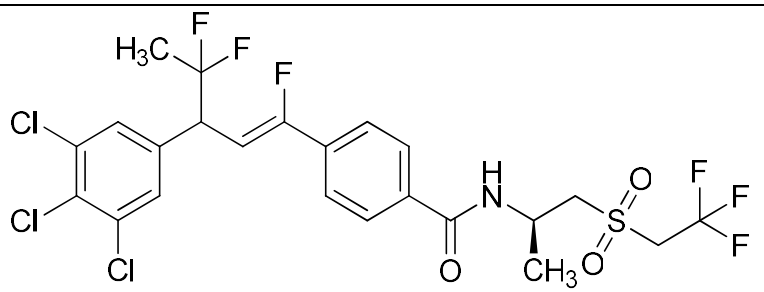
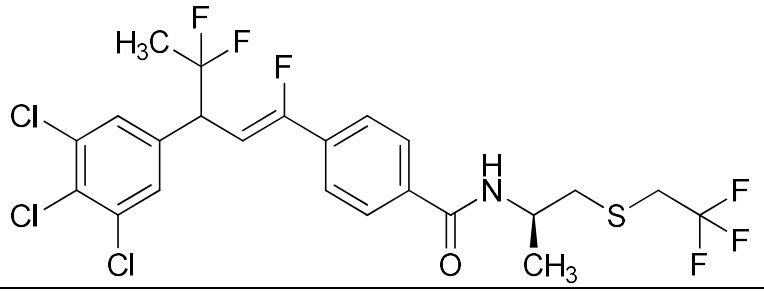
F127		698 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.85 (d, *J* = 1.7 Hz, 1H), 7.78 (dd, *J* = 8.0, 1.7 Hz, 1H), 7.64 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 7.52 (d, *J* = 8.3 Hz, 1H), 7.36 (s, 1H), 7.31 (dd, *J* = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 6.14 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 5.85 (dd, *J* = 32.6, 9.5 Hz, 1H), 4.76 – 4.60 (m, 2H), 4.19 – 4.04 (m, 1H), 4.04 – 3.89 (m, 1H), 3.53 (dd, *J* = 14.5, 6.5 Hz, 1H), 3.42 (dd, *J* = 14.5, 5.0 Hz, 1H), 1.29 (d, *J* = 7.0 Hz, 3H)	**^{19}F NMR** (376 MHz, $CDCl_3$) δ -57.87, -59.08, -61.15, -69.55 (d, *J* = 2.4 Hz), -112.29; **IR** (película delgada) 3282, 1714, 1652, 1540, 1491 cm^{-1}
F128		HRMS-ESI (*m/z*) $[M+H]^+$ calculado para $C_{24}H_{18}Cl_3F_7N_2OS$, 623.0140; encontrado, 623.0151	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.90 – 7.82 (m, 1H), 7.78 (dd, *J* = 8.3, 1.7 Hz, 1H), 7.62 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.43 (s, 2H), 5.89 – 5.74 (m, 2H), 4.60 (p, *J* = 8.7 Hz, 1H), 4.41 – 4.28 (m, 1H), 2.95 – 2.83 (m, 3H), 2.81 – 2.68 (m, 3H), 1.35 (d, *J* = 6.7 Hz, 3H)	**IR** (película delgada) 3260, 2974, 2108, 1644, 1552 cm^{-1}
F129		666 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.89 - 7.82 (m, 1H), 7.78 (dd, *J* = 8.2, 1.7 Hz, 1H), 7.65 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.43 (s, 2H), 6.42 - 6.08 (m, 2H), 5.82 (dd, *J* = 32.5, 9.6 Hz, 1H), 4.79 - 4.67 (m, 1H), 4.60 (p, *J* = 8.9 Hz, 1H), 3.85 - 3.57 (m, 2H), 3.47 (dd, *J* = 14.5, 6.6 Hz, 1H), 3.36 (dd, *J* = 14.5, 4.8 Hz, 1H), 1.54 (d, *J* = 7.0 Hz, 3H)	**^{19}F NMR** (376 MHz, $CDCl_3$) δ -59.04, -69.32 (d, *J* = 2.3 Hz), -111.92 (d, *J* = 2.7 Hz), -115.78 (d, *J* = 3.4 Hz)

