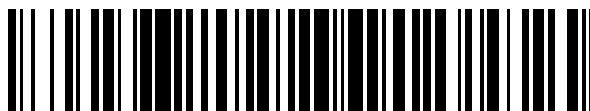


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 626 601**

51 Int. Cl.:

C07D 401/14 (2006.01)

C07D 417/14 (2006.01)

A01N 43/56 (2006.01)

A01N 43/78 (2006.01)

A01N 43/824 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **24.06.2011 PCT/EP2011/060596**

87 Fecha y número de publicación internacional: **05.01.2012 WO12000896**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **24.06.2011 E 11727451 (4)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **01.03.2017 EP 2585451**

54 Título: **Compuestos heterocíclicos como pesticidas**

30 Prioridad:

24.03.2011 EP 11159576

28.06.2010 US 359058 P

28.06.2010 EP 10167453

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

25.07.2017

73 Titular/es:

BAYER INTELLECTUAL PROPERTY GMBH
(100.0%)

Alfred-Nobel-Strasse 10
40789 Monheim, DE

72 Inventor/es:

BRETSCHNEIDER, THOMAS;
FISCHER, REINER;
FÜSSLEIN, MARTIN;
JESCHKE, PETER;
KÖHLER, ADELINE;
KLUTH, JOACHIM;
MÜHLTHAU, FRIEDRICH AUGUST;
SATO, YOSHITAKA;
VOERSTE, ARND y
SHIMOJO, EIICHI

74 Agente/Representante:

CARPINTERO LÓPEZ, Mario

Observaciones:

Véase nota informativa (Remarks, Remarques o Bemerkungen) en el folleto original publicado por la Oficina Europea de Patentes

ES 2 626 601 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 heterocíclicos como pesticidas

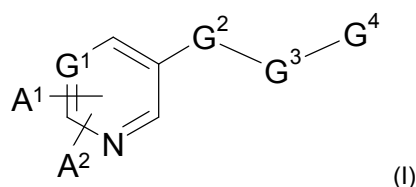
La presente solicitud se refiere a nuevos compuestos heterocíclicos, a procedimientos para la preparación de los mismos y a su uso para controlar plagas animales, que incluyen artrópodos y, especialmente, insectos, y también a productos intermedios para la preparación de los compuestos heterocíclicos.

Determinados compuestos de tiazolilo, tiadiazolilo y pirazolilo ya se han conocido como compuestos de acción insecticida (véase el documento WO 2010/006713 A2).

Los agentes fitosanitarios modernos deben cumplir muchos requerimientos por ejemplo en relación con el nivel, la duración y la amplitud de su acción y uso posible. Las cuestiones de toxicidad, capacidad de combinación con otros principios activos o coadyuvantes de formulación desempeñan un papel, como también lo hace la cuestión de los gastos que requiere la síntesis de un principio activo. Además, se pueden producir resistencias. Por todos estos motivos, la búsqueda de nuevos agentes fitosanitarios no se puede considerar completa y existe una necesidad constante de compuestos nuevos que tengan propiedades que, en comparación con los compuestos conocidos, sean mejores al menos en lo que respecta a aspectos individuales.

El objetivo de la presente invención era proporcionar compuestos mediante los cuales se amplíe el espectro de los pesticidas en varios aspectos.

El objetivo, así como objetivos adicionales mencionados no de manera explícita, que se pueden discernir o derivar de las relaciones tratadas en el presente documento, se soluciona mediante nuevos compuestos de fórmula (I)

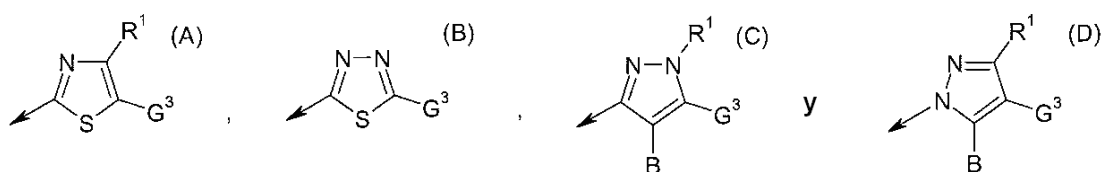


20 en la que

A¹ y A² independientemente entre sí representan hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ o alcoxi C₁-C₆,

G¹ representa N o C-A¹ y

G² representa un resto de la serie



25

en la que la flecha marca el enlace al anillo adyacente,

R¹ en el caso de los heterociclos (A) y (D) representan hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆ o haloalquilo-C₁-C₆,

R¹ en el caso del heterociclo (C) representa hidrógeno, alquilo-C₁-C₆ o haloalquilo-C₁-C₆,

30 B representa hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo-C₁-C₆, haloalquilo-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆ o cicloalquilo-C₃-C₆,

G³ representa heteroarilo de 5 miembros o heteroarilo de 6 miembros en cada caso opcionalmente sustituido con halógeno, ciano, nitro, amino, alquilamino-C₁-C₆, dialquilamino-C₁-C₆, alquilo-C₁-C₆, cicloalquilo-C₃-C₆, haloalquilo-C₁-C₆, hidroxilo, alcoxi-C₁-C₆, haloalcoxi-C₁-C₆, alquiltio-C₁-C₆, alquilcarbonilo-C₁-C₆, alcoxycarbonilo-C₁-C₆, alquenilo-C₂-C₆ o alquinilo-C₂-C₆,

35

G⁴ representa un resto de la serie



X representa oxígeno o azufre,

n representa 1 o 2,

5 R^2 representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo-C₁-C₆, haloalquilo-C₁-C₆, ciano-alquilo-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆, haloalcoxi-C₁-C₆, alquenilo-C₂-C₆, alquinilo-C₂-C₆, alcoxi-C₁-C₆-alquilo-C₁-C₆, alquilcarbonilo-C₁-C₆ y alquilsulfonilo-C₁-C₆ en cada caso opcionalmente sustituido con halógeno, alcocixarbonilo-C₁-C₆ sustituido opcionalmente con halógeno, cicloalquilcarbonilo-C₃-C₆ opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆, haloalquilo-C₁-C₆ y ciano, o representa un ion metálico mono o divalente o un ion amonio opcionalmente sustituido con alquilo-C₁-C₆ o arilo C₁-C₆.

10 R^7 representa un resto de la serie alquilo-C₁-C₆, alquenilo-C₂-C₆ y alquinilo-C₂-C₆ en cada caso opcionalmente sustituido con halógeno, alcoxi-C₁-C₆, haloalcoxi-C₁-C₆, alquiltio-C₁-C₆, haloalquiltio-C₁-C₆, alquilsulfino-C₁-C₆, haloalquilsulfino-C₁-C₆, alquilsulfonilo-C₁-C₆ y haloalquilsulfonilo-C₁-C₆, cicloalquilo-C₃-C₆, cicloalquil-C₃-C₆-alquilo-C₁-C₆ y cicloalquenilo-C₃-C₆ en cada caso opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo-C₁-C₆, haloalquilo-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆ o haloalcoxi-C₁-C₆, en los que los anillos pueden contener al menos un heteroátomo de la serie azufre, oxígeno (en la que los átomos de oxígeno no deben estar directamente adyacentes) y nitrógeno, arilo, heteroarilo, aril-alquilo-C₁-C₆ y heteroaril-alquilo-C₁-C₆ en cada caso opcionalmente sustituidos con halógeno, ciano (también en el resto alquilo), nitro, alquilo-C₁-C₆, haloalquilo-C₁-C₆, cicloalquilo-C₃-C₆, alcoxi-C₁-C₆, haloalcoxi-C₁-C₆, alquiltio-C₁-C₆, haloalquiltio-C₁-C₆, alquilsulfino-C₁-C₆, haloalquilsulfino-C₁-C₆, alquilsulfonilo-C₁-C₆, haloalquilsulfonilo-C₁-C₆, amino, alquilamino-C₁-C₆, di(alquil-C₁-C₆)amino, alquilcarbonilamino-C₁-C₆, alcocixarbonilamino-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆-alquilo-C₁-C₆, haloalcoxi-C₁-C₆-alquilo-C₁-C₆, alquenilo-C₂-C₆, alquinilo-C₂-C₆, cicloalquil-C₃-C₆-alquilo-C₁-C₆, alquilcarbonilo-C₁-C₆, alcocixarbonilo-C₁-C₆ o aminocarbonilo, o representa NR'R'', en el que R' y R'' independientemente entre sí en cada caso representan un resto de la serie de hidrógeno, alquilo-C₁-C₆, haloalquilo-C₁-C₆, cicloalquilo-C₃-C₆, cicloalquil-C₃-C₆-alquilo-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆, alquilcarbonilo-C₁-C₆ y alcocixarbonilo-C₁-C₆,

15 R^2 y R^7 pueden también formar, junto con el grupo N-S(O)_n al que están unidos, un anillo de 5 a 7 miembros saturado o insaturado y opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo-C₁-C₆, haloalquilo-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆, haloalcoxi-C₁-C₆, que puede contener uno o más heteroátomos adicionales de la serie azufre, oxígeno (en la que los átomos de oxígeno no deben estar directamente adyacentes) y nitrógeno y/o al menos un grupo carbonilo,

20 R^{11} y R^{12} independientemente entre sí representan un resto en cada caso opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo-C₁-C₆, haloalquilo-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆, haloalcoxi-C₁-C₆, de la serie alquilo-C₁-C₆, alquenilo-C₂-C₆, alquinilo-C₂-C₆, fenilo y fenil-alquilo-C₁-C₆

y en la que

35 halógeno se selecciona de la serie flúor, cloro, bromo y yodo,

arilo (también como parte de una unidad mayor, como por ejemplo arilalquilo) se selecciona de la serie fenilo, naftilo, antrilo, fenantrenilo,

hetarilo (sinónimo de heteroarilo, también como parte de una unidad mayor, como por ejemplo hetarilalquilo) se

30 selecciona de la serie furilo, tienilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, oxazolilo,

40 isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 1,2,3-oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo, 1,2,3-

tiadiazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, 1,2,3-

triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo, benzofurilo, benzoisofurilo, benzotienilo, benzoisotienilo, indolilo, isoindolilo,

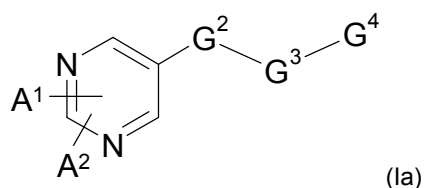
45 indazolilo, benzotiazolilo, benzoisotiazolilo, benzoxazolilo, benzoisoxazolilo, bencimidazolilo, 2,1,3-benzoxadiazol,

quinolinilo, isoquinolinilo, cinnolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, naftiridinilo, benzotriazinilo, purinilo,

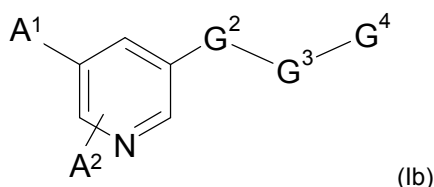
pteridinilo e indolizínilo,

así como sales y N-óxidos de los compuestos de fórmula (I).

Cuando G¹ representa N, se obtienen por consiguiente compuestos de fórmula (Ia)



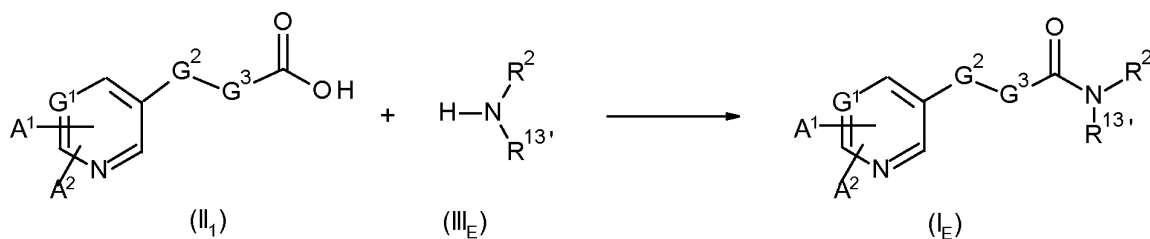
y cuando G¹ representa C-A¹, se obtienen compuestos de fórmula (Ib)



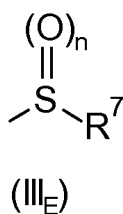
en la que los sustituyentes restantes tienen en cada caso los significados mencionados anteriormente,

- 5 Además se ha descubierto que los compuestos de fórmula (I) se pueden obtener mediante los procedimientos descritos a continuación.

Los compuestos de fórmula (I_E) se pueden preparar, por ejemplo, haciendo reaccionar los ácidos carboxílicos de fórmula (II₁) o los cloruros ácidos de los mismos con derivados amina de fórmula (III_E).



- 10 en la que R^{13'} representa



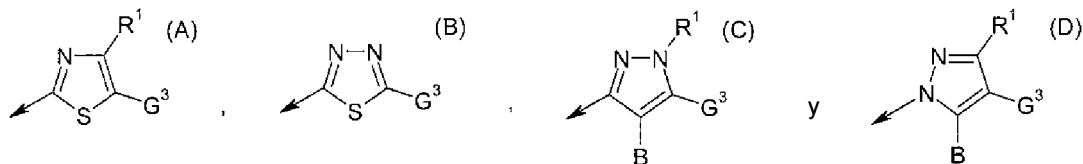
- 15 Por último, se ha descubierto que los compuestos nuevos de fórmula (I) tienen propiedades biológicas muy pronunciadas y son adecuados, en particular, para controlar plagas animales, especialmente de insectos, arácnidos y nematodos, que se encuentran en la agricultura, en los bosques, en la protección de productos y materiales almacenados y en el sector de la higiene.

Los compuestos de fórmula (I) pueden encontrarse, eventualmente en función de la naturaleza de los sustituyentes, como isómeros geométricos y/o como isómeros ópticamente activos o las correspondientes mezclas de isómeros en diferentes composiciones. La invención se refiere tanto a los isómeros puros como a las mezclas de isómeros.

- 20 Los compuestos de la invención pueden también estar presentes como complejos metálicos, como se ha descrito para otras amidas, por ejemplo en el documento DE 2221647.

Los sustituyentes o intervalos preferentes de los restos expuestos en los compuestos de fórmula (I) se aclaran a continuación.

- A¹ representa hidrógeno, halógeno o ciano.
 A² representa hidrógeno.
 25 G¹ representa N o C-A¹.
 G² representa un resto de la serie



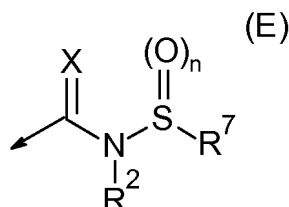
en la que la flecha marca el enlace al anillo adyacente.

R¹ representa hidrógeno o alquilo-C₁-C₄.

B representa hidrógeno.

5 G³ representa heteroarilo de 5 miembros o heteroarilo de 6 miembros sustituido con alquinilo C₂-C₆ en cada caso opcionalmente sustituidos con halógeno, ciano, nitro, amino, alquilamino-C₁-C₆, dialquilamino-C₁-C₆, alquilo-C₁-C₆, cicloalquilo-C₃-C₆, haloalquilo-C₁-C₆, hidroxilo, alcoxi-C₁-C₆, haloalcoxi-C₁-C₆, alquiltio-C₁-C₆, alquilcarbonilo-C₁-C₆, alcoxicarbonilo-C₁-C₆, alquenilo-C₂-C₆ o alquinilo-C₂-C₆.

G⁴ representa el resto



10

en la que la flecha, en cada caso, marca el enlace a G³.

X representa oxígeno.

n representa 2.

15 R² representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo-C₁-C₄, alquinilo-C₂-C₄, ciano-alquilo-C₁-C₄ y alcoxi-C₁-C₄-alquilo-C₁-C₄, y alquilcarbonilo-C₁-C₄ o alquilsulfonilo-C₁-C₄ opcionalmente sustituido con halógeno, alcoxicarbonilo-C₁-C₄ opcionalmente sustituido con halógeno, cicloalquilcarbonilo-C₃-C₆ opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo-C₁-C₄, alcoxi-C₁-C₄, haloalquilo-C₁-C₄ y ciano, o representa un ion metálico mono o divalente, o un ion amonio opcionalmente sustituido con alquilo-C₁-C₄ o aril-alquilo C₁-C₄.

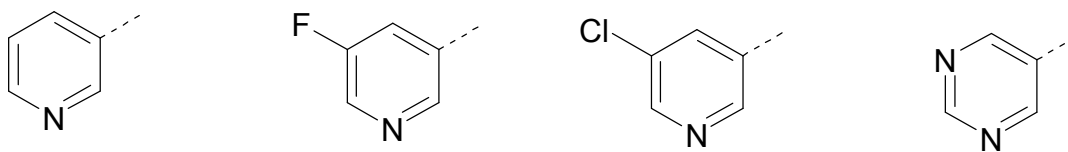
20 R⁷ representa un resto de la serie alquilo-C₁-C₄, alquenilo-C₂-C₄ y alquinilo-C₂-C₄ en cada caso opcionalmente sustituido con halógeno, alcoxi-C₁-C₄, haloalcoxi-C₁-C₄, alquiltio-C₁-C₄, haloalquiltio-C₁-C₄, alquilsulfino-C₁-C₄, haloalquilsulfino-C₁-C₄, alquilsulfonilo-C₁-C₄ y haloalquilsulfonilo-C₁-C₄, cicloalquilo-C₃-C₆, cicloalquil-C₃-C₆-alquilo-C₁-C₄ y cicloalquenilo-C₃-C₄ en cada caso opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo-C₁-C₄, haloalquilo-C₁-C₄, alcoxi-C₁-C₄ o haloalcoxi-C₁-C₄, en los que los anillos pueden contener al menos un heteroátomo de la serie azufre, oxígeno (en la que los átomos de oxígeno no deben estar directamente adyacentes) y nitrógeno, arilo, heteroarilo, aril-alquilo-C₁-C₄ y heteroaril-alquilo-C₁-C₄ en cada caso opcionalmente sustituidos con halógeno, ciano (también en el resto alquilo), nitro, alquilo-C₁-C₄, haloalquilo-C₁-C₄, cicloalquilo-C₃-C₆, alcoxi-C₁-C₄, haloalcoxi-C₁-C₄, alquiltio-C₁-C₄, haloalquiltio-C₁-C₄, alquilsulfino-C₁-C₄, haloalquilsulfino-C₁-C₄, alquilsulfonilo-C₁-C₄, haloalquilsulfonilo-C₁-C₄, amino, alquilamino-C₁-C₄, di(alquil-C₁-C₄)amino, alquilcarbonilamino-C₁-C₄, alcoxicarbonilamino-C₁-C₄, alcoxi-C₁-C₄-alquilo-C₁-C₄, haloalcoxi-C₁-C₄-alquilo-C₁-C₄, alquenilo-C₂-C₄, alquinilo-C₂-C₄, cicloalquil-C₃-C₆-alquilo-C₁-C₄, alquilcarbonilo-C₁-C₄, alcoxicarbonilo-C₁-C₄ o aminocarbonilo, o representa NR'R'' en el que R' y R'' independientemente entre sí en cada caso representan un resto de la serie hidrógeno, alquilo-C₁-C₄ y cicloalquil-C₃-C₆-alquilo-C₁-C₄.

35 Sustituyentes o intervalos especialmente preferentes de los restos expuestos en los compuestos de fórmula (I) se aclaran a continuación.

A¹ representa un resto de la serie hidrógeno, flúor y cloro.

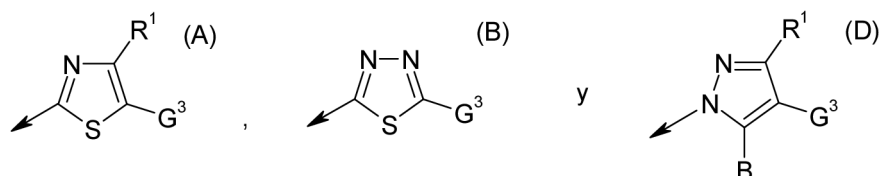
A² representa hidrógeno.

G¹ representa N o C-A¹, que lleva a compuestos que contienen los siguientes elementos estructurales:



en la que la línea discontinua quiere decir el enlace a G².

G² representa un resto de la serie

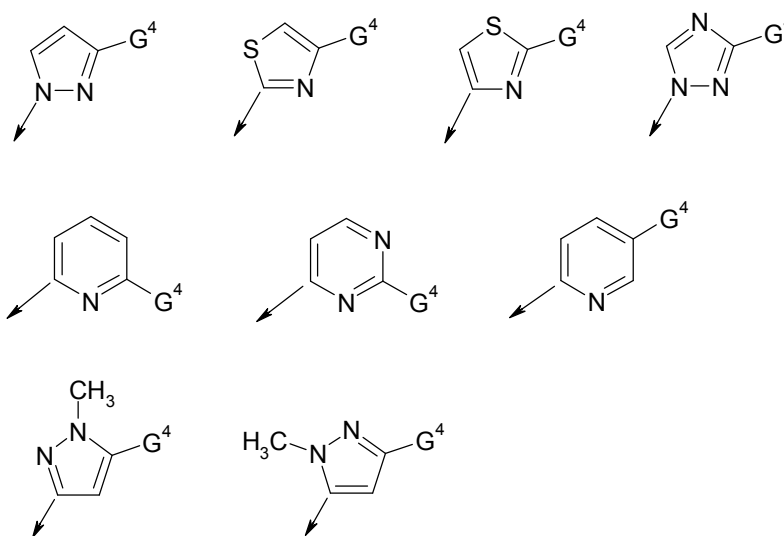


5 en la que la flecha, en cada caso, marca el enlace al anillo adyacente.

R¹ representa hidrógeno o metilo.

B representa hidrógeno.

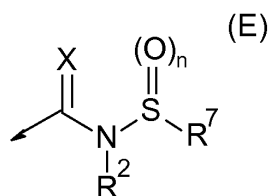
G³ representa un resto opcionalmente sustituido con halógeno, ciano, metilo, metoxi, trifluorometilo, amino o dimetilamino de la serie



10

en la que la flecha, en cada caso, marca el enlace a G², y G⁴ también se muestra para ilustración.

G⁴ representa el resto



en la que la flecha, en cada caso, marca el enlace a G³.

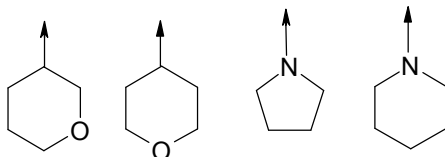
15 X representa oxígeno.

n representa 2.

R² representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo-C₁-C₄, alquino-C₂-C₄, ciano-alquilo-C₁-C₄ y alcoxi-C₁-C₄-alquilo-C₁-C₄, y alquilcarbonilo-C₁-C₄ o alquilsulfonilo-C₁-C₄ sustituido opcionalmente con halógeno,

alcoxicarbonilo-C₁-C₄ sustituido opcionalmente con halógeno, cicloalquilcarbonilo-C₃-C₆ opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo-C₁-C₄, alcoxi-C₁-C₄, haloalquilo-C₁-C₄ y ciano, o representa un ion metálico mono o divalente, o un ion amonio opcionalmente sustituido con alquilo-C₁-C₄ o aril-alquilo C₁-C₄.

5 R^7 representa un resto de la serie alquilo-C₁-C₄, alqueno-C₂-C₄ y alquino-C₂-C₄ en cada caso opcionalmente sustituido con halógeno, alcoxi-C₁-C₄, haloalcoxi-C₁-C₄, alquiltio-C₁-C₄, haloalquiltio-C₁-C₄, alquilsulfino-C₁-C₄, haloalquilsulfino-C₁-C₄, alquilsulfonilo-C₁-C₄ y haloalquilsulfonilo-C₁-C₄, cicloalquilo-C₃-C₆, cicloalquil-C₃-C₆-alquilo-C₁-C₄ y cicloalqueno-C₃-C₄ en cada caso opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo-C₁-C₄, haloalquilo-C₁-C₄, alcoxi-C₁-C₄ o haloalcoxi-C₁-C₄, en los que los anillos pueden contener al menos un heteroátomo de la serie azufre, oxígeno (en la que los átomos de oxígeno no deben estar directamente adyacentes) y nitrógeno (y a este respecto especialmente representa



15 en la que la flecha en cada caso marca el enlace al átomo de S en el resto (E)), arilo, heteroarilo, aril-alquilo C₁-C₄ y heteroaril-alquilo-C₁-C₄ en cada caso opcionalmente sustituidos con halógeno, ciano (también en el resto alquilo), nitro, alquilo-C₁-C₄, haloalquilo-C₁-C₄, cicloalquilo-C₃-C₆, alcoxi-C₁-C₄, haloalcoxi-C₁-C₄, alquiltio-C₁-C₄, haloalquiltio-C₁-C₄, alquilsulfino-C₁-C₄, haloalquilsulfino-C₁-C₄, alquilsulfonilo-C₁-C₄, haloalquilsulfonilo-C₁-C₄, amino, alquilamino-C₁-C₄, di(alquil-C₁-C₄)amino, alquilcarbonilamino-C₁-C₄, alcoxicarbonilamino-C₁-C₄, alcoxi-C₁-C₄-alquilo-C₁-C₄, haloalcoxi-C₁-C₄-alquilo-C₁-C₄, alqueno-C₂-C₄, alquino-C₂-C₄, cicloalquil-C₃-C₆-alquilo-C₁-C₄, alquilcarbonilo-C₁-C₄, alcoxicarbonilo-C₁-C₄ o aminocarbonilo, o representa NR'R'', en el que R' y R'' independientemente entre sí en cada caso representan un resto de la serie hidrógeno y alquilo-C₁-C₄, y en particular R⁷ representa un resto de la serie metilo, etilo, i-propilo, CF₃, CHF₂, CH₂F, CH₂CF₃, ciclopropilo, dimetilamino, dietilamino, fenilo y bencilo.

En las definiciones preferidas, a menos que se indique lo contrario,

halógeno se selecciona de la serie flúor, cloro, bromo y yodo, preferentemente, a su vez, de la serie flúor, cloro y bromo,

25 arilo (incluido como parte de una unidad mayor, como por ejemplo arilalquilo) se selecciona de la serie fenilo, naftilo, antrilo, fenantrenilo y, a su vez, representa preferentemente fenilo,

hetarilo (incluido como parte de una unidad mayor, como por ejemplo hetarilalquilo) se selecciona de la serie piridilo, pirimidilo, oxadiazolilo, oxazolilo, pirazinilo, imidazolilo, tiazolilo, tiadiazolilo y furanilo.

En las definiciones especialmente preferentes, a menos que se indique lo contrario,

30 arilo representa fenilo, y

hetarilo (equivalente a heteroarilo, incluido como parte de una unidad mayor, como por ejemplo hetarilalquilo) representa un resto seleccionado de la serie pirazolilo, oxazolilo, tiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazinilo y pirazinilo.

35 Los restos sustituidos con halógeno, por ejemplo haloalquilo (= halogenoalquilo), están mono o polihalogenados, hasta como máximo el número de posibles sustituyentes. En el caso de la polihalogenación, los átomos de halógeno pueden ser idénticos o diferentes. En este caso, halógeno representa flúor, cloro, bromo o yodo, especialmente flúor, cloro o bromo.

Los restos de hidrocarburo saturados o insaturados, tales como alquilo o alqueno, pueden ser, en cada caso, de cadena lineal o ramificados, en tanto que sea posible, también en combinación con heteroátomos como, por ejemplo, en alcoxi.

40 Los restos opcionalmente sustituidos pueden estar mono o polisustituidos, en los que, en el caso de polisustitución, los sustituyentes pueden ser iguales o diferentes.

En los restos (A), (B), (C) y (D) que G² puede representar, la flecha, en cada caso, marca el enlace al anillo adyacente.

En un grupo destacado de compuestos de acuerdo con la invención, G² representa el resto (A).

45 En otro grupo destacado de compuestos de acuerdo con la invención, G² representa el resto (B).

En otro grupo destacado de compuestos de acuerdo con la invención, G² representa el resto (C).

En otro grupo destacado de compuestos de acuerdo con la invención, G² representa el resto (D).

En otro grupo destacado de compuestos de acuerdo con la invención, X representa oxígeno.

En otro grupo destacado de compuestos de acuerdo con la invención, X representa azufre.

En otro grupo destacado de compuestos de acuerdo con la invención, G¹ representa C-H.

5 En otro grupo destacado de compuestos de acuerdo con la invención, G¹ representa C-F.

En otro grupo destacado de compuestos de acuerdo con la invención, G¹ representa N (nitrógeno).

En otro grupo destacado de compuestos de acuerdo con la invención, A¹ representa hidrógeno.

En otro grupo destacado de compuestos de acuerdo con la invención, A² representa hidrógeno.

