

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 965 527**

51 Int. Cl.:

C07D 401/14 (2006.01)
C07D 405/14 (2006.01)
C07D 403/04 (2006.01)
C07D 409/14 (2006.01)
A61K 31/506 (2006.01)
A01N 43/653 (2006.01)
C07D 403/14 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **15.04.2019** **E 22154568 (4)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **23.08.2023** **EP 4039682**

54 Título: **Compuestos heteroarilo-triazol y heteroarilo-tetrazol novedosos como plaguicidas**

30 Prioridad:

17.04.2018 EP 18167825
31.07.2018 EP 18186592

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la
traducción de la patente:
15.04.2024

73 Titular/es:

BAYER AKTIENGESELLSCHAFT (100.0%)
Kaiser-Wilhelm-Allee 1
51373 Leverkusen, DE

72 Inventor/es:

ARLT, ALEXANDER;
HALLENBACH, WERNER;
SCHWARZ, HANS-GEORG;
FÜSSLEIN, MARTIN;
WROBLOWSKY, HEINZ-JUERGEN;
LINKA, MARC;
GÖRGENS, ULRICH;
ILG, KERSTIN;
EBBINGHAUS-KINTSCHER, ULRICH;
CANCHO-GRANDE, YOLANDA;
DAMIJONAITIS, ARUNAS JONAS;
EILMUS, SASCHA;
TURBERG, ANDREAS y
HEISLER, IRING

74 Agente/Representante:

GONZÁLEZ PECES, Gustavo Adolfo

ES 2 965 527 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

Compuestos heteroarilo-triazol y heteroarilo-tetrazol novedosos como plaguicidas

La presente invención se refiere a compuestos heteroarilo-triazol y heteroarilo-tetrazol novedosos, a formulaciones y composiciones que comprenden tales compuestos y a su uso en el control de plagas animales que incluyen artrópodos e insectos para la protección de plantas y a su uso para el control de ectoparásitos en animales.

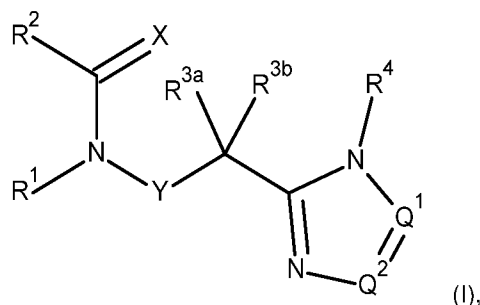
No se reivindican procedimientos de tratamiento del cuerpo animal *per se*.

Los compuestos de heteroarilo-triazol y heteroarilo-tetrazol de fórmula I (R^{3a} = alquilo C_1 - C_3 o haloalquilo C_1 - C_3 , R^{3b} = hidrógeno) se describen para el uso para controlar ectoparásitos en animales en WO 2017/192385.

Los productos de protección de plantas y ectoparasiticidas veterinarios modernos deben satisfacer varias demandas, por ejemplo con relación a las propiedades de eficiencia, persistencia, espectro y rotura de resistencia. Las cuestiones de toxicidad, la combinabilidad con otros compuestos activos o auxiliares de formulación juegan un papel, así como también el tema del gasto que requiere la síntesis de un compuesto activo. Por otra parte, pueden producirse resistencias. Por todas estas razones, la búsqueda de composiciones novedosas para la protección de cultivos o ectoparasiticidas veterinarios no puede ser considerada como completa, y hay una necesidad constante de nuevos compuestos con propiedades que, en comparación con los compuestos conocidos, se mejoran al menos en relación con los aspectos individuales.

Un objeto de la presente invención fue proporcionar compuestos que amplíen el espectro de los pesticidas en varios aspectos.

La presente invención proporciona por lo tanto compuestos de la fórmula general (I)



en cuya (Configuración 5-2):

X es O;

Q^1 es N

Q^2 es CR^5 o N;

Y es un enlace directo;

R^1 es, metoxi o etoxi;

R^2 es 3-cloro-5-trifluorometil-fenilo, 3-trifluorometil-fenilo, 3,5-bis(trifluorometil)-fenilo, 3,5-dicloro-fenilo, 3-cloro-fenilo, 3-cloro-5-metilsulfonyl-fenilo, 3-cloro-5-(pentafluoro- λ^6 -tio)-fenilo, 3-fluoro-5-ciclopropil-fenilo, 3-cloro-5-ciclopropil-fenilo, 5-metilsulfonyl-piridin-3-ilo, 2-cloro-tien-4-ilo;

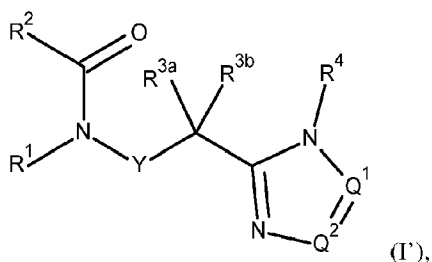
R^{3a} es metilo;

R^{3b} es hidrógeno;

R^4 es pirimidin-2-ilo, 5-ciano-piridin-2-ilo;

R^5 es hidrógeno.

En otra realización preferida adicional, la invención se refiere a compuestos de fórmula (I')



en la que los elementos estructurales Y, Q¹, Q², R¹, R², R^{3a}, R^{3b}, R⁴ y R⁵ tienen el significado dado en la Configuración (5-2).

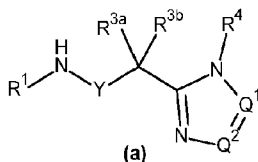
- 5 En otras realizaciones preferidas adicionales de los compuestos de fórmula (I'), Q¹ representa N y Q² representa CR⁵ y todos los demás elementos estructurales Y, R¹, R², R^{3a}, R^{3b}, R⁴ y R⁵ tienen el significado descrito anteriormente en la Configuración (5-2).

Entre ellas, se da especial preferencia a las configuraciones que se muestran a continuación:

Compuestos de la fórmula	con según Q ¹	con según Q ²	todos los demás elementos estructurales según
I'	N	CR ⁵	Configuración (5-2)
I'	N	N	Configuración (5-2)

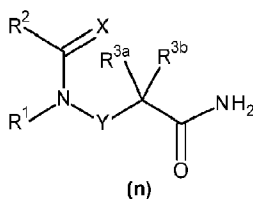
- 10 Según un aspecto adicional, la presente invención cubre compuestos intermedios que son útiles para la preparación de los compuestos de fórmula general (I), *supra*.

En particular, la invención cubre los compuestos intermedios de fórmula general (a):



en la que los elementos estructurales Y, Q¹, Q², R¹, R^{3a}, R^{3b}, R⁴ y R⁵ tienen el significado dado en la Configuración (5-2).

- 15 En particular, la invención cubre los compuestos intermedios de fórmula general (n):



en la que los elementos estructurales Y, R¹, R², R^{3a} y R^{3b} tienen el significado dado en la Configuración (5-2).

- 20 Los compuestos de la fórmula (I) pueden posiblemente también, según la naturaleza de los sustituyentes, estar en forma de estereoisómeros, es decir en forma de isómeros geométricos y/u ópticos o mezclas de isómeros de diversa composición. Esta invención provee los estereoisómeros puros y cualesquiera mezclas deseadas de estos isómeros, aunque generalmente solo se describen en la presente compuestos de la fórmula (I).

Sin embargo, se da preferencia de acuerdo con la invención a usar las formas estereoisoméricas ópticamente activas de los compuestos de la fórmula (I) y sales de estos.

- 25 La invención por ende se refiere a los enantiómeros y diastereómeros puros y a mezclas de estos para controlar plagas animales, que incluye artrópodos y particularmente insectos.

De ser apropiado, los compuestos de la fórmula (I) pueden estar presentes en varias formas polimórficas o como una mezcla de diferentes formas polimórficas. Tanto los polimorfos puros como las mezclas de polimorfos se proporcionan por la invención y se pueden usar de acuerdo con la invención.

Definiciones

- 5 El experto en la técnica es consciente de que, si no se menciona explícitamente, las expresiones "uno" o "una" como se usan en la presente solicitud pueden, dependiendo de la situación, significar "uno (1)", "uno (1) o más" o "al menos uno (1)",

Para todas las estructuras descritas en la presente, como grupos y sistemas de anillo, los átomos adyacentes no deben ser -O-O u -O-S-.

- 10 Las estructuras con una cantidad variable de átomos de carbono posibles (átomos de C) pueden referirse en la presente solicitud como estructuras $C_{\text{límite inferior de átomos de carbono}}-C_{\text{límite superior de átomos de carbono}}$ (estructuras $C_{LL}-C_{UL}$), para estipularse de forma más específica. Por ejemplo: un grupo alquilo puede estar formado por 3 a 10 átomos de carbono y en ese caso corresponde a alquilo- C_3-C_{10} . Las estructuras de anillo compuestas de átomos y heteroátomos de carbono pueden denominarse estructuras de "LL a UL miembros". Un ejemplo de una estructura de anillo de 6 miembros es tolueno (una estructura de anillo de 6 miembros sustituida por un grupo metilo).

- 15 Si un término colectivo para un sustituyente, por ejemplo alquilo $C_{LL}-C_{UL}$ se encuentra al final de un sustituyente compuesto, por ejemplo cicloalquilo $C_{LL}-C_{UL}$ -alquilo $C_{LL}-C_{UL}$, el constituyente al comienzo del sustituyente compuesto, por ejemplo el cicloalquilo $C_{LL}-C_{UL}$ puede estar mono o polisustituido de forma idéntica o diferente e independiente del último sustituyente, por ejemplo alquilo $C_{LL}-C_{UL}$. Todos los términos colectivos que se usan en la presente solicitud para los grupos químicos, sistemas cíclicos y grupos cíclicos pueden estipularse más específicamente a través de la adición de " $C_{LL}-C_{UL}$ " o de "LL a UL miembros".

- 20 En las definiciones de los símbolos que se proporcionan en las fórmulas anteriores, se usaron los términos colectivos que representan generalmente los siguientes sustituyentes:

- 25 Halógeno se refiere a elementos del 7mo grupo principal, preferentemente flúor, cloro, bromo y yodo, más preferentemente flúor, cloro y bromo e incluso más preferentemente flúor y cloro.

Los ejemplos de heteroátomo son N, O, S, P, B, Si. Preferentemente, el término "heteroátomo" se refiere a N, S y O.

- 30 De acuerdo con la invención, "alquilo" - por sí solo o como parte de un grupo químico- representa hidrocarburos de cadena recta o ramificada que preferentemente tienen 1 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, s-butilo, t-butilo, pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 1,2-dimetilpropilo, 1,1-dimetilpropilo, 2,2-dimetilpropilo, 1-etilpropilo, hexilo, 1-metilpentilo, 2-metilpentilo, 3-metilpentilo, 4-metilpentilo, 1,2-dimetilpropilo, 1,3-dimetilbutilo, 1,4-dimetilbutilo, 2,3-dimetilbutilo, 1,1-dimetilbutilo, 2,2-dimetilbutilo, 3,3-dimetilbutilo, 1,1,2-trimetilpropilo, 1,2,2-trimetilpropilo, 1-etilbutilo y 2-etilbutilo. También se da preferencia a alquilos que tienen de 1 a 4 átomos de carbono, como, entre otros, metilo, etilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo o t-butilo. Los alquilos de la invención pueden estar sustituidos por uno o más radicales idénticos o diferentes.

- 35 De acuerdo con la invención, "alqueno" - por sí solo o como parte de un grupo químico - representa hidrocarburos de cadena recta o ramificada, preferentemente con 2 a 6 átomos de carbono y al menos un enlace doble, por ejemplo, vinilo, 2-propenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-2-propenilo, 2-metil-2-propenilo, 2-pentenilo, 3-pentenilo, 4-pentenilo, 1-metil-2-butenilo, 2-metil-2-butenilo, 3-metil-2-butenilo, 1-metil-3-butenilo, 2-metil-3-butenilo, 3-metil-3-butenilo, 1,1-dimetil-2-propenilo, 1,2-dimetil-2-propenilo, 1-etil-2-propenilo, 2-hexenilo, 3-hexenilo, 4-hexenilo, 5-hexenilo, 1-metil-2-pentenilo, 2-metil-2-pentenilo, 3-metil-2-pentenilo, 4-metil-2-pentenilo, 3-metil-3-pentenilo, 4-metil-3-pentenilo, 1-metil-4-pentenilo, 2-metil-4-pentenilo, 3-metil-4-pentenilo, 4-metil-4-pentenilo, 1,1-dimetil-2-butenilo, 1,1-dimetil-3-butenilo, 1,2-dimetil-2-butenilo, 1,2-dimetil-3-butenilo, 1,3-dimetil-2-butenilo, 2,2-dimetil-3-butenilo, 2,3-dimetil-2-butenilo, 2,3-dimetil-3-butenilo, 1-etil-2-butenilo, 1-etil-3-butenilo, 2-etil-2-butenilo, 2-etil-3-butenilo, 1,1,2-trimetil-2-propenilo, 1-etil-1-metil-2-propenilo y 1-etil-2-metil-2-propenilo. También se da preferencia a alquenos que tienen de 2 a 4 átomos de carbono como, entre otros, 2-propenilo, 2-butenilo o 1-metil-2-propenilo. Los alquenos de la invención pueden estar sustituidos por uno o más radicales idénticos o diferentes.

- 40 De acuerdo con la invención, "alquino" -por sí solo o como parte de un grupo químico - representa hidrocarburos de cadena recta o ramificada, que tiene preferentemente de 2 a 6 átomos de carbono y al menos un enlace triple, por ejemplo, 2-propinilo, 2-butinilo, 3-butinilo, 1-metil-2-propinilo, 2-pentinilo, 3-pentinilo, 4-pentinilo, 1-metil-3-butinilo, 2-metil-3-butinilo, 1-metil-2-butinilo, 1,1-dimetil-2-propinilo, 1-etil-2-propinilo, 2-hexinilo, 3-hexinilo, 4-hexinilo, 5-hexinilo, 1-metil-2-pentinilo, 1-metil-3-pentinilo, 1-metil-4-pentinilo, 2-metil-3-pentinilo, 2-metil-4-pentinilo, 3-metil-4-pentinilo, 4-metil-2-pentinilo, 1,1-dimetil-3-butinilo, 1,2-dimetil-3-butinilo, 2,2-dimetil-3-butinilo, 1-etil-3-butinilo, 2-etil-3-butinilo, 1-etil-1-metil-2-propinilo y 2,5-hexadiinilo. También se da preferencia a los alquinos que tienen de 2 a 4 átomos de carbono como, entre otros, etinilo, 2-propinilo o 2-butinilo-2-propenilo. Los alquinos de la invención pueden estar sustituidos por uno o más radicales idénticos o diferentes.

- De acuerdo con la invención, "cicloalquilo" – por sí solo o como parte de un grupo químico - representa hidrocarburos mono, bi o tricíclicos que tienen preferentemente de 3 a 10 carbonos, por ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo, ciclooctilo, biciclo[2.2.1]heptilo, biciclo[2.2.2]octilo o adamantilo. También se da preferencia a los cicloalquilos que tienen 3, 4, 5, 6, o 7 átomos de carbono como, entre otros, ciclopropilo o ciclobutilo. Los cicloalquilos de la invención pueden estar sustituidos por uno o más radicales idénticos o diferentes.
- De acuerdo con la invención, "alquilocicloalquilo" representa alquilocicloalquilo mono, bi o tricíclico que tiene preferentemente de 4 a 10 o de 4 a 7 átomos de carbono, por ejemplo, metilciclopropilo, etilciclopropilo, isopropilciclobutilo, 3-metilciclopentilo y 4-metilciclohexilo. También se da preferencia a los alquilocicloalquilos que tienen 4, 5, o 7 átomos de carbono como, entre otros, etilciclopropilo o 4-metilciclohexilo. Los alquilocicloalquilos de la invención pueden estar sustituidos por uno o más radicales idénticos o diferentes.
- De acuerdo con la invención, "cicloalquilalquilo" representa cicloalquilalquilo mono, bi o tricíclico que tiene preferentemente de 4 a 10 o de 4 a 7 átomos de carbono, por ejemplo, ciclopropilmetilo, ciclobutilmetilo, ciclopentilmetilo, ciclohexilmetilo y ciclopentiletilo. También se da preferencia a cicloalquilalquilos que tienen 4, 5, o 7 átomos de carbono como, entre otros, ciclopropilmetilo o ciclobutilmetilo. Los cicloalquilalquilos de la invención pueden estar sustituidos por uno o más radicales idénticos o diferentes.
- De acuerdo con la invención, "hidroxialquilo" representa un alcohol de cadena recta o ramificada, que tiene preferentemente de 1 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, metanol, etanol, n-propanol, isopropanol, n-butanol, isobutanol, s-butanol y t-butanol. También se le da preferencia a grupos hidroxialquilo que tienen de 1 a 4 átomos de carbono. Los grupos hidroxialquilos de la invención pueden estar sustituidos por uno o más radicales idénticos o diferentes.
- De acuerdo con la invención, "alcoxi" representa un O-alquilo de cadena recta o ramificada, que tiene preferentemente de 1 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, metoxi, etoxi, n-propoxi, isopropoxi, n-butoxi, isobutoxi, s-butoxi y t-butoxi. También se le da preferencia a grupos alcoxi que tienen de 1 a 4 átomos de carbono. Los grupos alcoxi de la invención pueden estar sustituidos por uno o más radicales idénticos o diferentes.
- De acuerdo con la invención, "alquiltio" o "alquilsulfanilo" representa S-alquilo de cadena recta o ramificada, preferentemente con 1 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, metiltio, etiltio, n-propiltio, isopropiltio, n-butiltio, isobutiltio, s-butiltio y t-butiltio. También se le da preferencia a grupos alquiltio que tienen de 1 a 4 átomos de carbono. Los grupos alquiltio de la invención pueden estar sustituidos por uno o más radicales idénticos o diferentes.
- De acuerdo con la invención, "alquilsulfínilo" representa alquilsulfínilo de cadena recta o ramificada, preferentemente con 1 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, metilsulfínilo, etilsulfínilo, n-propilsulfínilo, isopropsulfínilo, n-butilsulfínilo, isobutilsulfínilo, s-butilsulfínilo y t-butilsulfínilo. También se le da preferencia a los grupos alquilsulfínilo que tienen de 1 a 4 átomos de carbono. Los grupos alquilsulfínilo de la invención pueden estar sustituidos por uno o más radicales idénticos o diferentes y abarcan ambos enantiómeros.
- De acuerdo con la invención, "alquilsulfonilo" representa alquilsulfonilo de cadena recta o ramificada, preferentemente con 1 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n-propilsulfonilo, isopropsulfonilo, n-butilsulfonilo, isobutilsulfonilo, s-butilsulfonilo y t-butilsulfonilo. También se le da preferencia a los grupos alquilsulfonilo que tienen de 1 a 4 átomos de carbono. Los grupos alquilsulfonilo de la invención pueden estar sustituidos por uno o más radicales idénticos o diferentes.
- De acuerdo con la invención, "cicloalquiltio" o "cicloalquilsulfanilo" representa -S-cicloalquilo que tiene preferentemente 3 a 6 átomos de carbono, por ejemplo ciclopropiltio, ciclobutiltio, ciclopentiltio, ciclohexiltio. También se le da preferencia a los grupos cicloalquiltio que tienen de 3 a 5 átomos de carbono. Los grupos cicloalquiltio de la invención pueden estar sustituidos por uno o más radicales idénticos o diferentes.
- De acuerdo con la invención, "cicloalquilsulfínilo" representa -S(O)-cicloalquilo que tiene preferentemente 3 a 6 átomos de carbono, por ejemplo ciclopropilsulfínilo, ciclobutilsulfínilo, ciclopentilsulfínilo, ciclohexilsulfínilo. También se le da preferencia a los grupos cicloalquilsulfínilo que tienen de 3 a 5 átomos de carbono. Los grupos cicloalquilsulfínilo de la invención pueden estar sustituidos por uno o más radicales idénticos o diferentes y abarcan ambos enantiómeros.
- De acuerdo con la invención, "cicloalquilsulfonilo" representa -SO₂-cicloalquilo que tiene preferentemente 3 a 6 átomos de carbono, por ejemplo ciclopropilsulfonilo, ciclobutilsulfonilo, ciclopentilsulfonilo, ciclohexilsulfonilo. También se le da preferencia a los grupos cicloalquilsulfonilo que tienen de 3 a 5 átomos de carbono. Los grupos cicloalquilsulfonilo de la invención pueden estar sustituidos por uno o más radicales idénticos o diferentes.
- De acuerdo con la invención, "feniltio", o "fenilsulfanilo" representa -S-fenilo, por ejemplo feniltio. Los grupos feniltio de la invención pueden estar sustituidos por uno o más radicales idénticos o diferentes.
- De acuerdo con la invención, "fenilsulfínilo" representa -S(O)-fenilo, por ejemplo fenilsulfínilo. Los grupos fenilsulfínilo de la invención pueden estar sustituidos por uno o más radicales idénticos o diferentes y abarcan ambos enantiómeros.

De acuerdo con la invención, "fenilsulfonilo" representa -SO₂-fenilo por ejemplo fenilsulfonilo. Los grupos fenilsulfonilo de la invención pueden estar sustituidos por uno o más radicales idénticos o diferentes.

De acuerdo con la invención "alquilcarbonilo" representa alquilo-C(=O) de cadena recta o ramificada, que tienen preferentemente 2 a 7 átomos de carbono como metilcarbonilo, etilcarbonilo, n-propilcarbonilo, isopropilcarbonilo, s-butilcarbonilo y t-butilcarbonilo. También se le da preferencia a los alquilcarbonilos que tienen de 1 a 4 átomos de carbono. Los alquilcarbonilos de la invención pueden estar sustituidos por uno o más radicales idénticos o diferentes.

De acuerdo con la invención, "alcoxycarbonilo", por sí solo o como constituyente de un grupo químico, representa alcoxycarbonilo de cadena recta o ramificada, preferentemente con 1 a 6 átomos de carbono o con 1 a 4 átomos de carbono en el resto alcoxi, por ejemplo, metoxycarbonilo, etoxycarbonilo, n-propoxycarbonilo, isopropoxycarbonilo, s-butoxycarbonilo y t-butoxycarbonilo. Los grupos alcoxycarbonilo de la invención pueden estar sustituidos por uno o más radicales idénticos o diferentes.

De acuerdo con la invención, "alquilaminocarbonilo" representan alquilaminocarbonilo de cadena recta o ramificada que tiene preferentemente de 1 a 6 átomos de carbono o 1 a 4 átomos de carbono en el resto alquilo, por ejemplo, metilaminocarbonilo, etilaminocarbonilo, n-propilaminocarbonilo, isopropilaminocarbonilo, s-butilaminocarbonilo y t-butilaminocarbonilo. Los grupos alquilaminocarbonilo de la invención pueden estar sustituidos por uno o más radicales idénticos o diferentes.

De acuerdo con la invención "*N,N*-dialquilaminocarbonilo" representa *N,N*-dialquilaminocarbonilo de cadena recta o ramificada que tiene preferentemente de 1 a 6 átomos de carbono o de 1 a 4 átomos de carbono en el resto alquilo, por ejemplo, *N,N*-dimetilaminocarbonilo, *N,N*-dietilaminocarbonilo, *N,N*-di(n-propilamino)carbonilo, *N,N*-di(isopropilamino)carbonilo y *N,N*-di(s-butilamino)carbonilo. Los grupos *N,N*-dialquilaminocarbonilo de la invención pueden estar sustituidos por uno o más radicales idénticos o diferentes.

De acuerdo con la invención, "arilo" representa un sistema aromático mono, bi o policíclico que tiene preferentemente de 6 a 14, especialmente de 6 a 10 átomos de carbono de anillo, por ejemplo, fenilo, naftilo, antrilo, fenantrenilo, preferentemente fenilo. Además, arilo también representa sistemas policíclicos como tetrahidronaftilo, indenilo, indanilo, fluorenilo, bifenilo, donde el sitio de enlace se encuentra en el sistema aromático. Los grupos arilo de la invención pueden estar sustituidos por uno o más radicales idénticos o diferentes.

Ejemplos de arilos sustituidos son los arilalquilos, que de la misma forma pueden estar sustituidos por uno o más radicales idénticos o diferentes en el resto alquiloC₁-C₄ y/o ariloC₆-C₁₄. Ejemplos de tales arilalquilos incluyen bencilo y fenil-1-etilo.

De acuerdo con la invención, "heterociclo", "anillo heterocíclico" o "sistema de anillo heterocíclico" representa un sistema de anillo carbocíclico con al menos un anillo donde al menos un átomo de carbono se reemplaza por un heteroátomo, preferentemente por un heteroátomo del grupo que consiste en N, O, S, P, B, Si, Se y que es saturado, insaturado o heteroaromático y puede estar insustituido o sustituido, donde el sitio de enlace es sobre un átomo de anillo. A menos que se defina de forma diferente, el anillo heterocíclico contiene preferentemente de 3 a 9 átomos de anillo, especialmente de 3 a 6 átomos de anillo, y uno o más, preferentemente de 1 a 4, especialmente 1, 2, o 3 heteroátomos en el anillo heterocíclico, preferentemente del grupo que consiste en N, O y S, aunque no debe haber adyacentes directamente dos átomos de oxígeno. Los anillos heterocíclicos en general contienen no más de 4 átomos de nitrógeno y/o no más de 2 átomos de oxígeno y/o no más de 2 átomos de azufre. Cuando el radical heterocíclico o el anillo heterocíclico está opcionalmente sustituido, se puede fusionar a otros anillos carbocíclicos o heterocíclicos. En el caso de heterocíclico opcionalmente sustituido, la invención también comprende sistemas policíclicos, por ejemplo, 8-azabicyclo[3.2.1]octanilo o 1-azabicyclo[2.2.1]heptilo. En el caso de heterocíclico opcionalmente sustituido, la invención también comprende sistemas espirocíclicos, por ejemplo, 1-oxa-5-azaspiro[2.3]hexilo.

Los grupos heterocíclicos de la invención son, por ejemplo, piperidinilo, piperazinilo, morfolinilo, tiomorfolinilo, dihidropiraniilo, tetrahidropiraniilo, dioxaniilo, pirrolinilo, pirrolidinilo, imidazolinilo, imidazolidinilo, tiazolidinilo, oxazolidinilo, dioxolanilo, dioxolilo, pirazolidinilo, tetrahidrofuranilo, dihidrofuranilo, oxetanilo, oxiranilo, azetidino, aziridinilo, oxazetidino, oxaziridinilo, oxazepanilo, oxazinanilo, azepanilo, oxopirrolidinilo, dioxopirrolidinilo, oxomorfolinilo, oxopiperazinilo y oxepanilo.

Son de particular importancia los heteroarilos, es decir, los sistemas heteroaromáticos. De acuerdo con la invención, el término heteroarilo representa compuestos heteroaromáticos, es decir, compuestos heterocíclicos aromáticos completamente insaturados comprendidos en la definición anterior de heterociclos. Se da preferencia a los anillos de 5 a 7 miembros con 1 a 3, preferentemente 1 o 2, heteroátomos idénticos o diferentes del grupo anterior. Los heteroarilos de la invención son, por ejemplo, urilo, tienilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3- y 1,2,4-triazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 1,2,3-, 1,3,4-, 1,2,4- y 1,2,5-oxadiazolilo, azepinilo, pirrolilo, piridilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, 1,3,5-, 1,2,4- y 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-, 1,3,2-, 1,3,6- y 1,2,6-oxazinilo, oxepinilo, tiepinilo, 1,2,4-triazolonilo y 1,2,4-diazepinilo. Los grupos heteroarilo de la invención pueden estar sustituidos por uno o más radicales idénticos o diferentes.

El término "en cada caso opcionalmente sustituido" significa que un grupo/sustituyente, como radical alquilo, alqueno, alquino, alcoxi, alquiltio, alquilsulfino, alquilsulfonilo, cicloalquilo, arilo, fenilo, bencilo, heterocíclico y heteroarilo, está sustituido, lo que significa, por ejemplo, un radical sustituido que deriva de la estructura base insustituída, donde los sustituyentes, por ejemplo, un (1) sustituyente o múltiples sustituyentes, preferentemente 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7, se seleccionan de un grupo que consiste en amino, hidroxilo, halógeno, nitro, ciano, isociano, mercapto, isotiocianato, carboxilo_{C1-C4}, carbonamida, SF₅, aminosulfonilo, alquilo_{C1-C4}, haloalquilo_{C1-C4}, cicloalquilo_{C3-C4}, alqueno_{C2-C4}, cicloalqueno_{C5-C6}, alquino_{C2-C4}, *N*-mono-alquilamino_{C1-C4}, *N,N*-di-alquilamino_{C1-C4}, *N*-alcanoilamino_{C1-C4}, alcoxi_{C1-C4}, haloalcoxi_{C1-C4}, alquenoiloxi_{C2-C4}, alquinoiloxi_{C2-C4}, cicloalcoxi_{C3-C4}, cicloalquenoiloxi_{C5-C6}, alcoxycarbonilo_{C1-C4}, alquenoiloxycarbonilo_{C2-C4}, alquinoiloxycarbonilo_{C2-C4}, ariloxycarbonilo_{C6}, -C₁₀, -C₁₄, alcanoilo_{C1-C4}, alquenoilcarbonilo_{C2-C4}, alquinoilcarbonilo_{C2-C4}, arilcarbonilo_{C6}, -C₁₀, -C₁₄, alquiltio_{C1-C4}, haloalquiltio_{C1-C4}, cicloalquiltio_{C3-C4}, alquenoiltio_{C2-C4}, cicloalquenoiltio_{C5-C6}, alquinoiltio_{C2-C4}, alquilsulfino_{C1-C4}, que incluye ambos enantiómeros del grupo alquilsulfino_{C1-C4}, haloalquilsulfino_{C1-C4}, que incluye ambos enantiómeros del grupo haloalquilsulfino_{C1-C4}, alquilsulfonilo_{C1-C4}, haloalquilsulfonilo_{C1-C4}, *N*-mono-alquilaminosulfonilo_{C1-C4}, *N,N*-di-alquilaminosulfonilo_{C1-C4}, alquilsulfonilo_{C1-C4}, alquilsulfonilo_{C1-C4}, que incluye ambos enantiómeros de alquilsulfonilo_{C1-C4} y alquilsulfonilo_{C1-C4}, *N*-alquilaminocarbonilo_{C1-C4}, *N,N*-di-alquilaminocarbonilo_{C1-C4}, *N*-alcanoilaminocarbonilo_{C1-C4}, *N*-alcanoilo_{C1-C4}-*N*-alquilaminocarbonilo_{C1-C4}, arilo_{C6}, -C₁₀, -C₁₄, ariloxi_{C6}, -C₁₀, -C₁₄, bencilo, benciloxi, benciltio, ariltio_{C6}, -C₁₀, -C₁₄, arilamino_{C6}, -C₁₀, -C₁₄, bencilamino, heterocíclico y trialkilsililo, sustituyentes enlazados por un enlace doble, como alquilideno_{C1-C4} (p. ej. metilideno o etilideno), un grupo oxo, un grupo imino y un grupo imino sustituido. Cuando dos o más radicales forman uno o más anillos, estos pueden ser carbocíclicos, heterocíclicos, saturados, parcialmente saturados, insaturados, por ejemplo incluyendo anillos aromáticos y con sustitución adicional. Los sustituyentes mencionados a modo de ejemplo ("primer nivel de sustituyente") pueden, si contienen componentes hidrocarbonáceos, tener opcionalmente sustitución adicional allí ("segundo nivel de sustituyente"), por ejemplo por uno o más de los sustituyentes, cada uno independientemente seleccionado de halógeno, hidroxilo, amino, nitro, ciano, isociano, azido, acilamino, un grupo oxo y un grupo imino. El término grupo "(opcionalmente) sustituido" abarca preferentemente solo uno o dos niveles de sustituyentes.

