

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 956 011**

51 Int. Cl.:

C07D 413/04 (2006.01)
A01N 43/76 (2006.01)
A01N 43/90 (2006.01)
A01P 7/04 (2006.01)
A61K 31/4439 (2006.01)
A61K 31/444 (2006.01)
A61K 31/5025 (2006.01)
A61P 33/00 (2006.01)
C07D 487/04 (2006.01)
C07D 471/04 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- 86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **12.10.2016 PCT/JP2016/080274**
- 87 Fecha y número de publicación internacional: **20.04.2017 WO17065183**
- 96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **12.10.2016 E 16855436 (8)**
- 97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **28.06.2023 EP 3372595**

54 Título: **Compuesto heterocíclico condensado que contiene un grupo oxima o sales del mismo e insecticida agrícola y hortícola que contiene dicho compuesto y método para el uso del mismo**

30 Prioridad:

13.10.2015 JP 2015201937
19.02.2016 JP 2016030466
15.07.2016 JP 2016140926

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:
11.12.2023

73 Titular/es:

NIHON NOHYAKU CO., LTD. (100.0%)
19-8, Kyobashi 1-chome Chuo-ku
Tokyo 104-8386, JP

72 Inventor/es:

SANO, YUSUKE;
YONEMURA, IKKI;
MATSUO, SOICHIRO;
SUWA, AKIYUKI y
FUJIE, SHUNPEI

74 Agente/Representante:

ARIAS SANZ, Juan

ES 2 956 011 T3

Aviso: En el plazo de nueve meses a contar desde la fecha de publicación en el Boletín Europeo de Patentes, de la mención de concesión de la patente europea, cualquier persona podrá oponerse ante la Oficina Europea de Patentes a la patente concedida. La oposición deberá formularse por escrito y estar motivada; sólo se considerará como formulada una vez que se haya realizado el pago de la tasa de oposición (art. 99.1 del Convenio sobre Concesión de Patentes Europeas).

DESCRIPCIÓN

Compuesto heterocíclico condensado que contiene un grupo oxima o sales del mismo e insecticida agrícola y hortícola que contiene dicho compuesto y método para el uso del mismo

5

Campo técnico

La presente invención se refiere a un compuesto heterocíclico condensado que contiene un grupo oxima o una sal del mismo, un insecticida agrícola u hortícola que comprende el compuesto como principio activo y un método para usar el insecticida.

10

Antecedentes de la técnica

Se han examinado diversos compuestos por su potencial como insecticidas agrícolas y hortícolas y, entre ellos, se ha informado que ciertas clases de compuestos heterocíclicos condensados son útiles como insecticidas (por ejemplo, véase la bibliografía de patentes 1 a 7). Ninguna de estas referencias divulga de manera específica ningún compuesto que tenga un grupo oxima unido a un anillo heterocíclico condensado.

15

Listado de citas

20

Bibliografía de patentes

Bibliografía de patentes 1: JP-A 2009-280574

Bibliografía de patentes 2: JP-A 2010-275301

25

Bibliografía de patentes 3: JP-A 2011-79774

Bibliografía de patentes 4: JP-A 2012-131780

Bibliografía de patentes 5: WO 2012/086848

Bibliografía de patentes 5: WO 2013/018928

Bibliografía de patentes 7: WO 2015/121136

30

Sumario de la invención**Problema técnico**

35

En la producción de cultivos en los campos de la agricultura, la horticultura y similares, el daño provocado por las plagas de insectos, etc, aún es inmenso y han aparecido plagas de insectos resistentes a los insecticidas existentes. En estas circunstancias, es deseable el desarrollo de nuevos insecticidas agrícolas y hortícolas.

Solución al problema

40

El presente invento llevó a cabo una amplia investigación para resolver los problemas descritos anteriormente. Como resultado, el presente inventor descubrió que un compuesto heterocíclico condensado que contiene un grupo oxima representado por la fórmula general (1) o una sal del mismo es altamente eficaz para el control de plagas agrícolas y hortícolas y completó la presente invención.

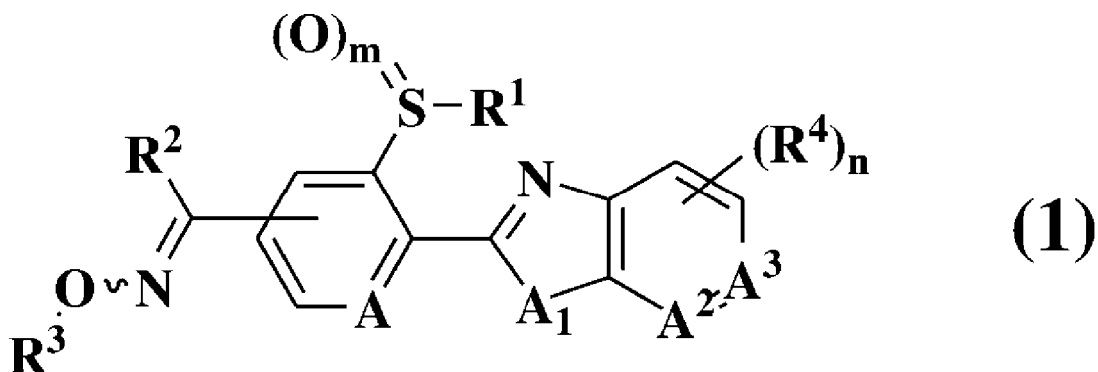
45

Es decir, la presente invención se refiere a lo siguiente.

[1] Un compuesto heterocíclico condensado representado por la fórmula general (1):

50

[Quim. 1]



{en donde

R¹ representa

- 5 (a1) un grupo alquilo (C₁-C₆);
 (a2) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆);
 (a3) un grupo alqueno (C₂-C₆) o
 (a4) un grupo alquino (C₂-C₆),

10 R² representa

- (b1) un átomo de hidrógeno;
 (b2) un grupo alquilo (C₁-C₆);
 (b3) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆);
 15 (b4) un grupo haloalquilo (C₁-C₆);
 (b5) un grupo amino;
 (b6) un grupo ciano;
 (b7) un grupo alcóxicarbonilo (C₁-C₆);
 (b8) un grupo aminocarbonilo;
 20 (b9) un grupo mono-alquilaminocarbonilo (C₂-C₆) o
 (b10) un grupo di-alquilaminocarbonilo (C₁-C₆),

R³ representa

- 25 (c1) un átomo de hidrógeno;
 (c2) un grupo alquilo (C₁-C₆);
 (c3) un grupo alqueno (C₂-C₆);
 (c4) un grupo alquino (C₂-C₆);
 (c5) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆);
 30 (c6) un grupo cicloalquil (C₃-C₆)alquilo (C₁-C₆);
 (c7) un grupo alcóxi (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆);
 (c8) un grupo haloalquilo (C₁-C₆);
 (c9) un grupo haloalqueno (C₂-C₆);
 (c10) un grupo haloalquino (C₂-C₆);
 35 (c11) un grupo fenilo;
 (c12) un grupo fenilo que tiene, en el anillo, de 1 a 5 grupos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan entre (a) un átomo de halógeno, (b) un grupo ciano, (c) un grupo nitro, (d) un grupo formilo, (e) un grupo alquilo (C₁-C₆), (f) un grupo haloalquilo (C₂-C₆), (g) un grupo alcóxi (C₁-C₆), (h) un grupo haloalcóxi (C₁-C₆), (i) un grupo cicloalquil (C₃-C₆)alcóxi (C₁-C₆), (j) un grupo alquiltio (C₁-C₆), (k) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆), (l) un grupo alquilsulfino (C₁-C₆), (m) un grupo haloalquilsulfino (C₁-C₆), (n) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆) y (o) un grupo haloalquilsulfonilo (C₁-C₆);
 (c13) un grupo fenilalquilo (C₁-C₆);
 45 (c14) un grupo fenilalquilo (C₁-C₆) que tiene, en el anillo, de 1 a 5 grupos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan entre (a) un átomo de halógeno, (b) un grupo ciano, (c) un grupo nitro, (d) un grupo formilo, (e) un grupo alquilo (C₁-C₆), (f) un grupo haloalquilo (C₁-C₆), (g) un grupo alcóxi (C₁-C₆), (h) un grupo haloalcóxi (C₁-C₆), (i) un grupo cicloalquil (C₃-C₆)alcóxi (C₁-C₆), (j) un grupo alquiltio (C₁-C₆), (k) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆), (l) un grupo alquilsulfino (C₁-C₆), (m) un grupo haloalquilsulfino (C₁-C₆), (n) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆) y (o) un grupo haloalquilsulfonilo (C₁-C₆);
 (c15) un grupo alquilcarbonilo (C₁-C₆);
 50 (c16) un grupo cicloalquilcarbonilo (C₃-C₆);
 (c17) un grupo cianoalquilo;
 (c18) un grupo alquiltio (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆);
 (c19) un grupo alquilsulfino (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆);
 (c20) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆);
 55 (c21) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆);
 (c22) un grupo haloalquilsulfino (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆) o
 (c23) un grupo haloalquilsulfonilo (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆),

R⁴ representa

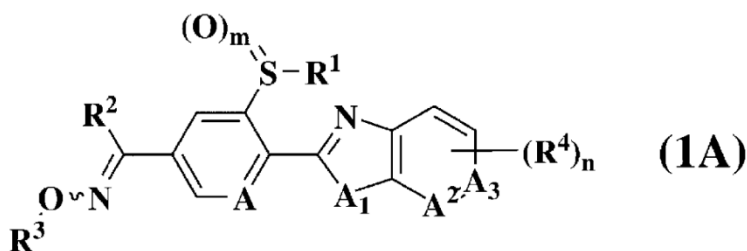
- 60 (d1) un átomo de halógeno;
 (d2) un grupo ciano;
 (d3) un grupo nitro;
 (d4) un grupo alquilo (C₁-C₆);
 65 (d5) un grupo alcóxi (C₁-C₆);
 (d6) un grupo alqueno (C₂-C₆);

- 5 (d7) un grupo alquinoxilo (C₂-C₆);
 (d8) un grupo haloalquilo (C₁-C₆);
 (d9) un grupo haloalcoxi (C₁-C₆);
 (d10) un grupo haloalquinoxilo (C₂-C₆);
 (d11) un grupo haloalquinoxilo (C₂-C₆);
 (d12) un grupo alquiltio (C₁-C₆);
 (d13) un grupo alquilsulfinilo (C₁-C₆);
 (d14) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆);
 10 (d15) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆);
 (d16) un grupo haloalquilsulfinilo (C₁-C₆) o
 (d17) un grupo haloalquilsulfonilo (C₁-C₆),

15 cada uno de A, A² y A³ representa CH o un átomo de nitrógeno,
 A¹ representa O, S o N-R⁵ (en donde R⁵ representa (e1) un grupo alquilo (C₁-C₆); (e2) un grupo cicloalquilo (C₃-
 C₆); (e3) un grupo alqueno (C₂-C₆); o (e4) un grupo alquino (C₂-C₆)),
 m representa 0, 1 o 2 y
 n representa 0, 1 o 2} o
 una sal del mismo.

20 [2] El compuesto heterocíclico condensado según el apartado [1] anterior o una sal del mismo, en donde el
 compuesto heterocíclico condensado está representado por la fórmula general (1A):

[Quim. 2]



25 {en donde

R¹ representa (a1) un grupo alquilo (C₁-C₆),
 R² representa

- 30 (b1) un átomo de hidrógeno o
 (b2) un grupo alquilo (C₁-C₆),

R³ representa

- 35 (c1) un átomo de hidrógeno o
 (c8) un grupo haloalquilo (C₁-C₆),

R⁴ representa

- 40 (d8) un grupo haloalquilo (C₁-C₆);
 (d9) un grupo haloalcoxi (C₁-C₆);
 (d15) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆);
 (d16) un grupo haloalquilsulfinilo (C₁-C₆) o
 45 (d17) un grupo haloalquilsulfonilo (C₁-C₆),

A representa un átomo de nitrógeno,
 cada uno de A² y A³ representa CH o un átomo de nitrógeno,
 A¹ representa O o N-R⁵ (en donde R⁵ representa (e1) un grupo alquilo (C₁-C₆)),
 m representa 0 o 2 y
 50 n representa 1}.

[3] El compuesto heterocíclico condensado según el apartado [2] anterior o una sal del mismo, en donde A¹ es O.

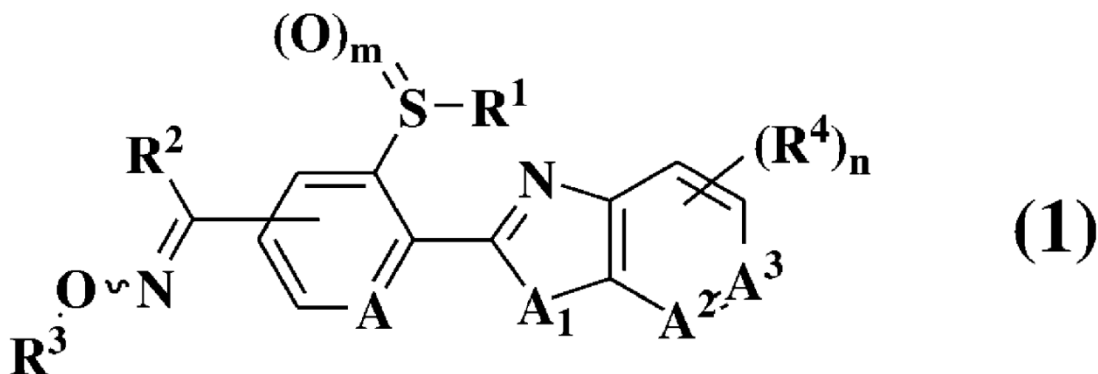
[4] Un insecticida agrícola y hortícola que comprende el compuesto heterocíclico condensado según uno cualquiera de los apartados [1] a [3] anteriores o una sal del mismo como principio activo.

[5] Un método para usar un insecticida agrícola y hortícola, comprendiendo el método la aplicación de una cantidad eficaz del compuesto heterocíclico condensado según uno cualquiera de los apartados [1] a [3] anteriores o una sal del mismo a las plantas o al suelo.

[6] Un agente de control ectoparasitario animal que comprende una cantidad eficaz del compuesto heterocíclico condensado según una cualquiera de los apartados [1] a [3] anteriores o una sal del mismo como principio activo.

[7] El compuesto heterocíclico condensado según el apartado [1] anterior o una sal del mismo, en donde el compuesto heterocíclico condensado está representado por la fórmula general (1):

[Quim. 3]



10

{en donde

R¹ representa

15

- (a1) un grupo alquilo (C₁-C₆);
- (a2) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆);
- (a3) un grupo alqueno (C₂-C₆); o
- (a4) un grupo alquino (C₂-C₆),

20

R² representa

25

- (b1) un átomo de hidrógeno;
- (b2) un grupo alquilo (C₁-C₆);
- (b3) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆);
- (b4) un grupo haloalquilo (C₁-C₆); o
- (b5) un grupo amino,

R³ representa

30

- (c1) un átomo de hidrógeno;
- (c2) un grupo alquilo (C₁-C₆);
- (c3) un grupo alqueno (C₂-C₆);
- (c4) un grupo alquino (C₂-C₆);
- (c5) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆);
- (c6) un grupo cicloalquil (C₃-C₆)alquilo (C₁-C₆);
- (c7) un grupo alcoxi (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆);
- (c8) un grupo haloalquilo (C₁-C₆);
- (c9) un grupo haloalqueno (C₂-C₆);
- (c10) un grupo haloalquino (C₂-C₆);
- (c11) un grupo fenilo;

35

40

(c12) un grupo fenilo que tiene, en el anillo, de 1 a 5 grupos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan entre (a) un átomo de halógeno, (b) un grupo ciano, (c) un grupo nitro, (d) un grupo formilo, (e) un grupo alquilo (C₁-C₆), (f) un grupo haloalquilo (C₂-C₆), (g) un grupo alcoxi (C₁-C₆), (h) un grupo haloalcoxi (C₁-C₆), (i) un grupo cicloalquil (C₃-C₆)alcoxi (C₁-C₆), (j) un grupo alquiltio (C₁-C₆), (k) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆), (l) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆), (m) un grupo haloalquilsulfonilo (C₁-C₆), (n) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆) y (o) un grupo haloalquilsulfonilo (C₁-C₆);

45

(c13) un grupo fenilalquilo (C₁-C₆);

50

(c14) un grupo fenilalquilo (C₁-C₆) que tiene, en el anillo, de 1 a 5 grupos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan entre (a) un átomo de halógeno, (b) un grupo ciano, (c) un grupo nitro, (d) un grupo formilo, (e) un grupo alquilo (C₁-C₆), (f) un grupo haloalquilo (C₁-C₆), (g) un grupo alcoxi (C₁-C₆), (h) un grupo haloalcoxi (C₁-C₆), (i) un grupo cicloalquil (C₃-C₆)alcoxi (C₁-C₆), (j) un grupo alquiltio (C₁-

C₆), (k) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆), (l) un grupo alquilsulfinilo (C₁-C₆), (m) un grupo haloalquilsulfinilo (C₁-C₆), (n) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆) y (o) un grupo haloalquilsulfonilo (C₁-C₆);
 (c15) un grupo alquilcarbonilo (C₁-C₆); o
 (c16) un grupo cicloalquilcarbonilo (C₃-C₆),

5

R⁴ representa

(d1) un átomo de halógeno;
 (d2) un grupo ciano;
 (d3) un grupo nitro;
 (d4) un grupo alquilo (C₁-C₆);
 (d5) un grupo alcoxi (C₁-C₆);
 (d6) un grupo alquenilo (C₂-C₆);
 (d7) un grupo alquinoxilo (C₂-C₆);
 (d8) un grupo haloalquilo (C₁-C₆);
 (d9) un grupo haloalcoxi (C₁-C₆);
 (d10) un grupo haloalquenilo (C₂-C₆);
 (d11) un grupo haloalquinoxilo (C₂-C₆);
 (d12) un grupo alquiltio (C₁-C₆);
 (d13) un grupo alquilsulfinilo (C₁-C₆);
 (d14) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆);
 (d15) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆);
 (d16) un grupo haloalquilsulfinilo (C₁-C₆); o
 (d17) un grupo haloalquilsulfonilo (C₁-C₆),

10

15

20

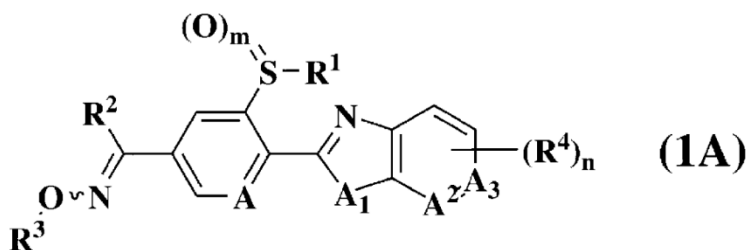
25

cada uno de A, A² y A³ representa CH o un átomo de nitrógeno,
 A¹ representa O, S o N-R⁵ (en donde R⁵ representa (e1) un grupo alquilo (C₁-C₆); (e2) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆); (e3) un grupo alquenilo (C₂-C₆); o (e4) un grupo alquinoxilo (C₂-C₆)),
 m representa 0, 1 o 2 y
 n representa 0, 1 o 2}.

30

[8] El compuesto heterocíclico condensado según el apartado [7] anterior o una sal del mismo, en donde el compuesto heterocíclico condensado está representado por la fórmula general (1A):

[Quim. 4]



35

{en donde

R¹ representa

(a1) un grupo alquilo (C₁-C₆);
 (a2) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆);
 (a3) un grupo alquenilo (C₂-C₆); o
 (a4) un grupo alquinoxilo (C₂-C₆),

40

45

R² representa

(b1) un átomo de hidrógeno;
 (b2) un grupo alquilo (C₁-C₆);
 (b3) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆); o
 (b5) un grupo amino,

50

R³ representa

- (c1) un átomo de hidrógeno;
 (c2) un grupo alquilo (C_1-C_6);
 (c3) un grupo alqueno (C_2-C_6);
 (c4) un grupo alquino (C_2-C_6);
 5 (c5) un grupo cicloalquilo (C_3-C_6);
 (c6) un grupo cicloalquil (C_3-C_6)alquilo (C_1-C_6);
 (c7) un grupo alcoxi (C_1-C_6)alquilo (C_1-C_6);
 (c8) un grupo haloalquilo (C_1-C_6);
 (c9) un grupo haloalqueno (C_2-C_6);
 10 (c10) un grupo haloalquino (C_2-C_6);
 (c11) un grupo fenilo;
 (c12) un grupo fenilo que tiene, en el anillo, de 1 a 5 grupos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan entre (a) un átomo de halógeno, (b) un grupo ciano, (c) un grupo nitro, (d) un grupo formilo, (e) un grupo alquilo (C_1-C_6), (f) un grupo haloalquilo (C_2-C_6), (g) un grupo alcoxi (C_1-C_6), (h) un grupo haloalcoxi (C_1-C_6), (i) un grupo cicloalquil (C_3-C_6)alcoxi (C_1-C_6), (j) un grupo alquiltio (C_1-C_6), (k) un grupo haloalquiltio (C_1-C_6), (l) un grupo alquilsulfino (C_1-C_6), (m) un grupo haloalquilsulfino (C_1-C_6), (n) un grupo alquilsulfono (C_1-C_6) y (o) un grupo haloalquilsulfono (C_1-C_6);
 (c13) un grupo fenilalquilo (C_1-C_6); o
 (c14) un grupo fenilalquilo (C_1-C_6) que tiene, en el anillo, de 1 a 5 grupos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan entre (a) un átomo de halógeno, (b) un grupo ciano, (c) un grupo nitro, (d) un grupo formilo, (e) un grupo alquilo (C_1-C_6), (f) un grupo haloalquilo (C_2-C_6), (g) un grupo alcoxi (C_1-C_6), (h) un grupo haloalcoxi (C_1-C_6), (i) un grupo cicloalquil (C_3-C_6)alcoxi (C_1-C_6), (j) un grupo alquiltio (C_1-C_6), (k) un grupo haloalquiltio (C_1-C_6), (l) un grupo alquilsulfino (C_1-C_6), (m) un grupo haloalquilsulfino (C_1-C_6), (n) un grupo alquilsulfono (C_1-C_6) y (o) un grupo haloalquilsulfono (C_1-C_6),

25

 R^4 representa

- (d1) un átomo de halógeno;
 (d2) un grupo ciano;
 30 (d3) un grupo nitro;
 (d4) un grupo alquilo (C_1-C_6);
 (d5) un grupo alcoxi (C_1-C_6);
 (d6) un grupo alqueno (C_2-C_6);
 (d7) un grupo alquino (C_2-C_6);
 35 (d8) un grupo haloalquilo (C_1-C_6);
 (d9) un grupo haloalcoxi (C_1-C_6);
 (d10) un grupo haloalqueno (C_2-C_6);
 (d11) un grupo haloalquino (C_2-C_6);
 (d12) un grupo alquiltio (C_1-C_6);
 40 (d13) un grupo alquilsulfino (C_1-C_6);
 (d14) un grupo alquilsulfono (C_1-C_6);
 (d15) un grupo haloalquiltio (C_1-C_6);
 (d16) un grupo haloalquilsulfino (C_1-C_6); o
 (d17) un grupo haloalquilsulfono (C_1-C_6),

45

cada uno de A, A^2 y A^3 representa CH o un átomo de nitrógeno,
 A^1 representa O, S o N- R^5 (en donde R^5 representa (e1) un grupo alquilo (C_1-C_6); (e2) un grupo cicloalquilo (C_3-C_6); (e3) un grupo alqueno (C_2-C_6); o (e4) un grupo alquino (C_2-C_6)),
 m representa 0, 1 o 2 y
 n representa 0, 1 o 2}.

50

[9] El compuesto heterocíclico condensado según el apartado [8] anterior o una sal del mismo, en donde

55 R^1 representa (a1) un grupo alquilo (C_1-C_6),
 R^2 representa

- (b1) un átomo de hidrógeno; o
 (b2) un grupo alquilo (C_1-C_6),

60

 R^3 representa

- (c1) un átomo de hidrógeno;
 (c2) un grupo alquilo (C_1-C_6);
 (c3) un grupo alqueno (C_2-C_6);
 65 (c7) un grupo alcoxi (C_1-C_6)alquilo (C_1-C_6);
 (c11) un grupo fenilo; o

(c13) un grupo fenilalquilo (C₁-C₆),

R⁴ representa

5 (d8) un grupo haloalquilo (C₁-C₆); o
(d15) un grupo haloalquilitio (C₁-C₆),

10 cada uno de A, A² y A³ representa un átomo de nitrógeno,
A¹ representa N-R⁵ (en donde R⁵ representa (e1) un grupo alquilo (C₁-C₆)),
m representa 0, 1 o 2 y
n representa 1.

[10] El compuesto heterocíclico condensado según el apartado [8] o [9] anterior o una sal del mismo, en donde

15 R¹ representa (a1) un grupo alquilo (C₁-C₆),
R² representa

20 (b1) un átomo de hidrógeno; o
(b2) un grupo alquilo (C₁-C₆),

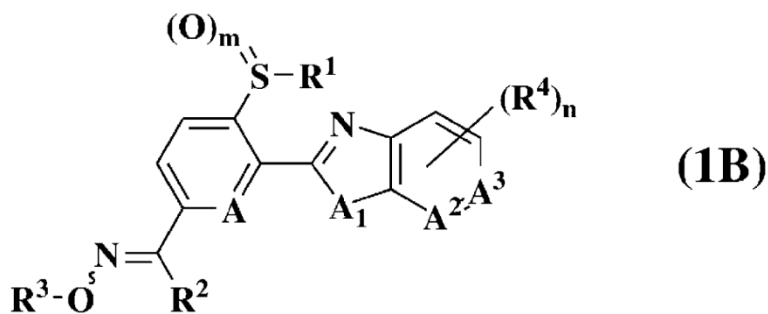
R³ representa

25 (c1) un átomo de hidrógeno;
(c2) un grupo alquilo (C₁-C₆);
(c3) un grupo alqueno (C₂-C₆);
(c7) un grupo alcoxi (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆);
(c11) un grupo fenilo; o
(c13) un grupo fenilalquilo (C₁-C₆),

30 R⁴ representa (d8) un grupo haloalquilo (C₁-C₆),
cada uno de A, A² y A³ representa un átomo de nitrógeno,
A¹ representa N-R⁵ (en donde R⁵ representa (e1) un grupo alquilo (C₁-C₆)),
m representa 2 y
35 n representa 1.

[11] El compuesto heterocíclico condensado según el apartado [7] anterior o una sal del mismo, en donde el compuesto heterocíclico condensado está representado por la fórmula general (1B):

[Quim. 5]



40 {en donde

R¹ representa

45 (a1) un grupo alquilo (C₁-C₆);
(a2) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆);
(a3) un grupo alqueno (C₂-C₆); o
(a4) un grupo alquino (C₂-C₆),

50 R² representa

- (b1) un átomo de hidrógeno;
 (b2) un grupo alquilo (C₁-C₆);
 (b3) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆); o
 (b5) un grupo amino,

5

R³ representa

- (c1) un átomo de hidrógeno;
 (c2) un grupo alquilo (C₁-C₆);
 10 (c3) un grupo alqueno (C₂-C₆);
 (c4) un grupo alquino (C₂-C₆);
 (c5) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆);
 (c6) un grupo cicloalquil (C₃-C₆)alquilo (C₁-C₆);
 15 (c7) un grupo alcoxi (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆);
 (c8) un grupo haloalquilo (C₁-C₆);
 (c9) un grupo haloalqueno (C₂-C₆);
 (c10) un grupo haloalquino (C₂-C₆);
 (c11) un grupo fenilo;
 20 (c12) un grupo fenilo que tiene, en el anillo, de 1 a 5 grupos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan entre (a) un átomo de halógeno, (b) un grupo ciano, (c) un grupo nitro, (d) un grupo formilo, (e) un grupo alquilo (C₁-C₆), (f) un grupo haloalquilo (C₂-C₆), (g) un grupo alcoxi (C₁-C₆), (h) un grupo haloalcoxi (C₁-C₆), (i) un grupo cicloalquil (C₃-C₆)alcoxi (C₁-C₆), (j) un grupo alquiltio (C₁-C₆), (k) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆), (l) un grupo alquilsulfinilo (C₁-C₆), (m) un grupo haloalquilsulfinilo (C₁-C₆), (n) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆) y (o) un grupo haloalquilsulfonilo (C₁-C₆);
 25 (c13) un grupo fenilalquilo (C₁-C₆); o
 (c14) un grupo fenilalquilo (C₁-C₆) que tiene, en el anillo, de 1 a 5 grupos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan entre (a) un átomo de halógeno, (b) un grupo ciano, (c) un grupo nitro, (d) un grupo formilo, (e) un grupo alquilo (C₁-C₆), (f) un grupo haloalquilo (C₁-C₆), (g) un grupo alcoxi (C₁-C₆), (h) un grupo haloalcoxi (C₁-C₆), (i) un grupo cicloalquil (C₃-C₆)alcoxi (C₁-C₆), (j) un grupo alquiltio (C₁-C₆), (k) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆), (l) un grupo alquilsulfinilo (C₁-C₆), (m) un grupo haloalquilsulfinilo (C₁-C₆), (n) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆) y (o) un grupo haloalquilsulfonilo (C₁-C₆),
 30

R⁴ representa

- 35 (d1) un átomo de halógeno;
 (d2) un grupo ciano;
 (d3) un grupo nitro;
 (d4) un grupo alquilo (C₁-C₆);
 (d5) un grupo alcoxi (C₁-C₆);
 40 (d6) un grupo alqueno (C₂-C₆);
 (d7) un grupo alquino (C₂-C₆);
 (d8) un grupo haloalquilo (C₁-C₆);
 (d9) un grupo haloalcoxi (C₁-C₆);
 45 (d10) un grupo haloalqueno (C₂-C₆);
 (d11) un grupo haloalquino (C₂-C₆);
 (d12) un grupo alquiltio (C₁-C₆);
 (d13) un grupo alquilsulfinilo (C₁-C₆);
 (d14) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆);
 50 (d15) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆);
 (d16) un grupo haloalquilsulfinilo (C₁-C₆); o
 (d17) un grupo haloalquilsulfonilo (C₁-C₆),

cada uno de A, A² y A³ representa CH o un átomo de nitrógeno,

- 55 A¹ representa O, S o N-R⁵ (en donde R⁵ representa (e1) un grupo alquilo (C₁-C₆); (e2) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆); (e3) un grupo alqueno (C₂-C₆); o (e4) un grupo alquino (C₂-C₆)),
 m representa 0, 1 o 2 y
 n representa 0, 1 o 2}.

[12] El compuesto heterocíclico condensado según el apartado [11] anterior o una sal del mismo, en donde

60

R¹ representa (a1) un grupo alquilo (C₁-C₆),
 R² representa

- 65 (b1) un átomo de hidrógeno; o
 (b2) un grupo alquilo (C₁-C₆),

R³ representa

- 5 (c1) un átomo de hidrógeno;
 (c2) un grupo alquilo (C₁-C₆);
 (c3) un grupo alqueno (C₂-C₆);
 (c7) un grupo alcoxi (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆);
 (c11) un grupo fenilo; o
 (c13) un grupo fenilalquilo (C₁-C₆),

10 R⁴ representa

- (d8) un grupo haloalquilo (C₁-C₆); o
 (d15) un grupo haloalquilitio (C₁-C₆),

15 cada uno de A, A² y A³ representa un átomo de nitrógeno,
 A¹ representa N-R⁵ (en donde R⁵ representa (e1) un grupo alquilo (C₁-C₆)),
 m representa 0, 1 o 2 y n representa 1.

20 [13] El compuesto heterocíclico condensado según el apartado [11] o [12] anterior o una sal del mismo, en donde

R¹ representa (a1) un grupo alquilo (C₁-C₆),
 R² representa

- 25 (b1) un átomo de hidrógeno; o
 (b2) un grupo alquilo (C₁-C₆),

R³ representa

- 30 (c1) un átomo de hidrógeno;
 (c2) un grupo alquilo (C₁-C₆);
 (c3) un grupo alqueno (C₂-C₆);
 (c7) un grupo alcoxi (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆);
 (c11) un grupo fenilo; o
 (c13) un grupo fenilalquilo (C₁-C₆),

35 R⁴ representa (d8) un grupo haloalquilo (C₁-C₆),
 cada uno de A, A² y A³ representa un átomo de nitrógeno,
 A¹ representa N-R⁵ (en donde R⁵ representa (e1) un grupo alquilo (C₁-C₆)),
 m representa 2 y
 40 n representa 1.

[14] Un insecticida agrícola y hortícola que comprende el compuesto heterocíclico condensado según uno cualquiera de los apartados [7] a [13] anteriores o una sal del mismo como principio activo.

45 [15] Un método para usar un insecticida agrícola y hortícola, comprendiendo el método la aplicación de una cantidad eficaz del compuesto heterocíclico condensado según uno cualquiera de los apartados [7] a [13] anteriores o una sal del mismo a las plantas o al suelo.

[16] Un agente de control ectoparasitario animal que comprende una cantidad eficaz del compuesto heterocíclico condensado según una cualquiera de los apartados [7] a [13] anteriores o una sal del mismo como principio activo.

50 Efecto de la invención

El compuesto heterocíclico condensado que contiene un grupo oxima de la presente invención o una sal del mismo no solo es altamente eficaz como insecticida agrícola y hortícola, sin que también es eficaz contra plagas que viven en el exterior de las mascotas, tales como perros y gatos, y animales domésticos, tales como ganado vacuno y ovino y contra otras plagas perjudiciales tales como termitas.

Descripción de las realizaciones

60 En las definiciones en relación con la fórmula general (1) que representa el compuesto heterocíclico condensado que contiene un grupo oxima de la presente invención o una sal del mismo, "halo" se refiere a un "átomo de halógeno" y representa un átomo de cloro, un átomo de bromo, un átomo de yodo o un átomo de flúor.

65 El "grupo alquilo (C₁-C₆)" se refiere a un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada de 1 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo isopropilo, un grupo n-butilo, un grupo isobutilo, un grupo sec-butilo, un grupo *terc*-butilo, un grupo n-pentilo, un grupo isopentilo, un grupo *terc*-pentilo, un grupo neopentilo, un grupo 2,3-dimetilpropilo, un grupo 1-etilpropilo, un grupo 1-metilbutilo, un grupo 2-metilbutilo, un grupo

n-hexilo, un grupo isohexilo, un grupo 2-hexilo, un grupo 3-hexilo, un grupo 2-metilpentilo, un grupo 3-metilpentilo, un grupo 1,1,2-trimetilpropilo, un grupo 3,3-dimetilbutilo o similar.

5 El "grupo cicloalquilo (C₃-C₆)" se refiere a un grupo alquilo cíclico de 3 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo ciclopropilo, un grupo ciclobutilo, un grupo ciclopentilo, un grupo ciclohexilo o similar. El "grupo alcoxi (C₁-C₆)" se refiere a un grupo alcoxi de cadena lineal o ramificada de 1 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo n-propoxi, un grupo isopropoxi, un grupo n-butoxi, un grupo sec-butoxi, un grupo *terc*-butoxi, un grupo n-pentiloxi, un grupo isopentiloxi, un grupo *terc*-pentiloxi, un grupo neopentiloxi, un grupo 2,3-dimetilpropiloxi, un grupo 1-etilpropiloxi, un grupo 1-metilbutiloxi, un grupo n-hexiloxi, un grupo isohexiloxi, un grupo 1,1,2-trimetilpropiloxi o similar. El "grupo alqueniloxi (C₂-C₆)" se refiere a un grupo alqueniloxi de cadena lineal o ramificada de 2 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo propeniloxi, un grupo buteniloxi, un grupo penteniloxi, un grupo hexeniloxi o similar. El "grupo alquiniloxi (C₂-C₆)" se refiere a un grupo alquiniloxi de cadena lineal o ramificada de 2 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo propiniloxi, un grupo butiniloxi, un grupo pentiniloxi, un grupo hexiniloxi o similar.

15 El "grupo alquiltio (C₁-C₆)" se refiere a un grupo alquiltio de cadena lineal o ramificada de 1 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo metiltio, un grupo etiltio, un grupo n-propiltio, un grupo isopropiltio, un grupo n-butiltio, un grupo sec-butiltio, un grupo *terc*-butiltio, un grupo n-pentiltio, un grupo isopentiltio, un grupo *terc*-pentiltio, un grupo neopentiltio, un grupo 2,3-dimetilpropiltio, un grupo 1-etilpropiltio, un grupo 1-metilbutiltio, un grupo n-hexiltio, un grupo isohexiltio, un grupo 1,1,2-trimetilpropiltio o similar. El "grupo alquilsulfinilo (C₁-C₆)" se refiere a un grupo alquilsulfinilo de cadena lineal o ramificada de 1 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo metilsulfinilo, un grupo etilsulfinilo, un grupo n-propilsulfinilo, un grupo isopropilsulfinilo, un grupo n-butilsulfinilo, un grupo sec-butilsulfinilo, un grupo *terc*-butilsulfinilo, un grupo n-pentilsulfinilo, un grupo isopentilsulfinilo, un grupo *terc*-pentilsulfinilo, un grupo neopentilsulfinilo, un grupo 2,3-dimetilpropilsulfinilo, un grupo 1-etilpropilsulfinilo, un grupo 1-metilbutilsulfinilo, un grupo n-hexilsulfinilo, un grupo isohexilsulfinilo, un grupo 1,1,2-trimetilpropilsulfinilo o similar. El "grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆)" se refiere a un grupo alquilsulfonilo de cadena lineal o ramificada de 1 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, un grupo metilsulfonilo, un grupo etilsulfonilo, un grupo n-propilsulfonilo, un grupo isopropilsulfonilo, un grupo n-butilsulfonilo, un grupo sec-butilsulfonilo, un grupo *terc*-butilsulfonilo, un grupo n-pentilsulfonilo, un grupo isopentilsulfonilo, un grupo *terc*-pentilsulfonilo, un grupo neopentilsulfonilo, un grupo 2,3-dimetilpropilsulfonilo, un grupo 1-etilpropilsulfonilo, un grupo 1-metilbutilsulfonilo, un grupo n-hexilsulfonilo, un grupo isohexilsulfonilo, un grupo 1,1,2-trimetilpropilsulfonilo o similar.

Los anteriormente mencionados "grupo alquilo (C₁-C₆)",

35 "grupo alquenilo (C₂-C₆)",
 "grupo alquinilo (C₂-C₆)",
 "grupo cicloalquilo (C₃-C₆)",
 "grupo cicloalquiloxi (C₃-C₆)",
 "grupo alcoxi (C₁-C₆)",
 "grupo alqueniloxi (C₂-C₆)",
 40 "grupo alquiniloxi (C₂-C₆)",
 "grupo alquiltio (C₁-C₆)",
 "grupo alquilsulfinilo (C₁-C₆)",
 "grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆)",
 "grupo alqueniltio (C₂-C₆)",
 45 "grupo alquiniltio (C₂-C₆)",
 "grupo alquensulfinilo (C₂-C₆)",
 "grupo alquensulfonilo (C₂-C₆)",
 "grupo alquinsulfinilo (C₂-C₆)",
 "grupo alquinsulfonilo (C₂-C₆)",
 50 "grupo cicloalquiltio (C₃-C₆)",
 "grupo cicloalquilsulfinilo (C₃-C₆)" y
 "grupo cicloalquilsulfonilo (C₃-C₆)"
 pueden estar sustituidos con uno o más átomos de halógeno en una o más posiciones sustituibles y, en el caso en el que cualquiera de los grupos anteriormente enumerados está sustituido con dos o más átomos de halógeno, los átomos de halógeno pueden ser iguales o diferentes.

El "grupo sustituido con uno o más átomos de halógeno" mencionado anteriormente se expresa como

60 un "grupo haloalquilo (C₁-C₆)",
 un "grupo haloalquenilo (C₂-C₆)",
 un "grupo haloalquinilo (C₂-C₆)",
 un "grupo halocicloalquilo (C₃-C₆)",
 un "grupo cicloalquiloxi (C₃-C₆)",
 un "grupo haloalcoxi (C₁-C₆)",
 65 un "grupo haloalqueniloxi (C₂-C₆)",
 un "grupo haloalquiniloxi (C₂-C₆)",

- 5 un "grupo haloalquiltio (C₁-C₆)",
 un "grupo haloalquilsulfinilo (C₁-C₆)",
 un "grupo alquilsulfonylo (C₁-C₆)",
 un "grupo haloalqueniitio (C₂-C₆)",
 un "grupo haloalquilitio (C₂-C₆)",
 un "grupo haloalqueniilsulfinilo (C₂-C₆)",
 un "grupo haloalquiniilsulfinilo (C₂-C₆)",
 un "grupo haloalqueniilsulfonylo (C₂-C₆)",
 un "grupo haloalquiniilsulfonylo (C₂-C₆)",
 10 un "grupo halocicloalquiltio (C₃-C₆)",
 un "grupo halocicloalquilsulfinilo (C₃-C₆)" o
 un "grupo halocicloalquilsulfonylo (C₃-C₆)".

Todas las definiciones y ejemplos anteriores de cada grupo son obvias para los expertos en la materia.

- 15 Las expresiones "(C₁-C₆)", "(C₂-C₆)", "(C₃-C₆)", etc., se refieren cada una al intervalo del número de átomos de carbono en cada grupo. La misma definición es válida para los grupos en los que dos o más de los grupos mencionados anteriormente están enlazados y, por ejemplo, el "grupo alcoxi (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆)" significa que un grupo alcoxi de cadena lineal o ramificada de 1 a 6 átomos de carbono está unido a un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada de 1 a 6 átomos de carbono.

- 20 Los ejemplos de la sal del compuesto heterocíclico condensado que contiene un grupo oxima representado por la fórmula general (1) de la presente invención incluyen sales de ácido orgánico, tales como clorhidratos, sulfatos, nitratos y fosfatos; sales de ácidos orgánicos, tales como acetatos, fumaratos, maleatos, oxalatos, metanosulfonatos, bencenosulfonatos y p-toluenosulfonatos; y sales con una base inorgánica u orgánica tales como un ion sodio, un ion potasio, un ion calcio y un ion trimetilamonio.

- 25 El compuesto heterocíclico condensado que contiene un grupo oxima representado por la fórmula general (1) de la presente invención y una sal del mismo puede tener uno o más centros quirales en la fórmula estructural, y puede existir en forma de dos o más clases de isómeros ópticos o diastereómeros. Todos los isómeros ópticos y mezclas de los isómeros en cualquier proporción están incluidos también en la presente invención. Además, el compuesto representado por la fórmula general (1) de la presente invención y una sal del mismo puede existir en forma de dos clases de isómeros geométricos debido a doble enlace carbono-carbono en la fórmula estructural. Todos los isómeros geométricos y mezclas de los isómeros en cualquier proporción están incluidos también en la presente invención. En el caso del compuesto de la presente invención, se forman un isómero syn (isómero Z) y un isómero anti (isómero E) debido a la presencia del grupo oxima. El compuesto de la presente invención puede ser cualquiera de los dos isómeros o una mezcla de los mismos en cualquier proporción.

- 40 Como el compuesto heterocíclico condensado que contiene un grupo oxima representado por la fórmula general (1) de la presente invención o una sal del mismo, se prefiere un compuesto de fórmula general (1) en la que

R¹ representa (a1) un grupo alquilo (C₁-C₆),
 R² representa

- 45 (b1) un átomo de hidrógeno;
 (b2) un grupo alquilo (C₁-C₆); o
 (b5) un grupo amino,

R³ representa

- 50 (c1) un átomo de hidrógeno;
 (c2) un grupo alquilo (C₁-C₆);
 (c4) un grupo alquiniilo (C₂-C₆);
 (c6) un grupo cicloalquil (C₃-C₆)alquilo (C₁-C₆);
 55 (c8) un grupo haloalquilo (C₁-C₆);
 (c15) un grupo alquilcarbonilo (C₁-C₆); o
 (c16) un grupo cicloalquilcarbonilo (C₃-C₆),

R⁴ representa

- 60 (d8) un grupo haloalquilo (C₁-C₆); o
 (d15) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆),

- 65 cada uno de A, A² y A³ representa CH o un átomo de nitrógeno,
 A¹ representa O o N-R⁵ (en donde R⁵ representa (e1) un grupo alquilo (C₁-C₆)),
 m representa 1 o 2 y

n representa 1.

Como el compuesto heterocíclico condensado que contiene un grupo oxima representado por la fórmula general (1A) de la presente invención o una sal del mismo, se prefiere un compuesto de fórmula general (1A) en el que

5

R¹ representa (a1) un grupo alquilo (C₁-C₆),
R² representa

10

(b1) un átomo de hidrógeno; o
(b5) un grupo amino,

R³ representa

15

(c1) un átomo de hidrógeno;
(c2) un grupo alquilo (C₁-C₆);
(c4) un grupo alquilo (C₂-C₆);
(c6) un grupo cicloalquil (C₃-C₆)alquilo (C₁-C₆); o
(c8) un grupo haloalquilo (C₁-C₆),

20

R⁴ representa

(d8) un grupo haloalquilo (C₁-C₆); o
(d15) un grupo haloalquilo (C₁-C₆),

25

cada uno de A, A² y A³ representa CH o un átomo de nitrógeno,
A¹ representa O o N-R⁵ (en donde R⁵ representa (e1) un grupo alquilo (C₁-C₆)),
m representa 1 o 2 y
n representa 1.

30

Como el compuesto heterocíclico condensado que contiene un grupo oxima representado por la fórmula general (1B) de la presente invención o una sal del mismo, se prefiere un compuesto de fórmula general (1B) en el que

35

R¹ representa (a1) un grupo alquilo (C₁-C₆),
R² representa

(b1) un átomo de hidrógeno;
(b2) un grupo alquilo (C₁-C₆); o
(b5) un grupo amino,

40

R³ representa

(c1) un átomo de hidrógeno;
(c2) un grupo alquilo (C₁-C₆);
(c4) un grupo alquilo (C₂-C₆);
(c6) un grupo cicloalquil (C₃-C₆)alquilo (C₁-C₆); o
(c8) un grupo haloalquilo (C₁-C₆),

45

R⁴ representa

50

(d8) un grupo haloalquilo (C₁-C₆); o
(d15) un grupo haloalquilo (C₁-C₆),

55

cada uno de A, A² y A³ representa CH o un átomo de nitrógeno,
A¹ representa O o N-R⁵ (en donde R⁵ representa (e1) un grupo alquilo (C₁-C₆)),
m representa 1 o 2 y
n representa 1.

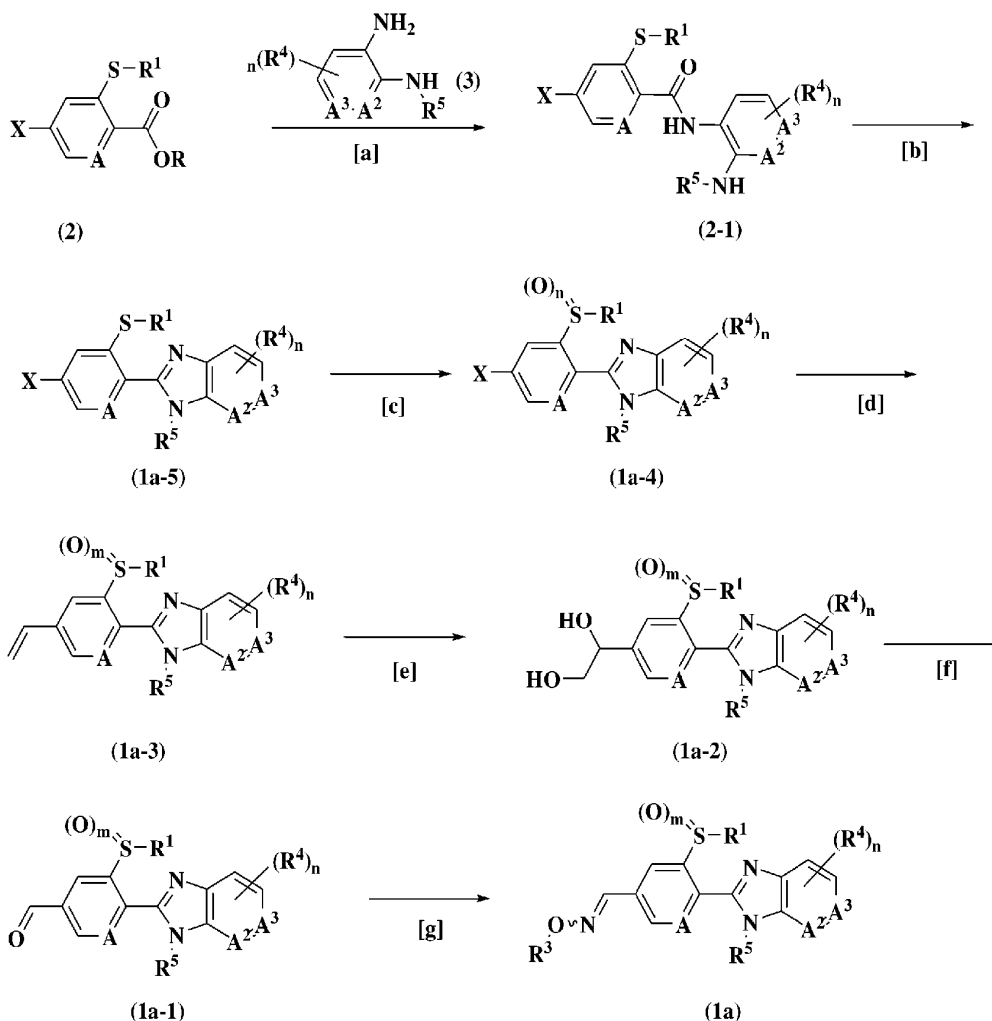
60

El compuesto heterocíclico condensado de la presente invención o una sal del mismo se puede producir según, por ejemplo, los métodos de producción descritos a continuación, que son ejemplos no limitantes en la presente invención. Los compuestos usados en la presente invención se producen mediante métodos conocidos o métodos conocidos *per se*.