En otro grupo destacado de compuestos de acuerdo con la invención, n representa 2.

10 En otro grupo destacado de compuestos de acuerdo con la invención, R¹ representa hidrógeno.

En otro grupo destacado de compuestos de acuerdo con la invención, R¹ representa metilo.

En otro grupo destacado de compuestos de acuerdo con la invención, R¹ representa flúor.

En otro grupo destacado de compuestos de acuerdo con la invención, G⁴ representa el resto (E).

En otro grupo destacado de compuestos de acuerdo con la invención, G³ representa un resto pirazolilo.

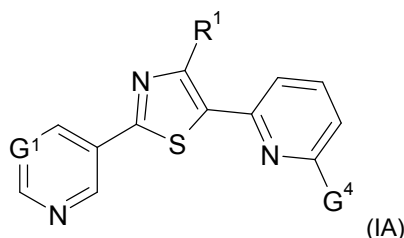
15 En otro grupo destacado de compuestos de acuerdo con la invención, G³ representa un resto tiazolilo.

En otro grupo destacado de compuestos de acuerdo con la invención, G³ representa un resto triazolilo.

En otro grupo destacado de compuestos de acuerdo con la invención, G³ representa un resto piridinilo.

En otro grupo destacado de compuestos de acuerdo con la invención, G³ representa un resto pirimidinilo.

Una forma de realización destacada de la invención se refiere a compuestos de fórmula (IA)

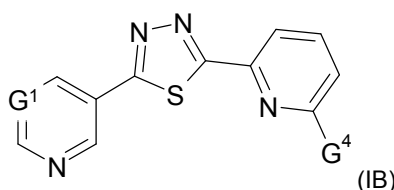


en la que

G¹ representa C-H, C-F, C-Cl o N,
 R¹ representa hidrógeno o metilo, y
 G⁴ representa el resto (E).

25 Un grupo de compuestos preferente entre los compuestos de fórmula (IA) son aquéllos en los que G¹ representa C-F, R¹ representa hidrógeno y G⁴ representa el resto (E).

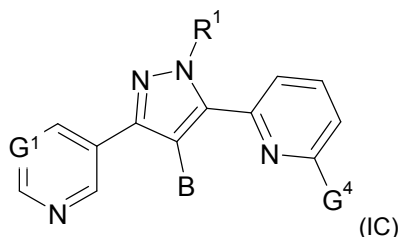
Una forma de realización adicional destacada de la invención se refiere a compuestos de fórmula (IB)



en la que

30 G¹ representa C-H, C-F, C-Cl o N y
 G⁴ representa el resto (E).

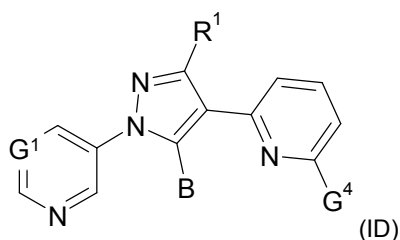
Una forma de realización adicional destacada de la invención se refiere a compuestos de fórmula (IC)



en la que

- 5 G¹ representa C-H, C-F, C-Cl o N,
 R¹ representa hidrógeno o metilo,
 B representa hidrógeno y
 G⁴ representa el resto (E).

Una forma de realización adicional destacada de la invención se refiere a compuestos de fórmula (ID)



10 en la que

- G¹ representa C-H, C-F, C-Cl o N,
 R¹ representa hidrógeno o metilo,
 B representa hidrógeno y
 G⁴ representa el resto (E).

15 Los sustituyentes en el resto (E) en los compuestos de fórmulas (IA), (IB), (IC) y (ID) pueden adoptar los significados mencionados anteriormente en la descripción.

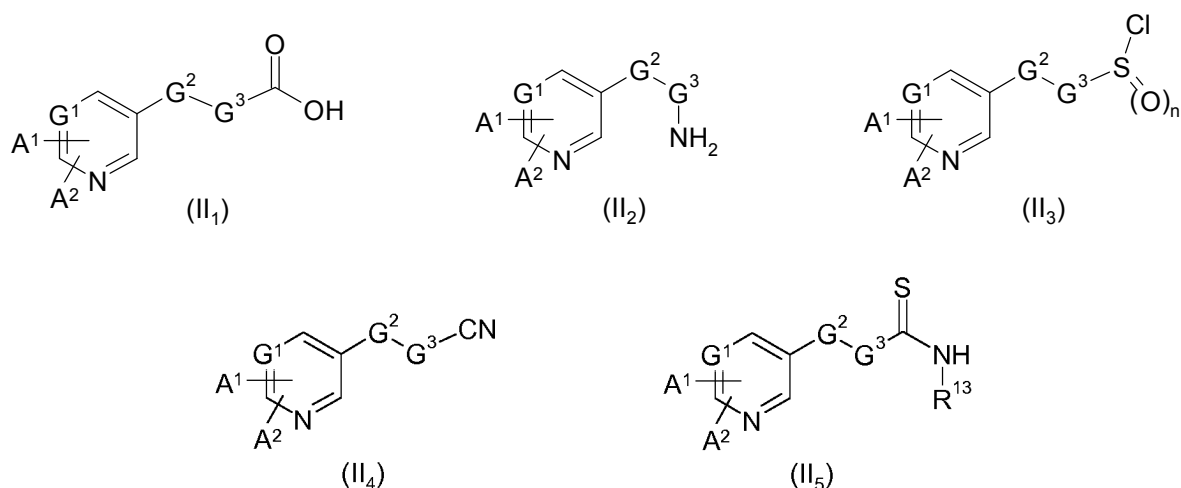
20 Las definiciones de restos o explicaciones indicadas con anterioridad en términos generales o indicadas en los intervalos de preferencia se aplican a los productos finales de fórmula (I) (y, por tanto, también a los compuestos de fórmulas (Ia), (Ib), (IA), (IB), (IC) y (ID)), y de manera correspondiente a los productos de partida y productos intermedios. Estas definiciones de restos se pueden combinar entre sí según se desee, es decir, también entre los intervalos de preferencia respectivos.

De acuerdo con la invención se prefieren compuestos de fórmula (I) en la que existe una combinación de los significados citados con anterioridad como preferentes.

25 De acuerdo con la invención se prefieren especialmente los compuestos de fórmula (I) en la que existe una combinación de los significados citados con anterioridad como especialmente preferentes.

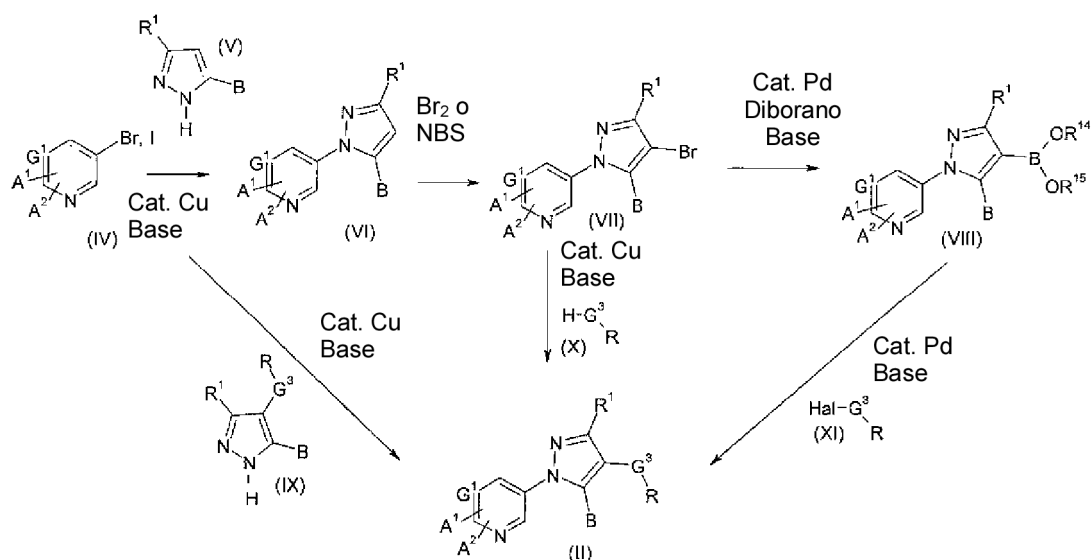
La preparación de los compuestos de acuerdo con la invención se explica con detalle a continuación.

Los compuestos necesarios como sustancias de partida de fórmula (II₁), (II₂), (II₃), (II₄) y (II₅), en las que G² representa los restos (A), (B) y (C), se pueden preparar de forma análoga a los procedimientos descritos en el documento WO 2010/006713 A2.



Los compuestos de partida necesarios como sustancias de partida de fórmula (II₁), (II₂), (II₃), (II₄) y (II₅), en las que G² representa el resto (D), se pueden preparar de forma análoga a lo indicado en la bibliografía, del siguiente modo.

5 Esquema de reacción 1



Por ejemplo, mediante la reacción de un bromuro de fórmula (IV) con un pirazol de fórmula (V) en presencia de un catalizador de cobre y de una base, tal como carbonato potásico, se obtienen los compuestos de fórmula (VI). Véase, por ejemplo, para 3-(4-bromopirazol-1-il)piridina. *Journal of Heterocyclic Chemistry* 1981, 18, 9-14; *European Journal of Organic Chemistry*, 2004, 695. A partir de estos pirazoles de fórmula (VI) se obtienen mediante reacción con bromo o N-bromosuccinimida, los bromuros de fórmula (VII). Véase, por ejemplo, para 3-(4-bromo-pirazol-1-il)-piridina. *Journal of Heterocyclic Chemistry* 18, 1981, 9-14. A partir de los bromuros de fórmula (VII) se obtienen mediante reacción con, por ejemplo, bis-pinacolato-diborano en presencia de un catalizador de paladio y de una base, los ésteres borónicos de fórmula (VIII). Los compuestos de partida de fórmula (II) requeridos se pueden obtener a partir de los bromuros de fórmula (VII) mediante reacción con un compuesto de fórmula (X), que constituye una unidad H-G³-R que contiene un N-H, como por ejemplo un pirazol, en presencia de un catalizador de cobre y de una base, o, de acuerdo con el mismo procedimiento, mediante reacción de los bromuros de fórmula (IV) con un pirazol adecuado de fórmula (IX).

Además, los compuestos de acuerdo con la invención de fórmula (I) se pueden obtener mediante reacción de los ésteres borónicos de fórmula (VIII) con un haluro de fórmula (XI) en presencia de un catalizador de paladio y de una base (reacción de Suzuki).

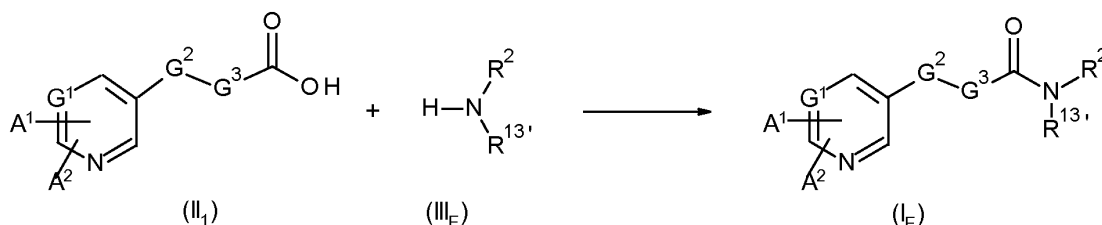
Cuando R representa un ácido carboxílico protegido, por ejemplo representa un éster, el ácido carboxílico (II₁) puede prepararse fácilmente mediante procedimientos conocidos.

Cuando R representa una amina protegida, la amina (II₂) puede prepararse fácilmente mediante procedimientos

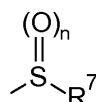
conocidos.

5 Cuando R representa halógeno, por ejemplo bromo, (de forma análoga a los documentos WO2007/45588 A1 y US2008/318941), el halógeno se puede intercambiar por un metal, por ejemplo litio. El compuesto metálico reacciona con dióxido de azufre y, después, con un reactivo de cloración tal como cloruro de sulfurilo o N-clorosuccinimida, para dar el compuesto de partida (II₃).

Esquema de reacción 2



en la que R¹³ representa



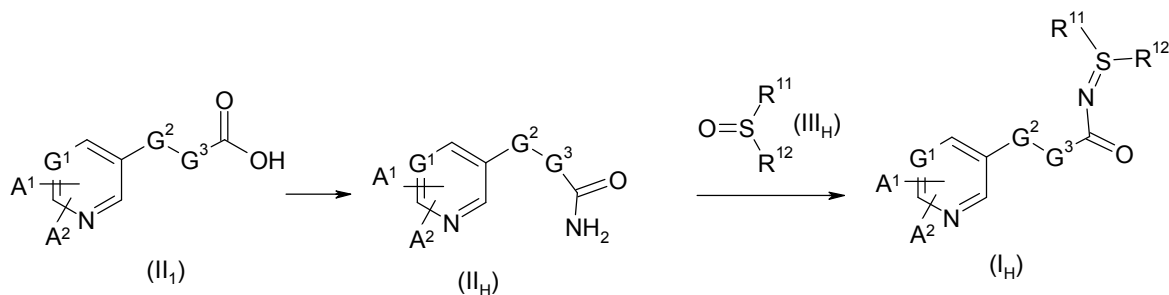
(en III_E).

10 Los derivados de amina de fórmula (III_E) requeridos como sustancias de partida se conocen o se pueden preparar según procedimientos conocidos en principio.

15 Los ácidos de fórmula (II₁) se pueden hacer reaccionar, tras la activación, por ejemplo, para dar el cloruro ácido (véase, por ejemplo, Bioorg & MedChem Letters 15, 4354 (2005)), o por medio de reactivos de activación, tales como CDI (carbonildiimidazol; véase, por ejemplo, Bioorg & MedChem 9, 1543 (2001), EDC (clorhidrato de 1-etil-3-[3-dimetilaminopropil]carbodiimida) en presencia de DMAP (dimetilaminopiridina; véase, por ejemplo, J. Med. Chem. 50, 3101 (2007)), o DCC (diciclohexilcarbodiimida) en presencia de HOBT (1-hidroxibenzotriazol, véase, por ejemplo, J. Med. Chem. 50, 3101 (2007)), con sulfonamidas de fórmula (III_E), opcionalmente en presencia de una base tal como hidruro metálico (especialmente hidruro sódico) o DBU (diazabicycloundeceno), para dar los compuestos de acuerdo con la invención de fórmula (I_E), en la que X representa oxígeno.

20 Los otros radicales mencionados para R¹³ se pueden preparar a partir de los ácidos de fórmula (II₁) o de los cloruros ácidos de los mismos, por medio de los procedimientos de la literatura o de forma análoga a estos procedimientos, por ejemplo mediante reacción con compuestos de fórmula (III_F) de acuerdo con Chem. Letters 36, 1370 (2007) o J. Med. Chem. 29, 1299 (1986), para dar los compuestos de la invención de fórmula (I_F), o, por ejemplo, con compuestos de fórmula (III_G) de acuerdo con J.Org.Chem. 72, 465 (2007) o Phosphorus & Sulfur 20, 93 (1984), para dar los compuestos de la invención de fórmula (I_G) y, por ejemplo, con cianamidas de fórmula (III_M) de acuerdo con el documento WO2006/002099 A2 para dar los compuestos de la invención de fórmula (I_M).

Esquema de reacción 3



30 Los compuestos de fórmula (I_H) se pueden preparar, por ejemplo, haciendo reaccionar las carboxamidas de fórmula (II_H) con sulfóxidos de fórmula (III_H) por medio de procedimientos conocidos por la bibliografía o procedimientos análogos, véase, por ejemplo, el documento WO 2008/154528 A2.

Las carboxamidas de fórmula (II_H) requeridas como sustancias de partida se pueden preparar a partir de los ácidos

(II₁) o sus cloruros de ácido por medio de procedimientos conocidos por la bibliografía o procedimientos análogos, por ejemplo como se describe en los documentos WO 2007/103755 A2 o US 2009/203657 A1.

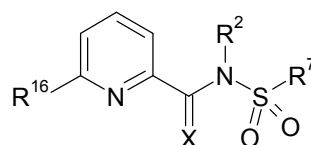
Los sulfóxidos de fórmula (III_H) son compuestos conocidos en la bibliografía.

5 Los compuestos de fórmula (I_E), en los que X representa azufre se pueden preparar a partir de los compuestos correspondientes de fórmula (I_E), en los que X representa oxígeno mediante reacción con un reactivo de sulfuración. Como agentes de sulfuración (reactivos de sulfuración) se usan, preferentemente, reactivos de fósforo, como por ejemplo pentasulfuro de difósforo (P₂S₅), pentasulfuro de difósforo/piridina (P₂S₅/Py), pentasulfuro de difósforo/trietilamina (P₂S₅/NEt₃), pentasulfuro de difósforo/hidrogenocarbonato de sodio (P₂S₅/NaHCO₃ “reactivo de Scheeren”), o de manera especialmente preferente el 2,4-bis(4-metoxifenil)-2,4-ditioxo-1,3,2,4-ditiadifosfetano “reactivo de Lawesson (LR)”, 2,4-bis(4-fenoxifenil)-2,4-ditioxo-1,3,2,4-ditiadifosfetano “reactivo de Belleau (BR)” o 2,4-bis(4-feniltiofenil)-2,4-ditioxo-1,3,2,4-ditiadifosfetano.

15 Se pueden obtener N-óxidos mediante, por ejemplo, reacción de compuestos de fórmula (I) con mCPBA (ácido meta-cloroperbenzoico). Se pueden obtener sales de compuestos de fórmula (I) mediante reacción de compuestos de fórmula (I) con compuestos de fórmula RX, en la que X representa, por ejemplo, halógeno tal como cloro o bromo, y R representa, por ejemplo, un resto alquilo, alquenilo o alquinilo en cada caso opcionalmente sustituido.

Los siguientes productos intermedios de fórmula (XII), (XV) y (XVI) son nuevos y también objeto de la invención.

Compuestos de fórmula (XII)



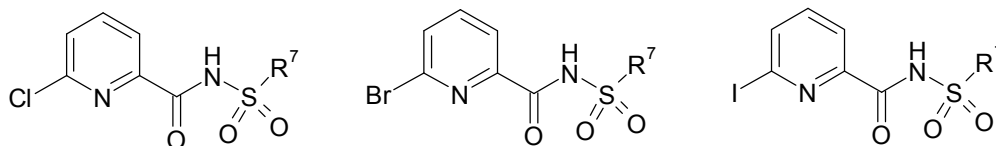
(XII)

en la que

20 R¹⁶ representa flúor, cloro, bromo o yodo (especialmente representa cloro, bromo o yodo) y

X, R² y R⁷ tienen los significados indicados anteriormente, con la excepción de que R⁷ no puede representar arilo.

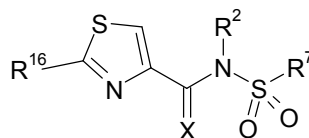
Cabe mencionar especialmente los siguientes compuestos de fórmula (XII).



25

en la que R⁷ representa metilo, etilo, ciclopropilo, CF₃, CH₂CF₃, dimetilamino, dietilamino, fenilo o bencilo.

Compuestos de fórmula (XV)

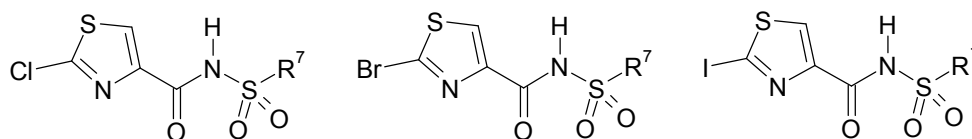


(XV)

en la que

30 R¹⁶ representa flúor, cloro, bromo o yodo (especialmente representa cloro, bromo o yodo) y X, R² y R⁷ tienen los significados indicados anteriormente.

Cabe mencionar especialmente los siguientes compuestos de fórmula (XV).



en la que R^7 representa metilo, etilo, ciclopropilo, CF_3 , CH_2CF_3 , dimetilamino, dietilamino, fenilo o bencilo.

Compuestos de fórmula (XVI)



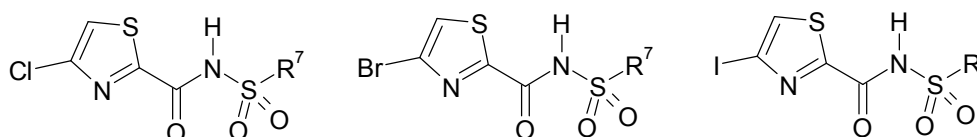
(XVI)

5 en la que

R^{16} representa flúor, cloro, bromo o yodo (especialmente representa cloro, bromo o yodo) y

X , R^2 y R^7 tienen los significados indicados anteriormente.

Cabe mencionar especialmente los siguientes compuestos de fórmula (XVI).



10 en la que R^7 tiene el significado indicado anteriormente y en particular representa metilo, etilo, ciclopropilo, CF_3 , CH_2CF_3 , dimetilamino, dietilamino, fenilo o bencilo.

Los principios activos de acuerdo con la invención, dada la buena tolerancia de las plantas, la toxicidad homeotérmica favorable y la buena compatibilidad ambiental, son adecuados para proteger plantas y órganos de plantas, para aumentar el rendimiento de las cosechas, para mejorar la calidad del producto cosechado y para combatir plagas animales, en particular insectos, arácnidos, helmintos, nematodos y moluscos que se encuentran en agricultura, en horticultura, en la cría de animales, en bosques, en jardines e instalaciones de recreo, en la protección de productos almacenados y de materiales y en el sector de la higiene. Preferentemente se pueden usar como agentes fitosanitarios. Son activos contra especies normalmente sensibles y resistentes y contra todas o contra todas y algunas fases del desarrollo. Las plagas mencionadas anteriormente incluyen:

20 Del orden de los anopluros (Phthiraptera), por ejemplo, *Damalinea* spp., *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Trichodectes* spp.

De la clase de los arácnidos por ejemplo, *Acarus siro*, *Aceria sheldoni*, *Aculops* spp., *Aculus* spp., *Amblyomma* spp., *Argas* spp., *Boophilus* spp., *Brevipalpus* spp., *Bryobia praetiosa*, *Chorioptes* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Eotetranychus* spp., *Eptrimerus pyri*, *Eutetranychus* spp., *Eriophyes* spp., *Hemitarsonemus* spp., *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Latrodectus mactans*, *Metatetranychus* spp., *Oligonychus* spp., *Ornithodoros* spp., *Panonychus* spp., *Phyllocoptura oleivora*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Psoroptes* spp., *Rhipicephalus* spp., *Rhizoglyphus* spp., *Sarcoptes* spp., *Scorpio maurus*, *Stenotarsonemus* spp., *Tarsonemus* spp., *Tetranychus* spp., *Vasates lycopersici*.

De la clase de los bivalvos, por ejemplo, *Dreissena* spp.

Del orden de los quilópodos, por ejemplo, *Geophilus* spp., *Scutigera* spp.

30 Del orden de los coleópteros, por ejemplo, *Acanthoscelides obtectus*, *Adoretus* spp., *Agelastica alni*, *Agriotes* spp., *Amphimallon solstitialis*, *Anobium punctatum*, *Anoplophora* spp., *Anthonomus* spp., *Anthrenus* spp., *Apogonia* spp., *Atomaria* spp., *Attagenus* spp., *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp., *Ceuthorhynchus* spp., *Cleonus mendicus*, *Conoderus* spp., *Cosmopolites* spp., *Costelytra zealandica*, *Curculio* spp., *Cryptorhynchus lapathi*, *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp., *Epilachna* spp., *Faustinus cubae*, *Gibbium psyllodes*, *Heteronychus arator*, *Hylamorpha elegans*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera postica*, *Hypothenemus* spp., *Lachnosterna consanguinea*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lixus* spp., *Lyctus* spp., *Meligethes aeneus*, *Melolontha melolontha*, *Migdolus* spp., *Monochamus* spp., *Naupactus xanthographus*, *Niptus hololeucus*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Otiorrhynchus sulcatus*, *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllophaga* spp., *Popillia japonica*, *Premnotrypes* spp., *Psylliodes chrysocephala*, *Ptinus* spp., *Rhizobius ventralis*, *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus*

spp., *Sphenophorus* spp., *Sternechus* spp., *Symphyletes* spp., *Tenebrio molitor*, *Tribolium* spp., *Trogoderma* spp., *Tychius* spp., *Xylotrechus* spp., *Zabrus* spp.

Del orden de los colémbolos, por ejemplo, *Onychiurus armatus*.

Del orden de los dermápteros, por ejemplo, *Forficula auricularia*.

5 Del orden de los diplópodos, por ejemplo, *Blaniulus guttulatus*.

Del orden de los dípteros, por ejemplo, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Bibio hortulanus*, *Calliphora erythrocephala*, *Ceratitis capitata*, *Chrysomyia* spp., *Cochliomyia* spp., *Cordylobia anthropophaga*, *Culex* spp., *Cuterebra* spp., *Dacus oleae*, *Dermatobia hominis*, *Drosophila* spp., *Fannia* spp., *Gastrophilus* spp., *Hylemyia* spp., *Hyppobosca* spp., *Hypoderma* spp., *Liriomyza* spp., *Lucilia* spp., *Musca* spp., *Nezara* spp., *Oestrus* spp., *Oscinella frit*, *Pegomyia hyoscyami*, *Phorbia* spp., *Stomoxys* spp., *Tabanus* spp., *Tannia* spp., *Tipula paludosa*, *Wohlfahrtia* spp.

10 De la clase de los gasterópodos, por ejemplo, *Arion* spp., *Biomphalaria* spp., *Bulinus* spp., *Deroceras* spp., *Galba* spp., *Lymnaea* spp., *Oncomelania* spp., *Succinea* spp.

15 De la clase de los helmintos, por ejemplo, *Ancylostoma duodenale*, *Ancylostoma ceylanicum*, *Acylostoma braziliensis*, *Ancylostoma* spp., *Ascaris lubricoides*, *Ascaris* spp., *Brugia malayi*, *Brugia timori*, *Bunostomum* spp., *Chabertia* spp., *Clonorchis* spp., *Cooperia* spp., *Dicrocoelium* spp., *Dictyocaulus filaria*, *Dipyllobothrium latum*, *Dracunculus medinensis*, *Echinococcus granulosus*, *Echinococcus multilocularis*, *Enterobius vermicularis*, *Faciola* spp., *Haemonchus* spp., *Heterakis* spp., *Hymenolepis nana*, *Hyostrogulus* spp., *Loa Loa*, *Nematodirus* spp., *Oesophagostomum* spp., *Opisthorchis* spp., *Onchocerca volvulus*, *Ostertagia* spp., *Paragonimus* spp., *Schistosomen* spp., *Strongyloides fuelleborni*, *Strongyloides stercoralis*, *Strongyloides* spp., *Taenia saginata*, *Taenia solium*, *Trichinella spiralis*, *Trichinella nativa*, *Trichinella britovi*, *Trichinella nelsoni*, *Trichinella pseudopsiralis*, *Trichostrongulus* spp., *Trichuris trichuria*, *Wuchereria bancrofti*.

20 También es posible controlar protozoos, tales como *Eimeria*.

También es posible controlar protozoos, tales como *Eimeria*.

25 Del orden de los heterópteros, por ejemplo, *Anasa tristis*, *Antestiopsis* spp., *Blissus* spp., *Calocoris* spp., *Campylomma livida*, *Cavelerius* spp., *Cimex* spp., *Creontiades dilutus*, *Dasynus piperis*, *Dichelops furcatus*, *Diconocoris hewetti*, *Dysdercus* spp., *Euschistus* spp., *Eurygaster* spp., *Heliopeltis* spp., *Horchias nobiellus*, *Leptocoris* spp., *Leptoglossus phyllopus*, *Lygus* spp., *Macropes excavatus*, *Miridae*, *Nezara* spp., *Oebalus* spp., *Pentomidae*, *Plesma quadrata*, *Piezodorus* spp., *Psallus seriatus*, *Pseudacysta perseae*, *Rhodonius* spp., *Sahlbergella singularis*, *Scotinophora* spp., *Stephanitis nashi*, *Tibraca* spp., *Triatoma* spp.