Los grupos químicos sustituidos por halógeno o grupos halogenados de la invención (por ejemplo alquilo o alcoxi) están mono o polisustituidos por halógeno hasta la máxima cantidad posible de sustituyentes. Tales grupos también se denominan grupos halo (por ejemplo, haloalquilo). En el caso de polisustitución por halógeno, los átomos de halógeno pueden ser iguales o diferentes y todos pueden estar unidos a un átomo de carbono o pueden estar unidos a múltiples átomos de carbono. Halógeno es especialmente flúor, cloro, bromo o yodo, preferentemente flúor, cloro o bromo y más preferentemente flúor. Más particularmente, los grupos sustituidos por halógeno son monohalocicloalquilo, como, 1-fluorociclopropilo, 2-fluorociclopropilo o 1-fluorociclobutilo, monohaloalquilo como 2-cloroetilo, 2-fluoroetilo, 1-cloroetilo, 1-fluoroetilo, clorometilo, o fluorometilo; perhaloalquilo como triclorometilo o trifluorometilo o CF₂CF₃, polihaloalquilo como difluorometilo, 2-fluoro-2-cloroetilo, diclorometilo, 1,1,2,2-tetrafluoroetilo o 2,2,2-trifluoroetilo. Ejemplos adicionales de haloalquilos son triclorometilo, clorodifluorometilo, diclorofluorometilo, clorometilo, bromometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, pentafluoroetilo, 3,3,3-trifluoropropilo y pentafluoro-*t*-butilo. Se da preferencia a haloalquilos que tienen 1 a 4 átomos de carbono y 1 a 9, preferentemente 1 a 5, átomos de halógeno idénticos o diferentes seleccionados de flúor, cloro y bromo. Se da particular preferencia a haloalquilos con 1 o 2 átomos de carbono y 1 a 5 átomos de halógeno idénticos o diferentes seleccionados de flúor y cloro, como, entre otros, difluorometilo, trifluorometilo o 2,2-difluoroetilo. Ejemplos adicionales de compuestos sustituidos por halógeno son haloalcoxi como OCF₃, OCHF₂, OCH₂F, OCF₂CF₃, OCH₂CF₃, OCH₂CHF₂ y OCH₂CH₂Cl, haloalquilsulfonilos como difluorometiltio, trifluorometiltio, triclorometiltio, clorodifluorometiltio, 1-fluoroetiltio, 2-fluoroetiltio, 2,2-difluoroetiltio, 1,1,2,2-tetrafluoroetiltio, 2,2,2-trifluoroetiltio o 2-cloro-1,1,2-trifluoroetiltio, haloalquilsulfonilos como difluorometilsulfino, trifluorometilsulfino, triclorometilsulfino, clorodifluorometilsulfino, 1-fluoroetilsulfino, 2-fluoroetilsulfino, 2,2-difluoroetilsulfino, 1,1,2,2-tetrafluoroetilsulfino, 2,2,2-trifluoroetilsulfino y 2-cloro-1,1,2-trifluoroetilsulfino, haloalquilsulfonilos como difluorometilsulfino, trifluorometilsulfino, triclorometilsulfino, clorodifluorometilsulfino, 1-fluoroetilsulfino, 2-fluoroetilsulfino, 2,2-difluoroetilsulfino, 1,1,2,2-tetrafluoroetilsulfino, 2,2,2-trifluoroetilsulfino y 2-cloro-1,1,2-trifluoroetilsulfino, grupos haloalquilsulfonilo como difluorometilsulfonilo, trifluorometilsulfonilo, triclorometilsulfonilo, clorodifluorometilsulfonilo, 1-fluoroetilsulfonilo, 2-fluoroetilsulfonilo, 2,2-difluoroetilsulfonilo, 1,1,2,2-tetrafluoroetilsulfonilo, 2,2,2-trifluoroetilsulfonilo y 2-cloro-1,1,2-trifluoroetilsulfonilo.

En el caso de radicales con átomos de carbono, se da preferencia a los que tienen 1 a 4 átomos de carbono, especialmente 1 o 2 átomos de carbono. En general se da preferencia a sustituyentes del grupo de halógeno, por ejemplo, flúor y cloro, alquilo-(C_{1-C4}), preferentemente metilo o etilo, haloalquilo-(C_{1-C4}), preferentemente trifluorometilo, alcoxi-(C_{1-C4}), preferentemente metoxi o etoxi, haloalcoxi-(C_{1-C4}), nitro y ciano. Se da aquí particular preferencia a los sustituyentes metilo, metoxi, flúor y cloro.

Amino sustituido, como amino mono o disustituido, significa un radical del grupo de los radicales amino sustituidos que están *N*-sustituidos, por ejemplo, por uno o más radicales idénticos o diferentes del grupo de alquilo, hidroxilo, amino, alcoxi, acilo y arilo; preferentemente *N*-mono- y *N,N*-dialquilamino, (por ejemplo metilamino, etilamino, *N,N*-dimetilamino, *N,N*-dietilamino, *N,N*-di-*n*-propilamino, *N,N*-diisopropilamino o *N,N*-dibutilamino), grupos *N*-mono- o *N,N*-dialcoxialquilamino (por ejemplo *N*-metoximetilamino, *N*-metoxietilamino, *N,N*-di(metoximetil)amino o *N,N*-di(metoxietil)amino), *N*-mono- y *N,N*-diarilamino, como anilinas opcionalmente sustituidas, acilamino, *N,N*-diacilamino,

N-alquil-*N*-arilamino, *N*-alquil-*N*-acilamino y también *N*-heterociclos saturados; se da preferencia aquí a los radicales alquilo que tienen de 1 a 4 átomos de carbono; aquí arilo es preferentemente fenilo o fenilo sustituido; para acilo, corresponde la definición provista a continuación, preferentemente alcanilo-(C₁-C₄). Lo mismo se aplica a hidrazino o hidroxilamino sustituido.

- 5 Amino sustituido también incluye compuestos de amonio cuaternario (sales) con cuatro sustituyentes orgánicos en el átomo de nitrógeno.

10 Fenilo opcionalmente sustituido es preferentemente fenilo que está insustituido o mono o polisustituido, preferentemente hasta trisustituido, por radicales idénticos o diferentes del grupo de halógeno alquilo(C₁-C₄), alcoxi(C₁-C₄), alcoxi(C₁-C₄)-alcoxi(C₁-C₄), alcoxi(C₁-C₄)-alquilo(C₁-C₄), haloalquilo(C₁-C₄), haloalcoxi(C₁-C₄), alquiltio(C₁-C₄), haloalquiltio(C₁-C₄), alquilsulfinilo(C₁-C₄) haloalquilsulfinilo(C₁-C₄), alquilsulfonilo(C₁-C₄) haloalquilsulfonilo(C₁-C₄), ciano, isociano y nitro, por ejemplo *o*-, *m*- y *p*-tolilo, dimetilfenilos, 2-, 3- y 4-clorofenilo, 2-, 3- y 4-fluorofenilo, 2-, 3- y 4-trifluorometilo- y 4-triclorometilfenilo, 2,4-, 3,5-, 2,5- y 2,3-diclorofenilo, *o*-, *m*- y *p*-metoxifenilo, 4-heptafluorofenilo.

15 Cicloalquilo opcionalmente sustituido es preferentemente cicloalquilo que está insustituido o mono o polisustituido, preferentemente hasta trisustituido, por radicales idénticos o diferentes del grupo de halógeno, ciano, alquilo(C₁-C₄), alcoxi(C₁-C₄), alcoxi(C₁-C₄)-alcoxi(C₁-C₄), alcoxi(C₁-C₄)-alquilo(C₁-C₄), haloalquilo(C₁-C₄) y haloalcoxi(C₁-C₄), especialmente por uno o dos radicales alquilo(C₁-C₄).

20 Los compuestos de la invención pueden ocurrir en realizaciones preferidas. Las realizaciones individuales descritas en la presente pueden combinarse entre sí. No se incluyen combinaciones que contravienen las leyes de la naturaleza y que por lo tanto el experto en la técnica descartaría sobre la base de su conocimiento experto. Se excluyen, por ejemplo, las estructuras de anillo con tres o más átomos de oxígeno adyacentes.

Isómeros

25 Dependiendo de la naturaleza de los sustituyentes, los compuestos de la fórmula (I) pueden estar en la forma de isómeros geométricos y/u ópticamente activos o mezclas de isómeros correspondientes en diferentes composiciones. Estos estereoisómeros son, por ejemplo, enantiómeros, diastereómeros, atropisómeros o isómeros geométricos. Por consiguiente, la invención abarca estereoisómeros puros y cualquier mezcla de estos isómeros.

Procedimientos y usos

30 La invención también se refiere a procedimientos para controlar plagas animales, en los que se permiten compuestos de la fórmula (I) para actuar sobre las plagas animales y/o su hábitat. El control de las plagas animales se lleva a cabo preferentemente en la agricultura y la silvicultura y en la protección del material. Quedan excluidos los procedimientos de tratamiento quirúrgico o terapéutico del cuerpo humano o animal y los procedimientos de diagnóstico realizados en el cuerpo humano o animal.

La invención también se refiere al uso de los compuestos de la fórmula (I) como plaguicidas, en particular agentes de protección de cultivo.

35 En el contexto de la presente solicitud, el término "plaguicida" en cada caso también siempre comprende el término "agente de protección de cultivos".

40 Los compuestos de la fórmula (I), que tienen una buena tolerancia de las plantas, toxicidad homeoterma favorable y una buena compatibilidad medioambiental, son adecuados para la protección de plantas y órganos de las plantas contra los factores de estrés bióticos y abióticos, para aumentar el rendimiento de las cosechas, para mejorar la calidad del material cosechado y para el control de plagas animales, especialmente insectos, arácnidos, helmintos, en particular nematodos y moluscos, que se presentan en la agricultura, en la horticultura, en la cría de animales, en cultivos acuáticos, en los bosques, en jardines e instalaciones de esparcimiento, en la protección de productos y materiales almacenados, y en el sector de la higiene.

45 En el contexto de la presente solicitud de patente, por el término "higiene" se entiende cualquiera y todas las medidas, procesos y prácticas que tienen como objetivo prevenir enfermedades, en particular enfermedades infecciosas, y que sirven para proteger la salud de los seres humanos y los animales y/o para proteger el medio ambiente, y/o que mantienen la limpieza. De acuerdo con la invención, esta incluye especialmente medidas para limpieza, desinfección y esterilización de, por ejemplo, textiles o superficies duras, especialmente superficies de vidrio, madera, hormigón, porcelana, cerámica, plástico o también de metal(es), y para asegurar que estas se mantengan exentas de plagas de higiene y/o sus excreciones. Preferentemente, se excluye del alcance de la invención en este sentido los procedimientos de tratamiento quirúrgico o terapéutico aplicables al cuerpo humano o a los cuerpos de los animales y los procedimientos de diagnóstico que se llevan a cabo en el cuerpo humano o en los cuerpos de los animales.

50 El término "sector de la higiene" por lo tanto cubre todas las áreas, campos técnicos y aplicaciones industriales en las que estas medidas de higiene, procedimientos y prácticas son importantes, por ejemplo respecto a la higiene en las

cocinas, panaderías, aeropuertos, baños, piscinas, grandes almacenes, hoteles, hospitales, establos, cría de animales, etc.

Por lo tanto, por el término "plaga de la higiene" se entiende una o más plagas animales cuya presencia en el sector de la higiene es problemática, en particular por razones sanitarias. Por lo tanto, es un objetivo primario para evitar o minimizar la presencia de plagas de higiene, y/o la exposición a éstas, en el sector de la higiene. Esto puede lograrse en particular mediante la aplicación de un plaguicida que se puede usar tanto para prevenir la infestación y para hacer frente a una infestación que ya está presente. También pueden usarse preparaciones que evitan o reducen la exposición a las plagas. Plagas de higiene incluyen, por ejemplo, los organismos mencionados a continuación.

El término "protección de la higiene" por lo tanto cubre todas las acciones para mantener y/o mejorar estas medidas, procedimientos y prácticas de higiene.

Los compuestos de la fórmula (I) pueden usarse preferentemente como plaguicidas. Son activos frente a especies normalmente sensibles y resistentes y contra todas o algunas etapas de desarrollo. Las plagas antemencionadas incluyen:

plagas del filo de los artrópodos, en particular de la clase de los arácnidos, por ejemplo *Acarus* spp., por ejemplo *Acarus siro*, *Aceria kuko*, *Aceria sheldoni*, *Aculops* spp., *Aculus* spp., por ejemplo *Aculus fockeui*, *Aculus schlechtendali*, *Amblyomma* spp., *Amphitetranynchus viennensis*, *Argas* spp., *Boophilus* spp., *Brevipalpus* spp., por ejemplo *Brevipalpus phoenicis*, *Bryobia graminum*, *Bryobia praetiosa*, *Centrurionides* spp., *Chorioptes* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Dermatophagoides pteronyssinus*, *Dermatophagoides farinae*, *Dermacentor* spp., *Eotetranychus* spp., por ejemplo *Eotetranychus hircorae*, *Epitrimerus pyri*, *Eutetranychus* spp., por ejemplo *Eutetranychus banksi*, *Eriophyes* spp., por ejemplo *Eriophyes pyri*, *Glycyphagus domesticus*, *Halotydeus destructor*, *Hemitarsonemus* spp., por ejemplo *Hemitarsonemus latus* (=Polyphagotarsonemus latus), *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Latrodectus* spp., *Loxosceles* spp., *Neutrombicula autumnalis*, *Nuphessa* spp., *Oligonychus* spp., por ejemplo *Oligonychus coffeae*, *Oligonychus coniferarum*, *Oligonychus ilicis*, *Oligonychus indicus*, *Oligonychus mangiferus*, *Oligonychus pratensis*, *Oligonychus punicae*, *Oligonychus yothersi*, *Ornithodoros* spp., *Ornithonyssus* spp., *Panonychus* spp., por ejemplo *Panonychus citri* (=Metatetranychus citri), *Panonychus ulmi* (=Metatetranychus ulmi), *Phyllocoptruta oleivora*, *Platytetranychus multidigituli*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Psoroptes* spp., *Rhipicephalus* spp., *Rhizoglyphus* spp., *Sarcoptes* spp., *Scorpio maurus*, *Steneotarsonemus* spp., *Steneotarsonemus spinki*, *Tarsonemus* spp., por ejemplo *Tarsonemus confusus*, *Tarsonemus pallidus*, *Tetranychus* spp., por ejemplo *Tetranychus canadensis*, *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus turkestanii*, *Tetranychus urticae*, *Trombicula alfreddugesi*, *Vaejovis* spp., *Vasates lycopersici*;

de la clase de los quilópodos, por ejemplo *Geophilus* spp., *Scutigera* spp. ;

del orden de los colémbolos, por ejemplo *Onychiurus armatus*; *Sminthurus viridis* ;

de la clase de los diplópodos, por ejemplo *Blaniulus guttulatus*;

de la clase de los insectos, por ejemplo del orden del Blattodea, por ejemplo, *Blatta orientalis*, *Blattella asahinai*, *Blattella germanica*, *Leucophaea maderae*, *Loboptera decipiens*, *Neostylopyga rhombifolia*, *Panchlora* spp., *Parcoblatta* spp., *Periplaneta* spp., por ejemplo *Periplaneta americana*, *Periplaneta australasiae*, *Pycnoscelus surinamensis*, *Supella longipalpa*;

del orden de los coleópteros, por ejemplo *Acalymma vittatum*, *Acanthoscelides obtectus*, *Adoretus* spp., *Aethina tumida*, *Agelastica alni*, *Agrilus* spp., por ejemplo *Agrilus planipennis*, *Agrilus coxalis*, *Agrilus bilineatus*, *Agrilus anxius*, *Agriotes* spp., por ejemplo *Agriotes linneatus*, *Agriotes mancus*, *Alphitobius diaperinus*, *Amphimallon solstitialis*, *Anobium punctatum*, *Anoplophora* spp., por ejemplo *Anoplophora glabripennis*, *Anthonomus* spp., por ejemplo *Anthonomus grandis*, *Anthrenus* spp., *Apion* spp., *Apogonia* spp., *Atomaria* spp., por ejemplo *Atomaria linearis*, *Attagenus* spp., *Baris caerulescens*, *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp., por ejemplo *Bruchus pisorum*, *Bruchus rufimanus*, *Cassida* spp., *Ceratomyza trifurcata*, *Ceutorhynchus* spp., por ejemplo *Ceutorhynchus assimilis*, *Ceutorhynchus quadridens*, *Ceutorhynchus rapae*, *Chaetocnema* spp., por ejemplo *Chaetocnema confinis*, *Chaetocnema denticulata*, *Chaetocnema ectypa*, *Cleonus mendicus*, *Conoderus* spp., *Cosmopolites* spp., por ejemplo *Cosmopolites sordidus*, *Costelytra zealandica*, *Ctenicera* spp., *Curculio* spp., por ejemplo *Curculio caryae*, *Curculio caryatipes*, *Curculio obtusus*, *Curculio sayi*, *Cryptolestes ferrugineus*, *Cryptolestes pusillus*, *Cryptorhynchus lapathi*, *Cryptorhynchus mangiferae*, *Cylindrocopturus* spp., *Cylindrocopturus adspersus*, *Cylindrocopturus furnissi*, *Dendroctonus* spp., por ejemplo *Dendroctonus ponderosae*, *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp., por ejemplo *Diabrotica balteata*, *Diabrotica barberi*, *Diabrotica undecimpunctata howardi*, *Diabrotica undecimpunctata undecimpunctata*, *Diabrotica virgifera virgifera*, *Diabrotica virgifera zaeae*, *Dichocrocis* spp., *Dicladispa armigera*, *Diloboderus* spp., *Epicaerus* spp., *Epilachna* spp., por ejemplo *Epilachna borealis*, *Epilachna varivestis*, *Epitrix* spp., por ejemplo *Epitrix cucumeris*, *Epitrix fuscata*, *Epitrix hirtipennis*, *Epitrix subcrinita*, *Epitrix tuberis*, *Faustinus* spp., *Gibbium psyllodes*, *Gnathocerus cornutus*, *Hellula undalis*, *Heteronychus arator*, *Heteronyx* spp., *Hylamorpha elegans*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera postica*, *Hypomeces squamosus*, *Hypothenemus* spp., por ejemplo *Hypothenemus hampei*, *Hypothenemus obscurus*, *Hypothenemus pubescens*, *Lachnosterna consanguinea*, *Lasioderma serricorne*, *Latheticus oryzae*, *Lathridius* spp., *Lema* spp., *Leptinotarsa decemlineata*, *Leucoptera* spp., por ejemplo *Leucoptera coffeella*, *Limonius*

ectypus, Lissorhoptrus oryzophilus, Lissorhoptrus (= Hyperodes) spp., Lixus spp., Luperodes spp., Luperomorpha xanthodera, Lyctus spp., Megacyllene spp., por ejemplo Megacyllene robiniae, Megascelis spp., Melanotus spp., por ejemplo Melanotus longulus oregonensis, Meligethes aeneus, Melolontha spp., por ejemplo Melolontha melolontha, Migdolus spp., Monochamus spp., Naupactus xanthographus, Necrobia spp., Neogalerucella spp., Niptus hololeucus, 5 Oryctes rhinoceros, Oryzaephilus surinamensis, Oryzaphagus oryzae, Otiorhynchus spp., por ejemplo Otiorhynchus cribricollis, Otiorhynchus ligustici, Otiorhynchus ovatus, Otiorhynchus rugosostriatus, Otiorhynchus sulcatus, Oulema spp., por ejemplo Oulema melanopus, Oulema oryzae, Oxycetonia jucunda, Phaedon cochleariae, Phyllophaga spp., Phyllophaga helleri, Phyllotreta spp., por ejemplo Phyllotreta armoraciae, Phyllotreta pusilla, Phyllotreta ramosa, Phyllotreta striolata, Popillia japonica, Premnotrypes spp., Prosthepanus truncatus, Psylliodes spp., por ejemplo 10 Psylliodes affinis, Psylliodes chrysocephala, Psylliodes punctulata, Ptinus spp., Rhizobius ventralis, Rhizopertha dominica, Rhynchophorus spp., Rhynchophorus ferrugineus, Rhynchophorus palmarum, Scolytus spp., por ejemplo Scolytus multistriatus, Sinoxylon perforans, Sitophilus spp., por ejemplo Sitophilus granarius, Sitophilus linearis, Sitophilus oryzae, Sitophilus zeamais, Sphenophorus spp., Stegobium paniceum, Sternechus spp., por ejemplo Sternechus paludatus, Symphyletes spp., Tanyemecus spp., por ejemplo Tanyemecus dilaticollis, Tanyemecus indicus, 15 Tanyemecus palliatus, Tenebrio molitor, Tenebrioides mauritanicus, Tribolium spp., por ejemplo Tribolium audax, Tribolium castaneum, Tribolium confusum, Trogoderma spp., Tychius spp., Xylotrechus spp., Zabrus spp., por ejemplo Zabrus tenebrioides;

del orden de los dermápteros, por ejemplo Anisolabis marítima, Forficula auricularia, Labidura riparia;

del orden de los dípteros, por ejemplo Aedes spp., por ejemplo Aedes aegypti, Aedes albopictus, Aedes sticticus, 20 Aedes vexans, Agromyza spp., por ejemplo Agromyza frontella, Agromyza parvicornis, Anastrepha spp., Anopheles spp., por ejemplo Anopheles quadrimaculatus, Anopheles gambiae, Asphondylia spp., Bactrocera spp., por ejemplo Bactrocera cucurbitae, Bactrocera dorsalis, Bactrocera oleae, Bibio hortulanus, Calliphora erythrocephala, Calliphora vicina, Ceratitis capitata, Chironomus spp., Chrysomya spp., Chrysops spp., Chrysosoma pluvialis, Cochliomya spp., Contarinia spp., por ejemplo Contarinia johnsoni, Contarinia nasturtii, Contarinia pyrivora, Contarinia schulzi, Contarinia 25 sorghicola, Contarinia tritici, Cordylobia anthropophaga, Cricotopus sylvestris, Culex spp., por ejemplo Culex pipiens, Culex quinquefasciatus, Culicoides spp., Culiceta spp., Cuterebra spp., Dacus oleae, Dasineura spp., por ejemplo Dasineura brassicae, Delia spp., por ejemplo Delia antiqua, Delia coarctata, Delia florilega, Delia platura, Delia radicum, Dermatobia hominis, Drosophila spp., por ejemplo Drosophila melanogaster, Drosophila suzukii, Echinocnemus spp., Euleia heraclei, Fannia spp., Gasterophilus spp., Glossina spp., Haematopota spp., Hydrellia spp., Hydrellia griseola, 30 Hylemya spp., Hippobosca spp., Hypoderma spp., Liriomyza spp., por ejemplo Liriomyza brassicae, Liriomyza huidobrensis, Liriomyza sativae, Lucilia spp., por ejemplo Lucilia cuprina, Lutzomyia spp., Mansonia spp., Musca spp., por ejemplo Musca domestica, Musca domestica vicina, Oestrus spp., Oscinella frit, Paratanytarsus spp., Paralauterborniella subcineta, Pegomya o Pegomyia spp., por ejemplo Pegomya betae, Pegomya hyoscyami, Pegomya rubivora, Phlebotomus spp., Phorbia spp., Phormia spp., Piophilidae casei, Platyparea poeciloptera, Prodiptosis 35 spp., Psila rosae, Rhagoletis spp., por ejemplo Rhagoletis cingulata, Rhagoletis completa, Rhagoletis fausta, Rhagoletis indifferens, Rhagoletis mendax, Rhagoletis pomonella, Sarcophaga spp., Simulium spp., por ejemplo Simulium meridionale, Stomoxys spp., Tabanus spp., Tetanops spp., Tipula spp., por ejemplo Tipula paludosa, Tipula simplex, Toxotrypana curvicauda;

del orden de los hemípteros, por ejemplo Acizzia acaciaebaileyanae, Acizzia dodonaeae, Acizzia uncatoides, Acrida 40 turrita, Acyrthosiphon spp., por ejemplo Acyrthosiphon pisum, Acrogonia spp., Aeneolamia spp., Agonosoma spp., Aleurocanthus spp., Aleurodes proletella, Aleurolobus barodensis, Aleurothrixus floccosus, Allocaridara malayensis, Amrasca spp., por ejemplo Amrasca bigutulla, Amrasca devastans, Anuraphis cardui, Aonidiella spp., por ejemplo Aonidiella aurantii, Aonidiella citrina, Aonidiella inornata, Aphanostigma piri, Aphis spp., por ejemplo Aphis citricola, Aphis craccivora, Aphis fabae, Aphis forbesi, Aphis glycines, Aphis gossypii, Aphis hederiae, Aphis illinoisensis, Aphis 45 middletoni, Aphis nasturtii, Aphis nerii, Aphis pomi, Aphis spiraeicola, Aphis viburniphila, Arboridia apicalis, Aryanilla spp., Aspidiella spp., Aspidiotus spp., por ejemplo Aspidiotus nerii, Atanus spp., Aulacorthum solani, Bemisia tabaci, Blastopsylla occidentalis, Boreioglycaspis melaleucae, Brachycaudus helichrysi, Brachycolus spp., Brevicoryne brassicae, Cacopsylla spp., por ejemplo Cacopsylla pyricola, Calligypona marginata, Capulinia spp., Carneiocephala fulgida, Ceratovacuna lanigera, Cercopidae, Ceroplastes spp., Chaetosiphon fragaefolii, Chionaspis tegalensis, 50 Chlorita onukii, Chondracris rosea, Chromaphis juglandicola, Chrysomphalus aonidum, Chrysomphalus ficus, Cicadulina mbila, Cocomytilus halli, Coccus spp., por ejemplo Coccus hesperidum, Coccus longulus, Coccus pseudomagnoliarum, Coccus viridis, Cryptomyzus ribis, Cryptoneossa spp., Ctenarytaina spp., Dalbulus spp., Dialeurodes chittendeni, Dialeurodes citri, Diaphorina citri, Diaspis spp., Diuraphis spp., Doralis spp., Drosicha spp., Dysaphis spp., por ejemplo Dysaphis apiifolia, Dysaphis plantaginea, Dysaphis tulipae, Dysmicoccus spp., Empoasca 55 spp., por ejemplo Empoasca abrupta, Empoasca fabae, Empoasca maligna, Empoasca solana, Empoasca stenseni, Eriosoma spp., por ejemplo Eriosoma americanum, Eriosoma lanigerum, Eriosoma pyricola, Erythroneura spp., Eucalyptolyma spp., Euphyllura spp., Euscelis bilobatus, Ferrisia spp., Fiorinia spp., Furcaspis oceanica, Geococcus coffeae, Glycaspis spp., Heteropsylla cubana, Heteropsylla spinulosa, Homalodisca coagulata, Hyalopteris arundinis, Hyalopteris pruni, Icerya spp., por ejemplo Icerya purchasi, Idiocerus spp., Idioscopus spp., Laodelphax striatellus, 60 Lecanium spp., por ejemplo Lecanium corni (=Parthenolecanium corni), Lepidosaphes spp., por ejemplo Lepidosaphes ulmi, Lipaphis erysimi, Lopholeucaspis japonica, Lycorma delicatula, Macrosiphum spp., por ejemplo Macrosiphum euphorbiae, Macrosiphum lili, Macrosiphum rosae, Macrosteles facifrons, Mahanarva spp., Melanaphis sacchari,

5 Metcalfiella spp., Metcalfa pruinosa, Metopolophium dirhodum, Monellia costalis, Monelliopsis pecanis, Myzus spp., por ejemplo Myzus ascalonicus, Myzus cerasi, Myzus ligustri, Myzus ornatus, Myzus persicae, Myzus nicotianae, Nasonovia ribisnigri, Neomaskellia spp., Nephrotettix spp., por ejemplo Nephrotettix cincticeps, Nephrotettix nigropictus, Nettigoniclla spectra, Nilaparvata lugens, Oncometopia spp., Orthezia praelonga, Oxya chinensis, Pachypsyla spp., Parabemisia myricae, Paratrioza spp., por ejemplo Paratrioza cockerelli, Parlatoria spp., Pemphigus spp., por ejemplo Pemphigus bursarius, Pemphigus populivenerae, Peregrinus maidis, Perkinsiella spp., Phenacoccus spp., por ejemplo Phenacoccus madeirensis, Phloeomyzus passerinii, Phorodon humuli, Phylloxera spp., por ejemplo Phylloxera devastatrix, Phylloxera notabilis, Pinnaspis aspidistrae, Saissetia spp., por ejemplo Planococcus citri, Prosopidopsyla flava, Protopulvinaria pyrifomis, Pseudaulacaspis pentagona, Pseudococcus spp., por ejemplo Pseudococcus calceolariae, Pseudococcus comstocki, Pseudococcus longispinus, Pseudococcus maritimus, Pseudococcus viburni, Psyllopsis spp., Psylla spp., por ejemplo Psylla buxi, Psylla mali, Psylla pyri, Pteromalus spp., Pulvinaria spp., Pyrrilla spp., Quadraspidiotus spp., por ejemplo Quadraspidiotus juglansregiae, Quadraspidiotus ostreaeformis, Quadraspidiotus perniciosus, Quesada gigas, Rastrococcus spp., Rhopalosiphum spp., por ejemplo Rhopalosiphum maidis, Rhopalosiphum oxyacanthae, Rhopalosiphum padi, Rhopalosiphum rufiabdominale, Saissetia spp., por ejemplo Saissetia coffeae, Saissetia miranda, Saissetia neglecta, Saissetia oleae, Scaphoideus titanus, Schizaphis graminum, Selenaspis articulatus, Siphia flava, Sitobion avenae, Sogatella furcifera, Sogatodes spp., Stictocephala festina, Siphoninus phillyrae, Tenalaphara malayensis, Tetragonocephala spp., Tinocallis caryaefoliae, Tomaspis spp., Toxoptera spp., por ejemplo Toxoptera aurantii, Toxoptera citricidus, Trialeurodes vaporariorum, Trioza spp., por ejemplo Trioza diospyri, Typhlocyba spp., Unaspis spp., Viteus vitifolii, Zyginina spp.;

25 del suborden de los heterópteros, por ejemplo Aelia spp., Anasa tristis, Antestiopsis spp., Boisea spp., Blissus spp., Calocoris spp., Campylomma livida, Cavelerius spp., Cimex spp., por ejemplo Cimex adjunctus, Cimex hemipterus, Cimex lectularius, Cimex pilosellus, Collaria spp., Creontiades dilutus, Dasynus piperis, Dichelops furcatus, Diconocoris hewetti, Dysdercus spp., Euschistus spp., por ejemplo Euschistus heros, Euschistus servus, Euschistus tristigmus, Euschistus variolarius, Eurydema spp., Eurygaster spp., Halyomorpha halys, Heliopeltis spp., Horcias nobilellus, Leptocoris spp., Leptocoris varicornis, Leptoglossus occidentalis, Leptoglossus phyllopus, Lygocoris spp., por ejemplo Lygocoris pabulinus, Lygus spp., por ejemplo Lygus elisus, Lygus hesperus, Lygus lineolaris, Macrops excavatus, Megacopta cribraria, Miridae, Monalonion atratum, Nezara spp., por ejemplo Nezara viridula, Nysius spp., Oebalus spp., Pentomidae, Piesma quadrata, Piezodorus spp., por ejemplo Piezodorus guildinii, Psallus spp., 30 Pseudacysta perseae, Rhodnius spp., Sahlbergella singularis, Scaptocoris castanea, Scotinophora spp., Stephanitis nashi, Tibraca spp., Triatoma spp.;

35 del orden de los himenópteros, por ejemplo Acromyrmex spp., Athalia spp., por ejemplo Athalia rosae, Atta spp., Camponotus spp., Dolichovespula spp., Diprion spp., por ejemplo Diprion similis, Hoplocampa spp., por ejemplo Hoplocampa cookei, Hoplocampa testudinea, Lasius spp., Linepithema (Iridomyrmex) humile, Monomorium pharaonis, Paratrechina spp., Paravespula spp., Plagiolepis spp., Sirex spp., por ejemplo Sirex noctilio, Solenopsis invicta, Tapinoma spp., Technomyrmex albipes, Urocera spp., Vespa spp., por ejemplo Vespa crabro, Wasmannia auropunctata, Xeris spp.;

del orden de los isópodos, por ejemplo Armadillidium vulgare, Oniscus asellus, Porcellio scaber;