F130		HRMS-ESI (*m/z*) $[M+H]^+$ calculado para $C_{24}H_{18}Cl_3F_{10}NO_3S$, 697.9960; encontrado, 697.9971	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 8.79 (d, *J* = 8.2 Hz, 1H), 8.13 (s, 1H), 8.09 - 8.02 (m, 3H), 7.64 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 6.79 (dd, *J* = 35.7, 10.1 Hz, 1H), 5.25 (p, *J* = 9.3 Hz, 1H), 4.51 (hept, *J* = 6.8 Hz, 1H), 3.54 - 3.43 (m, 4H), 2.86 - 2.71 (m, 2H), 1.29 (d, *J* = 6.7 Hz, 3H)	**IR** (película delgada) 3245, 3062, 1660, 1553 cm^{-1}
F131		692 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.84 (s, 1H), 7.76 (dd, *J* = 8.1, 1.3 Hz, 1H), 7.61 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.46 (s, 2H), 7.38 (s, 1H), 6.25 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 5.87 (dd, *J* = 32.6, 9.7 Hz, 1H), 4.76 – 4.61 (m, 2H), 4.17 – 4.03 (m, 1H), 4.03 – 3.89 (m, 1H), 3.54 (dd, *J* = 14.5, 6.5 Hz, 1H), 3.41 (dd, *J* = 14.5, 5.0 Hz, 1H), 2.21 – 2.05 (m, 2H), 1.53 (d, *J* = 6.9 Hz, 3H), 1.00 (t, *J* = 7.5 Hz, 3H)	**^{19}F NMR** (376 MHz, $CDCl_3$) δ -59.07, -61.14, -69.33 (t, *J* = 1.8 Hz), -98.00, -112.60; **IR** (película delgada) 3269, 2987, 1651, 1538 cm^{-1}
F132		662 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.84 (s, 1H), 7.76 (d, *J* = 6.8 Hz, 1H), 7.63 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 7.37 (d, *J* = 8.5 Hz, 1H), 7.29 – 7.26 (m, 1H), 6.11 (d, *J* = 7.8 Hz, 1H), 5.87 (dd, *J* = 33.1, 9.3 Hz, 1H), 5.01 (p, *J* = 9.0 Hz, 1H), 4.71 (dt, *J* = 13.3, 6.6 Hz, 1H), 4.17 – 4.02 (m, 1H), 4.02 – 3.90 (m, 1H), 3.53 (dd, *J* = 14.4, 6.4 Hz, 1H), 3.42 (dd, *J* = 14.5, 5.0 Hz, 1H), 2.59 (s, 3H), 1.55 (d, *J* = 5.7 Hz, 3H)	**^{19}F NMR** (376 MHz, $CDCl_3$) δ -59.04, -61.13, -69.06, -112.52; **IR** (película delgada) 3265, 1650, 1536 cm^{-1}