30 Del orden de los homópteros, por ejemplo, *Acyrtosipon* spp., *Aeneolamia* spp., *Agonoscena* spp., *Aleurodes* spp., *Aleurolobus barodensis*, *Aleurothrix* spp., *Amrasca* spp., *Anuraphis cardui*, *Aonidiella* spp., *Aphanostigma piri*, *Aphis* spp., *Arboridia apicalis*, *Aspidiella* spp., *Aspidiotus* spp., *Atanus* spp., *Aulacorthum solani*, *Bemisia* spp., *Brachycaudus helichrysi*, *Brachycolus* spp., *Brevicoryne brassicae*, *Calligypona marginata*, *Carneocephala fulgida*, *Ceratovacuna lanigera*, *Cercopidae*, *Ceroplastes* spp., *Chaetosiphon fragaefolii*, *Chionaspis tegalensis*, *Chlorita onukii*, *Chromaphis juglandicola*, *Chrysomphalus ficus*, *Cicadulina mbila*, *Coccoxystus halli*, *Coccus* spp., *Cryptomyzus ribis*, *Dalbulus* spp., *Dialeurodes* spp., *Diaphorina* spp., *Diaspis* spp., *Doralis* spp., *Drosicha* spp., *Dysaphis* spp., *Dysmicoccus* spp., *Empoasca* spp., *Eriosoma* spp., *Erythroneura* spp., *Euscelis bilobatus*, *Geococcus coffeae*, *Homalodisca coagulata*, *Hyalopterus arundinis*, *Icerya* spp., *Idiocerus* spp., *Idioscopus* spp., *Laodelphax striatellus*, *Lecanium* spp., *Lepidosaphes* spp., *Lipaphis erysimi*, *Macrosiphum* spp., *Mahanarva fimbriolata*, *Melanaphis sacchari*, *Metcalfiella* spp., *Metopolophium dirhodum*, *Monellia costalis*, *Monelliopsis pecanica*, *Myzus* spp., *Nasonovia ribisnigri*, *Nephotettix* spp., *Nilaparvata lugens*, *Oncometopia* spp., *Orthezia praelonga*, *Parabemisia myricae*, *Paratrioza* spp., *Parlatoria* spp., *Pemphigus* spp., *Peregrinus maidis*, *Phenacoccus* spp., *Phloeomyzus passerinii*, *Phorodon humuli*, *Phylloxera* spp., *Pinnaspis aspidistrae*, *Planococcus* spp., *Protopulvinaria pyriformis*, *Pseudaulacaspis pentagona*, *Pseudococcus* spp., *Psylla* spp., *Pteromalus* spp., *Pyrilla* spp., *Quadraspidiotus* spp., *Quesada gigas*, *Rastrococcus* spp., *Rhopalosiphum* spp., *Saissetia* spp., *Scaphoides titanus*, *Schizaphis graminum*, *Selenaspis articulatus*, *Sogata* spp., *Sogatella furcifera*, *Sogatodes* spp., *Stictocephala festina*, *Tenalaphara malayensis*, *Tinocallis caryaefoliae*, *Tomaspsis* spp., *Toxoptera* spp., *Trialeurodes vaporariorum*, *Triozia* spp., *Typhlocyba* spp., *Unaspis* spp., *Viteus vitifolii*.

35 Del orden de los himenópteros, por ejemplo, *Diprion* spp., *Hoplocampa* spp., *Lasius* spp., *Monomorium pharaonis*, *Vespa* spp.

50 Del orden de los isópodos, por ejemplo, *Armadillidium vulgare*, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*.

Del orden de los isópteros, por ejemplo, *Reticulitermes* spp., *Odontotermes* spp.

55 Del orden de los lepidópteros, por ejemplo, *Acronicta major*, *Aedia leucomelas*, *Agrotis* spp., *Alabama argillacea*, *Anticarsia* spp., *Barathra brassicae*, *Bucculatrix thurberiella*, *Bupalus piniarius*, *Cacoecia podana*, *Capua reticulana*, *Carpocapsa pomonella*, *Cheimatobia brumata*, *Chilo* spp., *Choristoneura fumiferana*, *Clysia ambiguella*, *Cnaphalocerus* spp., *Earias insulana*, *Ephestia kuehniella*, *Euproctis chrysothoea*, *Euxoa* spp., *Feltia* spp., *Galleria*

- mellonella*, *Helicoverpa* spp., *Heliothis* spp., *Hofmannophila pseudospretella*, *Homona magnanima*, *Hyponomeuta padella*, *Laphygma* spp., *Lithocolletis blancardella*, *Lithophane antennata*, *Loxagrotis albicosta*, *Lymantria* spp., *Malacosoma neustria*, *Mamestra brassicae*, *Mocis repanda*, *Mythimna separata*, *Oria* spp., *Oulema oryzae*, *Panolis flammea*, *Pectinophora gossypiella*, *Phyllocnistis citrella*, *Pieris* spp., *Plutella xylostella*, *Prodenia* spp., *Pseudaletia* spp., *Pseudoplusia includens*, *Pyrausta nubilalis*, *Spodoptera* spp., *Thermesia gemmatalis*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*, *Tortrix viridana*, *Trichoplusia* spp.
- Del orden de los ortópteros, por ejemplo, *Acheta domesticus*, *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Gryllotalpa* spp., *Leucophaea maderae*, *Locusta* spp., *Melanoplus* spp., *Periplaneta americana*, *Schistocerca gregaria*.
- Del orden de los sifonápteros, por ejemplo, *Ceratophyllus* spp., *Xenopsylla cheopis*.
- 10 Del orden de los sínfilos, por ejemplo, *Scutigera* spp., *Scutigera* spp., *Scutigera* spp.
- Del orden de los tisanópteros, por ejemplo, *Baliothrips biformis*, *Enneothrips flavens*, *Frankliniella* spp., *Heliothrips* spp., *Hercinothrips femoralis*, *Kakothrips* spp., *Rhipiphorothrips cruentatus*, *Scirtothrips* spp., *Taeniothrips cardamoni*, *Thrips* spp.
- Del orden de los tisanuros, por ejemplo, *Lepisma saccharina*.
- 15 Los nematodos fitoparásitos incluyen, por ejemplo, *Anguina* spp., *Aphelenchoides* spp., *Belonoaimus* spp., *Bursaphelenchus* spp., *Ditylenchus dipsaci*, *Globodera* spp., *Helicocotylechus* spp., *Heterodera* spp., *Longidorus* spp., *Meloidogyne* spp., *Pratylenchus* spp., *Radopholus similis*, *Rotylenchus* spp., *Trichodorus* spp., *Tylenchorhynchus* spp., *Tylenchulus* spp., *Tylenchulus semipenetrans* y *Xiphinema* spp.
- 20 Los compuestos de acuerdo con la invención pueden usarse en determinadas concentraciones o cantidades de aplicación también como herbicidas, antídotos, reguladores del crecimiento o agentes para mejorar las propiedades de la planta, o como microbicidas, por ejemplo como fungicidas, antimicóticos, bactericidas, viricidas (incluidos agentes contra viroides) o como agentes contra MLO (organismos similares a micoplasma) y RLO (organismos similares a rickettsia). Pueden también usarse como productos intermedios o precursores para la síntesis de otros principios activos.
- 25 Los principios activos pueden convertirse en las formulaciones habituales tales como soluciones, emulsiones, polvos humectables, suspensiones basadas en agua o en aceite, polvos, agentes de espolvoreo, pastas, polvos solubles, gránulos solubles, gránulos dispersables, concentrados de suspensión-emulsión, sustancias naturales impregnadas con principio activo, sustancias sintéticas impregnadas con principio activo, fertilizantes así como microencapsulaciones en sustancias poliméricas.
- 30 Estas formulaciones se producen de forma conocida, por ejemplo mezclando los principios activos con diluyentes, es decir los disolventes líquidos y/o vehículos sólidos, opcionalmente con el uso de tensioactivos, es decir emulsionantes y/o dispersantes y/o agentes de formación de espuma. La preparación de las formulaciones se realiza o bien en plantas adecuadas o también antes o durante la aplicación.
- 35 Como coadyuvantes pueden usarse las sustancias que son adecuadas para conferir al agente en sí y/o a las preparaciones derivadas del mismo (por ejemplo, caldos de pulverización, recubrimientos de semillas) propiedades particulares tales como propiedades técnicas determinadas y/o también propiedades biológicas particulares. Como coadyuvantes típicos se tienen en cuenta: diluyentes, disolventes y vehículos.
- 40 Como diluyentes son adecuados, por ejemplo, agua, líquidos químicos orgánicos polares y no polares, por ejemplo de las clases de los hidrocarburos aromáticos y no aromáticos (tales como parafinas, alquilbencenos, alquilnaftalenos, clorobencenos), de los alcoholes y polioles (que opcionalmente pueden estar también sustituidos, eterificados y/o esterificados), de las cetonas (tales como acetona, ciclohexanona), ésteres (también grasas y aceites) y (poli)éteres, de las aminas, amidas, lactamas (como la N-alquilpirrolidona) y lactonas, no sustituidas o sustituidas, de las sulfonas y sulfóxidos (tales como dimetilsulfóxido).
- 45 En el caso del uso de agua como diluyente pueden usarse por ejemplo también disolventes orgánicos tales como codisolventes. Como disolventes líquidos se tienen en cuenta esencialmente: compuestos aromáticos, tales como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, compuestos aromáticos clorados y hidrocarburos alifáticos clorados, tales como clorobencenos, cloroetilenos o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos, tales como ciclohexano o parafinas, por ejemplo, fracciones de petróleo, aceites minerales y vegetales, alcoholes tales como butanol o glicol y también sus éteres y ésteres, cetonas, tales como acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona o ciclohexanona, disolventes fuertemente polares, tales como dimetilsulfóxido, y también agua.
- 50 Como vehículos sólidos se tienen en cuenta:
- por ejemplo sales de amonio y harinas de rocas naturales, tales como caolines, arcillas, talco, tiza, cuarzo, atapulgita, montmorillonita o tierra de diatomeas, y harinas de rocas sintéticas, tales como ácido silícico altamente disperso, óxido de aluminio y silicatos, como vehículos sólidos para gránulos se tienen en cuenta: por

ejemplo, piedras quebradas y fraccionadas naturales tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita y también gránulos sintéticos de harinas inorgánicas y orgánicas, así como gránulos de material orgánico como papel, serrín, cáscaras de coco, mazorcas de maíz y varas de tabaco; como emulsionantes y/o formadores de espuma se tienen en cuenta: por ejemplo, emulsionantes no ionógenos y aniónicos, tales como ésteres de ácido graso de polioxietileno, éteres de alcohol graso de polioxietileno, por ejemplo alquilaril-poliglicoléteres, sulfonatos de alquilo, sulfatos de alquilo, sulfonatos de arilo y también hidrolizados de proteína; como dispersantes se tienen en cuenta sustancias no iónicas y/o iónicas, por ejemplo de las clases de los éteres alcohólicos de POE y/o de POP, ésteres de ácidos y/o POP-POE, éteres de alquilarilo y/o POP-POE, aductos de grasas y/o POP-POE, derivados de poliol de POE y/o de POP, aductos de azúcar o sorbitán de POE y/o de POP, sulfatos, sulfonatos y fosfatos de alquilo o arilo o los correspondientes aductos de éter de PO. Además, oligómeros o polímeros, por ejemplo partiendo de monómeros vinílicos, de ácido acrílico, de EO y/o PO solos o en combinación con, por ejemplo, (poli)alcoholes o (poli)aminas. Además pueden usarse lignina y sus derivados de ácido sulfónico, celulosas modificadas o no modificadas, ácidos sulfónicos aromáticos y/o alifáticos y también sus aductos con formaldehído.

En las formulaciones se pueden usar agentes de adherencia, tales como carboximetilcelulosa, polímeros naturales y sintéticos en forma de polvos, gránulos o redes, tales como goma arábiga, poli(alcohol vinílico), poli(acetato de vinilo), así como fosfolípidos naturales tales como cefalinas y lecitinas y fosfolípidos sintéticos.

Es posible usar colorantes tales como pigmentos inorgánicos, por ejemplo óxido de hierro, óxido de titanio, azul de Prusia y tintes orgánicos, tales como tintes de alizarina, tintes azoicos y tintes de ftalocianina metálica, y oligonutrientes tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc.

Otros aditivos pueden ser perfumes, aceites minerales o vegetales opcionalmente modificados, ceras y nutrientes (también oligonutrientes) tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc.

Además pueden estar contenidos estabilizadores, tales como criostabilizadores, conservantes, antioxidantes, agentes fotoprotectores u otros agentes que mejoran la estabilidad química y/o física.

En general, las formulaciones contienen entre el 0,01 % y el 98 % en peso del principio activo, preferentemente entre el 0,5 % y el 90 %.

Los principios activos de acuerdo con la invención pueden usarse como tales o en sus formulaciones o también en mezcla con uno o más fungicidas, bactericidas, acaricidas, nematocidas, insecticidas, microbicidas, fertilizantes, atrayentes, agentes esterilizantes, agentes de sinergia, antidotos, semioquímicos y/o sustancias reguladoras del crecimiento de las plantas adecuados, con el fin de ampliar así por ejemplo el espectro de actividad, de prolongar la duración de la acción, de incrementar la velocidad de acción, de evitar la repelencia o impedir el desarrollo de resistencias. Además, dichas combinaciones pueden mejorar el crecimiento de la planta, incrementar la tolerancia a temperaturas altas o bajas, a la sequía o al contenido en sales del agua o la tierra, potenciar el rendimiento de la floración, facilitar la recolección e incrementar los rendimientos, acelerar la maduración, incrementar la calidad y/o el valor nutritivo de los productos recolectados, prolongar la capacidad de almacenamiento y/o mejorar la capacidad de procesamiento de los productos recolectados. En general, mediante la combinación de los principios activos de acuerdo con la invención y asociados de mezcla se obtienen efectos sinérgicos, lo que significa que la eficacia de la mezcla concreta es mayor que la eficacia de cada componente individual. En general, es posible usar las combinaciones, bien como aplicaciones en semillas o en premezclas, mezclas en tanque o mezclas listas para usar.

Los asociados de mezcla particularmente favorables son, por ejemplo, los siguientes:

Insecticidas / acaricidas / nematocidas:

Los principios activos identificados en el presente documento por su "nombre común" se conocen y describen, por ejemplo, en el manual de pesticidas ("The Pesticide Manual", 14ª Ed., British Crop Protection Council 2006) o pueden encontrarse en internet (por ejemplo <http://www.alanwood.net/pesticides>).

(1) Inhibidores de la acetilcolinesterasa (AChE), como por ejemplo carbamatos, por ejemplo alanicarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxicarboxim, carbarilo, carbofurano, carbosulfano, etiofencarb, fenobucarb, formetanato, furatiocarb, isoprocarb, metiocarb, metomilo, metolcarb, oxamilo, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, triazamato, trimetacarb, XMC y xililcarb; u organofosfatos, por ejemplo acefato, azametifos, azinfos-etilo, azinfos-metilo, cadusafos, cloretoxifos, clorfenvinfos, clormefos, clorpirifos, clorpirifos-metilo, coumafos, cianofos, demeton-S-metilo, diazinona, diclorvos/DDVP, dicrotofos, dimetoato, dimetilvinfos, disulfoton, EPN, etion, etoprofos, famfur, fenamifos, fenitroton, fention, fostiazato, heptenofos, imiciafos, isofenfos, salicilato de O-(metoxiaminotio-fosforilo) de isopropilo, isoxation, malation, mecarbam, metamidofos, metidation, mevinfos, monocrotofos, naled, ometoato, oxidemeton-metilo, paration, paration-metilo, fentoato, forato, fosalona, fosmet, fosfamidon, foxim, pirimifos-metilo, profenofos, propetamfos, protiofos, piraclufos, piridafention, quinalfos, sulfotep, tebupirimfos, temefos, terbufos, tetraclorvinfos, tiometon, triazofos, triclorfon y vamidotion.

(2) Antagonistas de los canales de cloro dependientes de GABA, como por ejemplo ciclodieno-organocloros, por ejemplo clordano y endosulfán; o

fenilpirazoles (fiproles), por ejemplo etiprol y fipronilo.

(3) Moduladores de los canales de sodio/bloqueadores de canales de sodio dependientes de voltaje, como por ejemplo

piretroides, por ejemplo acrinatrina, aletrina, d-cis-trans-aletrina, d-trans-aletrina, bifentrina, bioaletrina, isómero S-ciclopentenilo de bioaletrina, bioresmetrina, cicloprotrina, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, lambda-cihalotrina, gamma-cihalotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, beta-cipermetrina, teta-cipermetrina, zeta-cipermetrina, cifenotrina [(1R)-*trans*-isómeros], deltametrina, empenrina [(EZ)-(1R)-isómeros], esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flumetrina, tau-fluvalinato, halfenprox, imiprotrina, kade-trina, permetrina, fenotrina [(1R)-*trans*-isómero], praletrina, piretrinas (piretro), resmetrina, silafluofeno, teflutrina, tetrametrina [(1R)-isómeros], tralometrina y transflutrina; o DDT; o metoxiclor.

(4) Agonistas de los receptores nicotínicos de acetilcolina (nAChR), como por ejemplo neonicotinoides, por ejemplo acetamiprid, clotianidina, dinotefurano, imidacloprid, nitenpiram, tiacloprid y tiametoxam; o nicotina.

(5) Activadores alostéricos de los receptores nicotínicos de acetilcolina (nAChR), como por ejemplo espinosinas, por ejemplo espinetoram y espinosad

(6) Activadores de los canales de cloro, como por ejemplo avermectinas/milbemicinas, por ejemplo abamectina, benzoato de emamectina, lepimectina y milbemectina.

(7) Miméticos de hormonas juveniles, como por ejemplo Análogos de hormonas juveniles, por ejemplo hidropreno, kinopreno y metopreno; o fenoxicarb; o piriproxifeno.

(8) Principios activos con mecanismos de acción desconocidos o inespecíficos, como por ejemplo haluros de alquilo, por ejemplo bromuro de metilo y otros haluros de alquilo; o Cloropricina; o fluoruro de sulfuro; o borax, o tártaro emético.

(9) Bloqueadores de alimentación selectivos, por ejemplo pimetrozina; o flonicamid.

(10) Inhibidores de crecimiento de ácaros, por ejemplo clofentezina, hexitiazox y diflovidazina; o etoxazol.

(11) Alteradores microbianos de las membranas del intestino medio de insectos, por ejemplo *Bacillus thuringiensis* subespecie *israelensis*, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus thuringiensis* subespecie *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subespecie *kurstaki*, *Bacillus thuringiensis* subespecie *tenebrionis*, y proteínas de plantas BT: Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry2Ab, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb, Cry34/35Ab1.

(12) Inhibidores de la fosforilación oxidativa, agentes de rotura del ATP, como por ejemplo diafenturon; o compuestos de organoestaño, por ejemplo azociclotina, cihexatina y óxido de fenbutatina; o Propargita; o tetradifon.

(13) Desacopladores de la fosforilación oxidativa por medio de interrupción del gradiente de protones H, como por ejemplo clorfenapir, DNOC y sulfuramid.

(14) Antagonistas de los receptores nicotínicos de acetilcolina, por ejemplo bensultap, clorhidrato de cartap, tiociclam y tiosultap-sodio.

(15) Inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 0, como por ejemplo bistrifluron, clorfluazuron, diflubenzuron, flucicloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, teflubenzuron o triflumuron.

(16) Inhibidores de la biosíntesis de la quitina, de tipo 1, por ejemplo buprofezina.

(17) Agentes de alteración de la muda, dipteran, como por ejemplo ciromazina.

(18) Agonistas del receptor de ecdisona, como por ejemplo clomaenozida, halofenozida, metoxifenozida y tebufenozida.

(19) Agonistas octopaminérgicos, como por ejemplo amitraz.

(20) Inhibidores del transporte de electrones del complejo III, por ejemplo hidrametilón; o acequinocilo; o fluacripirim.

(21) Inhibidores del transporte de electrones del complejo I, por ejemplo acaricidas METI, por ejemplo fenazaquina, fenpiroximato, pirimidifeno, piridabeno, tebufenpirad y tolfenpirad; o rotenona (Derris).

(22) Bloqueadores de canales de sodio dependientes de voltaje, por ejemplo indoxacarb; o metaflumizona.

(23) Inhibidores de acetil CoA carboxilasa, por ejemplo derivados del ácido tetrónico y tetrámico, por ejemplo espirodiclofeno, espiromesifeno y espirotetramato.

(24) Inhibidores del transporte de electrones del complejo IV, como por ejemplo fosfinas, por ejemplo fosfuro de aluminio, fosfuro de calcio, fosfina y fosfuro de cinc; o cianuro.

(25) Inhibidores de transporte de electrones del complejo II, como por ejemplo cienopirafeno.

(28) Efectores del receptor de rianodina, como por ejemplo diamidas, por ejemplo clorantraniliprol y flubendiamida.

Otros principios activos con mecanismo de acción desconocido, como por ejemplo amidoflumet, azadiractina, benclotiaz, benzoximato, bifenazato, bromopropilato, quinometionato, criolita, ciantraniliprol (Cyazypyr), ciflumetofen, dicofol, diflovodazina, fluensulfona, flufenerim, flufiprol, fluopiram, flufenozida, imidacloprid, iprodiona, piridalilo, pirifluquinazom y yodometano; además productos basados en *Bacillus firmus* (I-1582, BioNeem, Votivo) así como los siguientes compuestos activos conocidos: 3-bromo-N-{2-bromo-4-cloro-6-[(1-ciclopropyletil)carbamoil]fenil}-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocido por el documento

WO2005/077934), 4-[[[(6-bromopirid-3-il)metil]](2-fluoroetil)amino]furan-2(5H)-ona (conocido por el documento WO2007/115644), 4-[[[(6-fluoropirid-3-il)metil]](2,2-difluoroetil)amino]furan-2(5H)-ona (conocido por el documento WO2007/115644), 4-[[[(2-cloro-1,3-tiazol-5-il)metil]](2-fluoroetil)amino]furan-2(5H)-ona (conocido por el documento WO2007/115644), 4-[[[(6-cloropirid-3-il)metil]](2-fluoroetil)amino]furan-2(5H)-ona (conocido por el documento WO2007/115644), 4-[[[(6-cloropirid-3-il)metil]](2,2-difluoroetil)amino]furan-2(5H)-ona (conocido por el documento WO2007/115644), 4-[[[(5,6-dicloropirid-3-il)metil]](2-fluoroetil)amino]furan-2(5H)-ona (conocido por el documento WO2007/115646), 4-[[[(6-cloro-5-fluoropirid-3-il)metil]](ciclopropil)amino]furan-2(5H)-ona (conocido por el documento WO2007/115643), 4-[[[(6-cloropirid-3-il)metil]](ciclopropil)amino]furan-2(5H)-ona (conocido por el documento EP-A-0 539 588), 4-[[[(6-cloropirid-3-il)metil]](metil)amino]furan-2(5H)-ona (conocido por el documento EP-A-0 539 588), {[1-(6-cloropiridin-3-il)etil]](metil)óxido- λ^4 -sulfaniliden]cianamida (conocido por el documento WO 2007/149134), y sus diaestereómeros {[1(R)-1-(6-cloropiridin-3-il)etil]](metil)óxido- λ^4 -sulfaniliden]cianamida (A) y {[1(S)-1-(6-cloropiridin-3-il)etil]](metil)óxido- λ^4 -sulfaniliden]cianamida (B) (asimismo conocido por el documento WO2007/149134) así como sulfoxaflo (asimismo conocido por el documento WO2007/149134), y sus diaestereómeros [(R)-metil(óxido){(1R)-1-[6-(trifluorometil)piridin-3-il]etil]- λ^4 -sulfaniliden]cianamida (A1) y [(S)-metil(óxido){(1S)-1-[6-(trifluorometil)piridin-3-il]etil]- λ^4 -sulfaniliden]cianamida (A2), designado como grupo A de diaestereómeros (conocido por los documentos WO2010/074747, WO2010/074751), [(R)-metil(óxido){(1S)-1-[6-(trifluorometil)piridin-3-il]etil]- λ^4 -sulfaniliden]cianamida (B1) y [(S)-metil(óxido){(1R)-1-[6-(trifluorometil)piridin-3-il]etil]- λ^4 -sulfaniliden]cianamida (B2), designado como grupo B de diaestereómeros (asimismo conocido por los documentos WO 2010/074747, WO 2010/074751) y 11-(4-cloro-2,6-dimetilfenil)-12-hidroxi-1,4-dioxa-9-azadiespiro[4.2.4]tetradec-11-en-10-ona (conocido por el documento WO2006/089633), 3-(4'-fluoro-2,4-dimetilbifenil-3-il)-4-hidroxi-8-oxa-1-azaespiro[4.5]dec-3-en-2-ona (conocido por el documento WO2008/067911), 1-[2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]fenil]-3-(trifluorometil)-1H-1,2,4-triazol-5-amina (conocido por el documento WO2006/043635), ciclopropancarboxilato de [(3S,4aR,12R,12aS,12bS)-3-[(ciclopropilcarbonil)oxi]-6,12-dihidroxi-4,12b-dimetil-11-oxo-9-(piridin-3-il)-1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-decahidro-2H,11H-benzo[f]pirano[4,3-b]cromen-4-il]metilo (conocido por el documento WO2008/066153), 2-ciano-3-(difluorometoxi)-N,N-dimetilbencenosulfonamida (conocido por el documento WO2006/056433), 2-ciano-3-(difluorometoxi)-N-metilbencenosulfonamida (conocido por el documento WO2006/100288), 2-ciano-3-(difluorometoxi)-N-etilbencenosulfonamida (conocido por el documento WO2005/035486), 4-(difluorometoxi)-N-etil-N-metil-1,2-benzotiazol-3-amino-1,1-dióxido (conocido por el documento WO2007/057407), N-[1-(2,3-dimetilfenil)-2-(3,5-dimetilfenil)etil]-4,5-dihidro-1,3-tiazol-2-amina (conocido por el documento WO2008/104503), {1'-[(2E)-3-(4-clorofenil)prop-2-en-1-il]-5-fluoro-espiro[indol-3,4'-piperidin]-1(2H)-il]}(2-cloropiridin-4-il)metanona (conocido por el documento WO2003/106457), 3-(2,5-dimetilfenil)-4-hidroxi-8-metoxi-1,8-diazaespiro[4.5]dec-3-en-2-ona (conocido por el documento WO2009/049851), carbonato de 3-(2,5-dimetilfenil)-8-metoxi-2-oxo-1,8-diazaespiro[4.5]dec-3-en-4-il-etilo (conocido por el documento WO2009/049851), 4-(but-2-in-1-iloxi)-6-(3,5-dimetilpiperidin-1-il)-5-fluoropirimidina (conocido por el documento WO2004/099160), (2,2,3,3,4,4,5,5-octafluoropentil)(3,3,3-trifluoropropil)malononitrilo (conocido por el documento WO2005/063094), (2,2,3,3,4,4,5,5-octafluoropentil)(3,3,4,4,4-pentafluorobutil)malononitrilo (conocido por el documento WO2005/063094), 8-[2-(ciclopropilmetoxi)-4-(trifluorometil)fenoxi]-3-[6-(trifluorometil)piridazin-3-il]-3-azabicyclo[3.2.1]octano (conocido por el documento WO2007/040280), carbonato de 2-etil-7-metoxi-3-metil-6-[(2,2,3,3-tetrafluoro-2,3-dihidro-1,4-benzodioxin-6-il)oxi]-quinolin-4-ilmetilo (conocido por el documento JP2008/110953), acetato de 2-etil-7-metoxi-3-metil-6-[(2,2,3,3-tetrafluoro-2,3-dihidro-1,4-benzodioxin-6-il)oxi]quinolin-4-ilo (conocido por el documento JP2008/110953), PF1364 (nº de reg. CAS. 1204776-60-2) (conocido por el documento JP2010/018586), 5-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-benzonitrilo (conocido por el documento WO2007/075459), 5-[5-(2-cloropiridin-4-il)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)benzonitrilo (conocido por el documento WO2007/075459), 4-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-2-metil-N-{2-oxo-2-[[2,2,2-trifluoroetil]amino]etil}-benzamida (conocido por el documento WO2005/085216), 4-[[[(6-cloropiridin-3-il)metil]](ciclopropil)amino]-1,3-oxazol-2(5H)-ona, 4-[[[(6-cloropiridin-3-il)metil]](2,2-difluoroetil)amino]-1,3-oxazol-2(5H)-ona, 4-[[[(6-cloropiridin-3-il)metil]](etil)amino]-1,3-oxazol-2(5H)-ona, 4-[[[(6-cloropiridin-3-il)metil]](metil)amino]-1,3-oxazol-2(5H)-ona (todos conocidos por el documento WO2010/005692), NNI-0711 (conocido por el documento WO2002096882), 1-acetil-N-[4-(1,1,1,3,3,3-hexafluoro-2-metoxipropan-2-il)-3-isobutilfenil]-N-isobutil-3,5-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida (conocido por el documento WO2002096882), 2-[2-({[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil}amino)-5-cloro-3-metilbenzoil]-2-metilhidrazinacarboxilato de metilo (conocido por el documento WO2005/085216), 2-[2-({[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil}amino)-5-ciano-3-metilbenzoil]-2-etilhidrazina-carboxilato de metilo (conocido por el documento WO2005/085216), 2-[2-({[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil}amino)-5-ciano-3-metilbenzoil]-2-metilhidrazinacarboxilato de metilo (conocido por el documento WO2005/085216), 2-[3,5-dibromo-2-({[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil}amino)benzoil]-1,2-dietilhidrazinacarboxilato de metilo (conocido por el documento WO2005/085216), 2-[3,5-dibromo-2-({[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil}amino)benzoil]-2-etilhidrazinacarboxilato de metilo (conocido por el documento WO2005/085216), (5RS,7RS;5RS,7SR)-1-(6-cloro-3-piridilmetil)-1,2,3,5,6,7-hexahidro-7-metil-8-nitro-5-propoximidazo[1,2-a]piridina (conocido por el documento WO2007/101369), 2-[6-[2-(5-fluoropiridin-3-il)-1,3-tiazol-5-il]piridin-2-il]pirimidina (conocido por el documento WO2010/006713), 2-[6-[2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-il]piridin-2-il]pirimidina (conocido por el documento WO2010/006713), 1-(3-cloropiridin-2-il)-N-[4-ciano-2-metil-6-(metilcarbamoil)fenil]-3-[[5-(trifluorometil)-1H-tetrazol-1-il]metil]-1H-pirazol-5-carboxamida (conocido por el documento WO2010/069502), 1-(3-cloropiridin-2-il)-N-[4-ciano-2-metil-6-(metilcarbamoil)fenil]-3-[[5-

(trifluorometil)-2H-tetrazol-2-il]metil]-1H-pirazol-5-carboxamida (conocido por el documento WO2010/069502), N-[2-(terc-butilcarbamoil)-4-ciano-6-metilfenil]-1-(3-cloropiridin-2-il)-3-[[5-(trifluorometil)-1H-tetrazol-1-il]metil]-1H-pirazol-5-carboxamida (conocido por el documento WO2010/069502) y N-[2-(terc-butilcarbamoil)-4-ciano-6-metilfenil]-1-(3-cloropiridin-2-il)-3-[[5-(trifluorometil)-2H-tetrazol-2-il]metil]-1H-pirazol-5-carboxamida (conocido por el documento WO2010/069502).