Método de producción 1

65

[Quim. 6]



{En la fórmula, R^1 , R^3 , R^4 , R^5 , A, A^2 , A^3 , m y n son como se han definido anteriormente, X representa un átomo de halógeno tal como flúor, cloro, bromo y yodo (estas definiciones se aplicarán a lo largo de toda la presente memoria descriptiva), y R representa un grupo alquilo C_1 - C_3 tal como un grupo metilo y un grupo etilo.}

Método de producción en la etapa [a]

El éster del ácido carboxílico representado por la fórmula general (2) se hace reaccionar con el compuesto representado por la fórmula general (3) en presencia de una base y un disolvente inerte para la producción del compuesto amida representado por la fórmula general (2-1).

Los ejemplos de la base que se puede usar en esta reacción incluyen bases inorgánicas tales como hidróxido sódico, hidróxido potásico, carbonato sódico, carbonato potásico, hidrogenocarbonato sódico e hidrogenocarbonato potásico; hidruros de metal alcalino tales como hidruro sódico e hidruro potásico; acetatos tales como acetato potásico; alcóxidos de metal alcalino tales como t-butóxido potásico, metóxido sódico y etóxido sódico; aminas terciarias tales como trietilamina, diisopropilamina y 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno y compuestos aromáticos que contienen nitrógeno tales como piridina y dimetilaminopiridina. La cantidad de base usada está habitualmente en el intervalo de 1 a 10 veces la cantidad molar con respecto al compuesto representado por la fórmula general (3).

El disolvente inerte usado en esta reacción puede ser cualquier disolvente que no inhiba de manera notable el progreso de la reacción y los ejemplos incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; hidrocarburos aromáticos halogenados, tales como clorobenceno y diclorobenceno; éteres de cadena lineal o cíclicos tales como éter dietílico, metil *tert*-butil éter, dioxano y tetrahydrofurano; ésteres tales como acetato de etilo; amidas tales como dimetilformamida y dimetilacetamida; cetonas tales como acetona y metil etil cetona; y disolventes polares tales como dimetilsulfóxido y 1,3-dimetil-2-imidazolidinona. Uno de estos disolventes inertes se puede usar solo, o pueden usarse dos o más de ellos en forma de una mezcla.

Puesto que esta reacción es una reacción equimolar de los reactivos, estos se usan básicamente en cantidades equimolares, pero cualquiera de ellos se puede usar en una cantidad en exceso. La temperatura de reacción está en el intervalo de temperatura ambiente al punto de ebullición del disolvente inerte usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción y la temperatura de reacción, pero está básicamente en el intervalo de unos pocos minutos a 48 horas. Una vez completada la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla posterior a la reacción mediante un método habitual. Según sea necesario, recristalización, cromatografía en columna, etc., se pueden emplear para la purificación del compuesto de interés.

Método de producción en la etapa [b]

El compuesto heterocíclico condensado representado por la fórmula general (1a-5) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto de amida representado por la fórmula general (2-1) con un ácido en presencia de un disolvente inerte.

Los ejemplos del ácido usado en esta reacción incluyen ácidos inorgánicos, tales como ácido clorhídrico, ácido sulfúrico y ácido nítrico; ácidos orgánicos, tales como ácido fórmico, ácido acético, ácido propiónico, ácido trifluoroacético y ácido benzoico; ácidos sulfónicos tales como ácido metanosulfónico y ácido trifluorometanosulfónico y ácido fosfórico. La cantidad de ácido usada se selecciona de manera apropiada entre el intervalo de una cantidad molar de 0,01 a 10 veces con respecto al compuesto de amida representado por la fórmula general (2-1).

El disolvente inerte usado en esta reacción puede ser cualquier disolvente que no inhiba de manera notable el progreso de la reacción y los ejemplos incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; hidrocarburos aromáticos halogenados, tales como clorobenceno y diclorobenceno; éteres de cadena lineal o cíclicos tales como éter dietílico, metil *tert*-butil éter, dioxano y tetrahydrofurano; ésteres tales como acetato de etilo; amidas tales como dimetilformamida y dimetilacetamida; cetonas tales como acetona y metil etil cetona; y disolventes polares tales como dimetilsulfóxido y 1,3-dimetil-2-imidazolidinona. Uno de estos disolventes inertes se puede usar solo, o pueden usarse dos o más de ellos en forma de una mezcla.

La temperatura de reacción está en el intervalo de temperatura ambiente al punto de ebullición del disolvente inerte usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción y la temperatura de reacción, pero está básicamente en el intervalo de unos pocos minutos a 48 horas.

Una vez completada la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla posterior a la reacción mediante un método habitual. Según sea necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc., para la purificación del compuesto de interés.

Método de producción en la etapa [c]

El compuesto heterocíclico condensado representado por la fórmula general (1a-4) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto heterocíclico condensado representado por la fórmula general (1a-5) con un agente de oxidación en un disolvente inerte.

Los ejemplos del agente de oxidación usado en esta reacción incluyen peróxidos tales como solución de peróxido de hidrógeno, ácido perbenzoico y ácido *m*-cloroperoxibenzoico. La cantidad de agente de oxidación usada se selecciona según sea apropiado del intervalo de una cantidad molar de 1 a 5 veces con respecto al compuesto heterocíclico condensado representado por la fórmula general (1a-5).

El disolvente inerte usado en esta reacción puede ser cualquier disolvente que no inhibe de manera notable la reacción y los ejemplos incluyen éteres de cadena lineal o cíclicos tales como éter dietílico, tetrahydrofurano y dioxano; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; hidrocarburos aromáticos halogenados, tales como clorobenceno y diclorobenceno; nitrilos, tales como acetonitrilo; ésteres tales como acetato de etilo; ácidos orgánicos tales como ácido fórmico y ácido acético; y disolventes polares tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona y agua. Uno de estos disolventes inertes se puede usar solo, o pueden usarse dos o más de ellos en forma de una mezcla.

La temperatura de reacción en esta reacción se selecciona de manera adecuada entre el intervalo de -10 °C a la temperatura de reflujo del disolvente inerte usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción, la temperatura de reacción y similares y no es el mismo en cada caso, sino que se selecciona básicamente según sea apropiado en el intervalo de unos minutos a 48 horas. Una vez completada la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla posterior a la reacción mediante un método habitual. Según sea necesario, recristalización, cromatografía en columna, etc., se pueden emplear para la purificación del compuesto de interés.

Método de producción en la etapa [d]

El compuesto heterocíclico condensado representado por la fórmula general (1a-3) se puede producir mediante acoplamiento cruzado del compuesto heterocíclico condensado representado por la fórmula general (1a-4) con un compuesto de ácido vinilborónico en presencia de un catalizador metálico y una base en un disolvente inerte.

- 5 Los ejemplos del catalizador metálico que se pueden usar en esta reacción incluyen un catalizador de paladio, un catalizador de níquel, un catalizador de hierro, un catalizador de rutenio, un catalizador de platino, un catalizador de rodio y un catalizador de iridio. Dicho catalizador metálico se puede usar en forma de "un metal", "un metal soportado", "una sal de metal tal como cloruro de metal, un bromuro de metal, un yoduro de metal, un nitrato de metal, un sulfato de metal, un carbonato de metal, un oxalato de metal, un acetato de metal y un óxido de metal" o "un compuesto complejo tal como un complejo de olefina, un complejo de fosfina, un complejo de amina, un complejo de amina y un complejo de acetilacetato". Se prefiere un catalizador de paladio.

Los ejemplos del catalizador de paladio incluyen metales de paladio tales como negro de paladio y esponja de paladio y metales de paladio soportados tales como paladio/alúmina, paladio/carbono, paladio/silice y paladio/zeolita tipo Y.

- 15 Los ejemplos de sal de metal de paladio incluyen cloruro de paladio, bromuro de paladio, yoduro de paladio y acetato de paladio. Los ejemplos del compuesto complejo de paladio incluyen dímero de π -cloruro de alilpaladio, acetilacetato de paladio,

- 20 diclorobis(acetonitrilo)paladio,
diclorobis(benzonitrilo)paladio,
bis(dibencilidenoacetona)paladio,
tris(dibencilidenoacetona)dipaladio,
tris(dibencilidenoacetona)dipaladio (aducto de cloroformo),
diclorodiamina paladio,
25 diclorobis(trifenilfosfina)paladio,
diclorobis(triciclohexilfosfina)paladio,
tetraquis(trifenilfosfina)paladio,
dicloro[1,2-bis(difenilfosfino)etano]paladio,
dicloro[1,3-bis(difenilfosfino)propano]paladio,
30 dicloro[1,4-bis(difenilfosfino)butano]paladio,
dicloro[1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno]paladio y
un complejo [(difenilfosfino)ferroceno]dicloropaladio-diclorometano.

- 35 Estos catalizadores de paladio se pueden usar solos o junto con una fosfina terciaria. Los ejemplos de la fosfina terciaria que se pueden usar junto con el catalizador de paladio incluyen trifenilfosfina, trimetilfosfina, trietilfosfina, tributilfosfina, tri(*terc*-butil)fosfina, triciclohexilfosfina, tri-*o*-tolilfosfina, triocilfosfina,

- 40 9,9-dimetil-4,5-bis(difenilfosfino)xanteno,
2-(di-*terc*-butilfosfino)bifenilo,
2-(diciclohexilfosfino)bifenilo,
1,2-bis(difenilfosfino)etano,
1,3-bis(difenilfosfino)propano,
1,4-bis(difenilfosfino)butano, 1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno,
45 (R)-(+)-2,2'-bis(difenilfosfino)-1,1'-binaftilo,
(S)-(-)-2,2'-bis(difenilfosfino)-1,1'-binaftilo y
(\pm)-2,2'-bis(difenilfosfino)-1,1'-binaftilo.

- 50 Los ejemplos del compuesto de ácido vinilborónico que se puede usar en esta reacción incluyen bromuro de vinilmagnesio, cloruro de vinilmagnesio, cloruro de vinilcinc, tributilvinilestaño, viniltrifluoroborato potásico, ácido vinilborónico, anhídrido vinilborónico, 2-metil-2,4-pentanodiol éster del ácido vinilborónico, pinacol éster del ácido vinilborónico y trietoxivinilsilano.

- 55 Los ejemplos de la base que se puede usar en esta reacción incluyen bases inorgánicas tales como hidróxido sódico, hidróxido potásico, carbonato sódico, carbonato potásico, carbonato de cesio, hidrogenocarbonato sódico e hidrogenocarbonato potásico; hidruros de metal alcalino tales como hidruro sódico e hidruro potásico; y alcóxidos tales como metóxido de sodio, etóxido de sodio y *terc*-butóxido de potasio. La cantidad de base usada está habitualmente en el intervalo de una cantidad molar de aproximadamente 1 a 5 veces con respecto al compuesto heterocíclico condensado representado por la fórmula general (1a-4).

- 60 El disolvente inerte usado en esta reacción puede ser cualquier disolvente que no inhiba de manera notable la reacción y los ejemplos incluyen alcoholes tales como metanol, etanol, propanol, butanol y 2-propanol; éteres de cadena lineal o cíclicos tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, dioxano y 1,2-dimetoxietano (DME); hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; hidrocarburos aromáticos halogenados, tales como clorobenceno y diclorobenceno; nitrilos, tales como acetonitrilo; ésteres tales como acetato de etilo; disolventes polares, tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, dimetilsulfóxido y 1,3-dimetil-2-imidazolidinona; y agua. Uno de estos disolventes inertes se

puede usar solo, o pueden usarse dos o más de ellos en forma de una mezcla.

La temperatura de reacción en esta reacción habitualmente está en el intervalo de aproximadamente 0 °C al punto de ebullición del disolvente usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción, la temperatura de reacción y similares, sino que se selecciona básicamente según sea apropiado en el intervalo de unos minutos a 48 horas. Esta reacción se puede llevar a cabo en atmósfera de un gas inerte tal como gas nitrógeno y gas argón. Una vez completada la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla posterior a la reacción mediante un método habitual. Según sea necesario, recristalización, cromatografía en columna, etc., se pueden emplear para la purificación del compuesto de interés.

Método de producción en la etapa [e]

El compuesto heterocíclico condensado que contiene diol representado por la fórmula general (1a-2) se puede producir mediante reacción del compuesto heterocíclico condensado que contiene vinilo representado por la fórmula general (1a-3) en presencia de tetraóxido de osmio y un agente de oxidación según el método descrito en Lecture of Experimental Chemistry (Jikken Kagaku Kouza), 4ª edición, vol. 23, Organic Chemistry V, Oxidation Reaction (publicado por Maruzen Co., Ltd.). Una vez completada la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla posterior a la reacción mediante un método habitual. Según sea necesario, recristalización, cromatografía en columna, etc., se pueden emplear para la purificación del compuesto de interés.

Método de producción en la etapa [f]

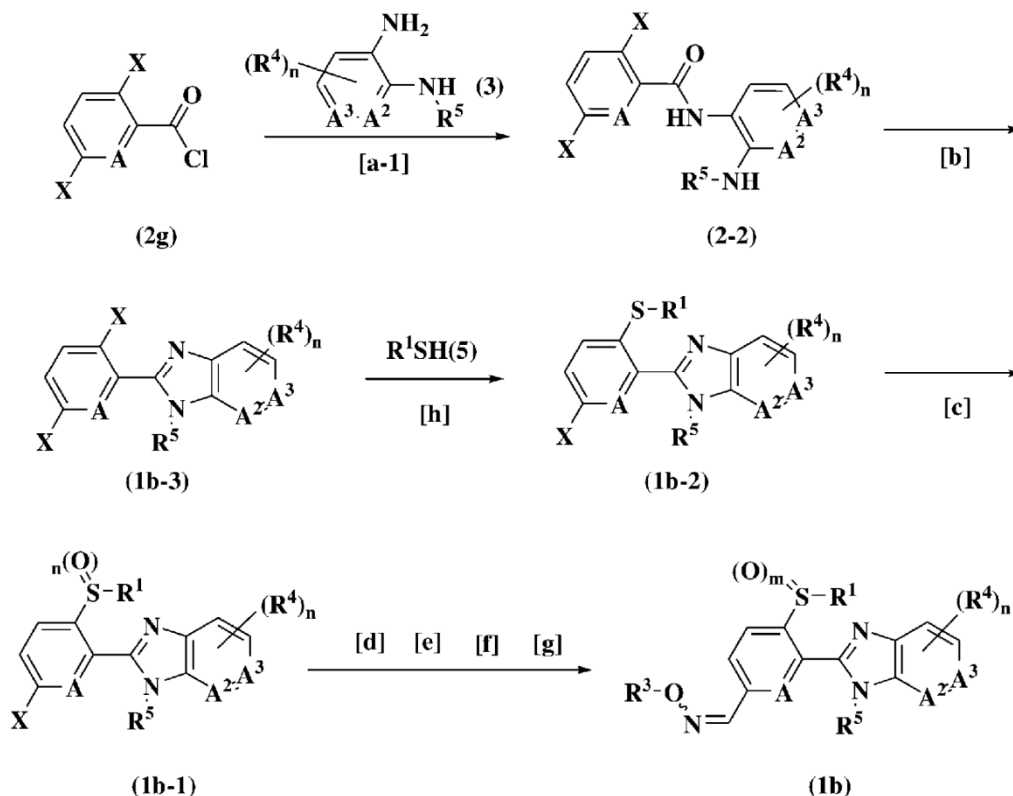
El compuesto heterocíclico condensado que contiene formilo representado por la fórmula general (1a-1) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto heterocíclico condensado que contiene diol representado por la fórmula general (1a-2) con un compuesto de ácido peryódico en presencia de un disolvente inerte según el método descrito en New Lecture of Experimental Chemistry (Shin Jikken Kagaku Kouza), vol. 15, Oxidation and Reduction I-1 (publicado por Maruzen Co., Ltd.). Una vez completada la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla posterior a la reacción mediante un método habitual. Según sea necesario, recristalización, cromatografía en columna, etc., se pueden emplear para la purificación del compuesto de interés.

Método de producción en la etapa [g]

El compuesto heterocíclico condensado que contiene oxima representado por la fórmula general (1a) se puede producir a partir del compuesto de formil imidazopiridazina representado por la fórmula general (1a-1) convirtiendo el grupo formilo en un grupo oxima según el método descrito en ORGANIC FUNCTIONAL GROUP PREPARATIONS III, 2ª edición, ACADEMIC PRESS, INC. Una vez completada la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla posterior a la reacción mediante un método habitual. Según sea necesario, recristalización, cromatografía en columna, etc., se pueden emplear para la purificación del compuesto de interés.

Método de producción 2

[Quim. 7]



(En la fórmula, R¹, R³, R⁴, R⁵, A, A², A³, m y n son como se han definido anteriormente, y X representa un átomo de halógeno.)

5

Método de producción en la etapa [a-1]

El compuesto de amida representado por la fórmula general (2-2) se puede producir haciendo reaccionar el cloruro carboxílico representado por la fórmula general (2g) con el compuesto representado por la fórmula general (3) en presencia de una base y un disolvente inerte. El cloruro carboxílico usado procede del ácido carboxílico correspondiente mediante el método habitual usado en síntesis orgánica.

10

Los ejemplos de la base que se puede usar en esta reacción incluyen bases inorgánicas tales como hidróxido sódico, hidróxido potásico, carbonato sódico, carbonato potásico, hidrogenocarbonato sódico e hidrogenocarbonato potásico; hidruros de metal alcalino tales como hidruro sódico e hidruro potásico; acetatos tales como acetato potásico; alcóxidos de metal alcalino tales como t-butóxido potásico, metóxido sódico y etóxido sódico; aminas terciarias tales como trietilamina, diisopropilamina y 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno; y compuestos aromáticos que contienen nitrógeno tales como piridina y dimetilaminopiridina. La cantidad de base usada está habitualmente en el intervalo de una cantidad molar de 1 a 10 veces con respecto al compuesto representado por la fórmula general (2g).

15

El disolvente inerte usado en esta reacción puede ser cualquier disolvente que no inhiba de manera notable el progreso de la reacción y los ejemplos incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; hidrocarburos aromáticos halogenados, tales como clorobenceno y diclorobenceno; éteres de cadena lineal o cíclicos tales como éter dietílico, metil *tert*-butil éter, dioxano y tetrahydrofurano; ésteres tales como acetato de etilo; amidas tales como dimetilformamida y dimetilacetamida; cetonas tales como acetona y metil etil cetona; y disolventes polares tales como dimetilsulfóxido y 1,3-dimetil-2-imidazolidinona. Uno de estos disolventes inertes se puede usar solo, o pueden usarse dos o más de ellos en forma de una mezcla.

20

Puesto que esta reacción es una reacción equimolar de los reactivos, estos se usan básicamente en cantidades equimolares, pero cualquiera de ellos se puede usar en una cantidad en exceso. La temperatura de reacción está en el intervalo de temperatura ambiente al punto de ebullición del disolvente inerte usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción y la temperatura de reacción, pero está básicamente en el intervalo de unos pocos minutos a 48 horas. Una vez completada la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla posterior a la reacción mediante un método habitual. Según sea necesario, recristalización, cromatografía en columna, etc., se pueden emplear para la purificación del compuesto de interés.

25

30

35

Método de producción en la etapa [b]

- 5 El compuesto representado por la fórmula general (1b-3) se puede producir a partir del compuesto de amida representado por la fórmula general (2-2) de la misma manera que se ha descrito en la etapa [b] del método de producción 1 anterior.

Método de producción en la etapa [h]

- 10 El compuesto representado por la fórmula general (1b-2) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula general (1b-3) con R¹SH (para más detalles véase el método de producción del producto intermedio (2) mostrado a continuación).

Método de producción en la etapa [c]

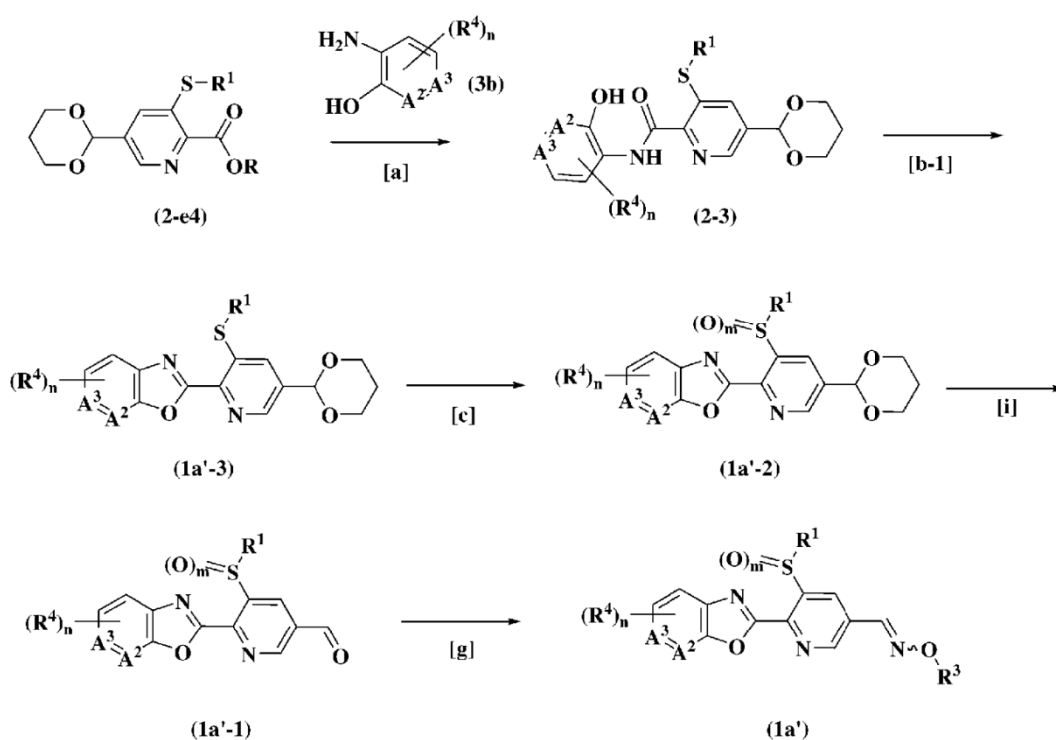
- 15 El compuesto representado por la fórmula general (1b-1) se puede producir a partir del compuesto representado por la fórmula general (1b-2) de la misma manera que se describe en la etapa [c] del método de producción 1 anterior.

Métodos de producción en las etapas [d], [e], [f] y [g]

- 20 El compuesto representado por la fórmula general (1b) se puede producir a partir del compuesto representado por la fórmula general (1b-1) de la misma manera que se describe en la etapas [d], [e], [f], [g] del método de producción 1 anterior.

- 25 Método de producción 3

[Quim. 8]



(En la fórmula, R¹, R³, R⁴, R, A², A³, m y n son como se han definido anteriormente.)

- 30 Método de producción en la etapa [a]

35 El compuesto representado por la fórmula general (2-3) se puede producir a partir del compuesto representado por la fórmula general (2-e4) y el compuesto representado por la fórmula general (3b) de la misma manera que se describe en la etapa [a] del método de producción 1 anterior.

Método de producción en la etapa [b-1]

El compuesto representado por la fórmula general (1a'-3) se puede producir a partir del compuesto representado por la fórmula general (2-3) de la misma manera que se describe en la etapa [b] del método de producción 1 anterior.

5 Como alternativa, el compuesto representado por la fórmula general (1a'-3) se puede producir por la reacción del compuesto representado por la fórmula general (2-3) en presencia de un disolvente inerte según el método descrito en Synthesis 1981, 1 (preferentemente, usando diéster del ácido azodicarboxílico y trifenilfosfina).

Método de producción en la etapa [c]

10 El compuesto representado por la fórmula general (1a'-2) se puede producir a partir del compuesto representado por la fórmula general (1a'-3) de la misma manera que se describe en la etapa [c] del método de producción 1 anterior.

Método de producción en la etapa [i]

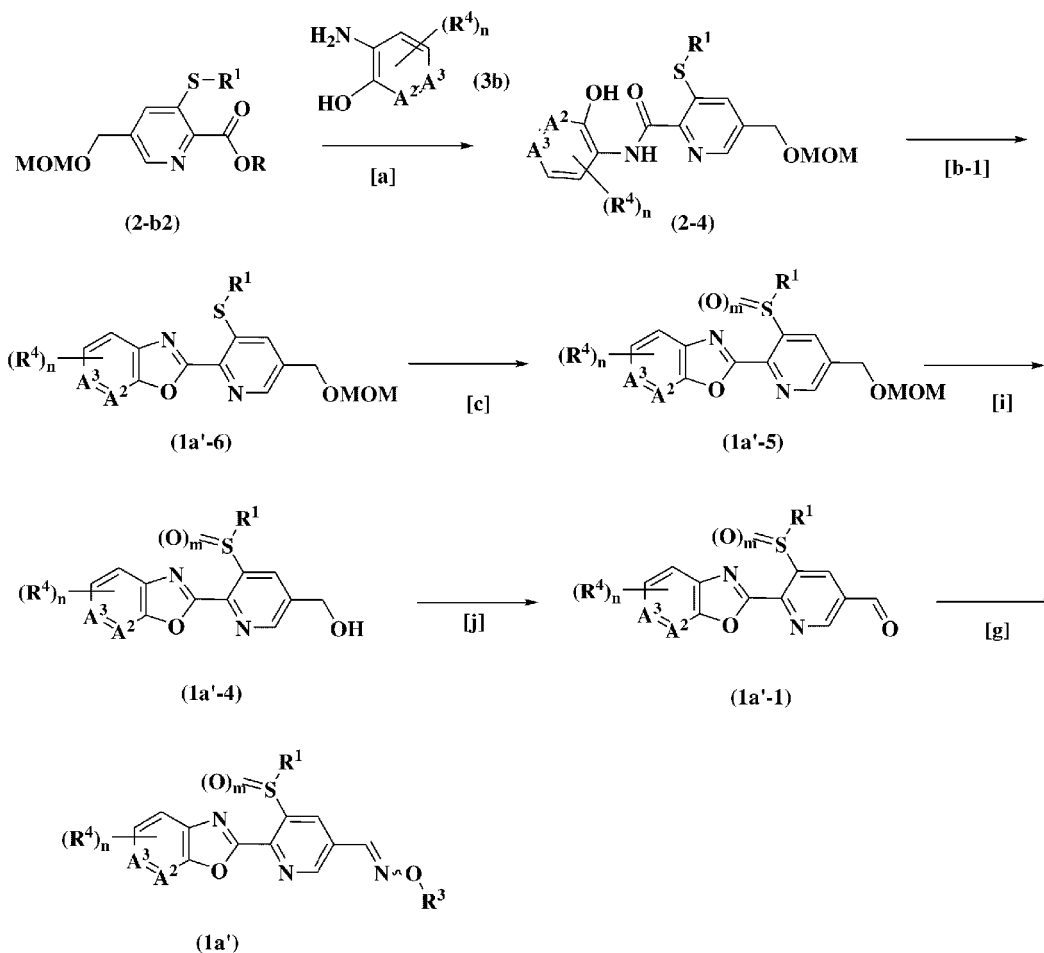
15 El compuesto representado por la fórmula general (1a'-1) se puede producir por desprotección del compuesto representado por la fórmula general (1a'-2) según el método descrito en Greene's Protective GROUPS in Organic SYNTHESIS (4ª edición).

20 Método de producción en la etapa [g]

El compuesto representado por la fórmula general (1a') se puede producir a partir del compuesto representado por la fórmula general (1a'-1) de la misma manera que se describe en la etapa [g] del método de producción 1 anterior.

25 Método de producción 4

[Quim. 9]



30 (En la fórmula, R¹, R³, R⁴, R, A², A³, m y n son como se han definido anteriormente, y MOM representa metoximetilo.)

Método de producción en la etapa [a]

5 El compuesto representado por la fórmula general (2-4) se puede producir a partir del compuesto representado por la fórmula general (2-b2) y el compuesto representado por la fórmula general (3b) de la misma manera que se describe en la etapa [a] del método de producción 1 anterior.

Método de producción en la etapa [b-1]

10 El compuesto representado por la fórmula general (1a'-6) se puede producir a partir del compuesto representado por la fórmula general (2-4) de la misma manera que se describe en la etapa [b] del método de producción 1 anterior. Como alternativa, el compuesto representado por la fórmula general (1a'-6) se puede producir por la reacción del compuesto representado por la fórmula general (2-4) en presencia de un disolvente inerte según el método descrito en Synthesis 1981, 1 (preferentemente, usando diéster del ácido azodicarboxílico y trifenilfosfina).

15 Método de producción en la etapa [c]

El compuesto representado por la fórmula general (1a'-5) se puede producir a partir del compuesto representado por la fórmula general (1a'-6) de la misma manera que se describe en la etapa [c] del método de producción 1 anterior.

20 Método de producción en la etapa [i]

El compuesto representado por la fórmula general (1a'-4) se puede producir por desprotección del compuesto representado por la fórmula general (1a'-5) según el método descrito en Greene's Protective GROUPS in Organic SYNTHESIS (4ª edición).

25

Método de producción en la etapa [j]

El compuesto representado por la fórmula general (1a'-1) se puede producir a partir del compuesto representado por la fórmula general (1a'-4) convirtiendo el grupo hidroximetilo en un grupo formilo según el método descrito en Synthesis 1996, 1153.

30

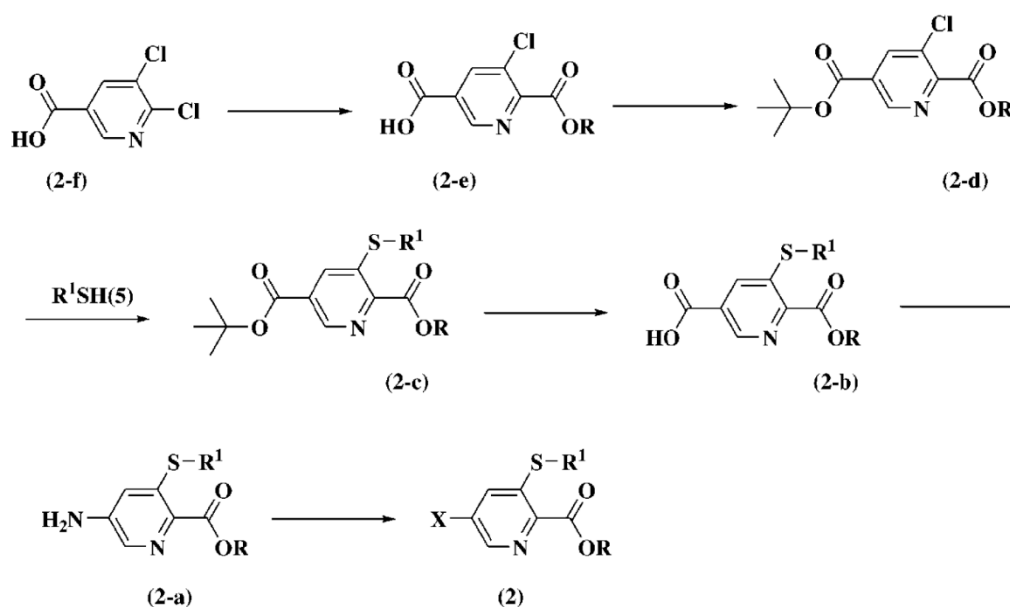
Método de producción en la etapa [g]

El compuesto representado por la fórmula general (1a') se puede producir a partir del compuesto representado por la fórmula general (1a'-1) convirtiendo el grupo formilo en un grupo oxima de la misma manera que se describe en la etapa [g] del método de producción 1 anterior.

35

Método de producción del producto intermedio (2)

[Quim. 10]



40

(En la fórmula, R¹ es como se ha definido anteriormente, R representa un grupo formador de éster, por ejemplo, n grupo alquilo C₁-C₃ o similar, y X representa un átomo de halógeno.)

El compuesto representado por la fórmula general (2), que es un producto intermedio en el curso de la producción del compuesto de la presente invención, se puede producir por el método siguiente.

5 El ácido dicloropiridin-3-carboxílico (2-f), que está disponible habitualmente, se somete a la reacción (reacción de Heck) según el método descrito en JP-A 2005-272338 para dar el ácido piridin-3-carboxílico (2-e), el cual es un grupo éster introducido en la 6ª posición. Una vez completada la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla posterior a la reacción mediante un método habitual. Según sea necesario, recristalización, cromatografía en columna, etc., se pueden emplear para la purificación del compuesto de interés.

10 El éster del ácido piridin-2,6-dicarboxílico (2-d) se puede producir como sigue. En primer lugar, el ácido piridin-3-carboxílico (2-e), que tiene un grupo éster introducido, se hace reaccionar con un agente de cloración en un disolvente inerte según el método de síntesis habitual para dar un compuesto de cloruro piridincarboxílico. A continuación, el compuesto de cloruro piridincarboxílico se hace reaccionar con un alcohol *terc*-butílico para dar el compuesto deseado.

15 El éster del ácido piridin dicarboxílico (2-c) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto de éster del ácido piridin dicarboxílico representado por la fórmula general (2-d) con el compuesto de tiol representado por la fórmula general (5) en presencia de una base y un disolvente inerte.

20 Los ejemplos de la base usada en esta reacción incluyen bases inorgánicas tales como hidróxido sódico, hidróxido potásico, carbonato sódico, carbonato potásico, hidrogenocarbonato sódico e hidrogenocarbonato potásico; acetatos tales como acetato sódico y acetato potásico; alcóxidos de metal alcalino tales como *t*-butóxido potásico, metóxido sódico y etóxido sódico; aminas terciarias tales como trietilamina, diisopropiletilamina y 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno; y compuestos aromáticos que contienen nitrógeno tales como piridina y dimetilaminopiridina. La cantidad de base usada está habitualmente en el intervalo de una cantidad molar de 1 a 10 veces con respecto al compuesto de éster del ácido piridin dicarboxílico representado por la fórmula general (2-d). En el caso en el que se usa una sal alcalina del compuesto representado por la fórmula general (5), no siempre es necesario usar una base.

30 El disolvente inerte usado en esta reacción puede ser cualquier disolvente que no inhiba de manera notable el progreso de la reacción y los ejemplos incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; hidrocarburos aromáticos halogenados, tales como clorobenceno y diclorobenceno; éteres de cadena lineal o cíclicos tales como éter dietílico, metil *terc*-butil éter, dioxano y tetrahidrofurano; ésteres tales como acetato de etilo; amidas tales como dimetilformamida y dimetilacetamida; cetonas tales como acetona y metil etil cetona; y disolventes polares tales como dimetilsulfóxido y 1,3-dimetil-2-imidazolidinona. Uno de estos disolventes inertes se puede usar solo, o pueden usarse dos o más de ellos en forma de una mezcla.

40 Puesto que esta reacción es una reacción equimolar de los reactivos, el compuesto representado por la fórmula general (5) y el compuesto de éster del ácido piridin dicarboxílico representado por la fórmula general (2-d) se usa básicamente en cantidades equimolares, pero cualquiera de ellos se puede usar en una cantidad en exceso. La temperatura de reacción está en el intervalo de -10 °C al punto de ebullición del disolvente inerte usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción y la temperatura de reacción, pero está básicamente en el intervalo de unos pocos minutos a 48 horas. Una vez completada la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla posterior a la reacción mediante un método habitual. Según sea necesario, recristalización, cromatografía en columna, etc., se pueden emplear para la purificación del compuesto de interés.

El ácido piridin dicarboxílico (2-b) se puede producir hidrolizando el compuesto de éster del ácido piridin dicarboxílico representado por la fórmula general (2-c) en presencia de un ácido y/o un disolvente inerte.

50 Los ejemplos del ácido usado en esta reacción incluyen ácidos inorgánicos, tales como ácido clorhídrico, ácido sulfúrico y ácido nítrico; ácidos orgánicos, tales como ácido fórmico, ácido acético, ácido propiónico, ácido trifluoroacético y ácido benzoico; y ácidos sulfónicos tales como ácido metanosulfónico y ácido trifluorometanosulfónico. La cantidad de ácido usada se selecciona de manera apropiada del intervalo de una cantidad molar de 1 a 10 veces con respecto al compuesto de éster del ácido piridin dicarboxílico representado por la fórmula general (2-c). En algunos casos, también se puede usar el ácido como disolvente.

60 El disolvente inerte usado en esta reacción puede ser cualquier disolvente que no inhiba de manera notable el progreso de la reacción y los ejemplos incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; hidrocarburos aromáticos halogenados, tales como clorobenceno y diclorobenceno; éteres de cadena lineal o cíclicos tales como éter dietílico, metil *terc*-butil éter, dioxano y tetrahidrofurano; ésteres tales como acetato de etilo; amidas tales como dimetilformamida y dimetilacetamida; cetonas tales como acetona y metil etil cetona; y disolventes polares tales como dimetilsulfóxido y 1,3-dimetil-2-imidazolidinona. Uno de estos disolventes inertes se puede usar solo, o pueden usarse dos o más de ellos en forma de una mezcla. En el caso en el que se usa el ácido como disolvente, no siempre es necesario usar otro disolvente.

65

La temperatura de reacción está en el intervalo de temperatura ambiente al punto de ebullición del disolvente inerte usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción y la temperatura de reacción, pero está básicamente en el intervalo de unos pocos minutos a 48 horas.

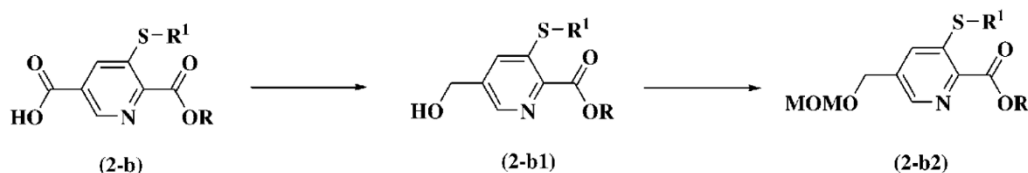
- 5 Una vez completada la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla posterior a la reacción mediante un método habitual. Según sea necesario, recristalización, cromatografía en columna, etc., se pueden emplear para la purificación del compuesto de interés.

10 El éster del ácido aminopiridin carboxílico (2-a) se puede producir haciendo reaccionar el ácido piridin carboxílico representado por la fórmula general (2-b) con DPPA (difencilfosforil azida) en presencia de una base y alcohol *terc*-butílico, según el método descrito en J. A. Chem. Soc. 1972, 94, 6203-6205, seguido de hidrólisis en condiciones ácidas. Una vez completada la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla posterior a la reacción mediante un método habitual. Según sea necesario, recristalización, cromatografía en columna, etc., se pueden emplear para la purificación del compuesto de interés.

15 El éster del ácido halopiridin carboxílico (2) se puede producir sometiendo el éster del ácido aminopiridin carboxílico representado por la fórmula general (2-a) a una reacción de Sandmeyer, es decir, según el método descrito en Chem. Rev. 1988, 88, 765. Una vez completada la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla posterior a la reacción mediante un método habitual. Según sea necesario, recristalización, cromatografía en columna, etc., se pueden emplear para la purificación del compuesto de interés.

Método de producción del producto intermedio (2-b2)

[Quim. 11]

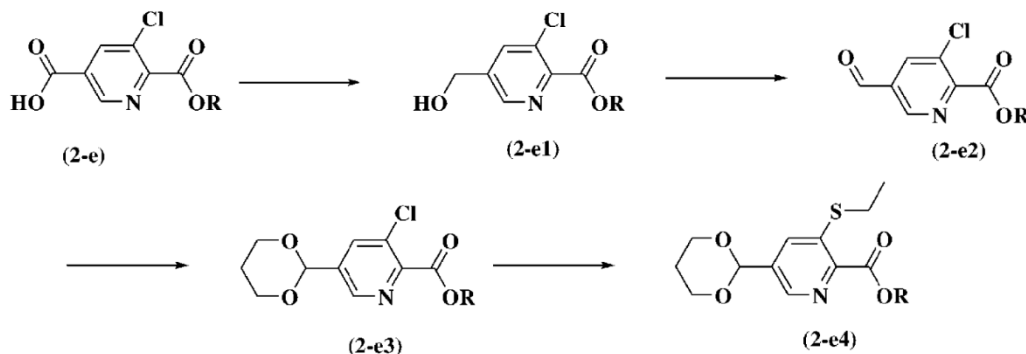


25 (En la fórmula, R¹ y R son como se han definido anteriormente.)

30 El compuesto de fórmula general (2-b) producido según el método de producción del producto intermedio mostrado anteriormente se somete a la reacción de reducción según el método descrito en el documento WO 2014/068988 para dar el compuesto de fórmula general (2-b1). El compuesto obtenido se somete a la reacción según el método descrito en Greene's Protective GROUPS en Organic SYNTHESIS (4^a edición) para dar el compuesto de fórmula general (2-b2).

Método de producción del producto intermedio (2-e4)

35 [Quim. 12]



R representa un grupo alquilo C₁-C₃.

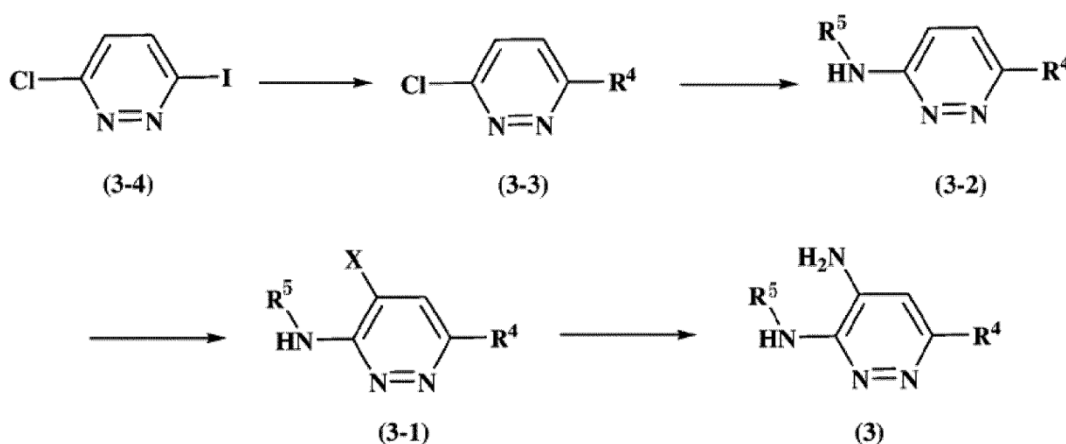
40 El compuesto carboxílico de fórmula general (2-e) producido según el método de producción del producción del producto intermedio mostrado anteriormente se convierte en el cloruro carboxílico correspondiente por el método habitual usado en síntesis orgánica y el cloruro carboxílico se reduce después con borohidruro sódico (NaBH₄) para dar el compuesto de alcohol representado por la fórmula general (2-e1). El compuesto (2-e1) se convierte al compuesto

de aldehído representado por la fórmula general (2-e2) mediante la denominada oxidación de Swern (usando DMSO (dimetilsulfóxido) y cloruro de oxalilo) y después el compuesto de aldehído se somete a la reacción según el método descrito en Greene's Protective GROUPS in Organic SYNTHESIS (4ª edición) para dar el compuesto de acetal cíclico representado por la fórmula general (2-e3).

5 Este compuesto de acetal se somete a la reacción según el método descrito para la producción del compuesto de fórmula general (2-c) en el método de producción del producto intermedio anterior, para dar el compuesto representado por la fórmula general (2-e4).

10 Método de producción del producto intermedio (3)

[Quim. 13]



(En la fórmula, R⁴ y R⁵ son como se han definido anteriormente, y X representa un átomo de halógeno.)

15 El compuesto de fórmula general (3), que es un intermedio en el curso de la producción del compuesto de la presente invención, se puede producir por el método siguiente.

20 En primer lugar, el compuesto de yodopiridazina de fórmula general (3-4) producido por el método descrito en la bibliografía (Tetrahedron, 1999, 55, 15067) se acopla de forma cruzada con un compuesto de yodo tal como yoduro de alquilo en presencia de un catalizador metálico, una base y un disolvente inerte según cualquiera de los métodos descritos en la bibliografía (Journal of Synthetic Organic Chemistry, Japón, vol. 69, n.º 7, 2011; Chem. Rev. 2011, 4475 y el documento WO 2013/018928) para la producción del compuesto de piridazina representado por la fórmula general (3-3).

25 El catalizador usado en esta reacción puede ser un compuesto de paladio, que incluye metales de paladio cerovalentes o divalentes normalmente disponibles y sus sales (que incluyen sus complejos). Dicho compuesto de paladio puede estar soportado sobre carbón activado, etc. Los ejemplos preferidos del compuesto de paladio incluyen paladio (0)/carbón, acetato de paladio (II), cloruro de paladio (II), bis(trifenilfosfina)cloruro de paladio (II) y tetraquis(trifenilfosfina)paladio (0).

35 Para la reacción en esta etapa, el catalizador antes mencionado se puede usar con un ligando. Los ejemplos de ligando incluyen ligandos de fosfina tales como trifenilfosfina (PPh₃), metildifenilfosfina (Ph₂PCH₃), trifurilfosfina (P(2-furilo)₃), tri(o-tolil)fosfina (P(o-tol)₃), tri(ciclohexil)fosfina (PCy₃), dicitlohexilfenilfosfina (PhPCy₂), tri(t-butil)fosfina (PtBu₃), 2,2'-bis(difenilfosfino)-1,1'-binaftilo (BINAP), difenilfosfinoferroceno (DPPF), 1,1'-bis(di-t-butilfosfino)ferroceno (DtBPF), N,N-dimetil-1-[2-(difenilfosfino)ferrocenil]etilamina, 1-[2-(difenilfosfino)ferrocenil]etil metil éter y Xantphos; y ligandos que imitan fosfina tales como carbeno imidazol-2-ilideno (véase Angewandte Chemie International Edition in English, vol. 36, pág. 2163 (1997)).

40 Los ejemplos de la base que se puede usar en la presente invención incluyen hidróxidos tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio e hidróxido de potasio; carbonatos tales como carbonato de litio, hidrogenocarbonato de litio, carbonato sódico, hidrogenocarbonato de sodio, carbonato potásico, hidrógeno carbonato potásico y carbonato de cesio; acetatos tales como acetato de litio, acetato sódico y acetato potásico; alcóxidos tales como metóxido sódico, etóxido sódico y *tert*-butóxido potásico; hidruros de metal tales como hidruro de sodio e hidruro de potasio; y bases orgánicas tales como piridina, picolina, lutidina, trietilamina, tributilamina y diisopropiletilamina. La cantidad de base usada se selecciona de manera apropiada del intervalo de una cantidad molar de 1 a 5,0 veces con respecto al compuesto representado por la fórmula general (3-4).

La temperatura de reacción en esta reacción habitualmente está en el intervalo de aproximadamente 0 °C al punto de ebullición del disolvente usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción, la temperatura de reacción y similares, sino que se selecciona básicamente según sea apropiado en el intervalo de unos minutos a 48 horas.

- 5 El compuesto de amino piridazina representado por la fórmula general (3-2) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto de piridazina representado por la fórmula general (3-3) con un compuesto amino (R^5NH_2).

10 El disolvente inerte usado en esta reacción puede ser cualquier disolvente que no inhiba de manera notable el progreso de la reacción y los ejemplos incluyen hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y tetracloruro de carbono; hidrocarburos aromáticos halogenados, tales como clorobenceno y diclorobenceno; éteres de cadena lineal o cíclicos tales como éter dietílico, metil *tert*-butil éter, dioxano y tetrahidrofurano; ésteres tales como acetato de etilo; amidas tales como dimetilformamida y dimetilacetamida; cetonas tales como acetona y metil etil cetona; y otros disolventes tales como dimetilsulfóxido y 1,3-dimetil-2-imidazolidinona. Uno de estos disolventes inertes se puede usar solo, o pueden usarse 15 dos o más de ellos en forma de una mezcla.

20 Si fuera necesario, se puede usar una base, y los ejemplos de la base usada incluyen bases inorgánicas tales como hidróxido sódico, hidróxido potásico, carbonato sódico, carbonato potásico, hidrogenocarbonato sódico e hidrogenocarbonato potásico; acetatos tales como acetato sódico y acetato potásico; alcóxidos de metal alcalino tales como *t*-butóxido potásico, metóxido sódico y etóxido sódico; aminas terciarias tales como trietilamina, diisopropiletilamina y 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno; y compuestos aromáticos que contienen nitrógeno tales como piridina y dimetilaminopiridina. La cantidad de base usada está habitualmente en el intervalo de una cantidad molar de 1 a 10 veces con respecto al compuesto representado por la fórmula general (3-3).