F133		633.85 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 8.84 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 8.12 - 8.04 (m, 2H), 7.77 - 7.72 (m, 2H), 7.64 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 6.80 (dd, *J* = 10.2, 35.7 Hz, 1H), 5.22 - 5.15 (m, 1H), 4.79 - 4.69 (m, 2H), 4.56 - 4.52 (m, 1H), 3.60 - 3.45 (m, 2H), 1.31 (d, *J* = 6.9 Hz, 3H)	**IR** (película delgada) 3431, 1657 cm^{-1}
F136		682 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 8.84 (d, *J* = 9.0 Hz, 1H), 8.13 (s, 1H), 8.05 (s, 1H), 8.04 (s, 2H), 7.64 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 6.85 (dd, *J* = 9.9, 35.4 Hz, 1H), 5.27 - 5.21 (m, 1H), 4.79 - 4.69 (m, 2H), 4.57 - 4.51 (m, 1H), 3.61 - 3.31 (m, 2H), 1.31 (d, *J* = 6.6 Hz, 3H)	
F137		HRMS-ESI (*m/z*) $[M+H]^+$ calculado para $C_{24}H_{18}Cl_3F_{10}NOS$, 666.0061; encontrado, 666.0059	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.88 – 7.83 (m, 1H), 7.78 (dd, *J* = 8.1, 1.8 Hz, 1H), 7.61 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.43 (s, 2H), 5.90 – 5.74 (m, 2H), 4.60 (p, *J* = 8.8 Hz, 1H), 4.46 – 4.32 (m, 1H), 2.89 – 2.68 (m, 4H), 2.49 – 2.34 (m, 2H), 1.35 (d, *J* = 6.7 Hz, 3H)	**IR** (película delgada) 3260, 1642, 1553 cm^{-1}
F138		HRMS-ESI (*m/z*) $[M+H]^+$ calculado para $C_{22}H_{16}Cl_3F_8NO_2S$, 617.9885; encontrado, 617.9886	^{1}H NMR (500 MHz, DMSO-d_6) δ 8.92 (t, *J* = 5.6 Hz, 1H), 8.13 (d, *J* = 1.7 Hz, 1H), 8.11 – 8.04 (m, 3H), 7.66 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 6.80 (dd, *J* = 35.7, 10.1 Hz, 1H), 5.25 (p, *J* = 9.4 Hz, 1H), 4.97 – 4.70 (m, 2H), 3.73 – 3.56 (m, 2H), 3.33 (s, 1H), 3.18 – 3.05 (m, 2H), 2.97 (dt, *J* = 12.7, 6.0 Hz, 1H)	**^{19}F NMR** (471 MHz, DMSO-d_6) δ -57.98, -68.59 (d, *J* = 9.1 Hz), -113.70 (d, *J* = 35.7 Hz), -219.11 (tdd, *J* = 46.9, 34.4, 21.6 Hz); **IR** (película delgada) 3426, 3248, 3061, 1664, 1553 cm^{-1}

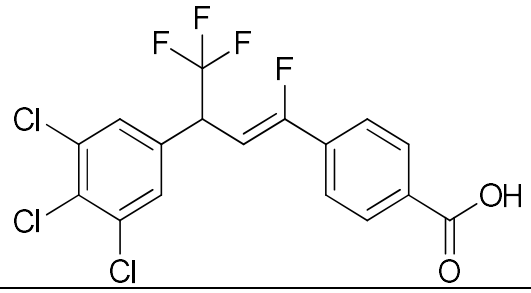
F141		642 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 8.83 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 8.13 (s, 1H), 8.08 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.73 (s, 1H), 7.63 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.56 (d, *J* = 7.8 Hz, 1H), 7.42 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 6.84 (dd, *J* = 9.9, 36.0 Hz, 1H), 5.08 - 5.02 (m, 1H), 4.79 - 4.69 (m, 2H), 4.56 - 4.52 (m, 1H), 3.60 - 3.47 (m, 2H), 2.74 - 2.66 (m, 2H), 1.31 (d, *J* = 6.6 Hz, 3H), 1.17 (t, *J* = 7.8 Hz, 3H)	**IR** (película delgada) 3271, 2930, 1655, 1127 cm^{-1}
F142		642 ($[M-H]^-$)	^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 8.83 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 8.12 (s, 1H), 8.08 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.75 (s, 1H), 7.63 (s, 1H), 7.59 - 7.56 (m, 1H), 7.21 (d, *J* = 8.7 Hz, 1H), 6.83 (dd, *J* = 10.2, 35.7 Hz, 1H), 5.04 - 4.98 (m, 1H), 4.79 - 4.69 (m, 2H), 4.59 - 4.52 (m, 1H), 3.86 (s, 3H), 3.60 - 3.47 (m, 2H), 1.31 (d, *J* = 6.6 Hz, 3H)	**IR** (película delgada) 3421, 2927, 1650, 1022 cm^{-1}
F143	125-128	704 ($[M-H]^-$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.85 (s, 1H), 7.79 - 7.74 (m, 1H), 7.63 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.46 (s, 2H), 7.38 (s, 1H), 6.21 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 5.87 (dd, *J* = 32.6, 9.7 Hz, 1H), 4.78 - 4.61 (m, 2H), 4.19 - 4.03 (m, 1H), 4.03 - 3.90 (m, 1H), 3.54 (dd, *J* = 14.5, 6.5 Hz, 1H), 3.41 (dd, *J* = 14.5, 5.0 Hz, 1H), 2.15 - 2.01 (m, 2H), 1.54 (d, *J* = 6.9 Hz, 3H), 1.52 - 1.41 (m, 2H), 0.95 (t, *J* = 7.4 Hz, 3H)	**^{19}F NMR** (376 MHz, $CDCl_3$) δ -59.06, -61.13, -69.31, -95.94, -112.56