- 5
- En una forma de realización preferente de la invención, un agente que favorece la penetración se añade adicionalmente a los agentes fitosanitarios para potenciar la acción. Como agentes que favorecen la penetración se tienen en consideración también por ejemplo sustancias que estimulan la disponibilidad de los compuestos de fórmula (I) en el recubrimiento por pulverización. Estos incluyen, por ejemplo, aceites minerales y vegetales. Como aceites se tienen en cuenta todos los aceites minerales y vegetales, eventualmente modificados, que normalmente se pueden usar en agentes agroquímicos. A modo de ejemplo se mencionan aceite de girasol, aceite de colza, aceite de oliva, aceite de ricino, aceite de colza, aceite de maíz, aceite de algodón y aceite de soja, o los éteres de los aceites mencionados. Se da preferencia al aceite de colza, aceite de girasol y sus ésteres de metilo o etilo, especialmente el éster metílico del aceite de colza.
- 10
- 15 La concentración del agente que favorece la penetración en los agentes de acuerdo con la invención puede variarse dentro de un intervalo amplio. En el caso de un agente fitosanitario formulado, ésta se encuentra en general en del 1 % al 95 % en peso, preferentemente en del 1 % al 55 % en peso, de manera especialmente preferente en del 15-40 % en peso. En los agentes listos para usar (caldos de pulverización), las concentraciones están, en general, entre 0,1 y 10 g/l, preferentemente entre 0,5 y 5 g/l.
- 20
- 25 Cuando se usan como insecticidas, los principios activos de acuerdo con la invención pueden también estar presentes en sus formulaciones disponibles comercialmente y en sus formas de uso preparadas a partir de estas formulaciones, en forma de una mezcla con agentes sinérgicos. Los agentes sinérgicos son compuestos que aumentan la acción de los principios activos, sin que el propio agente sinérgico añadido deba ser eficaz de manera activa.
- 30
- 35 Cuando se usan como insecticidas, los principios activos de acuerdo con la invención pueden también estar presentes en sus formulaciones disponibles comercialmente y en las formas de uso preparadas a partir de estas formulaciones, en forma de mezclas con inhibidores que reducen la degradación del principio activo después del uso en el entorno de la planta, sobre la superficie de partes de plantas o en tejidos vegetales.
- El contenido del principio activo de las formas de uso preparadas a partir de las formulaciones disponibles comercialmente puede variar dentro de márgenes muy amplios. La concentración del principio activo de las formas de aplicación puede ser del 0,0000001 % al 95 % en peso del principio activo, preferentemente entre el 0,00001 % y el 1 % en peso.
- La aplicación se realiza de una forma habitual apropiada para las formas de uso.
- La buena compatibilidad con las plantas de los principios activos en las concentraciones necesarias para el control de enfermedades de las plantas permite un tratamiento de las partes de las plantas situadas encima del suelo, del material de la planta y de las semillas y del suelo.
- 40
- El tratamiento de acuerdo con la invención de las plantas y partes de plantas con los principios activos se realiza directamente o mediante acción sobre su entorno, hábitat o espacio de almacenamiento mediante los procedimientos de tratamiento habituales, por ejemplo, mediante inmersión, pulverización, evaporación, nebulización, dispersión, embadurnado, inyección y en el caso de material de reproducción, especialmente en el caso de semillas, también mediante envolturas de una o más capas.
- 45
- Todas las plantas y partes de plantas pueden tratarse de acuerdo con la invención. Se entiende que plantas significa, en el presente documento, todas las plantas y poblaciones de plantas como plantas salvajes deseadas y no deseadas o plantas de cultivo, (incluidas las plantas de cultivo existentes en la naturaleza). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que se pueden obtener mediante procedimientos de cultivo y optimización convencionales o mediante procedimientos biotecnológicos y de ingeniería genética o combinaciones de estos procedimientos, incluidas las plantas transgénicas e incluidas las variedades de plantas que pueden estar protegidas o pueden no estar protegidas por los derechos de los cultivadores de plantas. Se entenderá que partes de las plantas significa todas las partes y órganos de las plantas por encima y debajo de la tierra, tales como brotes, hojas, flores y raíces, incluidos como ejemplos las hojas, espinas, tallos, troncos, flores, cuerpos frutales, frutas y semillas y también raíces, tubérculos y rizomas. Las partes de las plantas también incluyen el material recolectado y el material de propagación vegetativa y por generación, por ejemplo plantones, tubérculos, rizomas, esquejes y semillas.
- 50
- 55 Como plantas que se pueden tratar de acuerdo con la invención se mencionan las siguientes: algodón, lino, vides, fruta, verduras, tales como *Rosaceae* sp. (por ejemplo frutos pomáceos, tal como manzanas y peras, pero también frutos de hueso, tal como albaricoques, cerezas, almendras y melocotones y frutos rojos como las fresas), *Ribesioideae* sp., *Juglandaceae* sp., *Betulaceae* sp., *Anacardiaceae* sp., *Fagaceae* sp., *Moraceae* sp., *Oleaceae* sp., *Actinidaceae* sp., *Lauraceae* sp., *Musaceae* sp. (por ejemplo árboles y plantaciones de plátanos), *Rubiaceae* sp. (por ejemplo café), *Theaceae* sp., *Sterculiaceae* sp., *Rutaceae* sp. (por ejemplo limones, naranjas y pomelo); *Solanaceae* sp. (por ejemplo

tomates), *Liliaceae* sp., *Asteraceae* sp. (por ejemplo lechuga), *Umbelliferae* sp., *Cruciferae* sp., *Chenopodiaceae* sp., *Cucurbitaceae* sp. (por ejemplo pepino), *Alliaceae* sp. (por ejemplo puerro, cebollas), *Papilionaceae* sp. (por ejemplo guisantes); plantas de cultivo de gran importancia, tales como *Gramineae* sp. (por ejemplo maíz, gramas, cereales tales como trigo, centeno, arroz, cebada, avena, mijo y triticale), *Poaceae* sp. (por ejemplo caña de azúcar), *Asteraceae* sp. (por ejemplo girasol), *Brassicaceae* sp. (por ejemplo, repollo, col lombarda, brócoli, coliflor, coles de Bruselas, pak choi, colirábano, rábanos, así como colza, mostaza, rábano picante y berro), *Fabaceae* sp. (por ejemplo alubias, cacahuetes), *Papilionaceae* sp. (por ejemplo soja), *Solanaceae* sp. (por ejemplo patatas), *Chenopodiaceae* sp. (por ejemplo remolacha azucarera, remolacha forrajera, acelga suiza, remolacha roja); plantas útiles y plantas ornamentales en jardines y bosques; y también especies genéticamente modificadas de cada una de estas plantas.

Como ya se ha mencionado en lo que antecede, es posible tratar todas las plantas y sus partes de acuerdo con la invención. En una forma de realización preferente se tratan especies de plantas salvajes y cultivos de plantas, o las obtenidas mediante procedimientos de cultivo biológico convencionales, tales como cruzamiento o fusión de protoplastos, y también sus partes. En otra forma de realización preferente se tratan plantas transgénicas y cultivos de plantas obtenidos mediante ingeniería genética, si es adecuado en combinación con procedimientos convencionales (Genetically Modified Organisms), y sus partes. El término "partes" o "partes de plantas" o "partes de la planta" se ha explicado anteriormente. De manera especialmente preferente, las plantas de las variedades de cultivos de plantas que están disponibles comercialmente en cada caso o se encuentran en uso se tratan de acuerdo con la invención. Por variedades de plantas se entiende plantas que tienen características novedosas ("rasgos") y que se han obtenido mediante cultivo convencional, mediante mutagénesis o mediante técnicas de ADN recombinante. Pueden ser variedades, razas, biotipos o genotipos de plantas.

El procedimiento de tratamiento de acuerdo con la invención puede usarse para tratar organismos modificados genéticamente (GMO), por ejemplo plantas o semillas. Las plantas genéticamente modificadas (o plantas transgénicas) son plantas en las que se ha integrado un gen heterólogo en el genoma de manera estable. La expresión "gen heterólogo" significa un gen que se ha proporcionado o ensamblado fuera de la planta y que, cuando se introduce en el genoma nuclear, el genoma de los cloroplastos o el genoma mitocondrial, confiere a la planta transformada propiedades agronómicas nuevas o mejoradas u otras propiedades, de manera que se expresa una proteína o un polipéptido de interés o de manera que se reduce o se anula otro gen presente en la planta o bien otros genes que se encuentran en la planta (usando, por ejemplo, tecnología antisentido, tecnología de co-supresión o tecnología de ARN de interferencia (ARNi)). Un gen heterólogo que se localiza en el genoma se denomina también transgén. Un transgén, que se define por su presencia específica en el genoma de las plantas, se denomina un evento de transformación o transgénico.

Dependiendo de las especies de plantas o de las variedades cultivadas, de su localización y condiciones de crecimiento (suelos, clima, periodo vegetativo, nutrición), el tratamiento de acuerdo con la invención puede provocar también efectos superaditivos ("sinérgicos"). Por ejemplo, así son posibles los efectos siguientes, los cuales exceden los efectos que realmente se esperarían: reducción de las cantidades de aplicación y/o ampliación del espectro de acción y/o incremento de la actividad de los principios activos y de las composiciones que pueden usarse según la invención, crecimiento mejorado de las plantas, tolerancia incrementada frente a altas o bajas temperaturas, mayor tolerancia frente a la sequedad o al contenido de agua o sal del suelo, mayor rendimiento de floración, facilidad de recolección, maduración acelerada, mayores rendimientos de cosecha, frutos más grandes, mayor altura de la planta, hojas de un verde más intenso, adelanto de la floración, mayor calidad y/o mayor valor nutricional de los productos recolectados, mayor concentración de azúcar en los frutos, estabilidad de almacenamiento y/o procesamiento de los productos recolectados más favorables.

En ciertas cantidades de aplicación, los principios activos según la invención también pueden tener un efecto fortalecedor en plantas. En consecuencia, también son adecuados para movilizar el sistema de defensa de la planta frente al ataque de hongos y/o microorganismos y/o virus fitopatógenos no deseados. Esto puede ser eventualmente una de las razones de la actividad mejorada de las combinaciones según la invención, por ejemplo contra hongos. Las sustancias de fortalecimiento (inductoras de resistencia) de plantas se entenderá como que significan, en el presente contexto, también aquellas sustancias o combinaciones de sustancias que son capaces de estimular el sistema de defensa de las plantas en una forma tal que, cuando se inoculan después con hongos fitopatógenos no deseados, las plantas tratadas muestran un grado sustancial de resistencia a estos hongos fitopatógenos no deseados. Por tanto, las sustancias según la invención pueden usarse para proteger plantas contra el ataque de los patógenos anteriormente mencionados dentro de un determinado periodo de tiempo después del tratamiento. El periodo de tiempo dentro del cual es eficaz la protección se extiende generalmente de 1 a 10 días, preferentemente de 1 a 7 días, después del tratamiento de las plantas con los principios activos.

Las plantas y variedades de plantas que se tratan, preferentemente, de acuerdo con la invención incluyen todas las plantas que tienen material genético que imparte a estas plantas características útiles particularmente ventajosas (con independencia de si se consiguió mediante cultivo y/o biotecnología).

Las plantas y variedades de plantas que se tratan también de modo preferente de acuerdo con la invención son resistentes contra uno o varios factores de estrés biótico, es decir, estas plantas presentan una defensa mejorada contra parásitos microbianos o animales, tales como nematodos, insectos, ácaros, hongos fitopatógenos, bacterias, virus y/o viroides.

Las plantas y variedades de plantas que pueden tratarse también de acuerdo con la invención son las plantas que son resistentes a uno o varios factores de estrés abiótico. Las condiciones de estrés abiótico pueden incluir, por ejemplo, sequías, condiciones de frío y calor, estrés osmótico, inundación, aumento de la salinidad del suelo, exposición aumentada a minerales, condiciones de ozono, condiciones de luz intensa, disponibilidad limitada de nutrientes nitrogenados, disponibilidad limitada de nutrientes de fósforo o elusión de la sombra.

Las plantas y variedades de plantas que también pueden tratarse de acuerdo con la invención son las plantas que se caracterizan por un aumento de las características de rendimiento de cosecha. El rendimiento incrementado en dichas plantas puede ser el resultado de, por ejemplo, fisiología, crecimiento y desarrollo de plantas incrementados, tal como eficiencia del uso del agua, eficiencia de la retención del agua, uso de nitrógeno incrementado, asimilación de carbono incrementada, fotosíntesis incrementada, eficiencia de germinación incrementada y maduración acelerada. El rendimiento puede además verse afectado por una arquitectura de la planta mejorada (bajo condiciones de estrés o de no estrés), incluyendo floración temprana, controles de la floración para la producción de semillas híbridas, fortaleza de la plántula, tamaño de la planta, número y separación de los internodios, crecimiento de las raíces, tamaño de las semillas, tamaño de los frutos, tamaño de las vainas, número de vainas o espigas, número de semillas por vaina o espiga, peso de las semillas, relleno aumentado de las semillas, reducción de la dispersión de semillas, reducción de roturas de las vainas, así como resistencia al encamado. Otros rasgos adicionales de rendimiento incluyen la composición de las semillas, tales como el contenido en carbohidratos, el contenido en proteínas, el contenido y la composición del aceite, valor nutricional, disminución de compuestos antinutricionales, procesabilidad mejorada y mejor estabilidad de almacenamiento. Las plantas que se pueden tratar de acuerdo con la invención son plantas híbridas, que ya expresan las características de la heterosis o el efecto del híbrido, lo que en general conduce a un incremento de rendimiento, fortaleza, salud y resistencia contra factores de estrés biótico y abiótico. Tales plantas se producen típicamente cruzando una línea parental endogámica estéril masculina (progenitor femenino) con otra línea parental endogámica fértil masculina (progenitor masculino). Normalmente, la semilla híbrida se cosecha de las plantas masculinas estériles y se vende a los cultivadores. Las plantas estériles masculinas pueden producirse ocasionalmente (por ejemplo, en el caso del maíz) mediante despenechado (es decir, eliminación mecánica de los órganos reproductores o de las flores masculinas); no obstante es más típico que la esterilidad masculina sea el resultado de determinantes genéticos en el genoma de las plantas. En este caso, especialmente cuando en el caso del producto deseado, dado que se cosechará a partir de las plantas híbridas, se trate de las semillas es beneficioso, típicamente, asegurar que se restaura por completo la fertilidad masculina en las plantas híbridas, las cuales contienen determinantes genéticos responsables de la esterilidad masculina. Esto puede conseguirse asegurándose de que los progenitores masculinos posean los genes de restauración de la fertilidad apropiados que pueden restaurar la fertilidad masculina en plantas híbridas que contienen los determinantes genéticos responsables de la esterilidad masculina. En el citoplasma pueden localizarse determinantes genéticos de esterilidad masculina. Ejemplos de esterilidad masculina citoplásmica (CMS) se han descrito por ejemplo para especies de Brassica. Sin embargo, también pueden localizarse determinantes genéticos de esterilidad masculina en el genoma nuclear. También se pueden obtener plantas estériles masculinas con procedimientos de biotecnología vegetal, tales como ingeniería genética. En el documento WO 89/10396 se describe un modo particularmente útil de obtención de plantas estériles masculinas, en el que, por ejemplo, se expresa selectivamente una ribonucleasa como una barnasa en las células del tapete en los estambres. La fertilidad puede restaurarse entonces por expresión en las células del tapete de un inhibidor de ribonucleasa tal como Barstar.

Las plantas o las variedades de cultivos de plantas (obtenidas por procedimientos de biotecnología de plantas tales como ingeniería genética) que se pueden tratar de acuerdo con la invención son plantas tolerantes a herbicidas, es decir plantas hechas tolerantes a uno o más herbicidas dados. Tales plantas pueden obtenerse bien mediante transformación genética o mediante selección de plantas que contengan una mutación que confiera tal tolerancia a herbicidas.

Las plantas tolerantes a herbicidas son, por ejemplo, plantas tolerantes a glifosato, es decir plantas que se han convertido en tolerantes al herbicida glifosato o sales del mismo. Por ejemplo, las plantas tolerantes a glifosato pueden obtenerse así mediante la transformación de la planta con un gen que codifica la enzima 5-enolpiruvilshikimato-3-fosfato sintasa (EPSPS). Ejemplos de tales genes EPSPS son el gen *aroA* (mutante CT7) de la bacteria *Salmonella typhimurium*, el gen CP4 de la bacteria *Agrobacterium* sp., los genes que codifican una EPSPS de la petunia, una EPSPS del tomate o una EPSPS de la eleusina. También puede ser una EPSPS mutada. Las plantas tolerantes a glifosato también pueden obtenerse expresando un gen que codifica una enzima glifosato óxidoreductasa. Las plantas tolerantes a glifosato también pueden obtenerse expresando un gen que codifica una enzima glifosato acetiltransferasa. Las plantas tolerantes a glifosato pueden también obtenerse seleccionando plantas que contienen mutaciones naturales de los genes mencionados anteriormente.

Otras plantas resistentes a herbicidas son por ejemplo plantas, que se han hecho tolerantes a herbicidas que inhiben la enzima glutaminsintasa, tales como bialafos, fosfotricina o glufosinato. Tales plantas pueden obtenerse expresando una enzima que desintoxique el herbicida o una enzima glutamina sintasa mutante que es resistente a la inhibición. Tal enzima desintoxicante eficaz es, por ejemplo, una enzima que codifica la fosfotricina acetiltransferasa (tal como la proteína pat o la proteína bar de especies de *Streptomyces*). Se han descrito plantas que expresan una fosfotricina acetiltransferasa exógena.

Plantas tolerantes a herbicidas adicionales son también las plantas que se han hecho tolerantes a herbicidas que inhiben la enzima hidroxifenilpiruvato dioxigenasa (HPPD). Las hidroxifenilpiruvato dioxigenasas son enzimas que catalizan la reacción en la que el para-hidroxifenilpiruvato (HPP) se convierte en homogentisato. Se pueden transformar plantas

5 tolerantes a inhibidores de HPPD con un gen que codifique una enzima HPPD resistente de origen natural o un gen que codifique una enzima HPPD mutada. También puede obtenerse tolerancia frente a inhibidores de HPPD transformando plantas con genes que codifican ciertas enzimas que posibilitan la formación de homogentisato a pesar de la inhibición de la enzima nativa de HPPD por medio del inhibidor HPPD. La tolerancia de plantas a los inhibidores de HPPD también puede mejorarse mediante la transformación de plantas que adicionalmente a un gen que codifica una enzima tolerante al HPPD, tienen un gen que codifica una enzima prefenato deshidrogenasa.

10 Plantas resistentes a herbicidas adicionales son plantas que se han hecho tolerantes a los inhibidores de la acetolactato sintasa (ALS). Los inhibidores de la ALS conocidos incluyen, por ejemplo, sulfonilurea, imidazolinona, triazolopirimidina, pirimidiniloxi(tio)benzoato y/o herbicidas de sulfonilaminocarbonil-triazolinona. Se sabe que diferentes mutaciones en la enzima ALS (también conocida como acetohidroxiácido sintasa, AHAS) confieren tolerancia a diversos herbicidas o grupos de herbicidas. En la publicación internacional WO 1996/033270 se ha descrito la producción de plantas tolerantes a la sulfonilurea y de plantas tolerantes a la imidazolinona. También se han descrito otras plantas tolerantes a la sulfonilurea y a la imidazolinona, por ejemplo en el documento WO 2007/024782.

15 Pueden obtenerse otras plantas tolerantes a imidazolinona y/o sulfonilurea mediante mutagénesis inducida, mediante selección en cultivos celulares en presencia del herbicida o mediante cultivo de mutación.

20 Las plantas o las variedades de cultivos de plantas (obtenidas por procedimientos de biotecnología de plantas tales como ingeniería genética) que pueden tratarse también de acuerdo con la invención son plantas transgénicas resistentes a insectos, es decir plantas hechas resistentes al ataque por ciertos insectos objetivo. Tales plantas pueden obtenerse mediante transformación genética o mediante selección de plantas que contienen una mutación que confiere tal resistencia a insectos.

En el presente contexto, el término “planta transgénica resistente a insectos” incluye cualquier planta que contiene al menos un transgén que comprende una secuencia codificante que codifique lo siguiente:

1) una proteína cristalina insecticida de *Bacillus thuringiensis* o una porción insecticida de la misma, tal como las proteínas cristalinas insecticidas que se enumeran en Internet en el sitio:

25 http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/, o porciones insecticidas de las mismas, por ejemplo proteínas de las clases de proteínas Cry Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry2Ab, Cry3Ae o bien Cry3Bb o porciones insecticidas de las mismas; o

30 2) una proteína cristalina de *Bacillus thuringiensis* o una porción de la misma que tiene actividad insecticida en presencia de una segunda proteína cristalina diferente de *Bacillus thuringiensis* o una porción de la misma, tal como la toxina binaria, que consta de las proteínas cristalinas Cy34 y Cy35; o

3) una proteína híbrida insecticida que comprende partes de dos proteínas cristalinas insecticidas diferentes de *Bacillus thuringiensis*, tal como por ejemplo un híbrido de las proteínas de 1) anterior o un híbrido de las proteínas de 2) anterior, por ejemplo la proteína Cry1A.105, producida del evento del maíz MON98034 (documento WO 2007/027777); o

35 4) una proteína de cualquiera de los puntos 1) a 3) anteriores, en la que algunos aminoácidos, en particular de 1 a 10, han sido reemplazados por otro aminoácido, para obtener una mayor actividad insecticida frente a una especie de insectos diana y/o para ampliar el espectro de especies de insectos diana afectadas y/o debido a las modificaciones inducidas en el ADN codificante durante la clonación o la transformación, tales como la proteína Cry3Bb1 en los eventos del maíz MON863 o MON88017 o la proteína Cry3A en el evento del maíz MIR 604;

40 5) una proteína insecticida secretada de *Bacillus thuringiensis* o *Bacillus cereus*, o una porción insecticida de la misma, tal como las proteínas insecticidas de acción vegetativa (proteínas insecticidas vegetativas, VIP), que se enumeran en: http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/vip.html, por ejemplo proteínas de la clase de proteínas VIP3Aa; o

45 6) una proteína segregada por el *Bacillus thuringiensis* o el *Bacillus cereus*, que en presencia de una segunda proteína segregada por el *Bacillus thuringiensis* o el *B. cereus* tiene actividad insecticida, como la toxina binaria compuesta por las proteínas VIP1A y VIP2A;

7) una proteína híbrida insecticida, que comprende partes de diferentes proteínas segregadas por el *Bacillus thuringiensis* o el *Bacillus cereus*, tales como un híbrido de la proteína de 1) o un híbrido de la proteína de 2) anterior; o

50 8) una proteína de una cualquiera de los puntos 1) a 3) anteriores, en la que algunos aminoácidos, en particular de 1 a 10, han sido reemplazados por otro aminoácido, para obtener una mayor actividad insecticida frente a una especie de insectos diana y/o para ampliar el espectro de correspondientes especies de insectos diana y/o debido a las modificaciones inducidas en el ADN codificante durante la clonación o la transformación (mientras todavía codifica una proteína insecticida), como la proteína VIP3Aa en el evento del algodón COT102.

Por supuesto, las plantas transgénicas resistentes a insectos, en el presente contexto, también incluyen cualquier planta que comprenda una combinación de genes que codifican las proteínas de algunas de las clases mencionadas anteriormente 1 a 8. En una forma de realización, una planta resistente a insectos contiene más de un gen transgénico que codifica una proteína de acuerdo con cualquiera de las clases mencionadas anteriormente de 1 a 8, para ampliar el espectro de correspondientes especies de insectos diana o para retrasar el desarrollo de una resistencia de los insectos frente a las plantas, usando diversas proteínas insecticidas para las mismas especies de insectos diana, que presentan sin embargo un modo de acción diferente, tal como la unión en diferentes sitios de unión del receptor en el insecto.

Las plantas o las variedades de cultivo de plantas (obtenidas por procedimientos de biotecnología de plantas tales como ingeniería genética) que se pueden tratar también de acuerdo con la invención son tolerantes a factores de estrés abiótico. Tales plantas pueden obtenerse bien mediante transformación genética o mediante selección de plantas que contienen una mutación que confiere tal resistencia al estrés. Plantas particularmente útiles con tolerancia al estrés incluyen las siguientes:

a. plantas que contienen un gen transgénico capaz de disminuir la expresión y/o la actividad del gen de la poli(ADP-ribosa) polimerasa (PARP) en las células vegetales o en las plantas.

b. plantas que contienen un gen transgénico que mejora la tolerancia al estrés, capaz de reducir la expresión y/o la actividad de genes de plantas o de células vegetales que codifican PARP;

c. plantas que contienen un gen transgénico que mejora la tolerancia al estrés que codifica una enzima funcional de plantas de la ruta de biosíntesis de salvamento de nicotinamida adenina dinucleótido, que incluye nicotinamidasas, nicotinato fosforribosil transferasa, ácido nicotínico mononucleótido adeniltransferasa, nicotinamida adenina dinucleótido sintetasa o nicotinamida fosforribosil transferasa.

Plantas o las variedades de cultivo de plantas (que se han obtenido por procedimientos de biotecnología vegetal, como la ingeniería genética), que también se pueden tratar de acuerdo con la invención, presentan una cantidad, calidad y/o capacidad de almacenamiento del producto cosechado alterada y/o propiedades alteradas de determinadas partes constituyentes del producto cosechado, tales como por ejemplo:

1) plantas transgénicas, que sintetizan un almidón modificado, que está alterado con respecto a sus rasgos fisicoquímicos, en particular el contenido en amilosa o la relación amilosa/amilopectina, el grado de ramificación, la longitud media de las cadenas, la distribución de las cadenas laterales, el comportamiento de la viscosidad, la resistencia del gel, el tamaño de grano de almidón y/o la morfología de grano de almidón, en comparación con el almidón sintetizado en células de plantas o en plantas de tipo silvestre, de tal manera que este almidón modificado sea más adecuado para aplicaciones determinadas.

2) Plantas transgénicas que sintetizan polímeros de hidratos de carbono distintos al almidón o polímeros de hidratos de carbono distintos al almidón con propiedades alteradas en comparación con plantas de tipo silvestre sin modificación genética. Ejemplos son plantas que producen polifruktosa, en particular de los tipos inulina y levano, plantas que producen alfa-1,4-glucano, plantas que producen alfa-1,4-glucano ramificado en alfa-1,6 y plantas que producen alternano.