25 La temperatura de reacción en esta reacción se selecciona de manera adecuada entre el intervalo de -10 °C a la temperatura de reflujo del disolvente inerte usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción, la temperatura de reacción y similares y no es el mismo en cada caso, sino que se selecciona básicamente según sea apropiado en el intervalo de unos minutos a 48 horas. La cantidad de compuesto amino (R^5NH_2) usada se selecciona de manera apropiada del intervalo de una cantidad molar de 1 a 5 veces con respecto al compuesto de piridazina representado 30 por la fórmula general (3-3).

Una vez completada la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla posterior a la reacción mediante un método habitual. Según sea necesario, recristalización, cromatografía en columna, etc., se pueden emplear para la purificación del compuesto de interés.

35 El compuesto de halo piridazina representado por la fórmula general (3-1) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto de amino piridazina representado por la fórmula general (3-2) con un agente de halogenación.

40 El disolvente inerte usado en esta reacción puede ser cualquier disolvente que no inhiba de manera notable la reacción y los ejemplos incluyen alcoholes tales como metanol, etanol, propanol, butanol y 2-propanol; éteres de cadena lineal o cíclicos tales como éter dietílico, tetrahidrofurano y dioxano; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; ésteres tales como acetato de etilo; y disolventes polares tales como *N,N*-dimetilformamida, *N,N*-dimetilacetamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, agua y ácido acético. Uno de estos disolventes inertes se puede usar solo, o pueden usarse dos o más de ellos en forma de una mezcla.

45 Los ejemplos del agente de halogenación usados en la reacción incluyen moléculas de halógeno tales como una molécula de cloro, bromo o yodo; halosuccinimidias tales como NCS y NBS; hidantoinas halogenadas tales como DIH y cloruro de tionilo.

50 La temperatura de reacción en esta reacción se selecciona de manera adecuada entre el intervalo de -30 °C a la temperatura de reflujo del disolvente inerte usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción, la temperatura de reacción y similares y no es el mismo en cada caso, sino que se selecciona básicamente según sea apropiado en el intervalo de unos minutos a 48 horas.

55 Una vez completada la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla posterior a la reacción mediante un método habitual. Según sea necesario, recristalización, cromatografía en columna, etc., se pueden emplear para la purificación del compuesto de interés.

60 El compuesto de amino piridazina (3) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto de halo piridazina representado por la fórmula general (3-1) con amoniaco en presencia de un catalizador de cobre y un disolvente.

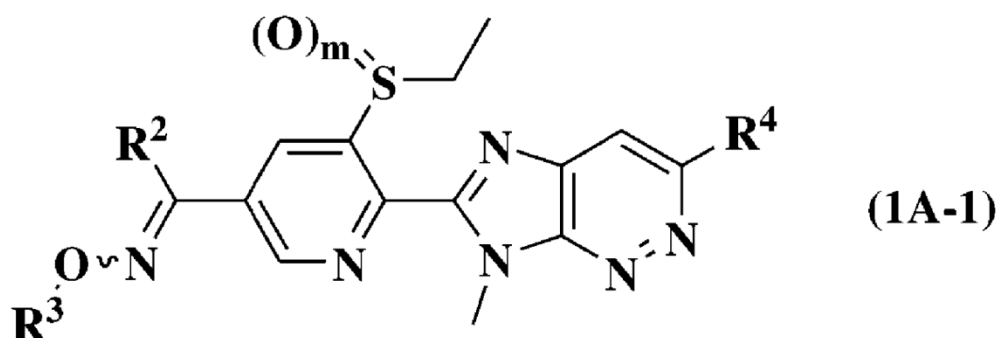
65 El disolvente inerte en esta reacción puede ser cualquier disolvente que no inhiba de manera notable el progreso de la reacción y los ejemplos incluyen alcoholes tales como metanol, etanol, propanol, butanol y 2-propanol; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos aromáticos halogenados, tales como clorobenceno y diclorobenceno; éteres de cadena lineal o cíclicos tales como éter dietílico, metil *tert*-butil éter, dioxano y tetrahidrofurano; amidas tales como dimetilformamida, dimetilacetamida y *N*-metilpirrolidona y otros disolventes tales

como dimetilsulfóxido y 1,3-dimetil-2-imidazolidinona. Uno de estos disolventes inertes se puede usar solo, o pueden usarse dos o más de ellos en forma de una mezcla. El catalizador de cobre usado en esta reacción puede ser óxido de cobre, bromuro de cobre, cloruro de cobre o similares. La cantidad de catalizador de cobre usada se selecciona de manera apropiada del intervalo de una cantidad molar de 1 a 5 veces con respecto al compuesto de halo piridazina representado por la fórmula general (3-1).

La temperatura de reacción en esta reacción se selecciona de manera adecuada entre el intervalo de -10 °C a la temperatura de reflujo del disolvente inerte usado. El tiempo de reacción varía con la escala de reacción, la temperatura de reacción y similares y no es el mismo en cada caso, sino que se selecciona básicamente según sea apropiado en el intervalo de unos minutos a 48 horas. La cantidad de amoníaco usada se selecciona de manera apropiada del intervalo de una cantidad molar de 1 a 5 veces el compuesto de halo piridazina representado por la fórmula general (3-1). Para la progresión eficaz de la reacción, se puede usar un autoclave. Una vez completada la reacción, el compuesto de interés se aísla de la mezcla posterior a la reacción mediante un método habitual. Según sea necesario, se puede emplear recristalización, cromatografía en columna, etc., para la purificación del compuesto de interés.

Los ejemplos específicos del compuesto de la presente invención se muestran a continuación. En las siguientes tablas, Me representa un grupo metilo, Et representa un grupo etilo, n-Pr representa un grupo n-propilo, i-Pr representa un grupo isopropilo, c-Pr representa un grupo ciclopropilo, Alilo representa un grupo alilo, t-Bu representa un grupo butilo terciario, Ph representa un grupo fenilo, Bn representa un grupo bencilo y Ac representa un grupo acetilo. La "E" o la "Z" en la columna de "Isomerismo" se refiere al isomerismo geométrico debido al grupo oxima. En la columna de "Propiedad física" se muestra un punto de fusión (°C) o "RMN". Los datos de la RMN se muestran en la tabla 7.

[Quim. 14]



[Tabla 1]

Tabla 1

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
1-1	H	H	CF ₃	E	0	
1-2	H	H	CF ₃	E	1	
1-3	H	H	CF ₃	E	2	240-241
1-4	H	Me	CF ₃	E	0	
1-5	H	Me	CF ₃	E	1	
1-6	H	Me	CF ₃	E	2	
1-7	H	Et	CF ₃	E	0	
1-8	H	Et	CF ₃	E	1	
1-9	H	Et	CF ₃	E	2	
1-10	H	Et	CF ₃	Z	0	
1-11	H	Et	CF ₃	Z	1	
1-12	H	Et	CF ₃	Z	2	
1-13	H	Alilo	CF ₃	E	0	
1-14	H	Alilo	CF ₃	E	1	
1-15	H	Alilo	CF ₃	E	2	
1-16	H	Alilo	CF ₃	Z	0	
1-17	H	Alilo	CF ₃	Z	1	
1-18	H	Alilo	CF ₃	Z	2	
1-19	H	Bn	CF ₃	E	0	
1-20	H	Bn	CF ₃	E	1	
1-21	H	Bn	CF ₃	E	2	

(continuación)

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
1-22	Me	Me	CF ₃	E	0	
1-23	Me	Me	CF ₃	E	1	
1-24	Me	Me	CF ₃	E	2	
1-25	Me	Me	CF ₃	Z	0	
1-26	Me	Me	CF ₃	Z	1	
1-27	Me	Me	CF ₃	Z	2	
1-28	Me	Et	CF ₃	E	0	
1-29	Me	Et	CF ₃	E	1	
1-30	Me	Et	CF ₃	E	2	

[Tabla 2]

Tabla 1 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
1-31	Me	Et	CF ₃	Z	0	
1-32	Me	Et	CF ₃	Z	1	
1-33	Me	Et	CF ₃	Z	2	
1-34	Me	Alilo	CF ₃	E	0	
1-35	Me	Alilo	CF ₃	E	1	
1-36	Me	Alilo	CF ₃	E	2	
1-37	Me	Alilo	CF ₃	Z	0	
1-38	Me	Alilo	CF ₃	Z	1	
1-39	Me	Alilo	CF ₃	Z	2	
1-40	Me	Bn	CF ₃	E	0	
1-41	Me	Bn	CF ₃	E	1	
1-42	Me	Bn	CF ₃	E	2	
1-43	Me	Bn	CF ₃	Z	0	
1-44	Me	Bn	CF ₃	Z	1	
1-45	Me	Bn	CF ₃	Z	2	
1-46	H	t-Bu	CF ₃	E	0	
1-47	H	t-Bu	CF ₃	E	1	
1-48	H	t-Bu	CF ₃	E	2	
1-49	H	t-Bu	CF ₃	Z	0	
1-50	H	t-Bu	CF ₃	Z	1	
1-51	H	t-Bu	CF ₃	Z	2	
1-52	H	Ph	CF ₃	E	0	
1-53	H	Ph	CF ₃	E	1	
1-54	H	Ph	CF ₃	E	2	
1-55	H	C(CH ₃) ₂ (OMe)	CF ₃	E	0	
1-56	H	C(CH ₃) ₂ (OMe)	CF ₃	E	1	
1-57	H	C(CH ₃) ₂ (OMe)	CF ₃	E	2	
1-58	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	0	
1-59	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	1	
1-60	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	202-203

[Tabla 3]

Tabla 1 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
1-61	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Z	0	
1-62	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Z	1	
1-63	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Z	2	
1-64	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	0	
1-65	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	1	
1-66	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
1-67	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Z	0	
1-68	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Z	1	
1-69	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Z	2	
1-70	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	0	
1-71	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	1	
1-72	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	188-189
1-73	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	Z	0	

(continuación)

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
1-74	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	Z	1	
1-75	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	Z	2	
1-76	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	0	
1-77	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	1	
1-78	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
1-79	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	Z	0	
1-80	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	Z	1	
1-81	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	Z	2	
1-82	H	CHF ₂	CF ₃	E	0	
1-83	H	CHF ₂	CF ₃	E	1	
1-84	H	CHF ₂	CF ₃	E	2	
1-85	H	CHF ₂	CF ₃	Z	0	
1-86	H	CHF ₂	CF ₃	Z	1	
1-87	H	CHF ₂	CF ₃	Z	2	
1-88	Me	CHF ₂	CF ₃	E	0	
1-89	Me	CHF ₂	CF ₃	E	1	
1-90	Me	CHF ₂	CF ₃	E	2	

[Tabla 4]

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
1-91	Me	CHF ₂	CF ₃	Z	0	
1-92	Me	CHF ₂	CF ₃	Z	1	
1-93	Me	CHF ₂	CF ₃	Z	2	
1-94	H	H	SCF ₃	E	0	
1-95	H	H	SCF ₃	E	1	
1-96	H	H	SCF ₃	E	2	
1-97	H	Me	SCF ₃	E	0	
1-98	H	Me	SCF ₃	E	1	
1-99	H	Me	SCF ₃	E	2	
1-100	H	Et	SCF ₃	E	0	
1-101	H	Et	SCF ₃	E	1	
1-102	H	Et	SCF ₃	E	2	
1-103	H	Et	SCF ₃	Z	0	
1-104	H	Et	SCF ₃	Z	1	
1-105	H	Et	SCF ₃	Z	2	
1-106	H	Alilo	SCF ₃	E	0	
1-107	H	Alilo	SCF ₃	E	1	
1-108	H	Alilo	SCF ₃	E	2	
1-109	H	Alilo	SCF ₃	Z	0	
1-110	H	Alilo	SCF ₃	Z	1	
1-111	H	Alilo	SCF ₃	Z	2	
1-112	H	Bn	SCF ₃	E	0	
1-113	H	Bn	SCF ₃	E	1	
1-114	H	Bn	SCF ₃	E	2	
1-115	Me	Me	SCF ₃	E	0	
1-116	Me	Me	SCF ₃	E	1	
1-117	Me	Me	SCF ₃	E	2	
1-118	Me	Me	SCF ₃	Z	0	
1-119	Me	Me	SCF ₃	Z	1	
1-120	Me	Me	SCF ₃	Z	2	

[Tabla 5]

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
1-121	Me	Et	SCF ₃	E	0	
1-122	Me	Et	SCF ₃	E	1	
1-123	Me	Et	SCF ₃	E	2	
1-124	Me	Et	SCF ₃	Z	0	

(continuación)

Tabla 1 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
1-125	Me	Et	SCF ₃	Z	1	
1-126	Me	Et	SCF ₃	Z	2	
1-127	Me	Alilo	SCF ₃	E	0	
1-128	Me	Alilo	SCF ₃	E	1	
1-129	Me	Alilo	SCF ₃	E	2	
1-130	Me	Alilo	SCF ₃	Z	0	
1-131	Me	Alilo	SCF ₃	Z	1	
1-132	Me	Alilo	SCF ₃	Z	2	
1-133	Me	Bn	SCF ₃	E	0	
1-134	Me	Bn	SCF ₃	E	1	
1-135	Me	Bn	SCF ₃	E	2	
1-136	Me	Bn	SCF ₃	Z	0	
1-137	Me	Bn	SCF ₃	Z	1	
1-138	Me	Bn	SCF ₃	Z	2	
1-139	H	t-Bu	SCF ₃	E	0	
1-140	H	t-Bu	SCF ₃	E	1	
1-141	H	t-Bu	SCF ₃	E	2	
1-142	H	t-Bu	SCF ₃	Z	0	
1-143	H	t-Bu	SCF ₃	Z	1	
1-144	H	t-Bu	SCF ₃	Z	2	
1-145	H	Ph	SCF ₃	E	0	
1-146	H	Ph	SCF ₃	E	1	
1-147	H	Ph	SCF ₃	E	2	
1-148	H	C(CH ₃) ₂ (OMe)	SCF ₃	E	0	
1-149	H	C(CH ₃) ₂ (OMe)	SCF ₃	E	1	
1-150	H	C(CH ₃) ₂ (OMe)	SCF ₃	E	2	

[Tabla 6]

Tabla 1 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
1-151	H	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	0	
1-152	H	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	1	
1-153	H	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
1-154	H	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	Z	0	
1-155	H	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	Z	1	
1-156	H	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	Z	2	
1-157	Me	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	0	
1-158	Me	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	1	
1-159	Me	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
1-160	Me	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	Z	0	
1-161	Me	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	Z	1	
1-162	Me	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	Z	2	
1-163	H	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	0	
1-164	H	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	1	
1-165	H	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
1-166	H	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	Z	0	
1-167	H	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	Z	1	
1-168	H	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	Z	2	
1-169	Me	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	0	
1-170	Me	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	1	
1-171	Me	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
1-172	Me	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	Z	0	
1-173	Me	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	Z	1	
1-174	Me	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	Z	2	
1-175	H	CHF ₂	SCF ₃	E	0	
1-176	H	CHF ₂	SCF ₃	E	1	
1-177	H	CHF ₂	SCF ₃	E	2	
1-178	H	CHF ₂	SCF ₃	Z	0	
1-179	H	CHF ₂	SCF ₃	Z	1	
1-180	H	CHF ₂	SCF ₃	Z	2	

[Tabla 7]

Tabla 1 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
1-181	Me	CHF ₂	SCF ₃	E	0	
1-182	Me	CHF ₂	SCF ₃	E	1	
1-183	Me	CHF ₂	SCF ₃	E	2	
1-184	Me	CHF ₂	SCF ₃	Z	0	
1-185	Me	CHF ₂	SCF ₃	Z	1	
1-186	Me	CHF ₂	SCF ₃	Z	2	
1-187	H	H	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-188	H	H	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-189	H	H	CF ₂ CF ₃	E	2	240-242
1-190	H	Me	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-191	H	Me	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-192	H	Me	CF ₂ CF ₃	E	2	193-194
1-193	H	Et	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-194	H	Et	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-195	H	Et	CF ₂ CF ₃	E	2	162-164
1-196	H	Et	CF ₂ CF ₃	Z	0	
1-197	H	Et	CF ₂ CF ₃	Z	1	
1-198	H	Et	CF ₂ CF ₃	Z	2	179-180
1-199	H	Alilo	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-200	H	Alilo	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-201	H	Alilo	CF ₂ CF ₃	E	2	155-160
1-202	H	Alilo	CF ₂ CF ₃	Z	0	
1-203	H	Alilo	CF ₂ CF ₃	Z	1	
1-204	H	Alilo	CF ₂ CF ₃	Z	2	141-142
1-205	H	Bn	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-206	H	Bn	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-207	H	Bn	CF ₂ CF ₃	E	2	RMN
1-208	Me	Me	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-209	Me	Me	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-210	Me	Me	CF ₂ CF ₃	E	2	175-176

[Tabla 8]

Tabla 1 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
1-211	Me	Me	CF ₂ CF ₃	Z	0	
1-212	Me	Me	CF ₂ CF ₃	Z	1	
1-213	Me	Me	CF ₂ CF ₃	Z	2	RMN
1-214	Me	Et	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-215	Me	Et	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-216	Me	Et	CF ₂ CF ₃	E	2	163-164
1-217	Me	Et	CF ₂ CF ₃	Z	0	
1-218	Me	Et	CF ₂ CF ₃	Z	1	
1-219	Me	Et	CF ₂ CF ₃	Z	2	RMN
1-220	Me	Alilo	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-221	Me	Alilo	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-222	Me	Alilo	CF ₂ CF ₃	E	2	173-174
1-223	Me	Alilo	CF ₂ CF ₃	Z	0	
1-224	Me	Alilo	CF ₂ CF ₃	Z	1	
1-225	Me	Alilo	CF ₂ CF ₃	Z	2	RMN
1-226	Me	Bn	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-227	Me	Bn	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-228	Me	Bn	CF ₂ CF ₃	E	2	213-214
1-229	Me	Bn	CF ₂ CF ₃	Z	0	
1-230	Me	Bn	CF ₂ CF ₃	Z	1	
1-231	Me	Bn	CF ₂ CF ₃	Z	2	117-119
1-232	H	t-Bu	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-233	H	t-Bu	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-234	H	t-Bu	CF ₂ CF ₃	E	2	RMN
1-235	H	t-Bu	CF ₂ CF ₃	Z	0	

(continuación)

Tabla 1 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
1-236	H	t-Bu	CF ₂ CF ₃	Z	1	
1-237	H	t-Bu	CF ₂ CF ₃	Z	2	RMN
1-238	H	Ph	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-239	H	Ph	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-240	H	Ph	CF ₂ CF ₃	E	2	168-169

[Tabla 9]

Tabla 1 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
1-241	H	C(CH ₃) ₂ (OMe)	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-242	H	C(CH ₃) ₂ (OMe)	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-243	H	C(CH ₃) ₂ (OMe)	CF ₂ CF ₃	E	2	RMN
1-244	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-245	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-246	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	2	207-208
1-247	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	0	
1-248	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	1	
1-249	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	2	
1-250	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-251	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-252	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	2	207-208
1-253	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	0	
1-254	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	1	
1-255	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	2	
1-256	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-257	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-258	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	2	207-208
1-259	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	0	
1-260	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	1	
1-261	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	2	
1-262	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-263	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-264	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	2	
1-265	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	0	
1-266	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	1	
1-267	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	2	
1-268	H	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-269	H	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-270	H	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	2	

[Tabla 10]

Tabla 1 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
1-271	H	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	0	
1-272	H	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	1	
1-273	H	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	2	
1-274	Me	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-275	Me	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-276	Me	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	2	
1-277	Me	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	0	
1-278	Me	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	1	
1-279	Me	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	2	
1-280	H	n-Pr	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-281	H	n-Pr	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-282	H	n-Pr	CF ₂ CF ₃	E	2	
1-283	H	n-Pr	CF ₂ CF ₃	Z	0	
1-284	H	n-Pr	CF ₂ CF ₃	Z	1	
1-285	H	n-Pr	CF ₂ CF ₃	Z	2	
1-286	Me	n-Pr	CF ₂ CF ₃	E	0	

(continuación)

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
1-287	Me	n-Pr	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-288	Me	n-Pr	CF ₂ CF ₃	E	2	
1-289	Me	n-Pr	CF ₂ CF ₃	Z	0	
1-290	Me	n-Pr	CF ₂ CF ₃	Z	1	
1-291	Me	n-Pr	CF ₂ CF ₃	Z	2	
1-292	H	i-Pr	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-293	H	i-Pr	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-294	H	i-Pr	CF ₂ CF ₃	E	2	
1-295	H	i-Pr	CF ₂ CF ₃	Z	0	
1-296	H	i-Pr	CF ₂ CF ₃	Z	1	
1-297	H	i-Pr	CF ₂ CF ₃	Z	2	
1-298	Me	i-Pr	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-299	Me	i-Pr	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-300	Me	i-Pr	CF ₂ CF ₃	E	2	

[Tabla 11]

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
1-301	Me	i-Pr	CF ₂ CF ₃	Z	0	
1-302	Me	i-Pr	CF ₂ CF ₃	Z	1	
1-303	Me	i-Pr	CF ₂ CF ₃	Z	2	
1-304	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-305	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-306	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	2	136-137
1-307	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	0	
1-308	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	1	
1-309	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	2	
1-310	Me	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	0	
1-311	Me	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	1	
1-312	Me	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	2	
1-313	Me	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	0	
1-314	Me	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	1	
1-315	Me	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	2	
1-316	CF ₃	H	CF ₃	E	0	
1-317	CF ₃	H	CF ₃	E	1	
1-318	CF ₃	H	CF ₃	E	2	
1-319	CF ₃	Me	CF ₃	E	0	
1-320	CF ₃	Me	CF ₃	E	1	
1-321	CF ₃	Me	CF ₃	E	2	
1-322	CF ₃	Et	CF ₃	E	0	
1-323	CF ₃	Et	CF ₃	E	1	
1-324	CF ₃	Et	CF ₃	E	2	
1-325	CF ₃	Et	CF ₃	Z	0	
1-326	CF ₃	Et	CF ₃	Z	1	
1-327	CF ₃	Et	CF ₃	Z	2	
1-328	CF ₃	H	C ₂ F ₅	E	0	
1-329	CF ₃	H	C ₂ F ₅	E	1	
1-330	CF ₃	H	C ₂ F ₅	E	2	

[Tabla 12]

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
1-331	CF ₃	Me	C ₂ F ₅	E	0	
1-332	CF ₃	Me	C ₂ F ₅	E	1	
1-333	CF ₃	Me	C ₂ F ₅	E	2	
1-334	CF ₃	Et	C ₂ F ₅	E	0	
1-335	CF ₃	Et	C ₂ F ₅	E	1	
1-336	CF ₃	Et	C ₂ F ₅	E	2	
1-337	CF ₃	Et	C ₂ F ₅	Z	0	

(continuación)

Tabla 1 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
1-338	CF ₃	Et	C ₂ F ₅	Z	1	
1-339	CF ₃	Et	C ₂ F ₅	Z	2	
1-340	CF ₃	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	0	
1-341	CF ₃	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	1	
1-342	CF ₃	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
1-343	CF ₃	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	Z	0	
1-344	CF ₃	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	Z	1	
1-345	CF ₃	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	Z	2	
1-346	CF ₃	CH ₂ CHF ₂	C ₂ F ₅	E	0	
1-347	CF ₃	CH ₂ CHF ₂	C ₂ F ₅	E	1	
1-348	CF ₃	CH ₂ CHF ₂	C ₂ F ₅	E	2	
1-349	CF ₃	CH ₂ CHF ₂	C ₂ F ₅	Z	0	
1-350	CF ₃	CH ₂ CHF ₂	C ₂ F ₅	Z	1	
1-351	CF ₃	CH ₂ CHF ₂	C ₂ F ₅	Z	2	
1-352	H	CH ₂ C ₂ F ₅	C ₂ F ₅	E	2	136-137
1-353	NH ₂	H	C ₂ F ₅	E	2	241-242
1-354	H	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	88-89
1-355	NH ₂	CH ₂ CHF ₂	C ₂ F ₅	E	2	85-86
1-356	NH ₂	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	RMN
1-357	H	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
1-358	Me	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
1-359	H	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
1-360	Me	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	

[Tabla 13]

Tabla 1 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
1-361	H	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-362	Me	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-363	H	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-364	Me	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-365	H	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-366	Me	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-367	H	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-368	Me	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-369	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
1-370	Me	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
1-371	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
1-372	Me	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
1-373	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-374	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-375	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-376	Me	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-377	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-378	Me	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-379	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-380	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-381	H	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
1-382	Me	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
1-383	H	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
1-384	Me	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
1-385	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
1-386	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
1-387	CN	Me	CF ₃	E	2	
1-388	CN	Et	CF ₃	E	2	
1-389	CN	n-Pr	CF ₃	E	2	
1-390	CN	i-Pr	CF ₃	E	2	

[Tabla 14]

Tabla 1 (continuación)

ES 2 956 011 T3

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
1-391	CN	H	CF ₃	E	2	
1-392	CN	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
1-393	CN	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
1-394	CN	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
1-395	CN	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
1-396	CN	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
1-397	CN	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
1-398	CN	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-399	CN	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-400	CN	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-401	CN	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-402	CN	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
1-403	CN	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
1-404	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-405	CN	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-406	CN	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-407	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-408	CN	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
1-409	CN	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
1-410	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
1-411	COOMe	Me	CF ₃	E	2	
1-412	COOMe	Et	CF ₃	E	2	
1-413	COOMe	n-Pr	CF ₃	E	2	
1-414	COOMe	i-Pr	CF ₃	E	2	
1-415	COOMe	H	CF ₃	E	2	
1-416	COOMe	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
1-417	COOMe	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
1-418	COOMe	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
1-419	COOMe	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
1-420	COOMe	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	

[Tabla 15]

Tabla 1 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
1-421	COOMe	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
1-422	COOMe	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-423	COOMe	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-424	COOMe	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-425	COOMe	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-426	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
1-427	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
1-428	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-429	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-430	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-431	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-432	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
1-433	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
1-434	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
1-435	COOEt	Me	CF ₃	E	2	
1-436	COOEt	Et	CF ₃	E	2	
1-437	COOEt	n-Pr	CF ₃	E	2	
1-438	COOEt	i-Pr	CF ₃	E	2	
1-439	COOEt	H	CF ₃	E	2	
1-440	COOEt	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
1-441	COOEt	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
1-442	COOEt	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
1-443	COOEt	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
1-444	COOEt	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
1-445	COOEt	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
1-446	COOEt	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-447	COOEt	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-448	COOEt	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	

(continuación)

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
1-449	COOEt	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-450	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	

[Tabla 16]

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
1-451	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
1-452	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-453	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-454	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-455	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-456	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
1-457	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
1-458	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
1-459	CONH ₂	Me	CF ₃	E	2	
1-460	CONH ₂	Et	CF ₃	E	2	
1-461	CONH ₂	n-Pr	CF ₃	E	2	
1-462	CONH ₂	i-Pr	CF ₃	E	2	
1-463	CONH ₂	H	CF ₃	E	2	
1-464	CONH ₂	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
1-465	CONH ₂	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
1-466	CONH ₂	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
1-467	CONH ₂	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
1-468	CONH ₂	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
1-469	CONH ₂	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
1-470	CONH ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-471	CONH ₂	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-472	CONH ₂	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-473	CONH ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-474	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
1-475	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
1-476	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-477	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-478	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-479	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-480	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	

[Tabla 17]

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
1-481	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
1-482	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
1-483	CONHMe	Me	CF ₃	E	2	
1-484	CONHMe	Et	CF ₃	E	2	
1-485	CONHMe	n-Pr	CF ₃	E	2	
1-486	CONHMe	i-Pr	CF ₃	E	2	
1-487	CONHMe	H	CF ₃	E	2	
1-488	CONHMe	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
1-489	CONHMe	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
1-490	CONHMe	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
1-491	CONHMe	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
1-492	CONHMe	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
1-493	CONHMe	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
1-494	CONHMe	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-495	CONHMe	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-496	CONHMe	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-497	CONHMe	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-498	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
1-499	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	

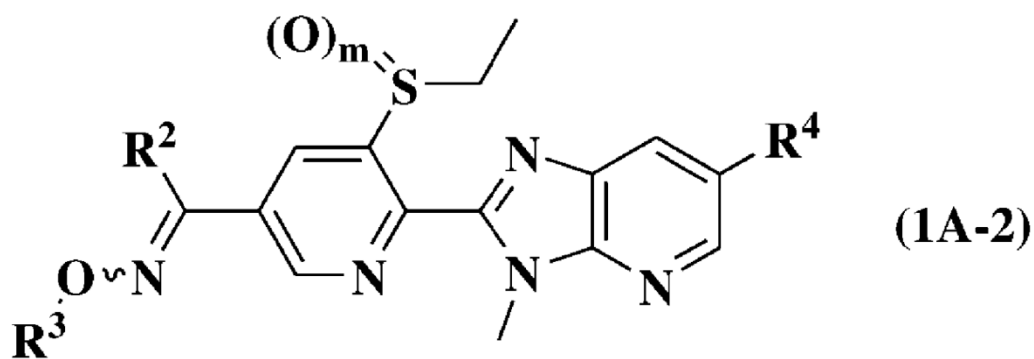
(continuación)

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
1-500	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-501	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-502	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-503	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-504	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
1-505	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
1-506	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
1-507	CONHMe	Me	CF ₃	E	2	
1-508	CONMe ₂	Me	CF ₃	E	2	
1-509	CONMe ₂	Et	CF ₃	E	2	
1-510	CONMe ₂	n-Pr	CF ₃	E	2	

[Tabla 18]

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
1-511	CONMe ₂	i-Pr	CF ₃	E	2	
1-512	CONMe ₂	H	CF ₃	E	2	
1-513	CONMe ₂	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
1-514	CONMe ₂	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
1-515	CONMe ₂	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
1-516	CONMe ₂	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
1-517	CONMe ₂	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
1-518	CONMe ₂	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
1-519	CONMe ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-520	CONMe ₂	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-521	CONMe ₂	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-522	CONMe ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-523	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
1-524	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
1-525	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-526	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-527	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-528	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
1-529	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
1-530	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
1-531	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	

[Quim. 15]



[Tabla 19]

Tabla 2						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
2-1	H	H	CF ₃	E	0	
2-2	H	H	CF ₃	E	1	
2-3	H	H	CF ₃	E	2	256-257
2-4	H	Me	CF ₃	E	0	
2-5	H	Me	CF ₃	E	1	
2-6	H	Me	CF ₃	E	2	245-246
2-7	H	Et	CF ₃	E	0	
2-8	H	Et	CF ₃	E	1	
2-9	H	Et	CF ₃	E	2	190-191
2-10	H	Et	CF ₃	Z	0	
2-11	H	Et	CF ₃	Z	1	
2-12	H	Et	CF ₃	Z	2	143-144
2-13	Me	Me	CF ₃	E	0	
2-14	Me	Me	CF ₃	E	1	
2-15	Me	Me	CF ₃	E	2	204-205
2-16	Me	Me	CF ₃	Z	0	
2-17	Me	Me	CF ₃	Z	1	
2-18	Me	Me	CF ₃	Z	2	
2-19	Me	Et	CF ₃	E	0	
2-20	Me	Et	CF ₃	E	1	
2-21	Me	Et	CF ₃	E	2	
2-22	Me	Et	CF ₃	Z	0	
2-23	Me	Et	CF ₃	Z	1	
2-24	Me	Et	CF ₃	Z	2	
2-25	H	t-Bu	CF ₃	E	0	
2-26	H	t-Bu	CF ₃	E	1	
2-27	H	t-Bu	CF ₃	E	2	
2-28	H	t-Bu	CF ₃	Z	0	
2-29	H	t-Bu	CF ₃	Z	1	
2-30	H	t-Bu	CF ₃	Z	2	

[Tabla 20]

Tabla 2 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
2-31	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	0	
2-32	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	1	
2-33	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	125-126
2-34	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Z	0	
2-35	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Z	1	
2-36	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Z	2	
2-37	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	0	
2-38	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	1	
2-39	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	127-128
2-40	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Z	0	
2-41	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Z	1	
2-42	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Z	2	
2-43	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	0	
2-44	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	1	
2-45	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	158-159
2-46	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	Z	0	
2-47	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	Z	1	
2-48	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	Z	2	
2-49	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	0	
2-50	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	1	
2-51	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
2-52	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	Z	0	
2-53	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	Z	1	
2-54	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	Z	2	
2-55	H	CHF ₂	CF ₃	E	0	
2-56	H	CHF ₂	CF ₃	E	1	

(continuación)

Tabla 2 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
2-57	H	CHF ₂	CF ₃	E	2	
2-58	H	CHF ₂	CF ₃	Z	0	
2-59	H	CHF ₂	CF ₃	Z	1	
2-60	H	CHF ₂	CF ₃	Z	2	

[Tabla 21]

Tabla 2 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
2-61	Me	CHF ₂	CF ₃	E	0	
2-62	Me	CHF ₂	CF ₃	E	1	
2-63	Me	CHF ₂	CF ₃	E	2	
2-64	Me	CHF ₂	CF ₃	Z	0	
2-65	Me	CHF ₂	CF ₃	Z	1	
2-66	Me	CHF ₂	CF ₃	Z	2	
2-67	H	H	SCF ₃	E	0	
2-68	H	H	SCF ₃	E	1	
2-69	H	H	SCF ₃	E	2	
2-70	H	Me	SCF ₃	E	0	
2-71	H	Me	SCF ₃	E	1	
2-72	H	Me	SCF ₃	E	2	
2-73	H	Et	SCF ₃	E	0	
2-74	H	Et	SCF ₃	E	1	
2-75	H	Et	SCF ₃	E	2	
2-76	H	Et	SCF ₃	Z	0	
2-77	H	Et	SCF ₃	Z	1	
2-78	H	Et	SCF ₃	Z	2	
2-79	Me	Me	SCF ₃	E	0	
2-80	Me	Me	SCF ₃	E	1	
2-81	Me	Me	SCF ₃	E	2	
2-82	Me	Me	SCF ₃	Z	0	
2-83	Me	Me	SCF ₃	Z	1	
2-84	Me	Me	SCF ₃	Z	2	
2-85	Me	Et	SCF ₃	E	0	
2-86	Me	Et	SCF ₃	E	1	
2-87	Me	Et	SCF ₃	E	2	
2-88	Me	Et	SCF ₃	Z	0	
2-89	Me	Et	SCF ₃	Z	1	
2-90	Me	Et	SCF ₃	Z	2	

[Tabla 22]

Tabla 2 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
2-91	H	t-Bu	SCF ₃	E	0	
2-92	H	t-Bu	SCF ₃	E	1	
2-93	H	t-Bu	SCF ₃	E	2	
2-94	H	t-Bu	SCF ₃	Z	0	
2-95	H	t-Bu	SCF ₃	Z	1	
2-96	H	t-Bu	SCF ₃	Z	2	
2-97	H	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	0	
2-98	H	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	1	
2-99	H	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
2-100	H	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	Z	0	
2-101	H	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	Z	1	
2-102	H	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	Z	2	
2-103	Me	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	0	
2-104	Me	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	1	
2-105	Me	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
2-106	Me	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	Z	0	
2-107	Me	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	Z	1	
2-108	Me	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	Z	2	

(continuación)

Tabla 2 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
2-109	H	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	0	
2-110	H	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	1	
2-111	H	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
2-112	H	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	Z	0	
2-113	H	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	Z	1	
2-114	H	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	Z	2	
2-115	Me	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	0	
2-116	Me	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	1	
2-117	Me	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
2-118	Me	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	Z	0	
2-119	Me	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	Z	1	
2-120	Me	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	Z	2	

[Tabla 23]

Tabla 2 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
2-121	H	CHF ₂	SCF ₃	E	0	
2-122	H	CHF ₂	SCF ₃	E	1	
2-123	H	CHF ₂	SCF ₃	E	2	
2-124	H	CHF ₂	SCF ₃	Z	0	
2-125	H	CHF ₂	SCF ₃	Z	1	
2-126	H	CHF ₂	SCF ₃	Z	2	
2-127	Me	CHF ₂	SCF ₃	E	0	
2-128	Me	CHF ₂	SCF ₃	E	1	
2-129	Me	CHF ₂	SCF ₃	E	2	
2-130	Me	CHF ₂	SCF ₃	Z	0	
2-131	Me	CHF ₂	SCF ₃	Z	1	
2-132	Me	CHF ₂	SCF ₃	Z	2	
2-133	H	H	CF ₂ CF ₃	E	0	
2-134	H	H	CF ₂ CF ₃	E	1	
2-135	H	H	CF ₂ CF ₃	E	2	
2-136	H	Me	CF ₂ CF ₃	E	0	
2-137	H	Me	CF ₂ CF ₃	E	1	
2-138	H	Me	CF ₂ CF ₃	E	2	
2-139	H	Et	CF ₂ CF ₃	E	0	
2-140	H	Et	CF ₂ CF ₃	E	1	
2-141	H	Et	CF ₂ CF ₃	E	2	
2-142	H	Et	CF ₂ CF ₃	Z	0	
2-143	H	Et	CF ₂ CF ₃	Z	1	
2-144	H	Et	CF ₂ CF ₃	Z	2	
2-145	Me	Me	CF ₂ CF ₃	E	0	
2-146	Me	Me	CF ₂ CF ₃	E	1	
2-147	Me	Me	CF ₂ CF ₃	E	2	
2-148	Me	Me	CF ₂ CF ₃	Z	0	
2-149	Me	Me	CF ₂ CF ₃	Z	1	
2-150	Me	Me	CF ₂ CF ₃	Z	2	

[Tabla 24]

Tabla 2 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
2-151	Me	Et	CF ₂ CF ₃	E	0	
2-152	Me	Et	CF ₂ CF ₃	E	1	
2-153	Me	Et	CF ₂ CF ₃	E	2	
2-154	Me	Et	CF ₂ CF ₃	Z	0	
2-155	Me	Et	CF ₂ CF ₃	Z	1	
2-156	Me	Et	CF ₂ CF ₃	Z	2	
2-157	H	t-Bu	CF ₂ CF ₃	E	0	
2-158	H	t-Bu	CF ₂ CF ₃	E	1	
2-159	H	t-Bu	CF ₂ CF ₃	E	2	
2-160	H	t-Bu	CF ₂ CF ₃	Z	0	

(continuación)

Tabla 2 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
2-161	H	t-Bu	CF ₂ CF ₃	Z	1	
2-162	H	t-Bu	CF ₂ CF ₃	Z	2	
2-163	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	0	
2-164	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	1	
2-165	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	2	
2-166	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	0	
2-167	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	1	
2-168	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	2	
2-169	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	0	
2-170	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	1	
2-171	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	2	
2-172	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	0	
2-173	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	1	
2-174	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	2	
2-175	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	0	
2-176	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	1	
2-177	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	2	
2-178	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	0	
2-179	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	1	
2-180	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	2	

[Tabla 25]

Tabla 2 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
2-181	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	0	
2-182	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	1	
2-183	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	2	
2-184	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	0	
2-185	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	1	
2-186	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	2	
2-187	H	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	0	
2-188	H	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	1	
2-189	H	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	2	
2-190	H	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	0	
2-191	H	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	1	
2-192	H	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	2	
2-193	Me	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	0	
2-194	Me	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	1	
2-195	Me	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	2	
2-196	Me	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	0	
2-197	Me	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	1	
2-198	Me	CHF ₂	CF ₂ CF ₃	Z	2	
2-199	H	n-Pr	CF ₂ CF ₃	E	0	
2-200	H	n-Pr	CF ₂ CF ₃	E	1	
2-201	H	n-Pr	CF ₂ CF ₃	E	2	
2-202	H	n-Pr	CF ₂ CF ₃	Z	0	
2-203	H	n-Pr	CF ₂ CF ₃	Z	1	
2-204	H	n-Pr	CF ₂ CF ₃	Z	2	
2-205	Me	n-Pr	CF ₂ CF ₃	E	0	
2-206	Me	n-Pr	CF ₂ CF ₃	E	1	
2-207	Me	n-Pr	CF ₂ CF ₃	E	2	
2-208	Me	n-Pr	CF ₂ CF ₃	Z	0	
2-209	Me	n-Pr	CF ₂ CF ₃	Z	1	
2-210	Me	n-Pr	CF ₂ CF ₃	Z	2	

[Tabla 26]

Tabla 2 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
2-211	H	i-Pr	CF ₂ CF ₃	E	0	
2-212	H	i-Pr	CF ₂ CF ₃	E	1	
2-213	H	i-Pr	CF ₂ CF ₃	E	2	
2-214	H	i-Pr	CF ₂ CF ₃	Z	0	
2-215	H	i-Pr	CF ₂ CF ₃	Z	1	
2-216	H	i-Pr	CF ₂ CF ₃	Z	2	
2-217	Me	i-Pr	CF ₂ CF ₃	E	0	
2-218	Me	i-Pr	CF ₂ CF ₃	E	1	
2-219	Me	i-Pr	CF ₂ CF ₃	E	2	
2-220	Me	i-Pr	CF ₂ CF ₃	Z	0	
2-221	Me	i-Pr	CF ₂ CF ₃	Z	1	
2-222	Me	i-Pr	CF ₂ CF ₃	Z	2	
2-223	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	0	
2-224	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	1	
2-225	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	2	
2-226	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	0	
2-227	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	1	
2-228	H	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	2	
2-229	Me	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	0	
2-230	Me	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	1	

[Tabla 27]

Tabla 2 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
2-231	Me	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	2	
2-232	Me	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	0	
2-233	Me	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	1	
2-234	Me	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	Z	2	
2-235	H	Ac	CF ₃	E	2	217-218
2-236	H	CO-c-Pr	CF ₃	E	2	194-195
2-237	H	CH ₂ -c-Pr	CF ₃	E	2	140-142
2-238	H	CH ₂ C=CH	CF ₃	E	2	204-205
2-239	Me	H	CF ₃	E	2	194-195
2-240	Me	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	114-115
2-241	H	Me	CF ₃	Z	2	204-205
2-242	H	n-Pr	CF ₃	E	2	134-135
2-243	Me	n-Pr	CF ₃	E	2	
2-244	H	n-Pr	CF ₃	E	2	156-157
2-245	Me	n-Pr	CF ₃	E	2	
2-246	H	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	RMN
2-247	Me	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
2-248	H	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	RMN
2-249	Me	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
2-250	H	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	205-206
2-251	Me	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-252	H	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-253	Me	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-254	H	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-255	Me	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-256	H	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-257	Me	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-258	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	97-98
2-259	Me	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
2-260	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	

[Tabla 28]

Tabla 2 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
2-261	Me	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
2-262	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	107-108
2-263	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-264	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	115-116
2-265	Me	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-266	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-267	Me	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-268	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-269	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-270	H	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
2-271	Me	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
2-272	H	CH ₂ CH ₂ SO CF ₃	CF ₃	E	2	
2-273	Me	CH ₂ CH ₂ SO CF ₃	CF ₃	E	2	
2-274	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
2-275	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
2-276	H	CH ₂ C=N	CF ₃	E	2	204-205
2-277	Me	CH ₂ C=N	CF ₃	E	2	
2-278	H	c-Pen	CF ₃	E	2	124-125
2-279	Me	c-Pen	CF ₃	E	2	
2-280	H	CH ₂ CH=CHCl	CF ₃	E	2	159-160
2-281	Me	CH ₂ CH=CHCl	CF ₃	E	2	
2-282	H	n-Bu	CF ₃	E	2	119-120
2-283	Me	n-Bu	CF ₃	E	2	
2-284	H	n-Pen	CF ₃	E	2	133-134
2-285	Me	n-Pen	CF ₃	E	2	
2-286	H	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CF ₃	E	2	132-133
2-287	Me	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CF ₃	E	2	
2-288	CN	Me	CF ₃	E	2	
2-289	CN	Et	CF ₃	E	2	
2-290	CN	n-Pr	CF ₃	E	2	148-151

[Tabla 29]

Tabla 2 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
2-291	CN	i-Pr	CF ₃	E	2	
2-292	CN	H	CF ₃	E	2	
2-293	CN	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	163-166
2-294	CN	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
2-295	CN	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
2-296	CN	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
2-297	CN	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
2-298	CN	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
2-299	CN	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-300	CN	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-301	CN	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-302	CN	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-303	CN	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
2-304	CN	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
2-305	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-306	CN	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-307	CN	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-308	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-309	CN	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
2-310	CN	CH ₂ CH ₂ SO CF ₃	CF ₃	E	2	
2-311	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
2-312	COOMe	Me	CF ₃	E	2	
2-313	COOMe	Et	CF ₃	E	2	
2-314	COOMe	n-Pr	CF ₃	E	2	
2-315	COOMe	i-Pr	CF ₃	E	2	
2-316	COOMe	H	CF ₃	E	2	

(continuación)

Tabla 2 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
2-317	COOMe	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
2-318	COOMe	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
2-319	COOMe	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
2-320	COOMe	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	

[Tabla 30]

Tabla 2 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
2-321	COOMe	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
2-322	COOMe	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
2-323	COOMe	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-324	COOMe	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-325	COOMe	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-326	COOMe	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-327	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
2-328	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
2-329	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-330	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-331	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-332	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-333	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
2-334	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
2-335	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
2-336	COOEt	Me	CF ₃	E	2	
2-337	COOEt	Et	CF ₃	E	2	
2-338	COOEt	n-Pr	CF ₃	E	2	
2-339	COOEt	i-Pr	CF ₃	E	2	
2-340	COOEt	H	CF ₃	E	2	
2-341	COOEt	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
2-342	COOEt	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
2-343	COOEt	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
2-344	COOEt	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
2-345	COOEt	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
2-346	COOEt	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
2-347	COOEt	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-348	COOEt	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-349	COOEt	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-350	COOEt	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	

[Tabla 31]

Tabla 2 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
2-351	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
2-352	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
2-353	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-354	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-355	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-356	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-357	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
2-358	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
2-359	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
2-360	CONH ₂	Me	CF ₃	E	2	
2-361	CONH ₂	Et	CF ₃	E	2	
2-362	CONH ₂	n-Pr	CF ₃	E	2	
2-363	CONH ₂	i-Pr	CF ₃	E	2	
2-364	CONH ₂	H	CF ₃	E	2	
2-365	CONH ₂	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
2-366	CONH ₂	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
2-367	CONH ₂	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
2-368	CONH ₂	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	

(continuación)

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
2-369	CONH ₂	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
2-370	CONH ₂	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
2-371	CONH ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-372	CONH ₂	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-373	CONH ₂	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-374	CONH ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-375	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
2-376	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
2-377	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-378	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-379	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-380	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	

[Tabla 32]

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
2-381	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
2-382	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
2-383	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
2-384	CONHMe	Me	CF ₃	E	2	
2-385	CONHMe	Et	CF ₃	E	2	
2-386	CONHMe	n-Pr	CF ₃	E	2	
2-387	CONHMe	i-Pr	CF ₃	E	2	
2-388	CONHMe	H	CF ₃	E	2	
2-389	CONHMe	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
2-390	CONHMe	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
2-391	CONHMe	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
2-392	CONHMe	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
2-393	CONHMe	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
2-394	CONHMe	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
2-395	CONHMe	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-396	CONHMe	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-397	CONHMe	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-398	CONHMe	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-399	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
2-400	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
2-401	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-402	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-403	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-404	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-405	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
2-406	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
2-407	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
2-408	CONHMe	Me	CF ₃	E	2	
2-409	CONMe ₂	Me	CF ₃	E	2	
2-410	CONMe ₂	Et	CF ₃	E	2	

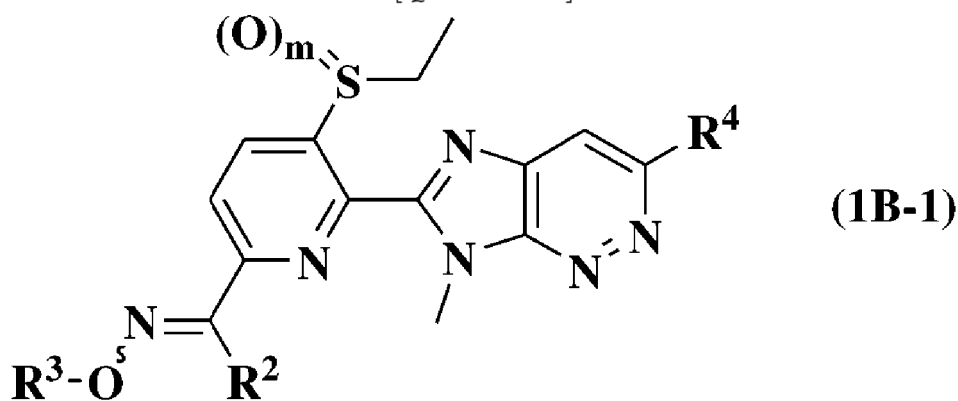
[Tabla 33]

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
2-411	CONMe ₂	n-Pr	CF ₃	E	2	
2-412	CONMe ₂	i-Pr	CF ₃	E	2	
2-413	CONMe ₂	H	CF ₃	E	2	
2-414	CONMe ₂	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
2-415	CONMe ₂	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
2-416	CONMe ₂	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
2-417	CONMe ₂	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
2-418	CONMe ₂	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
2-419	CONMe ₂	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	