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

No.	Estructura	Prep.*
FC1		13
FC2		13

***preparado de acuerdo con el número de ejemplo**

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

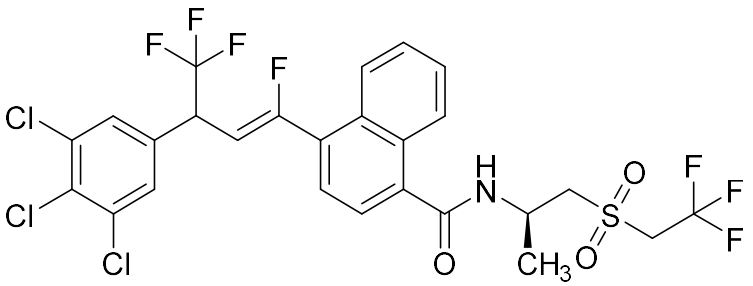
No.	Estructura	Prep.*
CC1		1

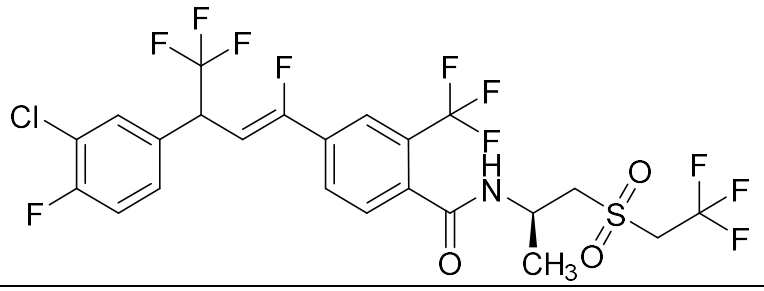
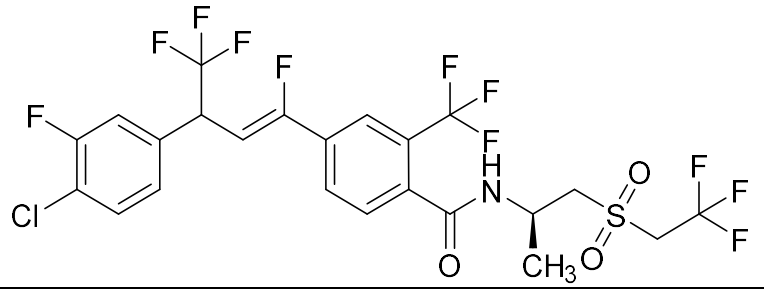
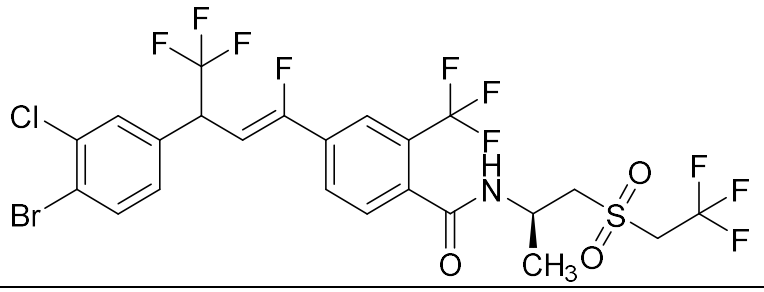
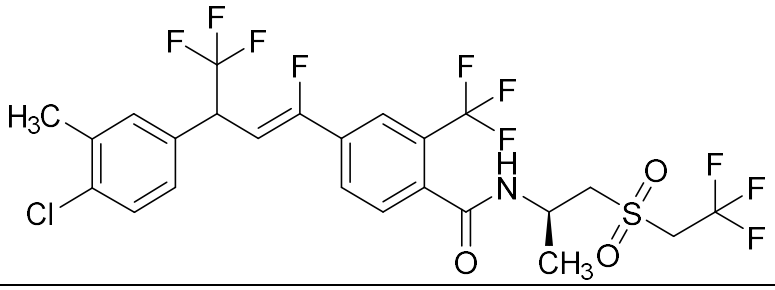
***preparado de acuerdo con el número de ejemplo**