3) Plantas transgénicas que producen hialuronano.

Las plantas o las variedades de cultivo de plantas (obtenidas por procedimientos de biotecnología vegetal, tales como la ingeniería genética), que se pueden tratar también de acuerdo con la invención, son plantas, tales como plantas de algodón, con características de fibra alteradas. Tales plantas pueden obtenerse mediante transformación genética o mediante selección de plantas que contengan una mutación que confiera tales características de fibra alteradas; a esto pertenecen:

a) plantas, tales como plantas de algodón, que contienen una forma alterada de genes de celulosasintasa,

b) plantas, tales como plantas de algodón, que contienen una forma alterada de los ácidos nucleicos homólogos rsw2 o rsw3;

c) plantas, tales como plantas de algodón, con una expresión incrementada de sacarosa fosfosintasa;

d) plantas, tales como plantas de algodón, con una expresión incrementada de sacarosa sintasa;

e) Plantas, tales como plantas de algodón, en las que el momento de control de paso de plasmodesmos en base a la célula de fibra está alterado, por ejemplo mediante regulación por disminución de β -1,3-glucanasa selectiva de fibras;

f) plantas, tales como plantas de algodón, que poseen fibras con reactividad alterada, por ejemplo mediante la expresión del gen de la N-acetilglucosamina transferasa, que incluye también genes de la quitina sintasa y nodC.

Las plantas o las variedades de cultivo de plantas (obtenidas por procedimientos de biotecnología vegetal, tales como la ingeniería genética), que se pueden tratar también de acuerdo con la invención, son plantas, tales como colza o plantas de

Brassica relacionadas, con características modificadas de la composición de aceite. Tales plantas pueden obtenerse mediante transformación genética o mediante selección de plantas que contengan una mutación que confiera tales características de aceite alteradas; a esto pertenecen:

- a) plantas, tales como plantas de colza, que producen aceite con un alto contenido en ácido oleico;
- 5 b) plantas, tales como plantas de colza, que producen aceite con un bajo contenido en ácido linolénico;
- c) plantas, tales como plantas de colza, que producen aceite con un bajo contenido de ácidos grasos saturados.

Plantas transgénicas particularmente útiles que pueden tratarse de acuerdo con la invención son plantas que comprenden uno o más genes que codifican una o más toxinas; son las siguientes plantas transgénicas que se comercializan con los nombres comerciales siguientes: YIELD GARD® (por ejemplo, maíz, algodón, soja), KnockOut® (por ejemplo, maíz), BiteGard® (por ejemplo, maíz), BT-Xtra® (por ejemplo, maíz), StarLink® (por ejemplo, maíz), Bollgard® (algodón), NucoIn® (algodón), NucoIn 33B® (algodón), NatureGard® (por ejemplo, maíz), Protecta® y NewLeaf® (patata). Ejemplos de plantas tolerantes a herbicida que pueden mencionarse son variedades de maíz, variedades de algodón y variedades de soja que están disponibles con los nombres comerciales siguientes: Roundup Ready® (tolerancia a glifosato, por ejemplo maíz, algodón, soja), Liberty Link® (tolerancia a fosfinotricina, por ejemplo colza), IMI® (tolerancia a imidazolinonas) y SCS® (tolerancia a sulfonilureas), por ejemplo maíz. Las plantas resistentes a herbicidas (plantas reproducidas de forma convencional para la tolerancia a herbicida) que pueden mencionarse incluyen las variedades que se venden con el nombre Clearfield® (por ejemplo maíz).

Plantas transgénicas particularmente útiles que se pueden tratar según la invención son plantas que contienen eventos de transformación o una combinación de eventos de transformación, que se enumeran por ejemplo en las bases de datos de varias agencias reguladoras nacionales o regionales (véase por ejemplo http://gmoinfo.jrc.it/gmp_browser.aspx y <http://www.agbios.com/dbase.php>).

Las plantas enumeradas pueden tratarse de acuerdo con la invención de un modo particularmente ventajoso con los compuestos de fórmula general (I) o las mezclas de principios activos de acuerdo con la invención. Los intervalos preferentes indicados en lo que antecede para los principios activos o mezclas también se aplican para el tratamiento de estas plantas. El tratamiento de plantas con los compuestos o mezclas indicados especialmente en el presente texto es particularmente destacado.

Los principios activos de acuerdo con la invención no solo son activos contra plagas de plantas, plagas higiénicas y plagas de productos almacenados, sino que, en el sector de la medicina veterinaria, también contra parásitos animales (ecto- y endoparásitos) tales como garrapatas duras, garrapatas blandas, ácaros de la sarna del vellón, ácaros rojos, moscas (picadoras y lamedoras), larvas de moscas parásitas, piojo, piojo de la cabeza, piojo de las aves y pulgas. Estos parásitos incluyen:

del orden de los anopluros, por ejemplo, *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phtirus* spp. y *Solenopotes* spp.

Del orden de los malofágidos y los subórdenes Amblycerina e Ischnocerina, por ejemplo, *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Damalina* spp., *Trichodectes* spp. y *Felicola* spp.

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

Del orden de los sifonápteros, por ejemplo, *Pulex* spp., *Ctenocephalides* spp. (*Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*), *Xenopsylla* spp. y *Ceratophyllus* spp.

Del orden de los heteroptéridos, por ejemplo, *Cimex* spp., *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp. y *Panstrongylus* spp.

Del orden de los blatáridos, por ejemplo, *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Blattella germanica* y *Supella* spp.

De la subclase de los ácaros (Acarina) y de los órdenes Meta- y Mesostigmata, por ejemplo, *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Otobius* spp., *Ixodes* spp., *Amblyomma* spp., *Boophilus* spp., *Dermacentor* spp., *Haemophysalis* spp., *Hyalomma* spp., *Rhipicephalus* spp., *Dermanyssus* spp., *Raillietia* spp., *Pneumonyssus* spp., *Sternostoma* spp. y *Varroa* spp.

Del orden de los actinédidos (Prostigmata) y acarídidos (Astigmata), por ejemplo, *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp., *Ornithocheyletiella* spp., *Myobia* spp., *Psorergates* spp., *Demodex* spp., *Trombicula* spp., *Listrophorus* spp., *Acarus* spp., *Tyrophagus* spp., *Caloglyphus* spp., *Hypodectes* spp., *Pterolichus* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp.,

Otodectes spp., *Sarcoptes* spp., *Notoedres* spp., *Knemidocoptes* spp., *Cytodites* spp y *Laminosioptes* spp.

Los principios activos de fórmula (I) de acuerdo con la invención son también adecuados para controlar artrópodos que atacan al ganado agrícola tal como, por ejemplo, ganado vacuno, ovejas, cabras, caballos, cerdos, asnos, camellos, búfalos, conejos, pollos, pavos, patos, gansos, abejas melíferas, otros animales domésticos tales como, por ejemplo, perros, gatos, pájaros de jaula, peces de acuario y los denominados animales experimentales tales como, por ejemplo, hámsteres, conejillos de Indias, ratas y ratones. El control de estos artrópodos desea reducir los casos de muertes y las disminuciones de productividad (en el caso de carne, leche, lana, cueros, huevos, miel, etc.), de tal forma que sea posible una cría de animales más económica y más fácil por el uso de los principios activos de acuerdo con la invención.

5 En el sector veterinario y en la cría de animales, los principios activos según la invención se aplican de modo conocido mediante administración enteral en forma de, por ejemplo, comprimidos, cápsulas, pociones, bebidas, gránulos, pastas, bolos, procedimiento a través de la alimentación, supositorios, mediante administración parenteral, tal como, por ejemplo, mediante inyecciones (intramuscular, subcutánea, intravenosa, intraperitoneal y similares), implantes, mediante aplicación nasal, por medio de aplicación dérmica en forma de, por ejemplo, baño o inmersión (15 *dippen*), pulverización (*spray*), vertido en dorso y en la cruz (*pour-on* y *spot-on*), lavado, espolvoreo y, con ayuda de artículos moldeados que comprenden principio activo, tales como collares, etiquetas para las orejas, etiquetas para la cola, brazaletes para las extremidades, ronzales, dispositivos de marcado y similares.

20 Cuando se usan en ganado, aves de corral, animales domésticos y similares, los principios activos de fórmula (I) pueden aplicarse en forma de formulaciones (por ejemplo polvos, emulsiones, agentes fluidizables) que comprenden los principios activos en una cantidad del 1 % al 80 % en peso, bien directamente bien después de diluirlas entre 100 y 10.000 veces, o pueden usarse como baño químico.

También se ha encontrado que los compuestos de acuerdo con la invención tienen una fuerte acción insecticida contra insectos que destruyen los materiales industriales.

A modo de ejemplo y preferentemente (sin embargo sin limitarse es éstos) se mencionan los insectos siguientes:

25 escarabajos, tales como *Hylotrupes bajulus*, *Chlorophorus pilosis*, *Anobium punctatum*, *Xestobium rufovillosum*, *Ptilinus pecticornis*, *Dendrobium pertinex*, *Ernobius mollis*, *Priobium carpini*, *Lyctus brunneus*, *Lyctus africanus*, *Lyctus planicollis*, *Lyctus linearis*, *Lyctus pubescens*, *Trogoxylon aequale*, *Minthes rugicollis*, *Xyleborus spec.*, *Tryptodendron spec.*, *Apate monachus*, *Bostrychus capucins*, *Heterobostrychus brunneus*, *Sinoxylon spec.*, *Dinoderus minutus*;

30 dermápteros, tales como *Sirex juvencus*, *Urocerus gigas*, *Urocerus gigas taignus*, *Urocerus augur*,
termitas, tales como *Kaloterms flavicollis*, *Cryptoterms brevis*, *Heteroterms indicola*, *Reticuliterms flavipes*, *Reticuliterms santonensis*, *Reticuliterms lucifugus*, *Mastoterms darwiniensis*, *Zootermopsis nevadensis*, *Coptoterms formosanus*;

pececillos de plata, tales como *Lepisma saccharina*.

35 Los materiales industriales en el presente contexto se entiende que significan materiales inanimados, tales como, preferentemente, plásticos, adhesivos, colas, papeles y cartones, cuero, madera, productos de madera procesada y composiciones de recubrimiento.

Los agentes listos para usar pueden comprender, opcionalmente, otros insecticidas y, opcionalmente, uno o más fungicidas.

40 Respecto a posibles asociados de mezcla adicionales se hace referencia a los insecticidas y fungicidas mencionados anteriormente.

Al mismo tiempo, los compuestos de acuerdo con la invención pueden usarse también para proteger objetos que están en contacto con agua marina o salobre, especialmente cascos de barcos, tamices, redes, edificios, instalaciones de atraque y sistemas de señalización, de la formación de incrustación.

45 Además, los compuestos de acuerdo con la invención, solos o en combinaciones con otros principios activos, se pueden usar como agentes anti-incrustantes.

Los principios activos son también útiles para combatir plagas animales en el sector doméstico, en el sector de la higiene y en la protección de productos almacenados, en especial insectos, arácnidos y ácaros, que se encuentran en los espacios cerrados, por ejemplo, domicilios, naves industriales, oficinas, cabinas de vehículos y similares.

50 Estos se pueden usar para combatir estas plagas solos o combinados con otros principios activos y coadyuvantes en productos insecticidas domésticos. Son efectivos contra especies sensibles y resistentes y contra todos los estadios de desarrollo. Estas plagas incluyen:

del orden de los escorpiones, por ejemplo, *Buthus occitanus*.

Del orden de los ácaros, por ejemplo, *Argas persicus*, *Argas reflexus*, *Bryobia* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Glyciphagus domesticus*, *Ornithodoros moubat*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Trombicula alfreddugesi*, *Neutrombicula autumnalis*, *Dermatophagoides pteronissimus*, *Dermatophagoides forinae*.

Del orden de las arañas, por ejemplo, *Aviculariidae*, *Araneidae*.

- 5 Del orden de los opiliones, por ejemplo, *Pseudoscorpiones chelifer*, *Pseudoscorpiones cheiridium*, *Opiliones phalangium*.

Del orden de los isópodos, por ejemplo, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*.

Del orden de los diplópodos, por ejemplo, *Blaniulus guttulatus*, *Polydesmus* spp.

Del orden de los quilópodos, por ejemplo, *Geophilus* spp.

- 10 Del orden de los zigentomas, por ejemplo, *Ctenolepisma* spp., *Lepisma saccharina*, *Lepismodes inquilinus*.

Del orden de los blatarios, por ejemplo, *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Blattella asahinai*, *Leucophaea maderae*, *Panchlora* spp., *Parcoblatta* spp., *Periplaneta australasiae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Supella longipalpa*.

Del orden de los saltatorios, por ejemplo, *Acheta domesticus*.

- 15 Del orden de los dermápteros, por ejemplo, *Forficula auricularia*.

Del orden de los isópteros, por ejemplo, *Kaloterms* spp., *Reticuliterms* spp.

Del orden de los psocópteros, por ejemplo, *Lepinatus* spp., *Liposcelis* spp.

- 20 Del orden de los coleópteros, por ejemplo, *Anthrenus* spp., *Attagenus* spp., *Dermestes* spp., *Latheticus oryzae*, *Necrobia* spp., *Ptinus* spp., *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus granarius*, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Stegobium paniceum*.

Del orden de los dípteros, por ejemplo, *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes taeniorhynchus*, *Anopheles* spp., *Calliphora erythrocephala*, *Chrysozona pluvialis*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex pipiens*, *Culex tarsalis*, *Drosophila* spp., *Fannia canicularis*, *Musca domestica*, *Phlebotomus* spp., *Sarcophaga carnaria*, *Simulium* spp., *Stomoxys calcitrans*, *Tipula paludosa*.

- 25 Del orden de los lepidópteros, por ejemplo, *Achroia grisella*, *Galleria mellonella*, *Plodia interpunctella*, *Tinea cloacella*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*.

Del orden de los sifonápteros, por ejemplo, *Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, *Xenopsylla cheopis*.

- 30 Del orden de los himenópteros, por ejemplo, *Camponotus herculeanus*, *Lasius fuliginosus*, *Lasius niger*, *Lasius umbratus*, *Monomorium pharaonis*, *Paravespula* spp., *Tetramorium caespitum*.

Del orden de los anopluros, por ejemplo, *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pemphigus* spp., *Phylloera vastatrix*, *Phthirus pubis*.

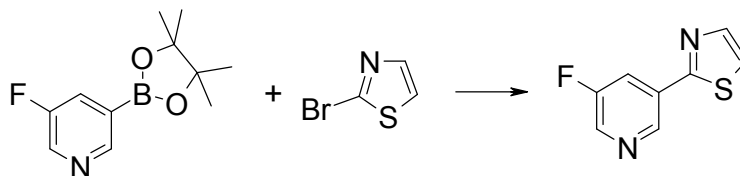
Del orden de los heterópteros, por ejemplo, *Cimex hemipterus*, *Cimex lectularius*, *Rhodinus prolixus*, *Triatoma infestans*.

- 35 La aplicación en el campo de los insecticidas domésticos se realiza sola o en combinación con otros principios activos adecuados, tales como ésteres de ácido fosfórico, carbamatos, piretroides, neo-nicotinoides, reguladores del crecimiento o principios activos de otras clases conocidas de insecticidas.

- 40 La aplicación se realiza en aerosoles, productos de pulverización sin presión, por ejemplo pulverizadores de bomba y atomizadores, sistemas automáticos de nebulización, nebulizadores, espumas, geles, productos de vaporización con placas de vaporización realizadas en celulosa o plástico, vaporizadores de líquido, vaporizadores de gel y membrana, vaporizadores con propulsores, sistemas de vaporización carentes de energía o pasivos, papeles antipolillas, bolsitas antipolillas y geles antipolillas, en forma de gránulos o polvos, en cebos para dispersar o en trampas con cebo.

Ejemplos de preparación**Ejemplo B: 6-[2-(5-Fluoropiridin-3-il)-1,3-tiazol-5-il]-N-[(trifluorometil)sulfonil]piridin-2-carboxamida**

Etapa 1: 3-Fluoro-5-(1,3-tiazol-2-il)piridina



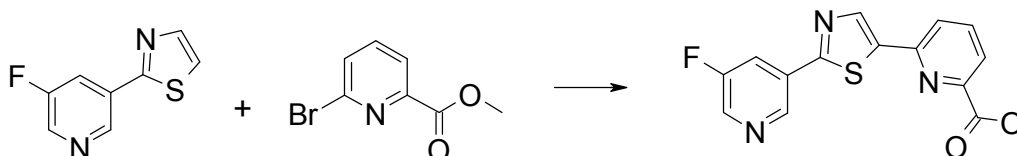
- 5 Se agitaron bajo argón en 40 ml de dimetoxietano a 80 °C durante 16 horas 2,0 g (8,97 mmol) de éster piridil bórico, 1,47 g (8,97 mmol) de 2-bromotiazol, 197 mg (0,27 mmol) de cloruro de bis(difenilfosfino)ferrocenopaladio(II) y 3,72 g (26,9 mmol) de carbonato potásico.

Para el tratamiento, la mezcla se concentró y se purificó por medio de cromatografía en columna sobre gel de sílice (eluyente: ciclohexano/acetato de etilo).

- 10 Rendimiento: 778 mg (48 % del teórico)

HPLC-EM: logP(HCOOH): 1,48; masa (m/z): 180,9 (M+H)⁺;

RMN de ¹H (d6-DMSO): 7,95 (m,1H), 8,04 (m,1H), 8,24 (m,1H), 8,69 (m,1H), 9,04 (m,1H) ppm.

Etapa 2: 6-[2-(5-Fluoropiridin-3-il)-1,3-tiazol-5-il]piridin-2-carboxilato de metilo

- 15 Se agitaron en 10 ml de dimetilformamida bajo argón a 120 °C durante 16 h 748 mg (4,15 mmol) del fluoropiridil-tiazol, 897 mg (4,15 mmol) de la bromopiridina, 62 mg (0,13 mmol) de dihidrogeno-dicloro-bis(di-t-butilfosfinito-kP)paladato(2-) (dicloro{bis[di-terc-butil(hidroxi)fosforanil]}paladio, POPd, empresa CombiPhos, EE.UU.) y 1,147 g (8,3 mmol) de carbonato potásico.

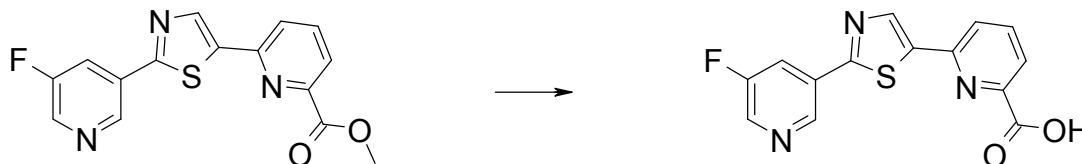
Para el tratamiento, la mezcla se concentró y se purificó por medio de cromatografía en columna sobre gel de sílice (eluyente: ciclohexano/acetato de etilo).

- 20 Rendimiento: 615 mg (47 % del teórico)

HPLC-EM: logP(HCOOH): 2,37; masa (m/z): 316,0 (M+H)⁺;

RMN de ¹H (d6-DMSO): 3,93 (s,3H), 8,03 (m,1H), 8,14 (m,1H), 8,36 (m,2H), 8,73 (m,1H), 8,80 (m,1H), 9,12 (m,1H) ppm.

- 25 **Etapa 3:** Ácido 6-[2-(5-fluoropiridin-3-il)-1,3-tiazol-5-il]piridin-2-carboxílico



Se disolvieron 570 mg (1,81 mmol) del piridilcarboxilato de metilo en una mezcla de 25 ml de tetrahidrofurano y 8 ml de agua, se añadió una solución de 152 mg (3,62 mmol) de hidróxido de litio monohidratado en 17 ml de agua y se agitó a temperatura ambiente durante 16 h.

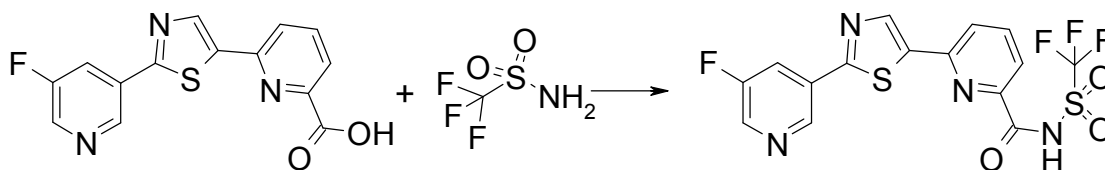
- 30 Para el tratamiento, la mezcla se concentró y se repartió entre agua y éter metil t-butílico, la fase acuosa se acidificó con ácido clorhídrico 1 N, y el precipitado sólido se separó por filtración con succión y se secó.

Rendimiento: 556 mg (91 % del teórico)

HPLC-EM: logP(HCOOH): 1,72; masa (m/z): 302,1 (M+H)⁺;

RMN de ¹H (d6-DMSO): 8,00 (m,1H), 8,10 (m,1H), 8,32 (m,2H), 8,72 (m,1H), 8,78 (m,1H), 9,10 (m,1H), 13,5 (ancho) ppm.

- 35

Etapas 4: 6-[2-(5-Fluoropiridin-3-il)-1,3-tiazol-5-il]-N-[(trifluorometil)sulfonyl]piridin-2-carboxamida

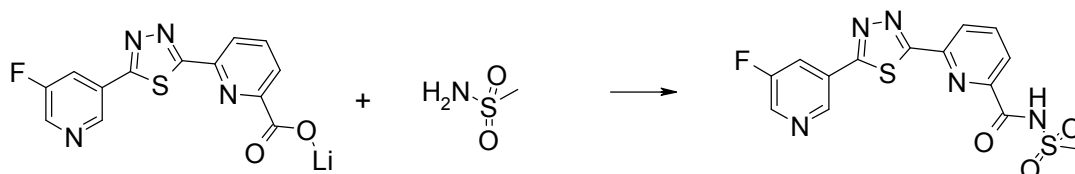
5 Se cargaron 100 mg (0,33 mmol) del ácido piridilcarboxílico inicialmente en 5 ml de tetrahidrofurano, se añadieron 81 mg (0,50 mmol) de carbonildiimidazol y se llevó a ebullición a reflujo durante 1 h. Después de enfriar hasta temperatura ambiente, se añadieron 74 mg (0,50 mmol) de trifluorometanosulfonamida, se agitó durante 10 min, luego se añadieron 76 mg (0,50 mmol) de diazabicyclo-undeceno (DBU) y se agitó a temperatura ambiente durante 16 h.

Para el tratamiento, la mezcla se concentró y se purificó por medio de cromatografía en columna sobre gel de sílice (eluyente: diclorometano/metanol).

10 Rendimiento: 28 mg (20 % del teórico)

HPLC-EM: logP(HCOOH): 1,86; masa (m/z): 433,0 (M+H)⁺;

RMN de ¹H (d₆-DMSO): 7,60 (m,1H), 7,88 (m,1H), 7,96 (m,1H), 8,12 (m,1H), 8,30 (m,1H), 8,70 (m,1H), 8,89 (m,1H), 9,10 (m,1H) ppm.

Ejemplo C: 6-[5-(5-Fluoropiridin-3-il)-1,3,4-tiadiazol-2-il]-N-(metilsulfonyl)piridin-2-carboxamida

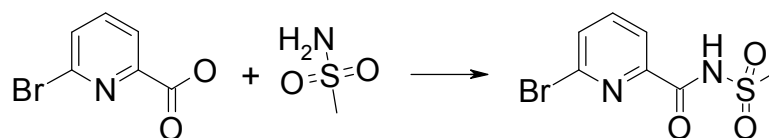
15 Se cargaron 200 mg (0,64 mmol) de la sal de litio y 1,01 g (7,78 mmol) de diisopropil-etilamina inicialmente en 5 ml de acetonitrilo, se añadieron 198 mg (0,77 mmol) de cloruro de ácido bis(2-oxo-3-oxazolidinil)fosfínico (BOP-Cl), se agitó durante 20 min, se añadieron 185 mg (1,94 mmol) de metanosulfonamida y 99 mg (0,64 mmol) de diazabicyclo-undeceno (DBU) y se agitó a temperatura ambiente durante 16 h.

20 Para el tratamiento, la mezcla se concentró y se repartió entre agua y acetato de etilo, y la fase orgánica se secó y se concentró. La purificación posterior se efectuó por medio de cromatografía en columna sobre gel de sílice (eluyente: diclorometano / metanol) y luego sobre gel de sílice RP18 (eluyente: agua/acetonitrilo).

Rendimiento: 37 mg (15 % del teórico)

HPLC-EM: logP(HCOOH): 1,79; masa (m/z): 380,1 (M+H)⁺;

25 RMN de ¹H (d₆-DMSO): 3,40 (s,3H), 8,22 (m,1H), 8,30 (m,1H), 8,48 (m,1H), 8,59 (m,1H), 8,82 (m,1H), 9,18 (m,1H), 12,1 (ancho) ppm.

Ejemplo D: 6-[1-(5-Fluoropiridin-3-il)-1H-pirazol-4-il]-N-(metilsulfonyl)piridin-2-carboxamida**Etapas 1:** 6-Bromo-N-(metilsulfonyl)piridin-2-carboxamida

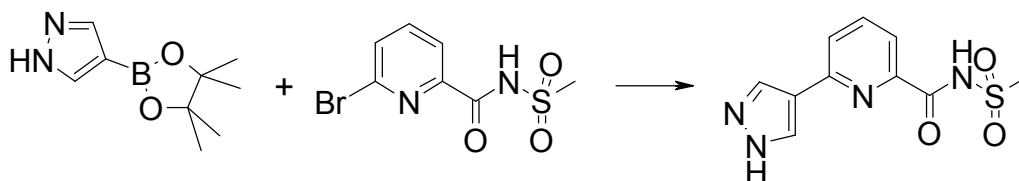
30 Se cargaron 5,40 g (26,7 mmol) de ácido 6-bromo-2-piridincarboxílico inicialmente en 150 ml de tetrahidrofurano, se añadieron 6,51 g (40,0 mmol) de carbonildiimidazol y se llevó a ebullición a reflujo durante 1 h. Después de enfriar hasta temperatura ambiente, se añadieron 3,81 g (40,0 mmol) de metanosulfonamida, se agitó durante 10 min, luego se añadieron 6,10 g (40 mmol) de diazabicyclo-undeceno (DBU) y se agitó a temperatura ambiente durante 16 h.

35 Para el tratamiento, la mezcla se concentró y se purificó por medio de cromatografía en columna sobre gel de sílice (eluyente: diclorometano / metanol).

Rendimiento: 5,10 g (69 % del teórico)

HPLC-EM: logP(HCOOH): 1,21; masa (m/z): 281,0 (M+H)⁺;

RMN de ¹H (d₆-DMSO): 3,37 (s,3H), 7,95 (m,2H), 8,06 (m,1H) ppm.

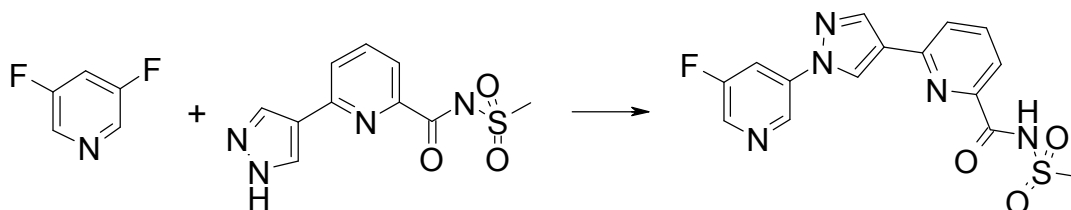
Etapas 2: N-(Metilsulfonil)-6-(1H-pirazol-4-il)piridin-2-carboxamida

5 Se agitaron en 10 ml de dimetoxietano bajo argón a 80 °C durante 16 h 285 mg (1,47 mmol) del éster 4-pirazolborónico, 410 mg (1,47 mmol) de la bromopiridina, 32 mg (0,04 mmol) de cloruro de bis(difenilfosfino)ferrocenopaladio(II) y 467 mg (4,41 mmol) de carbonato potásico.

Para el tratamiento, la mezcla se concentró y se purificó por medio de cromatografía en columna sobre gel de sílice (eluyente: ciclohexano/acetato de etilo).