40 del orden de los isópteros, por ejemplo Coptotermes spp., por ejemplo Coptotermes formosanus, Cornitermes cumulans, Cryptotermes spp., Incisitermes spp., Kaloterms spp., Microtermes obesi, Nasutitermes spp., Odontotermes spp., Porotermes spp., Reticulitermes spp., por ejemplo Reticulitermes flavipes, Reticulitermes hesperus;

45 del orden de los lepidópteros, por ejemplo Achroia grisella, Acronicta major, Adoxophyes spp., por ejemplo Adoxophyes orana, Aedia leucomelas, Agrotis spp., por ejemplo Agrotis segetum, Agrotis ipsilon, Alabama spp., por ejemplo Alabama argillacea, Amyelois transitella, Anarsia spp., Anticarsia spp., por ejemplo Anticarsia gemmatilis, Argyroploce spp., Autographa spp., Barathra brassicae, Blastodacna atra, Borbo cinnara, Bucculatrix thurberiella, Bupalus piniarius, Busseola spp., Cacoecia spp., Caloptilia theivora, Capua reticulana, Carpocapsa pomonella, Carposina niponensis, Cheimatomyia brumata, Chilo spp., por ejemplo Chilo plejadellus, Chilo suppressalis, Choreutis pariana, Choristoneura spp., Chrysodeixis chalcites, Clysia ambiguella, Cnaphalocerus spp., Cnaphalocrocis medinalis, Cnephasia spp., Conopomorpha spp., Conotrachelus spp., Copitarsia spp., Cydia spp., por ejemplo Cydia nigricana, Cydia pomonella, Dalaca noctuides, Diaphania spp., Diparopsis spp., Diatraea saccharalis, Dioryctria spp., por ejemplo Dioryctria zimmermani, Earias spp., Ecdytolopha aurantium, Elasmopalpus lignosellus, Eldana saccharina, Ephestia spp., por ejemplo Ephestia elutella, Ephestia kuehniella, Epinotia spp., Epiphyas postvittana, Erannis spp., Erschoviella musculana, Etiella spp., Eudocima spp., Eulia spp., Eupoecilia ambiguella, Euproctis spp., por ejemplo Euproctis chrysorrhoea, Euxoa spp., Feltia spp., Galleria mellonella, Gracillaria spp., Grapholitha spp., por ejemplo Grapholitha molesta, Grapholitha prunivora, Hedylepta spp., Helicoverpa spp., por ejemplo Helicoverpa armigera, Helicoverpa zea, Heliothis spp., por ejemplo Heliothis virescens, Hofmannophila pseudospretella, Homoeosoma spp., Homona spp., Hyponomeuta padella, Kakivoria flavofasciata, Lampides spp., Laphygma spp., Laspeyresia molesta, Leucinodes orbonalis, Leucoptera spp., por ejemplo Leucoptera coffeella, Lithocolletis spp., por ejemplo Lithocolletis blanchardella, Lithophane antennata, Lobesia spp., por ejemplo Lobesia botrana, Loxagrotis albicosta, Lymantria spp., 60 por ejemplo Lymantria dispar, Lyonetia spp., por ejemplo Lyonetia clerkella, Malacosoma neustria, Maruca testulalis,

- 5 Mamestra brassicae, Melanitis leda, Mocis spp., Monopis obviella, Mythimna separata, Nemapogon cloacellus, Nymphula spp., Oiketicus spp., Omphisa spp., Operophtera spp., Oria spp., Orthaga spp., Ostrinia spp., por ejemplo Ostrinia nubilalis, Panolis flammea, Parnara spp., Pectinophora spp., por ejemplo Pectinophora gossypiella, Perileucoptera spp., Phthorimaea spp., por ejemplo Phthorimaea operculella, Phyllocnistis citrella, Phyllonorycter spp., por ejemplo Phyllonorycter blancardella, Phyllonorycter crataegella, Pieris spp., por ejemplo Pieris rapae, Platynota stultana, Plodia interpunctella, Plusia spp., Plutella xylostella (=Plutella maculipennis), Podesia spp., por ejemplo Podesia syringae, Prays spp., Prodenia spp., Protoparce spp., Pseudaletia spp., por ejemplo Pseudaletia unipuncta, Pseudoplusia includens, Pyrausta nubilalis, Rachiplusia nu, Schoenobius spp., por ejemplo Schoenobius bipunctifer, Scirpophaga spp., por ejemplo Scirpophaga innotata, Scotia segetum, Sesamia spp., por ejemplo Sesamia inferens, Sparganothis spp., Spodoptera spp., por ejemplo Spodoptera eradiana, Spodoptera exigua, Spodoptera frugiperda, Spodoptera praefica, Stathmopoda spp., Stenoma spp., Stomopteryx subsecivella, Synanthedon spp., Tecia solanivora, Thaumetopoea spp., Thermesia gemmatilis, Tinea cloacella, Tinea pellionella, Tineola bisselliella, Tortrix spp., Trichophaga tapetzella, Trichoplusia spp., por ejemplo Trichoplusia ni, Tryporyza incertulas, Tuta absoluta, Virachola spp.;
- 10 del orden de los ortópteros o saltatorios, por ejemplo Acheta domesticus, Dichroplus spp., Gryllotalpa spp., por ejemplo Gryllotalpa gryllotalpa, Hieroglyphus spp., Locusta spp., por ejemplo Locusta migratoria, Melanoplus spp., por ejemplo Melanoplus devastator, Paratlanticus ussuriensis, Schistocerca gregaria;
- del orden de los fitápteros, por ejemplo Damalinia spp., Haematopinus spp., Linognathus spp., Pediculus spp., Phylloxera vastatrix, Phthirus pubis, Trichodectes spp.;
- 20 del orden de los psocópteros, por ejemplo Lepinotus spp., Liposcelis spp.;
- del orden de los sifonápteros, por ejemplo, Ceratophyllus spp., Ctenocephalides spp., por ejemplo Ctenocephalides canis, Ctenocephalides felis, Pulex irritans, Tunga penetrans, Xenopsylla cheopis;
- 25 del orden de los tisanópteros, por ejemplo Anaphothrips obscurus, Baliothrips biformis, Chaetanaphothrips leeuweni, Drepanothrips reuteri, Enneothrips flavens, Frankliniella spp., por ejemplo Frankliniella fusca, Frankliniella occidentalis, Frankliniella schultzei, Frankliniella tritici, Frankliniella vaccinii, Frankliniella williamsi, Haplothrips spp., Heliothrips spp., Hercinothrips femoralis, Kakothrips spp., Rhipiphorothrips cruentatus, Scirtothrips spp., Taeniothrips cardamomi, Thrips spp., por ejemplo Thrips palmi, Thrips tabaci;
- del orden de los zigentomos (= Thysanura), por ejemplo Ctenolepisma spp., Lepisma saccharina, Lepismodes inquilinus, Thermobia domestica;
- 30 de la clase de los sinfilos, por ejemplo Scutigera spp., por ejemplo Scutigera immaculata;
- plagas del filo de los moluscos, por ejemplo de la clase de los bivalvos, por ejemplo Dreissena spp.,
- y también de la clase de los gasterópodos, por ejemplo Arion spp., por ejemplo Arion ater rufus, Biomphalaria spp., Bulinus spp., Deroceras spp., por ejemplo Deroceras laeve, Galba spp., Lymnaea spp., Oncomelania spp., Pomacea spp., Succinea spp.;
- 35 plagas de las plantas del filo de los nematodos, es decir, los nematodos fitoparásitos, en particular Aglenchus spp., por ejemplo Aglenchus agricola, Anguina spp., por ejemplo Anguina tritici, Aphelenchoides spp., por ejemplo Aphelenchoides arachidis, Aphelenchoides fragariae, Belonolaimus spp., por ejemplo Belonolaimus gracilis, Belonolaimus longicaudatus, Belonolaimus nortoni, Bursaphelenchus spp., por ejemplo Bursaphelenchus cocophilus, Bursaphelenchus eremus, Bursaphelenchus xylophilus, Cacopaurus spp., por ejemplo plagas Cacopaurus, Criconemella spp., por ejemplo Criconemella curvata, Criconemella onoensis, Criconemella ornata, Criconemella rusium, Criconemella xenoplax (= Mesocriconema xenoplax), Criconemoides spp., por ejemplo Criconemoides ferniae, Criconemoides onoense, Criconemoides ornatum, Ditylenchus spp., por ejemplo Ditylenchus dipsaci, Dolichodorus spp., Globodera spp., por ejemplo Globodera pallida, Globodera rostochiensis, Helicotylenchus spp., por ejemplo Helicotylenchus dihystra, Hemicriconemoides spp., Hemicyclophora spp., Heterodera spp., por ejemplo Heterodera avenae, Heterodera glycines, Heterodera schachtii, Hirschmaniella spp., Hoplolaimus spp., Longidorus spp., por ejemplo Longidorus africanus, Meloidogyne spp., por ejemplo Meloidogyne chitwoodi, Meloidogyne fallax, Meloidogyne hapla, Meloidogyne incognita, Meloinema spp., Nacobbus spp., Neotylenchus spp., ., Paralongidorus spp., Paraphelenchus spp., Paratrichodorus spp., por ejemplo Paratrichodorus minor, Paratylenchus spp., Pratylenchus spp., por ejemplo Pratylenchus penetrans, Pseudohalenchus spp., Psilenchus spp., Punctodera spp., Quinisulcius spp., Radopholus spp., por ejemplo Radopholus citrophilus, Radopholus similis, Rotylenchulus spp., Rotylenchus spp., Scutellonema spp., Subanguina spp., Trichodorus spp., por ejemplo Trichodorus obtusus, Trichodorus primitivus, Tylenchorhynchus spp., por ejemplo Tylenchorhynchus annulatus, Tylenchulus spp., por ejemplo Tylenchulus semipenetrans, Xiphinema spp., por ejemplo Xiphinema index.
- 50 Los compuestos de la fórmula (I) opcionalmente pueden, en determinadas concentraciones o velocidades de aplicación, usarse también como herbicidas, protectores, reguladores de crecimiento o agentes para mejorar las propiedades de plantas, como microbicidas o gametocidas, por ejemplo como fungicidas, antimicóticos, bactericidas,
- 55

viricidas (incluyendo contra viroides) o como agentes contra MLO (organismos tipo micoplasma) y RLO (organismos tipo rickettsia). También se pueden usar como productos intermedios o precursores para la síntesis de otros compuestos activos, si corresponde.

Formulaciones

- 5 La presente invención se refiere además a formulaciones y formas de uso preparadas a partir de estas como plaguicidas, por ejemplo licores en spray, goteo y pulverización, que comprenden al menos un compuesto de la fórmula (I). En algunos casos, las formas de uso comprenden además plaguicidas y/o adyuvantes que mejoran la acción, como penetrantes, p. ej., aceites vegetales, por ejemplo, aceite de colza, aceite de girasol, aceites minerales, por ejemplo, aceite de parafina, alquil ésteres de ácidos grasos vegetales, por ejemplo metil éster de aceite de colza o metil éster de aceite de soja, o alcohólicatos y/o esparcadores, por ejemplo, alquilsiloxanos y/o sales, por ejemplo, sales de amonio o fosfonio orgánicas o inorgánicas, por ejemplo, sulfato de amonio o hidrogenofosfato de diamonio y/o promotores de retención, por ejemplo dioctil sulfosuccinato o polímeros de hidroxipropil guar y/o humectantes, por ejemplo, glicerol y/o fertilizantes, por ejemplo, fertilizantes que contienen amonio, potasio o fósforo.
- 10 Las formulaciones habituales son, por ejemplo, líquidos solubles en agua (SL), concentrados de emulsión (EC), emulsiones en agua (EW), concentrados de suspensión (SC, SE, FS, OD), gránulos dispersables en agua (WG), gránulos (GR) y concentrados de cápsulas (CS); estos y otros tipos posibles de formulaciones se describen, por ejemplo, en Crop Life International and in Pesticide Specifications, Manual del desarrollo y uso de especificaciones de FAO y WHO para plaguicidas, FAO Plant Production and Protection Papers – 173, preparados por FAO/WHO Joint Meeting on Pesticide Specifications, 2004, ISBN: 9251048576. Las formulaciones, además de uno o más compuestos de la fórmula (I), comprenden opcionalmente otros compuestos agroquímicamente activos.
- 15 Estas son preferentemente formulaciones o formas de uso que comprenden auxiliares, por ejemplo, extensores, solventes, promotores de espontaneidad, portadores, emulsionantes, dispersantes, protectores contra escarcha, biocidas, espesantes y/u otros auxiliares, por ejemplo adyuvantes. Un adyuvante en este contexto es un componente que potencia el efecto biológico de la formulación, sin tener el propio componente ningún efecto biológico. Ejemplos de adyuvantes son agentes que promueven la retención, diseminación, unión de la superficie de la hoja o penetración.
- 20 Estas formulaciones se preparan de una forma conocida, por ejemplo, mezclando los compuestos de la fórmula (I) con auxiliares como, por ejemplo, extensores, solventes y/o portadores sólidos y/u otros auxiliares como, por ejemplo, tensioactivos. Las formulaciones se preparan ya sea en instalaciones adecuadas o de otro modo antes o durante la aplicación.
- 25 Los auxiliares usados pueden ser sustancias adecuadas para impartir propiedades especiales, como determinadas propiedades físicas, técnicas y/o biológicas, a la formulación de los compuestos de la fórmula (I), o para usar formas preparadas a partir de estas formulaciones (por ejemplo, plaguicidas prontos para usar como licores en spray o productos de recubrimiento de semillas).
- 30 Los extensores adecuados son, por ejemplo, agua, líquidos químicos orgánicos polares y no polares, por ejemplo de las clases de hidrocarburos aromáticos y no aromáticos (como parafinas, alquilbencenos, alquilnaftalenos, clorobencenos), los alcoholes y polioles (que, de ser adecuado, se pueden también sustituir, eterificar y/o esterificar), las cetonas (como acetona, ciclohexanona), los ésteres (incluyendo grasas y aceites) y poli(éteres), las aminas insustituídas y sustituidas, amidas, lactamas (como N-alquilpirrolidonas) y lactonas, las sulfonas y sulfóxidos (como dimetil sulfóxido), los carbonatos y los nitrilos.
- 35 Si el extensor usado es agua, también es posible usar, por ejemplo, solventes orgánicos como solventes auxiliares. Esencialmente, los solventes líquidos adecuados son: aromáticos, como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, hidrocarburos aromáticos clorados o alifáticos clorados, como clorobencenos, cloroetilenos o metilen cloruro, hidrocarburos alifáticos como ciclohexano o parafinas, por ejemplo, fracciones de aceite mineral, aceites minerales y vegetales, alcoholes como butanol o glicol y sus éteres y ésteres, cetonas como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona o ciclohexanona, solventes fuertemente polares como dimetilformamida o dimetil sulfóxido, carbonatos como carbonato de propileno, carbonato de butileno, dietil carbonato o dibutil carbonato, o nitrilos como acetonitrilo o propanonitrilo.
- 40 En principio, es posible usar todos los solventes adecuados. Ejemplos de solventes adecuados son hidrocarburos aromáticos, como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, hidrocarburos aromáticos clorados o alifáticos clorados, como clorobenceno, cloroetileno o metilen cloruro, hidrocarburos alifáticos, como ciclohexano, parafinas, fracciones de petróleo, aceites minerales y vegetales, alcoholes, como metanol, etanol, isopropanol, butanol o glicol y sus éteres y ésteres, cetonas como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona o ciclohexanona, solventes fuertemente polares como dimetil sulfóxido, carbonatos como carbonato de propileno, carbonato de butileno, dietil carbonato o dibutil carbonato, nitrilos como acetonitrilo o propanonitrilo, y también agua.
- 45 En principio, es posible usar todos los portadores adecuados. Los portadores útiles incluyen especialmente: por ejemplo sales de amonio y minerales naturales molidos como caolinas, arcillas, talco, tiza, cuarzo, atapulgita, montmorillonita o tierra diatomea, y materiales sintéticos molidos como sílice finamente dividida, alúmina y silicatos
- 50
- 55

naturales o sintéticos, resinas, ceras y/o fertilizantes sólidos. Igualmente pueden usarse mezclas de tales portadores. Portadores útiles para gránulos incluyen: por ejemplo, rocas naturales molidas y fraccionadas como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita y gránulos sintéticos de harinas inorgánicas y orgánicas y también gránulos de material orgánico como aserrín, papel, cáscaras de coco, mazorca de maíz y tallos de tabaco.

- 5 También se pueden usar extensores o solventes gaseosos licuados. Los extensores y portadores particularmente adecuados son los que son gaseosos a temperatura ambiente y a presión atmosférica, por ejemplo, gases propulsores en aerosol, como halohidrocarburos y también butano, propano, nitrógeno y dióxido de carbono.

- 10 Ejemplos de emulsionantes y/o formadores de espuma, dispersantes o agentes humectantes con propiedades iónicas o no iónicas, o mezclas de estos tensioactivos, son sales de ácido poliacrílico, sales de ácido lignosulfónico, sales de ácido fenolsulfónico o ácido naftalenosulfónico, policondensados de óxido de etileno con alcoholes grasos o con ácidos grasos o con aminas grasas, con fenoles sustituidos (preferentemente alquilfenoles o arilfenoles), sales de ésteres sulfosuccínicos, derivados de taurina (preferentemente alquil tauratos), derivados de isetonato, ésteres fosfóricos de alcoholes polietoxilados o fenoles, ésteres grasos de polioles y derivados de los compuestos que contienen sulfatos, sulfonatos y fosfatos, por ejemplo, alquilaril poliglicol éteres, alquilsulfonatos, alquil sulfatos, arilsulfonatos, hidrolisados de proteína, licores de residuos de lignosulfito y metilcelulosa. La presencia de un tensioactivo es ventajosa si uno de los compuestos de fórmula (I) y/o uno de los portadores inertes es insoluble en agua y cuando la aplicación tiene lugar en agua.

- 20 Es posible usar colorantes como pigmentos inorgánicos, por ejemplo óxido de hierro, óxido de titanio y azul de Prusia, y tintes orgánicos como tintes de alizarina, tintes azo y tintes de metal ftalocianina, y nutrientes y nutrientes traza como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y zinc como otros auxiliares en las formulaciones y las formas de uso derivadas a partir de estas.

Componentes adicionales pueden ser estabilizadores, como estabilizadores a baja temperatura, conservantes, antioxidantes, estabilizadores de luz u otros agentes que mejoran la estabilidad química y/o física. Los formadores de espuma o antiespumantes también pueden estar presentes.

- 25 Los adhesivos como carboximetilcelulosa y polímeros naturales y sintéticos en la forma de polvos, gránulos o redes, como goma arábiga, polivinil alcohol y polivinil acetato, o fosfolípidos naturales como cefalinas y lecitinas y fosfolípidos sintéticos también pueden estar presentes como auxiliares adicionales en las formulaciones y las formas de uso que derivan de estos. Otros auxiliares posibles son aceites minerales y vegetales.

- 30 Opcionalmente, otros auxiliares pueden estar presentes en las formulaciones y las formas de uso derivadas a partir de estas. Ejemplos de tales aditivos incluyen fragancias, coloides protectores, aglutinantes, adhesivos, espesantes, agentes tixotrópicos, penetrantes, promotores de retención, estabilizadores, secuestrantes, agentes formadores de complejo, humectantes, esparcidores. En general, los compuestos de la fórmula (I) se pueden combinar con cualquier aditivo sólido o líquido usado comúnmente a efectos de la formulación.

- 35 Los promotores de retención útiles incluyen todas esas sustancias que reducen la tensión de superficie dinámica, por ejemplo dioctil sulfosuccinato o aumentar la viscoelasticidad, por ejemplo polímeros de horoxipropilguar.

- 40 Los penetrantes adecuados en el presente contexto son todas las sustancias que se usan generalmente para mejorar la penetración de compuestos agroquímicamente activos. Los penetrantes se definen en este contexto por su capacidad de penetrar del licor de aplicación (generalmente acuoso) y/o del recubrimiento por pulverización en la cutícula de la planta y así aumentar la movilidad de los compuestos activos en la cutícula. El procedimiento descrito en la bibliografía (Baur et ál., 1997, Pesticide Science 51, 131-152) puede usarse para determinar esta propiedad. Ejemplos incluyen alcoxilatos de alcohol como etoxilato graso de coco (10) o etoxilato de isotridecilo (12), ésteres de ácido graso, por ejemplo, metil éster de aceite de colza o metil éster de aceite de soja, alcoxilados de amina grasa, por ejemplo, etoxilato de amina de sebo (15) o sales de amonio y/o fosfonio, por ejemplo sulfato de amonio o hidrogenofosfato de diamonio.

- 45 Las formulaciones preferentemente comprenden entre 0,00000001 y 98% en peso del compuesto de la fórmula (I) o, con particular preferencia, entre 0,01% y 95% en peso del compuesto de la fórmula (I), más preferentemente entre 0,5% y 90% en peso del compuesto de la fórmula (I), en función del peso de la formulación.

- 50 El contenido del compuesto de la fórmula (I) en las formas de uso preparadas a partir de las formulaciones (en particular plaguicidas) pueden variar dentro de rangos amplios. La concentración del compuesto de la fórmula (I) en las formas de uso es generalmente entre 0,00000001 y 95% en peso del compuesto de la fórmula (I), preferentemente entre 0,00001 y 1% en peso, en función del peso de la forma de uso. Los compuestos se emplean de forma habitual y adecuada para las formas de uso.

Mezclas

- 55 Los compuestos de la fórmula (I) también se pueden emplear como una mezcla con uno o más fungicidas, bactericidas, acaricidas, molusquicidas, nematocidas, insecticidas, microbiológicos, especies beneficiosas, herbicidas, fertilizantes,

repelentes de aves, fitotónicos, esterilizadores, protectores, estereoquímicos y/o reguladores de crecimiento de plantas adecuados, para poder así, por ejemplo, ampliar el espectro de acción, prolongar la duración de la acción, aumentar la velocidad de acción, prevenir la repulsión o evitar la evolución de resistencia. Asimismo, tales combinaciones de compuestos activos pueden mejorar el crecimiento de las plantas y/o tolerancia a factores abióticos, por ejemplo temperaturas altas o bajas, sequías o elevado contenido de agua o salinidad del suelo. También es posible mejorar el rendimiento de la floración y la fructificación, optimizar la capacidad de germinación y desarrollo de las raíces, facilitar la cosecha y mejorar rendimientos, influir en la maduración, mejorar la calidad y/o el valor nutricional de los productos cosechados, prolongar la vida del almacenamiento y/o mejorar la procesabilidad de los productos cosechados.

Asimismo, los compuestos de la fórmula (I) pueden estar presentes en una mezcla de otros compuestos activos o semioquímicos como atrayentes y/o repelentes de aves y/o activadores de plantas y/o reguladores del crecimiento y/o fertilizantes. Del mismo modo, los compuestos de la fórmula (I) pueden usarse para mejorar las propiedades de las plantas como, por ejemplo, crecimiento, rendimiento y calidad del material cosechado.

En una realización particular de acuerdo con la invención, los compuestos de la fórmula (I) están presentes en las formulaciones o las formas de uso preparadas a partir de estas formulaciones en una mezcla con otros compuestos, preferentemente aquellos según se describe más adelante.

Si uno de los compuestos mencionados a continuación puede ocurrir en formas tautoméricas diferentes, estas formas también se incluyen incluso si no se mencionan explícitamente en cada caso. Adicionalmente, todos los compañeros de unión mencionados pueden, si sus grupos funcionales lo permiten, formar opcionalmente sales con ácidos o bases adecuados.

Insecticidas/acaricidas/nematicidas

Los compuestos activos identificados en la presente por sus nombres comunes se conocen y describen, por ejemplo, en el manual de plaguicidas ("The Pesticide Manual" 16a Ed., British Crop Protection Council 2012) o se pueden encontrar en Internet (por ejemplo, <http://www.alanwood.net/pesticides>). La clasificación se basa en IRAC Mode of Action Classification Scheme en vigencia al momento de presentar esta solicitud de patente.

(1) Inhibidores de acetilcolinesterasa (AChE), preferentemente carbamatos que se seleccionan de alanycarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxicarboxim, carbarilo, carbofuran, carbosulfan, etiofencarb, fenobucarb, formetanato, furatiocarb, isoprocarb, metiocarb, metomilo, metolcarb, oxamilo, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, triazamato, trimetacarb, XMC y xililcarb, u organofosfatos que se seleccionan de acefato, azametifos, azinfos-etilo, azinfos-metilo, cadusafos, cloretoxifos, clorfenvinfos, clormefos, clorpirifos-metilo, coumafos, cianofos, demeton-S-metilo, diazinon, diclorvos/DDVP, dicrotofos, dimetoato, dimetilvinfos, disulfoton, EPN, etion, etoprofos, famfur, fenamifos, fenitrotrion, fention, fostiazato, heptenofos, imiciafos, isofenfos, isopropil O-(metoxiaminotiofosforil) salicilato, isoxation, malation, mecarbam, metamidofos, metidation, mevinfos, monocrotofos, naled, ometoato, oxidemeton-metilo, paration-metilo, fentoato, forato, fosadona, fosmet, fosfamidon, foxim, pirimifos-metilo, profenofos, propetamfos, protiofos, piraclofos, piridafention, quinalfos, sulfotep, tebupirimfos, temefos, terbufos, tetraclorvinfos, tiometon, triazofos, triclorfon y vamidotion.

(2) Bloqueadores del canal de cloruro controlado con GABA, preferentemente ciclodieno-organocloros que se seleccionan de clordano y endosulfan o fenilpirazoles (fiproles), por ejemplo etiprol y fipronil.

(3) Moduladores del canal de sodio, preferentemente piretroides que se seleccionan de acrinatrina, aletrina, d-cis-trans aletrina, d-trans aletrina, bifentrina, bioaletrina, isómero de bioaletrina s-ciclopentenilo, bioresmetrina, cicloprotrina, ciflutrina, beta-ciflutrina, cialotrina, lambda-cialotrina, gamma-cialotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, beta-cipermetrina, theta-cipermetrina, zeta-cipermetrina, cifenotrina [(1R)-trans-isómero], deltametrina, empentrina [(EZ)-(1R)-isómero], esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flumetrina, tau-fluvalinato, halfenprox, imiprotrina, kadetrina, momfluorotrina, permetrina, fenotrina [(1R)-trans-isómero], praletrina, piretrinas (piretrum), resmetrina, silafluofen, teflutrina, tetrametrina, tetrametrina [(1R)-isómero], tralometrina y transflutrina o DDT o metoxiclor.

(4) Moduladores competitivos del receptor acetilcolina nicotínico (nAChR), como preferentemente neonicotinoides que se seleccionan de acetamiprid, clotianidina, dinotefuran, imidacloprid, nitenpiram, tiacloprid y tiametoxam o nicotina o sulfoxaflor o flupiradifurona.

(5) Moduladores alostéricos del receptor acetilcolina nicotínico (nAChR), preferentemente espinosinas que se seleccionan de espinetoram y espinosad.

(6) Moduladores alostéricos del canal de cloruro controlados por glutamato (GluCl), preferentemente avermectinas/milbemecinas que se seleccionan de abamectina, emamectina benzoato, lepimectina y milbemectina.

(7) Miméticos de la hormona juvenil, preferentemente análogos de la hormona juvenil que se seleccionan de hidropreno, kinopreno y metopreno, o fenoxicarb o piriproxifen.