Tabla 7: Datos analíticos para Compuestos en la Tabla 5

No.	Mp (°C)	Masa (*m/z*)	^{1}H NMR	^{13}C NMR; ^{19}F NMR; IR
FC1		617 ([M+H]$^{+}$)	^{1}H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 7.81 (d, *J* = 8.2 Hz, 2H), 7.64 (d, *J* = 8.5 Hz, 2H), 7.43 (s, 2H), 6.57 (d, *J* = 7.9 Hz, 1H), 5.79 (dd, *J* = 32.7, 9.6 Hz, 1H), 4.73 (dt, *J* = 13.0, 6.3 Hz, 1H), 4.60 (p, *J* = 9.0 Hz, 1H), 4.00 (p, *J* = 9.2 Hz, 2H), 3.57 (dd, *J* = 14.5, 5.8 Hz, 1H), 3.43 (dd, *J* = 14.5, 5.2 Hz, 1H), 1.59 (d, *J* = 7.0 Hz, 3H)	**^{19}F NMR** (376 MHz, $CDCl_3$) δ -61.04, -69.40, -111.75
FC2		584 ([M+H]$^{+}$)	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.80 (d, *J* = 8.2 Hz, 2H), 7.66 - 7.59 (m, 2H), 7.43 (s, 2H), 6.22 (d, *J* = 7.9 Hz, 1H), 5.78 (dd, *J* = 32.8, 9.6 Hz, 1H), 4.60 (p, *J* = 8.9 Hz, 1H), 4.49 - 4.34 (m, 1H), 3.26 - 3.05 (m, 2H), 2.99 - 2.86 (m, 2H), 1.40 - 1.34 (m, 3H)	**^{19}F NMR** (376 MHz, $CDCl_3$) δ -66.49, -69.41, -111.71

Tabla 8. Estructura y método de preparación de los compuestos de las Series PF

No.	Estructura	Prep.*
PF1		**13**

No.	Estructura	Prep.*
PF2		13
PF4		13
PF5		13
PF8		13

***preparado de acuerdo con el número de ejemplo**

Tabla 9: Datos analíticos para Compuestos en la Tabla 8

No.	Mp (°C)	Masa (*m/z*)	^{1}H NMR	^{13}C NMR; ^{19}F NMR; IR
PF1		664 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 8.87 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 8.26 (d, *J* = 7.5 Hz, 1H), 8.07 (s, 2H), 7.98 - 7.96 (m, 1H), 7.75 - 7.69 (m, 2H), 7.67 (s, 1H), 7.63 (d, *J* = 7.5 Hz, 1H), 6.29 (dd, *J* = 9.9, 34.2 Hz, 1H), 5.35 - 5.29 (m, 1H), 4.82 - 4.69 (m, 3H), 3.71 - 3.66 (m, 1H), 3.57 - 3.50 (m, 1H), 1.39 (d, *J* = 6.6 Hz, 3H)	**IR** (película delgada) 3429, 1651, 1023, 706 cm^{-1}
PF2		630 ($[M-H]^-$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 8.83 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 8.13 (s, 1H), 8.07 (d, *J* = 7.6 Hz, 1H), 7.96 (d, *J* = 6.8 Hz, 1H), 7.69 - 7.68 (m, 1H), 7.63 (d, *J* = 7.6 Hz, 1H), 7.53 - 7.48 (m, 1H) 6.83 (dd, *J* = 9.6, 35.6 Hz, 1H), 5.18 - 5.13 (m, 1H), 4.78 - 4.70 (m, 2H), 4.55 - 4.52 (m, 1H), 3.59 -3.31 (m, 2H), 1.30 (d, *J* = 4.0 Hz, 3H)	**IR** (película delgada) 3279, 2969, 1655, 1127 cm^{-1}
PF4		632 ($[M+H]^+$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 8.80 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 8.09 (s, 1H), 8.04 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 7.77 (d, *J* = 10.8 Hz, 1H), 7.67 (t, *J* = 8.0 Hz, 1H), 7.60 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 7.51 (d, *J* = 8.8 Hz, 1H), 6.77 (dd, *J* = 9.6, 35.6 Hz, 1H), 5.16 - 5.11 (m, 1H), 4.74 - 4.66 (m, 2H), 4.52 - 4.49 (m, 1H), 3.56 - 3.42 (m, 2H), 1.36 (d, *J* = 6.4 Hz, 3H)	**IR** (película delgada) 3428, 2969, 1650 cm^{-1}