Rendimiento: 145 mg (37 % del teórico)

HPLC-EM: logP(HCOOH): 0,91; masa (m/z): 267,0 (M+H)⁺

10 **Etapas 3:** 6-[1-(5-Fluoropiridin-3-il)-1H-pirazol-4-il]-N-(metilsulfonil)piridin-2-carboxamida

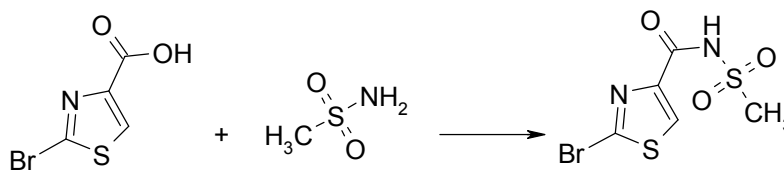
Se agitaron en 5 ml de dimetilformamida bajo argón a 120 °C durante 12 h 43 mg (0,37 mmol) de 3,5-difluoropiridina, 99 mg (0,37 mmol) de la pirazolil-piridina, 6 mg (0,01 mmol) de dihidrogeno-dicloro-bis(di-t-butilfosfinito-kP)paladato(2-) (POPd, empresa CombiPhos, EE.UU.) y 102 mg (0,74 mmol) de carbonato potásico.

15 Para el tratamiento, la mezcla se concentró y se purificó por medio de cromatografía en columna sobre gel de sílice (eluyente: diclorometano/metanol).

Rendimiento: 35 mg (26 % del teórico)

HPLC-EM: logP(HCOOH): 1,98; masa (m/z): 362,1 (M+H)⁺;

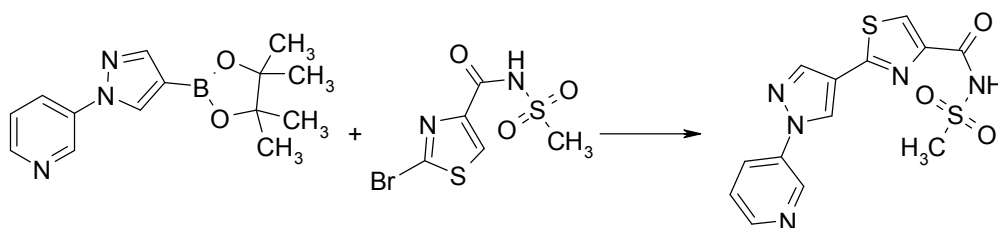
20 RMN de ¹H (d6-DMSO): 3,40 (s,3H), 7,98 (m,1H), 8,08 (m,2H), 8,2 (m,1H), 8,58 (m,1H), 8,70 (m,1H), 9,08 (m,1H), 9,40 (m,1H) ppm.

Ejemplo G: N-(Metilsulfonil)-2-[1-(piridin-3-il)-1H-pirazol-4-il]-1,3-tiazol-4-carboxamida**Etapas 1:** 2-Bromo-N-(metilsulfonil)-1,3-tiazol-4-carboxamida

25 Se cargó inicialmente ácido 2-bromo-1,3-tiazol-4-carboxílico (0,8 g, 3,85 mmol) en tetrahidrofurano (10 ml). Se añadió N,N'-carbonildiimidazol (0,94 g, 5,77 mmol) y la mezcla de reacción se calentó a reflujo durante 1 h. Se añadió metanosulfonamida (0,55 g, 5,77 mmol) y, después de 10 min, 1,8-diazabicyclo[5,4,0]undec-7-eno (0,88 g, 5,77 mmol). La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 16 h y luego se eliminó el disolvente a presión reducida. El residuo se recogió en agua y se acidificó con ácido clorhídrico. El producto precipitado se separó por filtración con succión. La fase acuosa se extrajo con diclorometano, la fase orgánica se secó sobre sulfato sódico, se filtró, y el disolvente se eliminó a vacío. Esto dio un total de 1,0 g (89 % del teórico) de 2-bromo-N-(metilsulfonil)-1,3-tiazol-4-carboxamida.

HPLC-EM: LogP(HCOOH): 0,83; masa (m/z): 284,9 (M+H)⁺;

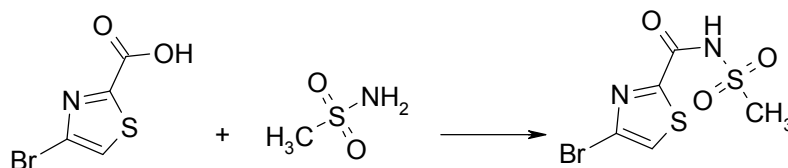
30 RMN de ¹H (d6-DMSO): 3,33 (s,3H), 8,61 (s,1H), 12,00 (s,1H)

Etapas 2: N-(Metilsulfonyl)-2-[1-(piridin-3-il)-1H-pirazol-4-il]-1,3-tiazol-4-carboxamida

Bajo argón se añadieron 3-[4-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)-1H-pirazol-1-il]piridina (0,1 g, 0,37 mmol), 2-bromo-N-(metilsulfonyl)-1,3-tiazol-4-carboxamida (0,105 g, 0,37 mmol) y tetraquis(trifenilfosfina)paladio (0,013 g, 0,011 mmol) a una mezcla desgasificada por medio de argón de solución de carbonato sódico en agua (1,5 ml, 2 M/l) y acetonitrilo (3,8 ml). La mezcla de reacción se agitó a 70 °C durante 16 h. Después de enfriar, la mezcla de reacción se vertió sobre agua y se extrajo con diclorometano. La fase orgánica se secó sobre sulfato sódico y el disolvente se eliminó a vacío. El residuo se agitó seguidamente con éter dietílico y se separó por filtración con succión. Esto dio 0,23 g (97 % del teórico) de 6-[1-(piridin-3-il)-1H-pirazol-4-il]piridin-2-sulfonamida.

HPLC-EM: LogP(HCOOH): 1,25; masa (m/z): 350,1 (M+H)⁺

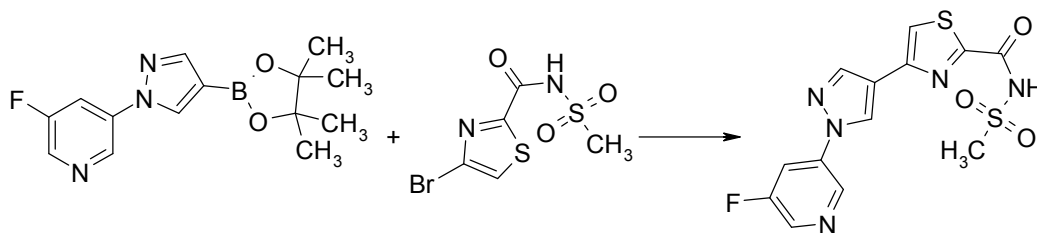
RMN de ¹H (d6-DMSO): 3,38(s,3H), 7,48-7,49(m,1H), 8,32-8,35(m,1H), 8,45(s,1H), 8,56(s,1H), 8,59-8,60(m,1H), 9,19-9,20(m,1H), 9,34(s,1H) ppm

Ejemplo H: 4-[1-(5-Fluoropiridin-3-il)-1H-pirazol-4-il]-N-(metilsulfonyl)-1,3-tiazol-2-carboxamida**Etapas 1:** 4-Bromo-N-(metilsulfonyl)-1,3-tiazol-2-carboxamida

Se cargó inicialmente en tetrahidrofurano (10 ml) ácido 4-bromo-1,3-tiazol-2-carboxílico (1,0 g, 4,8 mmol). Se añadió N,N'-carbonildiimidazol (1,17 g, 7,2 mmol) y la mezcla de reacción se calentó a reflujo durante 1 h. Se añadió metanosulfonamida (0,69 g, 7,2 mmol) y, después de 10 min, 1,8-diazabicyclo[5,4,0]undec-7-eno (1,10 g, 7,2 mmol). La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 16 h y luego se eliminó el disolvente a vacío. El residuo se recogió en agua y se acidificó con ácido clorhídrico. El producto precipitado se separó por filtración con succión. Esto dio 1,18 g (84 % del teórico) de 4-bromo-N-(metilsulfonyl)-1,3-tiazol-2-carboxamida.

HPLC-EM: LogP(HCOOH): 0,63; masa (m/z): 284,9 (M+H)⁺;

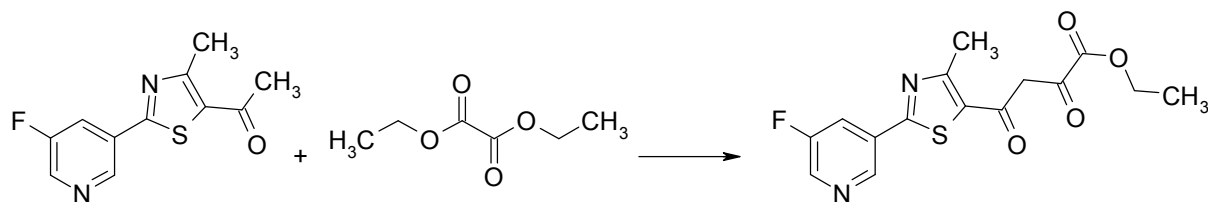
RMN de ¹H (d6-DMSO): 3,31 (s, 3H), 8,31 (s, 1H)

Etapas 2: 4-[1-(5-Fluoropiridin-3-il)-1H-pirazol-4-il]-N-(metilsulfonyl)-1,3-tiazol-2-carboxamida

Bajo argón se añadieron 3-fluoro-5-[4-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)-1H-pirazol-1-il]piridina (0,2 g, 0,69 mmol), preparada según los procedimientos descritos en el documento WO 2011/045224), 2-bromo-N-(metilsulfonyl)-1,3-tiazol-4-carboxamida (0,2 g, 0,69 mmol) y tetraquis(trifenilfosfina)paladio (0,024 g, 0,021 mmol) a una mezcla desgasificada por medio de argón de solución de carbonato sódico en agua (2,8 ml, 2 M/l) y acetonitrilo (9,4 ml). La mezcla de reacción se agitó a 70 °C durante 16 h. Después de enfriar, la mezcla de reacción se vertió sobre agua y se extrajo con diclorometano. La fase acuosa se acidificó con ácido clorhídrico y el precipitado sólido se separó por filtración con succión. El producto bruto se sometió a cromatografía con acetato de etilo/2-propanol sobre gel de sílice. Esto dio 0,21 g (8 % del teórico) de 4-[1-(5-fluoropiridin-3-il)-1H-pirazol-4-il]-N-(metilsulfonyl)-1,3-tiazol-2-carboxamida.

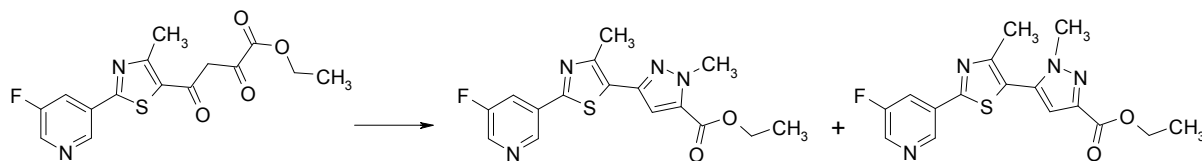
HPLC-EM: LogP(HCOOH): 1,68; masa (m/z): 368,1 (M+H)⁺

RMN de ¹H (d6-DMSO): 2,99 (s, 3H), 7,96 (s, 1H), 8,33 (s, 1H), 8,34 (s, 1H), 8,55-8,57 (m, 1H), 9,10 (s, 1H), 9,12 (s, 1H) ppm

Ejemplo I: 3-[2-(5-Fluoropiridin-3-il)-4-metil-1,3-tiazol-5-il]-1-metil-N-(metilsulfonil)-1H-pirazol-5-carboxamida**Etapas 1:** 4-[2-(5-Fluoropiridin-3-il)-4-metil-1,3-tiazol-5-il]-2,4-dioxobutanoato de etilo

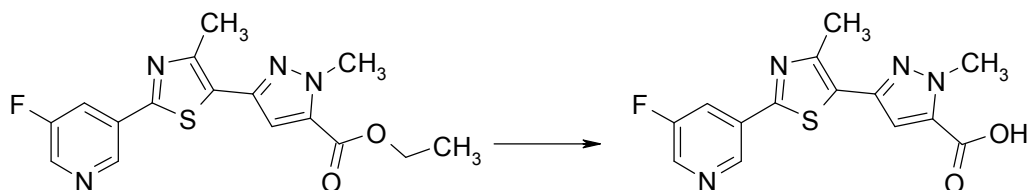
5 Bajo argón se cargó inicialmente en tetrahidrofurano (150 ml) bis(trimetilsilil)amida de litio (21 ml, 1 M/l en tetrahidrofurano). A -78 °C, se añadió lentamente gota a gota 1-[2-(5-fluoropiridin-3-il)-4-metil-1,3-tiazol-5-il]etanona (5,0 g, 21 mmol, preparada de forma análoga a Biorg. & Med. Chem. Lett 1056(2007) y 2828(2010)) disuelta en éter dietílico y la mezcla de reacción se agitó durante 2 h. Se añadió gota a gota oxalato de dietilo (3,1 g, 21 mmol) disuelto en éter y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 16 h. A continuación, se añadió solución de hidrogenosulfato potásico (5 %) y se extrajo repetidamente con acetato de etilo. Las fases orgánicas reunidas se secaron y el disolvente se eliminó a vacío. Esto dio 7,1 g (99 % del teórico) de 4-[2-(5-fluoropiridin-3-il)-4-metil-1,3-tiazol-5-il]-2,4-dioxobutanoato de etilo.

10 HPLC-EM: LogP(HCOOH): 3,37; masa (m/z): 337,1 (M+H)⁺
 RMN de ¹H (d6-DMSO): 1,31 (t, 3H), 2,79 (s, 3H), 4,31-4,32 (m, 2H), 6,71 (s ancho, 2H), 8,33 (d, 1H), 8,77 (s, 1H), 9,10 (s, 1H) ppm

Etapas 2: 3-[2-(5-Fluoropiridin-3-il)-4-metil-1,3-tiazol-5-il]-1-metil-1H-pirazol-5-carboxilato de etilo

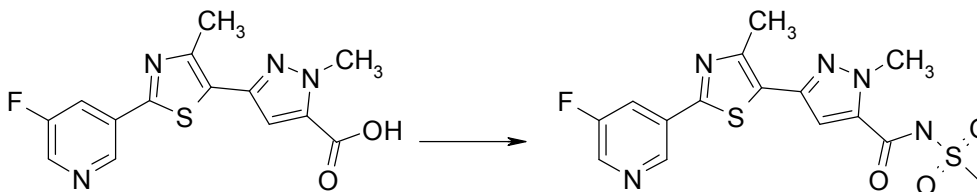
20 Se calentaron en etanol (250 ml) a reflujo durante 2 h 4-[2-(5-fluoropiridin-3-il)-4-metil-1,3-tiazol-5-il]-2,4-dioxobutanoato de etilo (6,9 g, 20,5 mmol) y metilhidrazina (0,65 g, 20,5 mmol). El producto formado se separó por filtración con succión y el disolvente del filtrado se eliminó a vacío. El residuo se sometió a cromatografía sobre gel de sílice (eluyente ciclohexano/acetato de etilo). Esto dio un total de 1,24 g (17 % del teórico) de 3-[2-(5-fluoropiridin-3-il)-4-metil-1,3-tiazol-5-il]-1-metil-1H-pirazol-5-carboxilato de etilo. Como subproducto, se obtuvieron 4,8 g (67 % del teórico) de 5-[2-(5-fluoropiridin-3-il)-4-metil-1,3-tiazol-5-il]-1-metil-1H-pirazol-3-carboxilato de etilo.

25 HPLC-EM: LogP(HCOOH): 3,70; masa (m/z): 347,0 (M+H)⁺
 RMN de ¹H (d6-DMSO): 1,35 (t, 3H), 2,63 (s, 3H), 4,15 (s, 3H), 4,35 (c, 2H), 7,17 (s, 1H), 8,19-8,22 (m, 1H), 8,68-8,69 (m, 1H), 9,00-9,01 (m, 1H) ppm

Etapas 3: Ácido 3-[2-(5-fluoropiridin-3-il)-4-metil-1,3-tiazol-5-il]-1-metil-1H-pirazol-5-carboxílico

30 Se disolvió en tetrahidrofurano (200 ml) y agua (100 ml) 3-[2-(5-fluoropiridin-3-il)-4-metil-1,3-tiazol-5-il]-1-metil-1H-pirazol-5-carboxilato de etilo (1,1 g, 3,1 mmol), y se añadió hidróxido de litio monohidratado (0,26 g, 6,2 mmol) disuelto en agua (100 ml). La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 16 h, luego se neutralizó con ácido clorhídrico, y el disolvente se eliminó a vacío. El sólido precipitado se separó por filtración con succión. Esto dio 0,96 g (94 % del teórico) de ácido 3-[2-(5-fluoropiridin-3-il)-4-metil-1,3-tiazol-5-il]-1-metil-1H-pirazol-5-carboxílico.

35 HPLC-EM: LogP(HCOOH): 2,05; masa (m/z): 319,0 (M+H)⁺
 RMN de ¹H (d6-DMSO): 2,62 (s, 3H), 4,14 (s, 3H), 7,13 (s, 1H), 8,18-8,22 (m, 1H), 8,68-8,69 (m, 1H), 9,00-9,01 (m, 1H) ppm

Etap 4: 3-[2-(5-Fluoropiridin-3-il)-4-metil-1,3-tiazol-5-il]-1-metil-N-(metilsulfonyl)-1H-pirazol-5-carboxamida

Se cargaron inicialmente en diclorometano enfriado en hielo (10 ml) ácido 3-[2-(5-fluoropiridin-3-il)-4-metil-1,3-tiazol-5-il]-1-metil-1H-pirazol-5-carboxílico (0,08 g, 0,25 mmol) y metanosulfonamida (0,024 g, 0,25 mmol). Se añadieron 4-dimetilaminopiridina (0,006 g, 0,05 mmol) y clorhidrato de N-(3-dimetilaminopropil)-N'-etilcarbodiimida (0,053 g, 0,275 mmol). La mezcla de reacción se agitó a 0 °C durante 2 h y luego a temperatura ambiente durante 16 h. El disolvente se eliminó a vacío y el residuo se sometió a cromatografía sobre gel de sílice (eluyente diclorometano/acetato de etilo). Esto dio 0,074 g (72 % del teórico) de 3-[2-(5-fluoropiridin-3-il)-4-metil-1,3-tiazol-5-il]-1-metil-N-(metilsulfonyl)-1H-pirazol-5-carboxamida.

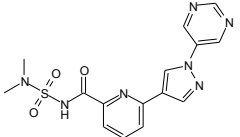
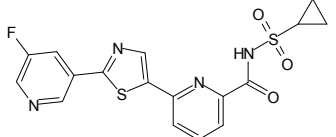
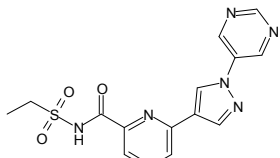
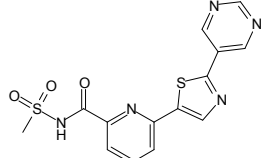
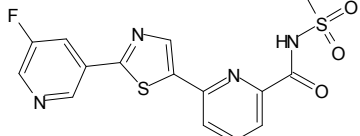
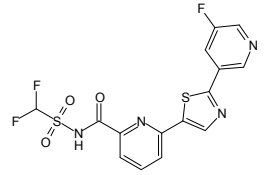
5 HPLC-EM: LogP(HCOOH): 2,04; masa (m/z): 396,0 (M+H)⁺

10 RMN de ¹H (d6-DMSO): 2,55 (s,3H), 3,40 (s,3H), 4,12 (s,3H), 7,68 (m,1H), 8,12 (m,1H), 8,69 (m,1H), 9,01 (m,1H) ppm

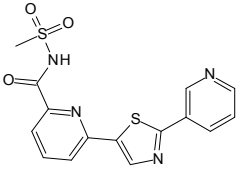
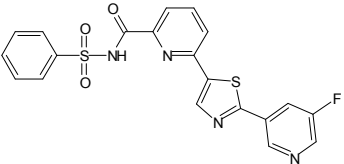
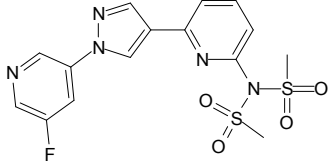
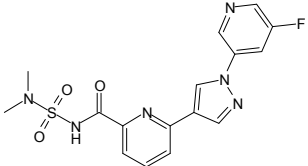
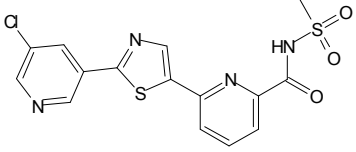
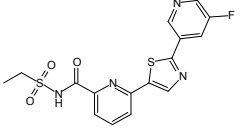
Los siguientes compuestos de fórmula (I) se obtuvieron de forma análoga a, o de acuerdo con, los procedimientos de preparación descritos antes:

Número	Compuesto	logP (HCOOH)	Datos de RMN	Masa M ⁺ + 1
2 (EP B)		1,86	RMN de ¹ H (d6-DMSO): 7,60 (m,1H), 7,88 (m,1H), 7,96 (m,1H), 8,12 (m,1H), 8,30 (m,1H), 8,70 (m,1H), 8,89 (m,1H), 9,10 (m,1H) ppm.	433
3 (EP C)		1,79	RMN de ¹ H (d6-DMSO): 3,40 (s,3H), 8,22 (m,1H), 8,30 (m,1H), 8,48 (m,1H), 8,59 (m,1H), 8,82 (m,1H), 9,18 (m,1H), 12,1 (ancho) ppm.	380,1
4 (EP D)		1,98	RMN de ¹ H (d6-DMSO): 3,40 (s,3H), 7,98 (m,1H), 8,08 (m,2H), 8,2 (m,1H), 8,58 (m,1H), 8,70 (m,1H), 9,08 (m,1H), 9,40 (m,1H) ppm.	362,1

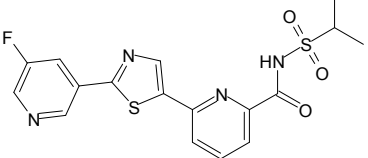
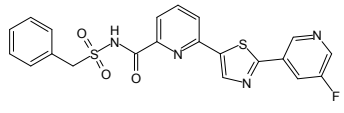
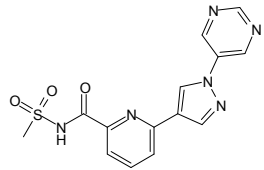
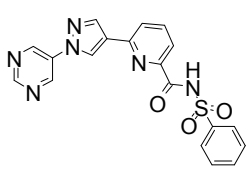
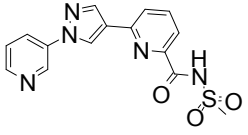
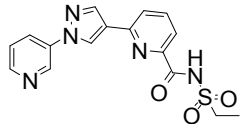
(continuación)

Número	Compuesto	logP (HCOOH)	Datos de RMN	Masa M ⁺ + 1
5		1,86	RMN de ¹ H(d6-DMSO): 2,66(s,6H), 7,78-7,85(m,3H), 8,50(s,1H), 9,17(s,1H), 9,26(s,1H), 9,40(s,2H)	373
6		2,44	RMN de ¹ H (d6-DMSO): 1,18 (m,4H), 3,15 (m,1H), 8,04 (m,1H), 8,15 (m,1H), 8,33 (m,2H), 8,74 (s,1H), 8,91 (s,1H), 9,11 (s,1H), 11,8 (ancho) ppm.	404,9
7		1,63	RMN de ¹ H(d6-DMSO):1,31(t,3H), 3,58 (c,2H), 7,96-7,98(m,1H), 8,07-8,14(m,2H), 8,83(s,1H), 9,20(s,1H), 9,38(s,2H), 9,52(s,1H), 11,60(s,1H)	358
8		1,48	RMN de ¹ H (d6-DMSO): 3,40 (s,3H), 8,02 (m,1H), 8,18 (m,1H), 8,35 (m,1H), 8,95 (s,1H), 9,30 (s,1H), 9,40 (s,2H), 11,8 (ancho) ppm.	362
9		2,05	RMN de ¹ H (d6-DMSO): 3,42 (s,3H), 8,02 (m,1H), 8,19 (m,1H), 8,34 (m,2H), 8,75 (m,1H), 8,93 (m,1H), 9,11 (m,1H), 11,8 (ancho) ppm.	379
11		1,79	RMN de ¹ H (d6-DMSO): 6,75 (m,1H), 7,50 (m,1H), 7,93 (m,2H), 8,12 (m,1H), 8,32 (m,1H), 8,70 (m,2H), 9,10 (m,1H) ppm.	415

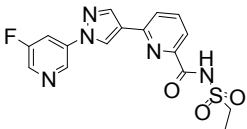
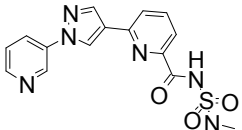
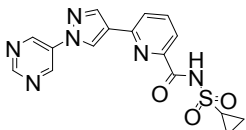
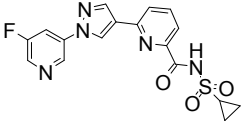
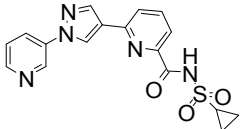
(continuación)

Número	Compuesto	logP (HCOOH)	Datos de RMN	Masa M ⁺ + 1
12		1,56	RMN de ¹ H (d6-DMSO): 3,42 (s,3H), 7,78 (m,1H), 8,00 (m,1H), 8,18 (m,1H), 8,32 (m,1H), 8,50 (m,1H), 8,75 (m,1H), 8,90 (s,1H), 9,29 (m,1H), 11,8 (ancho) ppm.	361
13		2,94	RMN de ¹ H (d6-DMSO): 7,70 (m,3H), 7,88 (m,1H), 8,08 (m,3H), 8,30 (m,2H), 8,75 (m,1H), 8,90 (s,1H), 9,12 (m,1H), 12,3 (ancho) ppm.	441
14		2,15	RMN de ¹ H (d6-DMSO): 3,74 (s, 6H), 7,59 (dd, 1H), 7,94 (dd, 1H), 8,07 (t, 1H), 8,35 (dt, 1H), 8,51 (s, 1H), 8,60 (d, 1H), 9,13 (m, 1H), 9,26 ppm (d, 1H).	412
16		2,42	RMN de ¹ H (d6-DMSO): 2,65(s,6H), 7,76- 7,84(m,3H), 8,30- 8,34(m,1H), 8,45(s,1H), 8,57-8,58(m,1H), 9,11(s,1H), 9,24(s,1H)	390
17		2,4	RMN de ¹ H (d6-DMSO): 3,42 (s,3H), 8,01 (m,1H), 8,18 (m,1H), 8,32 (m,2H), 8,78 (s,1H), 8,92 (m,1H), 9,18 (s,1H), 11,8 (ancho) ppm.	395
18		2,33	RMN de ¹ H (d6-DMSO): 1,28 (t,3H), 3,55 (c,2H), 7,98 (m,1H), 8,15 (m,1H), 8,33 (m,2H), 8,72 (m,1H), 8,90 (m,1H), 9,11 (s,1H), 11,8 (ancho) ppm.	393

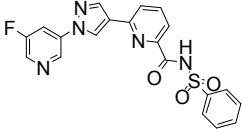
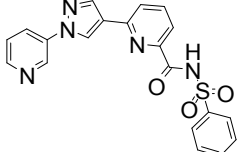
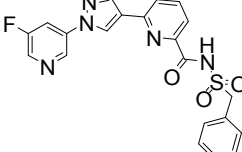
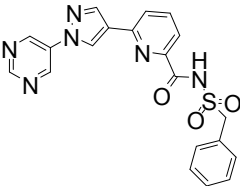
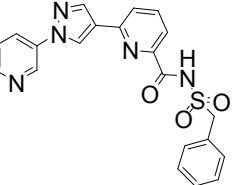
(continuación)

Número	Compuesto	logP (HCOOH)	Datos de RMN	Masa M ⁺ + 1
20		2,61	RMN de ¹ H (d6-DMSO): 1,38 (d,6H), 3,85 (m,1H), 7,99 (m,1H), 8,15 (m,1H), 8,35 (m,2H), 8,75 (s,1H), 8,92 (s,1H), 9,11 (s,1H), 11,8 (ancho) ppm.	407,1
21		2,97	RMN de ¹ H (d6-DMSO): 4,85 (s,2H), 7,48 (m,5H), 8,00 (m,1H), 8,18 (m,1H), 8,33 (m,2H), 8,72 (s,1H), 8,89 (s,1H), 9,10 (s,1H), 11,8 (ancho) ppm.	455,1
22		1,38	RMN de ¹ H(d6-DMSO):3,44(s,3H),7,98- 8,00(m,1H),8,08- 8,15(m,2H),8,84(s,1H);9,2 0(s,1H),9,38(s,2H),9,54(s,1 H),11,75(s,1H)	344
23		2,24	RMN de ¹ H(D6-DMSO): 7,39-7,42(m,3H), 7,74- 7,88(m,5H), 8,43(s,1H), 9,15(s,1H), 9,19- 9,20(m,1H), 9,39(s,2H) ppm	406,0
24		1,48	RMN de ¹ H(D6-DMSO): 3,43(s,3H), 7,61- 7,64(m,1H), 7,96- 7,99(m,1H), 8,09- 8,11(m,2H), 8,28- 8,31(m,1H), 8,58- 8,60(m,1H), 8,75(s,1H), 9,17-9,18(m,1H), 9,50(s1H), 11,70(s,1H) ppm	344,0
25		1,77	RMN de ¹ H(D6-DMSO):1,31(t,3H), 3,59(c, 2H), 7,61-7,64(m,1H), 7,95-7,97(m,1H), 8,09- 8,11(m,2H), 8,28- 8,32(m,1H), 8,56- 8,60(m,1H), 8,76(s,1H), 9,17-9,18(m,1H), 9,49(s,1H), 11,70(s,1H) ppm	358,1