- (8) Inhibidores no específicos diversos (multi-sitio), preferentemente alquil haluros que se seleccionan de metil bromuro y otros alquil haluros, o cloropirina o sulfúrico fluoruro o bórax o tártaro emético o generadores de metil isocianato que se seleccionan de diazomet y metam.
- (9) Moduladores del canal TRPV del órgano cordotonal que se seleccionan de pimetrozina y pirifluquinazona.
- 5 (10) Inhibidores del crecimiento de ácaros, que se seleccionan de clofentezina, hexitiazox, diflovidazin y etoxazol.
- (11) Disruptores microbianos de la membrana intestinal de insectos que se seleccionan de *Bacillus thuringiensis* subespecie *israelensis*, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus thuringiensis* subespecie *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subespecie *kurstaki*, *Bacillus thuringiensis* subespecies *tenebrionis*, y *B.t.* proteínas de plantas que se seleccionan de Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry1A.105, Cry2Ab, Vip3A, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb y Cry34Ab1/35Ab1.
- 10 (12) Inhibidores de ATP sintasa mitocondrial, preferentemente disruptores de ATP que se seleccionan de compuestos de diafenthiuron u organoestánicos que se seleccionan de óxido de azociclotina, cihexatina y fenbutatina o propargita o tetradifon.
- (13) Desacopladores de fosforilación oxidativa por interrupción del gradiente de protones que se selecciona de clorfenapir, DNOC y sulfluramid.
- 15 (14) Bloqueadores del canal de receptor de acetilcolina nicotínica, que se selecciona de bentsultap, cartap clorhidrato, tiocilam, y tiotsultap-sodio.
- (15) Inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 0, que se selecciona de bistrifluron, clorfluazuron, diflubenzuron, flucicloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, teflubenzuron y triflumuron.
- (16) Inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 1 que se selecciona de buprofezina.
- 20 (17) Disruptores de muda (en particular para Díptera, es decir dípteros) que se selecciona de ciromazina.
- (18) Agonistas del receptor de ecdisona que se selecciona de halofenozida, metoxifenozida y tebufenozida.
- (19) Agonistas del receptor de octopamina que se selecciona de amitraz.
- (20) Inhibidores del transporte de electrones de complejo III mitocondriano que se selecciona de hidrametilnon, acequinocilo y fluacipirim.
- 25 (21) Inhibidores del transporte de electrones complejo I mitocondriano, preferentemente acaricidas METI que se seleccionan de fenazaquina, fenpiroximato, pirimidifen, piridaben, tebufenpirad y tolfenpirad o rotenona (Derris).
- (22) Bloqueadores del canal de sodio dependientes del voltaje que se seleccionan de indoxacarb o metaflumizona.
- (23) Inhibidores de acetil CoA carboxilasa, preferentemente derivados de ácidos tetrónicos y tetrámicos que se seleccionan de espiroclorfenol, espiromesifeno y spirotetramat.
- 30 (24) Inhibidores del transporte de electrones del complejo IV mitocondrial, preferentemente fosfinas que se seleccionan de fosfuro de aluminio, fosfuro de calcio, fosfina y fosfuro de zinc, o cianuros que se seleccionan de cianuro de calcio, cianuro de potasio y cianuro de sodio.
- (25) Inhibidores del transporte de electrones del complejo II mitocondrial, preferentemente derivados de *beta*-cetonitrilo que se seleccionan de cienopirafen y ciflumetofen y carboxanilidas que se seleccionan de piflubumida.
- 35 (28) Moduladores del receptor de rianodina, preferentemente diamidas que se seleccionan de clorantraniliprol, ciantraniliprol y flubendiamida.
- (29) Moduladores de órganos cordotomales (con sitio diana indefinido) que se seleccionan de flonicamid.
- (30) otros compuestos activos que se seleccionan de Afidopiropen, Afoxolaner, Azadiractina, Benclotiaz, Benzoximato, Bifenazato, Broflanilida, Bromopropilato, Quinometionato, Cloropraetrina, Criolita, Ciclaniliprol, Cicloxaprid, Cihalodiamida Dicloromezotiaz, Dicofof, epsilon-metoflutrina, epsilon-momflutrina, Flometoquin, Fluazaindolidina, Fluensulfona, Flufenimer, Flufenoxistrobin, Flufiprol, Fluhexafon, Fluopiram, Fluralaner, Fluxametamida, Fufenozida, Guadipir, Heptaflutrina, Imidacloprid, Iprodiona, Isocicloseram, kappa-bifentrina, kappa-teflutrina, Lotilaner, Meperflutrina, Oxazosulfil, Paichongding, Piridilil, Pirifluquinazon, Piriminostrobin, Espirobudiclofen, Tetrametilflutrina, Tetraniliprol, Tetraclorantraniliprol, Tigolaner, Tioxazafen, Tiofluoximato, Triflomezopirim y yodometano; asimismo preparaciones a base de *Bacillus firmus* (I-1582, BioNeem, Votivo), y también los siguientes compuestos: 1-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfonil]fenil}-3-(trifluorometil)-1H-1,2,4-triazol-5-amina (conocido de WO2006/043635) (CAS 885026-50-6), {1'-[(2E)-3-(4-clorofenil)prop-2-en-1-il]-5-fluorospiro[indol-3,4'-piperidin]-1(2H)-il}(2-cloropiridin-4-il)metanona (conocido de WO2003/106457) (CAS 637360-23-7), 2-cloro-N-[2-{1'-[(2E)-3-(4-clorofenil)prop-2-en-1-il]piperidin-4-il}-4-(trifluorometil)fenil]isonicotinamida (conocido de WO2006/003494) (CAS 872999-66-1), 3-(4-cloro-2,

6-dimetilfenil)-4-hidroxi-8-metoxi-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-2-ona (conocido de WO 2010052161) (CAS 1225292-17-0), 3-(4-cloro-2,6-dimetilfenil)-8-metoxi-2-oxo-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-4-il etil carbonato (conocido de EP2647626) (CAS 1440516-42-6), 4-(but-2-in-1-ilo)-6-(3,5-dimetilpiperidin-1-il)-5-fluoropirimidina (conocido de WO2004/099160) (CAS 792914-58-0), PF1364 (conocido de JP2010/018586) (CAS 1204776-60-2), N-[(2E)-1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]piridin-2(1H)-ilideno]-2,2,2-trifluoroacetamida (conocido de WO2012/029672) (CAS 1363400-41-2), (3E)-3-[1-[(6-cloro-3-piridil)metil]-2-piridilideno]-1,1,1-trifluoro-propan-2-ona (conocido de WO2013/144213) (CAS 1461743-15-6), N-[3-(bencilcarbamoil)-4-clorofenil]-1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocido de WO2010/051926) (CAS 1226889-14-0), 5-bromo-4-cloro-N-[4-cloro-2-metil-6-(metilcarbamoil)fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)pirazol-3-carboxamida (conocido de CN103232431) (CAS 1449220-44-3), 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-2-metil-N-(cis-1-oxido-3-tietanil)-benzamida, 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-2-metil-N-(trans-1-oxido-3-tietanil)-benzamida y 4-[(5S)-5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-2-metil-N-(cis-1-oxido-3-tietanil)benzamida (conocido de WO 2013/050317 A1) (CAS 1332628-83-7), N-[3-cloro-1-(3-piridinil)-1H-pirazol-4-il]-N-etil-3-[(3,3,3-trifluoropropil)sulfenil]-propanamida, (+)-N-[3-cloro-1-(3-piridinil)-1H-pirazol-4-il]-N-etil-3-[(3,3,3-trifluoropropil)sulfenil]-propanamida y (-)-N-[3-cloro-1-(3-piridinil)-1H-pirazol-4-il]-N-etil-3-[(3,3,3-trifluoropropil)sulfenil]-propanamida (conocido de WO 2013/162715 A2, WO 2013/162716 A2, US 2014/0213448 A1) (CAS 1477923-37-7), 5-[[2(E)-3-cloro-2-propen-1-il]amino]-1-[2,6-dicloro-4-(trifluorometil)fenil]-4-[(trifluorometil)sulfenil]-1H-pirazol-3-carbonitrilo (conocido de CN 101337937 A) (CAS 1105672-77-2), 3-bromo-N-[4-cloro-2-metil-6-[(metilamino)tioxometil]fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-carboxamida, (Liudaibenjiaxuanan, conocido de CN 103109816 A) (CAS 1232543-85-9); N-[4-cloro-2-[[1-(1-dimetiletil)amino]carbonil]-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(fluorometoxi)-1H-Pirazol-5-carboxamida (conocido de WO 2012/034403 A1) (CAS 1268277-22-0), N-[2-(5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-il)-4-cloro-6-metilfenil]-3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocido de WO 2011/085575 A1) (CAS 1233882-22-8), 4-[3-[2,6-dicloro-4-[(3,3-dicloro-2-propen-1-il)oxil]fenoxil]propoxil]-2-metoxi-6-(trifluorometil)-pirimidina (conocido de CN 101337940 A) (CAS 1108184-52-6); (2E)- y 2(Z)-2-[2-(4-cianofenil)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etilideno]-N-[4-(difluorometoxi)fenil]-hidrazinacarboxamida (conocido de CN 101715774 A) (CAS 1232543-85-9); éster del ácido 3-(2,2-dicloroetenil)-2,2-dimetil-4-(1H-benzimidazol-2-il)fenil-ciclopropanecarboxílico (conocido de CN 103524422 A) (CAS 1542271-46-4); metil éster del ácido (4aS)-7-cloro-2,5-dihidro-2-[(metoxicarbonil)[4-(trifluorometil)tio]fenil]amino]carbonil]-indeno[1,2-e][1,3,4]oxadiazina-4a(3H)-carboxil (conocido de CN 102391261 A) (CAS 1370358-69-2); 6-desoxi-3-O-etil-2,4-di-O-metil-, 1-[N-[4-[1-[4-(1,1,2,2,2-pentafluoroetoxi)fenil]-1H-1,2,4-triazol-3-il]fenil]carbamato]-α-L-mannopiranos (conocido de US 2014/0275503 A1) (CAS 1181213-14-8); 8-(2-ciclopropilmetoxi-4-trifluorometil-fenoxi)-3-(6-trifluorometil-piridazin-3-il)-3-aza-biciclo[3.2.1]octano (CAS 1253850-56-4), (8-anti)-8-(2-ciclopropilmetoxi-4-trifluorometil-fenoxi)-3-(6-trifluorometil-piridazin-3-il)-3-aza-biciclo[3.2.1]octano (CAS 933798-27-7), (8-syn)-8-(2-ciclopropilmetoxi-4-trifluorometil-fenoxi)-3-(6-trifluorometil-piridazin-3-il)-3-aza-biciclo[3.2.1]octano (conocido de WO 2007040280 A1, WO 2007040282 A1) (CAS 934001-66-8), N-[3-cloro-1-(3-piridinil)-1H-pirazol-4-il]-N-etil-3-[(3,3,3-trifluoropropil)tio]-propanamida (conocido de WO 2015/058021 A1, WO 2015/058028 A1) (CAS 1477919-27-9) y N-[4-(aminotioxometil)-2-metil-6-[(metilamino)carbonil]fenil]-3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocido de CN 103265527 A) (CAS 1452877-50-7), 5-(1,3-dioxan-2-il)-4-[[4-(trifluorometil)fenil]metoxi]-pirimidina (conocido de WO 2013/115391 A1) (CAS 1449021-97-9), 3-(4-cloro-2,6-dimetilfenil)-4-hidroxi-8-metoxi-1-metil-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-2-ona (conocido de WO 2010/066780 A1, WO 2011/151146 A1) (CAS 1229023-34-0), 3-(4-cloro-2,6-dimetilfenil)-8-metoxi-1-metil-1,8-diazaspiro[4.5]decano-2,4-diona (conocido de WO 2014/187846 A1) (CAS 1638765-58-8), etil éster del ácido 3-(4-cloro-2,6-dimetilfenil)-8-metoxi-1-metil-2-oxo-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-4-il-carbónico (conocido de WO 2010/066780 A1, WO 2011/151146 A1) (CAS 1229023-00-0), N-[1-[(6-cloro-3-piridinil)metil]-2(1H)-piridinilideno]-2,2,2-trifluoro-acetamida (conocido de DE 3639877 A1, WO 2012029672 A1) (CAS 1363400-41-2), [N(E)]-N-[1-[(6-cloro-3-piridinil)metil]-2(1H)-piridinilideno]-2,2,2-trifluoro-acetamida, (conocido de WO 2016005276 A1) (CAS 1689566-03-7), [N(Z)]-N-[1-[(6-cloro-3-piridinil)metil]-2(1H)-piridinilideno]-2,2,2-trifluoro-acetamida, (CAS 1702305-40-5), 3-endo-3-[2-propoxi-4-(trifluorometil)fenoxil]-9-[[5-(trifluorometil)-2-piridinil]oxil]-9-azabicyclo[3.3.1]nonano (conocido de WO 2011/105506 A1, WO 2016/133011 A1) (CAS 1332838-17-1).

Fungicidas

Los ingredientes activos especificados en la presente por su Nombre Habitual son conocidos y se describen, por ejemplo, en The Pesticide Manual (16ta Ed. British Crop Protection Council) o pueden investigarse en internet (por ejemplo www.alanwood.net/pesticides).

Todos los compañeros de mezclas de fungicidas mencionados de las clases (1) a (15) pueden, si sus grupos funcionales lo permiten, formar opcionalmente sales con ácidos o bases adecuados. Todos los compañeros de mezclas mencionados de las clases (1) a (15) pueden incluir formas tautoméricas, de ser adecuado.

1) Inhibidores de la biosíntesis de ergosterol, por ejemplo (1.001) ciproconazol, (1.002) difenoconazol, (1.003) epoxiconazol, (1.004) fenhexamid, (1.005) fenpropidin, (1.006) fenpropimorph, (1.007) fenpirazamina, (1.008) fluquinconazol, (1.009) flutriafol, (1.010) imazalil, (1.011) imazalil sulfato, (1.012) ipconazol, (1.013) metconazol, (1.014) miclobutanil, (1.015) paclobutrazol, (1.016) procloraz, (1.017) propiconazol, (1.018) protioconazol, (1.019) Pirisoxazol, (1.020) espiroamina, (1.021) tebuconazol, (1.022) tetraconazol, (1.023) triadimenol, (1.024) tridemorf, (1.025) triticonazol, (1.026) (1R,2S,5S)-5-(4-clorobencil)-2-(clorometil)-2-metil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ilmetil)ciclopentanol, (1.027) (1S,2R,5R)-5-(4-clorobencil)-2-(clorometil)-2-metil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-

- 5 ilmetil)ciclopentanol, (1.028) (2R)-2-(1-clorociclopropil)-4-[(1R)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.029) (2R)-2-(1-clorociclopropil)-4-[(1S)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.030) (2R)-2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol, (1.031) (2S)-2-(1-clorociclopropil)-4-[(1R)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.032) (2S)-2-(1-clorociclopropil)-4-[(1S)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.033) (2S)-2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol, (1.034) (R)-[3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (1.035) (S)-[3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (1.036) [3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (1.037) 1-[(2R,4S)-2-[2-cloro-4-(4-clorofenoxi)fenil]-4-metil-1,3-dioxolan-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol, (1.038) 1-[(2S,4S)-2-[2-cloro-4-(4-clorofenoxi)fenil]-4-metil-1,3-dioxolan-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol, (1.039) 1-[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol-5-il tiocianato, (1.040) 1-[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol-5-il tiocianato, (1.041) 1-[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol-5-il tiocianato, (1.042) 2-[(2R,4R,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-iona, (1.043) 2-[(2R,4R,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-iona, (1.044) 2-[(2R,4S,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-iona, (1.045) 2-[(2R,4S,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-iona, (1.046) 2-[(2S,4R,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-iona, (1.047) 2-[(2S,4R,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-iona, (1.048) 2-[(2S,4S,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-iona, (1.049) 2-[(2S,4S,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-iona, (1.050) 2-[1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-iona, (1.051) 2-[2-cloro-4-(2,4-diclorofenoxi)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol, (1.052) 2-[2-cloro-4-(4-clorofenoxi)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.053) 2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.054) 2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)pentan-2-ol, (1.055) 2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol, (1.056) 2-[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-iona, (1.057) 2-[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-iona, (1.058) 2-[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-iona, (1.059) 5-(4-clorobencil)-2-(clorometil)-2-metil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)metil)ciclopentanol, (1.060) 5-(alilsulfanil)-1-[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol, (1.061) 5-(alilsulfanil)-1-[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol, (1.062) 5-(alilsulfanil)-1-[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol, (1.063) N'-(2,5-dimetil-4-{[3-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil]sulfanil}fenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.064) N'-(2,5-dimetil-4-{[3-(2,2,2-trifluoroetoxi)fenil]sulfanil}fenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.065) N'-(2,5-dimetil-4-{[3-(2,2,3,3-tetrafluoropropoxi)fenil]sulfanil}fenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.066) N'-(2,5-dimetil-4-{[3-(pentafluoroetoxi)fenil]sulfanil}fenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.067) N'-(2,5-dimetil-4-{[3-(1,1,2,2-tetrafluoroetil)sulfanil]fenoxi}fenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.068) N'-(2,5-dimetil-4-{[3-(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenoxi}fenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.069) N'-(2,5-dimetil-4-{[3-(2,2,3,3-tetrafluoropropil)sulfanil]fenoxi}fenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.070) N'-(2,5-dimetil-4-{[3-(pentafluoroetil)sulfanil]fenoxi}fenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.071) N'-(2,5-dimetil-4-fenoxifenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.072) N'-(4-{[3-(difluorometoxi)fenil]sulfanil}-2,5-dimetilfenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.073) N'-(4-{[3-(difluorometil)sulfanil]fenoxi}-2,5-dimetilfenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.074) N'-[5-bromo-6-(2,3-dihidro-1H-inden-2-iloxi)-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.075) N'-[4-{(4,5-dicloro-1,3-tiazol-2-il)oxi]-2,5-dimetilfenil]-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.076) N'-[5-bromo-6-[(1R)-1-(3,5-difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.077) N'-[5-bromo-6-[(1S)-1-(3,5-difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.078) N'-[5-bromo-6-[(cis-4-isopropilciclohexil)oxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.079) N'-[5-bromo-6-[(trans-4-isopropilciclohexil)oxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.080) N'-[5-bromo-6-[1-(3,5-difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.081) Mefentrifluconazol, (1.082) Ipfentrifluconazol.
- 2) Inhibidores de la cadena respiratoria en el complejo I o II, por ejemplo (2.001) benzovindiflupir, (2.002) bixafen, (2.003) boscalid, (2.004) carboxin, (2.005) fluopiram, (2.006) flutolanil, (2.007) fluxapiroxad, (2.008) furametpir, (2.009) isofetamid, (2.010) isopirazam (enantiómero anti-epimérico 1R,4S,9S), (2.011) isopirazam (enantiómero anti-epimérico 1S,4R,9R), (2.012) isopirazam (racemato anti-epimérico 1RS,4SR,9SR), (2.013) isopirazam (mezcla de racemato syn-epimérico 1RS,4SR,9RS y racemato anti-epimérico 1RS,4SR,9SR), (2.014) isopirazam (enantiómero syn-epimérico 1R,4S,9R), (2.015) isopirazam (enantiómero syn-epimérico 1S,4R,9S), (2.016) isopirazam (racemato syn-epimérico 1RS,4SR,9RS), (2.017) penflufen, (2.018) pentiopirad, (2.019) pidiflumetofen, (2.020) Piraziflumid, (2.021) sedaxano, (2.022) 1,3-dimetil-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.023) 1,3-dimetil-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.024) 1,3-dimetil-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.025) 1-metil-3-(trifluorometil)-N-[2'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.026) 2-fluoro-6-(trifluorometil)-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)benzamida, (2.027) 3-(difluorometil)-1-metil-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.028) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.029) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.030) 3-(difluorometil)-N-(7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.031) 3-(difluorometil)-N-[(3R)-7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1-metil-1H-pirazol-4-

carboxamida, (2.032) 3-(difluorometil)-N-[(3S)-7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.033) 5,8-difluoro-N-[2-(2-fluoro-4-[[4-(trifluorometil)piridin-2-il]oxi]fenil)etil]quinazolin-4-amina, (2.034) N-(2-terc-butil-5-fluorobencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.035) N-(2-terc-butilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.036) N-(2-terc-butilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.037) N-(5-cloro-2-etilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.038) N-(5-cloro-2-isopropilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.039) N-[(1R,4S)-9-(diclorometileno)-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.040) N-[(1S,4R)-9-(diclorometileno)-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.041) N-[1-(2,4-diclorofenil)-1-metoxipropan-2-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.042) N-[2-cloro-6-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.043) N-[3-cloro-2-fluoro-6-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.044) N-[5-cloro-2-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.045) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-N-[5-metil-2-(trifluorometil)benzyl]-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.046) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-N-[2-fluoro-6-isopropilbencil]-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.047) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropil-5-metilbencil)-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.048) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.049) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.050) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(5-fluoro-2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.051) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-4,5-dimetilbencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.052) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-5-fluorobencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.053) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-5-metilbencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.054) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropil-5-fluorobencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.055) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropil-5-metilbencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.056) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropilbencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida.

3) Inhibidores de la cadena respiratoria en el complejo III, por ejemplo (3.001) ametotradin, (3.002) amisulbrom, (3.003) azoxistrobin, (3.004) coumetoxistrobin, (3.005) coumoxistrobin, (3.006) ciazofamid, (3.007) dimoxistrobin, (3.008) enoxastrobin, (3.009) famoxadon, (3.010) fenamidon, (3.011) flufenoxistrobin, (3.012) fluoxastrobin, (3.013) kresoxim-metilo, (3.014) metominostrobin, (3.015) orisastrobin, (3.016) picoxistrobin, (3.017) piraclostrobin, (3.018) pirametrobin, (3.019) piraxistrobin, (3.020) trifloxistrobin, (3.021) (2E)-2-[2-[[[(1E)-1-(3-[[[(E)-1-fluoro-2-fenilvinil]oxi]fenil]etilideno]amino]oxi]metil]fenil]-2-(metoxiimino)-N-metilacetamida, (3.022) (2E,3Z)-5-[[1-(4-clorofenil)-1H-pirazol-3-il]oxi]-2-(metoxiimino)-N,3-dimetilpent-3-enamida, (3.023) (2R)-2-[2-[(2,5-dimetilfenoxi)metil]fenil]-2-metoxi-N-metilacetamida, (3.024) (2S)-2-[2-[(2,5-dimetilfenoxi)metil]fenil]-2-metoxi-N-metilacetamida, (3.025) (3S,6S,7R,8R)-8-bencil-3-[[[(3-[[isobutiriloxi]metoxi]-4-metoxipiridin-2-il]carbonil)amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-il 2-metilpropanoato, (3.026) 2-[2-[(2,5-dimetilfenoxi)metil]fenil]-2-metoxi-N-metilacetamida, (3.027) N-(3-etil-3,5,5-trimetilciclohexil)-3-formamido-2-hidroxibenzamida, (3.028) (2E,3Z)-5-[[1-(4-cloro-2-fluorofenil)-1H-pirazol-3-il]oxi]-2-(metoxiimino)-N,3-dimetilpent-3-enamida, (3.029) metil {5-[3-(2,4-dimetilfenil)-1H-pirazol-1-il]-2-metilbencil}carbamato.

4) Inhibidores de la mitosis y división celular, por ejemplo (4.001) carbendazim, (4.002) dietofencarb, (4.003) etaboxam, (4.004) fluopicolida, (4.005) pencicuron, (4.006) tiabendazol, (4.007) tiofanato-metilo, (4.008) zoxamida, (4.009) 3-cloro-4-(2,6-difluorofenil)-6-metil-5-fenilpiridazina, (4.010) 3-cloro-5-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-6-metilpiridazina, (4.011) 3-cloro-5-(6-cloropiridin-3-il)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorofenil)piridazina, (4.012) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.013) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-bromo-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.014) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-bromofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.015) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-cloro-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.016) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-clorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.017) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.018) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-N-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.019) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-N-(2-cloro-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.020) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-N-(2-clorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.021) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-N-(2-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.022) 4-(4-clorofenil)-5-(2,6-difluorofenil)-3,6-dimetilpiridazina, (4.023) N-(2-bromo-6-fluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.024) N-(2-bromofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.025) N-(4-cloro-2,6-difluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina.

5) Compuestos capaces de tener una acción multisitio, por ejemplo (5.001) mezcla bordeaux, (5.002) captafol, (5.003) captan, (5.004) clorotalonil, (5.005) hidróxido de cobre (5.006) naftenato de cobre, (5.007) óxido de cobre, (5.008) oxiclورو de cobre, (5.009) sulfato de cobre(2+), (5.010) ditiannon, (5.011) dodina, (5.012) folpet, (5.013) mancozeb, (5.014) maneb, (5.015) metiram, (5.016) zinc metiram, (5.017) oxina-cobre, (5.018) propineb, (5.019) azufre y preparaciones de azufre que incluyen polisulfuro de calcio, (5.020) tiram, (5.021) zineb, (5.022) ziram, (5.023) 6-etil-5,7-dioxo-6,7-dihidro-5H-pirrol[3',4':5,6][1,4]ditiino[2,3-c][1,2]tiazol-3-carbonitrilo.

6) Compuestos capaces de inducir una defensa de hospedador, por ejemplo (6.001) acibenzolar-S-metilo, (6.002) isotianilo, (6.003) probenazol, (6.004) tiadinil.

7) Inhibidores de la biosíntesis de aminoácidos y/o proteínas, por ejemplo (7.001) ciprodinil, (7.002) kasugamicina, (7.003) kasugamicina clorhidrato hidrato, (7.004) oxitetraciclina, (7.005) pirimetanilo, (7.006) 3-(5-fluoro-3,3,4,4-tetrametil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina.

8) Inhibidores de la producción de ATP, por ejemplo (8.001) siltiofam.

5 9) Inhibidores de la síntesis de la pared celular, por ejemplo (9.001) bentiavalicarb, (9.002) dimetomorf, (9.003) flumorf, (9.004) iprovalicarb, (9.005) mandipropamid, (9.006) pirimorph, (9.007) valifenalato, (9.008) (2E)-3-(4-terc-butilfenil)-3-(2-cloropiridin-4-il)-1-(morfolin-4-il)prop-2-en-1-ona, (9.009) (2Z)-3-(4-terc-butilfenil)-3-(2-cloropiridin-4-il)-1-(morfolin-4-il)prop-2-en-1-ona.

10 10) Inhibidores de la síntesis de membrana y lípidos, por ejemplo (10.001) propamocarb, (10.002) propamocarb clorhidrato, (10.003) tolclofos-metilo.

11) Inhibidores de la biosíntesis de melanina, por ejemplo (11.001) triciclazol, (11.002) 2,2,2-trifluoroetil {3-metil-1-[(4-metilbenzoi)amino]butan-2-il}carbamato.

12) Inhibidores de la síntesis de ácido nucleico, por ejemplo (12.001) benalaxil, (12.002) benalaxil-M (kiralaxil), (12.003) metalaxil, (12.004) metalaxil-M (mefenoxam).

15 13) Inhibidores de la transducción de señal, por ejemplo (13.001) fludioxonil, (13.002) iprodiona, (13.003) procimidona, (13.004) proquinazid, (13.005) quinoxifen, (13.006) vinclozolin.

14) Compuestos capaces de actuar como desacoplador, por ejemplo (14.001) fluazinam, (14.002) meptildinocap.

20 15) Compuestos adicionales, por ejemplo (15.001) ácido abscísico, (15.002) bentiazol, (15.003) betoxazina, (15.004) capsimicina, (15.005) carvona, (15.006) quinometionat, (15.007) cufraneb, (15.008) ciflufenamid, (15.009) cimoxanil, (15.010) ciprosulfamida, (15.011) flutianilo, (15.012) fosetil-aluminio, (15.013) fosetil-calcio, (15.014) fosetil-sodio, (15.015) metil isotiocianato, (15.016) metrafenona, (15.017) mildiomicina, (15.018) natamicina, (15.019) níquel dimetilditiocarbamato, (15.020) nitrotal-isopropilo, (15.021) oxamocarb, (15.022) oxatiapiprolina, (15.023) oxifentiina, (15.024) pentaclorofenol y sales, (15.025) ácido fosforoso y sus sales, (15.026) propamocarb-fosetilato, (15.027) piriofenona (clazafenona) (15.028) tebufloquina, (15.029) tecloftalam, (15.030) tolnifanida, (15.031) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]jetanona, (15.032) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]jetanona, (15.033) 2-(6-bencilpiridin-2-il)quinazolina, (15.034) 2,6-dimetil-1H,5H-[1,4]ditiino[2,3-c:5,6-c']dipirrol-1,3,5,7(2H,6H)-tetrona, (15.035) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{5-[2-(prop-2-in-1-ilo)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)jetanona, (15.036) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{5-[2-cloro-6-(prop-2-in-1-ilo)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)jetanona, (15.037) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{5-[2-fluoro-6-(prop-2-in-1-ilo)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)jetanona, (15.038) 2-[6-(3-fluoro-4-metoxifenil)-5-metilpiridin-2-il]quinazolina, (15.039) 2-[(5R)-3-[2-(1-{[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il]-3-clorofenil metanosulfonato, (15.040) 2-[(5S)-3-[2-(1-{[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il]-3-clorofenil metanosulfonato, (15.041) 2-{2-[(7,8-difluoro-2-metilquinolin-3-il)oxil]-6-fluorofenil}propan-2-ol, (15.042) 2-{2-fluoro-6-[(8-fluoro-2-metilquinolin-3-il)oxil]fenil}propan-2-ol, (15.043) 2-[3-[2-(1-{[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il]-3-clorofenil metanosulfonato, (15.044) 2-[3-[2-(1-{[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il]fenil metanosulfonato, (15.045) 2-fenilfenol y sales, (15.046) 3-(4,4,5-trifluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina, (15.047) 3-(4,4-difluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina, (15.048) 4-amino-5-fluoropirimidin-2-ol (forma tautométrica: 4-amino-5-fluoropirimidin-2(1H)-ona), (15.049) ácido 4-oxo-4-[(2-feniletil)amino]butanoico, (15.050) 5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-tiol, (15.051) 5-cloro-N'-fenil-N'-(prop-2-in-1-il)tiofeno 2-sulfonohidrazida, (15.052) 5-fluoro-2-[(4-fluorobencil)oxil]pirimidin-4-amina, (15.053) 5-fluoro-2-[(4-metilbencil)oxil]pirimidin-4-amina, (15.054) 9-fluoro-2,2-dimetil-5-(quinolin-3-il)-2,3-dihidro-1,4-benzoxazepina, (15.055) but-3-in-1-ilo {6-[(Z)-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metileno]amino}oximetil]piridin-2-il}carbamato, (15.056) (2Z)-3-amino-2-ciano-3-fenilacrilato de etilo, (15.057) ácido fenazina-1-carboxílico, (15.058) 3,4,5-trihidroxibenzoato de propilo, (15.059) quinolin-8-ol, (15.060) quinolin-8-ol sulfato (2:1), (15.061) {6-[(Z)-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metileno]amino}oximetil]piridin-2-il}carbamato de terc-butilo, (15.062) 5-fluoro-4-imino-3-metil-1-[(4-metilfenil)sulfonil]-3,4-dihidropirimidin-2(1H)-ona.

50 **Plaguicidas biológicos como componentes de mezcla**

Los compuestos de la fórmula (I) pueden combinarse con plaguicidas biológicos.

Los plaguicidas biológicos comprenden en particular bacterias, hongos, levaduras, extractos de plantas y productos formados por microorganismos, incluyendo proteínas y metabolitos secundarios.

55 Los plaguicidas biológicos comprenden bacterias como bacterias que forman esporas, bacterias de colonización de raíz y bacterias que actúan como insecticidas, fungicidas o nematocidas biológicos.

Ejemplos de tales bacterias que se emplean o pueden usarse como plaguicidas biológicos son:

- 5 *Bacillus amyloliquefaciens*, cepa FZB42 (DSM 231179), o *Bacillus cereus*, en particular *B. cereus* cepa CNCM I-1562 o *Bacillus firmus*, cepa I-1582 (número de acceso CNCM I-1582) o *Bacillus pumilus*, en particular cepa GB34 (número de acceso ATCC 700814) y cepa QST2808 (número de acceso NRRL B-30087), o *Bacillus subtilis*, en particular cepa GB03 (número de acceso ATCC SD-1397), o *Bacillus subtilis* cepa QST713 (número de acceso NRRL B-21661) o
- 10 *Bacillus subtilis* cepa OST 30002 (número de acceso NRRL B-50421) *Bacillus thuringiensis*, en particular *B. thuringiensis* subespecie *israelensis* (serotipo H-14), cepa AM65-52 (número de acceso ATCC 1276), o *B. thuringiensis* subsp. *aizawai*, en particular cepa ABTS-1857 (SD-1372), o *B. thuringiensis* subsp. *kurstaki* cepa HD-1, o *B. thuringiensis* subsp. *tenebrionis* cepa NB 176 (SD-5428), *Pasteuria penetrans*, *Pasteuria* spp. (Rotylenchulus reniformis nematodo)-PR3 (número de acceso ATCC SD-5834), *Streptomyces microflavus* cepa AQ6121 (= QRD 31.013, NRRL B-50550), *Streptomyces galbus* cepa AQ 6047 (número de acceso NRRL 30232).

Ejemplos de hongos y levaduras que se emplean o pueden usarse como plaguicidas biológicos son:

- 15 *Beauveria bassiana*, en particular cepa ATCC 74040, *Coniothyrium minitans*, en particular cepa CON/M/91-8 (número de acceso DSM-9660), *Lecanicillium* spp., en particular cepa HRO LEC 12, *Lecanicillium lecanii*, (antes conocida como *Verticillium lecanii*), en particular cepa KV01, *Metarhizium anisopliae*, en particular cepa F52 (DSM3884/ ATCC 90448), *Metschnikowia fructicola*, en particular cepa NRRL Y-30752, *Paecilomyces fumosoroseus* (ahora: *Isaria fumosorosea*), en particular cepa IFPC 200613, o cepa Apopka 97 (número de acceso ATCC 20874), *Paecilomyces lilacinus*, en particular *P. lilacinus* cepa 251 (AGAL 89/030550), *Talaromyces flavus*, en particular cepa V117b, *Trichoderma atroviride*, en particular cepa SC1 (número de acceso CBS 122089), *Trichoderma harzianum*, en particular *T. harzianum* rifai T39. (número de acceso CNCM I-952).
- 20

Ejemplos de virus que se utilizan o pueden usar como pesticidas biológicos son:

- 25 *Adoxophyes orana* (tortrix de fruta de verano) virus granulosis (GV), *Cydia pomonella* (polilla del manzano) virus granulosis (GV), *Helicoverpa armigera* (gusano cogollero) virus de la polihedrosis nuclear (NPV), *Spodoptera exigua* (gusano soldado) mNPV, *Spodoptera frugiperda* (cogollero dle maíz) mNPV, *Spodoptera littoralis* (rosquilla negra) NPV.

También se incluyen bacterias y hongos que se agregan como "inoculante" para plantas o partes de plantas u órganos de plantas y que, en virtud de sus propiedades particulares, promueven el crecimiento de las plantas y la salud de las plantas. Los ejemplos que se pueden mencionar son:

- 30 *Agrobacterium* spp., *Azorhizobium caulinodans*, *Azospirillum* spp., *Azotobacter* spp., *Bradyrhizobium* spp., *Burkholderia* spp., en particular *Burkholderia cepacia* (antes conocida como *Pseudomonas cepacia*), *Gigaspora* spp., o *Gigaspora monosporum*, *Glomus* spp., *Laccaria* spp., *Lactobacillus buchneri*, *Paraglomus* spp., *Pisolithus tinctorius*, *Pseudomonas* spp., *Rhizobium* spp., en particular *Rhizobium trifolii*, *Rhizopogon* spp., *Scleroderma* spp., *Suillus* spp., *Streptomyces* spp.

- 35 Ejemplos de extractos y productos de plantas formados por microorganismos que incluyen proteínas y metabolitos secundarios que se emplean o se pueden usar como plaguicidas biológicos son:

- 40 *Allium sativum*, *Artemisia absinthium*, azadirachtin, Biokeeper WP, *Cassia nigricans*, *Celastrus angulatus*, *Chenopodium anthelminticum*, chitin, Armour-Zen, *Dryopteris filix-mas*, *Equisetum arvense*, Fortune Aza, Fungastop, Heads Up (extracto de quinina *Chenopodium*), *Pyrethrum/Pyrethrins*, *Quassia amara*, *Quercus*, Quillaja, Regalia, "Requiem™ Insecticide", rotenona, riania/rianodina, *Symphytum officinale*, *Tanacetum vulgare*, timol, Triact 70, TriCon, *Tropaeolum majus*, *Urtica dioica*, Veratrin, *Viscum album*, extracto de Brassicaceae, en particular semilla de colza en polvo o mostaza en polvo.