(continuación)

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
2-420	CONMe ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-421	CONMe ₂	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-422	CONMe ₂	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-423	CONMe ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-424	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
2-425	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
2-426	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-427	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-428	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-429	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
2-430	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
2-431	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
2-432	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	

[Quim. 16]



[Tabla 34]

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
3-1	H	H	CF ₃	E	2	157-158
3-2	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	84-85
3-3	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	RMN
3-4	H	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	RMN
3-5	H	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	RMN
3-6	Me	H	CF ₃	E	2	
3-7	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
3-8	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
3-9	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
3-10	Me	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
3-11	H	H	CF ₂ CF ₃	E	2	219-220
3-12	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	2	RMN
3-13	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	2	RMN
3-14	Me	H	CF ₂ CF ₃	E	2	
3-15	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	2	
3-16	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	2	
3-17	H	n-Pr	CF ₃	E	2	
3-18	Me	n-Pr	CF ₃	E	2	
3-19	H	i-Pr	CF ₃	E	2	
3-20	Me	i-Pr	CF ₃	E	2	
3-21	H	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
3-22	Me	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
3-23	H	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
3-24	Me	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
3-25	H	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-26	Me	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	

(continuación)

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
3-27	H	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-28	Me	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-29	H	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-30	Me	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-31	H	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	

[Tabla 35]

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
3-32	Me	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-33	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
3-34	Me	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
3-35	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
3-36	Me	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
3-37	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-38	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-39	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-40	Me	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-41	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-42	Me	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-43	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-44	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-45	H	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
3-46	Me	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
3-47	H	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
3-48	Me	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
3-49	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
3-50	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
3-51	H	CH ₂ C=N	CF ₃	E	2	
3-52	Me	CH ₂ C=N	CF ₃	E	2	
3-53	H	c-Pen	CF ₃	E	2	
3-54	Me	c-Pen	CF ₃	E	2	
3-55	H	CH ₂ CH=CHCl	CF ₃	E	2	
3-56	Me	CH ₂ CH=CHCl	CF ₃	E	2	
3-57	H	n-Bu	CF ₃	E	2	
3-58	Me	n-Bu	CF ₃	E	2	
3-59	H	n-Pen	CF ₃	E	2	
3-60	Me	n-Pen	CF ₃	E	2	
3-61	H	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CF ₃	E	2	
3-62	Me	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CF ₃	E	2	

[Tabla 36]

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
3-63	CN	Me	CF ₃	E	2	
3-64	CN	Et	CF ₃	E	2	
3-65	CN	n-Pr	CF ₃	E	2	
3-66	CN	i-Pr	CF ₃	E	2	
3-67	CN	H	CF ₃	E	2	
3-68	CN	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
3-69	CN	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
3-70	CN	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
3-71	CN	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
3-72	CN	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
3-73	CN	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
3-74	CN	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-75	CN	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-76	CN	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-77	CN	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-78	CN	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	

(continuación)

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
3-79	CN	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
3-80	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-81	CN	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-82	CN	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-83	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-84	CN	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
3-85	CN	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
3-86	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
3-87	COOMe	Me	CF ₃	E	2	
3-88	COOMe	Et	CF ₃	E	2	
3-89	COOMe	n-Pr	CF ₃	E	2	
3-90	COOMe	i-Pr	CF ₃	E	2	
3-91	COOMe	H	CF ₃	E	2	
3-92	COOMe	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	

[Tabla 37]

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
3-93	COOMe	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
3-94	COOMe	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
3-95	COOMe	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
3-96	COOMe	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
3-97	COOMe	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
3-98	COOMe	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-99	COOMe	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-100	COOMe	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-101	COOMe	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-102	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
3-103	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
3-104	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-105	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-106	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-107	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-108	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
3-109	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
3-110	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
3-111	COOEt	Me	CF ₃	E	2	
3-112	COOEt	Et	CF ₃	E	2	
3-113	COOEt	n-Pr	CF ₃	E	2	
3-114	COOEt	i-Pr	CF ₃	E	2	
3-115	COOEt	H	CF ₃	E	2	
3-116	COOEt	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
3-117	COOEt	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
3-118	COOEt	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
3-119	COOEt	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
3-120	COOEt	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
3-121	COOEt	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
3-122	COOEt	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	

[Tabla 38]

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
3-123	COOEt	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-124	COOEt	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-125	COOEt	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-126	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
3-127	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
3-128	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-129	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-130	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	

(continuación)

Tabla 3 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
3-131	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-132	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
3-133	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
3-134	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
3-135	CONH ₂	Me	CF ₃	E	2	
3-136	CONH ₂	Et	CF ₃	E	2	
3-137	CONH ₂	n-Pr	CF ₃	E	2	
3-138	CONH ₂	i-Pr	CF ₃	E	2	
3-139	CONH ₂	H	CF ₃	E	2	
3-140	CONH ₂	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
3-141	CONH ₂	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
3-142	CONH ₂	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
3-143	CONH ₂	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
3-144	CONH ₂	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
3-145	CONH ₂	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
3-146	CONH ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-147	CONH ₂	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-148	CONH ₂	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-149	CONH ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-150	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
3-151	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
3-152	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	

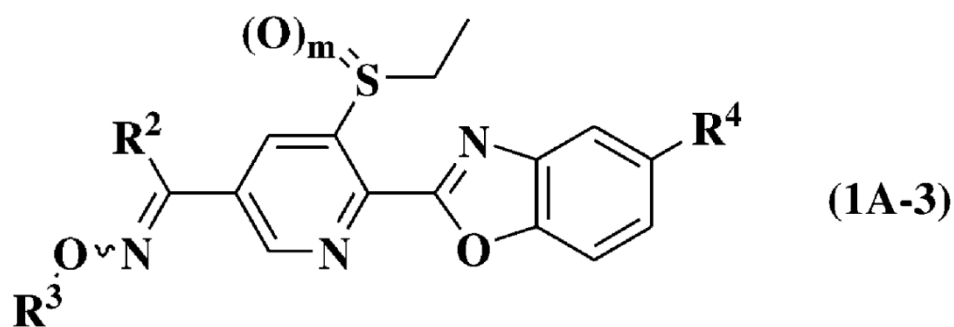
[Tabla 39]

Tabla 3 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
3-153	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-154	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-155	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-156	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
3-157	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
3-158	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
3-159	CONHMe	Me	CF ₃	E	2	
3-160	CONHMe	Et	CF ₃	E	2	
3-161	CONHMe	n-Pr	CF ₃	E	2	
3-162	CONHMe	i-Pr	CF ₃	E	2	
3-163	CONHMe	H	CF ₃	E	2	
3-164	CONHMe	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
3-165	CONHMe	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
3-166	CONHMe	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
3-167	CONHMe	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
3-168	CONHMe	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
3-169	CONHMe	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
3-170	CONHMe	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-171	CONHMe	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-172	CONHMe	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-173	CONHMe	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-174	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
3-175	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
3-176	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-177	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-178	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-179	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-180	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
3-181	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
3-182	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	

[Tabla 40]

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
3-183	CONHMe	Me	CF ₃	E	2	
3-184	CONMe ₂	Me	CF ₃	E	2	
3-185	CONMe ₂	Et	CF ₃	E	2	
3-186	CONMe ₂	n-Pr	CF ₃	E	2	
3-187	CONMe ₂	i-Pr	CF ₃	E	2	
3-188	CONMe ₂	H	CF ₃	E	2	
3-189	CONMe ₂	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
3-190	CONMe ₂	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
3-191	CONMe ₂	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
3-192	CONMe ₂	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
3-193	CONMe ₂	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
3-194	CONMe ₂	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
3-195	CONMe ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-196	CONMe ₂	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-197	CONMe ₂	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-198	CONMe ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-199	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
3-200	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
3-201	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-202	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-203	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-204	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
3-205	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
3-206	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
3-207	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	

[Quim. 17]



[Tabla 41]

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
4-1	H	H	CF ₃	E	2	243-244
4-2	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	187-188
4-3	H	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	180-181
4-4	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	1	
4-5	H	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	1	
4-6	Me	H	CF ₃	E	2	
4-7	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
4-8	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
4-9	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Z	2	
4-10	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	Z	2	
4-11	H	H	SCF ₃	E	2	213-214
4-12	H	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	157-158

(continuación)

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
4-13	H	CH ₂ C ₂ F ₅	SCF ₃	E	2	135-138
4-14	H	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	1	200-202
4-15	H	CH ₂ C ₂ F ₅	SCF ₃	E	1	196-197
4-16	Me	H	SCF ₃	E	2	
4-17	Me	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
4-18	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	SCF ₃	E	2	
4-19	Me	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	Z	2	
4-20	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	SCF ₃	Z	2	

[Tabla 42]

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
4-21	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
4-22	H	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
4-23	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
4-24	Me	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
4-25	H	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	154-155
4-26	H	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
4-27	Me	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
4-28	Me	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
4-29	H	H	OCF ₃	E	2	169-170
4-30	H	CH ₂ CHF ₂	OCF ₃	E	2	153-154
4-31	H	CH ₂ CHF ₂	OCF ₃	Z	2	150-151
4-32	H	CH ₂ CF ₃	OCF ₃	E	2	153-154
4-33	H	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	OCF ₃	E	2	127-128
4-34	H	CH ₂ C ₂ F ₅	OCF ₃	E	2	143-144
4-35	H	CH ₂ CF ₃	OCF ₃	E	1	
4-36	H	CH ₂ C ₂ F ₅	OCF ₃	E	1	
4-37	Me	H	OCF ₃	E	2	
4-38	Me	CH ₂ CHF ₂	OCF ₃	E	2	
4-39	Me	CH ₂ CF ₃	OCF ₃	E	2	
4-40	Me	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	OCF ₃	E	2	
4-41	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	OCF ₃	E	2	
4-42	Me	CH ₂ CF ₃	OCF ₃	E	1	
4-43	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	OCF ₃	E	1	

[Tabla 43]

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
4-44	H	n-Pr	SCF ₃	E	2	143-144
4-45	Me	n-Pr	SCF ₃	E	2	
4-46	H	i-Pr	SCF ₃	E	2	153-154
4-47	Me	i-Pr	SCF ₃	E	2	
4-48	H	CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	150-151
4-49	Me	CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-50	H	CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-51	Me	CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-52	H	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-53	Me	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-54	H	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-55	Me	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-56	H	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-57	Me	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-58	H	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-59	Me	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-60	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	141-142
4-61	Me	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-62	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-63	Me	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	

(continuación)

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
4-64	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-65	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-66	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-67	Me	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-68	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-69	Me	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-70	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-71	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-72	H	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SCF ₃	E	2	
4-73	Me	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SCF ₃	E	2	

[Tabla 44]

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
4-74	H	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SCF ₃	E	2	
4-75	Me	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SCF ₃	E	2	
4-76	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
4-77	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
4-78	H	CH ₂ C≡N	SCF ₃	E	2	
4-79	Me	CH ₂ C≡N	SCF ₃	E	2	
4-80	H	c-Pen	SCF ₃	E	2	
4-81	Me	c-Pen	SCF ₃	E	2	
4-82	H	CH ₂ CH=CHCl	SCF ₃	E	2	139-140
4-83	Me	CH ₂ CH=CHCl	SCF ₃	E	2	
4-84	H	n-Bu	SCF ₃	E	2	126-127
4-85	Me	n-Bu	SCF ₃	E	2	
4-86	H	n-Pen	SCF ₃	E	2	128-129
4-87	Me	n-Pen	SCF ₃	E	2	
4-88	H	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	SCF ₃	E	2	81-82
4-89	Me	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	SCF ₃	E	2	
4-90	H	H	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-91	H	CH ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	164-165
4-92	H	CH ₂ C ₂ F ₅	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-93	H	CH ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	E	2	161-162
4-94	H	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-95	Me	H	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-96	Me	CH ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	140-141
4-97	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-98	Me	CH ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	E	2	118-119
4-99	Me	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-100	H	H	OCHF ₂	E	2	
4-101	H	CH ₂ CF ₃	OCHF ₂	E	0	144-145
4-102	H	CH ₂ CF ₃	OCHF ₂	E	2	146-147
4-103	H	CH ₂ C ₂ F ₅	OCHF ₂	E	2	

[Tabla 45]

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
4-104	H	CH ₂ CHF ₂	OCHF ₂	E	2	
4-105	H	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	OCHF ₂	E	2	
4-106	Me	H	OCHF ₂	E	2	
4-107	Me	CH ₂ CF ₃	OCHF ₂	E	2	
4-108	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	OCHF ₂	E	2	
4-109	Me	CH ₂ CHF ₂	OCHF ₂	E	2	
4-110	Me	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	OCHF ₂	E	2	
4-111	H	H	SOCF ₃	E	2	
4-112	H	CH ₂ CF ₃	SOCF ₃	E	2	

(continuación)

Tabla 4 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
4-113	H	CH ₂ C ₂ F ₅	SOCF ₃	E	2	
4-114	H	CH ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	138-139
4-115	H	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	
4-116	Me	H	SOCF ₃	E	2	
4-117	Me	CH ₂ CF ₃	SOCF ₃	E	2	
4-118	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	SOCF ₃	E	2	
4-119	Me	CH ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	
4-120	Me	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	
4-121	H	n-Pr	SOCF ₃	E	2	
4-122	Me	n-Pr	SOCF ₃	E	2	
4-123	H	i-Pr	SOCF ₃	E	2	
4-124	Me	i-Pr	SOCF ₃	E	2	
4-125	H	CH ₂ SCH ₃	SOCF ₃	E	2	
4-126	Me	CH ₂ SCH ₃	SOCF ₃	E	2	
4-127	H	CH ₂ SOCH ₃	SOCF ₃	E	2	
4-128	Me	CH ₂ SOCH ₃	SOCF ₃	E	2	
4-129	H	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
4-130	Me	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
4-131	H	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
4-132	Me	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
4-133	H	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	

[Tabla 46]

Tabla 4 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
4-134	Me	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
4-135	H	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
4-136	Me	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
4-137	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SOCF ₃	E	2	
4-138	Me	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SOCF ₃	E	2	
4-139	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SOCF ₃	E	2	
4-140	Me	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SOCF ₃	E	2	
4-141	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
4-142	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
4-143	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
4-144	Me	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
4-145	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
4-146	Me	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
4-147	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
4-148	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
4-149	H	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SOCF ₃	E	2	
4-150	Me	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SOCF ₃	E	2	
4-151	H	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SOCF ₃	E	2	
4-152	Me	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SOCF ₃	E	2	
4-153	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SOCF ₃	E	2	
4-154	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SOCF ₃	E	2	
4-155	H	CH ₂ C≡N	SOCF ₃	E	2	
4-156	Me	CH ₂ C≡N	SOCF ₃	E	2	
4-157	H	c-Pen	SOCF ₃	E	2	
4-158	Me	c-Pen	SOCF ₃	E	2	
4-159	H	CH ₂ CH=CHCl	SOCF ₃	E	2	
4-160	Me	CH ₂ CH=CHCl	SOCF ₃	E	2	
4-161	H	n-Bu	SOCF ₃	E	2	
4-162	Me	n-Bu	SOCF ₃	E	2	
4-163	H	n-Pen	SOCF ₃	E	2	

[Tabla 47]

Tabla 4 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
4-164	Me	n-Pen	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-165	H	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-166	Me	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-167	H	n-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-168	Me	n-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-169	H	i-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-170	Me	i-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-171	H	CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-172	Me	CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-173	H	CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-174	Me	CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-175	H	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-176	Me	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-177	H	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-178	Me	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-179	H	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-180	Me	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-181	H	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-182	Me	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-183	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-184	Me	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-185	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-186	Me	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-187	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-188	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-189	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-190	Me	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-191	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-192	Me	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-193	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	

[Tabla 48]

Tabla 4 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
4-194	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-195	H	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-196	Me	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-197	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-198	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-199	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-200	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-201	H	CH ₂ C≡N	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-202	Me	CH ₂ C≡N	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-203	H	c-Pen	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-204	Me	c-Pen	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-205	H	CH ₂ CH=CHCl	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-206	Me	CH ₂ CH=CHCl	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-207	H	n-Bu	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-208	Me	n-Bu	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-209	H	n-Pen	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-210	Me	n-Pen	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-211	H	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-212	Me	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-213	H	Me	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-214	Me	Me	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-215	H	Et	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-216	Me	Et	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-217	H	Me	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-218	Me	Me	SO ₂ CF ₃	E	2	

(continuación)

Tabla 4 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
4-219	H	Et	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-220	Me	Et	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-221	CN	Me	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-222	CN	Et	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-223	CN	n-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	

[Tabla 49]

Tabla 4 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
4-224	CN	i-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-225	CN	H	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-226	CN	CH ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-227	CN	CH ₂ C ₂ F ₅	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-228	CN	CH ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-229	CN	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-230	CN	CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-231	CN	CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-232	CN	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-233	CN	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-234	CN	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-235	CN	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-236	CN	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-237	CN	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-238	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-239	CN	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-240	CN	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-241	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-242	CN	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-243	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-244	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-245	CN	Me	SCF ₃	E	2	
4-246	CN	Et	SCF ₃	E	2	
4-247	CN	n-Pr	SCF ₃	E	2	127-129
4-248	CN	i-Pr	SCF ₃	E	2	
4-249	CN	H	SCF ₃	E	2	
4-250	CN	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	148-153
4-251	CN	CH ₂ C ₂ F ₅	SCF ₃	E	2	
4-252	CN	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
4-253	CN	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	

[Tabla 50]

Tabla 4 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
4-254	CN	CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-255	CN	CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-256	CN	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-257	CN	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-258	CN	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-259	CN	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-260	CN	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-261	CN	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-262	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-263	CN	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-264	CN	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-265	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-266	CN	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SCF ₃	E	2	
4-267	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
4-268	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
4-269	COOMe	Me	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-270	COOMe	Et	SO ₂ CF ₃	E	2	

(continuación)

Tabla 4 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
4-271	COOMe	n-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-272	COOMe	i-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-273	COOMe	H	SOCF ₃	E	2	
4-274	COOMe	CH ₂ CF ₃	SOCF ₃	E	2	
4-275	COOMe	CH ₂ C ₂ F ₅	SOCF ₃	E	2	
4-276	COOMe	CH ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	
4-277	COOMe	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	
4-278	COOMe	CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-279	COOMe	CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-280	COOMe	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-281	COOMe	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-282	COOMe	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-283	COOMe	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	

[Tabla 51]

Tabla 4 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
4-284	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-285	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-286	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-287	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-288	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-289	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-290	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-291	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-292	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-293	COOMe	Me	SCF ₃	E	2	
4-294	COOMe	Et	SCF ₃	E	2	
4-295	COOMe	n-Pr	SCF ₃	E	2	
4-296	COOMe	i-Pr	SCF ₃	E	2	
4-297	COOMe	H	SCF ₃	E	2	
4-298	COOMe	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
4-299	COOMe	CH ₂ C ₂ F ₅	SCF ₃	E	2	
4-300	COOMe	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
4-301	COOMe	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
4-302	COOMe	CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-303	COOMe	CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-304	COOMe	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-305	COOMe	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-306	COOMe	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-307	COOMe	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-308	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-309	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-310	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-311	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-312	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-313	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	

[Tabla 52]

Tabla 4 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
4-314	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SCF ₃	E	2	
4-315	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SCF ₃	E	2	
4-316	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
4-317	COOEt	Me	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-318	COOEt	Et	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-319	COOEt	n-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-320	COOEt	i-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-321	COOEt	H	SOCF ₃	E	2	
4-322	COOEt	CH ₂ CF ₃	SOCF ₃	E	2	

(continuación)

Tabla 4 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
4-323	COOEt	CH ₂ C ₂ F ₅	SOCF ₃	E	2	
4-324	COOEt	CH ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	
4-325	COOEt	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	
4-326	COOEt	CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-327	COOEt	CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-328	COOEt	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-329	COOEt	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-330	COOEt	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-331	COOEt	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-332	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-333	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-334	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-335	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-336	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-337	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-338	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-339	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-340	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-341	COOEt	Me	SCF ₃	E	2	
4-342	COOEt	Et	SCF ₃	E	2	
4-343	COOEt	n-Pr	SCF ₃	E	2	

[Tabla 53]

Tabla 4 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
4-344	COOEt	i-Pr	SCF ₃	E	2	
4-345	COOEt	H	SCF ₃	E	2	
4-346	COOEt	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
4-347	COOEt	CH ₂ C ₂ F ₅	SCF ₃	E	2	
4-348	COOEt	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
4-349	COOEt	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
4-350	COOEt	CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-351	COOEt	CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-352	COOEt	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-353	COOEt	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-354	COOEt	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-355	COOEt	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-356	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-357	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-358	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-359	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-360	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-361	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-362	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SCF ₃	E	2	
4-363	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SCF ₃	E	2	
4-364	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
4-365	CONH ₂	Me	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-366	CONH ₂	Et	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-367	CONH ₂	n-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-368	CONH ₂	i-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-369	CONH ₂	H	SOCF ₃	E	2	
4-370	CONH ₂	CH ₂ CF ₃	SOCF ₃	E	2	
4-371	CONH ₂	CH ₂ C ₂ F ₅	SOCF ₃	E	2	
4-372	CONH ₂	CH ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	
4-373	CONH ₂	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	

[Tabla 54]

Tabla 4 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
4-374	CONH ₂	CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-375	CONH ₂	CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-376	CONH ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-377	CONH ₂	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-378	CONH ₂	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-379	CONH ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-380	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-381	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-382	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-383	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-384	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-385	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-386	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-387	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-388	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-389	CONH ₂	Me	SCF ₃	E	2	
4-390	CONH ₂	Et	SCF ₃	E	2	
4-391	CONH ₂	n-Pr	SCF ₃	E	2	
4-392	CONH ₂	i-Pr	SCF ₃	E	2	
4-393	CONH ₂	H	SCF ₃	E	2	
4-394	CONH ₂	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
4-395	CONH ₂	CH ₂ C ₂ F ₅	SCF ₃	E	2	
4-396	CONH ₂	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
4-397	CONH ₂	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
4-398	CONH ₂	CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-399	CONH ₂	CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-400	CONH ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-401	CONH ₂	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-402	CONH ₂	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-403	CONH ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	

[Tabla 55]

Tabla 4 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
4-404	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-405	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-406	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-407	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-408	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-409	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-410	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SCF ₃	E	2	
4-411	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SCF ₃	E	2	
4-412	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
4-413	CONHMe	Me	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-414	CONHMe	Et	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-415	CONHMe	n-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-416	CONHMe	i-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-417	CONHMe	H	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-418	CONHMe	CH ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-419	CONHMe	CH ₂ C ₂ F ₅	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-420	CONHMe	CH ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-421	CONHMe	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-422	CONHMe	CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-423	CONHMe	CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-424	CONHMe	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-425	CONHMe	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-426	CONHMe	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-427	CONHMe	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-428	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-429	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	

(continuación)

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
4-430	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-431	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-432	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-433	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	

[Tabla 56]

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
4-434	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-435	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-436	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-437	CONHMe	Me	SCF ₃	E	2	
4-438	CONHMe	Et	SCF ₃	E	2	
4-439	CONHMe	n-Pr	SCF ₃	E	2	
4-440	CONHMe	i-Pr	SCF ₃	E	2	
4-441	CONHMe	H	SCF ₃	E	2	
4-442	CONHMe	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
4-443	CONHMe	CH ₂ C ₂ F ₅	SCF ₃	E	2	
4-444	CONHMe	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
4-445	CONHMe	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
4-446	CONHMe	CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-447	CONHMe	CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-448	CONHMe	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-449	CONHMe	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-450	CONHMe	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-451	CONHMe	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-452	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-453	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-454	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-455	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-456	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-457	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-458	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SCF ₃	E	2	
4-459	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SCF ₃	E	2	
4-460	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
4-461	CONMe ₂	Me	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-462	CONMe ₂	Et	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-463	CONMe ₂	n-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	

[Tabla 57]

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
4-464	CONMe ₂	i-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-465	CONMe ₂	H	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-466	CONMe ₂	CH ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-467	CONMe ₂	CH ₂ C ₂ F ₅	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-468	CONMe ₂	CH ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-469	CONMe ₂	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-470	CONMe ₂	CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-471	CONMe ₂	CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-472	CONMe ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-473	CONMe ₂	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-474	CONMe ₂	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-475	CONMe ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-476	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-477	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-478	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-479	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	

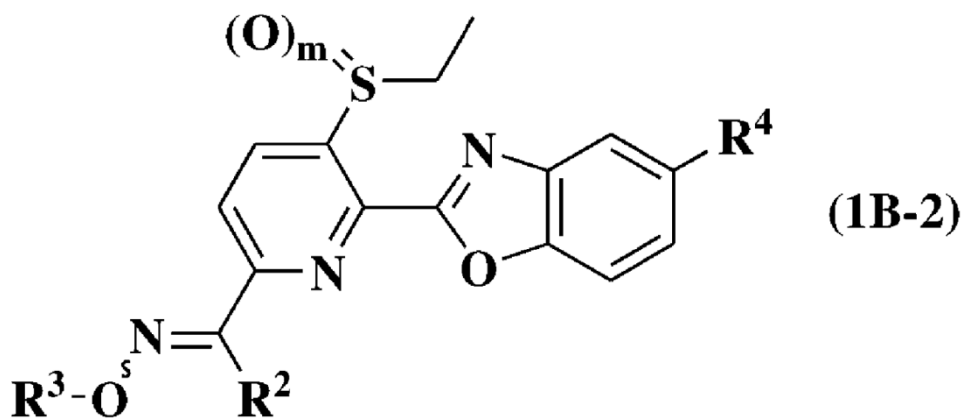
(continuación)

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
4-480	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-481	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-482	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-483	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-484	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
4-485	CONMe ₂	Me	SCF ₃	E	2	
4-486	CONMe ₂	Et	SCF ₃	E	2	
4-487	CONMe ₂	n-Pr	SCF ₃	E	2	
4-488	CONMe ₂	i-Pr	SCF ₃	E	2	
4-489	CONMe ₂	H	SCF ₃	E	2	
4-490	CONMe ₂	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
4-491	CONMe ₂	CH ₂ C ₂ F ₅	SCF ₃	E	2	
4-492	CONMe ₂	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
4-493	CONMe ₂	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	

[Tabla 58]

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
4-494	CONMe ₂	CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-495	CONMe ₂	CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-496	CONMe ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-497	CONMe ₂	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-498	CONMe ₂	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-499	CONMe ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-500	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-501	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
4-502	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-503	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-504	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-505	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
4-506	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SCF ₃	E	2	
4-507	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SCF ₃	E	2	
4-508	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	

[Quim. 18]



[Tabla 59]

Tabla 5						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
5-1	H	H	CF ₃	E	2	
5-2	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
5-3	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
5-4	H	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
5-5	H	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
5-6	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	1	
5-7	H	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	1	
5-8	Me	H	CF ₃	E	2	
5-9	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
5-10	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
5-11	Me	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
5-12	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
5-13	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	1	
5-14	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	1	
5-15	H	H	SCF ₃	E	2	81-82
5-16	H	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	138-139
5-17	H	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	121-122
5-18	H	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	127-128
5-19	H	CH ₂ C ₂ F ₅	SCF ₃	E	2	123-124
5-20	H	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	1	

[Tabla 60]

Tabla 5 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
5-21	H	CH ₂ C ₂ F ₅	SCF ₃	E	1	
5-22	Me	H	SCF ₃	E	2	
5-23	Me	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
5-24	Me	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
5-25	Me	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
5-26	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	SCF ₃	E	2	
5-27	Me	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	1	
5-28	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	SCF ₃	E	1	
5-29	H	H	OCF ₃	E	2	
5-30	H	CH ₂ CHF ₂	OCF ₃	E	2	
5-31	H	CH ₂ CHF ₂	OCF ₃	Z	2	
5-32	H	CH ₂ CF ₃	OCF ₃	E	2	
5-33	H	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	OCF ₃	E	2	
5-34	H	CH ₂ C ₂ F ₅	OCF ₃	E	2	
5-35	H	CH ₂ CF ₃	OCF ₃	E	1	
5-36	H	CH ₂ C ₂ F ₅	OCF ₃	E	1	
5-37	Me	H	OCF ₃	E	2	
5-38	Me	CH ₂ CHF ₂	OCF ₃	E	2	
5-39	Me	CH ₂ CF ₃	OCF ₃	E	2	
5-40	Me	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	OCF ₃	E	2	
5-41	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	OCF ₃	E	2	
5-42	Me	CH ₂ CF ₃	OCF ₃	E	1	
5-43	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	OCF ₃	E	1	

[Tabla 61]

Tabla 5 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
5-44	H	n-Pr	OCF ₃	E	2	RMN
5-45	Me	n-Pr	OCF ₃	E	2	
5-46	H	i-Pr	OCF ₃	E	2	115-116
5-47	Me	i-Pr	OCF ₃	E	2	
5-48	H	CH ₂ SCH ₃	OCF ₃	E	2	96-98
5-49	Me	CH ₂ SCH ₃	OCF ₃	E	2	
5-50	H	CH ₂ SOCH ₃	OCF ₃	E	2	
5-51	Me	CH ₂ SOCH ₃	OCF ₃	E	2	
5-52	H	CH ₂ SO ₂ CH ₃	OCF ₃	E	2	

(continuación)

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
5-53	Me	CH ₂ SO ₂ CH ₃	OCF ₃	E	2	
5-54	H	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	OCF ₃	E	2	
5-55	Me	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	OCF ₃	E	2	
5-56	H	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	OCF ₃	E	2	
5-57	Me	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	OCF ₃	E	2	
5-58	H	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	OCF ₃	E	2	
5-59	Me	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	OCF ₃	E	2	
5-60	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	OCF ₃	E	2	107-108
5-61	Me	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	OCF ₃	E	2	
5-62	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	OCF ₃	E	2	169-170
5-63	Me	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	OCF ₃	E	2	
5-64	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	OCF ₃	E	2	187-188
5-65	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	OCF ₃	E	2	
5-66	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	OCF ₃	E	2	
5-67	Me	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	OCF ₃	E	2	
5-68	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	OCF ₃	E	2	
5-69	Me	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	OCF ₃	E	2	
5-70	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	OCF ₃	E	2	
5-71	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	OCF ₃	E	2	
5-72	H	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	OCF ₃	E	2	
5-73	Me	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	OCF ₃	E	2	

[Tabla 62]

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
5-74	H	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	OCF ₃	E	2	
5-75	Me	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	OCF ₃	E	2	
5-76	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	OCF ₃	E	2	
5-77	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	OCF ₃	E	2	
5-78	H	CH ₂ C≡N	OCF ₃	E	2	
5-79	Me	CH ₂ C≡N	OCF ₃	E	2	
5-80	H	c-Pen	OCF ₃	E	2	113-114
5-81	Me	c-Pen	OCF ₃	E	2	
5-82	H	CH ₂ CH=CHCl	OCF ₃	E	2	RMN
5-83	Me	CH ₂ CH=CHCl	OCF ₃	E	2	
5-84	H	n-Bu	OCF ₃	E	2	77-78
5-85	Me	n-Bu	OCF ₃	E	2	
5-86	H	n-Pen	OCF ₃	E	2	69-70
5-87	Me	n-Pen	OCF ₃	E	2	
5-88	H	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	OCF ₃	E	2	RMN
5-89	Me	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	OCF ₃	E	2	
5-90	H	H	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-91	H	CH ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-92	H	CH ₂ C ₂ F ₅	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-93	H	CH ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	E	2	127-128
5-94	H	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-95	Me	H	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-96	Me	CH ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-97	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-98	Me	CH ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-99	Me	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-100	H	H	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-101	H	CH ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-102	H	CH ₂ C ₂ F ₅	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-103	H	CH ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	E	2	

[Tabla 63]

Tabla 5 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
5-104	H	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	
5-105	Me	H	SOCF ₃	E	2	
5-106	Me	CH ₂ CF ₃	SOCF ₃	E	2	
5-107	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	SOCF ₃	E	2	
5-108	Me	CH ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	
5-109	Me	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	
5-110	H	n-Pr	SOCF ₃	E	2	
5-111	Me	n-Pr	SOCF ₃	E	2	
5-112	H	i-Pr	SOCF ₃	E	2	
5-113	Me	i-Pr	SOCF ₃	E	2	
5-114	H	CH ₂ SCH ₃	SOCF ₃	E	2	
5-115	Me	CH ₂ SCH ₃	SOCF ₃	E	2	
5-116	H	CH ₂ SOCH ₃	SOCF ₃	E	2	
5-117	Me	CH ₂ SOCH ₃	SOCF ₃	E	2	
5-118	H	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
5-119	Me	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
5-120	H	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
5-121	Me	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
5-122	H	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
5-123	Me	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
5-124	H	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
5-125	Me	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
5-126	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SOCF ₃	E	2	
5-127	Me	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SOCF ₃	E	2	
5-128	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SOCF ₃	E	2	
5-129	Me	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SOCF ₃	E	2	
5-130	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
5-131	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
5-132	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
5-133	Me	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	

[Tabla 64]

Tabla 5 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
5-134	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
5-135	Me	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
5-136	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
5-137	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SOCF ₃	E	2	
5-138	H	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SOCF ₃	E	2	
5-139	Me	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SOCF ₃	E	2	
5-140	H	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SOCF ₃	E	2	
5-141	Me	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SOCF ₃	E	2	
5-142	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SOCF ₃	E	2	
5-143	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SOCF ₃	E	2	
5-144	H	CH ₂ C=N	SOCF ₃	E	2	
5-145	Me	CH ₂ C=N	SOCF ₃	E	2	
5-146	H	c-Pen	SOCF ₃	E	2	
5-147	Me	c-Pen	SOCF ₃	E	2	
5-148	H	CH ₂ CH=CHCl	SOCF ₃	E	2	
5-149	Me	CH ₂ CH=CHCl	SOCF ₃	E	2	
5-150	H	n-Bu	SOCF ₃	E	2	
5-151	Me	n-Bu	SOCF ₃	E	2	
5-152	H	n-Pen	SOCF ₃	E	2	
5-153	Me	n-Pen	SOCF ₃	E	2	
5-154	H	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	SOCF ₃	E	2	
5-155	Me	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	SOCF ₃	E	2	
5-156	H	n-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-157	Me	n-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-158	H	i-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	

(continuación)

Tabla 5 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
5-159	Me	i-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-160	H	CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-161	Me	CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-162	H	CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-163	Me	CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	

[Tabla 65]

Tabla 5 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
5-164	H	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-165	Me	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-166	H	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-167	Me	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-168	H	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-169	Me	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-170	H	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-171	Me	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-172	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-173	Me	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-174	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-175	Me	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-176	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-177	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-178	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-179	Me	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-180	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-181	Me	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-182	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-183	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-184	H	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-185	Me	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-186	H	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-187	Me	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-188	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-189	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-190	H	CH ₂ C≡N	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-191	Me	CH ₂ C≡N	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-192	H	c-Pen	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-193	Me	c-Pen	SO ₂ CF ₃	E	2	

[Tabla 66]

Tabla 5 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
5-194	H	CH ₂ CH=CHCl	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-195	Me	CH ₂ CH=CHCl	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-196	H	n-Bu	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-197	Me	n-Bu	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-198	H	n-Pen	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-199	Me	n-Pen	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-200	H	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-201	Me	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-202	H	Me	SOCF ₃	E	2	
5-203	Me	Me	SOCF ₃	E	2	
5-204	H	Et	SOCF ₃	E	2	
5-205	Me	Et	SOCF ₃	E	2	
5-206	H	Me	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-207	Me	Me	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-208	H	Et	SO ₂ CF ₃	E	2	

(continuación)

Tabla 5 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
5-209	Me	Et	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-210	CN	Me	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-211	CN	Et	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-212	CN	n-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-213	CN	i-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-214	CN	H	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-215	CN	CH ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-216	CN	CH ₂ C ₂ F ₅	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-217	CN	CH ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-218	CN	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-219	CN	CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-220	CN	CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-221	CN	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-222	CN	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-223	CN	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	

[Tabla 67]

Tabla 5 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
5-224	CN	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-225	CN	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-226	CN	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-227	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-228	CN	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-229	CN	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-230	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-231	CN	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-232	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-233	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-234	CN	Me	SCF ₃	E	2	
5-235	CN	Et	SCF ₃	E	2	
5-236	CN	n-Pr	SCF ₃	E	2	
5-237	CN	i-Pr	SCF ₃	E	2	
5-238	CN	H	SCF ₃	E	2	
5-239	CN	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
5-240	CN	CH ₂ C ₂ F ₅	SCF ₃	E	2	
5-241	CN	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
5-242	CN	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
5-243	CN	CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-244	CN	CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-245	CN	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-246	CN	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-247	CN	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-248	CN	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-249	CN	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-250	CN	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-251	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-252	CN	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-253	CN	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	

[Tabla 68]

Tabla 5 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
5-255	CN	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SCF ₃	E	2	
5-256	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
5-257	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
5-258	COOMe	Me	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-259	COOMe	Et	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-260	COOMe	n-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-261	COOMe	i-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	

(continuación)

Tabla 5 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
5-262	COOMe	H	SOCF ₃	E	2	
5-263	COOMe	CH ₂ CF ₃	SOCF ₃	E	2	
5-264	COOMe	CH ₂ C ₂ F ₅	SOCF ₃	E	2	
5-265	COOMe	CH ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	
5-266	COOMe	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	
5-267	COOMe	CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-268	COOMe	CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-269	COOMe	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-270	COOMe	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-271	COOMe	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-272	COOMe	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-273	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-274	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-275	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-276	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-277	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-278	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-279	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-280	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-281	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-282	COOMe	Me	SCF ₃	E	2	
5-283	COOMe	Et	SCF ₃	E	2	

[Tabla 69]

Tabla 5 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
5-284	COOMe	n-Pr	SCF ₃	E	2	
5-285	COOMe	i-Pr	SCF ₃	E	2	
5-286	COOMe	H	SCF ₃	E	2	
5-287	COOMe	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
5-288	COOMe	CH ₂ C ₂ F ₅	SCF ₃	E	2	
5-289	COOMe	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
5-290	COOMe	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
5-291	COOMe	CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-292	COOMe	CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-293	COOMe	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-294	COOMe	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-295	COOMe	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-296	COOMe	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-297	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-298	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-299	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-300	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-301	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-302	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-303	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SCF ₃	E	2	
5-304	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SCF ₃	E	2	
5-305	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
5-306	COOEt	Me	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-307	COOEt	Et	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-308	COOEt	n-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-309	COOEt	i-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-310	COOEt	H	SOCF ₃	E	2	
5-311	COOEt	CH ₂ CF ₃	SOCF ₃	E	2	
5-312	COOEt	CH ₂ C ₂ F ₅	SOCF ₃	E	2	
5-313	COOEt	CH ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	

[Tabla 70]

Tabla 5 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
5-314	COOEt	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	
5-315	COOEt	CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-316	COOEt	CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-317	COOEt	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-318	COOEt	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-319	COOEt	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-320	COOEt	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-321	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-322	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-323	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-324	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-325	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-326	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-327	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-328	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-329	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-330	COOEt	Me	SCF ₃	E	2	
5-331	COOEt	Et	SCF ₃	E	2	
5-332	COOEt	n-Pr	SCF ₃	E	2	
5-333	COOEt	i-Pr	SCF ₃	E	2	
5-334	COOEt	H	SCF ₃	E	2	
5-335	COOEt	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
5-336	COOEt	CH ₂ C ₂ F ₅	SCF ₃	E	2	
5-337	COOEt	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
5-338	COOEt	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
5-339	COOEt	CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-340	COOEt	CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-341	COOEt	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-342	COOEt	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-343	COOEt	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	

[Tabla 71]

Tabla 5 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
5-344	COOEt	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-345	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-346	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-347	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-348	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-349	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-350	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-351	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SCF ₃	E	2	
5-352	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SCF ₃	E	2	
5-353	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
5-354	CONH ₂	Me	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-355	CONH ₂	Et	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-356	CONH ₂	n-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-357	CONH ₂	i-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-358	CONH ₂	H	SOCF ₃	E	2	
5-359	CONH ₂	CH ₂ CF ₃	SOCF ₃	E	2	
5-360	CONH ₂	CH ₂ C ₂ F ₅	SOCF ₃	E	2	
5-361	CONH ₂	CH ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	
5-362	CONH ₂	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	
5-363	CONH ₂	CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-364	CONH ₂	CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-365	CONH ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-366	CONH ₂	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-367	CONH ₂	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-368	CONH ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-369	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	

(continuación)

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
5-370	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-371	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-372	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-373	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	

[Tabla 72]

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
5-374	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-375	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-376	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-377	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-378	CONH ₂	Me	SCF ₃	E	2	
5-379	CONH ₂	Et	SCF ₃	E	2	
5-380	CONH ₂	n-Pr	SCF ₃	E	2	
5-381	CONH ₂	i-Pr	SCF ₃	E	2	
5-382	CONH ₂	H	SCF ₃	E	2	
5-383	CONH ₂	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
5-384	CONH ₂	CH ₂ C ₂ F ₅	SCF ₃	E	2	
5-385	CONH ₂	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
5-386	CONH ₂	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
5-387	CONH ₂	CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-388	CONH ₂	CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-389	CONH ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-390	CONH ₂	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-391	CONH ₂	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-392	CONH ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-393	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-394	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-395	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-396	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-397	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-398	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-399	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SCF ₃	E	2	
5-400	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SCF ₃	E	2	
5-401	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
5-402	CONHMe	Me	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-403	CONHMe	Et	SO ₂ CF ₃	E	2	

[Tabla 73]

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
5-404	CONHMe	n-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-405	CONHMe	i-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-406	CONHMe	H	SOCF ₃	E	2	
5-407	CONHMe	CH ₂ CF ₃	SOCF ₃	E	2	
5-408	CONHMe	CH ₂ C ₂ F ₅	SOCF ₃	E	2	
5-409	CONHMe	CH ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	
5-410	CONHMe	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SOCF ₃	E	2	
5-411	CONHMe	CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-412	CONHMe	CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-413	CONHMe	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-414	CONHMe	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-415	CONHMe	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-416	CONHMe	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-417	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-418	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-419	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-420	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-421	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	

(continuación)

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
5-422	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-423	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-424	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-425	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-426	CONHMe	Me	SCF ₃	E	2	
5-427	CONHMe	Et	SCF ₃	E	2	
5-428	CONHMe	n-Pr	SCF ₃	E	2	
5-429	CONHMe	i-Pr	SCF ₃	E	2	
5-430	CONHMe	H	SCF ₃	E	2	
5-431	CONHMe	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
5-432	CONHMe	CH ₂ C ₂ F ₅	SCF ₃	E	2	
5-433	CONHMe	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	

[Tabla 74]

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
5-434	CONHMe	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
5-435	CONHMe	CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-436	CONHMe	CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-437	CONHMe	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-438	CONHMe	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-439	CONHMe	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-440	CONHMe	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-441	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-442	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-443	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-444	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-445	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-446	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-447	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SCF ₃	E	2	
5-448	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SCF ₃	E	2	
5-449	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
5-450	CONMe ₂	Me	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-451	CONMe ₂	Et	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-452	CONMe ₂	n-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-453	CONMe ₂	i-Pr	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-454	CONMe ₂	H	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-455	CONMe ₂	CH ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-456	CONMe ₂	CH ₂ C ₂ F ₅	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-457	CONMe ₂	CH ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-458	CONMe ₂	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-459	CONMe ₂	CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-460	CONMe ₂	CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-461	CONMe ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-462	CONMe ₂	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-463	CONMe ₂	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	

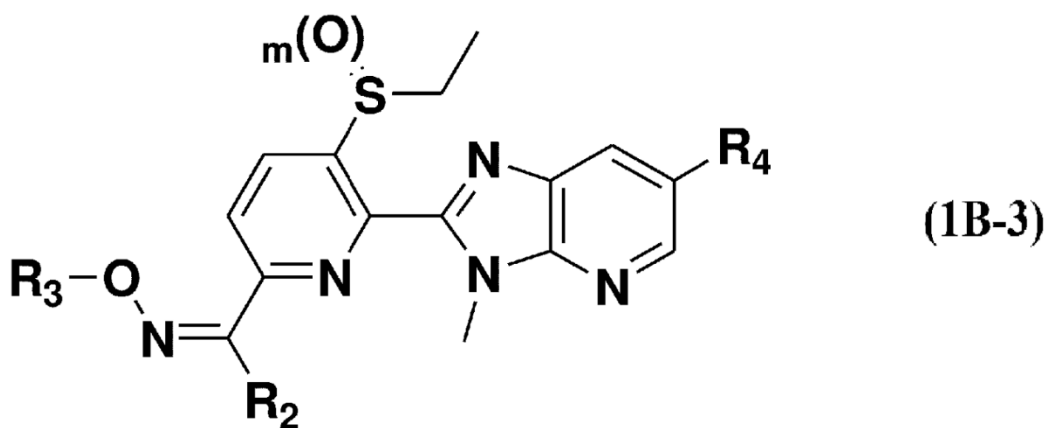
[Tabla 75]

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
5-464	CONMe ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-465	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-466	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-467	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-468	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-469	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-470	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-471	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-472	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	

(continuación)

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
5-473	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SO ₂ CF ₃	E	2	
5-474	CONMe ₂	Me	SCF ₃	E	2	
5-475	CONMe ₂	Et	SCF ₃	E	2	
5-476	CONMe ₂	n-Pr	SCF ₃	E	2	
5-477	CONMe ₂	i-Pr	SCF ₃	E	2	
5-478	CONMe ₂	H	SCF ₃	E	2	
5-479	CONMe ₂	CH ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	
5-480	CONMe ₂	CH ₂ C ₂ F ₅	SCF ₃	E	2	
5-481	CONMe ₂	CH ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
5-482	CONMe ₂	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	SCF ₃	E	2	
5-483	CONMe ₂	CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-484	CONMe ₂	CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-485	CONMe ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-486	CONMe ₂	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-487	CONMe ₂	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-488	CONMe ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-489	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-490	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	SCF ₃	E	2	
5-491	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-492	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-493	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-494	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	SCF ₃	E	2	
5-495	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	SCF ₃	E	2	
5-496	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	SCF ₃	E	2	
5-497	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	SCF ₃	E	2	

[Quim. 19]



[Tabla 76]

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
6-1	H	H	CF ₃	E	2	201-202
6-2	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	RMN
6-3	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
6-4	H	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	RMN
6-5	H	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	RMN
6-6	Me	H	CF ₃	E	2	
6-7	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
6-8	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
6-9	Me	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
6-10	Me	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
6-11	H	H	CF ₂ CF ₃	E	2	
6-12	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	2	

(continuación)

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
6-13	H	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	2	
6-14	Me	H	CF ₂ CF ₃	E	2	
6-15	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	E	2	
6-16	Me	CH ₂ CHF ₂	CF ₂ CF ₃	E	2	
6-17	H	n-Pr	CF ₃	E	2	RMN
6-18	Me	n-Pr	CF ₃	E	2	
6-19	H	i-Pr	CF ₃	E	2	142-143
6-20	Me	i-Pr	CF ₃	E	2	
6-21	H	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	RMN
6-22	Me	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
6-23	H	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
6-24	Me	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
6-25	H	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-26	Me	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-27	H	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-28	Me	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-29	H	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-30	Me	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-31	H	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	

[Tabla 77]

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
6-32	Me	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-33	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
6-34	Me	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
6-35	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
6-36	Me	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
6-37	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-38	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-39	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-40	Me	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-41	H	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-42	Me	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-43	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-44	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-45	H	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
6-46	Me	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
6-47	H	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
6-48	Me	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
6-49	H	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
6-50	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
6-51	H	CH ₂ C≡N	CF ₃	E	2	
6-52	Me	CH ₂ C≡N	CF ₃	E	2	
6-53	H	c-Pen	CF ₃	E	2	
6-54	Me	c-Pen	CF ₃	E	2	
6-55	H	CH ₂ CH=CHCl	CF ₃	E	2	RMN
6-56	Me	CH ₂ CH=CHCl	CF ₃	E	2	
6-57	H	n-Bu	CF ₃	E	2	RMN
6-58	Me	n-Bu	CF ₃	E	2	
6-59	H	n-Pen	CF ₃	E	2	RMN
6-60	Me	n-Pen	CF ₃	E	2	
6-61	H	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CF ₃	E	2	RMN
6-62	Me	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CF ₃	E	2	

[Tabla 78]

Tabla 6 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
6-63	CN	Me	CF ₃	E	2	
6-64	CN	Et	CF ₃	E	2	
6-65	CN	n-Pr	CF ₃	E	2	
6-66	CN	i-Pr	CF ₃	E	2	
6-67	CN	H	CF ₃	E	2	
6-68	CN	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
6-69	CN	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
6-70	CN	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
6-71	CN	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
6-72	CN	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
6-73	CN	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
6-74	CN	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-75	CN	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-76	CN	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-77	CN	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-78	CN	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
6-79	CN	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
6-80	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-81	CN	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-82	CN	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-83	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-84	CN	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
6-85	CN	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
6-86	CN	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
6-87	COOMe	Me	CF ₃	E	2	
6-88	COOMe	Et	CF ₃	E	2	
6-89	COOMe	n-Pr	CF ₃	E	2	
6-90	COOMe	i-Pr	CF ₃	E	2	
6-91	COOMe	H	CF ₃	E	2	
6-92	COOMe	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
6-93	COOMe	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	