(continuación)

Número	Compuesto	logP (HCOOH)	Datos de RMN	Masa M ⁺ + 1
26		2,21	RMN de ¹ H(D6-DMSO):1,16(t,3H), 2,49-2,52(m,2H), 7,79-7,89(m,3H), 8,33-8,36(m1H), 8,47(s,1H), 8,57-8,58(m,1H), 9,11(s,1H), 9,25(s,1H) ppm	376,0
27		1,96	RMN de ¹ H(D6-DMSO):2,95(s,6H), 7,61-7,64(m1H), 7,94-7,97(m,1H), 8,09-8,10(m,1H), 8,59-8,60(m,1H), 8,74(s,1H), 9,18-9,19(m,1H), 9,49(s,1H), 11,40(s,1H) ppm	373,1
28		1,76	RMN de ¹ H(D6-DMSO):1,14-1,17(M,2H); 1,24-1,26(m,2H), 3,15-3,22(m,1H), 7,98-8,00(m,1H), 8,08-8,15(m,2H); 8,83(s,1H), 9,20(s,1H), 9,38(s,1H), 9,52(s,1H), 11,7(s,1H) ppm	371,0
29		2,35		388,0
30		1,85	RMN de ¹ H(D6-DMSO):1,12-1,17(m,2H), 1,23-1,27(m,2H), 7,61-7,64(m,1H), 7,95-8,00(m2H), 8,08-8,11(m,2H), 8,28-8,32(m,1H), 8,59-8,60(m,1H), 8,75(s,1H), 9,17-9,18(m,1H), 9,48(s,1H), 11,80(s,1H) ppm	370,1

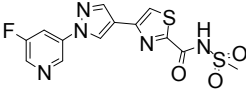
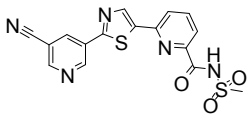
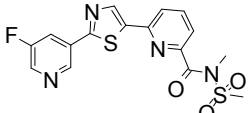
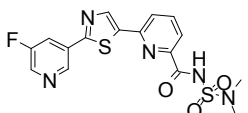
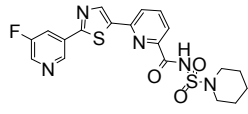
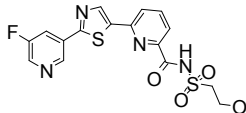
(continuación)

Número	Compuesto	logP (HCOOH)	Datos de RMN	Masa M ⁺ + 1
31		2,82	RMN de ¹ H(D6-DMSO): 7,38-7,42(m,3H), 7,74-7,88(m,5H), 8,32-8,36(m,1H), 8,39(s,1H), 8,56-8,58(m,1H), 9,10(s,1H), 9,18(s,1H) ppm	424,0
32		2,26	RMN de ¹ H(D6-DMSO): 7,42-7,43(m,3H), 7,55-7,59(m,1H), 7,76-7,89(m,5H), 8,31-8,34(m,1H), 8,38(s,1H), 8,54-8,56(m,1H), 9,14(s,1H), 9,17-9,18(m,1H) ppm	406,0
33		2,89	RMN de ¹ H(D6-DMSO): 4,48(s,2H), 7,24-7,34(m,5H), 7,72-7,90(m,3H), 8,33-8,36(m,1H), 8,46(s,1H), 8,57-8,58(m,2H), 9,11(s,1H), 9,25(s,1H) ppm	438,1
34		2,28	RMN de ¹ H(D6-DMSO): 4,44(s,2H), 7,24-7,34(m,5H), 7,72-7,83(m,3H), 8,47(s,1H), 9,16(s,1H), 9,24(s,1H), 9,41(s,2H) ppm	421,1
35		2,44	RMN de ¹ H(D6-DMSO): 4,48(s,2H), 7,24-7,34(m,5H), 7,57-7,60(m,1H), 7,73-7,84(m,3H), 8,32-8,35(m,1H), 8,42(s,1H), 8,55-8,57(m,1H), 9,19-9,20(m,2H) ppm	420,2

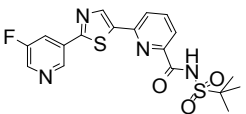
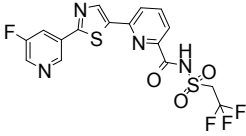
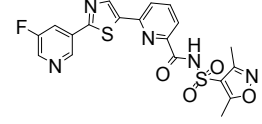
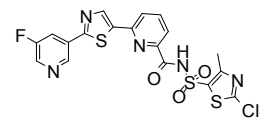
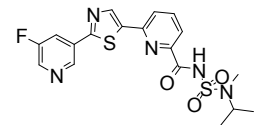
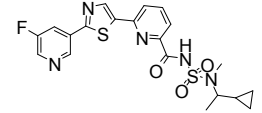
(continuación)

Número	Compuesto	logP (HCOOH)	Datos de RMN	Masa M ⁺ + 1
36 (EP G)		1,25	RMN de ¹ H(D6-DMSO): 3,38(s,3H), 7,48- 7,49(m,1H), 8,32- 8,35(m,1H), 8,45(s,1H), 8,56(s,1H), 8,59- 8,60(m,1H), 9,19- 9,20(m,1H), 9,34(s,1H) ppm	350,1
37		1,66	RMN de ¹ H(D6-DMSO): 8,33-8,37(m,1H), 8,46(s,1H), 8,51(s,1H), 8,61-8,62(m,1H), 9,11(s,1H), 9,39(s,1H) ppm	368,0
38		2,36	RMN de ¹ H(D6-DMSO): 1,15(t,6H), 3,44(c,4H), 7,94-7,96(m,1H), 8,06- 8,13(m,2H), 8,81(s,1H), 9,20(s,1H), 9,38(s,2H), 8,52(s,1H) ppm	402,1
39		2,98	RMN de ¹ H(D6-DMSO): 1,14(t,6H), 3,43(c,4H), 7,93-7,95(m,1H), 8,05- 8,12(m,2H), 8,27- 8,31(m,1H), 8,61- 8,62(m,1H), 8,77(s,1H), 9,10(s,1H), 9,50(s,1H) ppm	419,1
40		2,49	RMN de ¹ H(D6-DMSO): 1,14(t,6H), 3,42(c,4H), 7,60-7,64(m,1H), 7,91- 7,93(m,1H), 8,05- 8,07(m,2H), 8,29- 8,32(m,1H), 8,58- 8,60(m,1H), 8,71(s,1H), 9,18-9,19(m,1H), 9,46(s,1H) ppm	401,1
45		1,16	RMN de ¹ H(D6-DMSO): 3,20(s,1H), 7,59- 7,62(m,1H), 8,26(s,1H), 8,27-8,30(m,2H), 8,40(s,1H), 8,57- 8,58(m,1H), 9,13(s,1H), 9,14-9,15(m,1H) ppm	305,1

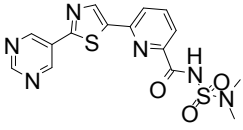
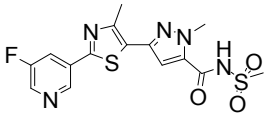
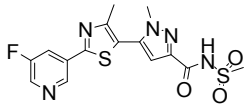
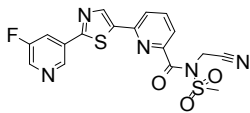
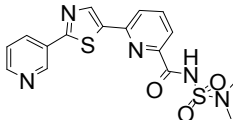
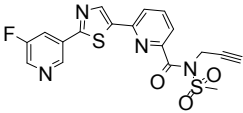
(continuación)

Número	Compuesto	logP (HCOOH)	Datos de RMN	Masa M ⁺ + 1
46 (EP H)		1,68	RMN de ¹ H(D6-DMSO): 2,99(s,3H), 7,96(s,1H), 8,33(s,1H), 8,34(s,1H), 8,55-8,57(m,1H), 9,10(s,1H), 9,12(s,1H) ppm	368,0
51		1,95	RMN de ¹ H (d6-DMSO) = 3,4 (s,3H), 8,02 (m,1H), 8,20 (m,1H), 8,33 (m,1H), 8,95 (m,2H), 9,15 (m,1H), 9,48 (m,1H), 11,80 (ancho,1H) ppm.	386,0
52		2,275	RMN de ¹ H (d6-DMSO) = 3,35 (s,3H), 3,57 (s,3H), 7,68 (m,1H), 8,12 (m,1H), 8,30 (m,2H), 8,72 (m,1H), 8,80 (m,1H), 9,11 (m,1H) ppm.	393,0
53		2,54	RMN de ¹ H (d6-DMSO) = 2,95 (s,6H), 8,00 (m,1H), 8,17 (m,1H), 8,35 (m,2H), 8,75 (m,1H), 8,95 (m,1H), 9,11 (m,1H), 11,5 (ancho,1H) ppm.	408,0
54		3,29	RMN de ¹ H (d6-DMSO) = 1,4-1,6 (m,6H), 3,2-3,4 (m,4H), 7,99 (m,1H), 8,18 (m,1H), 8,33 (m,2H), 8,75 (m,1H), 8,89 (m,1H), 9,12 (m,1H), 11,3 (ancho,1H) ppm.	448,0
55		2,19	RMN de ¹ H (d6-DMSO) = 3,15 (m,2H), 3,78 (m,2H), 7,97 (m,1H), 8,18 (m,1H), 8,33 (m,2H), 8,72 (m,1H), 8,90 (m,1H), 9,10 (m,1H), 11,7 (ancho,1H) ppm.	423,1

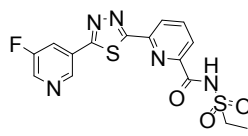
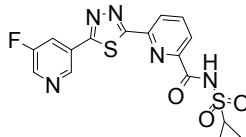
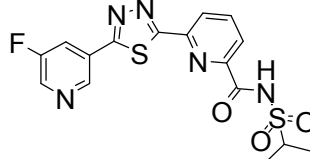
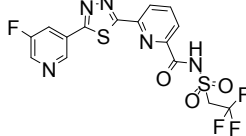
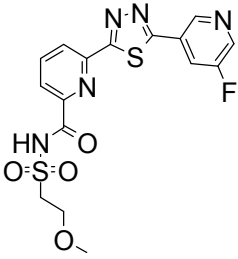
(continuación)

Número	Compuesto	logP (HCOOH)	Datos de RMN	Masa M ⁺ + 1
56		2,77	RMN de ¹ H (d6-DMSO) = 1,40 (s,9H), 7,90 (m,1H), 8,10 (m,1H), 8,30 (m,2H), 8,71 (m,1H), 8,85 (m,1H), 9,09 (m,1H), 11,0 (ancho,1H) ppm.	421,1
57		2,58	RMN de ¹ H (d6-DMSO) = 4,71 (m,2H), 7,99 (m,1H), 8,15 (m,1H), 8,33 (m,2H), 8,74 (m,1H), 8,88 (m,1H), 9,11 (m,1H) ppm.	447,0
58		3	RMN de ¹ H (d6-DMSO) = 2,69 (s,6H), 7,90 (m,1H), 8,05 (m,1H), 8,25 (m,1H), 8,33(m,1H), 8,71 (m,1H), 8,84 (m,1H), 9,11 (m,1H) ppm.	460,0
59		3,41	RMN de ¹ H (d6-DMSO) = 2,55 (s,3H), 7,91 (m,1H), 8,05 (m,1H), 8,25 (m,1H), 8,32 (m,1H), 8,71 (m,1H), 8,81 (m,1H), 9,10 (m,1H) ppm.	495,9
60		3,09	RMN de ¹ H (d6-DMSO) = 1,05 (d,6H), 2,85 (s,3H), 4,18 (m,1H), 7,98 (m,1H), 8,17 (m,1H), 8,32 (m,2H), 8,72 (m,1H), 8,90 (m,1H), 9,11 (m,1H) ppm.	436,0
61		3,47	RMN de ¹ H (d6-DMSO) = 0,3-1,2 (m,8H), 2,99 (s,3H), 3,30 (m,1H), 7,98 (m,1H), 8,16 (m,1H), 8,31 (m,2H), 8,72 (m,1H), 8,90 (m,1H), 9,11 (m,1H) ppm.	462,0

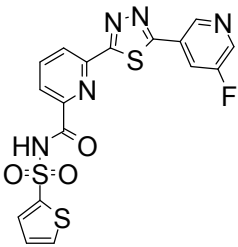
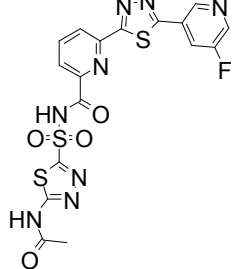
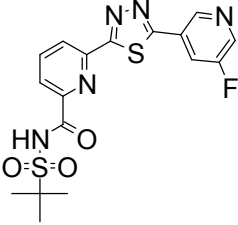
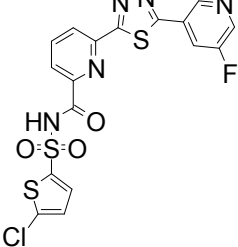
(continuación)

Número	Compuesto	logP (HCOOH)	Datos de RMN	Masa M ⁺ + 1
		1,9	RMN de ¹ H (d6-DMSO) = 2,95 (s,6H), 8,00 (m,1H), 8,17 (m,1H), 8,32 (m,1H), 8,95 (m,1H), 9,30 (m,1H), 9,40 (m,1H), 11,4 (m,1H) ppm.	391,0
63 (EP I)		2,04	RMN de ¹ H (d6-DMSO) = 2,55 (s,3H), 3,40 (s,3H), 4,12 (s,3H), 7,68 (m,1H), 8,12 (m,1H), 8,69 (m,1H), 9,01 (m,1H) ppm.	396,0
64		1,84	RMN de ¹ H (d6-DMSO) = 2,45 (s,3H), 3,25 (s,3H), 3,90 (s,3H), 7,12 (m,1H), 8,29 (m,1H), 8,72 (m,1H), 9,04 (m,1H) ppm.	396,0
65		2,28	RMN de ¹ H (d6-DMSO) = 3,71 (s,3H), 4,98 (s,2H), 7,70 (m,1H), 8,17 (m,1H), 8,35 (m,2H), 8,75 (m,1H), 8,85 (m,1H), 9,09 (m,1H) ppm.	418,1
66		2,01	RMN de ¹ H (d6-DMSO) = 2,93 (s,6H), 7,60 (m,1H), 8,00 (m,1H), 8,15 (m,1H), 8,32 (m,1H), 8,40 (m,1H), 8,73 (m,1H), 8,90 (m,1H), 9,23 (m,1H), 11,5 (ancho,1H) ppm.	390,0
68		2,56	RMN de ¹ H (d6-DMSO) = 3,65 (s,3H), 4,71 (s,2H), 7,70 (m,1H), 8,12 (m,1H), 8,32 (m,2H), 8,71 (m,1H), 8,81 (m,1H), 9,10 (m,1H) ppm.	417,0

(continuación)

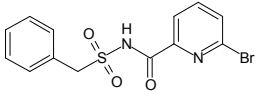
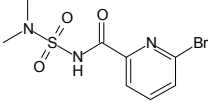
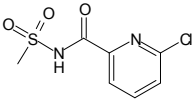
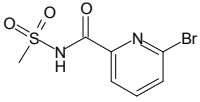
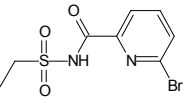
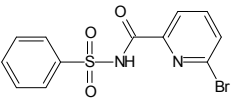
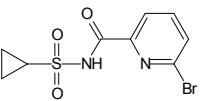
Número	Compuesto	logP (HCOOH)	Datos de RMN	Masa M ⁺ + 1
70		2,07	RMN de ¹ H (d6-DMSO)=1,3 (t,3H), 3,6 (m,2H), 8,2 (m,1H), 8,3 (m,1H) 8,45 (m,1H), 8,6 (m,1H) 8,85 (s,1H) 9,2 (s,1H) 12 (s,1H) ppm	393,4
71		2,14	RMN de ¹ H (d6-DMSO)=1,15 (m,2H), 1,25 (m,1,25), 3,15 (m,1H), 8,2 (m,1H), 8,3 (m,1H) 8,45 (m,1H), 8,6 (m,1H) 8,85 (s,1H) 9,2 (s,1H) 12 (s,1H) ppm	405
72		2,31	RMN de ¹ H (d6-DMSO)=1,35 (d,6H), 3,8 (m,1H), 8,2 (m,1H), 8,3 (m,1H) 8,45 (m,1H), 8,6 (m,1H) 8,85 (s,1H) 9,2 (s,1H) 12 (s,1H) ppm	407
73		2,42		447
74		1,97	RMN de ¹ H (d6-DMSO)=3,2 (m,3H), 3,75 (s,2H), 3,8 (m,2H) 8,2 (m,1H), 8,3 (m,1H), 8,5 (m,1H), 8,6 (m,1H) 8,85 (s,1H) 9,2 (s,1H) 12 (s,1H) ppm	423

(continuación)

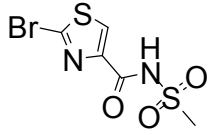
Número	Compuesto	logP (HCOOH)	Datos de RMN	Masa M ⁺ + 1
75		2,38		447
76		1,43		506
77		2,38		421
78		3,08		482

EP = Ejemplo de Preparación

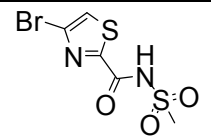
De acuerdo con los procedimientos de preparación descritos antes se obtuvieron los siguientes productos intermedios de fórmula (XII):

Número	Compuesto	logP (HCOOH)	Datos de RMN
XII-1		2,4	RMN de ^1H (D6-DMSO): 4,83 (s, 2H), 7,34-7,40 (m, 5H), 7,94-7,95 (m, 1H), 7,98-8,00 (m, 1H), 8,05-8,07 (m, 1H), 12,3 (s ancho, 1H)
XII-2		1,82	RMN de ^1H (D6-DMSO): 2,90(s,6H), 7,93-8,00(m,2H), 8,04-8,06(m,1H), 11,80(s,1H)
XII-3		1,15	RMN de ^1H (d6-DMSO): 3,33 (s,3H), 7,78 (m,1H), 8,05 (m,2H) ppm.
XII-4		1,28	RMN de ^1H (d6-DMSO): 3,37 (s,3H), 7,95 (m,2H), 8,06 (m,1H) ppm.
XII-5		1,54	RMN de ^1H (D6-DMSO): 1,27(t,3H), 3,50(c,2H), 7,94-8,01(m,2H), 8,05-8,07(m,1H), 11,90(s,1H)
XII-6		2,32	RMN de ^1H (DMSO): 7,57-7,70(m,3H), 7,84-8,01(m,5H)
XII-7		1,7	RMN de ^1H (D6-DMSO): 1,07-1,21(m,4H), 3,05-3,11(m,1H), 7,93-8,01(m,3H), 8,06-8,08(m,2H), 12,00(s,1H)

De acuerdo con los procedimientos de preparación descritos antes se obtuvieron los siguientes productos intermedios de fórmula (XV):

Número	Compuesto	logP (HCOOH)	Datos de RMN
XV-1		0,82	RMN de ¹ H (d6-DMSO): 3,33 (s, 3H), 8,61 (s, 1H), 12,00 (s, 1H)

5 De acuerdo con los procedimientos de preparación descritos antes se obtuvieron los siguientes productos intermedios de fórmula (XVI):

Número	Compuesto	logP (HCOOH)	Datos de RMN
XVI-1		0,63	RMN de ¹ H (d6-DMSO): 3,31(s,3H), 8,31(s,1H)

1) Descripción del procedimiento para determinar los valores logP (procedimiento del ácido fórmico)

10 La determinación de los valores de logP dados en la tabla se realizó de conformidad con la Directiva de la CEE 79/831 Anexo V.A8 por HPLC (Cromatografía Líquida de Alta Resolución) en una columna de fase inversa (C 18). Temperatura: 55 °C.

Eluyentes para la determinación en el intervalo ácido (pH 3,4):

Eluyente A: acetonitrilo + 1 ml de ácido fórmico/litro. Eluyente B: agua + 0,9 ml de ácido fórmico/litro.

Gradiente: desde el 10 % de eluyente A / 90 % de eluyente B hasta el 95 % de eluyente A / 5 % de eluyente B en 4,25 min.

15 La calibración se efectuó con alcan-2-onas no ramificadas (que tenían 3 a 16 átomos de carbono) con valores de logP conocidos (determinación de valores de logP por medio de los tiempos de retención por interpolación lineal entre dos alcanonas sucesivas). Los valores de lambda-máx se determinaron en el máximo de las señales cromatográficas por medio de los espectros UV de 200 nm a 400 nm.

2) Medición de los espectros de RMN

20 Los espectros de RMN se determinaron con un aparato Bruker Avance 400 provisto con un cabezal de sonda de flujo (volumen 60 µl). Como disolvente se usaron CD₃CN o d₆-DMSO, usándose tetrametilsilano (0,00 ppm) como referencia. En casos particulares, los espectros de RMN se determinaron con un aparato Bruker Avance II 600. Como disolvente se usaron CD₃CN o d₆-DMSO, usándose tetrametilsilano (0,00 ppm) como referencia.

25 La división de las señales se describió del siguiente modo: s (singlete), d (doblete), t (triplete), c (cuadruplete), quin (quintuplete), m (multiplete).

Ejemplos biológicos**Ensayo de Myzus (tratamiento de pulverización)**

	Disolvente:	78	partes en peso de acetona
		1,5	partes en peso de dimetilformamida
5	Emulsionante:	0,5	partes en peso de éter de alquilaril poliglicol

Para producir una preparación adecuada de principio activo se mezcla 1 parte en peso del principio activo con las cantidades establecidas de disolvente y emulsionante y se diluye el concentrado con agua que contiene emulsionante hasta la concentración deseada.

10 Discos de hojas de col china (*Brassica pekinensis*) infestadas con todos los estadios del pulgón verde del melocotonero (*Myzus persicae*) se rocían con una preparación del principio activo a la concentración deseada.

Después del tiempo deseado se determina la eficacia en %. A este respecto, el 100 % significa que todos los pulgones han muerto; el 0 % significa que ninguno de los pulgones ha muerto.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación exhibieron con una cantidad de aplicación de 500 g/ha, una eficacia del 80 %: 1, 10, 15, 21, 28, 62, 63

15 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación exhibieron con una cantidad de aplicación de 500 g/ha, una eficacia del 90 %: 5, 14, 23, 32, 34, 37, 38, 45, 47, 48, 65, 74

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación exhibieron con una cantidad de aplicación de 500 g/ha, una eficacia del 100 %: 2, 3, 4, 6, 7, 8, 9, 11, 12, 13, 16, 17, 18, 20, 22, 24, 25, 26, 27, 29, 30, 31, 33, 35, 36, 39, 40, 46, 51, 52, 53, 54, 55, 56, 57, 58, 59, 60, 61, 64, 66, 68, 70, 71, 72, 73, 75, 76, 77, 78.

20 **Ensayo de Tetranychus, resistente a OP (tratamiento por pulverización)**

	Disolvente:	78,0	partes en peso de acetona
		1,5	partes en peso de dimetilformamida
	Emulsionante:	0,5	partes en peso de éter de alquilaril poliglicol

25 Para producir una preparación adecuada de principio activo se mezcla 1 parte en peso del principio activo con las cantidades establecidas de disolvente y emulsionante, y se diluye el concentrado con agua que contiene emulsionante hasta la concentración deseada.

30 Discos de hojas de judía (*Phaseolus vulgaris*) infestadas con todos los estadios de la araña roja (*Tetranychus urticae*) se rocían con una preparación del principio activo a la concentración deseada. Después del tiempo deseado se determina la eficacia en %. A este respecto, el 100 % significa que todos los ácaros araña han muerto; el 0 % significa que ninguno de los ácaros araña ha muerto.

En este ensayo, por ejemplo, el siguiente compuesto de los ejemplos de preparación exhibió con una cantidad de aplicación de 500 g/ha, una eficacia del 100 %: 5.

Ensayo de Meloidogyne incognita

Disolvente: 80,0 partes en peso de acetona

35 Para producir una preparación adecuada de principio activo se mezcla 1 parte en peso del principio activo con las cantidades establecidas de disolvente, y se diluye el concentrado con agua hasta la concentración deseada.

Los vasos se llenan con arena, solución del principio activo, una suspensión de huevos/larvas de *Meloidogyne incognita* y semillas de lechuga. Las semillas de lechuga germinan y se desarrollan las plantas. Se desarrollan agallas en las raíces.

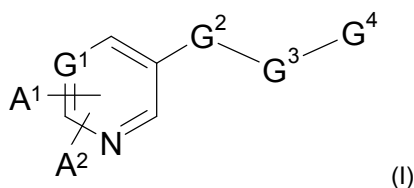
40 Después del tiempo deseado se determina la acción nematocida mediante la formación de agallas en %. A este respecto, el 100 % significa que no se encontraron agallas; el 0 % significa que el número de agallas sobre las plantas tratadas corresponde al control no tratado.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación exhibieron con una cantidad de aplicación de 20 ppm, una eficacia del 100 %: 56, 70, 75, 78.