Protector como componentes de mezcla

- 45 Los compuestos de la fórmula (I) se pueden combinar con protectores como, por ejemplo, benoxacor, cloquintocet (-mexil), ciometrinil, cipsosulfamida, diclormid, fenclorazol (-etil), fenclorim, flurazol, fluxofenim, furilazol, isoxadifen (-etil), mefenpir (-dietil), anhídrido naftálico, oxabetrinilo, 2-metoxi-N-((4-[(metilcarbamoil)amino]fenil)sulfonil)benzamida (CAS 129531-12-0), 4-(dicloroacetil)-1-oxa-4-azaspiro[4.5]decano (CAS 71526-07-3), 2,2,5-trimetil-3-(dicloroacetil)-1,3-oxazolidina (CAS 52836-31-4).

Plantas y partes de plantas

- 50 Todas las plantas y partes de plantas se pueden tratar de acuerdo con la invención. Aquí, plantas se refiere a todas las plantas y partes de plantas como plantas salvajes deseadas e indeseadas o plantas de cultivo (incluyendo plantas de cultivo de origen natural), por ejemplo, cereales (trigo, arroz, triticale, cebada, centeno, avena), maíz, semillas de soja, patata, remolacha azucarera, caña de azúcar, tomates, pimiento, pepino, melón, zanahoria, sandía, cebolla, lechuga, espinaca, puerro, porotos, *Brassica oleracea* (p. ej., repollo) y otras especies vegetales, algodón, tabaco, semilla de colza y también plantas frutales (con las frutas manzana, pera, frutas cítricas y parras). Las plantas de

- cultivo pueden ser plantas que se pueden obtener por procedimientos de reproducción y optimización convencionales o por procedimientos de ingeniería genética y biotecnológicos o combinaciones de estos procedimientos, incluyendo plantas transgénicas e incluyendo las variedades de plantas que pueden o no estar protegidas por derechos de propiedad de variedad. Plantas se refiere a todas las etapas del desarrollo, como semillas, plántulas, plantas jóvenes (inmaduras) hasta plantas maduras. Partes de plantas se refieren a todas las partes y órganos de las plantas por encima y debajo de la tierra, como tallo, hoja, flor y raíz, algunos ejemplos que se dan son hojas, agujas, caña, tallo, flores, cuerpos de frutas, frutas y semillas y también tubérculos, raíces y rizomas. Partes de plantas también incluyen plantas cosechadas o partes de plantas cosechadas y material de propagación vegetativo y generativo, por ejemplo, plántulas, tubérculos, rizomas, esquejes y semillas.
- El tratamiento de acuerdo con la invención de las plantas y partes de plantas con los compuestos de la fórmula (I) se lleva a cabo directamente o permitiendo que los compuestos actúan en los alrededores, ambiente o espacio de almacenamiento por los procedimientos de tratamiento habituales, por ejemplo, por inmersión, pulverización, evaporación, niebla, dispersión, pintura, inyección y, en el caso de material de propagación, en particular en el caso de semillas, también aplicando una o más capas.
- Como ya se mencionó anteriormente, es posible tratar todas las plantas y sus partes de acuerdo con la invención. En una realización preferida, se tratan especies de plantas silvestres y variedades cultivadas de plantas, o las que se obtienen mediante procedimientos convencionales biológicos de reproducción, como cruzamiento o fusión de protoplastos y también sus partes. En una realización preferida adicional, se tratan las plantas transgénicas y variedades cultivadas de plantas obtenidas por procedimientos de ingeniería genética, si corresponde en combinación con procedimientos convencionales (organismos genéticamente modificados) y partes de estos. Los términos "partes" o "partes de planta" se explicaron anteriormente. La invención se usa con preferencia particular para tratar plantas de las variedades cultivadas comercialmente habituales respectivas o las que están en uso. Se debe entender que las variedades cultivadas se refieren a plantas que tienen nuevas propiedades ("rasgos") y que se obtuvieron por cruzamiento convencional, por mutagénesis o por técnicas de ADN recombinante. Estas pueden ser variedades cultivadas, variedades, biotipos o genotipos.

Planta transgénica, tratamiento de semilla y eventos de integración

- Las plantas transgénicas o variedades cultivadas de plantas (las obtenidas por ingeniería genética) que se deben tratar con preferencia de acuerdo con la invención incluyen todas las plantas que, a través de modificación genética, recibieron material genético que otorga propiedades útiles ventajosas particulares ("rasgos") a estas plantas. Ejemplos de tales propiedades son mejor crecimiento de la planta, mayor tolerancia a altas o bajas temperaturas, mayor tolerancia a sequía o a niveles de agua o salinidad del suelo, mejor rendimiento de la floración, más fácil cosecha, maduración acelerada, mayores rendimientos, mayor calidad y/o un mayor valor nutricional de los productos cosechados, mejor vida en almacenamiento y/o procesabilidad de los productos cosechados. Ejemplos adicionales y particularmente destacados de tales propiedades son mayor resistencia de las plantas contra plagas animales y microbianas, como contra insectos, arácnidos, nemátodos, ácaros, babosas y caracoles que se deben, por ejemplo, a toxinas formadas en las plantas, en particular las formadas en las plantas por el material genético de *Bacillus thuringiensis* (por ejemplo por los genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb y CryIF y también combinaciones de estos), además mayor resistencia de las plantas contra hongos, bacterias y/o virus fitopatogénicos que se deben, por ejemplo, a resistencia adquirida sistémica (SAR), sistemina, fitoalexinas, provocadores y también genes de resistencia y proteínas y toxinas expresadas conforme a esto, y también mayor tolerancia de las plantas a determinados compuestos herbicidamente activos, por ejemplo, imidazolinonas, sulfonilureas, glifosato o fosfinotricina (por ejemplo el gen "PAT"). Los genes que otorgan los rasgos deseados en cuestión también pueden estar presentes en combinaciones entre sí en las plantas transgénicas. Ejemplos de plantas transgénicas que se pueden mencionar son las plantas de cultivo importantes, como cereales (trigo, arroz, triticale, cebada, centeno, avena), maíz, semillas de soja, patata, remolacha azucarera, caña de azúcar, tomates, frijoles y otros tipos de vegetales, algodón, tabaco, semilla de colza y también plantas frutales (con las frutas manzana, pera, frutas cítricas y uvas), con énfasis particular en el maíz, semillas de soja, trigo, arroz, patatas, algodón, caña de azúcar, tabaco y semilla de colza. Los rasgos a los que se les da un énfasis particular son la mayor resistencia de las plantas a insectos, arácnidos, nemátodos y babosas y caracoles.

Protección de cultivo - tipos de tratamiento

- El tratamiento de las plantas y partes de plantas con los compuestos de la fórmula (I) se lleva a cabo directamente o por acción de su ambiente, hábitat o espacio de almacenamiento usando procedimientos de tratamiento habituales, por ejemplo por goteo, pulverización, atomización, irrigación, evaporación, espolvoreo, niebla, transmisión, formación de espuma, pintura, aplicación, inyección, agua (empapado), irrigación por goteo y, en el caso de material de propagación, en particular en el caso de semillas, también como un polvo para el tratamiento de semilla seca, una solución para el tratamiento de semilla líquida, un polvo soluble en agua para tratamiento de suspensión, mediante incrustación, recubrimiento con una o más capas, etc. También es posible aplicar los compuestos de la fórmula (I) por el procedimiento de volumen ultra bajo o inyectar la forma de aplicación o el propio compuesto de la fórmula (I) en el suelo.

Un tratamiento directo preferido de las plantas es la aplicación foliar, es decir, los compuestos de la fórmula (I) se aplican al follaje, donde la frecuencia de tratamiento y la tasa de aplicación se deberían ajustar de acuerdo con el nivel de infestación con la plaga en cuestión.

En el caso de compuestos sistémicamente activos, los compuestos de la fórmula (I) también acceden a las plantas por el sistema radicular. Las plantas se tratan luego por la acción de los compuestos de la fórmula (I) en el hábitat de la planta. Esto se puede hacer, por ejemplo, por empapado o mezclando en el suelo o la solución de nutriente, es decir, el locus de la planta (por ejemplo, sistemas hidropónicos o de suelo) se impregnan con una forma líquida de los compuestos de la fórmula (I), o por aplicación en el suelo, es decir, los compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la invención se introducen en forma sólida (por ejemplo, en la forma de gránulos) en el locus de las plantas, o por goteo (a menudo denominado "quimigación"), es decir la aplicación líquida de los compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con la invención desde líneas de riego en la superficie o subsuelo durante un determinado período de tiempo junto con diversas cantidades de agua en lugares definidos en la cercanía de las plantas. En el caso de cultivos de arrozal, esto también se puede hacer midiendo el compuesto de la fórmula (I) en una forma de aplicación sólida (por ejemplo, como gránulos) en un campo de arrozal inundado.

Tratamiento de semillas

El control de plagas animales tratando la semilla de plantas se conoce hace mucho tiempo y es objeto de mejoras continuas. Sin embargo, el tratamiento de semillas implica una serie de problemas que no siempre se pueden solucionar de forma satisfactoria. Por lo tanto, se desea desarrollar procedimientos para proteger la semilla y la planta germinada que prescinda de, o al menos reduce considerablemente, la aplicación adicional de pesticidas durante el almacenamiento, luego de la siembra o después de la emergencia de las plantas. También se desea optimizar la cantidad de compuesto activo utilizado de una forma de proporcionar protección óptima para la semilla y planta germinada de ataques de plagas animales, pero sin dañar la planta en sí misma por el compuesto activo utilizado. En particular, los procedimientos para el tratamiento de semillas también deberían considerar las propiedades insecticidas o nematicidas intrínsecas de plantas transgénicas resistentes o tolerantes a las plagas para lograr la protección óptima de la semilla y también la planta germinada con un mínimo de pesticidas utilizados.

Por lo tanto la presente invención en particular también se refiere a un procedimiento para la protección de semillas y plantas germinadas, de ataques de plagas, tratando la semilla con uno de los compuestos de la fórmula (I). El procedimiento de acuerdo con la invención para proteger semillas y plantas germinadas contra ataques de plagas también comprende un procedimiento donde la semilla se trata simultáneamente en una operación o secuencialmente con un compuesto de la fórmula (I) y un componente de mezcla. También comprende un procedimiento donde la semilla se trata en momentos diferentes con un compuesto de la fórmula (I) y un componente de mezcla.

La invención del mismo modo se refiere al uso de los compuestos de la fórmula (I) para el tratamiento de semillas para proteger la semilla y la planta resultante de las plagas animales.

Además, lo divulgado pero no reivindicado *per se* es una semilla que se trató con un compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con la invención como para proporcionar protección de plagas animales. Se divulga pero no se reivindica *per se* una semilla que se trató simultáneamente con un compuesto de la fórmula (I) y un componente de mezcla. Se divulga pero no se reivindica una semilla que se trataron en momentos diferentes con un compuesto de la fórmula (I) y un componente de mezcla. En el caso de semillas tratadas en puntos diferentes en el tiempo con un compuesto de la fórmula (I) y un componente de mezcla, las sustancias individuales pueden estar presentes en la semilla en diferentes capas. Aquí, las capas que comprenden un compuesto de la fórmula (I) y los componentes de mezclas se pueden separar opcionalmente por una capa intermedia. Se divulga pero no se reivindica *per se* una semilla donde un compuesto de la fórmula (I) y un componente de mezcla se aplicaron como un componente de recubrimiento o como una capa adicional o capas adicionales además del recubrimiento.

Además, se divulga pero no se reivindica *per se* una semilla que, después del tratamiento con un compuesto de la fórmula (I), se someten a un proceso de recubrimiento de película para evitar la abrasión de polvos en la semilla.

Una de las ventajas encontradas con un compuesto de acción sistémica de la fórmula (I) es el hecho de que, al tratar la semilla, no solo la semilla en sí misma sino también las plantas que resultan de estas están, luego de la emergencia, protegidas contra plagas animales. De esta forma, se puede prescindir del tratamiento inmediato del cultivo al momento de sembrar o poco después de eso.

Se debe considerar una ventaja adicional el hecho de que por el tratamiento de la semilla con un compuesto de la fórmula (I), se puede mejorar la germinación y emergencia de la semilla tratada.

También se debe considerar ventajoso que los compuestos de la fórmula (I) se pueden usar en particular también para la semilla transgénica.

Además, los compuestos de la fórmula (I) se pueden emplear en combinación con composiciones o compuestos de tecnología de señalización, lo que lleva a una mejor colonización por simbiosis como, por ejemplo, hongos o bacterias rizobio, micorrizas y/o endofítica y/o a una mejor fijación de nitrógeno.

Los compuestos de la fórmula (I) son adecuados para la protección de semillas de cualquier variedad de planta que se usa en la agricultura, en el invernadero, en bosques o en horticultura. En particular, esto adopta la forma de semilla de cereales (por ejemplo, trigo, cebada, centeno, mijo y avena), maíz, algodón, semillas de soja, arroz, patatas, girasol, café, tabaco, canola, semilla de colza, remolacha (por ejemplo remolacha azucarera y forrajera), maní, vegetales (por ejemplo, tomates, pepinos, frijol, vegetales crucíferos, cebollas y lechugas), plantas de frutas, pastos y plantas ornamentales. El tratamiento de semillas de cereales (como trigo, cebada, centeno y avena), maíz, semillas de soja, algodón, canola, semilla de colza, vegetales y arroz es de particular importancia.

Como ya se mencionó anteriormente, el tratamiento de semillas transgénicas con un compuesto de la fórmula (I) también es de particular importancia. Esto adopta la forma de semillas de plantas que, como norma, comprenden al menos un gen heterólogo que gobierna la expresión de un polipéptido en particular con propiedades insecticidas y/o nematocidas. Los genes heterólogos en las semillas transgénicas pueden originarse de microorganismos como *Bacillus*, *Rhizobium*, *Pseudomonas*, *Serratia*, *Trichoderma*, *Clavibacter*, *Glomus* o *Gliocladium*. La presente invención es particularmente adecuada para el tratamiento de semillas transgénicas que comprenden al menos un gen heterólogo que se origina de *Bacillus* sp. Particularmente se prefiere un gen heterólogo derivado de *Bacillus thuringiensis*.

En el contexto de la presente invención, el compuesto de la fórmula (I) se aplica a la semilla. Preferentemente, la semilla se trata en un estado donde es lo suficientemente estable para evitar el daño durante el tratamiento. En general, la semilla se puede tratar en cualquier momento de tiempo entre la cosecha y la siembra. La semilla generalmente usada se separó de la planta y no tiene mazorcas, cáscaras, tallos, recubrimientos, pelos o la pulpa de las frutas. Por ejemplo, es posible usar semillas que se cosecharon, limpiaron y secaron a un contenido de humedad que permite el almacenamiento. De manera alternativa, también es posible usar semillas que, luego del secado, fueron tratadas con, por ejemplo, agua y luego se volvieron a secar, por ejemplo se cebaron. En el caso de semillas de arroz, también es posible usar semillas que se empaparon, por ejemplo en agua hasta determinada etapa del embrión de arroz ("etapa pecho de paloma"), estimulando la germinación y una emergencia más uniforme.

Al tratar las semillas, se debe tener cuidado con la cantidad de compuesto de la fórmula (I) aplicada a la semilla y/o la cantidad de otros aditivos que se elige en tal modo que la germinación de la semilla no se vea afectado negativamente, o que la planta resultante no se dañe. Eso se debe asegurar particularmente en el caso de compuestos activos que pueden presentar efectos fitotóxicos en determinadas tasas de aplicación.

En general, los compuestos de la fórmula (I) se aplican a la semilla en una formulación adecuada. Formulaciones y procesos adecuados para el tratamiento de semillas son conocidos por los expertos en la técnica.

Los compuestos de la fórmula (I) se pueden convertir en las formulaciones de recubrimiento de semilla habituales, como soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, espumas, lechadas u otras composiciones de recubrimiento para semillas, y también formulaciones de ULV.

Estas formulaciones se preparan de forma conocida mezclando los compuestos de la fórmula (I) con aditivos habituales como, por ejemplo, extensores habituales y también solventes o diluyentes, colorantes, agentes humectantes, dispersantes, emulsionantes, antiespumantes, conservantes, espesantes secundarios, adhesivos, giberelinas y también agua.

Los colorantes que pueden estar presentes en las formulaciones de recubrimiento de semillas que se pueden usar de acuerdo con la invención son todos colorantes que son habituales para tales efectos. Es posible usar pigmentos, que son solubles con moderación en agua, o colorantes, que son solubles en agua. Ejemplos incluyen colorantes conocidos por los nombres Rodamina B, C.I. Pigmento rojo 112 y C.I. Solvente rojo 1.

Los agentes humectantes útiles que pueden estar presentes en las formulaciones de recubrimiento de semilla útiles de acuerdo con la invención son todas las sustancias que promueven la humectación y que se usan convencionalmente para la formulación de compuestos agroquímicamente activos. Se da preferencia al uso de alquilnaftalenosulfonatos, como diisopropil o diisobutil naftalenosulfonatos.

Agentes dispersantes y/o emulsionantes útiles que pueden estar presentes en las formulaciones de revestimiento de semillas útiles de acuerdo con la invención son todos los dispersantes no iónicos, aniónicos y catiónicos que se usan de forma conveniente para la formulación de los ingredientes agroquímicos activos. Se da preferencia al uso de dispersantes no iónicos o aniónicos o mezclas de dispersantes no iónicos o aniónicos. Los dispersantes no iónicos adecuados incluyen en particular polímeros de bloque de óxido de etileno/óxido de propileno, alquilfenol poliglicol éteres y tristirilfenol poliglicol éteres y los derivados fosfatados o sulfatados de estos. Los dispersantes aniónicos adecuados son en particular lignosulfonatos, sales de ácido poliácrico y condensados de arilsulfonato/formaldehído.

Agentes antiespumantes útiles que pueden estar presentes en las formulaciones de revestimiento de semillas útiles de acuerdo con la invención son todas las sustancias que inhiben la espuma que se usan de forma conveniente para la formulación de los ingredientes agroquímicos activos. Se da preferencia al uso de antiespumantes de silicona y estearato de magnesio.

Los conservantes que pueden estar presentes en las formulaciones de revestimiento de semillas útiles de acuerdo con la invención son todas las sustancias útiles a tales efectos en composiciones agroquímicas. Ejemplos incluyen diclorofeno y alcohol bencílico hemiformal.

5 Los espesantes secundarios que pueden estar presentes en las formulaciones de recubrimiento de semilla útiles de acuerdo con la invención son todas las sustancias que se pueden usar con tales efectos en las composiciones agroquímicas. Se prefieren los derivados de celulosa, derivados de ácido acrílico, xantana, arcillas modificadas y sílice finamente dividido.

10 Adhesivos útiles que pueden estar presentes en las formulaciones de revestimiento de semillas útiles de acuerdo con la invención son todos los aglutinantes habituales que se pueden usar en los productos de revestimiento de semillas. Se pueden mencionar polivinilpirrolidona, polivinil acetato, polivinil alcohol y tilosa como preferidos.

Las giberelinas que pueden estar presentes en las formulaciones de recubrimiento de semilla que se pueden usar de acuerdo con la invención son preferentemente las giberelinas A1, A3 (= ácido giberélico), A4 y A7; el ácido giberélico se usa de manera especialmente preferida. Las giberelinas se conocen (véase, R. Wegler "Chemie der Pflanzenschutz- und Schädlingsbekämpfungsmittel", vol. 2, Springer Verlag, 1970, pp. 401-412).

15 Las formulaciones de recubrimiento de semilla útiles de acuerdo con la invención se pueden usar para tratar una amplia variedad de diferentes tipos de semillas sea directamente o después de la dilución previa con agua. Por ejemplo, los concentrados o las preparaciones que se pueden obtener a partir de estos por dilución con agua se pueden usar para recubrir la semilla de cereales, como trigo, cebada, centeno, avena y triticale y también la semilla de maíz, arroz, semilla de colza, arvejas, frijoles, algodón, girasol, semillas de soja y remolachas o una amplia variedad de diferentes semillas vegetales. Las formulaciones de recubrimiento de semillas útiles de acuerdo con la invención, o las formas de uso diluidas de estas, también se pueden usar para recubrir la semilla de plantas transgénicas.

20 Para el tratamiento de semillas con las formulaciones de recubrimiento de semilla útiles de acuerdo con la invención, o las formas de uso preparadas a partir de esto agregando agua, todas las unidades de mezcla útiles habitualmente para el recubrimiento de semillas son útiles. Específicamente, el procedimiento de recubrimiento de semilla debe colocar la semilla en un mezclador, que funciona por lotes o continuamente, agregar la cantidad deseada particular de formulaciones de recubrimiento de semilla, sea como tal o después de la dilución previa con agua y mezclar todo hasta que la formulación se distribuya homogéneamente en la semilla. Si corresponde, después de esto se realiza una operación de secado.

30 La tasa de aplicación de las formulaciones de recubrimiento de semilla útiles de acuerdo con la invención puede variar dentro de un intervalo relativamente amplio. Es guiada por el contenido particular de los compuestos de la fórmula (I) en las formulaciones y por la semilla. Las tasas de aplicación del compuesto de la fórmula (I) son generalmente entre 0,001 y 50 g por kilogramo de semilla, preferentemente entre 0,01 y 15 g por kilogramo de semilla.

Salud animal

35 En el campo de la salud animal, es decir, en el campo de medicina veterinaria, los compuestos de la fórmula (I) son activos contra parásitos animales, en particular ectoparásitos o endoparásitos. El término endoparásitos incluye en particular helmintos y protozoarios, como coccidia. Los ectoparásitos son típicos y preferentemente artrópodos, en particular insectos o ácaros.

40 En el campo de la medicina veterinaria los compuestos de la fórmula (I) son adecuados, con toxicidad favorable en animales de sangre caliente, para controlar parásitos que ocurren en la reproducción animal y cría animal en ganado, animales de cría, zoológico, laboratorio, experimentales o domésticos. Son activos contra todas las etapas o etapas específicas de desarrollo de los parásitos.

El ganado agrícola incluye, por ejemplo, mamíferos, como ovejas, cabras, caballos, burros, camellos, búfalos, conejos, renos, gamos, y en particular ganado y cerdos; o aves de corral como pavos, patos, gansos y en particular gallinas; peces o crustáceos, p. ej., en cultivo acuático; o según sea el caso, insectos como abejas.

45 Los animales domésticos incluyen, por ejemplo, mamíferos, como hámsters, cobayos, ratas, ratones, chinchillas, hurones o en particular perros, gatos; aves enjauladas; reptiles; anfibios y peces de acuario.

De acuerdo con una realización particular, los compuestos de la fórmula (I) se administran a mamíferos.

De acuerdo con otra realización particular, los compuestos de la fórmula (I) se administran a aves, a saber aves de jaula y en particular aves de corral.

50 Al usar los compuestos de la fórmula (I) para controlar parásitos de animales, se pretende reducir o evitar enfermedades, casos de muerte y reducciones de rendimiento (en el caso de carne, leche, lana, pieles, huevos, miel y similares), de modo de posibilitar un mantenimiento más económico y simple y se logre un mejor bienestar animal.

El término "control" o "controlar" como se usa en la presente respecto del campo de salud animal, significa que los compuestos de la fórmula (I) son eficaces para reducir la incidencia del parásito respectivo en un animal infectado con tales parásitos a niveles inocuos. Más específicamente, "controlar", como se usa en la presente, significa que los compuestos de la fórmula (I) son eficaces para matar el parásito respectivo, inhibir su crecimiento o inhibir su proliferación.

5

Ejemplos de artrópodos incluyen, de modo no taxativo

del orden de Anoplurida, por ejemplo, Haematopinus spp., Linognathus spp., Pediculus spp., Phtirus spp., Solenopotes spp.;

10

del orden de Mallophagida y los subórdenes Amblycerina y Ischnocerina, por ejemplo, Bovicola spp., Damalina spp., Felicola spp., Lepikentron spp., Menopon spp., Trichodectes spp., Trimenopon spp., Trinoton spp., Werneckiella spp.;

15

del orden de los dípteros y los subórdenes nematóceros y braquíceros, por ejemplo Aedes spp., Anopheles spp., Atylotus spp., Braula spp., Calliphora spp., Chrysomyia spp., Chrysops spp., Culex spp., Culicoides spp., Eusimulium spp., Fannia spp., Gasterophilus spp., Glossina spp., Haematobia spp., Haematopota spp., Hippobosca spp., Hybomitra spp., Hydrotaea spp., Hypoderma spp., Lipoptena spp., Lucilia spp., Lutzomyia spp., Melophagus spp., Morellia spp., Musca spp., Odagmia spp., Oestrus spp., Philipomyia spp., Phlebotomus spp., Rhinoestrus spp., Sarcophaga spp., Simulium spp., Stomoxys spp., Tabanus spp., Tipula spp., Wilhelmia spp., Wohlfahrtia spp.

del orden de los sifonápteros, por ejemplo, Ceratophyllus spp., Ctenocephalides spp., Pulex spp., Tunga spp., Xenopsylla spp.;

20

del orden de heterópteros, por ejemplo Cimex spp., Panstrongylus spp., Rhodnius spp., Triatoma spp.; así como plagas problemáticas o de higiene del orden de los blatodeos.

Asimismo, entre los artrópodos, se pueden mencionar los siguientes ácaros a modo de ejemplo, de modo no taxativo:

25

de la subclase de ácaros (Acarina) y el orden de Metastigmata, por ejemplo, de la familia de argasidae como Argas spp., Ornithodoros spp., Otobius spp., de la familia de Ixodidae como Amblyomma spp., Dermacentor spp., Haemaphysalis spp., Hyalomma spp., Ixodes spp., Rhipicephalus (Boophilus) spp., Rhipicephalus spp. (el género original de garrapatas de múltiples hospedadores); del orden de mesostigmata como Dermanyssus spp., Ornithonyssus spp., Pneumonyssus spp., Raillietia spp., Sternostoma spp., Tropilaelaps spp., Varroa spp.; del orden de Actinieda (Prostigmata), por ejemplo Acarapis spp., Cheyletiella spp., Demodex spp., Listrophorus spp., Myobia spp., Neotrombicula spp., Ornithocheyletia spp., Psorergates spp., Trombicula spp.; y del orden de Acaridida (Astigmata), por ejemplo Acarus spp., Caloglyphus spp., Chorioptes spp., Cytodites spp., Hypodectes spp., Knemidocoptes spp., Laminosioptes spp., Notoedres spp., Otodectes spp., Psoroptes spp., Pterolichus spp., Sarcoptes spp., Trixacarus spp., Tyrophagus spp.

30

Ejemplos de protozoos parásitos incluyen, de modo no taxativo:

Mastigophora (Flagellata) como:

Metamonada: del orden Diplomonadida, por ejemplo, Giardia spp., Spironucleus spp.

35

Parabasala: del orden Trichomonadida, por ejemplo, Histomonas spp., Pentatrichomonas spp., Tetratrichomonas spp., Trichomonas spp., Tritrichomonas spp.

Euglenozoa: del orden Trypanosomatida, por ejemplo, Leishmania spp., Trypanosoma spp.

Sarcomastigophora (Rhizopoda) como Entamoebidae, por ejemplo, Entamoeba spp., Centamoebidae, por ejemplo, Acanthamoeba sp., Euamoebidae, p. ej. Hartmanella sp.

40

Alveolata como Apicomplexa (Sporozoa): por ejemplo Cryptosporidium spp.; del orden Eimeriida, por ejemplo, Besnoitia spp., Cystoisospora spp., Eimeria spp., Hammondia spp., Isospora spp., Neospora spp., Sarcocystis spp., Toxoplasma spp.; del orden Adeleida, p. ej., Hepatozoon spp., Klossiella spp.; del orden Hemosporida, p. ej., Leucocytozoon spp., Plasmodium spp.; del orden Piroplasmida, p. ej., Babesia spp., Ciliophora spp., Echinozoon spp., Theileria spp.; del orden Vesiculiferida, p. ej., Balantidium spp., Buxtonella spp.

45

Microspora como Encephalitozoon spp., Enterocytozoon spp., Globidium spp., Nosema spp., y también, p. ej., Myxozoa spp.

Los helmintos patógenos a humanos o animales incluyen, por ejemplo, acantocéfalos, nematodos, pentastoma y platelmintos (por ejemplo monogéneos, cestodos y trematodos).

Ejemplos de helmintos incluyen, de modo no taxativo:

Monogeneos: p.ej.: *Dactylogyrus* spp., *Gyrodactylus* spp., *Microbothrium* spp., *Polystoma* spp., *Troglocephalus* spp.

Cestodos: del orden de los pseudofilidos, por ejemplo: *Bothridium* spp., *Diphylobothrium* spp., *Diplogonoporus* spp., *Ichthyobothrium* spp., *Ligula* spp., *Schistocephalus* spp., *Spirometra* spp.

5 Del orden de los ciclofilídeos, por ejemplo: *Andrya* spp., *Anoplocephala* spp., *Avitellina* spp., *Bertiella* spp., *Cittotaenia* spp., *Davainea* spp., *Diorchis* spp., *Diplopylidium* spp., *Dipylidium* spp., *Echinococcus* spp., *Echinocotyle* spp., *Echinolepis* spp., *Hydatigera* spp., *Hymenolepis* spp., *Joyeuxiella* spp., *Mesocostoides* spp., *Moniezia* spp., *Paranoplocephala* spp., *Raillietina* spp., *Stilesia* spp., *Taenia* spp., *Thysaniezia* spp., *Thysanosoma* spp.

10 Trematodos: de la clase de los digeneos, por ejemplo: *Austrobilharzia* spp., *Brachylaima* spp., *Calicophoron* spp., *Catantropis* spp., *Clonorchis* spp., *Collyriclum* spp., *Cotylophoron* spp., *Cyclocoelum* spp., *Dicrocoelium* spp., *Diplostomum* spp., *Echinochasmus* spp., *Echinoparyphium* spp., *Echinostoma* spp., *Eurytrema* spp., *Fasciola* spp., *Fasciolides* spp., *Fasciolopsis* spp., *Fischöderius* spp., *Gastrothylacus* spp., *Gigantobilharzia* spp., *Gigantocotyle* spp., *Heterophyes* spp., *Hypoderaeum* spp., *Leucochloridium* spp., *Metagonimus* spp., *Metorchis* spp., *Nanophyetus* spp., *Notocotylus* spp., *Opisthorchis* spp., *Ornithobilharzia* spp., *Paragonimus* spp., *Paramphistomum* spp., *Plagiorchis* spp., *Posthodiplostomum* spp., *Prosthogonimus* spp., *Schistosoma* spp., *Trichobilharzia* spp., *Troglostrongylus* spp., *Typhlocoelum* spp.

15 Nematodos: del orden de los triquinélidos, por ejemplo: *Capillaria* spp., *Eucolus* spp., *Paracapillaria* spp., *Trichinella* spp., *Trichomosoides* spp., *Trichuris* spp.

del orden de los tilénquidos, por ejemplo: *Micronema* spp., *Parastrongyloides* spp., *Strongyloides* spp.