PF5	133 - 135	692 ([M-H]-)	^{1}H NMR (300 MHz, DMSO-d_6) δ 8.84 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 8.13 (s, 1H), 8.08 (d, *J* = 7.8 Hz, 1H), 7.97 (s, 1H), 7.87 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 7.63 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.59 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 6.85 (dd, *J* = 9.9 Hz, 36.0 Hz, 1H), 5.20 - 5.13 (m, 1H), 4.79 (q, *J* = 10.2 Hz, 2H), 4.56 - 4.51 (m, 1H), 3.55 - 3.49 (m, 2H), 1.31 (d, *J* = 6.6 Hz, 3H)	
PF8	69 - 70	626 ([M-H]$^-$)	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 8.80 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 8.11 (s, 1H), 8.07 (d, *J* = 8.4 Hz, 1H), 7.62 - 7.60 (m, 2H), 7.47 (s, 2H), 6.78 (dd, *J* = 10.4 Hz, 36.4 Hz, 1H), 5.02 - 4.98 (m, 1H), 4.77 (q, *J* = 10.4 Hz, 2H), 4.56 - 4.52 (m, 1H), 3.59 - 3.31 (m, 2H), 2.35 (s, 3H), 1.30 (d, *J* = 6.8 Hz, 3H)	

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.	Plagas			
	BAW	**CL**	**GPA**	**YFM**
F1	A	A	B	C
F2	A	A	B	C
F3	A	A	B	C
F4	A	A	C	C
F5	A	A	C	C
F6	A	A	C	C
F7	A	A	C	C
F8	A	A	C	C
F9	A	A	C	C
F10	A	A	C	C
F11	A	A	C	C
F12	A	A	C	C
F13	A	A	C	C
F14	A	A	C	C
F15	A	A	C	C
F16	A	A	C	C
F17	A	A	C	A
F18	A	A	C	A
F19	A	A	C	A
F20	A	A	C	D
F21	A	A	A	A
F22	A	A	B	A
F23	A	A	C	A
F24	A	A	C	C
F25	A	A	C	A
F26	A	A	C	A
F27	A	A	C	A
F28	A	A	C	B
F29	A	A	C	A
F30	A	A	C	A
F31	A	A	C	B
F32	A	A	C	A
F33	A	A	C	A
F34	A	A	C	A

F35	A	A	C	A
F36	A	A	C	A
F37	A	A	C	A
F38	A	A	C	C
F39	A	A	C	C
F40	A	A	C	C
F41	A	A	C	C
F42	A	A	B	A
F43	A	A	A	A
F44	A	A	C	A
F45	A	A	C	A
F46	A	A	B	B
F47	A	A	C	C
F48	A	A	C	C
F49	A	A	C	A
F50	A	A	C	C
F51	A	A	C	C
F52	A	A	C	D
F53	A	A	C	D
F54	A	A	C	A
F55	A	A	C	A
F56	A	A	C	A
F57	A	A	C	C
F58	A	A	C	C
F59	C	C	C	C
F60	C	C	C	C
F61	C	C	C	C
F62	A	A	C	C
F63	A	A	C	C
F64	A	A	C	C
F65	A	A	C	B
F66	A	A	C	C
F67	A	A	C	C
F68	A	A	B	A
F69	A	A	B	A
F70	A	A	C	C
F71	A	A	C	C
F72	A	A	C	C
F73	A	A	C	C