45

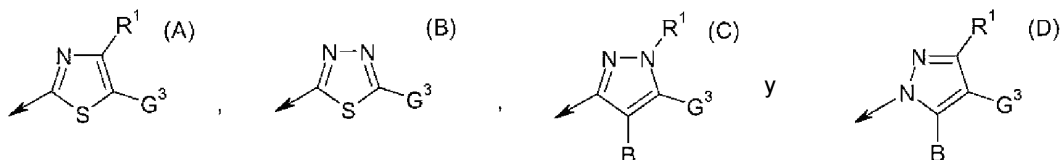
REIVINDICACIONES

1. Compuestos de fórmula (I)

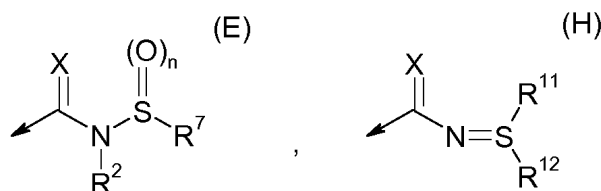


en la que

- 5 A¹ y A² independientemente entre sí representan hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ o alcoxi C₁-C₆,
 G¹ representa N o C-A¹ y
 G² representa un resto de la serie



- 10 en la que la flecha marca el enlace al anillo adyacente,
 R¹ en el caso de los heterociclos (A) y (D) representa hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆ o haloalquilo-C₁-C₆,
 R¹ en el caso del heterociclo (C) representa hidrógeno, alquilo-C₁-C₆ o haloalquilo-C₁-C₆,
 B representa hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo-C₁-C₆, haloalquilo-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆ o cicloalquilo-C₃-C₆,
 15 G³ representa heteroarilo de 5 miembros o heteroarilo de 6 miembros en cada caso dado el caso sustituidos con halógeno, ciano, nitro, amino, alquilamino-C₁-C₆, dialquilamino-C₁-C₆, alquilo-C₁-C₆, cicloalquilo-C₃-C₆, haloalquilo-C₁-C₆, hidroxilo, alcoxi-C₁-C₆, haloalcoxi-C₁-C₆, alquiltio-C₁-C₆, alquilcarbonilo-C₁-C₆, alcocarbonilo-C₁-C₆, alquenilo-C₂-C₆ o alquinilo-C₂-C₆,
 G⁴ representa un resto de la serie



- 20 X representa oxígeno o azufre,
 n representa 1 o 2,
 R² representa un resto de la serie de hidrógeno, alquilo-C₁-C₆, haloalquilo-C₁-C₆, ciano-alquilo-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆, haloalcoxi-C₁-C₆, alquenilo-C₂-C₆, alquinilo-C₂-C₆, alcoxi-C₁-C₆, alquilo-C₁-C₆ y alquilcarbonilo-C₁-C₆ y alquilsulfonilo-C₁-C₆ en cada caso dado el caso sustituidos con halógeno, alcocarbonilo-C₁-C₆ sustituido dado el caso con halógeno, cicloalquilcarbonilo-C₃-C₆ dado el caso sustituido con halógeno, alquilo-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆, haloalquilo-C₁-C₆ y ciano, o representa un ion metálico mono o divalente o un ion amonio dado el caso sustituido con alquilo-C₁-C₆ o arilo C₁-C₆,
 30 R⁷ representa un resto de la serie de alquilo-C₁-C₆, alquenilo-C₂-C₆ y alquinilo-C₂-C₆ en cada caso dado el caso sustituidos con halógeno, alcoxi-C₁-C₆, haloalcoxi-C₁-C₆, alquiltio-C₁-C₆, haloalquiltio-C₁-C₆, alquilsulfino-C₁-C₆, haloalquilsulfino-C₁-C₆, alquilsulfonilo-C₁-C₆, haloalquilsulfonilo-C₁-C₆, y cicloalquilo-C₃-C₆, cicloalquil-C₃-C₆-alquilo-C₁-C₆ y cicloalquenilo-C₃-C₆ en cada caso dado el caso sustituidos con halógeno, alquilo-C₁-C₆, haloalquilo-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆ o haloalcoxi-C₁-C₆, en los que los anillos pueden contener al menos un heteroátomo de la serie de azufre, oxígeno (en la que los átomos de oxígeno no deben estar directamente adyacentes) y nitrógeno, arilo, heteroarilo, aril-alquilo-C₁-C₆ y heteroaril-alquilo-C₁-C₆ en cada caso dado el caso sustituidos con halógeno, ciano (también en el resto alquilo), nitro, alquilo-C₁-C₆, haloalquilo-C₁-C₆, cicloalquilo-C₃-C₆, alcoxi-C₁-C₆, haloalcoxi-C₁-C₆, alquiltio-C₁-C₆, haloalquiltio-C₁-C₆, alquilsulfino-C₁-C₆, haloalquilsulfino-C₁-C₆, alquilsulfonilo-C₁-C₆, haloalquilsulfonilo-C₁-C₆, amino, alquilamino-C₁-C₆, di(alquil-C₁-C₆)amino, alquilcarbonilamino-C₁-C₆, alcocarbonilamino-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆-alquilo-C₁-C₆, haloalcoxi-C₁-C₆-alquilo-C₁-C₆, alquenilo-C₂-C₆, alquinilo-C₂-C₆, cicloalquil-C₃-C₆-alquilo-C₁-C₆, alquilcarbonilo-C₁-C₆, alcocarbonilo-C₁-C₆ o aminocarbonilo, o representa NR'R'', en donde R' y R'' independientemente entre sí en cada caso representan

un resto de la serie de hidrógeno, alquilo-C₁-C₆, haloalquilo-C₁-C₆, cicloalquilo-C₃-C₆, cicloalquil-C₃-C₆-alquilo-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆, alquilcarbonilo-C₁-C₆ y alcoxicarbonilo-C₁-C₆,

R² y R⁷ pueden también formar, junto con el grupo N-S(O)_n al que están unidos, un anillo de 5 a 7 miembros saturado o insaturado y dado el caso sustituido con halógeno, alquilo-C₁-C₆, haloalquilo-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆, haloalcoxi-C₁-C₆, que puede contener uno o más heteroátomos adicionales de la serie de azufre, oxígeno (en la que los átomos de oxígeno no deben estar directamente adyacentes) y nitrógeno y/o al menos un grupo carbonilo,

R¹¹ y R¹² independientemente entre sí representan un resto de la serie de alquilo-C₁-C₆, alqueno-C₂-C₆, alquinilo-C₂-C₆, fenilo y fenil-alquilo-C₁-C₆, en cada caso dado el caso sustituido con halógeno, alquilo-C₁-C₆, haloalquilo-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆, haloalcoxi-C₁-C₆,

y en la que

halógeno se selecciona de la serie de flúor, cloro, bromo y yodo, arilo (también como parte de una unidad mayor, como por ejemplo arilalquilo) se selecciona de la serie de fenilo, naftilo, antrilo, fenantrenilo, hetarilo (sinónimo de heteroarilo, también como parte de una unidad mayor, como por ejemplo hetarilalquilo) se selecciona de la serie de furilo, tienilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 1,2,3-oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo, 1,2,3-tiadiazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo, benzofurilo, benzoisofurilo, benzotienilo, benzoisotienilo, indolilo, isoindolilo, indazolilo, benzotiazolilo, benzoisotiazolilo, benzoxazolilo, benzoisoxazolilo, bencimidazolilo, 2,1,3-benzoxadiazol, quinolinilo, isoquinolinilo, cinnolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, naftiridinilo, benzotriazinilo, purinilo, pteridinilo e indolizínilo, así como sales y N-óxidos de los compuestos de fórmula (I).

2. Compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1, en la que

G³ representa pirazolilo, oxazolilo, tiazolilo, oxadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridacínilo, piramidínilo, pirazinilo o triazinilo en cada caso dado el caso sustituidos con halógeno, ciano, nitro, amino, alquilamino C₁-C₆, di-alquilamino C₁-C₆, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo-C₃-C₆, haloalquilo-C₁-C₆, hidroxilo, alcoxi-C₁-C₆, haloalcoxi-C₁-C₆, alquiltio-C₁-C₆, alquilcarbonilo-C₁-C₆, alcoxicarbonilo-C₁-C₆, alqueno-C₂-C₆ o alquinilo-C₂-C₆,

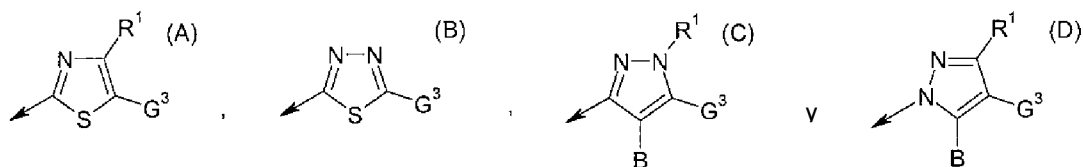
3. Compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1, en la que

A¹ representa hidrógeno, halógeno o ciano,

A² representa hidrógeno,

G¹ representa N o C-A¹,

G² representa un resto de la serie



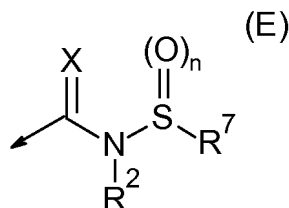
en la que la flecha marca el enlace al anillo adyacente.

R¹ representa hidrógeno o alquilo-C₁-C₄,

B representa hidrógeno,

G³ representa heteroarilo de 5 miembros o heteroarilo de 6 miembros en cada caso dado el caso sustituidos con halógeno, ciano, nitro, amino, alquilamino-C₁-C₆, dialquilamino-C₁-C₆, alquilo-C₁-C₆, cicloalquilo-C₃-C₆, haloalquilo-C₁-C₆, hidroxilo, alcoxi-C₁-C₆, haloalcoxi-C₁-C₆, alquiltio-C₁-C₆, alquilcarbonilo-C₁-C₆, alcoxicarbonilo-C₁-C₆, alqueno-C₂-C₆ o alquinilo-C₂-C₆,

G⁴ representa el resto



en el que la flecha marca el enlace a G³,

X representa oxígeno,

n representa 2,

R² representa un resto de la serie de hidrógeno, alquilo-C₁-C₄, alquinilo-C₂-C₄, ciano-alquilo-C₁-C₄ y alcoxi-C₁-C₄-alquilo-C₁-C₄, y alquilcarbonilo-C₁-C₄ o alquilsulfonilo-C₁-C₄ dado el caso sustituidos con halógeno,

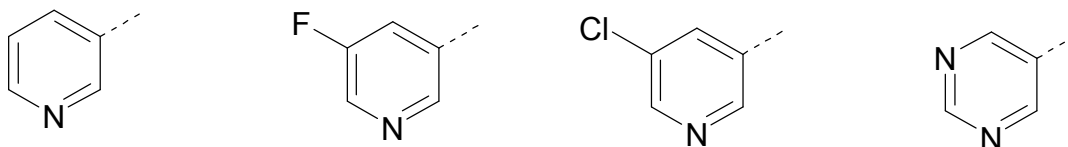
alcoxicarbonilo-C₁-C₄ dado el caso sustituido con halógeno, cicloalquilcarbonilo-C₃-C₆ dado el caso sustituido con halógeno, alquilo-C₁-C₄, alcoxi-C₁-C₄, haloalquilo-C₁-C₄ y ciano, o representa un ion metálico mono o divalente, o un ion amonio dado el caso sustituido con alquilo-C₁-C₄ o aril-alquilo C₁-C₄.

5 R⁷ representa un resto de la serie de alquilo-C₁-C₄, alqueno-C₂-C₄ y alquino-C₂-C₄ en cada caso dado el caso sustituidos con halógeno, alcoxi-C₁-C₄, haloalcoxi-C₁-C₄, alquiltio-C₁-C₄, haloalquiltio-C₁-C₄, alquilsulfinilo-C₁-C₄, haloalquilsulfinilo-C₁-C₄, alquilsulfonilo-C₁-C₄ y haloalquilsulfonilo-C₁-C₄, y cicloalquilo-C₃-C₆, cicloalquil-C₃-C₆-alquilo-C₁-C₄, cicloalqueno-C₃-C₄ en cada caso dado el caso sustituidos con halógeno, alquilo-C₁-C₄, haloalquilo-C₁-C₄, alcoxi-C₁-C₄ o haloalcoxi-C₁-C₄, en los que los anillos pueden contener al menos un heteroátomo de la serie de azufre, oxígeno (en donde los átomos de oxígeno no deben estar directamente adyacentes) y nitrógeno, arilo, heteroarilo, aril-alquilo-C₁-C₄ y heteroaril-alquilo-C₁-C₄ en cada caso dado el caso sustituidos con halógeno, y ciano (también en el resto alquilo), nitro, alquilo-C₁-C₄, haloalquilo-C₁-C₄, cicloalquilo-C₃-C₆, alcoxi-C₁-C₄, haloalcoxi-C₁-C₄, alquiltio-C₁-C₄, haloalquiltio-C₁-C₄, alquilsulfinilo-C₁-C₄, haloalquilsulfinilo-C₁-C₄, alquilsulfonilo-C₁-C₄, haloalquilsulfonilo-C₁-C₄, amino, alquilamino-C₁-C₄, di(alquil-C₁-C₄)amino, alquilcarbonilamino-C₁-C₄, alcoxicarbonilamino-C₁-C₄, alcoxi-C₁-C₄-alquilo-C₁-C₄, haloalcoxi-C₁-C₄-alquilo-C₁-C₄, alqueno-C₂-C₄, alquino-C₂-C₄, cicloalquil-C₃-C₆-alquilo-C₁-C₄, alquilcarbonilo-C₁-C₄, alcoxicarbonilo-C₁-C₄ o aminocarbonilo, o representa NR'R'' en donde R' y R'' independientemente entre sí en cada caso representan un resto de la serie de hidrógeno, alquilo-C₁-C₄ y cicloalquil-C₃-C₆-alquilo-C₁-C₄,

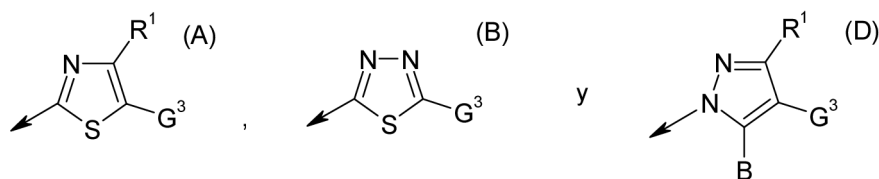
20 y en la que halógeno se selecciona de la serie de flúor, cloro, bromo y yodo, arilo (también como parte de una unidad mayor, como por ejemplo arilalquilo) se selecciona de la serie de fenilo, naftilo, antrilo, fenantrenilo y hetarilo (también como parte de una unidad mayor, como por ejemplo hetarilalquilo) se selecciona de la serie de piridilo, pirimidilo, oxadiazolilo, oxazolilo, pirazinilo, imidazolilo, tiazolilo, tiadiazolilo y furanilo.

4. Compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1, en la que

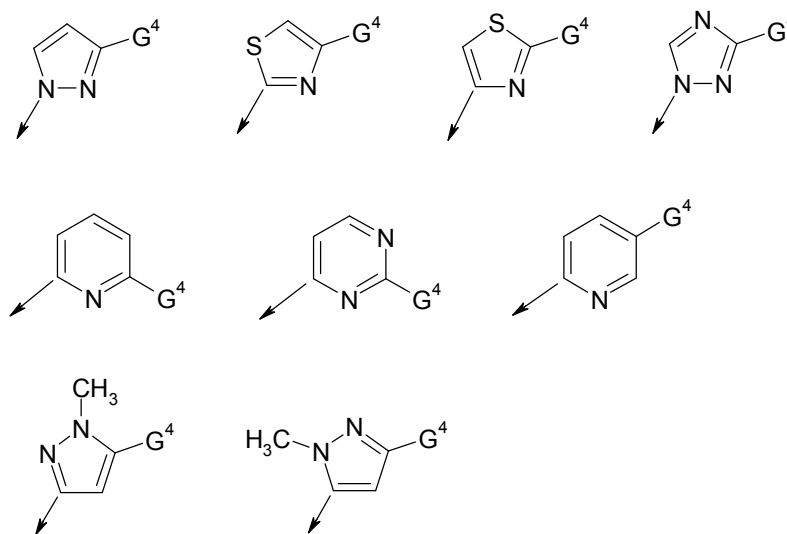
25 A¹ representa un resto de la serie de hidrógeno, flúor y cloro,
A² representa hidrógeno,
G¹ representa N o C-A¹, que lleva a compuestos que contienen los siguientes elementos estructurales:



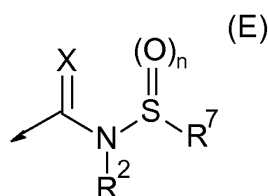
en donde la línea discontinua quiere decir el enlace a G²,
G² representa un resto de la serie



30 en la que la flecha, en cada caso, marca el enlace al anillo adyacente.
R¹ representa hidrógeno o metilo.
B representa hidrógeno.
G³ representa un resto dado el caso sustituido con halógeno, ciano, metilo, metoxi, trifluorometilo, amino o dimetilamino de la serie

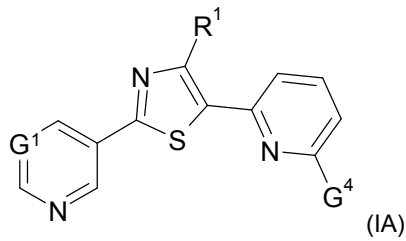


en la que la flecha, en cada caso, marca el enlace a G^2 , y G^4 también se muestra para ilustración, G^4 representa el resto



- 5 en donde la flecha marca el enlace a G^3 ,
 X representa oxígeno.
 n representa 2,
 R^2 representa un resto de la serie de hidrógeno, alquilo- C_1-C_4 , alquinilo- C_2-C_4 , ciano-alquilo- C_1-C_4 y alcoxi- C_1-C_4 -
 alquilo- C_1-C_4 , y alquilcarbonilo- C_1-C_4 o alquilsulfonilo- C_1-C_4 sustituidos dado el caso con halógeno, y
 10 alcocarbonilo- C_1-C_4 sustituido dado el caso con halógeno, y cicloalquilcarbonilo- C_3-C_6 dado el caso sustituido
 con halógeno, alquilo- C_1-C_4 , alcoxi- C_1-C_4 , haloalquilo- C_1-C_4 y ciano, o representa un ion metálico mono o
 divalente, o un ion amonio dado el caso sustituido con alquilo- C_1-C_4 o aril-alquilo C_1-C_4 ,
 R^7 representa un resto de la serie de alquilo- C_1-C_4 , alqueno- C_2-C_4 y alquinilo- C_2-C_4 en cada caso dado el caso
 15 sustituidos con halógeno, alcoxi- C_1-C_4 , haloalcoxi- C_1-C_4 , alquiltio- C_1-C_4 , haloalquiltio- C_1-C_4 , alquilsulfonilo- C_1-C_4 ,
 haloalquilsulfonilo- C_1-C_4 , alquilsulfonilo- C_1-C_4 y haloalquilsulfonilo- C_1-C_4 , y cicloalquilo- C_3-C_6 , cicloalquil- C_3-C_6 -
 alquilo- C_1-C_4 , cicloalqueno- C_3-C_4 en cada caso dado el caso sustituidos con halógeno, alquilo- C_1-C_4 ,
 20 haloalquilo- C_1-C_4 , alcoxi- C_1-C_4 o haloalcoxi- C_1-C_4 , en los que los anillos pueden contener al menos un
 heteroátomo de la serie de azufre, oxígeno (en donde los átomos de oxígeno no deben estar directamente
 adyacentes) y nitrógeno, y arilo, heteroarilo, aril-alquilo C_1-C_4 y heteroaril-alquilo- C_1-C_4 en cada caso dado el
 caso sustituidos con halógeno, ciano (también en la parte alquilo), nitro, alquilo- C_1-C_4 , haloalquilo- C_1-C_4 ,
 cicloalquilo- C_3-C_6 , alcoxi- C_1-C_4 , haloalcoxi- C_1-C_4 , alquiltio- C_1-C_4 , haloalquiltio- C_1-C_4 , alquilsulfonilo- C_1-C_4 ,
 haloalquilsulfonilo- C_1-C_4 , alquilsulfonilo- C_1-C_4 , haloalquilsulfonilo- C_1-C_4 , amino, alquilamino- C_1-C_4 , di(alquil- C_1 -
 C_4)amino, alquilcarbonilamino- C_1-C_4 , alcocarbonilamino- C_1-C_4 , alcoxi- C_1-C_4 -alquilo- C_1-C_4 , haloalcoxi- C_1-C_4 -
 25 alquilo- C_1-C_4 , alqueno- C_2-C_4 , alquinilo- C_2-C_4 , cicloalquil- C_3-C_6 -alquilo- C_1-C_4 , alquilcarbonilo- C_1-C_4 ,
 alcocarbonilo- C_1-C_4 o aminocarbonilo, o representa $NR'R''$, en donde R' y R'' independientemente entre sí en
 cada caso representan un resto de la serie de hidrógeno y alquilo- C_1-C_4 , y en donde halógeno se selecciona de
 la serie de flúor, cloro y bromo, arilo representa fenilo y
 30 hetarilo (equivalente a heteroarilo, también como parte de una unidad mayor, como por ejemplo hetarilalquilo)
 representa un resto seleccionado de la serie de pirazolilo, oxazolilo, tiazolilo, piridilo, pirimidinilo, pirazinilo y
 pirazinilo.

5. Compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1, en donde los compuestos de fórmula (I) son compuestos de fórmula (IA)

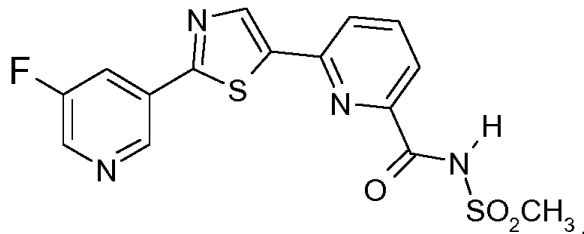


en la que

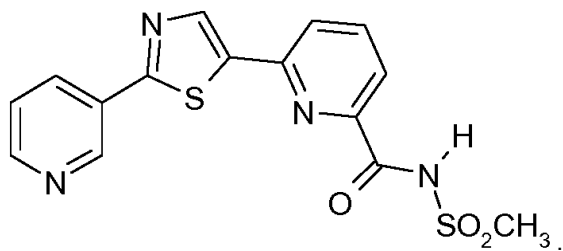
G¹ representa C-H, C-F, C-Cl o N,
R¹ representa hidrógeno o metilo y

5 G⁴ representa el resto (E) especificado en la reivindicación 1.

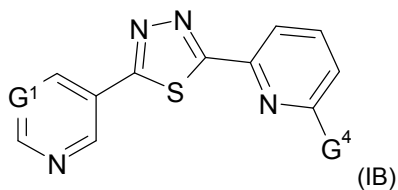
6. Compuesto de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1, en donde el compuesto de fórmula (I) es el compuesto de fórmula



7. Compuesto de fórmula de acuerdo con la reivindicación 1, en donde el compuesto de fórmula (I) es el compuesto de fórmula



8. Compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1, en donde los compuestos de fórmula (I) son compuestos de fórmula (IB)

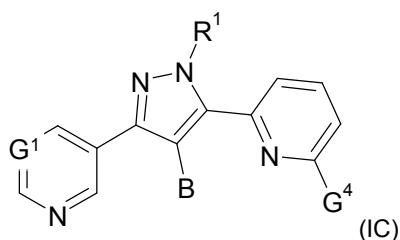


15 en la que

G¹ representa C-H, C-F, C-Cl o N y
G⁴ representa el resto (E) especificado en la reivindicación 1.

9. Compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1, en donde los compuestos de fórmula (I) son compuestos de fórmula (IC)

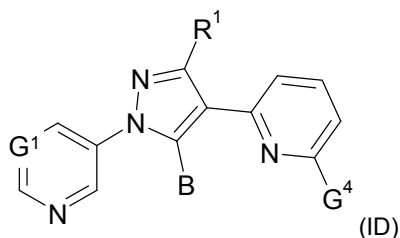
20



en la que

- 5 G¹ representa C-H, C-F, C-Cl o N,
 R¹ representa hidrógeno o metilo,
 B representa hidrógeno y
 G⁴ representa el resto (E) especificado en la reivindicación 1.

10. Compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1, en donde los compuestos de fórmula (I) son compuestos de fórmula (ID)



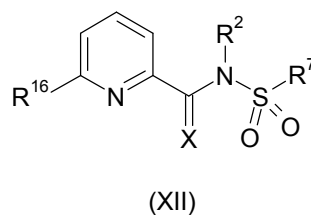
10 en la que

- G¹ representa es C-H, C-F, C-Cl o N,
 R¹ representa hidrógeno o metilo,
 B representa hidrógeno y
 G⁴ representa el resto (E) especificado en la reivindicación 1.

15 11. Agente, **caracterizado por** un contenido de al menos un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 9.

12. Procedimiento para controlar plagas, **caracterizado porque** se deja actuar sobre las plagas y/o su hábitat un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 10 o un agente de acuerdo con la reivindicación 11, excluyéndose el procedimiento en el cuerpo animal o humano.

20 13. Compuestos de fórmula (XII)

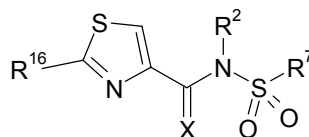


en la que

- R¹⁶ representa flúor, cloro, bromo o yodo,
 X y R² tienen los significados indicados en la reivindicación 1 y
 25 R⁷ representa un resto de la serie de alquilo-C₁-C₆, alqueno-C₂-C₆ y alquino-C₂-C₆ en cada caso dado el caso sustituidos con halógeno, alcoxi-C₁-C₆, haloalcoxi-C₁-C₆, alquiltio-C₁-C₆, haloalquiltio-C₁-C₆, alquilsulfino-C₁-C₆, haloalquilsulfino-C₁-C₆, alquilsulfonilo-C₁-C₆ y haloalquilsulfonilo-C₁-C₆, y cicloalquilo-C₃-C₆, cicloalquil-C₃-C₆-alquilo-C₁-C₆ y cicloalqueno-C₃-C₆ en cada caso dado el caso sustituidos con halógeno, alquilo-C₁-C₆, haloalquilo-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆ o haloalcoxi-C₁-C₆, en los que los anillos pueden contener al menos un heteroátomo de la serie de azufre, oxígeno (en la que los átomos de oxígeno no deben estar directamente adyacentes) y nitrógeno, heteroarilo y heteroaril-alquilo-C₁-C₆ en cada caso dado el caso sustituidos con halógeno, ciano (también en la parte alquilo), nitro, alquilo-C₁-C₆, haloalquilo-C₁-C₆, cicloalquilo-C₃-C₆, alcoxi-C₁-C₆, haloalcoxi-C₁-C₆, alquiltio-C₁-C₆, haloalquiltio-C₁-C₆, alquilsulfino-C₁-C₆, haloalquilsulfino-C₁-C₆, alquilsulfonilo-C₁-C₆, haloalquilsulfonilo-C₁-C₆, amino, alquilamino-C₁-C₆, di(alquil-C₁-C₆)amino,
- 30

5 alquilcarbonilamino-C₁-C₆, alcoxicarbonilamino-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆-alquilo-C₁-C₆, haloalcoxi-C₁-C₆-alquilo-C₁-C₆, alqueno-C₂-C₆, alquino-C₂-C₆, cicloalquil-C₃-C₆-alquilo-C₁-C₆, alquilcarbonilo-C₁-C₆, alcoxicarbonilo-C₁-C₆ o aminocarbonilo, o representa NR'R'', en donde R' y R'' independientemente entre sí en cada caso representan un resto de la serie de hidrógeno, alquilo-C₁-C₆, haloalquilo-C₁-C₆, cicloalquilo-C₃-C₆, cicloalquil-C₃-C₆-alquilo-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆, alquilcarbonilo-C₁-C₆ y alcoxicarbonilo-C₁-C₆, y en donde heteroarilo tiene los significados indicados en la reivindicación 1.

14. Compuestos de fórmula (XV)

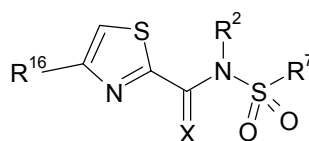


(XV)

en la que

10 R¹⁶ representa flúor, cloro, bromo o yodo y
 X y R² y R⁷ tienen los significados indicados en la reivindicación 1 y
 R⁷ representa un resto de la serie de alquilo-C₁-C₆, alqueno-C₂-C₆ y alquino-C₂-C₆ en cada caso dado el caso
 sustituidos con halógeno, alcoxi-C₁-C₆, haloalcoxi-C₁-C₆, alquiltio-C₁-C₆, haloalquiltio-C₁-C₆, alquilsulfino-C₁-C₆,
 15 haloalquilsulfino-C₁-C₆, alquilsulfono-C₁-C₆ y haloalquilsulfono-C₁-C₆, y cicloalquilo-C₃-C₆, cicloalquil-C₃-C₆-
 alquilo-C₁-C₆ y cicloalqueno-C₃-C₆ en cada caso dado el caso sustituidos con halógeno, alquilo-C₁-C₆,
 haloalquilo-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆ o haloalcoxi-C₁-C₆, en los que los anillos pueden contener al menos un
 heteroátomo de la serie de azufre, oxígeno (en donde los átomos de oxígeno no deben estar directamente
 adyacentes)
 y nitrógeno, y heteroarilo, aril-alquilo C₁-C₆ y heteroaril-alquilo-C₁-C₆ en cada caso dado el caso sustituidos con
 20 halógeno, ciano (también en la parte alquilo), nitro, alquilo-C₁-C₆, haloalquilo-C₁-C₆, cicloalquilo-C₃-C₆, alcoxi-C₁-
 C₆, haloalcoxi-C₁-C₆, alquiltio-C₁-C₆, haloalquiltio-C₁-C₆, alquilsulfino-C₁-C₆, haloalquilsulfino-C₁-C₆,
 alquilsulfono-C₁-C₆, haloalquilsulfono-C₁-C₆, amino, alquilamino-C₁-C₆, di(alquil-C₁-C₆)amino,
 alquilcarbonilamino-C₁-C₆, alcoxicarbonilamino-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆-alquilo-C₁-C₆, haloalcoxi-C₁-C₆-alquilo-C₁-C₆,
 25 alqueno-C₂-C₆, alquino-C₂-C₆, cicloalquil-C₃-C₆-alquilo-C₁-C₆, alquilcarbonilo-C₁-C₆, alcoxicarbonilo-C₁-C₆ o
 aminocarbonilo, o representa NR'R'', en donde R' y R'' independientemente entre sí en cada caso representan
 un resto de la serie de hidrógeno, alquilo-C₁-C₆, haloalquilo-C₁-C₆, cicloalquilo-C₃-C₆, cicloalquil-C₃-C₆-alquilo-C₁-
 C₆, alcoxi-C₁-C₆, alquilcarbonilo-C₁-C₆ y alcoxicarbonilo-C₁-C₆, y en donde arilo y heteroarilo tienen los
 significados indicados en la reivindicación 1.

15. Compuestos de fórmula (XVI)



(XVI)

30

en la que

R¹⁶ representa flúor, cloro, bromo o yodo y
 X y R² y R⁷ tienen los significados indicados en la reivindicación 1.