20 del orden de Rhabditina, por ejemplo: *Aelurostrongylus* spp., *Amidostomum* spp., *Ancylostoma* spp., *Angiostrongylus* spp., *Bronchonema* spp., *Bunostomum* spp., *Chabertia* spp., *Cooperia* spp., *Cooperioides* spp., *Crenosoma* spp., *Cyathostomum* spp., *Cyclocercus* spp., *Cyclodontostomum* spp., *Cylicocylus* spp., *Cylicostephanus* spp., *Cylindropharynx* spp., *Cystocaulus* spp., *Dictyocaulus* spp., *Elaphostrongylus* spp., *Filaroides* spp., *Globocephalus* spp., *Graphidium* spp., *Gyalocephalus* spp., *Haemonchus* spp., *Heligmosomoides* spp., *Hyostrongylus* spp., *Marshallagia* spp., *Metastrongylus* spp., *Muellerius* spp., *Necator* spp., *Nematodirus* spp., *Neostrongylus* spp., *Nippostrongylus* spp., *Obeliscoides* spp., *Oesophagodontus* spp., *Oesophagostomum* spp., *Ollulanus* spp., *Ornithostrongylus* spp., *Oslerus* spp., *Ostertagia* spp., *Paracooperia* spp., *Paracrenosoma* spp., *Parafilaroides* spp., *Parelaphostrongylus* spp., *Pneumocaulus* spp., *Pneumostrongylus* spp., *Poteriostomum* spp., *Protostrongylus* spp., *Spicocaulus* spp., *Stephanurus* spp., *Strongylus* spp., *Syngamus* spp., *Teladorsagia* spp., *Trichonema* spp., *Trichostrongylus* spp., *Triodontophorus* spp., *Troglostrongylus* spp., *Uncinaria* spp.

30 del orden de Spirurida, por ejemplo: *Acanthocheilonema* spp., *Anisakis* spp., *Ascaridia* spp., *Ascaris* spp., *Ascarops* spp., *Aspicularis* spp., *Baylisascaris* spp., *Brugia* spp., *Cercopithifilaria* spp., *Crassicauda* spp., *Dipetalonema* spp., *Dirofilaria* spp., *Dracunculus* spp., *Draschia* spp., *Enterobius* spp., *Filaria* spp., *Gnathostoma* spp., *Gongylonema* spp., *Habronema* spp., *Heterakis* spp., *Litomosoides* spp., *Loa* spp., *Onchocerca* spp., *Oxyuris* spp., *Parabronema* spp., *Parafilaria* spp., *Parascaris* spp., *Passalurus* spp., *Physaloptera* spp., *Probstmayria* spp., *Pseudofilaria* spp., *Setaria* spp., *Skjrabinema* spp., *Spirocerca* spp., *Stephanofilaria* spp., *Strongyluris* spp., *Syphacia* spp., *Thelazia* spp., *Toxascaris* spp., *Toxocara* spp., *Wuchereria* spp.

Acantocéfalos: del orden de Oligacanthorhynchida, por ejemplo: *Macracanthorhynchus* spp., *Prosthenorchis* spp., del orden de Moniliformida, por ejemplo: *Moniliformis* spp.

40 del orden de las polimorfidas, por ejemplo: *Filicollis* spp.; del orden de Echinorhynchida, por ejemplo: *Acanthocephalus* spp., *Echinorhynchus* spp., *Leptorhynchoides* spp.

Pentastoma: del orden de Porocephalida, por ejemplo: *Linguatula* spp.

45 En el campo veterinario y para mantener animales, la administración de los compuestos de la fórmula (I) se lleva a cabo por procedimientos conocidos generalmente en la técnica, como de forma entérica, parenteral, dérmica o nasal en forma de preparaciones adecuadas. La administración se puede llevar a cabo profiláctica, metafiláctica o terapéuticamente.

Por ende, una realización de la presente invención se refiere a los compuestos de la fórmula (I) para el uso de un medicamento.

Otro aspecto se refiere a los compuestos de la fórmula (I) para usar como un agente antiendoparasitario.

50 Otro aspecto particular se refiere a los compuestos de la fórmula (I) para usar como agente antelmíntico, más particular para usar como un agente nematocida, un agente plathelminthocida, un agente acantocéfalicida, o un agente pentastomicida.

Otro aspecto particular se refiere a los compuestos de la fórmula (I) para usar como un agente antiprotozoario.

Otro aspecto se refiere a los compuestos de la fórmula (I) para usar como un agente antiektoparasitario, en particular un agente artropodocida, más particular un agente insecticida o agente acaricida.

Otros aspectos de la invención son formulaciones veterinarias, que comprenden una cantidad eficaz de al menos un compuesto de la fórmula (I) y al menos uno de lo siguiente: excipiente farmacéuticamente aceptable (p. ej. diluyentes sólidos o líquidos), auxiliar farmacéuticamente aceptable (p. ej. tensioactivos), en particular un excipiente farmacéuticamente aceptable y/o auxiliar farmacéuticamente aceptable que se usa normalmente en formulaciones veterinarias.

Un aspecto relacionado de la invención es un procedimiento para preparar una formulación veterinaria como se describe en la presente, que comprende el paso de mezclar al menos un compuesto de la fórmula (I) con excipientes y auxiliares farmacéuticamente aceptables, en particular con excipientes y/o auxiliares farmacéuticamente compatibles que se usan normalmente en formulaciones veterinarias.

Otro aspecto particular de la invención son las formulaciones veterinarias, que se seleccionan del grupo de formulaciones ectoparasitocidas y endoparasitocidas, más particular que se seleccionan del grupo de formulaciones antihelmínticas, antiprotozoarias, artropodocidas, incluso más particular que se seleccionan del grupo de formulaciones nematocidas, platihelmínticas, acantocefalidocidas, pentastomocidas, insecticidas y acaricidas, de acuerdo con los aspectos mencionados, así como también procedimientos para la preparación.

Se divulga pero no se reivindica *per se* un procedimiento para el tratamiento de una infección parasitaria, en particular una infección por un parásito que se selecciona del grupo de ectoparásitos y endoparásitos mencionados en la presente, al aplicar una cantidad eficaz de un compuesto de la fórmula (I) a un animal, en particular un animal no humano, que lo necesita.

Se divulga pero no se reivindica *per se* un procedimiento para el tratamiento de una infección parasitaria, en particular una infección por un parásito que se selecciona del grupo de ectoparásitos y endoparásitos mencionados en la presente, al aplicar una formulación veterinaria como se define en la presente a un animal, en particular un animal no humano, que lo necesita.

Se divulga pero no se reivindica *per se* el uso de los compuestos de la fórmula (I) en el tratamiento de una infección parasitaria, en particular una infección por un parásito que se selecciona del grupo de ectoparásitos y endoparásitos mencionados en la presente, en un animal, en particular un animal no humano.

En el presente contexto de salud animal o campo veterinario, el término "tratamiento" incluye tratamiento profiláctico, metafiláctico y terapéutico.

En una realización particular, mezclas de al menos un compuesto de la fórmula (I) con otros ingredientes activos, particularmente con endo- y ectoparasitocidas, se proveen para el campo veterinario.

En el campo de la salud animal "mezcla" no solo significa que dos (o más) ingredientes activos diferentes se formulan en una formulación conjunta y que en consecuencia se aplican juntos sino también se refiere a productos que comprenden formulaciones separadas para cada compuesto activo. Por ende, si debe aplicarse más de dos compuestos activos, todos los compuestos activos pueden formularse en una formulación conjunta o todos los compuestos activos pueden formularse en formulaciones separadas; del mismo modo son posibles formas mixtas donde algunos de los compuestos activos se formulan conjuntamente y algunos de los compuestos activos se formulan por separado. Las formulaciones separadas permiten la aplicación separada o sucesiva de los compuestos activos en cuestión.

Los compuestos activos especificados en la presente por sus nombres comunes se conocen y describen, por ejemplo, en el Pesticide Manual (véase anteriormente) o se pueden encontrar en Internet (p. ej. <http://www.alanwood.net/pesticides>).

Ejemplos de ingredientes activos del grupo de ectoparasitocidas, como compañeros de mezcla, incluyen, de modo no taxativo insecticidas y acaricidas enumerados en detalle anteriormente. Otros ingredientes activos que pueden usarse se enumeran más adelante de acuerdo con la clasificación mencionada anteriormente que se basa en el actual Esquema de Clasificación de Modos de Acción IRAC: (1) inhibidores de acetilcolinesterasa (AChE); (2) bloqueadores del canal de cloruro controlado por GABA; (3) moduladores del canal de sodio; (4) moduladores competitivos del receptor de acetilcolina nicotínico (nAChR); (5) moduladores alostéricos del receptor de acetilcolina nicotínico (nAChR); (6) moduladores alostéricos del canal de cloruro controlado por glutamato (GluCl); (7) miméticos de la hormona juvenil; (8) inhibidores no específicos varios (multi-sitio); (9) moduladores de órganos cordotonaes; (10) inhibidores del crecimiento de ácaros; (12) inhibidores de ATP sintasa mitocondrial, como, disruptores de ATP; (13) desacopladores de la fosforilación oxidativa por disrupción del gradiente de protones; (14) bloqueadores del canal del receptor de acetilcolina nicotínica; (15) inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 0; (16) inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 1; (17) disruptor de muda (en particular en dípteros, es decir dípterans); (18) agonistas del receptor de ecdisona; (19) agonistas del receptor de octopamina; (21) inhibidores de transporte de electrones de complejo mitocondrial I; (25) inhibidores de transporte de electrones de complejo mitocondrial II; (20) inhibidores de transporte

de electrones de complejo mitocondrial III; (22) bloqueadores del canal de sodio dependiente del voltaje; (23) inhibidores de acetil CoA carboxilasa; (28) moduladores del receptor de rianodina;

- 5 Compuestos activos con modo de acción desconocido o no específico, p. ej., fentripanil, fenoxacrim, ciclopreno, clorobenzilato, clordimeform, flubenzimina, diciclanil, amidoflumet, quinometionat, triaraten, clotiazoben, tetrasul, oleato de potasio, petróleo, metoxadiazona, gossiplur, flutenzina, bromopropilato, criolito;
- Compuestos de otras clases, p. ej. butacarb, dimetilan, cloetocarb, fosfocarb, pirimifos(-etilo), paration(-etilo), metacrifos, o-salicilato de isopropilo, triclorfon, tigolaner, sulprofos, propafos, sebufos, piridation, protoato, diclofention, demeton-S-metilsulfona, isazofos, cianofenfos, dialifos, carbofenotion, autatiofos, aromfenvinfos(-metilo), azinphos(-etilo), clorpirifos(-etilo), fosmetilan, iodofenfos, dioxabenzofos, formotion, fonofos, flupirazofos, fensulfotion, etrimfos;
- 10 organoclorinas, p. ej. camfeclor, lindano, heptaclor; o fenilpirazoles, p. ej. acetoprol, pirafluprol, piriprol, vaniliprol, sisapronil; o isoxazolin, p. ej. sarolaner, afoxolaner, lotilaner, fluralaner;
- piretroides, p. ej. (cis-, trans-)metoflutrina, proflutrina, flufenprox, flubrocitrinato, fubfenprox, fenflutrina, protrifenbuto, piresmetrina, RU15525, teralletrina, cis-resmetrina, heptaflutrina, bioetanometrina, biopermetrina, fenpiritrina, cis-cipermetrina, cis-permetrina, clocitrina, cihalotrina (lambda-), clovaptorina, o compuestos de hidrocarburo halogenado (HCH),
- 15 neonicotinoides, p. ej. nitiazina
- dicloromezotiaz, triflumezopirim
- lactonas macrocíclicas, p. ej. nemadectina, ivermectina, latidectina, moxidectina, selamectina, eprinomectina, doramectina, emamectina benzoato; milbemicina oxima
- 20 tripreno, epofenonana, diofenolan;
- Biológicos, hormonas o feromonas, por ejemplo productos naturales, p. ej. turingiensina, codlemona o componentes de neem
- dinitrofenoles, p. ej. dinocap, dinobuton, binapacril;
- benzoiureas, p. ej. fluazuron, penfluron,
- 25 derivados de amidina, p. ej. clormebuform, cimiazol, demiditraz
- Ácaros varroa de colmena de abejas, por ejemplo, ácidos orgánicos, p. ej. ácido fórmico, ácido oxálico.
- Ejemplos de ingredientes activos del grupo de ectoparasiticidas, como compañeros de mezcla, incluyen, de modo no taxativo, compuestos activos desde el punto de vista antihelmíntico y compuestos activos antiprotozoarios.
- 30 Los compuestos activos desde el punto de vista antihelmíntico incluyen, de modo no taxativo, los siguientes compuestos activos desde el punto de vista nematocida, trematocida y/o cestocida:
- de la clase de lactonas macrocíclicas, por ejemplo: eprinomectina, abamectina, nemadectina, moxidectina, doramectina, selamectina, lepimectina, latidectina, milbemectina, ivermectina, emamectina, milbemicina;
- de la clase de bencimidazoles y probencimidazoles, por ejemplo: oxibendazol, mebendazol, triclabendazol, tiofanato, parabendazol, oxfendazol, netobimina, fenbendazol, febantel, tiabendazol, ciclobendazol, cambendazol, albendazol-sulfóxido, albendazol, flubendazol;
- 35 de la clase de depsipéptidos, preferentemente depsipéptidos cíclicos, en particular depsipéptidos cíclicos de 24 miembros, por ejemplo: emodepsido, PF1022A;
- de la clase de tetrahidropirimidinas, por ejemplo: morantel, pirantel, oxantel;
- de la clase de imidazotiazoles, por ejemplo: butamisol, levamisol, tetramisol;
- 40 de la clase de aminofenilamidinas, por ejemplo: amidantel, amidantel deacilado (dAMD), tribendimidina;
- de la clase de aminoacetonitrilos, por ejemplo: monepantel;
- de la clase de paraherquamidas, por ejemplo: paraherquamida, derquantel;
- de la clase de salicilanilidas, por ejemplo: tribromsalan, bromoxanida, brotiana, clioxanida, closantel, niclosamida, oxiclozanida, rafoxanida;
- 45 de la clase de fenoles sustituidos, por ejemplo: nitroxinil, bitionol, disofenol, hexaclorofeno, niclofolan, meniclofolan;

de la clase de los organofosfatos, por ejemplo: triclorfon, naftalofos, diclorvos/DDVP, crufomato, coumafos, haloxon;

de la clase de piperazinonas / quinolinas, por ejemplo: praziquantel, epsiprantel;

de la clase de piperazinas, por ejemplo: piperazina, hidroxizina;

de la clase de tetraciclinas, por ejemplo: tetraciclina, clorotetraciclina, doxiciclina, oxitetraciclina, rolitetraciclina;

- 5 de varias otras clases, por ejemplo: bunamidina, niridazol, resorantel, omfalotin, oltipraz, nitroscanato, nitroxinil, oxamniquin, mirasan, miracil, lucanton, hicanton, hetolin, emetina, dietilcarbamazina, diclorofen, diamfenetida, clonazepam, befenio, amoscanato, clorsulon.

Compuestos activos antiprotozoarios, que incluyen, de modo no taxativo, los siguientes compuestos activos:

de la clase de triazinas, por ejemplo: diclazuril, ponazuril, letrazuril, toltrazuril;

- 10 de la clase de ionóforo de poliléter, por ejemplo: monensina, salinomycin, maduramicina, narasina;

de la clase de lactonas macrocíclicas, por ejemplo: milbemicina, eritromicina;

de la clase de quinolonas, por ejemplo: enrofloxacin, pradofloxacin;

de la clase de quininas, por ejemplo: cloroquina;

de la clase de pirimidinas, por ejemplo: pirimetamina;

- 15 de la clase de sulfonamidas, por ejemplo: sulfaquinoxalina, trimetoprim, sulfaclozin;

de la clase de tiaminas, por ejemplo: amprolio;

de la clase de lincosamidas, por ejemplo: clindamicina;

de la clase de carbanilidas, por ejemplo: imidocarb;

de la clase de nitrofuranos, por ejemplo: nifurtimox;

- 20 de la clase de quinazolinona alcaloides, por ejemplo: halofuginon;

de varias otras clases, por ejemplo: oxamniquina, paromomicina;

de la clase de vacunas o antígenos de microorganismos, por ejemplo: Babesia canis rossi, Eimeria tenella, Eimeria praecox, Eimeria necatrix, Eimeria mitis, Eimeria maxima, Eimeria brunetti, Eimeria acervulina, Babesia canis vogeli, Leishmania infantum, Babesia canis canis, Dictyocaulus viviparus.

- 25 Todos los compañeros de unión mencionados pueden, si sus grupos funcionales lo permiten, formar opcionalmente sales con ácidos o bases adecuados.

Control de vectores

- 30 Los compuestos de la fórmula (I) también pueden utilizarse en el control de vectores. A efectos de la presente invención, un vector es un artrópodo, en particular un insecto o un arácnido, capaz de transmitir patógenos como, por ejemplo, virus, gusanos, organismos unicelulares y bacterias de un depósito (planta, animal, humano, etc.). Los patógenos se pueden transmitir mecánicamente (por ejemplo tracoma por moscas que no pican) a un hospedador o por inyección (por ejemplo, parásitos de malaria por mosquitos) en un hospedador.

Ejemplos de vectores y enfermedades o patógenos que transmiten son:

1) Mosquitos

- 35 - Anopheles: malaria, filariasis;
- Culex: Encefalitis japonesa, otras enfermedades virales, filariasis, transmisión de otros gusanos;
- Aedes: fiebre amarilla, fiebre del dengue, otras enfermedades virales, filariasis;
- Simuliidae: transmisión de gusanos, en particular Onchocerca volvulus;
- Psychodidae: transmisión de leishmaniasis

- 40 2) Piojos: infecciones de la piel, tifus epidémico;

3) Pulgas: plaga, tifus endémico, cestodos;

4) Moscas: enfermedad del sueño (trpanosomiasis); cólera, otras enfermedades bacterianas;

5) Ácaros: acariosis, tifus epidémica, rickettsialpox, tularemia, encefalitis de San Luis, encefalitis transmitida por garrapatas (TBE), fiebre hemorrágica de Crimea–Congo, borreliosis;

5 6) Garrapatas: borreliosis como *Borrelia burgdorferi* sensu lato., *Borrelia duttoni*, encefalitis transmitida por garrapatas, fiebre Q (*Coxiella burnetii*), babesiosis (*Babesia canis canis*), erliquiosis.

Ejemplos de vectores en el sentido de la presente invención son insectos, por ejemplo, áfidos, moscas, chicharritas o trips, que son capaces de transmitir virus de plantas a plantas. Otros vectores que pueden transmitir virus de plantas son los ácaros de araña, piojos, escarabajos y nematodos.

10 Ejemplos adicionales de vectores en el sentido de la presente invención son insectos y arácnidos como mosquitos, en particular del género *Aedes*, *Anopheles*, por ejemplo *A. gambiae*, *A. arabiensis*, *A. funestus*, *A. dirus* (malaria) y *Culex*, psicódidos como *Phlebotomus*, *Lutzomyia*, piojos, polillas, moscas, ácaros y garrapatas que pueden transmitir patógenos a animales y/o humanos.

El control de vectores también es posible si los compuestos de la fórmula (I) rompen la resistencia.

15 Los compuestos de la fórmula (I) son adecuados para el uso en la prevención de enfermedades y/o patógenos transmitidos por vectores. Por lo tanto, un aspecto adicional de la presente invención es el uso de compuestos de la fórmula (I) para el control de vectores, por ejemplo en la agricultura, horticultura, en jardines e instalaciones de recreación y también en la protección de materiales y productos almacenados.

Protección de materiales industriales

20 Los compuestos de la fórmula (I) son adecuados para proteger materiales industriales contra ataque o destrucción por insectos, por ejemplo, del orden Coleoptera, Hymenoptera, Isoptera, Lepidoptera, Psocoptera y ygentoma.

Materiales industriales en el contexto de la presente se refieren a materiales inanimados, como preferentemente plásticos, adhesivos, colas, papeles y tarjetas, cuero, madera, productos de madera procesada y composiciones de recubrimiento. El uso de la invención para proteger madera es particularmente preferido.

25 En una realización adicional, los compuestos de la fórmula (I) se usan juntos con al menos otro insecticida y/o al menos un fungicida.

En una realización adicional, los compuestos de la fórmula (I) están presentes como un pesticida pronto para usarse, es decir, se pueden aplicar al material en cuestión sin modificaciones adicionales. Insecticidas o fungicidas adicionales adecuados son en particular los mencionados anteriormente.

30 Sorprendentemente, también se encontró que los compuestos de la fórmula (I) pueden emplearse para proteger objetos que entran en contacto con agua salada o agua salobre, en particular cascos, pantallas, redes, edificios, amarraderos y sistemas de señalización, contra contaminaciones. Asimismo, los compuestos de la fórmula (I), solos o en combinaciones con otros compuestos activos, se pueden usar como agentes anticontaminantes.

Control de plagas animales en el sector de higiene

35 Los compuestos de la fórmula (I) son adecuados para controlar plagas animales en el sector de higiene. En particular, la invención se puede aplicar en el sector doméstico, en el sector higiene y en la protección de productos almacenados, especialmente para controlar insectos, arácnidos, garrapatas y ácaros encontrados en espacios cerrados como viviendas, corredores de fábricas, oficinas, cabinas de vehículos, cría de animales. Para controlar las plagas animales, los compuestos de la fórmula (I) se usan solos o en combinación con otros compuestos activos y/o auxiliares. Se usan
40 preferentemente en productos insecticidas domésticos. Los compuestos de la fórmula (I) son eficaces contra especies sensibles y resistentes, y contra todas las etapas de desarrollo.

Estas plagas incluyen, por ejemplo, plagas de la clase arácnidos, del orden escorpiones, arañas y opiliones, de las clases quilópodos y diplópodos, de la clase insectos del orden blatodeos, del orden coleópteros, dermápteros, dípteros, heterópteros, himenópteros, isópteros, lepidópteros, fitirápteros, psocópteros, Saltatoria u ortópteros, sifonápteros y
45 zygentomos y de la clase malacostráceos del orden isópodos.

Se usan, por ejemplo, en aerosoles, productos de pulverización sin presión, por ejemplo pulverizadores de bomba o atomizador, sistemas de niebla automáticos, formadores de niebla, espumas, geles, productos evaporadores con tabletas de evaporación hechas de celulosa o plástico, evaporadores líquidos, evaporadores de gel y membrana, evaporadores impulsados por propulsor, sistemas de evaporación libres de energía o pasivos, papel de polilla, bolsa
50 de polilla y geles de polilla, como gránulos o polvos, en cebos para esparcir o en estaciones de cebos.

Abreviaturas y símbolos

	AcOH:	ácido acético
	ac.:	acuoso
	br.:	amplio
5	d:	doblete
	DCC:	N,N'-diciclohexilcarbodiimida
	DIPEA:	diisopropiletilamina
	DMF:	N,N-dimetilformamida
	DMSO:	dimetilsulfóxido
10	ee:	exceso enantiomérico
	eq.:	equivalente
	ES:	ionización por electropulverización
	EtOAc:	acetato de etilo
	HATU:	1-[bis(dimetilamino)metilen]-1H-1,2,3-triazolo[4,5-b]piridinio-3-óxido hexafluorofosfato
15	HOBt:	1-hidroxibenzotriazol hidrato
	HPLC:	cromatografía líquida de alto rendimiento
	iPrOH:	isopropanol
	J:	constante de acoplamiento
	LCMS:	cromatografía líquida-espectrometría de masas
20	m/z:	relación masa-carga
	M:	molaridad
	m:	múltiple
	MeCN	acetonitrilo
	MeOH:	metanol
25	NMR:	resonancia magnética nuclear
	q:	cuarteto
	t. a.:	temperatura ambiente
	R _t :	tiempo de retención
	s:	singlete
30	sat.:	saturado
	T:	ambiente
	t:	triplete
	T3P®:	anhídrido propilfosfónico
	THF:	tetrahidrofurano
35	wt.:	peso
	δ:	desviación química

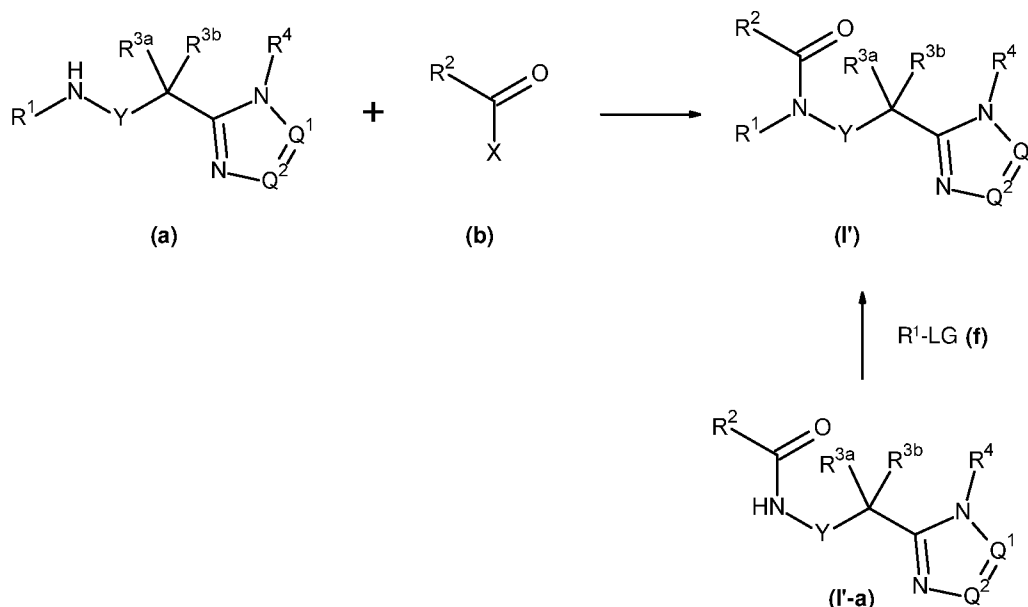
λ : Longitud de onda

Descripción de los procesos e intermedios

Los compuestos de fórmula I' pueden prepararse según se ilustra en el siguiente esquema 1 donde R^1 , R^2 , R^{3a} , R^{3b} , R^4 , Q^1 , Q^2 e Y son como se define anteriormente, X representa OH o Cl y LG es un grupo saliente adecuado.

5

Esquema 1



10

X = OH: Un compuesto azol de fórmula (a) se hace reaccionar con un ácido carboxílico de fórmula (b) (X = OH) para formar compuestos de fórmula I'. Por ejemplo, una mezcla de un azol de fórmula (a), un ácido carboxílico de fórmula (b) (X = OH), un reactivo de acoplamiento adecuado, como T3P®, HATU, DCC o HOBt, una base adecuada como trietilamina o DIPEA, en un solvente adecuado, como acetato de etilo o DMF se mezclan a temperaturas que varían de alrededor de 0 a 100 °C para proveer compuestos de fórmula I' que pueden luego aislarse y, de ser necesario y deseado, purificarse usando técnicas conocidas en la técnica, como cromatografía.

15

X = Cl: Un compuesto azol de fórmula (a) se hace reaccionar con un cloruro de ácido carboxílico de fórmula (b) (X = Cl) para formar compuestos de fórmula I'. Por ejemplo, una mezcla de un azol de fórmula (a), un cloruro de ácido carboxílico de fórmula (b) (X = Cl), una base adecuada como trietilamina o DIPEA, en un solvente adecuado, como diclorometano o THF se mezclan a temperaturas que varían de alrededor de 0 a 100 °C para proveer compuestos de fórmula I' que pueden luego aislarse y, de ser necesario y deseado, purificarse usando técnicas conocidas en la técnica, como cromatografía.

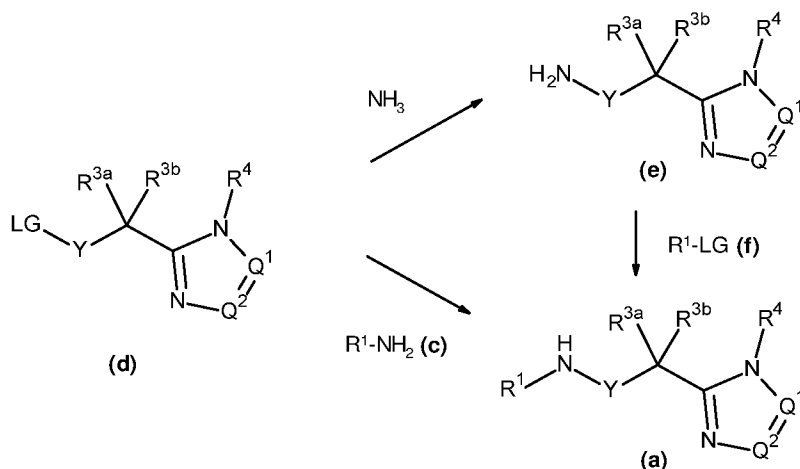
20

De manera alternativa, un compuesto amida de fórmula (I'-a) (R^1 = hidrógeno, por ejemplo conocido de WO 2017192385 donde R^{3a} es alquilo_{C1-C3} o haloalquilo_{C1-C3} y R^{3b} es hidrógeno) se hace reaccionar con un reactivo alquilante (f) en presencia de una base adecuada como hidróxido de sodio en un solvente adecuado, como acetonitrilo o DMF a temperaturas que varían de alrededor de 0 a 100 °C para proveer compuestos de fórmula I' que pueden luego aislarse y, de ser necesario y deseado, purificarse usando técnicas conocidas en la técnica, como cromatografía.

25

Los ácidos carboxílicos de fórmula (b) (X = OH), cloruros de ácido carboxílico de fórmula (b) (X = Cl) y agentes alquilantes de fórmula (f) están comercialmente disponibles o pueden sintetizarse por procedimientos conocidos por un experto en la técnica en el estado de la técnica. Los compuestos azol necesarios de fórmula (a) pueden prepararse como se ilustra en el siguiente esquema 2, donde R^1 , R^{3a} , R^{3b} , R^4 , Q^1 , Q^2 e Y son como se describe anteriormente y LG es un grupo saliente adecuado (síntesis analógicas véase también WO 2017192385).

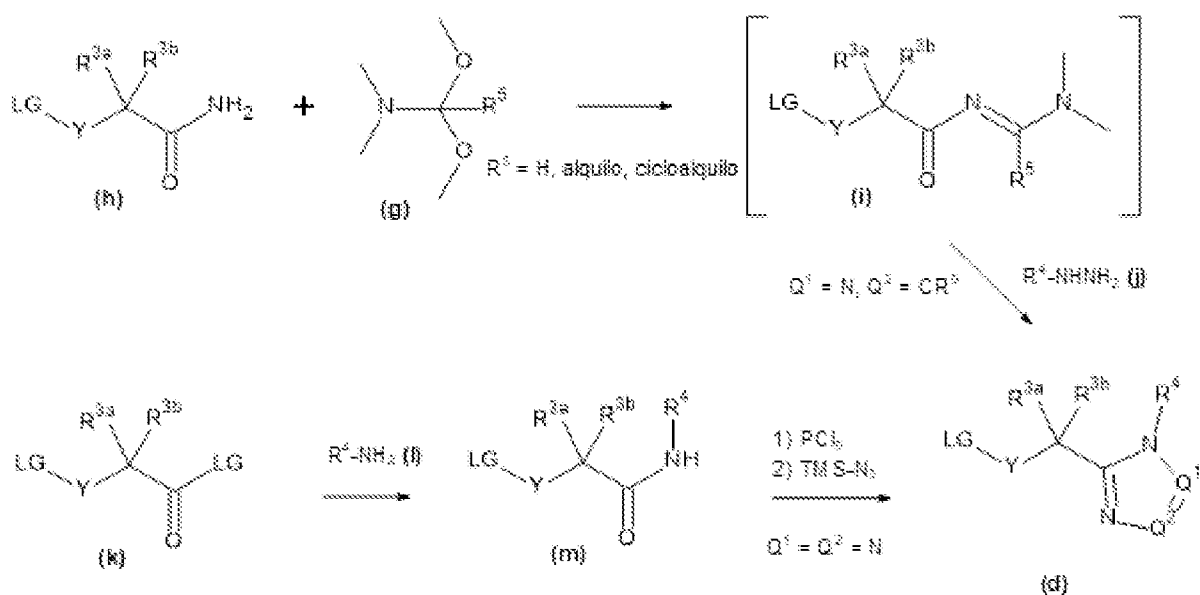
30

Esquema 2

Un amina de fórmula (c) se hace reaccionar con un azol sustituido de fórmula (d) para formar compuestos de fórmula (a). Por ejemplo, una mezcla de un azol de fórmula (d), una amina de fórmula (c), una base adecuada como K₂CO₃, NaH o DIPEA, en un solvente adecuado, como acetonitrilo o DMF se mezclan a temperaturas que varían de alrededor de 20 a 120 °C para proveer compuestos de fórmula (a) que pueden luego aislarse y, de ser necesario y deseado, purificarse usando técnicas conocidas en la técnica, como cromatografía.