[Tabla 79]

Tabla 6 (continuación)						
N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
6-94	COOMe	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
6-95	COOMe	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
6-96	COOMe	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
6-97	COOMe	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
6-98	COOMe	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-99	COOMe	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-100	COOMe	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-101	COOMe	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-102	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
6-103	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
6-104	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-105	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-106	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-107	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-108	COOMe	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
6-109	COOMe	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
6-110	COOMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
6-111	COOEt	Me	CF ₃	E	2	
6-112	COOEt	Et	CF ₃	E	2	
6-113	COOEt	n-Pr	CF ₃	E	2	
6-114	COOEt	i-Pr	CF ₃	E	2	
6-115	COOEt	H	CF ₃	E	2	
6-116	COOEt	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
6-117	COOEt	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
6-118	COOEt	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	

(continuación)

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
6-119	COOEt	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
6-120	COOEt	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
6-121	COOEt	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
6-122	COOEt	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-123	COOEt	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	

[Tabla 80]

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
6-124	COOEt	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-125	COOEt	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-126	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
6-127	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
6-128	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-129	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-130	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-131	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-132	COOEt	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
6-133	COOEt	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
6-134	COOEt	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
6-135	CONH ₂	Me	CF ₃	E	2	
6-136	CONH ₂	Et	CF ₃	E	2	
6-137	CONH ₂	n-Pr	CF ₃	E	2	
6-138	CONH ₂	i-Pr	CF ₃	E	2	
6-139	CONH ₂	H	CF ₃	E	2	
6-140	CONH ₂	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
6-141	CONH ₂	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
6-142	CONH ₂	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
6-143	CONH ₂	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
6-144	CONH ₂	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
6-145	CONH ₂	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
6-146	CONH ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-147	CONH ₂	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-148	CONH ₂	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-149	CONH ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-150	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
6-151	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
6-152	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-153	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	

[Tabla 81]

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
6-154	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-155	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-156	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
6-157	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
6-158	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
6-159	CONHMe	Me	CF ₃	E	2	
6-160	CONHMe	Et	CF ₃	E	2	
6-161	CONHMe	n-Pr	CF ₃	E	2	
6-162	CONHMe	i-Pr	CF ₃	E	2	
6-163	CONHMe	H	CF ₃	E	2	
6-164	CONHMe	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
6-165	CONHMe	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
6-166	CONHMe	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
6-167	CONHMe	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
6-168	CONHMe	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
6-169	CONHMe	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	

(continuación)

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
6-170	CONHMe	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-171	CONHMe	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-172	CONHMe	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-173	CONHMe	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-174	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
6-175	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
6-176	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-177	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-178	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-179	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-180	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
6-181	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
6-182	CONHMe	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
6-183	CONHMe	Me	CF ₃	E	2	

[Tabla 82]

N.º de compuesto	R ²	R ³	R ⁴	Isomerismo	m	Propiedad física
6-184	CONMe ₂	Me	CF ₃	E	2	
6-185	CONMe ₂	Et	CF ₃	E	2	
6-186	CONMe ₂	n-Pr	CF ₃	E	2	
6-187	CONMe ₂	i-Pr	CF ₃	E	2	
6-188	CONMe ₂	H	CF ₃	E	2	
6-189	CONMe ₂	CH ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	
6-190	CONMe ₂	CH ₂ C ₂ F ₅	CF ₃	E	2	
6-191	CONMe ₂	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
6-192	CONMe ₂	CH ₂ CF ₂ CHF ₂	CF ₃	E	2	
6-193	CONMe ₂	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
6-194	CONMe ₂	CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
6-195	CONMe ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-196	CONMe ₂	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-197	CONMe ₂	CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-198	CONMe ₂	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-199	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CF ₃	E	2	
6-200	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	CF ₃	E	2	
6-201	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-202	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-203	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-204	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₃	CF ₃	E	2	
6-205	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SCF ₃	CF ₃	E	2	
6-206	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SOCF ₃	CF ₃	E	2	
6-207	CONMe ₂	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CF ₃	CF ₃	E	2	

[Tabla 83]

N.º de compuesto	Datos de RMN ¹ H (CDCl ₃)
1-207	9,28 (d, 1H), 8,71 (d, 1H), 8,21 (s, 1H), 7,25-4,45 (m, 5H), 5,34 (s, 2H), 4,07 (s, 3H), 3,80 (c, 2H), 1,39 (t, 3H)
1-213	9,16 (d, 1H), 8,64 (d, 1H), 8,21 (s, 1H), 4,10 (s, 3H), 3,96 (s, 3H), 3,81 (c, 2H), 2,90 (s, 3H), 1,39 (t, 3H)
1-219	9,19 (d, 1H), 8,72 (d, 1H), 8,22 (s, 1H), 4,23 (c, 2H), 4,10 (s, 3H), 3,81 (c, 2H), 2,38 (s, 3H), 1,40 (t, 3H), 1,30 (t, 3H)
1-225	9,17 (d, 1H), 8,68 (d, 1H), 8,21 (s, 1H), 6,00 (tdd, 1H), 5,31 (ddd, 1H), 5,26 (ddd, 1H), 4,66 (td, 2H), 4,10 (s, 3H), 3,79 (c, 2H), 2,39 (s, 3H), 1,38 (t, 3H)
1-234	9,18 (d, 1H), 8,66 (d, 3H), 8,22 (s, 1H), 8,21 (s, 1H), 4,09 (s, 3H), 3,82 (c, 2H), 1,43 (t, 3H), 1,42 (s, 9H)

(continuación)

Tabla 7	
N.º de compuesto	Datos de RMN ¹ H (CDCl ₃)
1-237	9,45 (d, 1H), 9,10 (d, 3H), 8,21 (s, 1H), 7,57 (s, 1H), 4,09 (s, 3H), 3,80 (c, 2H), 1,45 (s, 9H), 1,39 (t, 3H)
1-243	9,24 (d, 1H), 8,71 (d, 3H), 8,32 (s, 1H), 8,21 (s, 1H), 4,09 (s, 3H), 3,82 (c, 2H), 3,33 (s, 3H), 1,59 (s, 6H), 1,41 (t, 3H)
1-356	9,39 (d, 1H), 8,84 (d, 1H), 8,21 (d, 1H), 6,01 (s, 2H), 4,53 (c, 2H), 4,07 (s, 3H), 3,79 (c, 2H), 1,38 (t, 3H)
2-246	9,15 (d, 1H), 8,77 (d, 1H), 8,71 (d, 1H), 8,31 (d, 1H), 8,30 (s, 1H), 5,35 (s, 2H), 3,91 (s, 3H), 3,89 (c, 2H), 2,32 (s, 3H), 1,40 (t, 3H)
2-248	9,14 (d, 1H), 8,78 (d, 1H), 8,74 (d, 1H), 8,44 (s, 1H), 8,32 (s, 1H), 5,18 (s, 2H), 3,91 (s, 3H), 3,90 (c, 2H), 2,68 (s, 3H), 1,39 (t, 3H)
3-3	8,54 (d, 1H), 8,31 (s, 1H), 8,28 (d, 1H), 8,20 (s, 1H), 6,07 (tt, 1H), 4,49 (td, 2H), 4,07 (s, 3H), 3,74 (c, 2H), 1,38 (t, 3H)
3-4	8,56 (d, 1H), 8,34 (s, 1H), 8,29 (d, 1H), 8,20 (s, 1H), 4,76 (c, 2H), 4,08 (s, 3H), 3,75 (c, 2H), 1,38 (t, 3H)
3-5	8,56 (d, 1H), 8,33 (s, 1H), 8,29 (d, 1H), 8,20 (s, 1H), 5,94 (tt, 1H), 4,71 (t, 2H), 4,07 (s, 3H), 3,75 (c, 2H), 1,37 (t, 3H)
3-12	8,56 (d, 1H), 8,34 (s, 1H), 8,29 (d, 1H), 8,22 (s, 1H), 4,66 (c, 2H), 4,07 (s, 3H), 3,76 (c, 2H), 1,38 (t, 3H)

[Tabla 84]

Tabla 7 (continuación)	
N.º de compuesto	Datos de RMN ¹ H (CDCl ₃)
3-13	8,56 (d, 1H), 8,31 (s, 1H), 8,28 (d, 1H), 8,22 (s, 1H), 6,07 (tt, 1H), 4,49 (td, 2H), 4,07 (s, 3H), 3,75 (c, 2H), 1,38 (t, 3H)
5-44	8,50 (d, 1H), 8,29 (s, 1H), 8,23 (d, 1H), 7,72 (d, 1H), 7,69 (d, 1H), 7,35 (dd, 1H), 4,25 (t, 2H), 3,95 (c, 2H), 1,79 (dd, 2H), 1,42 (t, 3H), 1,00 (t, 3H)
5-82	8,53 (d, 1H), 8,31 (s, 1H), 8,21 (d, 1H), 7,72 (d, 1H), 7,69 (d, 1H), 7,36 (dd, 1H), 6,38 (td, 1H), 6,18 (d, 1H), 4,76 (dd, 2H), 3,96 (c, 2H), 1,42 (t, 3H)
5-88	8,50 (d, 1H), 8,28 (s, 1H), 8,21 (d, 1H), 7,71 (d, 1H), 7,68 (d, 1H), 7,34 (dd, 1H), 5,49 (t, 1H), 4,79 (d, 2H), 3,94 (c, 2H), 1,82 (s, 3H), 1,78 (s, 3H), 1,42 (t, 3H)
6-2	8,78 (d, 1H), 8,54 (d, 1H), 8,34 (s, 1H), 8,32 (d, 1H), 8,23 (d, 1H), 4,65 (c, 2H), 3,89 (s, 3H), 3,82 (c, 2H), 1,38 (t, 3H)
6-4	8,78 (d, 1H), 8,54 (d, 1H), 8,32 (s, 1H), 8,31 (d, 1H), 8,22 (d, 1H), 4,75 (t, 2H), 3,89 (s, 3H), 3,82 (c, 2H), 1,37 (t, 3H)
6-5	8,78 (d, 1H), 8,54 (d, 1H), 8,32 (s, 1H), 8,31 (d, 1H), 8,22 (d, 1H), 5,91 (tt, 1H), 4,70 (t, 2H), 3,89 (s, 3H), 3,82 (c, 2H), 1,37 (t, 3H)
6-17	8,76 (d, 1H), 8,48 (d, 1H), 8,31 (d, 1H), 8,24 (s, 1H), 8,21 (d, 1H), 4,26 (t, 2H), 3,88 (s, 3H), 3,80 (c, 2H), 1,78 (td, 2H), 1,37 (t, 3H), 1,01 (t, 3H)
6-21	8,77 (d, 1H), 8,51 (d, 1H), 8,31 (d, 1H), 8,28 (s, 1H), 8,24 (d, 1H), 5,35 (s, 2H), 3,88 (s, 3H), 3,80 (c, 2H), 2,32 (s, 3H), 1,36 (t, 3H)
6-55	8,76 (d, 1H), 8,50 (d, 1H), 8,31 (d, 1H), 8,23 (d, 1H), 8,20 (s, 1H), 6,39 (td, 1H), 6,18 (d, 1H), 4,77 (d, 2H), 3,88 (s, 3H), 3,80 (c, 2H), 1,37 (t, 3H)
6-57	8,76 (d, 1H), 8,47 (d, 1H), 8,31 (d, 1H), 8,21 (d, 1H), 8,20 (s, 1H), 4,30 (t, 2H), 3,88 (s, 3H), 3,79 (c, 2H), 1,75 (dd, 2H), 1,46 (dd, 2H), 1,36 (t, 3H), 0,98 (t, 3H)
6-59	8,76 (d, 1H), 8,47 (d, 1H), 8,31 (d, 1H), 8,21 (d, 1H), 8,20 (s, 1H), 4,29 (t, 2H), 3,88 (s, 3H), 3,80 (c, 2H), 1,77 (dd, 2H), 1,39 (dd, 2H), 1,37 (dd, 2H), 1,37 (t, 3H), 0,93 (t, 3H)

[Tabla 85]

Tabla 7 (continuación)	
N.º de compuesto	Datos de RMN ¹ H (CDCl ₃)
6-61	8,76 (d, 1H), 8,48 (d, 1H), 8,30 (d, 1H), 8,22 (d, 1H), 8,20 (s, 1H), 5,50 (t, 1H), 4,80 (d, 2H), 3,87 (s, 3H), 3,80 (c, 2H), 1,81 (ds, 3H), 1,78 (s, 3H), 1,36 (t, 3H)

El insecticida agrícola y hortícola que comprende el compuesto heterocíclico condensado que contiene un grupo oxima

representado por la fórmula general (1) de la presente invención o una sal del mismo como principio activo es adecuado para controlar diferentes plagas que pueden dañar el arroz con cáscara, árboles frutales, verduras, otros cultivos y plantas ornamentales con flores. Las plagas diana son, por ejemplo, plagas agrícolas y forestales, plagas hortícolas, plagas de granos almacenados, plagas sanitarias, nematodos, termitas, etc.

5

Los ejemplos específicos de plagas, nematodos, etc. incluyen los siguientes:

las especies del orden *Lepidoptera*, tales como *Parasa consocia*, *Anomis mesogona*, *Papilio xuthus*, *Matsumuraeses azukivora*, *Ostrinia scapulalis*, *Spodoptera exempta*, *Hyphantria cunea*, *Ostrinia furnacalis*, *Pseudaletia separata*, *Tinea translucens*, *Bactra furfurana*, *Parnara guttata*, *Marasmia exigua*, *Parnara guttata*, *Sesamia inferens*, *Brachmia triannulella*, *Monema flavescens*, *Trichoplusia ni*, *Pleuroptya ruralis*, *Cystidia couaggaria*, *Lampides boeticus*, *Cephonodes hylas*, *Helicoverpa armigera*, *Phalerodonta manleyi*, *Eumeta japonica*, *Pieris brassicae*, *Malacosoma neustria testacea*, *Stathmopoda masinissa*, *Cuphodes diospyrosella*, *Archips xylosteanus*, *Agrotis segetum*, *Tetramoera schistaceana*, *Papilio machaon hippocrates*, *Endoclyta sinensis*, *Lyonetia prunifoliella*, *Phyllonorycter ringoneella*, *Cydia kurokoi*, *Eucoenogenes aestuosa*, *Lobesia botrana*, *Latoia sinica*, *Euzophera batangensis*, *Phalonidia mesotypa*, *Spilosoma imparilis*, *Glyphodes pyloalis*, *Olethreutes mori*, *Tineola bisselliella*, *Endoclyta excrescens*, *Nemapogon granellus*, *Synanthedon hector*, *Cydia pomonella*, *Plutella xylostella*, *Cnaphalocrocis medinalis*, *Sesamia calamistis*, *Scirpophaga incertulas*, *Pediasia teterrellus*, *Phthorimaea operculella*, *Stauropus fagi persimilis*, *Etiella zinckenella*, *Spodoptera exigua*, *Palpifer sexnotata*, *Spodoptera mauritia*, *Scirpophaga innotata*, *Xestia c-nigrum*, *Spodoptera depravata*, *Ephestia kuehniella*, *Angerona prunaria*, *Clostera anastomosis*, *Pseudoplusia includens*, *Matsumuraeses falcana*, *Helicoverpa assulta*, *Autographa nigrisigna*, *Agrotis ipsilon*, *Euproctis pseudoconspersa*, *Adoxophyes orana*, *Caloptilia theivora*, *Homona magnanima*, *Ephestia elutella*, *Eumeta minuscula*, *Clostera anachoreta*, *Heliothis maritima*, *Sparganothis pilleriana*, *Busseola fusca*, *Euproctis subflava*, *Biston robustum*, *Heliothis zea*, *Aedia leucomelas*, *Narosoideus flavidorsalis*, *Viminia rumicis*, *Bucculatrix pyrivorella*, *Grapholita molesta*, *Spulerina astaurota*, *Ectomyelois pyrivorella*, *Chilo suppressalis*, *Acrolepiopsis sapporensis*, *Plodia interpunctella*, *Hellula undalis*, *Sitotroga cerealella*, *Spodoptera litura*, una especie de la familia *Tortricidae* (*Eucosma aporema*), *Acleris comariana*, *Scopelodes contractus*, *Orgyia thyellina*, *Spodoptera frugiperda*, *Ostrinia zaguliaevi*, *Naranga aenescens*, *Andraca bipunctata*, *Paranthrene regalis*, *Acosmeryx castanea*, *Phyllocnistis toparcha*, *Endopiza viteana*, *Eupoecillia ambiguella*, *Anticarsia gemmatalis*, *Cnephasia cinereipalpana*, *Lymantria dispar*, *Dendrolimus spectabilis*, *Leguminivora glycinivorella*, *Maruca testulalis*, *Matsumuraeses phaseoli*, *Caloptilia soyella*, *Phyllocnistis citrella*, *Omiodes indicata*, *Archips fuscocupreanus*, *Acanthoplusia agnata*, *Bambalina* sp., *Carposina niponensis*, *Conogethes punctiferalis*, *Synanthedon* sp., *Lyonetia clerkella*, *Papilio helenus*, *Colias erate poliographus*, *Phalera flavescens*, las especies de la familia *Pieridae* tales como *Pieris rapae crucivora* y *Pieris rapae*, *Euproctis similis*, *Acrolepiopsis suzukiella*, *Ostrinia nubilalis*, *Mamestra brassicae*, *Ascotis selenaria*, *Phtheochroides clandestina*, *Hoshinoa adumbratana*, *Odonestis pruni japonensis*, *Triaena intermedia*, *Adoxophyes orana fasciata*, *Grapholita inopinata*, *Spilonota ocellana*, *Spilonota lechriaspis*, *Illiberis pruni*, *Argyresthia conjugella*, *Caloptilia zachrysa*, *Archips breviplicanus*, *Anomis flava*, *Pectinophora gossypiella*, *Notarcha derogata*, *Diaphania indica*, *Heliothis virescens* y *Earias cupreoviridis*;

las especies del orden *Hemiptera* tales como *Nezara antennata*, *Stenotus rubrovittatus*, *Graphosoma rubrolineatum*, *Trigonotylus coelestialium*, *Aeschynteles maculatus*, *Creontiades pallidifer*, *Dysdercus cingulatus*, *Chrysomphalus ficus*, *Aonidiella aurantii*, *Graptosaltria nigrofuscata*, *Blissus leucotibion*, *Icerya purchasi*, *Piezodorus hybneri*, *Lagynotomus elongatus*, *Thaia subrufa*, *Scotinophara lurida*, *Sitobion ibarae*, *Triozodes iwasaki*, *Aspidiotus destructor*, *Taylorlygus pallidulus*, *Myzus mumecola*, *Pseudaulacaspis prunicola*, *Acyrtosiphon pisum*, *Anacanthocoris striicornis*, *Ectometopterus micantulus*, *Eysarcoris lewisi*, *Molipteryx fuliginosa*, *Cicadella viridis*, *Rhopalosiphum rufiabdominalis*, *Saissetia oleae*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Aguriahana quercus*, *Lygus* spp., *Euceraphis punctipennis*, *Andaspis kashicola*, *Coccus pseudomagnoliarum*, *Cavelerius saccharivorus*, *Galeatus spinifrons*, *Macrosiphoniella sanborni*, *Aonidiella citrina*, *Halyomorpha mista*, *Stephanitis fasciicarina*, *Trioza camphorae*, *Leptocoris chinensis*, *Trioza quercicola*, *Uhlrites latus*, *Erythroneura comes*, *Paromius exiguus*, *Duplaspidotus claviger*, *Nephotettix nigropictus*, *Halticellus insularis*, *Perkinsiella saccharicida*, *Psylla malivorella*, *Anomomeura mori*, *Pseudococcus longispinis*, *Pseudaulacaspis pentagonis*, *Pulvinaria kuwacola*, *Apolygus lucorum*, *Togo hemipterus*, *Toxoptera aurantii*, *Saccharicoccus sacchari*, *Geoica lucifuga*, *Numata muiiri*, *Comstockaspis perniciosa*, *Unaspis citri*, *Aulacorthum solani*, *Eysarcoris ventralis*, *Bemisia argentifolii*, *Cicadella spectra*, *Aspidiotus hederae*, *Liorhyssus hyalinus*, *Calophya nigridorsalis*, *Sogatella furcifera*, *Megoura crassicauda*, *Brevicoryne brassicae*, *Aphis glycines*, *Leptocoris oratories*, *Nephotettix virescens*, *Uroeucon formosanus*, *Cyrtopeltis tenuis*, *Bemisia tabaci*, *Lecanium persicae*, *Parlatoria these*, *Pseudaonidia paeoniae*, *Empoasca onukii*, *Plautia stall*, *Dysaphis tulipae*, *Macrosiphum euphorbiae*, *Stephanitis pyrioides*, *Ceroplastes ceriferus*, *Parlatoria camelliae*, *Apolygus spinolai*, *Nephotettix cincticeps*, *Glaucias subpunctatus*, *Orthotylus flavosparus*, *Rhopalosiphum maidis*, *Peregrinus maidis*, *Eysarcoris parvus*, *Cimex lectularius*, *Psylla abietis*, *Nilaparvata lugens*, *Psylla tobirae*, *Eurydema rugosum*, *Schizaphis pircicola*, *Psylla pyricola*, *Parlatoreopsis pyri*, *Stephanitis nashi*, *Dysmicoccus wistariae*, *Lepholeucaspis japonica*, *Sappaphis piri*, *Lipaphis erysimi*, *Neotoxoptera formosana*, *Rhopalosiphum nymphaeae*, *Edwardsiana rosae*, *Pinnaspis aspidistrae*, *Psylla alni*, *Speusotettix subfuscus*, *Alnetoidia alneti*, *Sogatella panicicola*, *Adelphocoris lineolatus*, *Dysdercus poecilus*, *Parlatoria ziziphi*, *Uhlrites debile*, *Laodelphax striatella*, *Eurydema pulchrum*, *Cletus trigonus*, *Clovium punctata*, *Empoasca* sp., *Coccus hesperidum*, *Pachybrachius luridus*, *Planococcus kraunhiae*, *Stenotus binotatus*, *Arboridia apicalis*, *Macrostes fascifrons*, *Dolycoris baccarum*, *Adelphocoris triannulatus*, *Viteus vitifolii*, *Acanthocoris*

65

sordidus, *Leptocorisa acuta*, *Macropes obnubilus*, *Cletus punctiger*, *Riptortus clavatus*, *Paratrioza cockerelli*, *Aphrophora costalis*, *Lygus disponi*, *Lygus saundersi*, *Crisicoccus pini*, *Empoasca abietis*, *Crisicoccus matsumotoi*, *Aphis craccivora*, *Megacopta punctatissimum*, *Eysarcoris guttiger*, *Lepidosaphes beckii*, *Diaphorina citri*, *Toxoptera citricidus*, *Planococcus citri*, *Dialeurodes citri*, *Aleurocanthus spiniferus*, *Pseudococcus citriculus*,
5 *Zyginella citri*, *Pulvinaria citricola*, *Coccus discrepans*, *Pseudoaonidia duplex*, *Pulvinaria aurantii*, *Lecanium corni*, *Nezara viridula*, *Stenodema calcaratum*, *Rhopalosiphum padi*, *Sitobion akebiae*, *Schizaphis graminum*, *Sorhoanus tritici*, *Brachycaudus helichrysi*, *Carpocoris purpureipennis*, *Myzus persicae*, *Hyalopterus pruni*, *Aphis farinose yanagicola*, *Metasalis populi*, *Unaspis yanonensis*, *Mesohomotoma camphorae*, *Aphis spiraeicola*, *Aphis pomi*,
10 *Lepidosaphes ulmi*, *Psylla mali*, *Heterocordylus flavipes*, *Myzus malisuctus*, *Aphidonuguis mali*, *Orientus ishidae*, *Ovatus malicolens*, *Eriosoma lanigerum*, *Ceroplastes rubens* y *Aphis gossypii*;
las especies del orden Coleoptera tales como *Xystrocera globosa*, *Paederus fuscipes*, *Eucetonia roelofsi*, *Callosobruchus chinensis*, *Cylas formicarius*, *Hypera postica*, *Echinocnemus squamous*, *Oulema oryzae*, *Donacia provosti*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Colasposoma dauricum*, *Euscepes postfasciatus*, *Epilachna varivestis*,
15 *Acanthoscelides obtectus*, *Diabrotica virgifera virgifera*, *Involvulus cupreus*, *Aulacophora femoralis*, *Bruchus pisorum*, *Epilachna vigintioctomaculata*, *Carpophilus dimidiatus*, *Cassida nebulosa*, *Luperomorpha tunebrosa*, *Phyllotreta striolata*, *Psacotheta hilaris*, *Aeolesthes chrysothrix*, *Curculio sikkimensis*, *Carpophilus hemipterus*, *Oxycetonia jucunda*, *Diabrotica* spp., *Mimela splendens*, *Sitophilus zeamais*, *Tribolium castaneum*, *Sitophilus oryzae*, *Palorus subdepressus*, *Melolontha japonica*, *Anoplophora malasiaca*, *Neatus picipes*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Diabrotica undecimpunctata howardi*, *Sphenophorus venatus*, *Crioceris quatuordecimpunctata*,
20 *Conotrachelus nenuphar*, *Ceuthorrhynchidius albosuturalis*, *Phaedon brassicae*, *Lasioderma serricorne*, *Sitona japonicus*, *Adoretus tenuimaculatus*, *Tenebrio molitor*, *Basilepta balyi*, *Hypera nigrirostris*, *Chaetocnema concinna*, *Anomala cuprea*, *Heptophylla picea*, *Epilachna vigintioctopunctata*, *Diabrotica longicornis*, *Eucetonia pilifera*, *Agriotes* spp., *Attagenus unicolorjaponicus*, *Pagria signata*, *Anomala rufocuprea*, *Palorus ratzeburgii*, *Alphitobius laevigatus*, *Anthrenus verbasci*, *Lyctus brunneus*, *Tribolium confusum*, *Medythia nigrobilineata*, *Xylotrechus pyrrhoderus*, *Epitrix cucumeris*, *Tomicus piniperda*, *Monochamus alternatus*, *Popillia japonica*, *Epicauta gorhami*,
25 *Sitophilus zeamais*, *Rhynchites heros*, *Listroderes costirostris*, *Callosobruchus maculatus*, *Phyllobius armatus*, *Anthonomus pomorum*, *Linaeidea aenea* y *Anthonomus grandis*;
las especies del orden Diptera, tales como *Culex pipiens pallens*, *Pegomya hyoscyami*, *Liriomyza huidobrensis*, *Musca domestica*, *Chlorops oryzae*, *Hydrellia sasaki*, *Agromyza oryzae*, *Hydrellia griseola*, *Hydrellia griseola*,
30 *Ophiomyia phaseoli*, *Dacus cucurbitae*, *Drosophila sukuzii*, *Rhacochlaena japonica*, *Muscina stabulans*, las especies de la familia Phoridae, tales como *Megaselia spiracularis*, *Clogmia albipunctata*, *Tipula aino*, *Phormia regina*, *Culex tritaeniorhynchus*, *Anopheles sinensis*, *Hylemya brassicae*, *Asphondylia* sp., *Delia platura*, *Delia antique*, *Rhagoletis cerasi*, *Culex pipiens molestus* Forskal, *Ceratitis capitata*, *Bradysia agrestis*, *Pegomya cunicularia*, *Liriomyza sativae*, *Liriomyza bryoniae*, *Chromatomyia horticola*, *Liriomyza chinensis*, *Culex quinquefasciatus*, *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Liriomyza trifolii*, *Liriomyza sativae*, *Dacus dorsalis*, *Dacus tsuneonis*, *Sitodiplosis mosellana*, *Meromiza nigriventris*, *Anastrepha ludens* y *Rhagoletis pomonella*;
las especies del orden Hymenoptera, tales como *Pristomyrmex pungens*, las especies de la familia Bethyilidae, *Monomorium pharaonis*, *Pheidole noda*, *Athalia rosae*, *Dryocosmus kuriphilus*, *Formica fusca japonica*, las especies de la subfamilia Vespinae, *Athalia infumata infumata*, *Arge pagana*, *Athalia japonica*, *Acromyrmex* spp.,
40 *Solenopsis* spp., *Arge mall* y *Ochetellus glaber*;
las especies del orden Orthoptera, tales como *Homorocoryphus lineosus*, *Gryllotalpa* sp., *Oxya hyla intricata*, *Oxya yezoensis*, *Locusta migratoria*, *Oxya japonica*, *Homorocoryphus jezoensis* y *Teleogryllus emma*;
las especies del orden Thysanoptera, tales como *Selenothrips rubrocinctus*, *Stenchaetothrips biformis*, *Haplothrips aculeatus*, *Ponticulothrips diospyrosi*, *Thrips flavus*, *Anaphothrips obscurus*, *Liothrips floridensis*, *Thrips simplex*,
45 *Thrips nigropilosus*, *Heliethrips haemorrhoidalis*, *Pseudodendrothrips mori*, *Microcephalothrips abdominalis*, *Leeuwenia pasanii*, *Litotetothrips pasaniae*, *Scirtothrips citri*, *Haplothrips chinensis*, *Mycterothrips glycines*, *Thrips setosus*, *Scirtothrips dorsalis*, *Dendrothrips minowai*, *Haplothrips niger*, *Thrips tabaci*, *Thrips alliorum*, *Thrips hawaiiensis*, *Haplothrips kurdjumovi*, *Chirothrips manicatus*, *Frankliniella intonsa*, *Thrips coloratus*, *Frankliniella occidentalis*, *Thrips palmi*, *Frankliniella lilivora* y *Liothrips vaneecke*;
50 las especies del orden Acari, tales como *Leptotrombidium akamushi*, *Tetranychus ludeni*, *Dermacentor variabilis*, *Tetranychus truncatus*, *Ornithonyssus bacoti*, *Demodex canis*, *Tetranychus viennensis*, *Tetranychus kanzawai*, las especies de la familia Ixodidae, tales como *Rhipicephalus sanguineus*, *Cheyletus malaccensis*, *Tyrophagus putrescentiae*, *Dermatophagoides farinae*, *Latrodectus hasseltii*, *Dermacentor taiwanicus*, *Acaphylla theavagrans*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Aculops lycopersici*, *Ornithonyssus sylvairum*, *Tetranychus urticae*, *Eriophyes chibaensis*, *Sarcoptes scabiei*, *Haemaphysalis longicornis*, *Ixodes scapularis*, *Tyrophagus similis*, *Cheyletus eruditus*, *Panonychus citri*, *Cheyletus moorei*, *Brevipalpus phoenicis*, *Octodectes cynotis*, *Dermatophagoides ptenyssus*, *Haemaphysalis flava*, *Ixodes ovatus*, *Phyllocoptura citri*, *Aculus schlechtendali*, *Panonychus ulmi*, *Amblyomma americanum*, *Dermanyssus gallinae*, *Rhyzoglyphus robini* y *Sancassania* sp.;
60 las especies del orden Isoptera, tales como *Reticulitermes miyatakei*, *Incisitermes minor*, *Coptotermes formosanus*, *Hodotermopsis japonica*, *Reticulitermes* sp., *Reticulitermes flaviceps amamianus*, *Glyptotermes kushimensis*, *Coptotermes guanzhoensis*, *Neotermes koshunensis*, *Glyptotermes kodamai*, *Glyptotermes satsumensis*, *Cryptotermes domesticus*, *Odontotermes formosanus*, *Glyptotermes nakajimai*, *Pericapritermes nitobei* y *Reticulitermes speratus*;
las especies del orden Blattodea, tales como *Periplaneta fuliginosa*, *Blattella germanica*, *Blatta orientalis*,
65 *Periplaneta brunnea*, *Blattella lituricollis*, *Periplaneta japonica* y *Periplaneta americana*;
las especies del orden Siphonaptera, tales como *Pulex irritans*, *Ctenocephalides felis* y *Ceratophyllus gallinae*; las

especies del filo *Nematoda*, tales como *Nothotylenchus acris*, *Aphelenchoides besseyi*, *Pratylenchus penetrans*, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne incognita*, *Globodera rostochiensis*, *Meloidogyne javanica*, *Heterodera glycines*, *Pratylenchus coffeae*, *Pratylenchus neglectus* y *Tylenchus semipenetrans*;

5 las especies del filo *Mollusca*, tales como *Pomacea canaliculata*, *Achatina fulica*, *Meghimatium bilineatum*, *Lehmannina valentiana*, *Limax flavus* y *Acusta despecta sieboldiana*.

Además, el insecticida agrícola y hortícola de la presente invención también tiene un fuerte efecto insecticida sobre *Tuta absolute*.

10 Además, también se incluyen los ácaros y garrapatas parásitos de animales en las plagas diana, y los ejemplos incluyen las especies de la familia *Ixodidae*, tales como *Boophilus microplus*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Haemaphysalis longicornis*, *Haemaphysalis flava*, *Haemaphysalis campanulata*, *Haemaphysalis concinna*, *Haemaphysalis japonica*, *Haemaphysalis kitaokai*, *Haemaphysalis ias*, *Ixodes ovatus*, *Ixodes nipponensis*, *Ixodes persulcatus*, *Amblyomma testudinarium*, *Haemaphysalis megaspinoza*, *Dermacentor reticulatus* y *Dermacentor taiwanensis*; *Dermanyssus gallinae*; las especie del género *Ornithonyssus*, tales como *Ornithonyssus sylviarum* y *Ornithonyssus bursa*; las especies de la familia *Trombiculidae*, tales como *Eutrombicula wichmanni*, *Leptotrombidium akamushi*, *Leptotrombidium pallidum*, *Leptotrombidium fuji*, *Leptotrombidium tosa*, *Neotrombicula autumnalis*, *Eutrombicula alfreddugesi* y *Helenicula miyagawai*; las especies de la familia *Cheyletidae*, tales como *Cheyletiella yasguri*, *Cheyletiella parasitivorax* y *Cheyletiella blakei*; las especies de la familia *Sarcoptoidea*, tales como *Psoroptes cuniculi*, *Chorioptes bovis*, *Otodectes cynotis*, *Sarcoptes scabiei* y *Notoedres cati* y las especies de la familia *Demodicidae*, tales como *Demodex canis*.

25 Otras plagas diana incluyen pulgas, que incluyen los insectos ectoparasitarios sin alas que pertenecen al orden Siphonaptera, más específicamente, las especies pertenecientes a las familias *Pulicidae* y *Ceratophyllidae*. Los ejemplos de especies pertenecientes a la familia *Pulicidae* incluyen *Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Echidnophaga gallinacea*, *Xenopsylla cheopis*, *Leptopsylla segnis*, *Nosopsyllus fasciatus* y *Monopsyllus anisus*.

30 Otras plagas objetivo incluyen ectoparásitos, por ejemplo, las especies del suborden *Anoplura*, tal como *Haematopinus eurysternus*, *Haematopinus asini*, *Dalmalinia ovis*, *Linognathus vituli*, *Haematopinus suis*, *Phthirus pubis* y *Pediculus capitis*; las especies del orden *Mallophaga*, tales como *Trichodectes canis*; y plagas de insectos dípteros hematófagos tales como *Tabanus trigonus*, *Culicoides schultzei* y *Simulium ornatum*. También se incluyen endoparásitos, por ejemplo, nemátodos tales como gusanos pulmonares, tricuros, gusanos nodulares, lombrices parasitarias endogástricas, ascárides y filarias; cestodos tales como *Spirometra erinacei*, *Diphyllobothrium latum*, *Dipylidium caninum*, *Mult loops mult loops*, *Echinococcus granulosus* y *Echinococcus multilocularis*; trematodos tales como *Schistosoma japonicum* y *Fasciola hepatica*; y protozoos tales como coccidios, *Plasmodium*, *Sarcocystis* intestinal, *Toxoplasma* y *Cryptosporidium*.

40 El insecticida agrícola y hortícola que comprende el compuesto heterocíclico condensado que contiene un grupo oxima representado por la fórmula general (1) de la presente invención o una sal del mismo como principio activo tiene un notable efecto sobre las plagas anteriormente descritas que dañan los cultivos de llanura, cultivos de campo, árboles frutales, verduras, otros cultivos, plantas ornamentales con flores, etc. Se puede obtener el efecto deseado cuando el insecticida agrícola y hortícola se aplica a los viveros para plántulas, arrozales, campos, árboles frutales, verduras, otros cultivos, plantas ornamentales con flores, etc. y sus semillas, agua de arrozal, follaje, medios de cultivo tales como el suelo o similares, alrededor del momento esperado de infestación por plagas, es decir, antes de la infestación o tras la confirmación de la infestación. En realizaciones particularmente preferibles, la aplicación del insecticida agrícola y hortícola utiliza la denominada penetración y translocación. Es decir, el suelo de vivero, suelo en hoyos de trasplante, pie de planta, agua de riego, agua de cultivo en cultivos hidropónicos o similares se trata con los insecticidas agrícolas y hortícolas para permitir que los cultivos, plantas ornamentales con flores, etc. absorban el compuesto de 50 la presente invención por las raíces a través del suelo o de otro modo.

Los ejemplos de plantas útiles a las cuales se puede aplicar el insecticida agrícola y hortícola de la presente invención incluyen, pero no se limitan de forma particular a, cereales (por ejemplo, arroz, cebada, trigo, centeno, avena, maíz, etc.), legumbres (p. ej., soja, judías adzuki, habas, guisantes verdes, alubias, cacahuètes, etc.), árboles frutales y 55 frutas (p. ej., manzanas, frutas cítricas, peras, uvas, melocotones, ciruelas, cerezas, nueces, castañas, almendras, plátanos, etc.), verduras de hojas y frutas (por ejemplo, repollos, tomates, espinaca, brócoli, lechuga, cebollas, cebollas verdes (cebollinos y cebolletas), pimientos verdes, berenjenas, fresas, cultivos de pimientos, quingombó, cebollino chino, etc.), verduras de raíz (por ejemplo, zanahorias, patatas, batatas, colcasias, rábanos japoneses, nabos, raíces de loto, raíces de bardana, ajo, cebolletas chinas, etc.), cultivos para procesamiento (p. ej., algodón, cáñamo, remolacha, lúpulo, caña de azúcar, remolacha azucarera, aceitunas, caucho, café, tabaco, té, etc.), calabazas (p. ej., calabazas japonesas, pepinos, sandías, melones dulces orientales, melones, etc.), pasto (p. ej., dátilo, sorgo, fleo, trébol, alfalfa, etc.), césped (p. ej., césped coreano, agrostis, etc.), cultivos de especias y aromáticos y cultivos ornamentales (por ejemplo, lavanda, romero, tomillo, perejil, pimienta, jengibre, etc.), plantas ornamentales con flores (por ejemplo, crisantemo, rosa, clavel, orquídea, tulipán, lirio, etc.), árboles de jardín (por ejemplo, ginkgos, cerezos, laurel moteado, etc.) y árboles forestales (por ejemplo, *Abiessachalinensis*, *Picea jezoensis*, pino, cedro amarillo, cedro japonés, falso ciprés japonés hinoki, eucalipto, etc.). 65

Las "plantas" mencionadas anteriormente también incluyen plantas provistas de tolerancia a herbicidas mediante una técnica de mejora clásica o una técnica de recombinación genética. Los ejemplos de dicha tolerancia a herbicidas incluyen tolerancia a inhibidores de HPPD, tales como isoxaflutol; inhibidores de ALS, tales como imazetapir y

5 tifensulfuron-metilo; inhibidores de la EPSP sintasa, tales como glifosato; inhibidores de la glutamina sintetasa, tales como glufosinato; inhibidores de la acetil-CoA carboxilasa, tales como setoxidim; u otros herbicidas, tales como bromoxinilo, dicamba y 2,4-D.

Los ejemplos de las plantas provistas de tolerancia a herbicidas mediante una técnica de mejora clásica incluyen variedades de colza, trigo, girasol y arroz tolerantes a la familia de imidazolinona de herbicidas inhibidores de ALS

10 tales como imazetapir y dichas plantas se venden con el nombre comercial de Clearfield (marca registrada). También se incluye una variedad de soja provista de tolerancia a la familia de las sulfonilureas de herbicidas inhibidores de ALS tales como el tifensulfuron-metilo mediante una técnica de mejora clásica y se vende con el nombre comercial de soja STS. También se incluyen plantas provistas de tolerancia a inhibidores de acetil-CoA carboxilasa tales como herbicidas de triona oxima y herbicidas de ácido ariloxi fenoxipropiónico mediante una técnica de mejora clásica, por ejemplo, maíz SR y similares.

Las plantas provistas de tolerancia a los inhibidores de la acetil-CoA carboxilasa se describen en Proc. Natl. Acad. Sci. EE.UU, 87, 7175-7179 (1990) y similares. Además, se informa de mutantes de acetil-CoA carboxilasa resistentes a

20 los inhibidores de acetil-CoA carboxilasa en Weed Science, 53, 728-746 (2005), y similares, e introduciendo el gen de dicho mutante de acetil-CoA carboxilasa en plantas mediante una técnica de recombinación génica o introduciendo una mutación que confiere resistencia en acetil-CoA carboxilasa de plantas, pueden obtenerse por ingeniería genética plantas tolerantes a inhibidores de la acetil-CoA carboxilasa. Como alternativa, mediante la introducción de un ácido nucleico que provoca una mutación de sustitución de bases en células vegetales (un ejemplo típico de esta técnica es

25 la técnica de quimeroplastia (Gura T. 1999. Repairing the Genome's Spelling Mistakes. Science 285: 316-318.)) para permitir la mutación de sustitución específica del sitio en los aminoácidos codificados por un gen de acetil-CoA carboxilasa, un gen de ALS o similar de plantas, plantas tolerantes a los inhibidores de la acetil-CoA carboxilasa, inhibidores de ALS o similares pueden obtenerse por ingeniería genética. El insecticida agrícola y hortícola de la presente invención se puede aplicar también a estas plantas.

Además, las toxinas ilustrativas expresadas en plantas modificadas genéticamente incluyen proteínas insecticidas de *Bacillus cereus* o *Bacillus popilliae*; δ -endotoxinas de *Bacillus thuringiensis*, tales como CryIAb, CryIAc, CryIF, CryIFa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1 y Cry9C, y otras proteínas insecticidas, tales como VIP1, VIP2, VIP3 y VIP3A; proteínas insecticidas de nematodos; toxinas producidas por animales, tales como toxinas de escorpiones, toxinas de arañas, toxinas de abejas y neurotoxinas específicas de insectos; toxinas de hongos filamentosos; lectinas vegetales;

35 aglutinina; inhibidores de proteasas, tales como inhibidores de tripsina, inhibidores de serina proteasa, inhibidores de patatina, cistatina y papaína; proteínas inactivadoras de ribosomas (RIP), tales como ricina, RIP de maíz, abrina, lufina, saporina y briodina; enzimas metabolizadoras de esteroides, tales como la 3-hidroxiesteroide oxidasa, ecdiesterioide-UDP-glucosiltransferasa y colesterol oxidasa; inhibidores de ecdisona; HMG-CoA reductasa; inhibidores de canales de iones, tales como inhibidores de los canales de sodio e inhibidores de los canales de calcio; hormona esterasa juvenil; receptores de la hormona diurética; estilbeno sintasa; bibencil sintasa; quitinasa; y glucanasa.

También se incluyen toxinas híbridas, toxinas parcialmente deficientes y toxinas modificadas procedentes de lo siguiente: proteínas δ -endotoxinas tales como CryIAb, CryIAc, CryIF, CryIFa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1, Cry9C, Cry34Ab y Cry35Ab, y otras proteínas insecticidas tales como VIP1, VIP2, VIP3 y VIP3A. La toxina híbrida se puede producir combinando algunos dominios de estas proteínas de forma diferente a la combinación original en la naturaleza con el uso de una técnica de recombinación. Como toxina parcialmente deficiente, se conoce una toxina CryIAb en la que se elimina una parte de la secuencia de aminoácidos. En la toxina modificada, se sustituyen uno o más aminoácidos de una toxina de origen natural.

Se describen ejemplos de las toxinas anteriores y de plantas modificadas genéticamente capaces de sintetizar estas toxinas en los documentos EP-A-0 374 753, WO 93/07278, WO 95/34656, EP-A-0 427 529, EP-A-451 878, WO 03/052073, etc.

Debido a las toxinas contenidas en dichas plantas modificadas genéticamente, las plantas presentan resistencia a plagas, en particular, plagas de insectos coleópteros, plagas de insectos hemípteros, plagas de insectos dípteros, plagas de insectos lepidópteros y nematodos. Las tecnologías anteriormente descritas y el insecticida agrícola y hortícola de la presente invención se pueden usar en combinación o usar de forma sistemática.

Para controlar las plagas diana, el insecticida agrícola y hortícola de la presente invención, con o sin dilución o suspensión adecuada en agua, etc., se aplica a plantas potencialmente infestadas con las plagas de insectos o nematodos diana en una cantidad eficaz para el control de las plagas de insectos o nematodos. Por ejemplo, para combatir plagas de insectos y nematodos que pueden dañar plantas de cultivo tales como árboles frutales, cereales y verduras, se puede realizar aplicación foliar y tratamiento de semillas, tal como inmersión, recubrimiento en polvo y recubrimiento de peróxido de calcio. Además, también se puede realizar un tratamiento del suelo o similar para permitir que las plantas absorban productos agroquímicos a través de sus raíces. Los ejemplos de dicho tratamiento incluyen

la incorporación a suelo completo, tratamiento de hileras de siembra, incorporación en el suelo del semillero, tratamiento de plántulas en tapón, tratamiento del hoyo de plantación, tratamiento del pie de la planta, aplicación de cobertura, tratamiento de cajas de vivero para arroz con cáscara y aplicación sumergida. Además, se puede realizar la aplicación a los medios de cultivo en hidroponía, tratamiento con humo, inyección en el tronco y similares.

5 Además, el insecticida agrícola y hortícola de la presente invención, con o sin dilución o suspensión adecuada en agua, etc., se puede aplicar a sitios potencialmente infestados de plagas en una cantidad eficaz para el control de las plagas. Por ejemplo, se puede aplicar directamente a las plagas de granos almacenados, plagas domésticas, plagas sanitarias, plagas forestales, etc., y también se puede usar para el revestimiento de materiales de construcción
10 residencial, para el tratamiento con humo o como una formulación de cebo.

Los métodos a modo de ejemplo de tratamiento de semillas incluyen sumergir las semillas en un líquido diluido o sin diluir de una formulación líquida o sólida para la penetración de productos agroquímicos en las semillas; mezcla o recubrimiento en polvo de semillas con una formulación sólida o líquida para la adherencia de la formulación a las superficies de las semillas; recubrimiento de semillas con una mezcla de una formulación sólida o líquida y un vehículo adhesivo tal como resinas y polímeros; y aplicación de una formulación sólida o líquida en las proximidades de las semillas al mismo tiempo que la siembra.

El término "semilla" en el tratamiento de semillas mencionado anteriormente se refiere a un cuerpo vegetal que se encuentra en las primeras etapas de cultivo y se usa para la propagación de plantas. Los ejemplos incluyen, además de la llamada semilla, un cuerpo vegetal para la propagación vegetativa, tal como un bulbo, un tubérculo, una patata de siembra, un bulbillo, un propágulo, un tallo discoide y un tallo usado para propagación por esquejes.

El término "suelo" o "medio de cultivo" en el método de la presente invención para usar un insecticida agrícola y hortícola se refiere a un medio de soporte para el cultivo de cosechas, en particular, un medio de soporte que permita que las plantas de cultivo extiendan sus raíces en el mismo, y los materiales no están particularmente limitados siempre que permitan que las plantas crezcan. Los ejemplos del medio de soporte incluyen lo que se denomina suelos, esteras de plántulas y agua, y los ejemplos específicos de los materiales incluyen arena, piedra pómez, vermiculita, diatomita, agar-agar, sustancias gelatinosas, sustancias de alto peso molecular, lana de roca, lana de vidrio, virutas y corteza de madera.

Los métodos a modo de ejemplo de aplicación al follaje de los cultivos o a plagas de granos almacenados, plagas domésticas, plagas sanitarias, plagas forestales, etc., incluyen la aplicación de una formulación líquida, tal como un concentrado emulsionable y una formulación fluida o sólida, tal como un polvo humectable y un gránulo dispersable en agua, después de una dilución adecuada en agua; aplicación en polvo; y humo.

Los métodos a modo de ejemplo de aplicación al suelo incluyen la aplicación de una formulación líquida, diluida en agua o sin diluir, al pie de las plantas, semilleros de viveros para plántulas o similares; aplicación de un gránulo al pie de las plantas, semilleros de viveros para plántulas o similares; aplicación de un polvo, un polvo humectable, un gránulo dispersable en agua, un gránulo o similar en el suelo y la posterior incorporación de la formulación en todo el suelo antes de sembrar o trasplantar; y aplicación de un polvo, un polvo humectable, un gránulo dispersable en agua, un gránulo o similar a hoyos de siembra, hileras de siembra o similares antes de sembrar o plantar.