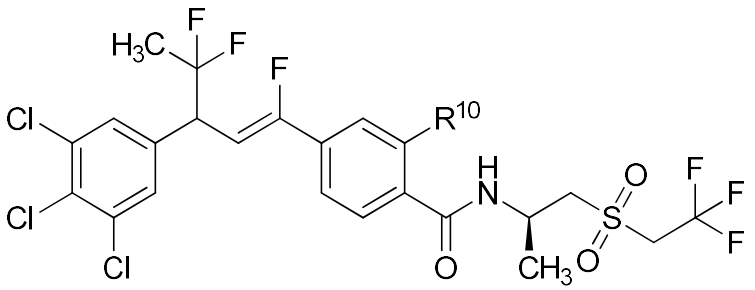
F75	A	A	C	C
F76	A	A	B	D
F77	A	A	C	C
F78	A	A	C	B
F79	A	A	C	C
F80	A	A	C	C
F81	A	A	C	C
F82	A	A	C	C
F83	A	A	C	C
F84	A	A	C	C
F85	A	A	C	C
F86	A	A	C	C
F87	A	A	C	C
F88	A	A	A	C
F89	A	A	C	C
F90	A	A	C	C
F91	A	A	C	D
F92	A	A	C	B
F93	A	A	C	C
F94	A	A	C	C
F95	A	A	C	A
F96	A	A	C	C
F97	A	A	C	C
F98	A	A	C	A
F99	A	A	C	A
F100	A	A	C	C
F101	A	A	C	C
F102	A	A	C	A
F103	A	A	C	A
F104	A	A	D	A
F109	A	A	C	C
F110	A	A	C	C
F112	A	A	C	C
F113	A	A	C	C
F114	A	A	C	C
F116	A	A	C	C
F117	A	A	C	C
F119	A	A	C	A
F120	A	A	C	C

F121	A	A	C	A
F122	A	A	B	A
F123	A	A	D	A
F124	A	A	C	C
F125	A	A	C	D
F126	A	A	C	C
F127	A	A	C	C
F128	A	A	C	C
F129	A	A	C	C
F130	A	A	C	B
F131	A	A	C	A
F132	A	A	C	C
F133	A	A	C	C
F136	A	A	C	C
F137	A	A	C	C
F138	A	A	C	C
F141	A	A	C	D
F142	A	A	C	B
F143	A	A	C	D
PF1	A	A	C	A
PF2	A	A	B	B
PF4	A	A	C	C
PF5	A	A	C	B
PF8	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 y la Tabla CD2.

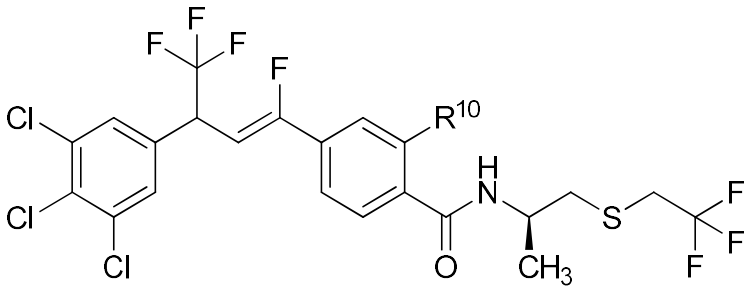
Tabla CD1



No.	R^{10}	5 µg/cm^2		0.5 µg/cm^2		0.05 µg/cm^2	
		BAW	CL	BAW	CL	BAW	CL
FC1	H	100*	100	20	81	0	0
F14	CH_3	100	100	100	100	69	100
F16	CF_3	100	100	100	100	100	100

***Porciento de control (o mortalidad)**

Tabla CD2



No.	R^{10}	5 µg/cm^2		0.5 µg/cm^2		0.05 µg/cm^2	
		BAW	CL	BAW	CL	BAW	CL
FC2	H	100*	100	20	0	0	0
F10	Cl	100	100	100	100	0	6
F7	Br	100	100	100	56	0	0
F4	CH_3	100	100	100	60	67	7
F1	CF_3	-	-	100	100	100	31

***Porciento de control (o mortalidad)**