De manera alternativa, un azol sustituido de fórmula (d) se hace reaccionar con amoníaco para formar compuestos de fórmula (e). Por ejemplo, una solución de amoníaco en un solvente adecuado, como metanol, y un azol sustituido de fórmula (d) se mezclan en un tubo sellado a temperaturas que varían de alrededor de 0 a 25 °C para proveer compuestos de fórmula (e) que pueden luego aislarse y, de ser necesario y deseado, purificarse usando técnicas conocidas en la técnica, como trituración. Un azol sustituido de fórmula (e), un compuesto de fórmula (f), una base adecuada como K₂CO₃ o DIPEA, en un solvente adecuado, como acetonitrilo o DMF se mezclan a temperaturas que varían de alrededor de 20 a 120 °C para proveer compuestos de fórmula (a) que pueden luego aislarse y, de ser necesario y deseado, purificarse usando técnicas conocidas en la técnica como cromatografía.

Aminas de fórmula (c) y compuestos de fórmula (f) están comercialmente disponibles o pueden sintetizarse por procedimientos conocidos por un experto en la técnica en el estado de la técnica. Los compuestos azol necesarios de fórmula (d) pueden prepararse como se ilustra en el siguiente esquema 3, donde R^{3a}, R^{3b}, R⁴, R⁵, Q¹, Q² e Y son como se describe anteriormente, LG es un grupo saliente adecuado.

Esquema 3

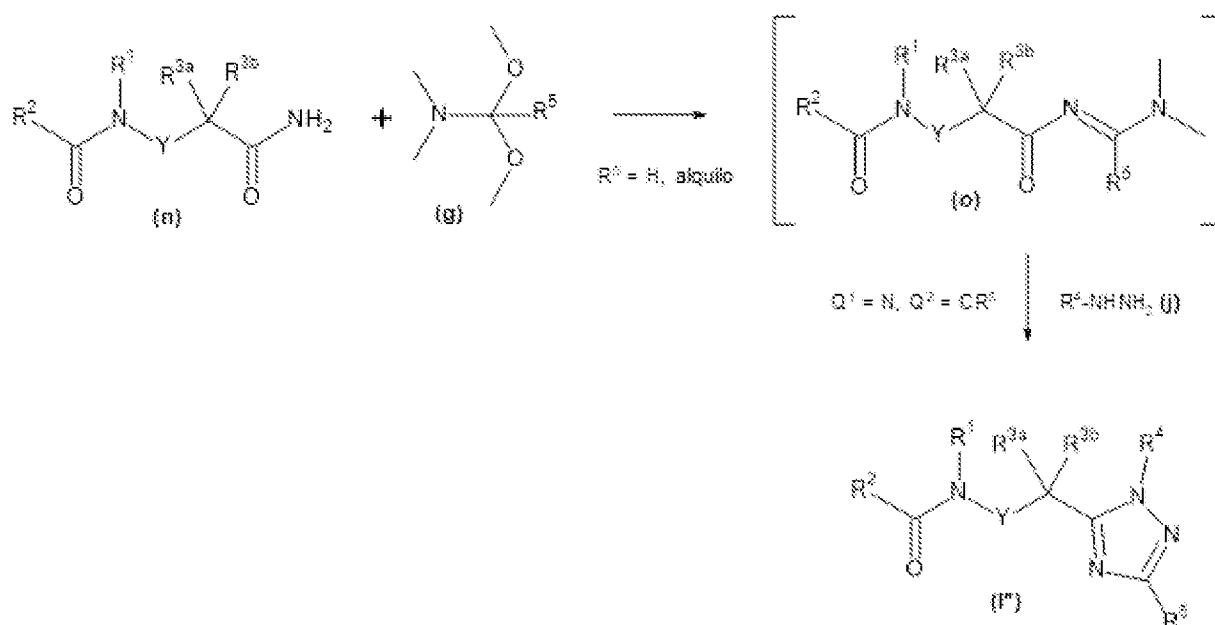
Una amida de fórmula (h) se hace reaccionar con un *N,N*-dimetilamida dimetil acetal (g) para formar compuestos de fórmula (i) que se hacen reaccionar posteriormente con hidrazinas (j) en condiciones ácidas para formar compuestos de fórmula (d). Por ejemplo, un compuesto de fórmula (h) y un *N,N*-dimetilamida dimetil acetal de fórmula (g) se hace reaccionar con un solvente adecuado, como CH_2Cl_2 a reflujo para proveer compuestos de fórmula (i). Tras retirar el solvente, los compuestos de fórmula (i) se hace reaccionar con una hidrazina sustituida (j) en un solvente adecuado como 1,4-dioxano, ácido acético o una mezcla de tales solventes a temperaturas que varían de alrededor de 20 a 100 °C para proveer compuestos de fórmula (d) que pueden luego aislarse y, de ser necesario o deseado, purificarse usando técnicas conocidas en la técnica, como cromatografía.

De manera alternativa, un derivado de ácido carboxílico de fórmula (k) se hace reaccionar con una amina de (l) y una base adecuada, como trietilamina o DIPEA, en un solvente adecuado, como tolueno, a temperaturas que varían de alrededor de 0 a 120 °C. Los compuestos resultantes (m) pueden luego aislarse y, de ser necesario y deseado, purificarse usando técnicas conocidas en la técnica, como cromatografía. Las amidas resultantes de fórmula (m) y pentacloruro de fósforo se hacen reaccionar en un solvente adecuado, como CH_2Cl_2 , a t. a. y luego trimetilsilil azida se agrega a la mezcla a 0 °C y la mezcla se agita a t. a. para proveer compuestos de fórmula (d) que pueden luego aislarse y, de ser necesario o deseado, purificarse usando técnicas conocidas en la técnica, como cromatografía.

N,N-dimetilamida acetales de fórmula (g), amidas de fórmula (h), derivados de ácido carboxílico de fórmula (k) e hidrazinas de fórmula (j) están comercialmente disponibles o pueden sintetizarse por procedimientos conocidos por un experto en la técnica en el estado de la técnica.

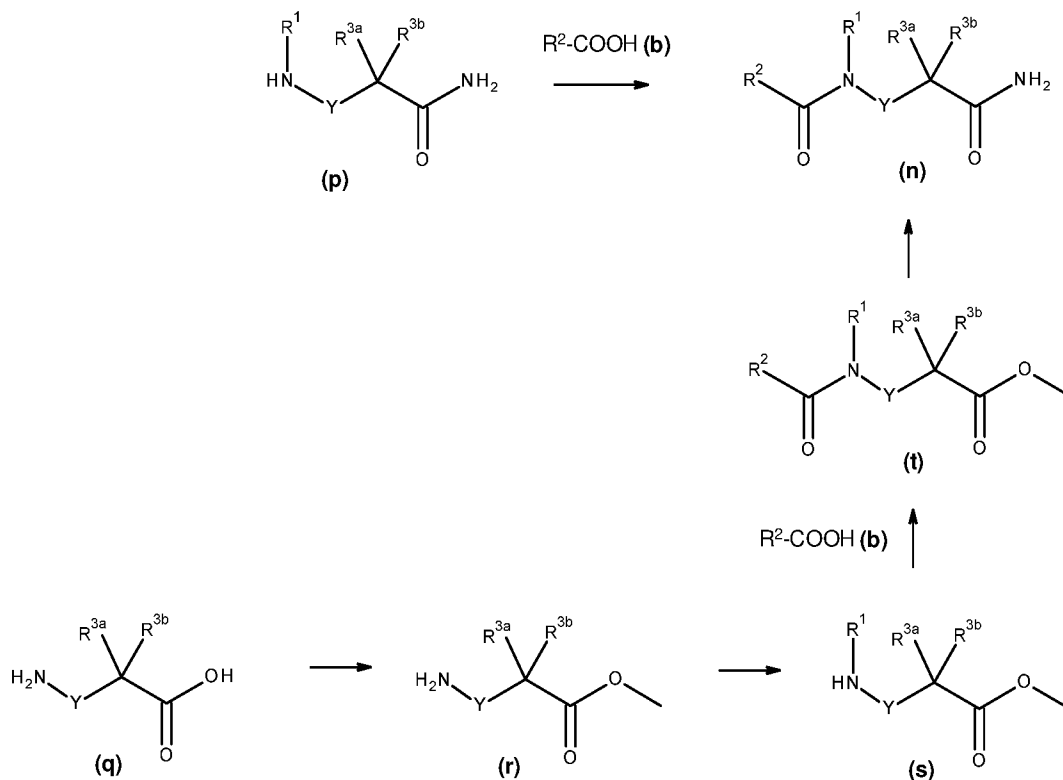
Los compuestos de fórmula I" pueden prepararse según se ilustra en el siguiente esquema 4 donde R^1 , R^2 , R^{3a} , R^{3b} , R^4 , R^5 e Y son como se define anteriormente.

Esquema 4



Una amida de fórmula (n) se hace reaccionar con un *N,N*-dimetilamida dimetil acetal de fórmula (g) para formar compuestos de fórmula (o) que se hacen reaccionar posteriormente con hidrazinas sustituidas de fórmula (j) en condiciones ácidas para formar compuestos de fórmula I''. Por ejemplo, un compuesto de fórmula (n) y un *N,N*-dimetilamida dimetil acetal de fórmula (g) se hace reaccionar con un solvente adecuado, como CH_2Cl_2 a reflujo para proveer compuestos de fórmula (o). Tras retirar el solvente, los compuestos de fórmula (o) se hace reaccionar con una hidrazina sustituida de fórmula (j) en un solvente adecuado como 1,4-dioxano, ácido acético o una mezcla de tales solventes a temperaturas que varían de alrededor de 20 a 100 °C. Los compuestos de fórmula I'' resultantes pueden luego aislarse y, de ser necesario o deseado, purificarse usando técnicas conocidas en la técnica, como cromatografía.

Las amidas de fórmula necesarias (n) pueden prepararse según se ilustra en el siguiente esquema 5, donde R^1 , R^2 , R^{3a} , R^{3b} e Y son como se describe anteriormente.

Esquema 5

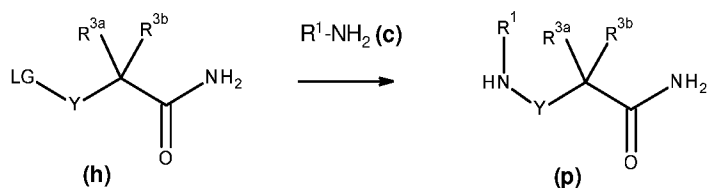
Una amida amino de fórmula (p) se hace reaccionar con un ácido carboxílico de fórmula (b) para formar compuestos de fórmula (n). Por ejemplo, una mezcla de una amida amino de fórmula (p), un ácido carboxílico (b), un reactivo de acoplamiento adecuado, como T3P®, HATU, DCC o HOBt, una base adecuada como trietilamina o DIPEA, en un solvente adecuado como acetato de etilo o DMF se mezclan a temperaturas que varían de alrededor de 0 a 100 °C para proveer compuestos de fórmula (n) que pueden luego aislarse y, de ser necesario y deseado,

purificarse usando técnicas conocidas en la técnica, como cromatografía.

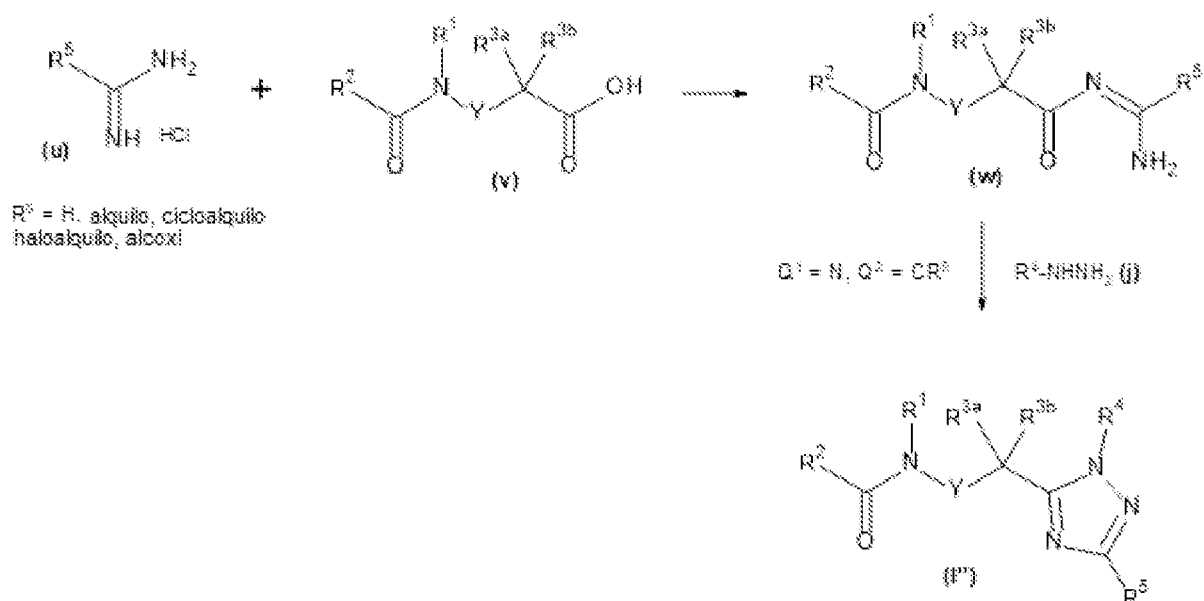
De manera alternativa, un aminoácido de fórmula (q) se hace reaccionar con cloruro de tionilo en un solvente adecuado, como MeOH, a t. a. para proveer ésteres de amino de fórmula (r). Los ésteres de amino resultantes (r) se hacen reaccionar con un aldehído o una cetona, un agente reductor adecuado como triacetoxiborohidruro de sodio, un agente deshidratante como Na₂SO₄, en un solvente adecuado como ácido acético, a t. a. para proveer compuestos de fórmula (s). Los ésteres de amino resultantes de fórmula (s) se hacen reaccionar luego con un ácido carboxílico de fórmula (b), un reactivo de acoplamiento adecuado, como T3P®, una base adecuada como DIPEA, en un solvente adecuado, como acetato de etilo a alrededor de 90 °C para proveer ésteres de amido de fórmula (t) que pueden luego aislarse y, de ser necesario y deseado, purificarse usando técnicas conocidas en la técnica, como cromatografía. Los ésteres de amido resultantes de fórmula (t) se hacen reaccionar con nitruro de magnesio en un solvente adecuado, como MeOH a alrededor de 80 °C en un tubo sellado para proveer compuestos de fórmula (n) que pueden luego aislarse y, de ser necesario y deseado, purificarse usando técnicas conocidas en la técnica, como cromatografía o extracción.

Los compuestos de fórmula (b) y (q) están comercialmente disponibles. Los compuestos amida amino necesarios de fórmula (p) están comercialmente disponibles o pueden prepararse como se ilustra en el siguiente esquema 6, donde R¹, R³ e Y son como se describe anteriormente y LG es un grupo saliente adecuado.

Los compuestos de fórmula (c) y (h) están comercialmente disponibles.

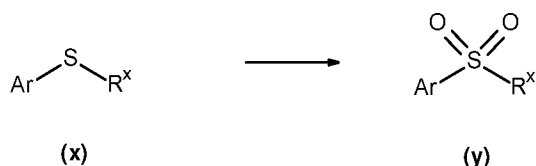
Esquema 6

Una amina de fórmula (c) se hace reaccionar con una amida de fórmula (h) para formar compuestos de fórmula (p). Por ejemplo, una mezcla de una amina de fórmula (c), una amida de fórmula (h), una base adecuada como K_2CO_3 o DIPEA, en un solvente adecuado, como acetonitrilo o DMF se mezclan a alrededor de 20 a 80 °C para proveer compuestos de fórmula (p) que pueden luego aislarse y, de ser necesario y deseado, purificarse usando técnicas conocidas en la técnica, como cromatografía.

Esquema 7

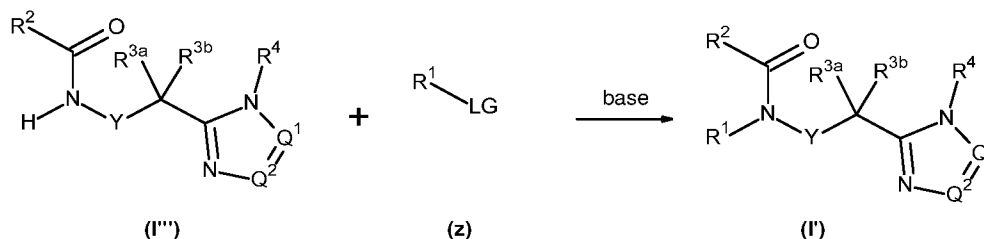
Un clorhidrato de amidina de fórmula (u) se hace reaccionar con un ácido de fórmula (v) para formar compuestos de fórmula (w) que se hacen reaccionar posteriormente con hidrazinas sustituidas de fórmula (j) en condiciones ácidas para formar compuestos de fórmula I".

Las sulfonas de la fórmula general (y) pueden prepararse como se ilustra en el siguiente esquema 8, donde Ar es fenilo o hetarilo y R^x es alquilo C_{1-6} o haloalquilo C_{1-6} .

Esquema 8

Un grupo alquil- o haloalquilitio como parte de la fórmula (x) está reaccionando con reactivos oxidantes como ácido 3-cloroperoxisulfónico o cloruro de rutenio(III) en combinación con periodato de sodio para formar compuestos de sulfona de fórmula (y).

Los compuestos de fórmula I' pueden prepararse según se ilustra en el siguiente esquema 9 donde R^1 , R^2 , R^{3a} , R^{3b} , R^4 , Q^1 , Q^2 e Y son como se define anteriormente y LG representa un grupo saliente adecuado como cloro, bromo o yodo.

Esquema 9

Un compuesto de fórmula I''' se hace reaccionar con un agente alquilante de fórmula (z) para formar compuestos de fórmula I'. Por ejemplo, una amida secundaria de fórmula I''' se desprotona con una base adecuada como bis(trimetilsilil)amida de potasio o hidruro de sodio, en un solvente adecuado como tetrahidrofurano o DMF. El intermedio aniónico resultante se hace reaccionar luego con un agente alquilante de fórmula (z) a temperaturas que varían de alrededor de -40 °C a 40 °C para proveer compuestos de fórmula I'.

Los procesos de acuerdo a la invención para la preparación de compuestos de la fórmula (I) se llevan a cabo preferentemente con un diluyente. Los diluyentes útiles para la realización de los procesos según la invención son, así como el agua, todos los solventes inertes. Los ejemplos incluyen: hidrocarburos halogenados (por ejemplo, hidrocarburos clorados, como tetracloroetileno, tetracloroetano, dicloropropano, cloruro de metileno, diclorobutano, cloroformo, tetracloruro de carbono, tricloroetano, tricloroetileno, pentacloroetano, difluorobenceno, 1,2-dicloroetano, clorobenceno, bromobenceno, diclorobenceno, clorotolueno, triclorobenceno), alcoholes (por ejemplo metanol, etanol, isopropanol, butanol), éteres (por ejemplo éter de etilo propilo, éter metil terc-butilo, anisol, fenetol, éter metil ciclohexilo, dimetil éter, dietil éter, dipropil éter, diisopropil éter, di-n-butil éter, diisobutil éter, diisoamil éter, etilenglicol dimetil éter, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, éter y diclorodietil poliéteres de óxido de etileno y/u óxido de propileno), aminas (por ejemplo trimetil-, trietil-, tripropil-, tributilamina, N-metilmorfolina, piridina y tetrametilendiamina), nitrohidrocarburos (por ejemplo nitrometano, nitroetano, nitropropano, nitrobenceno, cloronitrobenceno, o-nitrotolueno); nitrilos (por ejemplo acetonitrilo, propionitrilo, butironitrilo, isobutironitrilo, benzonitrilo, m-clorobenzonitrilo), dióxido de tetrahidrotiofeno, sulfóxido de dimetilo, sulfóxido de tetrametileno, sulfóxido de dipropil, bencilo sulfóxido de metilo, diisobutil sulfóxido, sulfóxido de dibutilo, diisoamílico sulfóxido, sulfonas (por ejemplo dimetil, dietilo, dipropilo, dibutilo, difenilo, dihexilo, metilo etilo, propilo etilo, isobutil etilo y sulfona de pentametileno), hidrocarburos alifáticos, cicloalifáticos o aromáticos (por ejemplo pentano, hexano, heptano, octano, nonano e hidrocarburos técnicos), y también los llamados "alcoholes blancos" con componentes que tienen puntos de ebullición en el rango que varía de, por ejemplo, 40 °C a 250 °C, fracciones de cimenso, petróleo en un rango de ebullición de 70 °C a 190 °C, ciclohexano, metilciclohexano, éter de petróleo, ligroína, benceno, tolueno, xileno, ésteres (por ejemplo, acetato de metilo, etilo, butilo y de isobutilo, carbonato de dimetilo, dibutilo y de etileno); amidas (por ejemplo triamida de ácido hexametilfosfórico, formamida, N-metilformamida, N, N-dimetilformamida, N, N-dipropilformamida, N, N-dibutilformamida, N-metilpirrolidina, N-metilcaprolactama, 1,3-dimetil-3,4,5,6-tetrahidro-2 (1H) -pirimidina, octilpirrolidona, octilcaprolactam, 1,3-dimetil-2-imidazolinadiona, N-formilpiperidina, N, N'-diformilpiperazina) y cetonas (por ejemplo acetona, acetofenona, metil etil cetona, metil butil cetona).

También es posible llevar a cabo el proceso de acuerdo con la invención en mezclas de los solventes y diluyentes mencionados.

Al realizar el proceso de acuerdo con la invención, las temperaturas de reacción pueden variar en un rango relativamente amplio. En general, las temperaturas empleadas son entre -30 °C y 150 °C, preferentemente entre -10 °C y 100 °C.

El proceso de acuerdo con la invención se lleva a cabo en general en condiciones de presión atmosférica. Sin embargo, también es posible llevar a cabo el proceso según la invención en condiciones de presión elevada o reducida - en general, a presiones absolutas entre 0,1 bar y 15 bar.

Para llevar a cabo el proceso según la invención, los materiales de partida se utilizan en general en cantidades aproximadamente equimolares. Sin embargo, también es posible utilizar uno de los componentes en un exceso relativamente grande. La reacción se lleva a cabo generalmente en un diluyente adecuado en presencia de un agente auxiliar de reacción, opcionalmente, también en una atmósfera de gas protectora (por ejemplo, con nitrógeno, argón o helio) y la mezcla de reacción se agita en general a la temperatura requerida durante varias horas. La elaboración se lleva a cabo por procedimientos usuales (véanse los ejemplos de preparación).

Los auxiliares de la reacción básicos utilizados para realizar el proceso de acuerdo a la invención pueden ser todos los fijadores de ácido adecuados. Los ejemplos incluyen: metal alcalinotérreo o compuestos de metales alcalinos (por ejemplo, hidróxidos, hidruros, óxidos y carbonatos de litio, sodio, potasio, magnesio, calcio y bario), bases de amidina o bases de guanidina (por ejemplo, 7-metil-1,5,7- triazabicyclo [4.4.0] dec-5-eno (MTBD); diazabicyclo [4.3.0] noneno (DBN), diazabicyclo [2.2.2] octano (DABCO), 1,8-diazabicyclo [5.4.0] undeceno (DBU), ciclohexiltetrabutylguanidina (CyTBG), ciclohexiltetrametilguanidina (CyTMG), N, N, N, N-tetrametil-1,8-naftalendiamina, pentametilpiperidina) y

aminas, especialmente aminas terciarias (por ejemplo, trietilamina, trimetilamina, tribencilamina, triisopropilamina, tributilamina, triciclohexilamina, triamilamina, trihexilamina, N, N-dimetilanilina, N, N-dimetiltoluidina, N, N-dimetil-p-aminopiridina, N-metilpirrolidina, N-metilpiperidina, N-metilimidazol, N-metilpirazol, N-metilmorfolina, N-metilhexametilenodiamina, piridina, 4-pirrolidinopiridina, 4-dimetilaminopiridina, quinolina, 2-picolina, 3-picolina, pirimidina, acridina, N, N, N', N'-tetrametilendiamina, N, N, N', N'-tetraetilendiamina, quinoxalina, N-propildiisopropilamina, N-etildiisopropilamina, N, N'-dimetilciclohexilamina, 2,6-lutidina, 2,4-lutidina o trietilendiamina).

Los auxiliares de reacción ácidos utilizados para llevar a cabo el proceso de acuerdo con la invención incluyen todos los ácidos minerales (por ejemplo, hidrácido halogenado ácidos como ácido fluorhídrico, ácido clorhídrico, ácido bromhídrico o ácido yodhídrico, y también ácido sulfúrico, ácido fosfórico, ácido fosforoso, ácido nítrico), ácidos de Lewis (por ejemplo, cloruro de aluminio (III), trifluoruro de boro o su eterato, cloruro de titanio (IV), cloruro de estaño (IV)) y ácidos orgánicos (por ejemplo ácido fórmico, ácido acético, ácido propiónico, ácido malónico, ácido láctico, ácido oxálico, ácido fumárico, ácido adípico, ácido esteárico, ácido tartárico, ácido oleico, ácido metanosulfónico, ácido benzoico, ácido bencenosulfónico o ácido para-toluenosulfónico).

Los ejemplos de preparación y uso que siguen ilustran la invención sin limitarla.

Ejemplos de preparación:

3-cloro-N-(piridin-2-ilmetil)-N-{1-[1-(pirimidin-2-il)-1H-1,2,4-triazol-5-il]etil}-5-(trifluorometil)benzamida (ejemplo I-001)

Paso 1: Agregar 1,07 g (9,91 mmol) 1-(piridin-2-il)metanamina a una suspensión de 1,5 g (4,95 mmol) 2-[5-(1-bromoetil)-1H-1,2,4-triazol-1-il]pirimidina (descrito en WO 2017/192385) y 2,06 g (14,8 mmol) K₂CO₃ en 30 mL MeCN y agitar la mezcla a 80 °C durante 2 horas. Enfriar la mezcla a temperatura ambiente y filtrar a través de Celite® seguido por lavado con EtOAc. Concentrar el filtrado a presión reducida. Particionar el residuo con agua y EtOAc, separar las capas y extraer la capa acuosa dos veces con EtOAc. Secar los extractos orgánicos combinados sobre Na₂SO₄, filtrar y concentrar a presión reducida para proveer 1,7 g de N-(piridin-2-ilmetil)-1-[1-(pirimidin-2-il)-1H-1,2,4-triazol-5-il]etanamina como material bruto que se usó como tal en el siguiente paso.

LC-MS: logP^[b] = 0,77

m/z [M+H]⁺ = 282,3

Paso 2: Agregar 212 mg (0,94 mmol) ácido 3cloro-5-(trifluorometil)benzoico a una solución de 300 mg (0,85 mmol) de N-(piridin-2-ilmetil)-1-[1-(pirimidin-2-il)-1H-1,2,4-triazol-5-il]etanamina y 0,49 mL DIPEA en 30 mL EtOAc y agitar la mezcla a temperatura ambiente durante 10 min. Agregar 1 mL T3P® (50 % en peso en EtOAc) y agitar a temperatura ambiente durante la noche. Dividir la mezcla entre agua y EtOAc, separar las capas y lavar la fase orgánica secuencialmente con agua, NaHCO₃ ac. sat. y NH₄Cl ac. sat. Secar sobre Na₂SO₄, filtrar y concentrar a presión reducida y purificar el residuo por cromatografía preparativa para proveer el compuesto del título I-001 (54 mg).

¹H-NMR (260 Kelvin): CD₃CN, δ véase lista de picos NMR en Tabla 1.

m/z [M+H]⁺ = 488,0

3-cloro-N-(etoximetil)-N-{1-[1-(pirimidin-2-il)-1H-1,2,4-triazol-5-il]etil}-5-(trifluorometil)benzamida (ejemplo I-013)

Una solución de 100 mg (80 % puro, 202 μmol) 3-cloro-N-{1-[1-(pirimidin-2-il)-1H-1,2,4-triazol-5-il]etil}-5-(trifluorometil)benzamida en 3 mL tetrahidrofurano se enfrió hasta -45 °C y se trató con 0,42 mL (0,21 mmol) de una solución 0,5 M de bis(trimetilsilil)amida de potasio en tolueno. La solución se agitó durante 15 min a -45 °C luego de lo que se agregó 37 μL (0,40 mmol) clorometil etil éter. Luego de 30 min a -45 °C la solución se dejó alcanzar temperatura ambiente y se agitó durante la noche. Se agregó una solución acuosa de cloruro de sodio (10%), las capas se separaron y la capa acuosa se extrajo varias veces con acetato de etilo. Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre Na₂SO₄, se filtraron y se concentraron a presión reducida. El residuo se purificó por HPLC (H₂O / acetonitrilo) para proporcionar 21 mg de 3-cloro-N-(etoximetil)-N-{1-[1-(pirimidin-2-il)-1H-1,2,4-triazol-5-il]etil}-5-(trifluorometil)benzamida.

¹H-NMR (260 Kelvin): CDCl₃, δ véase lista de picos NMR en Tabla 1.

m/z [M+H]⁺ = 455,1

3-cloro-N-[2-(metilsulfanil)etil]-5-(metilsulfonil)-N-{1-[1-(pirimidin-2-il)-1H-tetrazol-5-il]etil}benzamida (ejemplo I-048)

Paso 1: Agregar 190,5 mg (2,08 mmol) 2-(metilsulfanil)etanamina a una suspensión de 400 mg (1,89 mmol) 2-[5-(1-cloroetil)-1H-tetrazol-1-il]pirimidina (sintetizado en analogía a WO 2017/192385) y 787 mg (5,69 mmol) K₂CO₃ en 30 mL MeCN y agitar la mezcla a 80 °C durante 2 horas. Enfriar la mezcla a temperatura ambiente y filtrar a través de

Celite® seguido por lavado con EtOAc. Concentrar el filtrado a presión reducida. Particionar el residuo con agua y EtOAc, separar las capas y extraer la capa acuosa dos veces con EtOAc. Secar los extractos orgánicos combinados sobre Na₂SO₄, filtrar y concentrar a presión reducida para proveer 760 mg de N-[2-(metilsulfanil)etil]-1-[1-(pirimidin-2-il)-1H-tetrazol-5-il]etanamina como material bruto que se usó como tal en el siguiente paso.

5 LC-MS: logP^[b] = 1,14

m/z [M+H]⁺ = 238,1

10 **Paso 2:** Agregar 478,5 mg (1,89 mmol) cloruro de 3-cloro-5-(metilsulfonyl)benzoilo a una solución de 760 mg (1,71 mmol) de N-[2-(metilsulfanil)etil]-1-[1-(pirimidin-2-il)-1H-tetrazol-5-il]etanamina y 1 mL DIPEA en 20 mL MeCN y agitar la mezcla a temperatura ambiente durante la noche. Retirar todos los volátiles a presión reducida y dividir el residuo entre agua y diclorometano, separar las capas y lavar la fase orgánica con agua, secar sobre Na₂SO₄, filtrar y concentrar a presión reducida y purificar el residuo por cromatografía de gel de sílice para proveer el compuesto del título I-048 (28,8 mg).

¹H-NMR d₆-DMSO, δ véase lista de picos NMR en Tabla 1.

m/z [M+H]⁺ = 482,2

15 **Datos analíticos de los compuestos**

La determinación de [M+H]⁺ o M⁺ por LC-MS en condiciones cromatográficas ácidas se realizó con 1 ml ácido fórmico por litro de acetonitrilo y 0,9 ml ácido fórmico por litro de agua Millipore como eluyentes. Se usó la columna Zorbax Eclipse Plus C18 50 mm * 2,1 mm. La temperatura del horno de columna fue 55 °C.