A cajas de vivero para arroz con cáscara, por ejemplo, un polvo fino, un gránulo dispersable en agua, un gránulo o similar se le puede aplicar, aunque la formulación adecuada puede variar según el momento de aplicación, en otras palabras, dependiendo de la etapa de cultivo, tal como el momento de la siembra, periodo de reverdecimiento y momento de la plantación. Una formulación tal como un polvo, un gránulo dispersable en agua y un gránulo se pueden mezclar con suelo de vivero. Por ejemplo, dicha formulación se incorpora al suelo del semillero, cubriendo el suelo o a todo el suelo. Simplemente, se pueden colocar alternativamente en capas suelo de vivero y dicha formulación.

En la aplicación a los arrozales, una formulación sólida, tal como un jumbo, un paquete, un gránulo y un gránulo dispersable en agua, o una formulación líquida, tal como un concentrado fluido y uno emulsionable, se aplica habitualmente a arrozales inundados. En un periodo de siembra de arroz, una formulación adecuada, tal cual o después de mezclar con un fertilizante o similar, puede aplicarse al suelo o inyectarse en el suelo. Además, un concentrado emulsionable, un fluido o similar se puede aplicar a la fuente de suministro de agua para los arrozales, tal como una entrada de agua y un dispositivo de riego. En este caso, el tratamiento se puede lograr con el suministro de agua y, por lo tanto, se puede lograr de una manera que ahorre trabajo.

En el caso de cultivos de campo, sus semillas, los medios de cultivo en las proximidades de sus plantas, o similares, pueden tratarse en el periodo de cultivo de siembra a plántulas. En el caso de plantas cuyas semillas se siembran directamente en el campo, además del tratamiento directo de semillas, es preferible el tratamiento del pie de las plantas durante el cultivo. Específicamente, el tratamiento puede realizarse, por ejemplo, aplicando un gránulo sobre el suelo o empapando el suelo con una formulación en forma líquida diluida en agua o sin diluir. Otro tratamiento preferible es la incorporación de un gránulo al medio de cultivo antes de la siembra.

En el caso de plantas de cultivo para trasplantar, los ejemplos preferibles del tratamiento en el periodo de cultivo de

siembra a plántulas incluyen, además del tratamiento directo de semillas, tratamiento por empapamiento de semilleros de vivero para plántulas con una formulación en forma líquida; y aplicación de gránulos a semilleros de vivero para plántulas. También se incluyen el tratamiento de hoyos de siembra con un gránulo; y la incorporación de un gránulo al medio de cultivo en las proximidades de los puntos de siembra en el momento de la plantación fija.

5 El insecticida agrícola y hortícola de la presente invención se usa normalmente en forma de una formulación conveniente para su aplicación, la cual se prepara según el método habitual para preparar formulaciones agroquímicas.

10 Es decir, el compuesto heterocíclico condensado que contiene un grupo oxima representado por la fórmula general (1) de la presente invención o una sal del mismo y un vehículo inactivo apropiado y, si fuera necesario, un adyuvante, se mezclan en una proporción apropiada y mediante la etapa de disolución, separación, suspensión, mezcla, impregnación, adsorción y/o adhesión, se formulan en una forma apropiada para la aplicación, tal como un concentrado en suspensión, un concentrado emulsionable, un concentrado soluble, un polvo humectable, un gránulo dispersable en agua, un gránulo, un polvo fino, y comprimido y un paquete.

15 La composición (insecticida agrícola y hortícola o agente de control parasitario animal) de la presente invención opcionalmente puede contener un aditivo usado para formulaciones agroquímicas o agentes de control parasitario animal junto con el principio activo. Los ejemplos de aditivos incluyen vehículos tales como vehículos sólidos o líquidos, tensioactivos, dispersantes, agentes humectantes, aglutinantes, adherentes, espesantes, colorantes, esparcidores, agentes de adhesión/esparcidores, agentes anticongelantes, agentes antiaglomerantes, agentes disgregantes y estabilizantes. Si fuera necesario, conservantes, fragmentos de plantas, etc. se pueden usar también como aditivos. Uno de estos aditivos se puede usar solo o se pueden usar dos o más de ellos en combinación.

25 Los ejemplos de vehículos sólidos incluyen minerales naturales, tales como cuarzo, arcilla, caolinita, pirofilita, sericita, talco, bentonita, arcilla ácida, atapulgita, zeolita y diatomita; sales inorgánicas, tales como carbonato cálcico, sulfato de amonio, sulfato de sodio y cloruro de potasio; vehículos sólidos orgánicos, tales como ácido silícico sintético, silicatos sintéticos, almidón, celulosa y polvos vegetales (por ejemplo, serrín, cáscara de coco, mazorca de maíz, tallo del tabaco, etc.); vehículos plásticos, tales como polietileno, polipropileno y cloruro de polivinilideno; urea; materiales inorgánicos huecos; materiales plásticos huecos y sílice pirógena (carbón blanco). Se puede usar uno de estos vehículos sólidos o una combinación de dos o más de ellos.

35 Los ejemplos de vehículos líquidos incluyen alcoholes, incluyendo alcoholes monohídricos, tales como metanol, etanol, propanol, isopropanol y butanol y alcoholes polihídricos, tales como etilenglicol, dietilenglicol, propilenglicol, hexilenglicol, polietilenglicol, polipropilenglicol y glicerina; compuestos de poliol, tales como éter de propilenglicol; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona, diisobutil cetona y ciclohexanona; éteres, tales como éter etílico, dioxano, etilenglicol monoetil éter, dipropil éter y tetrahidrofurano; hidrocarburos alifáticos, tales como parafina normal, nafteno, isoparafina, queroseno y aceite mineral; hidrocarburos aromáticos, tales como benceno, tolueno, xileno, nafta disolvente y alquil naftaleno; hidrocarburos halogenados, tales como diclorometano, cloroformo y tetracloruro de carbono; ésteres, tales como acetato de etilo, ftalato de diisopropilo, ftalato de dibutilo, ftalato de dioctilo y adipato de dimetilo; lactonas, tales como γ -butirolactona; amidas, tales como dimetilformamida, dietilformamida, dimetilacetamida y N-alquil pirrolidinona; nitrilos, tales como acetonitrilo; compuestos de azufre, tales como dimetilsulfóxido; aceites vegetales, tales como aceite de soja, aceite de colza, aceite de semilla de algodón y aceite de ricino y agua. Se puede usar uno de estos vehículos líquidos solo o se pueden usar dos o más de ellos en combinación.

45 Los ejemplos de tensioactivos usados como dispersante o agente humectante/esparcidos incluyen tensioactivos no iónicos, tales como éster de ácido graso de sorbitano, éster de ácido graso de polioxietileno sorbitano, éster de ácido graso de sacarosa, éster de ácido graso de polioxietileno, éster de ácido de resina de polioxietileno, diéster de ácido graso de polioxietileno, alquil éter de polioxietileno, alquil aril éter de polioxietileno, alquil fenil éter de polioxietileno, dialquil fenil éter de polioxietileno, condensados de formaldehído-alquil fenil éter de polioxietileno, copolímeros en bloque de polioxietileno-polioxipropileno, polímeros en bloque de poliestireno-polioxietileno, alquil éter de copolímero en bloque de polioxietileno-polipropileno, alquilamina de polioxietileno, amida de ácido graso de polioxietileno, bis (fenil éter) de ácido graso de polioxietileno, bencil fenil éter de polialquileno, estiril fenil éter de polioxialquileno, acetilen diol, acetilen diol con polioxialquileno añadido, silicona de tipo polioxietileno éter, silicona de tipo éster, fluorotensioactivos, aceite de ricino de polioxietileno y aceite de ricino hidrogenado de polioxietileno; tensioactivos aniónicos, tales como alquil sulfatos, alquil éter sulfatos de polioxietileno, alquil fenil éter sulfatos de polioxietileno, estiril fenil éter sulfatos de polioxietileno, alquilbencen sulfonatos, alquilaril sulfonatos, lignosulfonatos, alquil sulfosuccinatos, naftalen sulfonatos, alquilnaftalen sulfonatos, sales de condensados de ácido naftaleno-sulfónico-formaldehído, sales de condensados de ácido alquilnaftaleno-sulfónico-formaldehído, sales de ácidos grasos, sales de ácido policarboxílico, poliácridatos, sarcosinatos de ácido N-metil-graso, resinatos, fosfatos de polioxietileno alquil éter y fosfatos de polioxietileno alquil fenil éter; tensioactivos catiónicos que incluyen sales de alquil amina, tales como clorhidrato de lauril amina, clorhidrato de estearil amina, clorhidrato de oleil amina, acetato de estearil amina, acetato de estearil aminopropil amina, alquilo trimetil cloruro de amonio y cloruro de alquil dimetil benzalconio; y tensioactivos anfóteros, tales como tensioactivos anfótero de tipo aminoácido o de tipo betaína. Se puede usar uno de estos tensioactivos solo o se pueden usar dos o más de ellos en combinación.

5 Los ejemplos de aglutinantes o de adherentes incluyen carboximetilcelulosa o sales de la misma, dextrina, almidón soluble, goma de xantano, goma guar, sacarosa, polivinilpirrolidona, goma arábiga, alcohol polivinílico, acetato de polivinilo, poliacrilato de sodio, polietilenglicoles con un peso molecular medio de 6.000 a 20.000, óxidos de polietileno con un peso molecular medio de 100.000 a 5.000.000, fosfolípidos (por ejemplo, cefalina, lecitina, etc.), polvo de celulosa, dextrina, almidón modificado, compuestos quelantes de ácido poliaminocarboxílico, polivinilpirrolidona reticulada, copolímeros de ácido maleico-estireno, copolímeros de ácido (met)acrílico, semiésteres de polímero de alcohol polihídrico y anhídrido dicarboxílico, poliestiren sulfonatos solubles en agua, parafina, terpeno, resinas de poliamida, poliacrilatos, polioxietileno, ceras, polivinil alquil éter, condensados de alquilfenol-formaldehído y emulsiones de resinas sintéticas.

15 Los ejemplos de espesantes incluyen polímeros solubles en agua, tales como goma xantana, goma guar, goma diutano, carboximetilcelulosa, polivinilpirrolidona, polímeros de carboxivinilo, polímeros acrílicos, compuestos de almidón y polisacáridos; y polvos finos inorgánicos, tales como bentonita de alta calidad y sílice pirógena (carbón blanco).

Los ejemplos de los colorantes incluyen pigmentos inorgánicos, tales como óxido de hierro, óxido de titanio y azul de Prusia; y tintes orgánicos, tales como tintes de alizarina, tintes azo y tintes de ftalocianina metálica.

20 Los ejemplos de agentes anticongelantes incluyen alcoholes polihídricos, tales como etilenglicol, dietilenglicol, propilenglicol y glicerina.

25 Los ejemplos de los adyuvantes que sirven para evitar el apelmazamiento o facilitar la disgregación incluyen polisacáridos (almidón, ácido algínico, manosa, galactosa, etc.), polivinilpirrolidona, sílice pirógena (carbón blanco), goma de éster, resina de petróleo, tripolifosfato sódico, hexametáfosfato de sodio, estearatos metálicos, polvo de celulosa, dextrina, copolímeros de metacrilato, polivinilpirrolidona, compuestos quelantes de ácido poliaminocarboxílico, copolímeros de anhídrido estiren-isobutilen-maleico sulfonados y copolímeros de injerto de almidón-poliacrilonitrilo.

30 Los ejemplos de los agentes estabilizantes incluyen desecantes, tales como zeolita, cal viva y óxido de magnesio; antioxidantes, tales como compuestos fenólicos, compuestos de amina, compuestos de azufre y compuestos de ácido fosfórico; y absorbedores de ultravioleta, tales como compuestos de ácido salicílico y compuestos de benzofenona.

35 Los ejemplos de los conservantes incluyen sorbato potásico y 1,2-benzotiazolin-3-ona.

Además, otros adyuvantes que incluyen agentes dispersantes funcionales, potenciadores de la actividad tales como inhibidores metabólicos (butóxido de piperonilo, etc.), agentes anticongelantes (propilenglicol, etc.), antioxidantes (BHT, etc.) y absorbentes ultravioleta se pueden usar también si fuera necesario.

40 La cantidad del compuesto del ingrediente activo en el insecticida agrícola y hortícola de la presente invención se puede ajustar si fuera necesario y, básicamente, la cantidad de compuesto del principio activo se selecciona de forma apropiada dentro del intervalo de 0,01 a 90 partes en peso en 100 partes en peso del insecticida agrícola y hortícola. Por ejemplo, en el caso en el que el insecticida agrícola y hortícola es un polvo, un gránulo, un concentrado emulsionable o un polvo humectable, es adecuado que la cantidad del compuesto del principio activo sea de 0,01 a 45 50 partes en peso (del 0,01 al 50 % en peso con respecto al peso total del insecticida agrícola y hortícola).

50 La velocidad de aplicación del insecticida agrícola y hortícola de la presente invención puede variar debido a diversos factores, por ejemplo, el propósito, la plaga diana, las condiciones de crecimiento de los cultivos, la tendencia a la infestación por plagas, el clima, las condiciones ambientales, la forma de dosificación, el método de aplicación, el sitio de aplicación, la esterificación de la aplicación, etc., pero básicamente, la velocidad de aplicación del compuesto del principio activo se selecciona de manera apropiada del intervalo de 0,001 g a 10 kg y, preferentemente, de 0,01 g a 1 kg por 10 áreas, dependiendo del propósito.

55 Asimismo, para la expansión de la variedad de plagas diana y el tiempo apropiado para el control de la plaga o para la reducción de la dosis, el insecticida agrícola y hortícola de la presente invención se puede usar después de mezclar con otros insecticidas agrícolas y hortícolas, acaricidas, nematocidas, microbicidas, parasiticidas y/o similares. Además, el insecticida agrícola y hortícola se puede usar después de mezclar con herbicidas, reguladores del crecimiento de la planta, fertilizantes y/o similares, dependiendo de la situación.

60 Los ejemplos de dichos otros insecticidas agrícolas y hortícolas, acaricidas y nematocidas usados para los fines mencionados anteriormente incluyen metilcarbamato de 3,5-xililo (XMC), toxinas proteicas cristalinas producidas por *Bacillus thuringiensis* tales como *Bacillus thuringiensis aizawai*, *Bacillus thuringiensis israelensis*, *Bacillus thuringiensis japonensis*, *Bacillus thuringiensis kurstaki* y *Bacillus thuringiensis tenebrionis*, BPMC, compuestos insecticidas derivados de la toxina Bt, clorfenson (CPCBS), diclorodiisopropil éter (DCIP), 1,3-dicloropropeno (D-D), DDT, NAC, O-4-dimetilsulfamoilfenil O,O-dietil fosforotioato (DSP), O-etil O-4-nitrofenil fenilfosfonotioato (EPN), tripropilisocianurato (TPIC), acrinatrina, azadiractina, azinfós-metilo, acequinocilo, acetamiprid, acetoprol, acefato, abamectina,

avermectina-B, amidoflumet, amitraz, alanicarb, aldicarb, aldoxicarb, aldrina, alfa-endosulfán, alfa-cipermetrina, albendazol, aletrina, isazofós, isamidofós, isoamidofós, isoxatión, isofenfós, isoprocarb (MIPC), ivermectina, imiciafós, imidacloprid, imiprotrina, indoxacarb, esfenvalerato, etiofencarb, etión, etiprol, etoxazol, etofenprox, etoprofós, etrimfós, emamectina, emamectina-benzoato, endosulfán, empentrina, oxamilo, oxidemetón-metilo, oxideprofós (ESP), oxibendazol, oxfendazol, oleato de potasio, oleato de sodio, cadusafós, cartap, carbarilo, carbosulfano, carbofurano, gamma-cihalotrina, xililcarb, quinalfós, kinopreno, cinometionat, cloetocarb, clotianidina, clofentezina, cromafenozida, clorantraniliprol, cloretoxifós, clordimeform, clordano, clorpirifós, clorpirifós-metilo, clorfenapir, clorfensón, clorfenvinfós, clorfluzazurón, clorobencilato, clorobenzoato, keltthane (dicofol), salitión, cianofós (CYAP), diafentiurón, diamidafós, ciantraniliprol, theta-cipermetrina, dienocloro, cienopirafeno, dioxabenzofós, diofenolán, sigma-cipermetrina, diclofentiación (ECP), cicloprotrina, diclorvos (DDVP), disulfotón, dinotefurano, cihalotrina, cifenotrina, ciflutrina, diflubenzurón, ciflumetofeno, diflovidazina, cihexatina, cipermetrina, dimetilvinfós, dimetoato, dimeflutrina, silafluofeno, ciromazina, espinetoram, espinosad, espiroclorofeno, espirotetramat, espiromesifeno, sulfluramida, sulprofós, sulfoxaflor, zeta-cipermetrina, diacínón, tau-fluvalinato, dazomet, tiacloprid, tiametoxam, tiodicarb, tiociclam, tiosultap, tiosultap-sodio, tionazina, tiometón, deet, dieldrina, tetraclorvinfós, tetradifón, tetrametilflutrina, tetrametrina, tebupirimfós, tebufenozida, tebufenpirad, teflutrina, teflubenzurón, demetón-S-metilo, temefós, deltametrina, terbufós, tralopirilo, tralometrina, transflutrina, triazamato, triazurón, triclamida, triclorfón (DEP), triflumurón, tolfenpirad, naled (BRP), nitiazina, nitenpiram, novalurón, noviflumurón, hidropreno, vaniliprol, vamidotión, paratiación, paratiación-metilo, halfenprox, halofenozida, bistriflurón, bisultap, hidrametilnona, almidón de hidroxipropilo, binapacril, bifenazato, bifentrina, pimetrocina, piraclófós, pirafluprol, piridafentiación, piridabeno, piridalilo, pirifluquinazón, piriprol, piriproxifeno, pirimicarb, pirimidifeno, pirimifós-metilo, piretrinas, fipronil, fenazaquina, fenamifós, bromopropilato, fenitrotión (MEP), fenoxicarb, fenotiocarb, fenotrina, fenobucarb, fensulfotión, fentiación (MPP), fentoato (PAP), fenvalerato, fenpiroximato, fenpropatrina, fenbendazol, fostiazato, formetanato, butatíofós, buprofezina, furatiocarb, praletrina, fluacipirim, fluazinam, fluazurón, fluensulfona, flucicloxurón, flucitricinato, fluvalinato, flupirazofós, flufenerim, flufenoxurón, flufenzina, flufenprox, fluproxifeno, flubrocitrinato, flubendiamida, flumetrina, flurimfeno, protíofós, protrifenbuto, flonicamid, propafós, propargita (BPPS), profenofós, proflutrina, propoxur (PHC), bromopropilato, beta-ciflutrina, hexaflumurón, hexitiazox, heptenofós, perimetrina, benclotiaz, bendiocarb, bensultap, benzoximato, benfuracarb, foxim, fosalona, fostiazato, fostietano, fosfamidón, fosfocarb, fosmet (PMP), polinactinas, formetanato, formatión, forato, aceite para máquinas, malatiación, milbemicina, milbemicina-A, milbemectina, mecarbam, mesulfenfós, metomilo, metaldehído, metaflumizona, metamidofós, metam-amonio, metam-sodio, metiocarb, metidatiación (DMTP), metilisotiocianato, metilneodecanamida, metilparatiación, metoxadiazona, metoxicloro, metoxifenozida, metoflutrina, metopreno, metolcarb, meperflutrina, mevinfós, monocrotofós, monosultap, lambda-cihalotrina, rianodina, lufenurón, resmetrina, lepimectina, rotenona, clorhidrato de levamisol, óxido de fenbutatina, tartarato de morantel, bromuro de metilo, hidróxido de triciclohexilestaño (cihexatina), cianamida de calcio, polisulfuro de calcio, azufre y nicotina-sulfato.

Los ejemplos de los microbicidas agrícolas y hortícolas usados para los mismos fines que los anteriores incluyen aureofungina, azaconazol, azitiram, acipetacs, acibenzolar, acibenzolar-S-metilo, azoxistrobina, anilacina, amisulbrom, ampropilfós, ametoctradina, alcohol alílico, aldimorf, amobam, isotianilo, isovalediona, isopirazam, isoprotilano, ipconazol, iprodiona, iprovalicarb, iprobenfós, imazalilo, iminoctadina, albesilato de iminoctadina, triacetato de iminoctadina, imibenconazol, uniconazol, uniconazol-P, eclomezol, edifenfós, etaconazol, etaboxam, etirimol, etem, etoxiquina, etridiazol, enestroburina, epoxiconazol, oxadixilo, oxicarboxina, quinolinolato de cobre-8, oxitetraciclina, oxinato de cobre, oxpoconazol, fumarato de oxpoconazol, ácido oxolínico, octilnona, ofurace, orisastrobina, metam-sodio, kasugamicina, carbamorf, carpropamid, carbendazim, carboxina, carvona, quinazaxina, quinacetol, quinoxifeno, quinometionato, captafol, captán, kiralaxilo, quinconazol, quintoceno, guazatina, cufraneb, cuprobam, gliodina, griseofulvina, climbazol, cresol, kresoxim-metilo, clozolinato, clotrimazol, clobentiazona, cloraniformetano, cloranilo, clorquinox, cloropicrina, clorfenazol, clorodinitronaftaleno, clorotalonilo, cloroneb, zarilamida, salicilanilida, ciazofamid, pirocarbonato de dietilo, dietofencarb, ciclafuramida, diclocimet, diclozolina, diclobutrazol, diclofluanida, cicloheximida, diclomezina, diclorán, diclorofeno, diclona, disulfiram, ditalimfós, ditanona, diniconazol, diniconazol-M, zineb, dinocap, dinoción, dinosulfón, dinoterbón, dinobutón, dinopentón, dipiritiona, difenilamina, difenoconazol, ciflufenamid, diflufetorim, ciproconazol, ciprodinilo, ciprofuram, cipendazol, simeconazol, dimetirimol, dimetomorf, cimoxanilo, dimoxistrobina, bromuro de metilo, ziram, siltiofam, estreptomycina, espiroxamina, sultropeno, sedaxano, zoxamida, dazomet, tiadiazina, tiadinilo, tiadifluor, tiabendazol, tioximida, tioclorfenfím, tiofanato, tiofanatometilo, ticiofeno, tioquinox, cinometionat, tifluzamida, tiram, decafentina, tecnazeno, tecloftalam, tecoram, tetraconazol, debacarb, ácido deshidroacético, tebuconazol, tebufloquina, dodicina, dodina, dodecil bencensulfonato bis-etilendiamina de cobre (II) (DBEDC), dodemorf, drazoxolona, triadimenol, triadimefón, triazbutil, triazóxido, triamifós, triarimol, triclamida, triciclazol, triticonazol, tridemorf, óxido de tributilestaño, triflumizol, trifloxistrobina, triforina, tolilfluanida, tolclofós-metilo, natamicina, nabam, nitrotal-isopropilo, nitrostireno, nuarimol, nonilfenol sulfonato de cobre, halacrinato, validamicina, valifenalato, proteína harpina, bixafeno, picoxistrobina, picobenzamida, bitionol, bitertanol, hidroxiiisoxazol, hidroxiiisoxazol-potasio, binapacril, bifenilo, piperalina, himexazol, piraoxistrobina, piracarbolida, piraclostrobina, pirazofós, pirametostrobina, piriofenona, piridinitrilo, pirifenox, piribencarb, pirimetanilo, piroxicloro, piroxifur, piroquilón, vinclozolona, famoxadona, fenapanilo, fenamidona, fenaminosulf, fenarimol, fenitropán, fenoxanilo, ferimzona, ferbam, fentina, fempiclonilo, fempirazamina, fenbuconazol, fenfuram, fenpropidina, fenpropimorf, fenhexamida, ftalida, butiobato, butilamina, bupirimato, fuberidazol, blasticidina-S, furametpir, furalaxilo, fluacipirim, fluazinam, fluoxastrobina, fluotrimazol, fluopicolida, fluopiram, fluoroimida, furcarbanilo, fluxapiroxad, fluquinconazol, furconazol, furconazol-cis, fludioxonilo, flusilazol, flusulfamida, flutianilo, flutolanilo, flutiafol, furfural, furmeciclox, flumetover, flumorf, proquinazid, procloraz, procimidona, protiocarb, protioconazol, propamocarb,

propiconazol, propineb, furofanato, probenazol, bromuconazol, hexaclorobutadieno, hexaconazol, hexiltiofós, betoxazina, benalaxilo, benalaxilo-M, benodanilo, benomilo, pefurazoato, benquinox, penconazol, benzamorf, pencicurón, ácido benzohidroxámico, bentalurón, bentiazol, bentiavalicarb-isopropilo, pentiopirad, penflufeno, boscalid, fosdifeno, fosetilo, fosetilo-Al, polioxinas, polioxorim, policarbamatao, folpet, formaldehído, aceite para máquinas, maneb, mancozeb, mandipropamid, miclozolina, miclobutanilo, mildiomicina, milneb, mecarbinzida, metasulfocarb, metazoxolona, metam, metam-sodio, metalaxilo, metalaxilo-M, metiram, isotiocianato de metilo, meptildinocap, metconazol, metsulfovax, metfuroxam, metominostrobrina, metrafenona, mepanipirim, mefenoxam, meptildinocap, mepronilo, mebenilo, yodometano, rabenzazol, cloruro de benzalconio, cloruro de cobre básico, sulfato de cobre básico, microbicidas inorgánicos tales como plata, hipoclorito de sodio, hidróxido cúprico, azufre humectable, polisulfuro de calcio, hidrogenocarbonato de potasio, hidrogenocarbonato de sodio, azufre, anhídrido de sulfato de cobre, dimetilditiocarbamato de níquel, compuestos de cobre tales como quinolinolato de cobre-8 (oxina de cobre), sulfato de cinc y sulfato de cobre pentahidratado.

Además, los ejemplos de herbicidas incluyen 1-naftilacetamida, 2,4-PA, 2,3,6-TBA, 2,4,5-T, 2,4,5-TB, 2,4-D, 2,4-DB, 2,4-DEB, 2,4-DEP, 3,4-DA, 3,4-DB, 3,4-DP, 4-CPA, 4-CPB, 4-CPP, MCP, MCPA, MCPA-tioetilo, MCPB, ioxinilo, acionifeno, azafenidina, acifluorfenó, aziprotrina, azimsulfurón, asulam, acetoclor, atrazina, atratón, anisurón, anilofós, aviglicina, ácido abscísico, amicarbazona, amidosulfurón, amitrol, aminociclopiraclo, aminopiridina, amibuzina, amiprofós-metilo, ametriona, ametrina, alacloro, alidocloro, aloxidim, alorac, isourón, isocarbamida, isoxaclorol, isoxapirifop, isoxaflutol, isoxabeno, isocilo, isonorurón, isoproturón, isopropalina, isopolinato, isometiozina, inabenfida, ipacina, ipfencarbazona, iprimidam, imazaquín, imazapic, imazapir, imazametapir, imazametabenz, imazametabenz-metilo, imazamox, imazetapir, imazosulfurón, indaciflam, indanofán, ácido indolbutírico, uniconazol-P, eglinazina, esprocarb, etametsulfurón, etametsulfurón-metilo, etalfuralina, etiolato, eticlozato-etilo, etidimurón, etinofeno, etefón, etoxisulfurón, etoxifeno, etniproamida, etofumesato, etobenzanida, epronaz, erbón, endotal, oxadiazón, oxadiargilo, oxaziclomefona, oxasulfurón, oxapirazona, oxifluorfenó, orizalina, ortosulfamurón, orbencarb, cafenstrol, cambendiclor, carbasulam, carfentrazona, carfentrazona-etilo, carbutilato, carbetamida, carboxazol, quizalofop, quizalofop-P, quizalofop-etilo, xilaclor, quinoclamina, quinonamida, quinclorac, quinmerac, cumilurón, clodinato, glifosato, glufosinato, glufosinato-P, credazina, cletodim, cloxifonac, clodinafop, clodinafop-propargilo, clorotolurón, clopiralida, cloproxiidim, cloprop, clorbromurón, clofop, clomazona, clometoxinilo, clometoxifeno, clomeprop, clorazifop, clorazina, cloransulam, cloranocriol, clorambeno, cloransulam-metilo, cloridazón, clorimurón, clorimuronetilo, clorsulfurón, clortal, clortiamida, clortolurón, clornitrofenó, clorfenac, clorfenprop, clorbufam, clorflurazol, clorflurenol, clorprocarb, clorprofam, clormequat, cloreturón, cloroxinilo, cloroxurón, cloropón, saflufenacilo, cianazina, cianatrina, di-alato, diuron, dietamquat, dicamba, ciclurón, cicloato, cicloxiidim, diclosulam, ciclo sulfamurón, diclorprop, diclorprop-P, diclobenilo, diclofop, diclofop-metilo, diclormato, dicloralurea, diquat, cisanilida, disul, sidurón, ditiopir, dinitramina, cinidón-etilo, dinosam, cinosulfurón, dinoseb, dinoterb, dinofenato, dinoprop, cihalofop-butilo, difenamida, difenoxurón, difenopenteno, difenzoquat, cibusitrina, ciprazina, ciprazol, diflufenicán, diflufenzopir, dipropetrina, cipromid, ciperquat, giberelina, simazina, dimexano, dimetaclo, dimidazona, dimetametrina, dimetenamida, simetrina, simetol, dimetopirato, dimetopir, cinmetilina, swep, sulglificapina, sulcotriona, sulfalato, sulfentrazona, sulfosulfurón, sulfometurón, sulfometurón-metilo, sebumetón, setoxidim, sebutilazina, terbacilo, daimurón, dazomet, dalapón, tiazaflurón, tiazopir, tiencarbazona, tiencarbazona-metilo, tiocarbazilo, tioclorim, tiobencarb, tidiazimina, tidiazurón, tifensulfurón, tifensulfurón-metilo, desmedifam, desmetrina, tetraflurón, tenilcloro, tebutam, tebutiurón, terbutometón, tepraloxidim, tefuriltriona, tembotriona, delacloro, terbacilo, terbucarb, terbucloro, terbutilazina, terbutrina, topramezona, tralcoxiidim, triaziflam, triasulfurón, tri-alato, trietazina, tricamba, tricopir, tridifano, tritac, tritosulfurón, triflusalurón, triflusalurón-metilo, trifluralina, trifloxisulfurón, tripropindan, tribenurón-metilo, tribenurón, trifop, trifopsima, trimeturón, naptalam, naproanilida, napropamida, nicosulfurón, nitalina, nitrofenó, nitrofluorfenó, nipiraclofenó, neburón, norflurazón, norurón, barban, paclobutrazol, paraquat, paraflurón, haloxidina, haloxifop, haloxifop-P, haloxifop-metilo, halosafeno, halosulfurón, halosulfurón-metilo, picloram, picolinafeno, biciclopirona, bispiribac, bispiribac-sodio, pidanón, pinoxadén, bifenox, piperfos, himexazol, piraclonilo, piraclorol, pirazoxifeno, pirazosulfurón, pirazosulfurón-etilo, pirazolato, bilanafós, piraflufen-etilo, piriclor, piridafol, piritiobac, piritiobac-sodio, piridato, pirifalid, piributicarb, piribenzoxim, pirimisulfano, primisulfurón, piriminobac-metilo, piroxasulfona, piroxulam, fenasulam, fenisofam, fenurón, fenoxasulfona, fenoxaprop, fenoxaprop-P, fenoxapropetilo, fenotirol, fenoprop, fenobenzurón, fentiaprop, fenteracol, fentrazamida, fenmedifam, fenmedifametilo, butacloro, butafenacilo, butamifós, butiurón, butidazol, butilato, buturón, butenacloro, butroxidim, butralina, flazasulfurón, flamprop, furiloxifeno, prinaclor, primisulfurón-metilo, fluazifop, fluazifop-P, fluazifop-butilo, fluazolato, fluoxipir, fluotiurón, fluometurón, fluoroglicofeno, fluorocloridona, fluorodifeno, fluoronitrofenó, fluoromidina, flucarbazona, flucarbazona-sodio, flucloralina, flucetosulfurón, flutiacet, flutiacet-metilo, flupirsulfurón, flufenacet, flufenicán, flufenpir, flupropacilo, flupropanato, flupoxam, flumioxazina, flumiclorac, pentilflumiclorac, flumipropina, flumiazina, fluometurón, flumetsulam, fluridona, flurtamona, fluroxipir, pretilacloro, proxan, proglinazina, proclazina, proclazina, prodiamina, prosulfalina, prosulfocarb, propaquizafop, propacloro, propazina, propanilo, propizamida, propisocloro, prohidrojasmon, propirissulfurón, profam, profluzol, profluralina, prohexadiona-calcio, propoxicarbazona, propoxicarbazona-sodio, profoxidim, bromacilo, brompirazón, prometrina, prometón, bromoxinilo, bromofenoxim, bromobutida, bromobonilo, florasulam, hexacloroacetona, hexazinona, petoxamid, benazolina, penoxsulam, pebulato, beflubutamid, vernolato, perfluidona, bencarbazona, benzadox, benzipram, bencilaminopurina, bentiazurón, benzfenidazona, bensulida, bensulfurón-metilo, benzoilprop, benzobicalón, benzofenap, benzofluoro, bentazona, pentanocloro, bentiocarb, pendimetalina, pentoxazona, benfluralina, benfuresato, fosamina, fomesafeno, foramsulfurón, forclorfenurón, hidrazida maleica, mecoprop, mecoprop-P, medinoterb, mesosulfurón, mesosulfurón-metilo, mesotriona, mesoprazina, metoprotina, metazaclor, metazol, metazosulfurón, metabenziazurón, metamitrón, metamifop, metam, metalpropalina, metiurón,

metiozolina, metiobencarb, metildimrón, metoxurón, metosulam, metsulfurón, metsulfurón-metilo, metflurazón, metobromurón, metobenzurón, metometón, metolacloro, metribuzina, cloruro de mepiquat, mefenacet, mefluidida, monalida, monisourón, monurón, ácido monocloroacético, monolinurón, molinato, morfamcuat, yodosulfurón, yodosulfurón-metil-sodio, yodobonilo, yodometano, lactofeno, linurón, rimsulfurón, lenacilo, rodetanilo, peróxido de calcio y bromuro de metilo.

Los ejemplos de biopesticidas incluyen formulaciones víricas tales como virus de la polihedrosis nuclear (NPV), virus de la granulosis (GV), virus de la poliedrosis citoplasmática (CPV) y entomopoxvirus (EPV); plaguicidas microbianos usados como insecticida o nematocida, tales como *Monacrosporium phymatophagum*, *Steinernema carpocapsae*, *Steinernema kushidai* y *Pasteuria penetrans*; plaguicidas microbianos usados como microbicida, tales como *Trichoderma lignorum*, *Agrobacterium radiobactor*, *Erwinia carotovora* avirulento y *Bacillus subtilis*; y bioplaguicidas usados como herbicida, tales como *Xanthomonas campestris*. Se puede esperar que un uso combinado de insecticida agrícola y hortícola de la presente invención con los biopesticidas anteriores en forma de mezcla proporcione el mismo efecto que anteriormente.

Otros ejemplos de bioplaguicidas incluyen depredadores naturales tales como *Encarsia formosa*, *Aphidius colemani*, *Aphidoletes aphidimyza*, *Diglyphus isaea*, *Dacnusa sibirica*, *Phytoseiulus persimilis*, *Amblyseius cucumeris* y *Orius sauteri*; plaguicidas microbianos tales como *Beauveria brongniartii*; y feromonas tales como acetato de (Z)-10-tetradecenilo, acetato de (E,Z)-4,10-tetradecadienilo, acetato de (Z)-8-dodecenilo, acetato de (Z)-11-tetradecenilo, (Z)-13-icosen-10-ona y 14-metil-1-octadeceno.

En lo sucesivo en el presente documento, los ejemplos de producción de compuestos representativos de la presente invención y sus intermedios se describirán con más detalle, pero la presente invención no se limita solo a estos ejemplos.

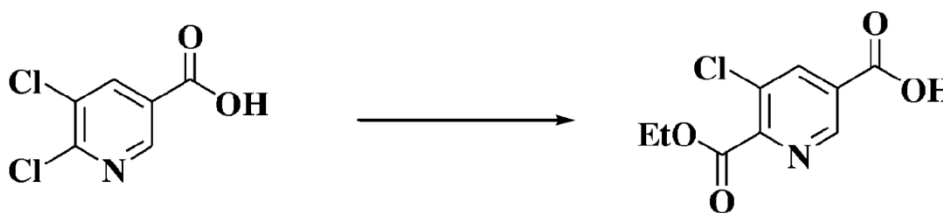
En lo sucesivo en el presente documento, los ejemplos de producción de compuestos representativos de la presente invención y sus intermedios se describirán con más detalle, pero la presente invención no se limita solo a estos ejemplos.

30 Ejemplos

Ejemplo de producción 1 del producto intermedio (2)

Método de producción de ácido 5-cloro-6-etoxicarbonilpiridin-3-carboxílico

35 [Quim. 20]



Se cargó un autoclave con una solución en etanol (60 ml) de ácido 5,6-dicloropiridin-3-carboxílico (10 g, 52 mmol). A esto se le añadió DPPB (1,4-bis(difenilfosfino)butano) (2,2 g, 10 % en mol), trietilamina (14 g, 2,5 eq) y PdCl₂(PPh₃)₂ (911 mg, 2,5 % en mol), la atmósfera en el sistema de reacción se reemplazó con monóxido de carbono (presión de CO, 4,0 MPa) y la mezcla se agitó a 135 °C durante 4 horas. Se añadieron agua y ácido clorhídrico 3 N a la mezcla de reacción para acidificar la capa acuosa y se extrajo con acetato de etilo varias veces. La capa orgánica se secó sobre sulfato sódico y después se concentró, y el sólido resultante se lavó con una mezcla de hexano-acetato de etilo (2:1 (v/v)) para dar el compuesto deseado, es decir, ácido 5-cloro-6-etoxicarbonilpiridin-3-carboxílico (10,9 g, 76 %).

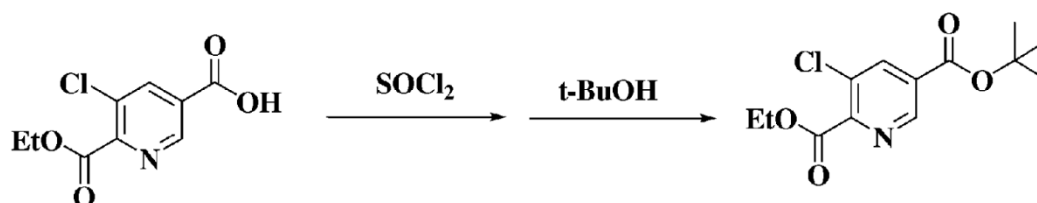
45 Propiedad física: RMN ¹H (CDCl₃): 9,02 (d, 1H), 8,44 (d, 1H), 4,42 (dd, 2H), 1,33 (t, 3H)

Ejemplo de producción 2 del producto intermedio (2)

Método de producción del t-butil éster del ácido 5-cloro-6-etoxicarbonilpiridin-3-carboxílico

50

[Quim. 21]



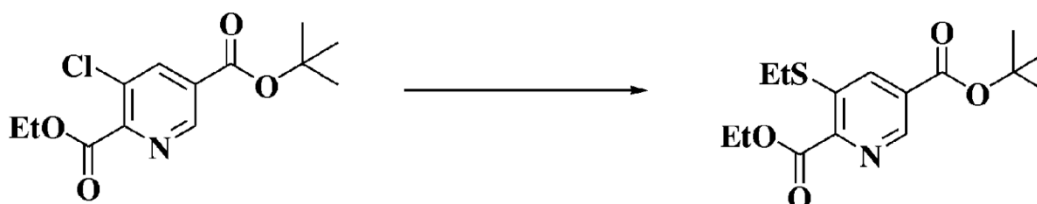
El ácido 5-cloro-6-etoxicarbonilpiridin-3-carboxílico (10,9 g, 47,6 mmol) obtenido en la etapa anterior se disolvió en tolueno (30 ml) y se añadió DMF (dimetilformamida) (4 ml). Posteriormente, se añadió cloruro de tionilo (11 g, 2 eq) y la mezcla se calentó con agitación a 90 °C durante 3 horas. Se dejó que la mezcla de reacción volviera a temperatura ambiente y después se concentró. El residuo concentrado se añadió lentamente a una mezcla de t-butanol (35 ml, 10 eq), THF (tetrahidrofurano) (100 ml), diisopropiletilamina (50 ml, 7 eq) y DMAP (N,N-dimetil-4-aminopiridina) (6 g, 1 eq) en otro recipiente enfriando con hielo. La mezcla de reacción se calentó a reflujo durante 3 horas y se dejó enfriar a temperatura ambiente. A esto, se le añadió agua y acetato de etilo y se llevó a cabo la extracción varias veces. La capa orgánica se secó sobre sulfato sódico y después se concentró. El residuo se sometió a cromatografía en columna (hexano-AcOEt (etil éster del ácido acético) = 5:1 (v/v)) para dar el compuesto deseado, es decir, éster t-bufílico del ácido 5-cloro-6-etoxicarbonilpiridin-3-carboxílico (8,43 g, 62 %).

Propiedad física: RMN ¹H (CDCl₃): 9,05 (d, 1H), 8,30 (d, 1H), 4,50 (dd, 2H), 1,61 (s, 9H), 1,44 (t, 3H)

15 Ejemplo de producción 3 del producto intermedio (2)

Método de producción de t-butil éster del ácido 5-etiltio-6-etoxicarbonilpiridin-3-carboxílico

[Quim. 22]



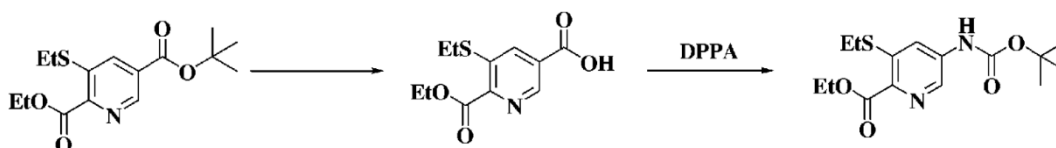
El t-butil éster del ácido 5-cloro-6-etoxicarbonilpiridin-3-carboxílico (8,43 g, 21,65 mmol) se disolvió en DMF (100 ml). Se añadió etanotiolato de sodio (2,27 g, 1 eq) lentamente a la solución enfriando con hielo y la mezcla se agitó durante 5 minutos. A esto, se le añadió agua y ácido clorhídrico 0,5 N sucesivamente. Después de extraer con acetato de etilo varias veces, la capa orgánica se secó sobre sulfato sódico y después se concentró. El residuo se sometió a cromatografía en columna (hexano-AcOEt = 5:1 (v/v)) para dar el compuesto deseado, es decir, t-butil éster del ácido 5-etiltio-6-etoxicarbonilpiridin-3-carboxílico (6,17 g, 92 %).

Propiedad física: RMN ¹H (CDCl₃): 8,91 (d, 1H), 8,22 (d, 1H), 4,49 (dd, 2H), 2,99 (dd, 2H), 1,61 (s, 9H), 1,45 (t, 3H), 1,40 (t, 3H)

30 Ejemplo de producción 4 del producto intermedio (2)

Método de producción de etil éster del ácido 3-etiltio-5-t-butoxicarbonilaminopiridin-2-carboxílico

[Quim. 23]



El t-butil éster del ácido 5-etiltio-6-etoxicarbonilpiridin-3-carboxílico (6,17 g, 19,9 mmol) se disolvió en ácido trifluoroacético (30 ml), y la solución se calentó a reflujo durante 30 minutos. La mezcla de reacción se concentró, se añadieron tolueno y acetato de etilo al residuo y la mezcla se concentró otra vez. Al residuo, se le añadió t-butanol (100 ml), trietilamina (6,5 g, 3 eq) y DPPA (difenilfosforil azida) (11,74 g, 2 eq) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora y después se sometió a reflujo durante 4 horas. La mezcla de reacción se concentró y el

residuo se sometió a cromatografía en columna (hexano-acetato de etilo = 2:1 (v/v)) para dar el compuesto deseado, es decir, etil éster del ácido 3-etiltio-5-t-butoxicarbonilaminopiridin-2-carboxílico (3,63 g, 56 %).

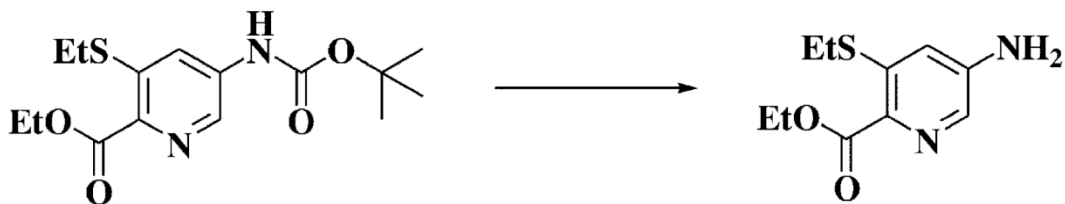
Propiedad física: RMN ¹H (CDCl₃): 8,25 (d, 1H), 8,09 (d, 1H), 6,74 (s, 1H), 4,46 (dd, 2H), 2,97 (dd, 2H), 1,53 (s, 9H), 1,44 (t, 3H), 1,41 (t, 3H)

5

Ejemplo de producción 5 del producto intermedio (2)

Método de producción de etil éster del ácido 5-amino-3-etiltiopiridin-2-carboxílico

[Quim. 24]



10

Se disolvió etil éster del ácido 3-etiltio-5-t-butoxicarbonilaminopiridin-2-carboxílico (670 mg, 2,06 mmol) en ácido trifluoroacético (30 ml) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 30 minutos. La mezcla de reacción se concentró y se añadieron agua, acetato de etilo y carbonato potásico al residuo. Después de extraer con acetato de etilo varias veces, la capa orgánica se secó sobre sulfato sódico y después se concentró. El residuo se sometió a cromatografía en columna (hexano-AcOEt = 1:3 (v/v)) para dar el compuesto deseado, es decir, etil éster del ácido 5-amino-3-etiltiopiridin-2-carboxílico (358 mg, 77 %).

15

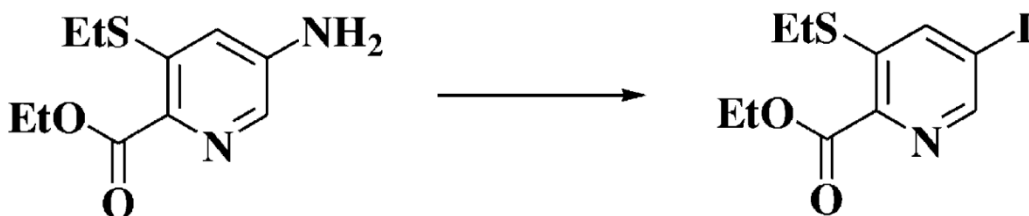
Propiedad física: RMN ¹H (CDCl₃): 7,89 (d, 1H), 6,80 (s, 1H), 4,43 (dd, 2H), 4,08 (s, 2H), 2,88 (dd, 2H), 1,56 (s, 9H), 1,42 (t, 3H), 1,40 (t, 3H)

20

Ejemplo de producción 6 del producto intermedio (2)

Método de producción de etil éster del ácido 3-etiltio-5-yodopiridin-2-carboxílico

[Quim. 25]



25

Se disolvió etil éster del ácido 5-amino-3-etiltiopiridin-2-carboxílico (1 g, 4,44 mmol) en acetonitrilo (10 ml). A esto, se le añadió ácido trifluoroacético (500 mg, 1 eq) y ácido p-toluenosulfónico (2,6 g, 3 eq) y la mezcla se enfrió en un baño con agua de aproximadamente 5 °C. A la mezcla de reacción, se le añadió lentamente una solución acuosa (10 ml) de yoduro potásico (2,25 g, 3 eq) y nitrito sódico (612 mg, 2 eq) preparada en otro recipiente. La mezcla se agitó durante 30 minutos y después se agitó a temperatura ambiente durante 30 minutos. Se añadió una solución "hipo" (hiposulfito de sodio) a la mezcla de reacción y se extrajo con acetato de etilo varias veces. La capa orgánica se secó y se concentró. El residuo se sometió a cromatografía en columna para dar el compuesto deseado, es decir, etil éster del ácido 3-etiltio-5-yodopiridin-2-carboxílico (761 mg, 51 %).

30

35

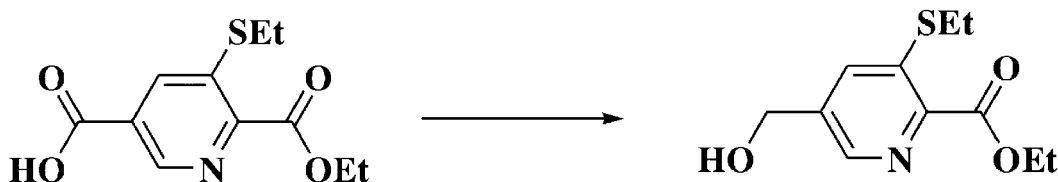
Propiedad física: RMN ¹H (CDCl₃): 8,61 (s, 1H), 7,95 (s, 1H), 4,45 (dd, 2H), 2,91 (dd, 2H), 1,43 (t, 3H), 1,39 (t, 3H)

Ejemplo de producción 1 del producto intermedio (2-b2)

Método de producción de etil éster del ácido 3-etiltio-5-hidroximetilpiridin-2-carboxílico

40

[Quim. 26]



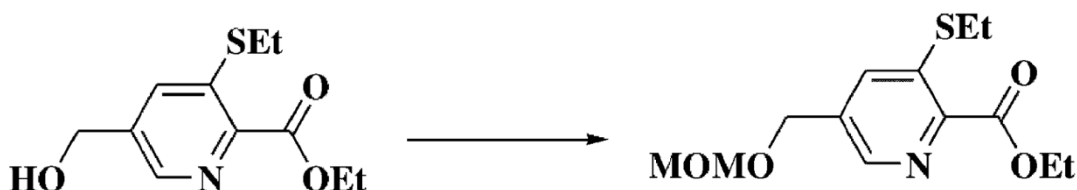
A una solución en THF (100 ml) de ácido 5-etiltio-6-etoxicarbonilpiridin-3-carboxílico (10 g), cuyo compuesto se produjo según el método de producción descrito en el ejemplo de producción 4 del producto intermedio (2) anterior, se le añadió CDI (carbonildiimidazol) (10 g) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas. Esta solución en THF se añadió lentamente a una solución acuosa de 100 ml de NaBH₄ (5,5 g) a 0 °C y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora. Después de que se completara la reacción, se añadió una solución 4 M de ácido clorhídrico para ajustar el pH a 2 y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de cloruro sódico, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice para dar etil éster del ácido 3-etiltio-5-hidroximetilpiridin-2-carboxílico (6,4 g, 62 %).

Ejemplo de producción 2 del producto intermedio (2-b2)

Método de producción de etil éster del ácido 3-etiltio-5-metoximetoxipiridin-2-carboxílico

15

[Quim. 27]

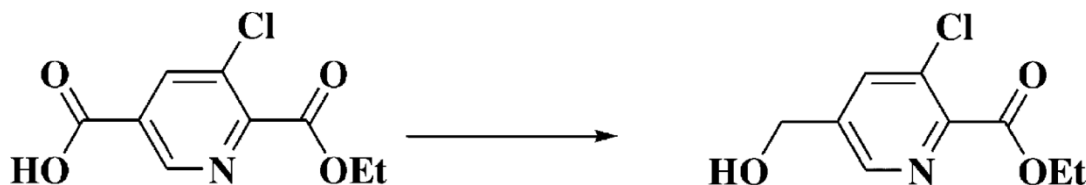


A una solución en CHCl₃ (50 ml) de etil éster del ácido 3-etiltio-5-hidroximetilpiridin-2-carboxílico (6,4 g), se le añadió DIPEA (N,N-diisopropiletilamina) (13,6 ml) y cloruro de metoximetilo (MOMCl) (6,0 ml) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora. Después de que se completara la reacción, se añadió una solución acuosa de cloruro de amonio y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de cloruro sódico, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró al vacío para dar etil éster del ácido 3-etiltio-5-metoximetoxipiridin-2-carboxílico (7,1 g, 94 %).

25 Ejemplo de producción 1 del producto intermedio (2-e4)

Método de producción de etil éster del ácido 3-cloro-5-hidroximetilpiridin-2-carboxílico

[Quim. 28]



30

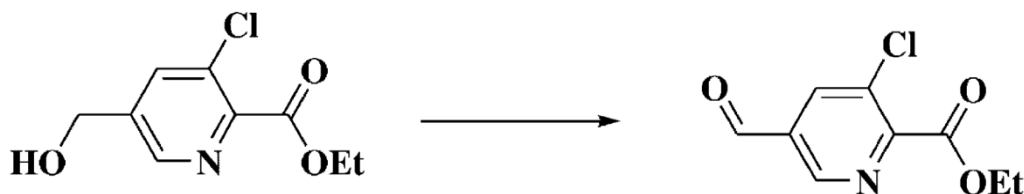
A una solución en CHCl₃ (150 ml) de ácido 5-cloro-6-etoxicarbonilpiridin-3-carboxílico (8,3 g), cuyo compuesto se produjo según el método del ejemplo de producción 1 del producto intermedio (2), se le añadió DMF (0,3 ml) y cloruro de oxalilo (4,7 ml) sucesivamente y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora. La mezcla de reacción se concentró al vacío. Se añadió lentamente una solución en CHCl₃ (50 ml) del residuo concentrado a una solución en agua/CHCl₃ (1:3 (v/v)) (150 ml) de NaBH₄ (5,5 g) a 0 °C y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora. Después de que se completara la reacción, se añadió una solución 4 M de ácido clorhídrico para ajustar el pH a 2 y se extrajo con CHCl₃. La capa orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de cloruro sódico, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice para dar etil éster del ácido 3-cloro-5-hidroximetilpiridin-2-carboxílico (4,9 g, 62 %).

35

40 Ejemplo de producción 2 del producto intermedio (2-e4)

Método de producción de etil éster del ácido 3-cloro-5-formilpiridin-2-carboxílico

[Quim. 29]



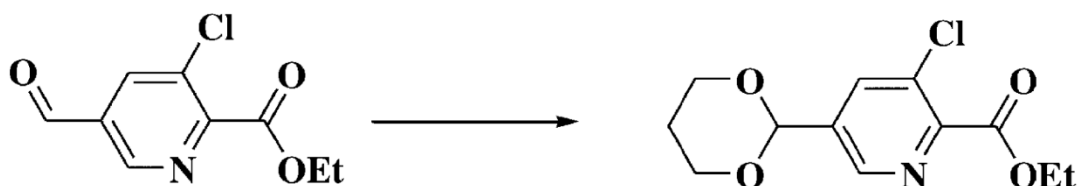
- 5 A una solución en CHCl_3 (50 ml) de cloruro de oxalilo, se le añadió dimetilsulfóxido (8,0 ml) lentamente gota a gota a -78°C y la mezcla de reacción se agitó durante 10 minutos. A esto, se le añadió una solución en CHCl_3 (15 ml x 2) de etil éster del ácido 3-cloro-5-hidroximetilpiridin-2-carboxílico (4,9 g) a -78°C y la mezcla se agitó durante 15 minutos. A esto, se le añadió Et_3N (22 ml) a -78°C y la mezcla se agitó a 0°C durante 20 minutos. Después de que se completara la reacción, se añadió una solución acuosa saturada de NH_4Cl y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de cloruro sódico, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se secó al vacío. El residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice para dar etil éster del ácido 3-cloro-5-formilpiridin-2-carboxílico (4,8 g, 99 %).

Ejemplo de producción 3 del producto intermedio (2-e4)

15

Método de producción de etil éster del ácido 3-cloro-5-(1,3-dioxan-2-il)-2-piridin-carboxílico

[Quim. 30]

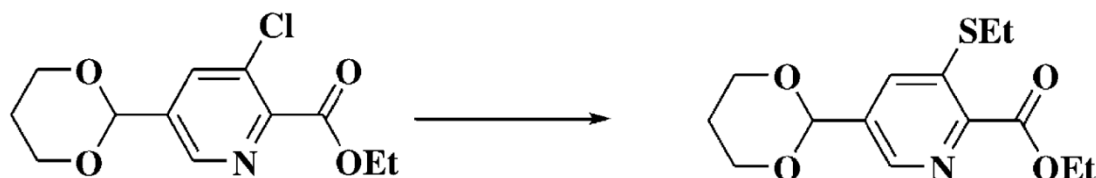


- 20 A una solución en tolueno (50 ml) de etil éster del ácido 3-cloro-5-formilpiridin-2-carboxílico (4,8 g), se le añadió 1,3-propanodiol (3,4 g) y CSA (ácido 10-canforsulfónico) (0,5 g) y la mezcla se calentó a reflujo durante 2 horas. Después de que se completara la reacción, la mezcla de reacción se concentró al vacío, y el residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice para dar etil éster del ácido 3-cloro-5-(1,3-dioxan-2-il)-2-piridin-carboxílico (4,9 g, 81 %).

25 Ejemplo de producción 4 del producto intermedio (2-e4)

Método de producción de etil éster del ácido 3-etiltio-5-(1,3-dioxan-2-il)-2-piridin-carboxílico

[Quim. 31]

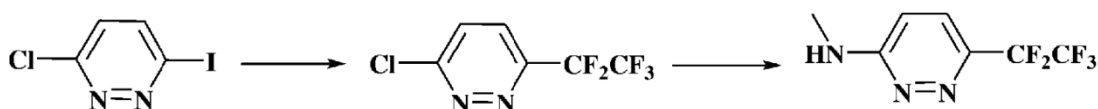


- 30 A una solución en THF (40 ml) de etil éster del ácido 3-cloro-5-(1,3-dioxan-2-il)-2-piridin-carboxílico (4,9 g), se le añadió NaH (1,5 g) y EtSH (1,7 ml) a 0°C y la mezcla se agitó a 50°C durante 2 horas. Después de que se completara la reacción, se añadió una solución acuosa saturada de NH_4Cl y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de cloruro sódico, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se secó al vacío. El residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice para dar etil éster del ácido 3-etiltio-5-(1,3-dioxan-2-il)-2-piridin-carboxílico (2,6 g, 49 %).

Ejemplo de producción 1 del producto intermedio (3)

40 Método de producción de 3-metilamino-6-pentafluoroetil piridazina

[Quim. 32]



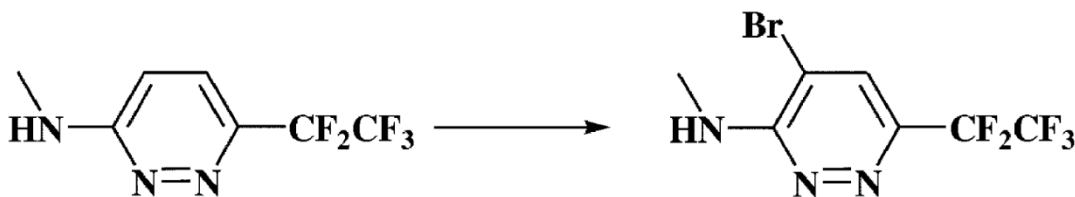
En atmósfera de argón, 3-cloro-6-yodopiridazina (7,2 g) sintetizada según el método descrito en la referencia mencionada anteriormente, yoduro de cobre (2,86 g), 1,10-fenantrolina (2,7 g) y una solución (aprox. 0,33 M, 80 ml) de un reactivo de bisfluoro alquil cinc en NMP (N-metil-2-pirrolidona) preparado según el método descrito en el Program and Abstracts of the 94th Spring Annual Meeting of the Chemical Society de Japón (presentación n.º 2B1-17, pág. 1229) se mezclaron en un recipiente con agitación a 90 °C durante 40 minutos, y después se dejó enfriar a temperatura ambiente. La mezcla de reacción resultante se añadió lentamente gota a gota a una mezcla de THF (30 ml) y metilamina (30 ml de una solución 10 M de metilamina en metanol) en otro recipiente enfriando con hielo. La mezcla se calentó a temperatura ambiente y se agitó durante 1 hora. Después de añadir agua y acetato de etilo, la mezcla se agitó durante 5 minutos y después se filtró a través de Celite. El filtrado se extrajo con acetato de etilo 3 veces. La capa orgánica se secó sobre sulfato sódico y después se concentró. El residuo se sometió a cromatografía en columna para dar el compuesto deseado, es decir, 3-metilamino-6-pentafluoroetil piridazina (6,36 g).

Propiedad física: Punto de fusión: de 141 a 143 °C

Ejemplo de producción 2 del producto intermedio (3)

Método de producción de 4-bromo-3-metilamino-6-pentafluoroetil piridazina

[Quim. 33]



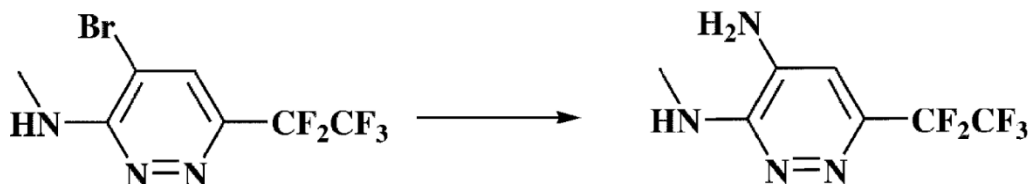
A una solución de 3-metilamino-6-pentafluoroetil piridazina (6,05 g) en ácido acético (50 ml), se le añadió 1,3-dibromo-5,5-dimetilhidantoína (8,4 g) y la mezcla se calentó a 95 °C con agitación durante 3 horas. La mezcla de reacción se concentró y se añadió agua al residuo. Esto se neutralizó con carbonato potásico y se extrajo con acetato de etilo 3 veces. La capa orgánica se secó sobre sulfato sódico y después se concentró. El residuo se sometió a cromatografía en columna para dar el compuesto deseado, es decir, 4-bromo-3-metilamino-6-pentafluoroetil piridazina (6,16 g, 76 %).

Propiedad física: Punto de fusión: de 41 a 43 °C

Ejemplo de producción 3 del producto intermedio (3)

Método de producción de 4-amino-3-metilamino-6-pentafluoroetil piridazina

[Quim. 34]



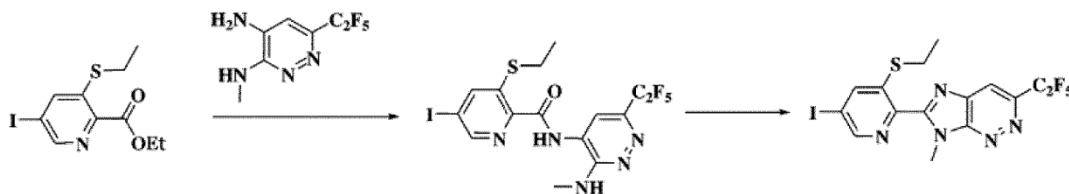
Un autoclave se cargó sucesivamente con 4-bromo-3-metilamino-6-pentafluoroetil piridazina (6,16 g), óxido de cobre (I) (1,44 g), NMP (30 ml) y una solución acuosa al 28 % de amoníaco (30 ml), se purgó con argón y después se selló. La mezcla en el autoclave se calentó a 80 °C con agitación durante 3 horas y después se dejó enfriar a temperatura ambiente. Después de añadir agua y acetato de etilo, la mezcla se agitó durante 5 minutos y después se filtró a través de Celite. El filtrado se extrajo con acetato de etilo 3 veces. La capa orgánica se secó sobre sulfato sódico y después se concentró. El residuo se sometió a cromatografía en columna para dar el compuesto deseado, es decir, 4-amino-3-metilamino-6-pentafluoroetil piridazina (3,39 g, 69 %).

Propiedad física: RMN ¹H (CDCl₃): 6,75 (s, 1H), 5,18 (s, 1H), 4,59 (s, 2H), 2,85 (s, 3H)

Ejemplo de referencia 1

5 Método de producción de 2-(3-etiltio-5-yodopiridin-2-il)-3-metil-6-pentafluoroetil-3H-imidazo[4,5-c]piridazina

[Quim. 35]



10 A una solución en tetrahidrofurano (240 ml) de 4-amino-3-metilamino-6-pentafluoroetil piridazina (17,9 g), se le añadió hidruro sódico (3,1 g) enfriando con hielo y la mezcla se agitó hasta que dejaron de formarse burbujas. A continuación, se añadió una solución en tetrahidrofurano (120 ml) de 3-etiltio-5-yodo-2-piridincarboxilato de etilo (25 g) enfriando con hielo y se dejó que la mezcla alcanzara la temperatura ambiente y después se agitó durante 2 horas. Se añadió una solución acuosa 0,5 M de ácido clorhídrico para ajustar el pH a 3 y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró al vacío para dar la amida del ácido 3-etiltio-5-yodo-N-(3-metilamino-6-pentafluoroetilpiridazin-4-il)-2-piridin-carboxílico. Este compuesto se usó directamente para la reacción siguiente sin purificación.

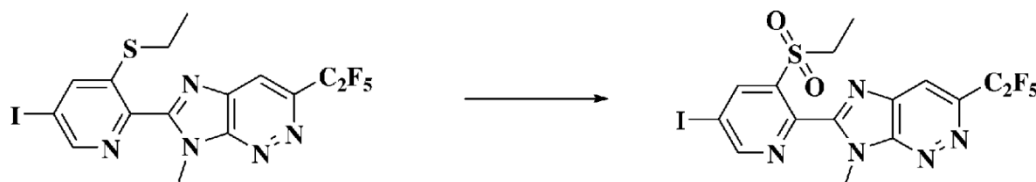
15 A una solución en tolueno (300 ml) de la amida de ácido 3-etiltio-5-yodo-N-(3-metilamino-6-pentafluoroetilpiridazin-4-il)-2-piridin-carboxílico, se le añadió ácido acético (40 ml) y la mezcla se calentó a reflujo durante 6 horas. Se dejó que la mezcla de reacción alcanzara la temperatura ambiente y después se concentró al vacío. Se añadió una solución acuosa saturada de bicarbonato sódico al residuo y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró al vacío. Se añadió una pequeña cantidad de metil t-butil éter y hexano al residuo y el sólido resultante se recogió por filtración.

20 Como resultado, se obtuvieron 27 g de 2-(3-etiltio-5-yodopiridin-2-il)-3-metil-6-pentafluoroetil-3H-imidazo[4,5-c]piridazina.
Rendimiento: 71 % Punto de fusión: de 127 a 128 °C

Ejemplo de referencia 2

30 Método de producción de 2-(3-etilsulfonil-5-yodopiridin-2-il)-3-metil-6-pentafluoroetil-3H-imidazo[4,5-c]piridazina

[Quim. 36]



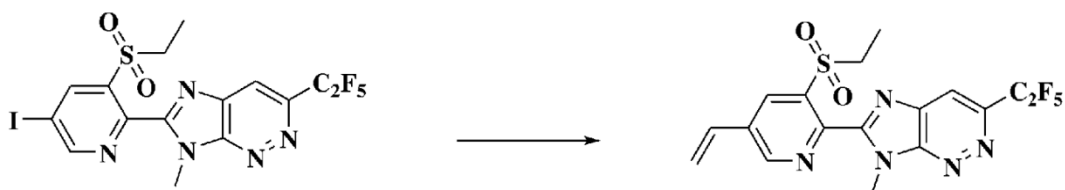
35 El compuesto de imidazopyridazina (395 mg, 0,766 mmol) obtenido en la etapa anterior se disolvió en acetato de etilo (10 ml), se añadió ácido m-cloroperoxibenzoico (450 mg, 2,2 eq) a la solución y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas. A la mezcla de reacción se le añadieron varias gotas de FAMSO (metil(metilsulfinil)metilsulfuro) y trietilamina (1 ml) y la mezcla se concentró. El residuo se sometió a cromatografía en columna para dar el compuesto de sulfona deseado (406 mg, 97 %).

40 Propiedad física: Punto de fusión: de 188 a 189 °C

Ejemplo de referencia 3

45 Método de producción de 2-(3-etilsulfonil-5-vinilpiridin-2-il)-3-metil-6-pentafluoroetil-3H-imidazo[4,5-c]piridazina

[Quim. 37]



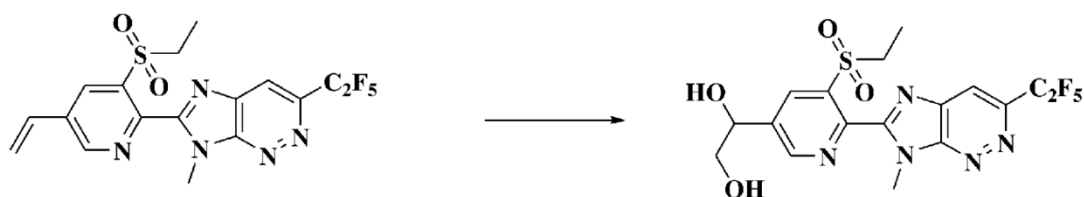
A una solución en DME/H₂O (4:1 (v/v)) (4 ml) de 2-(3-etilsulfonyl-5-yodopiridin-2-il)-3-metil-6-pentafluoroetil-3H-imidazo[4,5-c]piridazina (0,40 g, 0,73 mmol), viniltrifluoroborato de potasio (0,15 g, 1,1 mmol), se le añadió un complejo de [(difenilfosfino)ferroceno]dicloropaldio-diclorometano (0,060 g, 0,073 mmol) y carbonato de cesio (0,71 g, 2,2 eq) y la mezcla se agitó a 80 °C durante 1 hora. Después de que se completara la reacción, se añadió gel de sílice y la mezcla se concentró al vacío. El residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 2-(3-etilsulfonyl-5-vinilpiridin-2-il)-3-metil-6-pentafluoroetil-3H-imidazo[4,5-c]piridazina.

Propiedad física: Punto de fusión de 188 a 190 °C

Ejemplo de referencia 4

Método de producción de 2-[3-etilsulfonyl-5-(1,2-dihidroxietyl)piridin-2-il]-3-metil-6-pentafluoroetil-3H-imidazo[4,5-c]piridazina

[Quim. 38]



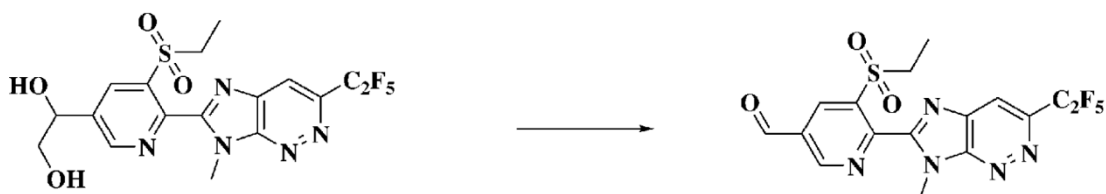
A una solución en THF/agua (2:1 (v/v)) (4 ml) de 2-(3-etilsulfonyl-5-vinilpiridin-2-il)-3-metil-6-pentafluoroetil-3H-imidazo[4,5-c]piridazina, se le añadió óxido de N-metilmorfolina (0,51 g, 2,20 mmol, solución acuosa al 50 %) y tetraóxido de osmio (1,8 ml, 0,22 mmol, solución en t-butanol 0,039 M) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente hasta el día siguiente. A esto, se le añadió una solución acuosa saturada de carbonato sódico y se extrajo con AcOEt 3 veces. La capa orgánica se lavó con a una solución acuosa saturada de cloruro sódico, se secó sobre MgSO₄ y se filtró, y el filtrado se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 2-[3-etilsulfonyl-5-(1,2-dihidroxietyl)piridin-2-il]-3-metil-6-pentafluoroetil-3H-imidazo[4,5-c]piridazina (0,31 g, 0,64 mmol, 88 %).

Propiedad física: RMN ¹H (CDCl₃): 9,04 (d, 1H), 8,58 (d, 1H), 8,22 (s, 1H), 5,12 (t a, 1H), 4,06 (s, 3H), 4,00 (m, 1H), 3,75 (c, 2H), 3,82 (m, 1H), 1,36 (t, 3H)

Ejemplo de referencia 5

Método de producción de 2-(3-etilsulfonyl-5-formilpiridin-2-il)-3-metil-6-pentafluoroetil-3H-imidazo[4,5-c]piridazina

[Quim. 39]



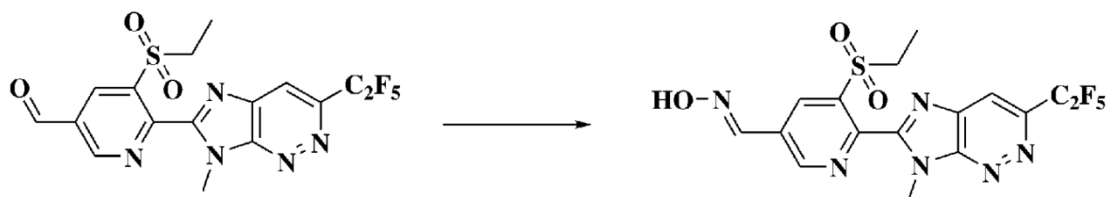
A una solución en THF/agua (2:1 (v/v)) (6 ml) de 2-[3-etilsulfonyl-5-(1,2-dihidroxietyl)piridin-2-il]-3-metil-6-pentafluoroetil-3H-imidazo[4,5-c]piridazina (0,29 g, 0,60 mmol), se le añadió peryodato sódico (0,26 g, 1,2 mmol) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas. Después de que se completara la reacción, se extrajo con AcOEt 3 veces. La capa orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de cloruro sódico, se secó sobre sulfato de magnesio y se filtró, y el filtrado se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía en columna sobre gel de sílice para

dar 2-(3-etilsulfonil-5-formilpiridin-2-il)-3-metil-6-pentafluoroetil-3H-imidazo[4,5-c]piridazina (0,25 g, 0,56 mmol, 92 %).
Propiedad física: punto de fusión de 238 a 239 °C

Ejemplo de producción 1

- 5 Método de producción de 2-(3-etilsulfonil-5-hidroxiiminopiridin-2-il)-3-metil-6-pentafluoroetil-3H-imidazo[4,5-c]piridazina (número de compuesto: 1-189)

[Quim. 40]

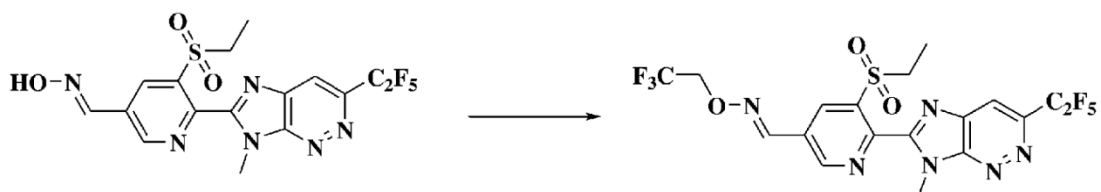


- 10 A una solución en etanol (1 ml) de 2-(3-etilsulfonil-5-formilpiridin-2-il)-3-metil-6-pentafluoroetil-3H-imidazo[4,5-c]piridazina (0,030 g, 0,067 mmol), se le añadió clorhidrato de hidroxilamina (0,0070 g, 0,10 mmol) y acetato sódico (0,0080 g, 0,10 mmol), y la mezcla se calentó a reflujo durante 2 horas. La mezcla de reacción se concentró al vacío, y el residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 2-(3-etilsulfonil-5-hidroxiiminopiridin-2-il)-3-metil-6-pentafluoroetil-3H-imidazo[4,5-c]piridazina (0,028 g, 0,061 mmol, 92 %). Propiedad física: punto de fusión de 240 a 242 °C

Ejemplo de producción 2

- 20 Método de producción de 2-(3-etilsulfonil-5-(2,2,2-trifluoroetoxiimino)piridin-2-il)-3-metil-6-pentafluoroetil-3H-imidazo[4,5-c]piridazina (número de compuesto: 1-246)

[Quim. 41]

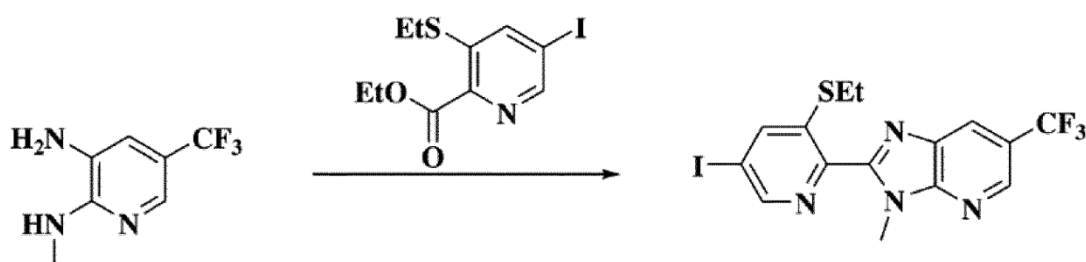


- 25 A una solución en N,N-dimetilformamida (1 ml) de 2-(3-etilsulfonil-5-hidroxiiminopiridin-2-il)-3-metil-6-pentafluoroetil-3H-imidazo[4,5-c]piridazina (0,075 g), se le añadió carbonato de cesio (0,11 g) y 2,2,2-trifluoroetil éster del ácido trifluorometanosulfónico (75 mg) a 0 °C y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas. Después de que se completara la reacción, se añadió una solución acuosa de cloruro de amonio y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró al vacío, y el residuo se purificó por cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 2-(3-etilsulfonil-5-(2,2,2-trifluoroetoxiimino)piridin-2-il)-3-metil-6-pentafluoroetil-3H-imidazo[4,5-c]piridazina (0,055 g, 63 %).
Propiedad física: Punto de fusión: de 207 a 208 °C

Ejemplo de referencia 6

- 35 Método de producción de 2-(3-etiltio-5-yodopiridin-2-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina

[Quim. 42]



A una solución en tetrahidrofurano (15 ml) de 3-amino-2-metilamino-5-trifluorometilpiridina (0,71 g), se le añadió hidruro sódico (0,18 g) y una solución en THF (5 ml) de 3-etiltio-5-yodo-2-piridincarboxilato de etilo (1,25 g) sucesivamente enfriando con hielo. Se dejó que la mezcla regresara a la temperatura ambiente y después se agitó durante 2 horas. Después de que se completara la reacción, se añadió una solución 1 M de ácido clorhídrico y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de cloruro sódico y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se eliminó el disolvente por evaporación. Se añadieron NMP (20 ml) y TsOH·H₂O (1,9 g) al residuo y la mezcla se agitó a 150 °C durante 3 horas. Después de que se completara la reacción, se añadió una solución acuosa saturada de NaHCO₃ y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de cloruro sódico y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se eliminó el disolvente por evaporación. El residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice para dar 2-(3-etiltio-5-yodopiridin-2-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina (1,52 g, 89 %).

15 Ejemplo de referencia 7

Método de producción de 2-(3-etiltio-5-vinilpiridin-2-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina

[Quim. 43]

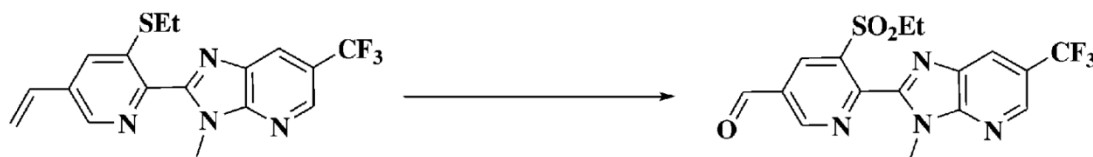


A una solución en DME/H₂O (4:1 (v/v)) (20 ml) de 2-(3-etiltio-5-yodopiridin-2-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina (1,52 g), cuyo compuesto se produjo mediante el método de producción del ejemplo de referencia anterior, se le añadió viniltrifluoroborato de potasio (0,44 g), PdCl₂ (dppf)-acetona (0,13 g) y Cs₂CO₃ (2,1 g) y la mezcla se calentó a reflujo durante 2 horas. Después de que se completara la reacción, la mezcla de reacción se secó al vacío y el residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice para dar 2-(3-etiltio-5-vinilpiridin-2-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina (0,85 g, 71 %). dppf representa 1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno.

Ejemplo de referencia 8

30 Método de producción de 2-(3-etilsulfonil-5-formilpiridin-2-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina

[Quim. 44]



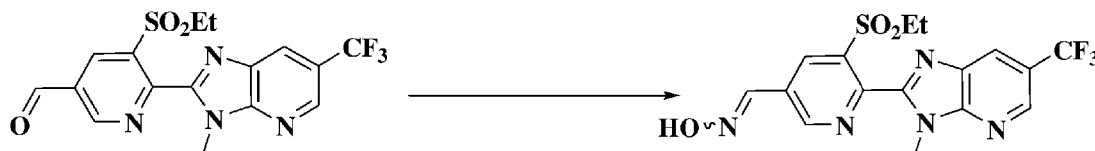
A una solución en THF/tampón acuoso a pH 7 (2:1 (v/v)) (20 ml) de 2-(3-etiltio-5-vinilpiridin-2-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina (0,85 g), cuyo compuesto se produjo mediante el método de producción del ejemplo de referencia anterior, se le añadió NMO (N-óxido de N-metilmorfolina) (1,64 g, 50 % en H₂O) y OsO₄ (6,0 ml, 0,039 M en t-BuOH) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente hasta el día siguiente. A esto, se le añadió NaIO₄ (1,5 g) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas. Después de que se completara la reacción, se añadió una solución saturada de Na₂S₂O₃ y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución acuosa

saturada de cloruro sódico, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se secó al vacío. El residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice para dar 2-(3-etilsulfonil-5-formilpiridin-2-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina (0,54 g, 86 %).

5 Ejemplo de producción 3

Método de producción de 2-(3-etilsulfonil-5-(hidroxilimino)piridin-2-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina (número de compuesto: 2-3)

10 [Quim. 45]

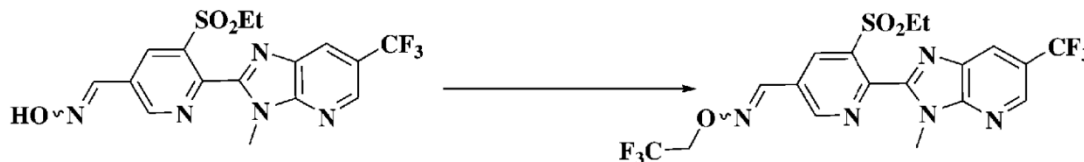


15 A una solución en etanol (10 ml) de 2-(3-etilsulfonil-5-formilpiridin-2-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina (0,54 g), se le añadió clorhidrato de hidroxilamina (0,14 g) y acetato sódico (0,17 g), y la mezcla se calentó a reflujo durante 4 horas. Después de que se completara la reacción, la mezcla de reacción se concentró al vacío y el residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice para dar 2-(3-etilsulfonil-5-(hidroxilimino)piridin-2-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina (0,50 g, 89 %).

20 Ejemplo de producción 4

Método de producción de 2-(3-etilsulfonil-5-(2,2,2-trifluoroetoxilimino)piridin-2-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina (número de compuesto: 2-33)

[Quim. 46]

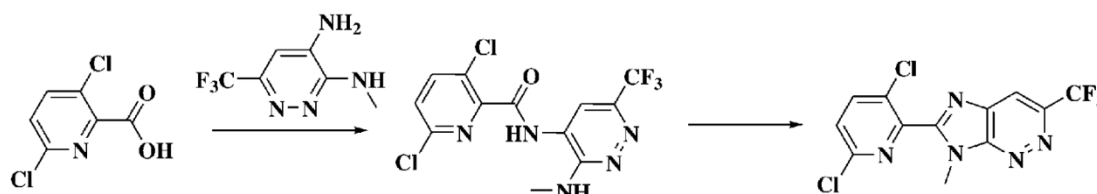


25 A una solución en DMF (1 ml) de 2-(3-etilsulfonil-5-(hidroxilimino)piridin-2-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina (0,05 g), se le añadió Cs_2CO_3 (0,06 g) y trifluorometanosulfonato de 2,2,2-trifluoroetilo (0,06 mg) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora. Después de que se completara la reacción, se añadió una solución acuosa de cloruro de amonio y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró al vacío, y el residuo se purificó por cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 2-(3-etilsulfonil-5-(2,2,2-trifluoroetoxilimino)piridin-2-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-b]piridina (0,042 g, 71 %).

35 Ejemplo de referencia 9

Método de producción de 2-(3,6-dicloropiridin-2-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-c]piridazina

[Quim. 47]



40 A una solución en tolueno (5 ml) de ácido 3,6-dicloro-2-piridincarboxílico (1 g), se le añadió DMF (0,02 ml) y SOCl_2 (1,0 ml) a 0 °C y la mezcla se calentó a reflujo durante 2 horas. Después de que se completara la reacción, la mezcla de reacción se concentró al vacío. Se añadió una solución en THF (5 ml) del residuo a una solución en THF (5 ml) de 4-amino-3-metilamino-6-trifluorometilpiridina (1,0 g) a 0 °C y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 2

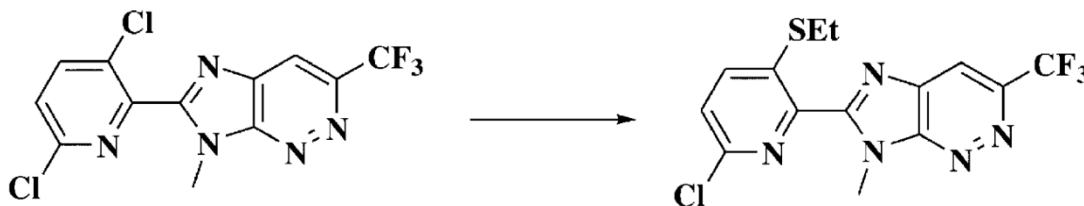
horas y después se concentró al vacío. Se añadió ácido acético (10 ml) al residuo y la mezcla se calentó con agitación durante 2 horas. Después de que se completara la reacción, la mezcla de reacción se concentró al vacío y el residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice para dar 2-(3,6-dicloropiridin-2-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-c]piridazina (3,2 g, 62 %, dos etapas).

5

Ejemplo de referencia 10

Método de producción de 2-(3-etiltio-6-cloropiridin-2-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-c]piridazina

[Quim. 48]



10

A una solución en THF (20 ml) de 2-(3,6-dicloropiridin-2-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-c]piridazina (1,1 g), se le añadió NaH (0,2 g) y EtSH (0,24 ml) a 0 °C y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora. Después de que se completara la reacción, se añadió una solución acuosa saturada de NH₄Cl y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de cloruro sódico, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se secó al vacío. El residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice para dar 2-(3-etiltio-6-cloropiridin-2-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-c]piridazina (0,82 g, 68 %).

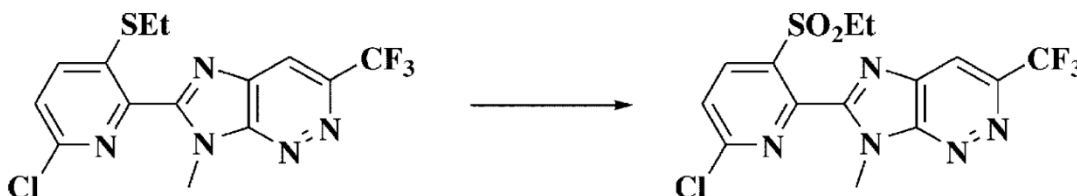
15

Ejemplo de referencia 11

20

Método de producción de 2-(3-etilsulfonil-6-cloropiridin-2-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-c]piridazina

[Quim. 49]



25

A una solución en acetato de etilo (20 ml) de 2-(3-etiltio-6-cloropiridin-2-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-c]piridazina (0,82 g), se le añadió ácido m-cloroperoxibenzoico (1,13 g) a temperatura ambiente y la mezcla se agitó durante 2 horas. Después de que se completara la reacción, se añadieron una solución acuosa saturada de bicarbonato sódico y una solución acuosa saturada de tiosulfato sódico y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de cloruro sódico, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se secó al vacío. El residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice para dar 2-(3-etilsulfonil-6-cloropiridin-2-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-c]piridazina (0,89 g, cuantitativo).

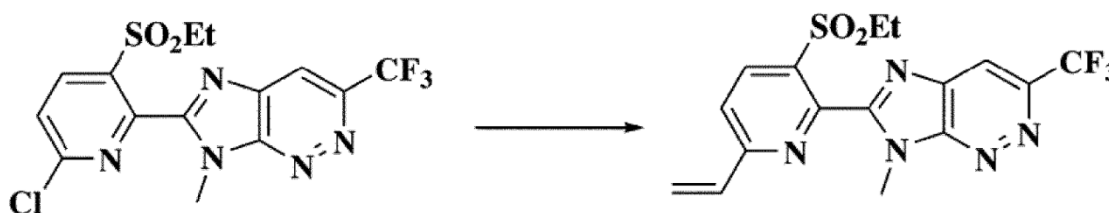
30

Ejemplo de referencia 12

35

Método de producción de 2-(3-etilsulfonil-6-vinilpiridin-2-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-c]piridazina

[Quim. 50]

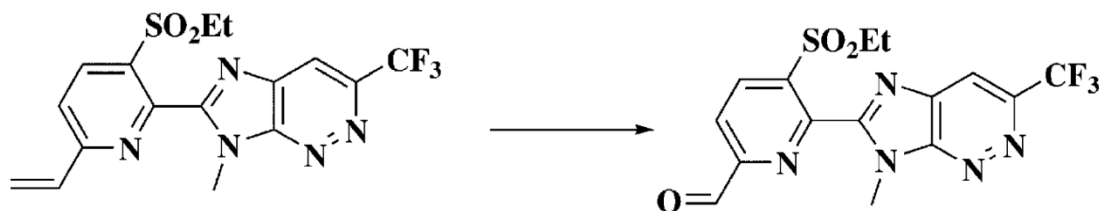


A una solución en DME/H₂O (4:1) (10 ml) de 2-(3-etilsulfonil-6-cloropiridin-2-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-c]piridazina (0,92 g), viniltrifluoroborato de potasio (0,45 g), se le añadió PdCl₂ (dppf)-acetona (0,17 g) y Cs₂CO₃ (1,5 g) y la mezcla se agitó a 80 °C durante 1 hora. Después de que se completara la reacción, la mezcla de reacción se concentró al vacío y el residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice para dar 2-(3-etilsulfonil-6-vinilpiridin-2-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-c]piridazina (0,59 g, 66 %).

Ejemplo de referencia 13

Método de producción de 2-(3-etilsulfonil-6-formilpiridin-2-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-c]piridazina

[Quim. 51]

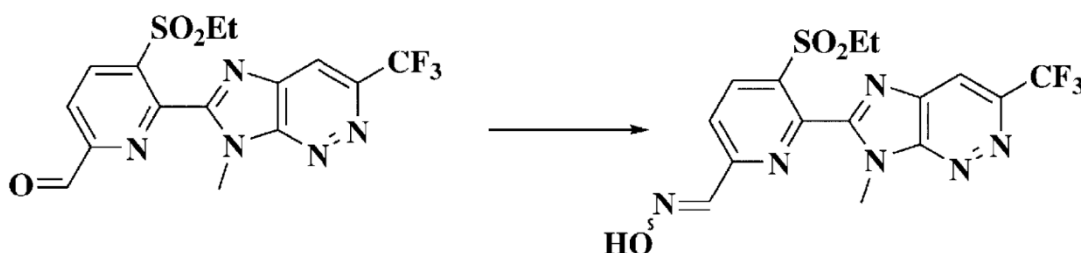


A una solución en THF/tampón fosfato a pH 7 (2:1) (14 ml) de 2-(3-etilsulfonil-6-vinilpiridin-2-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-c]piridazina (0,59 g), se le añadió NMO (1,04 g, 50 % en H₂O) y OsO₄ (3,0 ml, 0,039 M en t-BuOH) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente hasta el día siguiente. A esto, se le añadió NaIO₄ (0,38 g) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas. Después de que se completara la reacción, se añadió una solución saturada de Na₂S₂O₃ y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de cloruro sódico, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se secó al vacío. El residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice para dar 2-(3-etilsulfonil-6-formilpiridin-2-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-c]piridazina (0,51 g, 86 %).

Ejemplo de producción 5

Método de producción de 2-(3-etilsulfonil-6-(hidroxiimino)piridin-2-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-c]piridazina (número de compuesto: 3-1)

[Quim. 52]

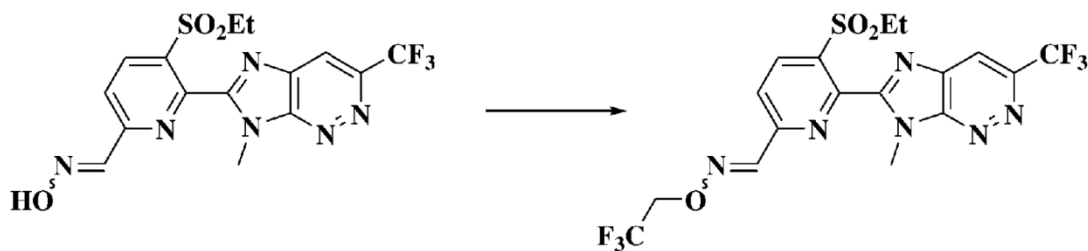


A una solución en etanol (5 ml) de 2-(3-etilsulfonil-6-formilpiridin-2-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-c]piridazina (0,51 g), se le añadió clorhidrato de hidroxilamina (0,13 g) y acetato sódico (0,26 g) y la mezcla se calentó a reflujo durante 2 horas. Después de que se completara la reacción, la mezcla de reacción se concentró al vacío y el residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice para dar 2-(3-etilsulfonil-6-(hidroxiimino)piridin-2-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-c]piridazina (0,48 g, 91 %).

Ejemplo de producción 6

Método de producción de 2-(3-etilsulfonil-6-(2,2,2-trifluoroetoxiimino)piridin-2-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-c]piridazina (número de compuesto: 3-2)

[Quim. 53]

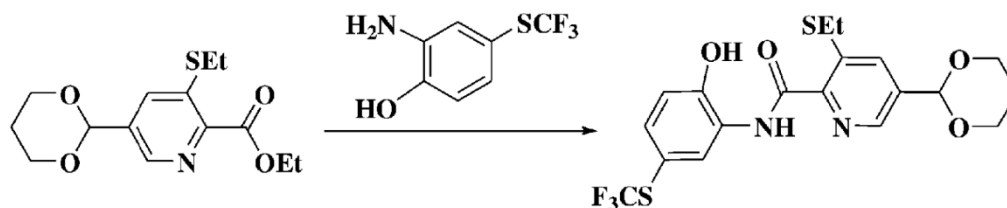


A una solución en DMF (1 ml) de 2-(3-etilsulfonil-6-(hidroxiimino)piridin-2-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-c]piridazina (0,1 g), se le añadió Cs_2CO_3 (0,15 g) y trifluorometanosulfonato de 2,2,2-trifluoroetilo (0,11 mg) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora. Después de que se completara la reacción, se añadió una solución acuosa de cloruro de amonio y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró al vacío y el residuo se purificó por cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 2-(3-etilsulfonil-6-(2,2,2-trifluoroetoxiimino)piridin-2-il)-3-metil-6-trifluorometil-3H-imidazo[4,5-c]piridazina (0,062 g, 68 %).

Ejemplo de referencia 14

Método de producción de la amida del ácido 3-etiltio-5-(1,3-dioxan-2-il)-N-(2-hidroxi-5-(trifluorometiltio)fenil)-2-piridin-carboxílico

[Quim. 54]



A una solución en THF (10 ml) de etil éster del ácido 3-etiltio-5-(1,3-dioxan-2-il)-2-piridin-carboxílico (0,60 g), cuyo compuesto se produjo mediante el método de producción del producto intermedio (2-e4), se añadieron sucesivamente NaH (0,32 g) y una solución en THF (3 ml) de 2-amino-4-(trifluorometiltio)fenol (0,79 g) a 0 °C y la mezcla se agitó a 50 °C durante 2 horas. Después de que se completara la reacción, se añadió una solución acuosa saturada de NH_4Cl y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de cloruro sódico, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se secó al vacío. El residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice para dar la amida del ácido 3-etiltio-5-(1,3-dioxan-2-il)-N-(2-hidroxi-5-(trifluorometiltio)fenil)-2-piridin-carboxílico (0,73 g, 60 %).

Ejemplo de referencia 15

Método de producción de 2-(5-(1,3-dioxan-2-il)-3-etiltio-piridin-2-il)-5-(trifluorometiltio)benzo[d]oxazol

[Quim. 55]



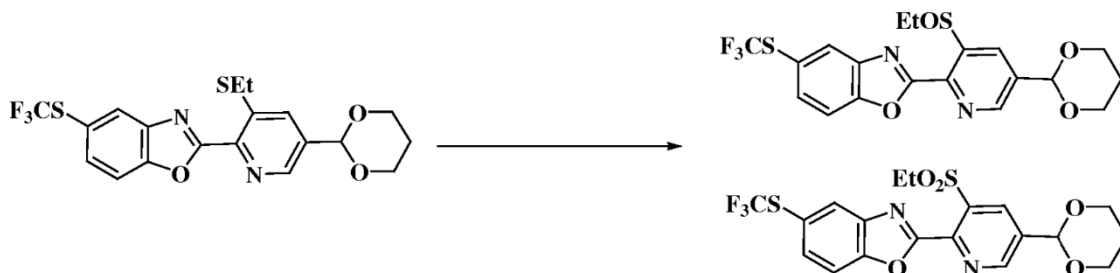
A una solución en THF (5 ml) de la amida del ácido 3-etiltio-5-(1,3-dioxan-2-il)-N-(2-hidroxi-5-(trifluorometiltio)fenil)-2-piridin-carboxílico (0,73 g), se le añadió PPh_3 (1,04 g) y azodicarboxilato de bis(2-metoxietilo) (0,93 g) y la mezcla se agitó a 60 °C durante 1 hora. Después de que se completara la reacción, se añadió agua y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de cloruro sódico, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se secó al vacío. El residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice para dar 2-(5-(1,3-dioxan-2-il)-

3-etiltio-piridin-2-il)-5-(trifluorometiltio)benzo[d]oxazol (0,70 g, cuantitativo).

Ejemplo de referencia 16

5 Método de producción de 2-(5-(1,3-dioxan-2-il)-3-etilsulfonil-piridin-2-il)-5-(trifluorometiltio)benzo[d]oxazol

[Quim. 56]



10 A una solución en acetato de etilo (15 ml) de 2-(5-(1,3-dioxan-2-il)-3-etiltio-piridin-2-il)-5-(trifluorometiltio)benzo[d]oxazol (0,68 g), se le añadió ácido m-cloroperoxisulfónico (0,74 g) a temperatura ambiente y la mezcla se agitó durante 2 horas. Después de que se completara la reacción, se añadieron una solución acuosa saturada de bicarbonato sódico y una solución acuosa saturada de tiosulfato sódico y se extrajo con acetato de etilo.