Instrumentos:

20 **LC-MS3:** Waters UPLC con espectrómetro de masas SQD2 y muestreador automático SampleManager. Gradiente lineal 0,0 a 1,70 minutos de 10 % acetonitrilo a 95 % acetonitrilo, de 1,70 a 2,40 minutos constante 95 % acetonitrilo, flujo 0,85 ml/min.

25 **LC-MS6 y LC-MS7:** Muestreador automático Agilent 1290 LC, Agilent MSD, HTS PAL. Gradiente lineal 0,0 a 1,80 minutos de 10 % acetonitrilo a 95 % acetonitrilo, de 1,80 a 2,50 minutos constante 95 % acetonitrilo, flujo 1,0 ml/min.

La determinación de [M+H]⁺ por LC-MS en condiciones cromatográficas neutras se realizó con acetonitrilo y agua Millipore que contenía 79 mg/l carbonato de amoníaco como eluyentes.

Instrumentos:

30 **LC-MS4:** Waters IClass Acquity con espectrómetro de masas QDA y muestreador automático FTN (columna Waters Acquity 1,7 µm 50 mm * 2,1 mm, temperatura de horno 45°C). Gradiente lineal 0,0 a 2,10 minutos de 10 % acetonitrilo a 95 % acetonitrilo, de 2,10 a 3,00 minutos constante 95 % acetonitrilo, flujo 0,7 ml/min.

35 **LC-MS5:** Sistema Agilent 1100 LC con espectrómetro de masas MSD y muestreador automático HTS PAL (columna: Zorbax XDB C18 1,8 µm 50 mm * 4,6 mm, temperatura de horno 55°C). Gradiente lineal 0,0 a 4,25 minutos de 10 % acetonitrilo a 95 % acetonitrilo, de 4,25 a 5,80 minutos constante 95 % acetonitrilo, flujo 2,0 ml/min.

La medición de valores logP se realizó de acuerdo con la directiva EEC 79/831 Anexo V.A8 por HPLC (cromatografía líquida de alto rendimiento) en columnas de fase inversa con los siguientes procedimientos:

^[a] El valor logP se determina por medición de LC-UV, en un intervalo ácido, con 0,1% de ácido fórmico en agua y acetonitrilo como eluyente (gradiente lineal de 10% de acetonitrilo a 95% de acetonitrilo).

40 ^[b] El valor logP se determina por medición de LC-UV, en un intervalo neutro, con 0,001 de solución de acetato de amonio molar agua y acetonitrilo como eluyente (gradiente lineal de 10% de acetonitrilo a 95% de acetonitrilo).

45 La calibración se realizó con alcan-2-onas (con 3 a 16 átomos de carbono) con valores de logP conocidos (medición de valores de logP usando tiempos de retención con interpolación lineal entre alcanonas sucesivas). Los valores de Lambda-max se determinaron usando espectros UV de 200 nm a 400 nm y los valores pico de las señales cromatográficas.

La determinación de los datos ¹H-NMR se realizó con un espectrómetro Bruker **Avance III 400 MHz** equipado con un cabezal de sonda TCI de 1,7 mm, con tetrametilsilano como referencia (0,00 ppm) y las mediciones se registraron generalmente de soluciones en los solventes CD₃CN, CDCl₃ o d₆-DMSO. De manera alternativa

un instrumento **Bruker Avance III 600 MHz** equipado con un cabezal de sonda CPNMP de 5 mm o un instrumento Bruker **Avance NEO 600 MHz** equipado con un cabezal de sonda TCI de 5 mm se usaron para las mediciones. Generalmente las mediciones se llevaron a cabo con una temperatura de cabezal de sonda de 298 K. Otras temperaturas de medición se notaron explícitamente.

- 5 Los datos NMR de ejemplo seleccionados se enumeran ya sea en forma convencional (valores δ , división de multipletes, cantidad de átomos de hidrógeno) o como listas de picos NMR.

Procedimiento de lista de pico NMR

- 10 Los datos ^1H -NMR de ejemplos seleccionados se escriben en la forma de listas de picos ^1H -NMR. Valores- δ en ppm y la intensidad de señal entre paréntesis se enumeran para cada pico de señal. Los punto y coma se describen como delimitadores entre el valor- δ – pares de intensidad de señal.

Por ende la lista de picos de un ejemplo tiene la forma:

δ_1 (intensidad₁); δ_2 (intensidad₂);.....; δ_i (intensidad_i);.....; δ_n (intensidad_n)

- 15 La intensidad de las señales agudas se correlaciona con la altura de las señales en una vista impresa de un espectro ^1H -NMR en cm y muestra las relaciones reales de intensidades de señal. Pueden mostrarse varios picos de señales anchas o la mitad de la señal y su intensidad relativa en comparación con la señal más intensa en el espectro.

Tetrametilsilano o el cambio químico del solvente en casos donde la muestra no contiene tetrametilsilano se usa para una calibración del cambio químico para los espectros ^1H . Por ende el pico de tetrametilsilano puede ocurrir en listas de picos ^1H -NMR, pero no necesariamente.

- 20 Las listas de picos ^1H -NMR son equivalentes las impresiones clásicas de ^1H -NMR y contienen normalmente todos los picos, que también se enumeran en las interpretaciones clásicas de ^1H -NMR.

Además, pueden mostrar señales de solventes, estereoisómeros de los compuestos que también son opcionalmente objeto de la invención, y/o picos de impurezas, como impresiones clásicas de ^1H -NMR.

- 25 Las señales de solventes de ^1H -NMR, la señal de tetrametilsilano y la señal de agua en el correspondiente solvente se excluyen de la calibración de intensidad relativa a medida que tienen valores de intensidad muy alto.

En promedio, los picos de estereoisómeros de los compuestos de acuerdo con la invención y/o picos de impurezas tienen normalmente una menor intensidad que los picos de los compuestos de acuerdo con la invención (por ejemplo con una pureza >90%).

- 30 Tales estereoisómeros y/o impurezas pueden ser típicos para el proceso de preparación específico. Entonces, los picos correspondientes pueden ayudar a reconocer la reproducción del proceso de preparación mediante "huellas de productos secundarios".

- 35 Un experto, que calcula los picos de los compuestos diana con procedimientos conocidos (MestreC, simulación ACD, pero también con valores de expectativa evaluados empíricamente) puede asignar los picos de los compuestos diana según sea necesario, usando opcionalmente filtros de intensidad adicionales. La asignación sería similar a la recolección de pico relevante en las interpretaciones clásicas de ^1H -NMR.

El solvente usado puede extraerse del archivo JCAMP con el parámetro "solvente", la frecuencia de espectrómetro con "observar frecuencia" y el tipo de espectrómetro con "espectrómetro/sistema de datos".

- 40 Los datos ^{13}C -NMR se muestran análogos a los datos ^1H -NMR como listas de picos de espectros ^{13}C -NMR desacoplados de banda ancha. Las señales de solvente ^{13}C -NMR y tetrametilsilano se excluyen de la calibración de intensidad relativa ya que estas señales pueden ser intensidades muy altas.

Detalles adicionales de la descripción de datos de NMR con listas de picos se describen en la solicitud "Citation of NMR Peaklist Data within Patent Applications" de la base de datos de investigación de descripción número 564025.

- 45 Los compuestos de acuerdo con la invención descritos en tabla 1 más adelante son del mismo modo compuestos preferidos de la fórmula (I) de acuerdo con la invención que se obtienen de acuerdo con o análogamente a los ejemplos de preparación descritos anteriormente.

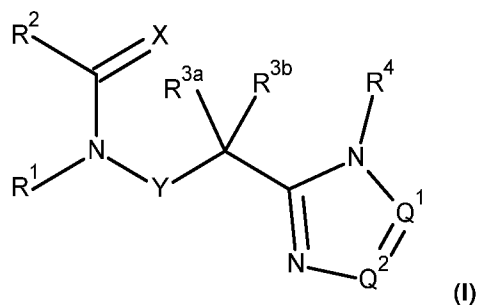


Tabla 1

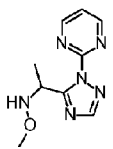
Ejemplo	Estructura	Lista de picos NMR [1]	m/z [M+H] ⁺ [2]
I-026		1-026: ¹ H-NMR(400,2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,9543 (14,5); 8,9421 (14,8); 8,2818 (15,4); 8,0210 (5,7); 7,7474 (6,1); 7,6474 (5,2); 7,6354 (14,2); 7,6231 (4,7); 6,4646 (1,0); 6,4473 (3,6); 6,4298 (3,6); 6,4123 (1,0); 3,3905 (27,4); 3,3268 (229,7); 2,6761 (0,7); 2,6716 (1,0); 2,6671 (0,8); 2,5250 (2,9); 2,5114 (59,8); 2,5072 (121,2); 2,5027 (160,4); 2,4981 (118,8); 2,4938 (59,7); 2,3339 (0,7); 2,3295 (1,0); 2,3250 (0,8); 2,0751 (1,4); 1,8082 (16,0); 1,7907 (15,9); 0,1459 (0,4); 0,0079 (3,0); -0,0002 (88,5); -0,0084 (3,5); -0,1497 (0,4)	427,0
I-027		1-027: ¹ H-NMR(400,2 MHz, CD ₃ CN): δ= 8,8340 (10,0); 8,8219 (10,2); 8,0629 (9,2); 7,8064 (4,9); 7,7183 (5,0); 7,6654 (5,4); 7,4697 (3,0); 7,4576 (5,9); 7,4455 (3,0); 6,5124 (1,1); 6,4949 (3,5); 6,4774 (3,5); 6,4600 (1,1); 3,7153 (0,4); 3,6973 (1,3); 3,6777 (2,1); 3,6594 (1,6); 3,6416 (0,5); 3,5671 (0,6); 3,5496 (2,0); 3,5316 (2,4); 3,5109 (1,7); 3,4930 (0,5); 2,1732 (27,9); 2,1220 (0,4); 2,1145 (0,4); 2,1086 (0,4); 1,9655 (0,9); 1,9535 (13,2); 1,9474 (25,8); 1,9413 (36,8); 1,9351 (26,7); 1,9290 (14,5); 1,8363 (16,0); 1,8188 (16,0); 0,7695 (7,0); 0,7519 (14,2); 0,7342 (6,9); -0,0002 (2,5)	441,0
I-028		1-028: ¹ H-NMR(400,2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,9402 (13,6); 8,9281 (13,7); 8,2733 (13,5); 8,1743 (0,5); 7,8592 (2,7); 7,8401 (3,3); 7,7140 (2,2); 7,6946 (4,7); 7,6699 (3,6); 7,6507 (4,4); 7,6358 (10,3); 7,6236 (8,2); 7,6114 (4,0); 6,4820 (1,1); 6,4648 (3,8); 6,4473 (3,8); 6,4298 (1,1); 3,3378 (35,0); 3,3256 (164,5); 2,6753 (0,8); 2,6710 (1,1); 2,6667 (0,8); 2,5065 (144,2); 2,5021 (186,7); 2,4976 (136,5); 2,3332 (0,9); 2,3288 (1,2); 2,3246 (0,9); 1,8074 (16,0); 1,7899 (15,9); 0,1455 (0,6); 0,0072 (6,3); -0,0006 (136,2); -0,0087 (5,5); -0,1500 (0,6)	393,2
I-029		1-029: ¹ H-NMR(400,2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,9491 (15,2); 8,9369 (15,5); 8,2697 (14,5); 7,8591 (2,6); 7,8397 (3,2); 7,7301 (2,3); 7,7106 (4,3); 7,6731 (3,4); 7,6556 (6,4); 7,6392 (5,0); 7,6347 (2,0); 7,6271 (8,9); 7,6150 (4,4); 6,4852 (1,1); 6,4678 (4,0); 6,4504 (4,0); 6,4328 (1,1); 3,6501 (0,4); 3,6326 (1,3); 3,6118 (2,1); 3,5937 (1,7); 3,5762 (0,5); 3,5308 (0,7); 3,5131 (2,4); 3,4953 (2,7); 3,4920 (2,3); 3,4740 (1,9); 3,4562 (0,5); 3,3324 (45,6); 2,6733 (0,4); 2,5265 (1,1); 2,5131 (25,1); 2,5087 (51,0); 2,5042 (67,4); 2,4997 (48,4); 2,4953 (23,2); 2,3311 (0,4); 2,0874 (0,4); 1,8049 (16,0); 1,7874 (15,9); 0,7028 (7,5); 0,6852 (16,0); 0,6676 (7,3); 0,0080 (2,5); -0,0002 (65,4); -0,0085 (2,1)	407,2

Ejemplo	Estructura	Lista de picos NMR [1]	m/z [M+H] ⁺ [2]
---------	------------	------------------------	-------------------------------

[1] 260 K' denota que la medición se realizó a 260 Kelvin.

[2] La masa establecida corresponde al pico del patrón de isotipo del ión [M+H]⁺ con la mayor intensidad.

Tabla 2 (Intermedios)

Intermedio	Estructura	LogP ^[a]	m/z [M+H] ⁺ [#]
a-024		0,42	221,1

[a] El valor logP se determina por medición de LC-UV, en un intervalo neutro, con 0,001 de solución de acetato de amonio molar en agua y acetonitrilo como eluyente (gradiente lineal de 10% de acetonitrilo a 95% de acetonitrilo).

[#] La masa establecida corresponde al pico del patrón de isotipo del ión [M+H]⁺ con la mayor intensidad.

[†] Denota que se registró el ión [M-H]⁻.

Ejemplos biológicos

5 Ctenocephalides felis – pruebas de contacto in-vitro con pulgas de gato adulto

Se disuelve 9 mg de compuesto en 1 ml de acetona y se diluye con acetona hasta lograr la concentración deseada. 250µl de la solución de prueba se rellena en tubos de ensayo de vidrio de 25ml y se distribuye de forma homogénea en las paredes internas por rotación e inclinación en un dispositivo de agitación (2 h a 30 rpm). Con una concentración de compuesto de 900 ppm, una superficie interna de 44,7 cm² y una distribución homogénea, se logra una dosis de 5µg/cm².

Después de evaporado el solvente, cada tubo de ensayo se rellena con 5-10 pulgas de gato adulto (*Ctenocephalides felis*), se cierra con una tapa perforada y se incuba en una posición recostada a temperatura ambiente y humedad relativa. Después de 48 horas se determina la eficacia. Las pulgas se pasan en el suelo de los tubos y se incuban en una placa de calentamiento a 45-50°C durante como mucho 5 minutos. Las pulgas inmóviles o con movimiento descoordinado, que no son capaces de escapar del calor escalando hacia arriba, se marcan como muertas o moribundas.

Un compuesto muestra una buena eficacia contra *Ctenocephalides felis*, si a una concentración de compuesto de 5µg/cm² se monitorea una eficacia de al menos 80 %. Una eficacia de 100 % significa que todas las pulgas están muertas o moribundas; 0 % significa que no hay pulgas muertas ni moribundas.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación mostraron buena actividad de 100% a una velocidad de aplicación de 5 µg/cm²: I-027, I-029,.

Rhipicephalus sanguineus - pruebas de contacto in-vitro con garrapatas de perro pardo adulto

Se disuelve 9 mg de compuesto en 1 ml de acetona y se diluye con acetona hasta lograr la concentración deseada. 250µl de la solución de prueba se rellena en tubos de ensayo de vidrio de 25ml y se distribuye de forma homogénea en las paredes internas por rotación e inclinación en un dispositivo de agitación (2 h a 30 rpm). Con una concentración de compuesto de 900 ppm, una superficie interna de 44,7 cm² y una distribución homogénea, se logra una dosis de 5µg/cm².

Después de evaporado el solvente, cada tubo de ensayo se rellena con 5-10 garrapatas de perro pardo adulto (*Rhipicephalus sanguineus*), se cierra con una tapa perforada y se incuba en una posición recostada a temperatura ambiente y humedad relativa. Después de 48 horas se determina la eficacia. Las garrapatas se pasan en el suelo de los tubos y se incuban en una placa de calentamiento a 45-50°C durante como mucho 5 minutos. Las garrapatas inmóviles o con movimiento descoordinado, que no son capaces de escapar del calor escalando hacia arriba, se marcan como muertas o moribundas.

Un compuesto muestra una buena eficacia contra *Rhipicephalus sanguineus*, si a una concentración de compuesto de 5µg/cm² se monitorea una eficacia de al menos 80%. Una eficacia de 100% significa que todas las garrapatas están muertas o moribundas; 0 % significa que no hay garrapatas muertas ni moribundas.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación mostraron buena actividad de 100% a una velocidad de aplicación de 5 µg/cm²: I-028.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación mostraron buena actividad de 80% a una velocidad de aplicación de 5 µg/cm²: I-029.

- 5 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación mostraron buena actividad de 100% a una velocidad de aplicación de 1 µg/cm²: I-027.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación mostraron buena actividad de 80% a una velocidad de aplicación de 1 µg/cm²: I-028.

Boophilus microplus – prueba de inyección

- 10 Solvente: dimetil sulfóxido

Para producir una preparación adecuada de compuesto activo, se disolvieron 10 mg del compuesto activo en 0,5 ml de solvente y el concentrado se diluye con solvente a la concentración deseada.

Se inyectan cinco garrapatas hembra dilatadas adultas (*Boophilus microplus*) con una solución de compuesto de 1 µl en el abdomen. Las garrapatas se transfieren a placas replicadas y se incubaron en una cámara climática.

- 15 Luego de 7 días se monitorea la deposición de huevos de huevos fértiles. Los huevos donde no es visible fertilidad se almacenan en una cámara climática hasta la incubación luego de alrededor de 42 días. Una eficacia de 100% significa que todos los huevos son infértiles; 0% significa que todos los huevos son fértiles.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación mostraron buena actividad de 100% a una velocidad de aplicación de 20 µg /animal: I-026, I-027, I-028, I-029.

- 20 **Ctenocephalides felis – prueba oral**

Solvente: dimetil sulfóxido

Para producir una preparación adecuada de compuesto activo, se disolvieron 10 mg del compuesto activo en 0,5 ml de solvente y el concentrado se diluye con sangre de ganado a la concentración deseada.

- 25 Aproximadamente 20 pulgas de gato adulto sin alimentar (*Ctenocephalides felis*) se colocan en cámaras de pulgas. La cámara de sangre, sellada con parafilm en la parte inferior, se llenan con sangre de ganado suministrada con solución de compuesto y se colocan en la parte superior cubierta con gasa de la cámara de pulgas, para que las pulgas puedan chupar la sangre. La cámara de sangre se calienta a 37 °C mientras que la cámara de pulgas se mantiene a temperatura ambiente.

- 30 Luego de 2 días se determina la mortalidad en %. 100% significa que se mataron todas las pulgas; 0% significa que no se mató ninguna pulga.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación mostraron buena actividad de 100% a una velocidad de aplicación de 100 ppm: I-027.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación mostraron buena actividad de 80% a una velocidad de aplicación de 100 ppm: I-029.

- 35 **Diabrotica balteata – prueba de aerosol**

Solvente: 78,0 partes en peso de acetona

1,5 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: éter de alquilarilpoliglicol

- 40 Para producir una preparación adecuada de compuesto activo, 1 parte en peso de compuesto activo se mezcla con la cantidad establecida de solvente y se diluye el concentrado con agua, que contiene una concentración emulsionante de 1000 ppm, a la concentración deseada. Concentraciones de prueba adicionales se preparan por dilución con agua que contiene emulsionante.

- 45 Semillas de trigo empapadas (*Triticum aestivum*) se colocan en una placa de múltiples pocillos rellena con ágar y algo de agua y se incuban durante 1 día para germinar (5 semillas por pocillo). Las semillas de trigo germinada se pulverizan con una solución de prueba que contiene la concentración deseada del ingrediente activo. Después cada unidad se infecta con 10-20 larvas de escarabajos rayados del pepino (*Diabrotica balteata*).

Luego de 7 días se determina la eficacia en %. 100% significa que todas las plántulas crecieron como en el control no tratada, no infectado; 0% significa que ninguna de las plántulas creció.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación mostraron buena actividad de 100% a una velocidad de aplicación de 160 µg/pocillo: I-026, I-027.

- 5 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación mostraron buena actividad de 100% a una velocidad de aplicación de 80 µg/pocillo: I-026, I-027, I-028.

Myzus persicae – prueba oral

Solvente: 100 partes en peso de acetona

- 10 Para producir una preparación adecuada del componente activo, se mezcló 1 parte en peso de compuesto activo con la cantidad establecida de solvente y el concentrado se diluyó con agua a la concentración deseada.

50 µl de solución de compuesto se llena en placas de microtitulación y se agrega 150 µl de medio de insectos IPL41 (33% + 15% azúcar) para obtener un volumen total de 200 µl por pocillo. Luego las placas se sellan con parafilm a través de lo que una población mezclada del pulgón verde del melocotón (*Myzus persicae*) puede succionar la preparación de compuestos.

Luego de 5 días se determina la mortalidad en %. 100% significa que se mataron todos los áfidos; 0% significa que no se mató ningún áfido.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación mostraron buena actividad de 100% a una velocidad de aplicación de 20 ppm: I-026, I-027.

- 20 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación mostraron buena actividad de 100% a una velocidad de aplicación de 4 ppm: I-026, I-027, I-029.

Nezara viridula – prueba de pulverización

Solvente: 78,0 partes en peso de acetona

1,5 partes en peso de dimetilformamida

- 25 Emulsionante: alquilarilpoliglicol éter

Para producir una preparación adecuada de compuesto activo, 1 parte en peso de compuesto activo se mezcla con la cantidad establecida de solventes y se diluye con agua, que contiene una concentración emulsionante de 1000 ppm, a la concentración deseada. Concentraciones de prueba adicionales se preparan por dilución con agua que contiene emulsionante.

- 30 Las plantas de cebada (*Hordeum vulgare*) infestadas con larvas de chinche verde del arroz (*Nezara viridula*) se pulverizan con una solución de prueba que contiene la concentración deseada del ingrediente activo.

Luego de 4 días se determina la mortalidad en %. 100% significa que se mataron toda la pudenta; 0% significa que no se mató ninguna pudenta.

- 35 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación mostraron buena actividad de 100% a una velocidad de aplicación de 500 g/ha: I-026, I-027, I-028.

Nilaparvata lugens – prueba de aerosol

Solvente: 78,0 partes en peso de acetona

1,5 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: éter de alquilarilpoliglicol

- 40 Para producir una preparación adecuada de compuesto activo, 1 parte en peso de compuesto activo se mezcla con la cantidad establecida de solventes y se diluye con agua, que contiene una concentración emulsionante de 1000 ppm, a la concentración deseada. Concentraciones de prueba adicionales se preparan por dilución con agua que contiene emulsionante.

- 45 Las plantas de arroz (*Oryza sativa*) se pulverizan con una preparación del ingrediente activo de la concentración deseada y las plantas se infestan con el saltahoja café (*Nilaparvata lugens*).

Luego de 4 días se determina la mortalidad en %. 100% significa que se mataron todos los saltahoja; 0% significa que no se mató ningún saltahoja.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación mostraron buena actividad de 100% a una velocidad de aplicación de 500 g/ha: I-028.

5 **Phaedon cochleariae – prueba de pulverización**

Solvente: 78,0 partes en peso de acetona
1,5 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: éter de alquilarilpoliglicol

10 Para producir una preparación adecuada de compuesto activo, 1 parte en peso de compuesto activo se mezcla con la cantidad establecida de solventes y se diluye con agua, que contiene una concentración emulsionante de 1000 ppm, a la concentración deseada. Concentraciones de prueba adicionales se preparan por dilución con agua que contiene emulsionante.

15 Discos de hoja de col china (*Brassica pekinensis*) se pulverizan con una preparación del ingrediente activo de la concentración deseada. Una vez secos, los discos de hojas se infectan con larva de escarabajo de la mostaza (*Phaedon cochleariae*).

Luego de 7 días se determina la mortalidad en %. 100% significa que se mataron todas las larvas de escarabajo; 0% significa que no se mató ninguna larva de escarabajo.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación mostraron buena actividad de 100% a una velocidad de aplicación de 500 g/ha: I-026, I-027.

20 **Spodoptera frugiperda – prueba de pulverización**

Solvente: 78,0 partes en peso de acetona
1,5 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: alquilarilpoliglicol éter

25 Para producir una preparación adecuada de compuesto activo, 1 parte en peso de compuesto activo se mezcla con la cantidad establecida de solventes y se diluye con agua, que contiene una concentración emulsionante de 1000 ppm, a la concentración deseada. Concentraciones de prueba adicionales se preparan por dilución con agua que contiene emulsionante.

30 Secciones de hoja de maíz (*Zea mays*) se pulverizan con una preparación del ingrediente activo de la concentración deseada. Una vez secas, las secciones de hojas se infectan con larva de cogollero del maíz (*Spodoptera frugiperda*).

Luego de 7 días se determina la mortalidad en %. 100% significa que se mataron todas las orugas; 0% significa que no se mató ninguna oruga.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación mostraron buena actividad de 100% a una velocidad de aplicación de 500 g/ha: I-026.

35 **Tetranychus urticae (resistente a OP) – prueba de pulverización**

Solvente: 78,0 partes en peso de acetona
1,5 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: éter de alquilarilpoliglicol

40 Para producir una preparación adecuada de compuesto activo, 1 parte en peso de compuesto activo se mezcla con la cantidad establecida de solventes y se diluye con agua, que contiene una concentración emulsionante de 1000 ppm, a la concentración deseada. Concentraciones de prueba adicionales se preparan por dilución con agua que contiene emulsionante.

Discos de hoja de judía (*Phaseolus vulgaris*) infectados con todos los estadios de ácaro de dos puntos (*Tetranychus urticae*), se pulverizan con una preparación del ingrediente activo de la concentración deseada.

Luego de 6 días se determina la mortalidad en %. 100% significa que se mataron todos los ácaros; 0% significa que no se mató ningún ácaro.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación mostraron buena actividad de 90% a una velocidad de aplicación de 500 g/ha: I-026.

- 5 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación mostraron buena actividad de 80% a una velocidad de aplicación de 500 g/ha: I-027.

Prueba de Anopheles funestus (tratamiento de superficie y ensayo de contacto ANPHFU)

Solvente: Acetona + 2000 ppm metil éster de aceite de colza (RME)

- 10 Para producir una solución que contiene ingrediente activo necesario es necesario disolver el compuesto de prueba en la mezcla de solvente (acetona a 2 mg/ml / RME 2000 ppm). Esta solución se coloca en pipetas sobre una loseta vitrificada y luego de la evaporación de la acetona, los mosquitos adultos de la especie Anopheles funestus cepa FUMQZ-R (Hunt et ál., Med. Vet. Entomol. septiembre de 2005; 19(3): 271-275) se colocan sobre la superficie seca. El tiempo de exposición es de 30 minutos.

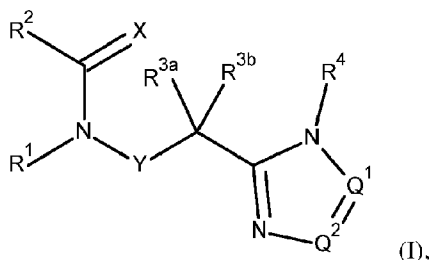
- 15 La mortalidad en porcentaje (%) se determina 24 horas luego del contacto de los insectos con la superficie tratada. 100% mortalidad significa que todos los insectos analizados están muertos, 0% significa que ningún insecto está muerto.

Los siguientes ejemplos mostraron en esta eficacia de prueba de 85-100% a una concentración de superficie de 20 mg/m²: I-027.

- 20 Los siguientes ejemplos mostraron en esta eficacia de prueba de 85-100% a una concentración de superficie de 4 mg/m²: I-027.

REIVINDICACIONES

1. Compuesto de fórmula (I)



en la cual

5 X es O;

Q¹ es N

Q² es CR⁵ o N;

Y es un enlace directo;

R¹ metoxi o etoxi;

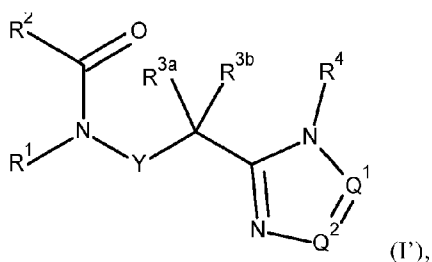
10 R² es 3-cloro-5-trifluorometil-fenilo, 3-trifluorometil-fenilo, 3,5-bis(trifluorometil)-fenilo, 3,5-dicloro-fenilo, 3-cloro-fenilo, 3-cloro-5-metilsulfonyl-fenilo, 3-cloro-5-(pentafluoro-λ⁶-tio)-fenilo, 3-fluoro-5-ciclopropil-fenilo, 3-cloro-5-ciclopropil-fenilo, 5-metilsulfonyl-piridin-3-ilo, 2-cloro-tien-4-ilo; R^{3a} es metilo;

R^{3b} es hidrógeno;

R⁴ es pirimidin-2-ilo, 5-ciano-piridin-2-ilo;

15 R⁵ es hidrógeno.

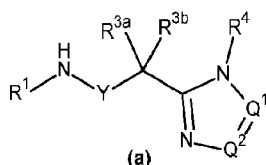
2. Compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, **caracterizado porque** tiene una estructura de acuerdo con la fórmula (I')



20 en la que los elementos estructurales Y, Q¹, Q², R¹, R², R^{3a}, R^{3b}, R⁴ y R⁵ tienen los significados dados en la reivindicación 1.

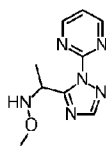
3. Compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 2, en el que Q² representa CR⁵ y todos los demás elementos estructurales Y, Q¹, R¹, R², R^{3a}, R^{3b}, R⁴ y R⁵ tienen los significados dados en la reivindicación 1.

4. Compuesto de la fórmula (a)



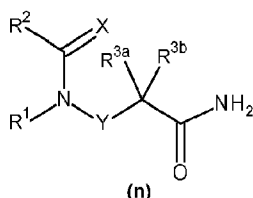
25 en la que los elementos estructurales Y, Q¹, Q², R¹, R^{3a}, R^{3b} y R⁴ tienen los significados dados en la reivindicación 1.

5. Compuesto de la fórmula (a-024) de acuerdo con la reivindicación 4



a-024

6. Compuesto de la fórmula (n)



en la que los elementos estructurales X, Y, R¹, R², R^{3a} y R^{3b} tienen los significados dados en la reivindicación 1.

- 5 7. Formulación que comprende al menos un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3.
8. Formulación de acuerdo con la reivindicación 7, que comprende además al menos un extensor y/o al menos una sustancia con actividad de superficie.
- 10 9. Formulación de acuerdo con la reivindicación 7 u 8, caracterizada porque el compuesto de fórmula (I) está mezclado con al menos un compuesto activo adicional.
- 15 10. Procedimiento para controlar plagas, especialmente plagas animales, **caracterizado porque** se deja actuar sobre las plagas un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 o una formulación de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 7 a 9 y/ o su hábitat, en el que se excluyen los procedimientos de tratamiento del cuerpo del animal mediante cirugía o terapia y los procedimientos de diagnóstico practicados en el cuerpo del animal.
11. Procedimiento de acuerdo con la reivindicación 10, **caracterizado porque** la plaga es una plaga animal y comprende un insecto, un arácnido o un nematodo, o **porque** la plaga es un insecto, un arácnido o un nematodo.
- 20 12. Uso de un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 o de una formulación de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 7 a 9 para controlar plagas de animales, en el que se excluyen procedimientos para el tratamiento del cuerpo del animal mediante cirugía o terapia y procedimientos de diagnóstico practicados en el cuerpo del animal.
13. Uso de acuerdo con la reivindicación 12, **caracterizado porque** la plaga animal comprende un insecto, un arácnido o un nematodo, o **porque** la plaga animal es un insecto, un arácnido o un nematodo.
14. Uso de acuerdo con la reivindicación 12 o 13 en protección de cultivos.
- 25 15. Uso de un compuesto o una sal de acuerdo con la reivindicación 12 o 13 en el control de vectores.
16. Procedimiento para proteger una semilla o una planta en germinación de plagas que comprende una etapa del procedimiento en el que la semilla se pone en contacto con un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 o con una formulación de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 7 a 9.