15 La capa orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de cloruro sódico, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se secó al vacío. El residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice para dar 2-(5-(1,3-dioxan-2-il)-3-etilsulfonil-piridin-2-il)-5-(trifluorometiltio)benzo[d]oxazol (0,31 g, 40 %) y 2-(5-(1,3-dioxan-2-il)-3-etilsulfonil-piridin-2-il)-5-(trifluorometiltio)benzo[d]oxazol (0,40 g, 56 %).

Ejemplo de producción 7

20 Método de producción de (E)-(5-etilsulfonil)-6-(trifluorometiltio)benzo[d]oxazol-2-il)nicotinaldehído oxima (número de compuesto: 4-11)

[Quim. 57]

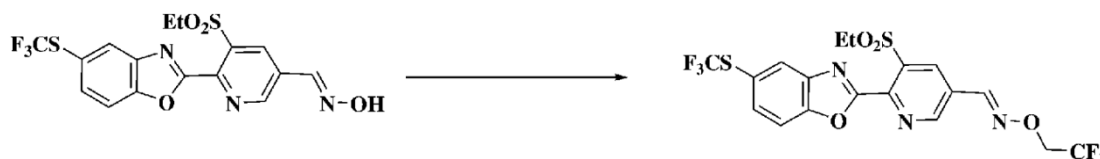


25 A una solución en THF (20 ml) de 2-(5-(1,3-dioxan-2-il)-3-etilsulfonil-piridin-2-il)-5-(trifluorometiltio)benzo[d]oxazol (0,31 g), se le añadió una solución 2 M de HCl (10 ml) y la mezcla se agitó hasta el día siguiente. A la mezcla de reacción se le añadió AcOH (20 ml) y la mezcla se agitó a 80 °C durante 1 hora. A esto se le añadió clorhidrato de hidroxilamina (0,15 g) y la mezcla se agitó durante 1 hora más. Después de que se completara la reacción, la mezcla de reacción se concentró al vacío y el residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice para dar 5-etilsulfonil-6-(trifluorometiltio)benzo[d]oxazol-2-il)nicotinaldehído oxima (0,22 g, 78 %).

Ejemplo de producción 8

35 Método de producción de (E)-(5-etilsulfonil)-6-(trifluorometiltio)benzo[d]oxazol-2-il)nicotinaldehído O-(2,2,2-trifluoroetil)oxima (número de compuesto: 4-12)

[Quim. 58]



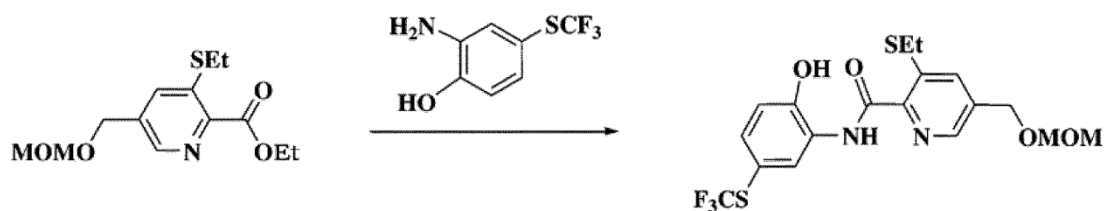
40 A una solución en DMF (1 ml) de (E)-(5-etilsulfonil)-6-(trifluorometiltio)benzo[d]oxazol-2-il)nicotinaldehído oxima (0,1 g), se le añadió Cs₂CO₃ (0,15 g) y trifluorometanosulfonato de 2,2,2-trifluoroetilo (0,11 mg) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora. Después de que se completara la reacción, se añadió una solución acuosa de

cloruro de amonio y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró al vacío y el residuo se purificó por cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar (E)-5-(5-etilsulfonil)-6-(trifluorometiltio)benzo[d]oxazol-2-il)nicotinaldehído O-(2,2,2-trifluoroetil)oxima (0,031 g, 32 %).

5 Ejemplo de referencia 17

Método de producción de la amida del ácido 3-etiltio-5-(metoximetoxi)-N-(2-hidroxi-5-(trifluorometiltio)fenil)-2-piridin-carboxílico

[Quim. 59]



10

A una solución en THF (10 ml) de etil éster del ácido 3-etiltio-5-metoximetil-2-piridincarboxílico (0,64 g), cuyo compuesto se produjo mediante el método de producción del producto intermedio (2-b2), se añadieron sucesivamente NaH (0,36 g) y una solución en THF (2 ml) de 2-amino-4-(trifluorometiltio)fenol (0,4 g) a 0 °C y la mezcla se agitó a 50 °C durante 2 horas. Después de que se completara la reacción, se añadió una solución acuosa saturada de NH₄Cl y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de cloruro sódico, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se secó al vacío. El residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice para dar la amida del ácido 3-etiltio-5-(metoximetoxi)-N-(2-hidroxi-5-(trifluorometiltio)fenil)-2-piridin-carboxílico (0,73 g, 60 %).

15

20

Ejemplo de referencia 18

Método de producción de 2-(3-etiltio-5-(metoximetoxi)piridin-2-il)-5-(trifluorometiltio)benzo[d]oxazol

[Quim. 60]



25

A una solución en THF (5 ml) de la amida del ácido 3-etiltio-5-(metoximetoxi)-N-(2-hidroxi-5-(trifluorometiltio)fenil)-2-piridin-carboxílico (0,73 g), se le añadió PPh₃ (1,04 g) y azodicarboxilato de bis(2-metoxietilo) (0,93 g) y la mezcla se agitó a 60 °C durante 1 hora. Después de que se completara la reacción, se añadió H₂O y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de cloruro sódico, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se secó al vacío. El residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice para dar 2-(3-etiltio-5-(metoximetoxi)piridin-2-il)-5-(trifluorometiltio)benzo[d]oxazol (0,70 g, cuantitativo).

30

35

Ejemplo de referencia 19

Método de producción de 2-(5-metoximetoxi-3-etilsulfonil-piridin-2-il)-5-(trifluorometiltio)benzo[d]oxazol

[Quim. 61]



40

A una solución en acetato de etilo (15 ml) de 2-(3-etiltio-5-(metoximetoximetil)piridin-2-il)-5-(trifluorometiltio)benzo[d]oxazol (0,68 g), se le añadió ácido m-cloroperoxisulfónico (0,74 g) a temperatura ambiente y la mezcla se agitó durante 2 horas. Después de que se completara la reacción, se añadieron una solución acuosa

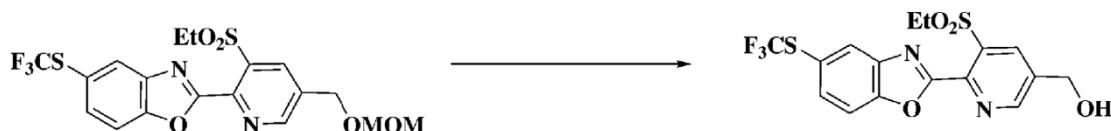
saturada de bicarbonato sódico y una solución acuosa saturada de tiosulfato sódico y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de cloruro sódico, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se secó al vacío. El residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice para dar 2-(5-metoximetoxi-3-etilsulfonilpiridin-2-il)-5-(trifluorometiltio)benzo[d]oxazol (0,40 g, 60 %).

5

Ejemplo de referencia 20

Método de producción de 2-(3-etilsulfonil-5-(hidroximetil)piridin-2-il)-5-(trifluorometiltio)benzo[d]oxazol

[Quim. 62]



10

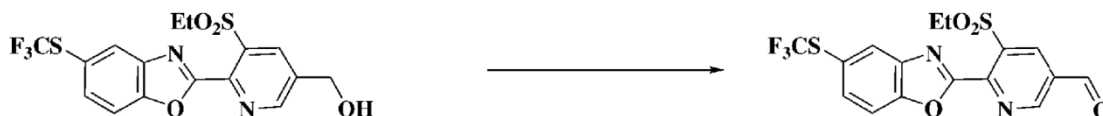
A una solución en metanol (7 ml) de 2-(5-metoximetoxi-3-etilsulfonil-piridin-2-il)-5-(trifluorometiltio)benzo[d]oxazol (0,55 g), se le añadió ácido clorhídrico concentrado (2 ml) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente hasta el día siguiente. Después de que se completara la reacción, la mezcla de reacción se secó al vacío. Se añadió una solución acuosa saturada de bicarbonato sódico al residuo y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de cloruro sódico, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice para dar 2-(3-etilsulfonil-5-(hidroximetil)piridin-2-il)-5-(trifluorometiltio)benzo[d]oxazol (0,34 g, 70 %).

15

20 Ejemplo de referencia 21

Método de producción de(5-etilsulfonil)-6-(trifluorometiltio)benzo[d]oxazol-2-il)nicotinaldehído

[Quim. 63]



25

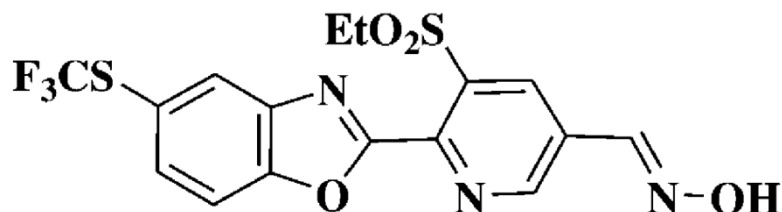
A una solución en CHCl_3 (7 ml) de 2-(3-etilsulfonil-5-(hidroximetil)piridin-2-il)-5-(trifluorometiltio)benzo[d]oxazol (0,34 g), se le añadió BAIB ([bis(acetoxi)yodo]benceno) (0,32 g) y TEMPO (2,2,6,6-tetrametilpiperidin 1-oxilo radical libre) (0,028 g) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente hasta el día siguiente. Después de que se completara la reacción, se añadió una solución acuosa saturada de tiosulfato sódico y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de cloruro sódico, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice para dar 5-etilsulfonil-6-(trifluorometiltio)benzo[d]oxazol-2-il)nicotinaldehído (0,26 g, 75 %).

30

(5-etilsulfonil)-6-(trifluorometiltio)benzo[d]oxazol-2-il)nicotinaldehído, que se produjo mediante el método anterior, se convirtió en el compuesto de la presente invención según los métodos de producción descritos en los ejemplos de producción 7 y 8 anteriores. Es decir, el compuesto representado por la fórmula siguiente:

35

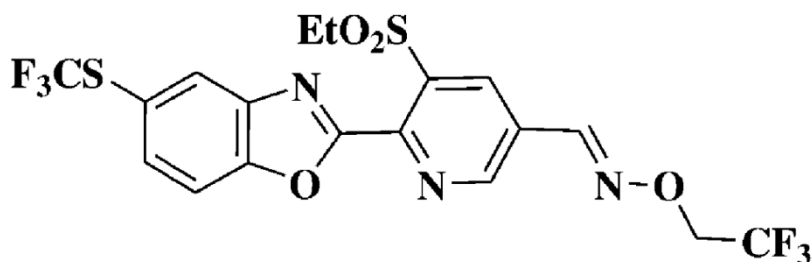
[Quim. 64]



40

(Isómero E) se obtuvo primero, y a partir de este compuesto, el compuesto representado por la fórmula siguiente:

[Quim. 65]



(Isómero E)
se obtuvo según el método descrito en el ejemplo de producción 8.

5 En lo sucesivo en el presente documento, se muestran ejemplos de formulación, pero la presente invención no se limita a los mismos. En los ejemplos de formulación, la "parte" significa una parte en peso.

Ejemplo de formulación 1

10	Compuesto de la presente invención	10 partes
	Xileno	70 partes
	N-metilpirrolidona	10 partes
	Mezcla de nonilfenil éter de polioxietileno y alquilbenceno sulfonato de calcio (relación en peso 1:1)	10 partes

Los ingredientes anteriores se mezclan de manera uniforme para disolución para dar una formulación concentrada emulsionable.

15 Ejemplo de formulación 2

Compuesto de la presente invención	3 partes
Polvo de arcilla	82 partes
Polvo de diatomita	15 partes

Los ingredientes anteriores se mezclan de manera uniforme y después se pulverizan para dar una formulación en polvo.

20 Ejemplo de formulación 3

Compuesto de la presente invención	5 partes
Mezcla de polvo de bentonita y polvo de arcilla	90 partes
Lignosulfonato de calcio	5 partes

25 Los ingredientes se mezclan de manera uniforme. Después de la adición de un volumen de agua apropiado, la mezcla se amasa, se granula y se seca para dar una formulación granulada.

Ejemplo de formulación 4

Compuesto de la presente invención	20 partes
Caolín y ácido silícico de alta dispersión sintético	75 partes
Mezcla de nonilfenil éter de polioxietileno y alquilbenceno sulfonato de calcio (relación en peso 1:1)	5 partes

30 Los ingredientes anteriores se mezclan de manera uniforme y después se pulverizan para dar una formulación en polvo humectable.

En lo sucesivo en el presente documento, se muestran ejemplos de prueba en relación con la presente invención, pero la presente invención no se limita a los mismos.

35 Ejemplo de prueba 1

Prueba de control de eficacia en *Myzus persicae*

40 Se plantaron plantas de col china en macetas de plástico (diámetro: 8 cm, altura: 8 cm), se propagaron pulgones verdes del melocotonero (*Myzus persicae*) en las plantas y se contó el número de pulgones verdes del melocotonero

supervivientes en cada maceta. Se dispersó el compuesto heterocíclico condensado que contiene un grupo oximas representado por la fórmula general (1) de la presente invención o sales del mismo en agua y se diluyó a 500 ppm y la dispersión agroquímica se aplicó a las hojas de las plantas de col china plantadas en macetas. Después de secar las plantas al aire, las macetas se mantuvieron en un invernadero. A los 6 días de la aplicación foliar, se contó el número de pulgones verdes del melocotonero supervivientes en la planta de col china en cada maceta, la tasa de control se calculó según la fórmula mostrada a continuación y la eficacia de control se evaluó según los criterios mostrados a continuación.

[Fórm. matem. 1]

$$\text{Tasa de control} = 100 - \left\{ \frac{T \times Ca}{Ta \times C} \right\} \times 100$$

Ta: el número de supervivientes antes de la aplicación foliar en una parcela de tratamiento

T: el número de supervivientes después de la aplicación foliar en una parcela de tratamiento

Ca: el número de supervivientes antes de la aplicación foliar en una parcela sin tratamiento

C: el número de supervivientes después de la aplicación foliar en una parcela sin tratamiento

Criterios

A: la tasa de control es del 100 %.

B: la tasa de control es del 90 al 99 %.

C: la tasa de control es del 80 al 89 %.

D: la tasa de control es del 50 al 79 %.

Como resultado, los compuestos 1-3, 1-60, 1-72, 1-189, 1-192, 1-195, 1-198, 1-201, 1-204, 1-207, 1-210, 1-213, 1-216, 1-219, 1-222, 1-225, 1-228, 1-231, 1-234, 1-237, 1-240, 1-243, 1-246, 1-258, 1-306, 1-352, 1-353, 1-354, 2-3, 2-6, 2-9, 2-12, 2-15, 2-33, 2-39, 2-45, 2-235, 2-236, 2-237, 2-238, 2-239, 2-240, 2-241, 3-1, 3-2, 3-3, 3-4, 3-5, 3-11, 3-12, 3-13, 4-1, 4-2, 4-3, 4-11, 4-12, 4-13, 4-14, 4-15, 4-29, 4-30, 4-31, 4-32, 4-33, 4-34, 5-15, 5-16, 5-17, 5-18, 5-19 y 5-93 de la presente invención mostraron el nivel de actividad evaluado como A.

Ejemplo de prueba 2

Prueba insecticida en *Laodelphax striatella*

Se dispersaron de forma separada los compuestos heterocíclicos condensados que contienen un grupo oxima representados por la fórmula general (1) de la presente invención o las sales del mismo en agua y se diluyeron a 500 ppm y las plántulas de plantas de arroz (variedad: Nihonbare) se sumergieron en las dispersiones agroquímicas durante 30 segundos. Después de secar al aire, cada plántula se puso en un tubo de ensayo de vidrio separado y se inoculó con diez larvas de tercer estadio de *Laodelphax striatella* y después los tubos de ensayo se taparon con tapones de algodón. A los 8 días después de la inoculación, se contó el número de larvas supervivientes y larvas muertas, la tasa de mortalidad corregida se calculó según la fórmula mostrada a continuación y el efecto insecticida se evaluó según los criterios del ejemplo de prueba 1.

[Fórm. matem. 2]

$$\text{Tasa de mortalidad corregida (\%)} = 100 \times \frac{(\text{Tasa de supervivencia en una parcela sin tratamiento} - \text{Tasa de supervivencia en una parcela de tratamiento})}{\text{Tasa de supervivencia en una parcela sin tratamiento}}$$

Como resultado, los compuestos 1-3, 1-60, 1-72, 1-189, 1-192, 1-195, 1-198, 1-201, 1-204, 1-207, 1-210, 1-213, 1-216, 1-219, 1-222, 1-225, 1-228, 1-231, 1-234, 1-237, 1-240, 1-243, 1-246, 1-258, 1-306, 1-352, 1-353, 1-354, 2-3, 2-6, 2-9, 2-12, 2-15, 2-33, 2-39, 2-45, 2-235, 2-236, 2-237, 2-238, 2-239, 2-240, 2-241, 3-1, 3-2, 3-3, 3-4, 3-5, 3-11, 3-12, 3-13, 4-1, 4-2, 4-3, 4-11, 4-12, 4-13, 4-14, 4-15, 4-29, 4-30, 4-31, 4-32, 4-33, 4-34, 5-15, 5-16, 5-17, 5-18, 5-19 y 5-93 de la presente invención mostraron el nivel de actividad evaluado como A.

Ejemplo de prueba 3

Prueba insecticida en *Plutella xylostella*

Se liberaron adultos de *Plutella xylostella* sobre plántulas de col china y se les permitió poner huevos sobre ellas. A los 2 días después de la liberación de los adultos, las plántulas de col china con huevos puestos se sumergieron durante aproximadamente 30 segundos en las dispersiones agroquímicas diluidas a 500 ppm, cada una de las cuales contenía un tipo distinto de compuesto heterocíclico condensado que contiene un grupo oxima representado por la fórmula general (1) de la presente invención como principio activo. Después de secar al aire, las plántulas se mantuvieron en una cámara termostática a 25 °C. A los 6 días después del tratamiento por inmersión, se contó el número de larvas eclosionadas por parcela, se calculó la tasa de mortalidad según la fórmula mostrada a continuación y se evaluó la eficacia insecticida según los criterios del ejemplo de prueba 1. Esta prueba se realizó por triplicado

usando 10 adultos de *Plutella xylostella* por parcela.

[Fórm. matem. 3]

- 5 Tasa de mortalidad corregida (%) = $100 \times (\text{número de larvas eclosionadas en una parcela sin tratamiento} - \text{Número de larvas eclosionadas en una parcela con tratamiento}) / \text{Número de larvas eclosionadas en una parcela sin tratamiento}$

- 10 Como resultado, los compuestos 1-3, 1-60, 1-72, 1-189, 1-192, 1-195, 1-198, 1-201, 1-204, 1-207, 1-210, 1-213, 1-216, 1-219, 1-222, 1-225, 1-228, 1-231, 1-234, 1-237, 1-240, 1-243, 1-246, 1-258, 1-306, 1-352, 1-353, 1-354, 2-3, 2-6, 2-9, 2-12, 2-15, 2-33, 2-39, 2-45, 2-235, 2-236, 2-237, 2-238, 2-239, 2-240, 2-241, 3-1, 3-2, 3-3, 3-4, 3-5, 3-11, 3-12, 3-13, 4-1, 4-2, 4-3, 4-11, 4-12, 4-13, 4-14, 4-15, 4-29, 4-30, 4-31, 4-32, 4-33, 4-34, 5-15, 5-16, 5-17, 5-18, 5-19 y 5-93 de la presente invención mostraron el nivel de actividad evaluado como A.

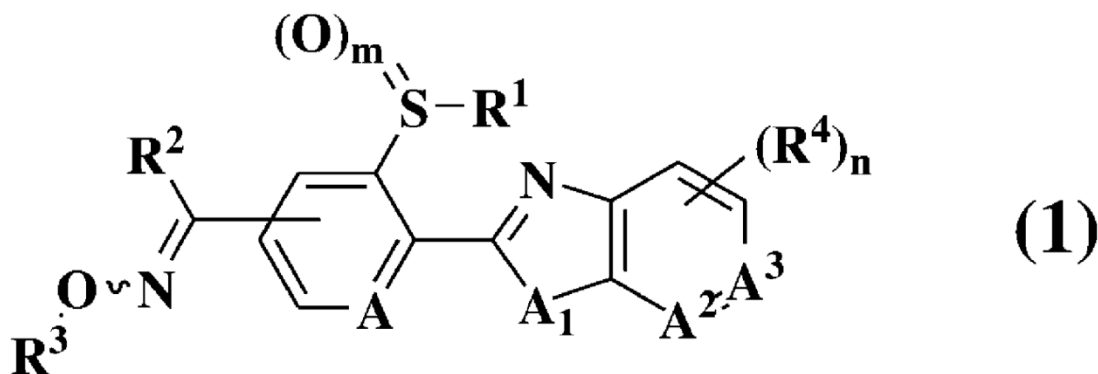
15 **Disponibilidad industrial**

El compuesto de la presente invención es altamente eficaz para el control de un amplio espectro de plagas agrícolas y hortícolas y por lo tanto es útil.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto heterocíclico condensado representado por la fórmula general (1):

[Quim. 1]



{en donde

R¹ representa

- (a1) un grupo alquilo (C₁-C₆);
- (a2) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆);
- (a3) un grupo alquenilo (C₂-C₆); o
- (a4) un grupo alquinilo (C₂-C₆),

R² representa

- (b1) un átomo de hidrógeno;
- (b2) un grupo alquilo (C₁-C₆);
- (b3) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆);
- (b4) un grupo haloalquilo (C₁-C₆);
- (b5) un grupo amino;
- (b6) un grupo ciano;
- (b7) un grupo alcoxicarbonilo (C₁-C₆);
- (b8) un grupo aminocarbonilo;
- (b9) un grupo mono-alquilaminocarbonilo (C₁-C₆); o
- (b10) un grupo di-alquilaminocarbonilo (C₁-C₆),

R³ representa

- (c1) un átomo de hidrógeno;
- (c2) un grupo alquilo (C₁-C₆);
- (c3) un grupo alquenilo (C₂-C₆);
- (c4) un grupo alquinilo (C₂-C₆);
- (c5) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆);
- (c6) un grupo cicloalquil (C₃-C₆)alquilo (C₁-C₆);
- (c7) un grupo alcoxi (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆);
- (c8) un grupo haloalquilo (C₁-C₆);
- (c9) un grupo haloalquenilo (C₂-C₆);
- (c10) un grupo haloalquinilo (C₂-C₆);
- (c11) un grupo fenilo;
- (c12) un grupo fenilo que tiene, en el anillo, de 1 a 5 grupos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan entre (a) un átomo de halógeno, (b) un grupo ciano, (c) un grupo nitro, (d) un grupo formilo, (e) un grupo alquilo (C₁-C₆), (f) un grupo haloalquilo (C₂-C₆), (g) un grupo alcoxi (C₁-C₆), (h) un grupo haloalcoxi (C₁-C₆), (i) un grupo cicloalquil (C₃-C₆)alcoxi (C₁-C₆), (j) un grupo alquiltio (C₁-C₆), (k) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆), (l) un grupo alquilsulfinilo (C₁-C₆), (m) un grupo haloalquilsulfinilo (C₁-C₆), (n) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆) y (o) un grupo haloalquilsulfonilo (C₁-C₆);
- (c13) un grupo fenilalquilo (C₁-C₆);
- (c14) un grupo fenilalquilo (C₁-C₆) que tiene, en el anillo, de 1 a 5 grupos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan entre (a) un átomo de halógeno, (b) un grupo ciano, (c) un grupo nitro, (d) un grupo formilo, (e) un grupo alquilo (C₁-C₆), (f) un grupo haloalquilo (C₁-C₆), (g) un grupo alcoxi (C₁-C₆), (h) un

grupo haloalcoxi (C₁-C₆), (i) un grupo cicloalquil (C₃-C₆)alcoxi (C₁-C₆), (j) un grupo alquiltio (C₁-C₆), (k) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆), (l) un grupo alquilsulfinilo (C₁-C₆), (m) un grupo haloalquilsulfinilo (C₁-C₆), (n) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆) y (o) un grupo haloalquilsulfonilo (C₁-C₆);

(c15) un grupo alquilcarbonilo (C₁-C₆);

(c16) un grupo cicloalquilcarbonilo (C₃-C₆);

(c17) un grupo cianoalquilo;

(c18) un grupo alquiltio (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆);

(c19) un grupo alquilsulfinil (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆);

(c20) un grupo alquilsulfonil (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆);

(c21) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆);

(c22) un grupo haloalquilsulfinil (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆); o

(c23) un grupo haloalquilsulfonil (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆),

R⁴ representa

(d1) un átomo de halógeno;

(d2) un grupo ciano;

(d3) un grupo nitro;

(d4) un grupo alquilo (C₁-C₆);

(d5) un grupo alcoxi (C₁-C₆);

(d6) un grupo alqueniloxi (C₂-C₆);

(d7) un grupo alquiniloxi (C₂-C₆);

(d8) un grupo haloalquilo (C₁-C₆);

(d9) un grupo haloalcoxi (C₁-C₆);

(d10) un grupo haloalqueniloxi (C₂-C₆);

(d11) un grupo haloalquiniloxi (C₂-C₆);

(d12) un grupo alquiltio (C₁-C₆);

(d13) un grupo alquilsulfinilo (C₁-C₆);

(d14) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆);

(d15) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆);

(d16) un grupo haloalquilsulfinilo (C₁-C₆) o

(d17) un grupo haloalquilsulfonilo (C₁-C₆),

cada uno de A, A² y A³ representa CH o un átomo de nitrógeno,

A¹ representa O, S o N-R⁵ (en donde R⁵ representa (e1) un grupo alquilo (C₁-C₆); (e2) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆); (e3) un grupo alquenilo (C₂-C₆) o (e4) un grupo alquinilo (C₂-C₆)),

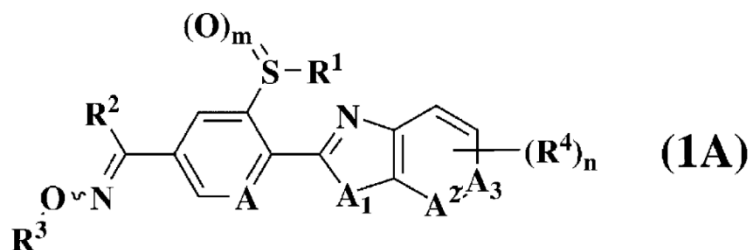
m representa 0, 1 o 2 y

n representa 0, 1 o 2} o

una sal del mismo.

2. El compuesto heterocíclico condensado según la reivindicación 1 o una sal del mismo, en donde el compuesto heterocíclico condensado está representado por la fórmula general (1A):

[Quim. 2]



{en donde

R¹ representa (a1) un grupo alquilo (C₁-C₆),

R² representa

(b1) un átomo de hidrógeno; o

(b2) un grupo alquilo (C₁-C₆),

R³ representa

(c1) un átomo de hidrógeno; o
 (c8) un grupo haloalquilo (C₁-C₆),

5 R⁴ representa

(d8) un grupo haloalquilo (C₁-C₆);
 (d9) un grupo haloalcoxi (C₁-C₆);
 10 (d15) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆);
 (d16) un grupo haloalquilsulfonilo (C₁-C₆) o
 (d17) un grupo haloalquilsulfonilo (C₁-C₆),

15 A representa un átomo de nitrógeno,
 cada uno de A² y A³ representa CH o un átomo de nitrógeno,
 A¹ representa O o N-R⁵ (en donde R⁵ representa (e1) un grupo alquilo (C₁-C₆)),
 m representa 0 o 2 y
 n representa 1}.

20 3. El compuesto heterocíclico condensado según la reivindicación 2 o una sal del mismo, en donde A¹ es O.

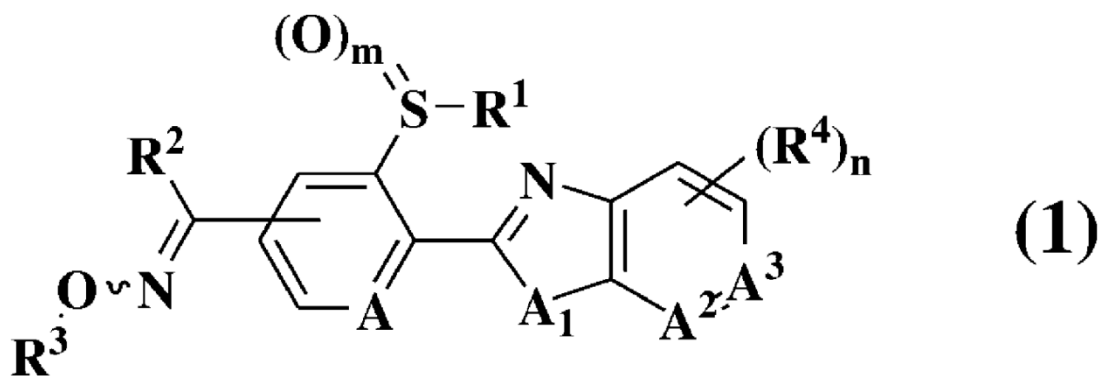
4. Un insecticida agrícola y hortícola que comprende el compuesto heterocíclico condensado según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 o una sal del mismo como principio activo.

25 5. Un método para usar un insecticida agrícola y hortícola, comprendiendo el método aplicar una cantidad eficaz del compuesto heterocíclico condensado según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 o una sal del mismo a las plantas o al suelo.

30 6. Un agente de control ectoparasitario animal que comprende una cantidad eficaz del compuesto heterocíclico condensado según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 o una sal del mismo como principio activo.

7. El compuesto heterocíclico condensado según la reivindicación 1 o una sal del mismo, en donde el compuesto heterocíclico condensado está representado por la fórmula general (1):

[Quim. 3]



35 {en donde

R¹ representa

40 (a1) un grupo alquilo (C₁-C₆);
 (a2) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆);
 (a3) un grupo alqueno (C₂-C₆); o
 (a4) un grupo alquino (C₂-C₆),

45 R² representa

(b1) un átomo de hidrógeno;
 (b2) un grupo alquilo (C₁-C₆);
 (b3) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆);
 50 (b4) un grupo haloalquilo (C₁-C₆); o
 (b5) un grupo amino,

R³ representa

- 5 (c1) un átomo de hidrógeno;
 (c2) un grupo alquilo (C₁-C₆);
 (c3) un grupo alqueno (C₂-C₆);
 (c4) un grupo alquino (C₂-C₆);
 (c5) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆);
 10 (c6) un grupo cicloalquil (C₃-C₆)alquilo (C₁-C₆);
 (c7) un grupo alcoxi (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆);
 (c8) un grupo haloalquilo (C₁-C₆);
 (c9) un grupo haloalqueno (C₂-C₆);
 (c10) un grupo haloalquino (C₂-C₆);
 (c11) un grupo fenilo;
 15 (c12) un grupo fenilo que tiene, en el anillo, de 1 a 5 grupos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan entre (a) un átomo de halógeno, (b) un grupo ciano, (c) un grupo nitro, (d) un grupo formilo, (e) un grupo alquilo (C₁-C₆), (f) un grupo haloalquilo (C₃-C₆), (g) un grupo alcoxi (C₁-C₆), (h) un grupo haloalcoxi (C₁-C₆), (i) un grupo cicloalquil (C₃-C₆)alcoxi (C₁-C₆), (j) un grupo alquiltio (C₁-C₆), (k) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆), (l) un grupo alquilsulfinilo (C₁-C₆), (m) un grupo haloalquilsulfinilo (C₁-C₆), (n) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆) y (o) un grupo haloalquilsulfonilo (C₁-C₆);
 20 (c13) un grupo fenilalquilo (C₁-C₆);
 (c14) un grupo fenilalquilo (C₁-C₆) que tiene, en el anillo, de 1 a 5 grupos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan entre (a) un átomo de halógeno, (b) un grupo ciano, (c) un grupo nitro, (d) un grupo formilo, (e) un grupo alquilo (C₁-C₆), (f) un grupo haloalquilo (C₁-C₆), (g) un grupo alcoxi (C₁-C₆), (h) un grupo haloalcoxi (C₁-C₆), (i) un grupo cicloalquil (C₃-C₆)alcoxi (C₁-C₆), (j) un grupo alquiltio (C₁-C₆), (k) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆), (l) un grupo alquilsulfinilo (C₁-C₆), (m) un grupo haloalquilsulfinilo (C₁-C₆), (n) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆) y (o) un grupo haloalquilsulfonilo (C₁-C₆);
 25 (c15) un grupo alquilcarbonilo (C₁-C₆); o
 (c16) un grupo cicloalquilcarbonilo (C₃-C₆),
 30

R⁴ representa

- (d1) un átomo de halógeno;
 (d2) un grupo ciano;
 35 (d3) un grupo nitro;
 (d4) un grupo alquilo (C₁-C₆);
 (d5) un grupo alcoxi (C₁-C₆);
 (d6) un grupo alqueno (C₂-C₆);
 (d7) un grupo alquino (C₂-C₆);
 40 (d8) un grupo haloalquilo (C₁-C₆);
 (d9) un grupo haloalcoxi (C₁-C₆);
 (d10) un grupo haloalqueno (C₂-C₆);
 (d11) un grupo haloalquino (C₂-C₆);
 (d12) un grupo alquiltio (C₁-C₆);
 45 (d13) un grupo alquilsulfinilo (C₁-C₆);
 (d14) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆);
 (d15) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆);
 (d16) un grupo haloalquilsulfinilo (C₁-C₆) o
 50 (d17) un grupo haloalquilsulfonilo (C₁-C₆),

cada uno de A, A² y A³ representa CH o un átomo de nitrógeno,

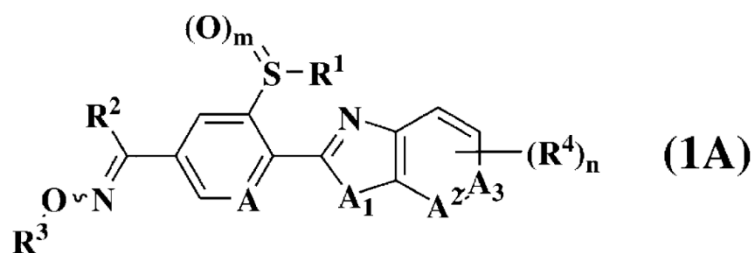
A¹ representa O, S o N-R⁵ (en donde R⁵ representa (e1) un grupo alquilo (C₁-C₆); (e2) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆); (e3) un grupo alqueno (C₂-C₆) o (e4) un grupo alquino (C₂-C₆)),

m representa 0, 1 o 2 y

55 n representa 0, 1 o 2}.

8. El compuesto heterocíclico condensado según la reivindicación 7 o una sal del mismo, en donde el compuesto heterocíclico condensado está representado por la fórmula general (1A):

[Quim. 4]



{en donde

5 R¹ representa

- (a1) un grupo alquilo (C₁-C₆);
- (a2) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆);
- 10 (a3) un grupo alquenilo (C₂-C₆); o
- (a4) un grupo alquinilo (C₂-C₆),

R² representa

- 15 (b1) un átomo de hidrógeno;
- (b2) un grupo alquilo (C₁-C₆);
- (b3) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆); o
- (b5) un grupo amino,

R³ representa

- 20 (c1) un átomo de hidrógeno;
- (c2) un grupo alquilo (C₁-C₆);
- (c3) un grupo alquenilo (C₂-C₆);
- 25 (c4) un grupo alquinilo (C₂-C₆);
- (c5) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆);
- (c6) un grupo cicloalquil (C₃-C₆)alquilo (C₁-C₆);
- (c7) un grupo alcoxi (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆);
- (c8) un grupo haloalquilo (C₁-C₆);
- 30 (c9) un grupo haloalquenilo (C₂-C₆);
- (c10) un grupo haloalquinilo (C₂-C₆);
- (c11) un grupo fenilo;
- (c12) un grupo fenilo que tiene, en el anillo, de 1 a 5 grupos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan entre (a) un átomo de halógeno, (b) un grupo ciano, (c) un grupo nitro, (d) un grupo formilo, (e) un grupo alquilo (C₁-C₆), (f) un grupo haloalquilo (C₂-C₆), (g) un grupo alcoxi (C₁-C₆), (h) un grupo haloalcoxi (C₁-C₆), (i) un grupo cicloalquil (C₃-C₆)alcoxi (C₁-C₆), (j) un grupo alquiltio (C₁-C₆), (k) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆), (l) un grupo alquilsulfinilo (C₁-C₆), (m) un grupo haloalquilsulfinilo (C₁-C₆), (n) un grupo alquilsulfonylo (C₁-C₆) y (o) un grupo haloalquilsulfonylo (C₁-C₆);
- 35 (c13) un grupo fenilalquilo (C₁-C₆); o
- (c14) un grupo fenilalquilo (C₁-C₆) que tiene, en el anillo, de 1 a 5 grupos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan entre (a) un átomo de halógeno, (b) un grupo ciano, (c) un grupo nitro, (d) un grupo formilo, (e) un grupo alquilo (C₁-C₆), (f) un grupo haloalquilo (C₁-C₆), (g) un grupo alcoxi (C₁-C₆), (h) un grupo haloalcoxi (C₁-C₆), (i) un grupo cicloalquil (C₃-C₆)alcoxi (C₁-C₆), (j) un grupo alquiltio (C₁-C₆), (k) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆), (l) un grupo alquilsulfinilo (C₁-C₆), (m) un grupo haloalquilsulfinilo (C₁-C₆), (n) un grupo alquilsulfonylo (C₁-C₆) y (o) un grupo haloalquilsulfonylo (C₁-C₆),

45

R⁴ representa

- (d1) un átomo de halógeno;
- 50 (d2) un grupo ciano;
- (d3) un grupo nitro;
- (d4) un grupo alquilo (C₁-C₆);
- (d5) un grupo alcoxi (C₁-C₆);
- (d6) un grupo alquenilo (C₂-C₆);
- 55 (d7) un grupo alquinilo (C₂-C₆);
- (d8) un grupo haloalquilo (C₁-C₆);

- (d9) un grupo haloalcoxi (C₁-C₆);
 (d10) un grupo haloalqueniloxi (C₂-C₆);
 (d11) un grupo haloalquiniloxi (C₂-C₆);
 (d12) un grupo alquiltio (C₁-C₆);
 (d13) un grupo alquilsulfinilo (C₁-C₆);
 (d14) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆);
 (d15) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆);
 (d16) un grupo haloalquilsulfinilo (C₁-C₆); o
 (d17) un grupo haloalquilsulfonilo (C₁-C₆),

cada uno de A, A² y A³ representa CH o un átomo de nitrógeno,
 A¹ representa O, S o N-R⁵ (en donde R⁵ representa (e1) un grupo alquilo (C₁-C₆); (e2) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆); (e3) un grupo alquenilo (C₂-C₆) o (e4) un grupo alquinilo (C₂-C₆)),
 m representa 0, 1 o 2 y
 n representa 0, 1 o 2}.

9. El compuesto heterocíclico condensado según la reivindicación 8 o una sal del mismo, en donde

R¹ representa (a1) un grupo alquilo (C₁-C₆),
 R² representa

- (b1) un átomo de hidrógeno; o
 (b2) un grupo alquilo (C₁-C₆),

R³ representa

- (c1) un átomo de hidrógeno;
 (c2) un grupo alquilo (C₁-C₆);
 (c3) un grupo alquenilo (C₂-C₆);
 (c7) un grupo alcoxi (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆);
 (c11) un grupo fenilo; o
 (c13) un grupo fenilalquilo (C₁-C₆),

R⁴ representa

- (d8) un grupo haloalquilo (C₁-C₆) o
 (d15) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆),

cada uno de A, A² y A³ representa un átomo de nitrógeno,
 A¹ representa N-R⁵ (en donde R⁵ representa (e1) un grupo alquilo (C₁-C₆)),
 m representa 0, 1 o 2 y
 n representa 1.

10. El compuesto heterocíclico condensado según la reivindicación 8 o 9 o una sal del mismo, en donde

R¹ representa (a1) un grupo alquilo (C₁-C₆),
 R² representa

- (b1) un átomo de hidrógeno; o
 (b2) un grupo alquilo (C₁-C₆),

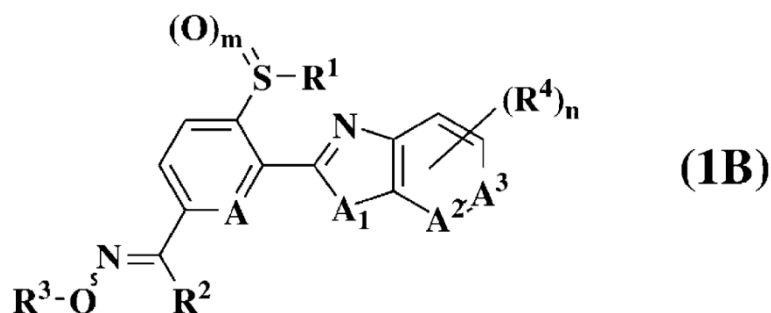
R³ representa

- (c1) un átomo de hidrógeno;
 (c2) un grupo alquilo (C₁-C₆);
 (c3) un grupo alquenilo (C₂-C₆);
 (c7) un grupo alcoxi (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆);
 (c11) un grupo fenilo; o
 (c13) un grupo fenilalquilo (C₁-C₆),

R⁴ representa (d8) un grupo haloalquilo (C₁-C₆),
 cada uno de A, A² y A³ representa un átomo de nitrógeno,
 A¹ representa N-R⁵ (en donde R⁵ representa (e1) un grupo alquilo (C₁-C₆)),
 m representa 2 y
 n representa 1.

11. El compuesto heterocíclico condensado según la reivindicación 7 o una sal del mismo, en donde el compuesto heterocíclico condensado está representado por la fórmula general (1B):

[Quim. 5]



5

{en donde

R¹ representa

- 10 (a1) un grupo alquilo (C₁-C₆);
 (a2) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆);
 (a3) un grupo alquenilo (C₂-C₆); o
 (a4) un grupo alquinilo (C₂-C₆),

15 R² representa

- (b1) un átomo de hidrógeno;
 (b2) un grupo alquilo (C₁-C₆);
 (b3) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆); o
 20 (b5) un grupo amino,

R³ representa

- 25 (c1) un átomo de hidrógeno;
 (c2) un grupo alquilo (C₁-C₆);
 (c3) un grupo alquenilo (C₂-C₆);
 (c4) un grupo alquinilo (C₂-C₆);
 (c5) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆);
 (c6) un grupo cicloalquil (C₃-C₆)alquilo (C₁-C₆);
 30 (c7) un grupo alcoxi (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆);
 (c8) un grupo haloalquilo (C₁-C₆);
 (c9) un grupo haloalquenilo (C₂-C₆);
 (c10) un grupo haloalquinilo (C₂-C₆);
 (c11) un grupo fenilo;
 35 (c12) un grupo fenilo que tiene, en el anillo, de 1 a 5 grupos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan entre (a) un átomo de halógeno, (b) un grupo ciano, (c) un grupo nitro, (d) un grupo formilo, (e) un grupo alquilo (C₁-C₆), (f) un grupo haloalquilo (C₂-C₆), (g) un grupo alcoxi (C₁-C₆), (h) un grupo haloalcoxi (C₁-C₆), (i) un grupo cicloalquil (C₃-C₆)alcoxi (C₁-C₆), (j) un grupo alquiltio (C₁-C₆), (k) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆), (l) un grupo alquilsulfinilo (C₁-C₆), (m) un grupo haloalquilsulfinilo (C₁-C₆), (n) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆) y (o) un grupo haloalquilsulfonilo (C₁-C₆);
 40 (c13) un grupo fenilalquilo (C₁-C₆); o
 (c14) un grupo fenilalquilo (C₁-C₆) que tiene, en el anillo, de 1 a 5 grupos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan entre (a) un átomo de halógeno, (b) un grupo ciano, (c) un grupo nitro, (d) un grupo formilo, (e) un grupo alquilo (C₁-C₆), (f) un grupo haloalquilo (C₁-C₆), (g) un grupo alcoxi (C₁-C₆), (h) un grupo haloalcoxi (C₁-C₆),
 45 (i) un grupo cicloalquil (C₃-C₆)alcoxi (C₁-C₆), (j) un grupo alquiltio (C₁-C₆), (k) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆), (l) un grupo alquilsulfinilo (C₁-C₆), (m) un grupo haloalquilsulfinilo (C₁-C₆), (n) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆) y (o) un grupo haloalquilsulfonilo (C₁-C₆),

50 R⁴ representa

- (d1) un átomo de halógeno;
 (d2) un grupo ciano;
 (d3) un grupo nitro;
 (d4) un grupo alquilo (C₁-C₆);
 5 (d5) un grupo alcoxi (C₁-C₆);
 (d6) un grupo alqueniloxi (C₂-C₆);
 (d7) un grupo alquiniloxi (C₂-C₆);
 (d8) un grupo haloalquilo (C₁-C₆);
 (d9) un grupo haloalcoxi (C₁-C₆);
 10 (d10) un grupo haloalqueniloxi (C₂-C₆);
 (d11) un grupo haloalquiniloxi (C₂-C₆);
 (d12) un grupo alquiltio (C₁-C₆);
 (d13) un grupo alquilsulfinilo (C₁-C₆);
 (d14) un grupo alquilsulfonilo (C₁-C₆);
 15 (d15) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆);
 (d16) un grupo haloalquilsulfinilo (C₁-C₆); o
 (d17) un grupo haloalquilsulfonilo (C₁-C₆),
- cada uno de A, A² y A³ representa CH o un átomo de nitrógeno,
 20 A¹ representa O, S o N-R⁵ (en donde R⁵ representa (e1) un grupo alquilo (C₁-C₆); (e2) un grupo cicloalquilo (C₃-C₆); (e3) un grupo alquenilo (C₂-C₆) o (e4) un grupo alquinilo (C₂-C₆)),
 m representa 0, 1 o 2 y
 n representa 0, 1 o 2}.
- 25 12. El compuesto heterocíclico condensado según la reivindicación 11 o una sal del mismo, en donde
- R¹ representa (a1) un grupo alquilo (C₁-C₆),
 R² representa
- 30 (b1) un átomo de hidrógeno; o
 (b2) un grupo alquilo (C₁-C₆),
- R³ representa
- 35 (c1) un átomo de hidrógeno;
 (c2) un grupo alquilo (C₁-C₆);
 (c3) un grupo alquenilo (C₂-C₆);
 (c7) un grupo alcoxi (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆);
 (c11) un grupo fenilo; o
 40 (c13) un grupo fenilalquilo (C₁-C₆),
- R⁴ representa
- 45 (d8) un grupo haloalquilo (C₁-C₆); o
 (d15) un grupo haloalquiltio (C₁-C₆),
- cada uno de A, A² y A³ representa un átomo de nitrógeno,
 A¹ representa N-R⁵ (en donde R⁵ representa (e1) un grupo alquilo (C₁-C₆)),
 m representa 0, 1 o 2 y
 50 n representa 1.
13. El compuesto heterocíclico condensado según la reivindicación 11 o 12 o una sal del mismo, en donde
- R¹ representa (a1) un grupo alquilo (C₁-C₆),
 55 R² representa
- (b1) un átomo de hidrógeno; o
 (b2) un grupo alquilo (C₁-C₆),
- 60 R³ representa
- (c1) un átomo de hidrógeno;
 (c2) un grupo alquilo (C₁-C₆);
 (c3) un grupo alquenilo (C₂-C₆);
 65 (c7) un grupo alcoxi (C₁-C₆)alquilo (C₁-C₆);
 (c11) un grupo fenilo; o

(c13) un grupo fenilalquilo (C₁-C₆),

R⁴ representa (d8) un grupo haloalquilo (C₁-C₆),
cada uno de A, A² y A³ representa un átomo de nitrógeno,

5 A¹ representa N-R⁵ (en donde R⁵ representa (e1) un grupo alquilo (C₁-C₆)),
m representa 2 y
n representa 1.

10 14. Un insecticida agrícola y hortícola que comprende el compuesto heterocíclico condensado según una cualquiera de las reivindicaciones 7 a 13 o una sal del mismo como principio activo.

15 15. Un método para usar un insecticida agrícola y hortícola, comprendiendo el método aplicar una cantidad eficaz del compuesto heterocíclico condensado según una cualquiera de las reivindicaciones 7 a 13 o una sal del mismo a las plantas o al suelo.

16. Un agente de control ectoparasitario animal que comprende una cantidad eficaz del compuesto heterocíclico condensado según una cualquiera de las reivindicaciones 7 a 13 o una sal del mismo como principio activo.