

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 980 245**

51 Int. Cl.:

C07D 471/04 (2006.01)

A01N 43/50 (2006.01)

A61P 17/00 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **24.02.2020 PCT/EP2020/054747**

87 Fecha y número de publicación internacional: **03.09.2020 WO20173861**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **24.02.2020 E 20707065 (7)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **20.03.2024 EP 3931192**

54 Título: **Derivados heterociclos bicíclicos condensados como plaguicida**

30 Prioridad:

26.02.2019 EP 19159323

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

30.09.2024

73 Titular/es:

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

72 Inventor/es:

**FISCHER, RÜDIGER;
WILLOT, MATTHIEU;
HAGER, DOMINIK;
HOFFMEISTER, LAURA;
ILG, KERSTIN;
LÖSEL, PETER y
ZHERSH, SERGEY**

74 Agente/Representante:

GONZÁLEZ PECES, Gustavo Adolfo

ES 2 980 245 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

Derivados heterociclos bicíclicos condensados como plaguicida

La invención aquí presente se refiere a nuevos derivados heterociclos, bicíclicos condensados de la Fórmula (I), a su aplicación como acaricidas y/o insecticidas para combatir plagas animales, ante todo, artrópodos y especialmente insectos y arácnidos y procedimientos e intermedios para su fabricación.

Los derivados heterociclos bicíclicos condensados con propiedades insecticidas ya fueron descritos en la bibliografía, p. ej., en WO 2010/125985, WO 2012/074135, WO 2012/086848, WO 2013/018928, WO 2013/191113, WO 2014/142292, WO 2014/148451, WO 2015/000715, WO 2015/121136, WO 2015/198859, WO 2015/133603, WO 2015/198859, WO 2015/002211, WO 2015/071180, WO 2015/091945, WO 2016/005263, WO 2015/198817, WO 2016/124563, WO 2016/124557, WO 2016/091731, WO 2016/039444, WO 2016/041819, WO 2016/039441, WO 2016/026848, WO 2016/023954, WO 2016/020286, WO 2016/046071, WO2016/091731, WO2016/107742, WO2016/129684, WO2016/142326, 2017/072039, WO2017/026384, WO2017/061497, WO2017/146220, WO2017/155103, WO2018/084142, WO2018/105632.

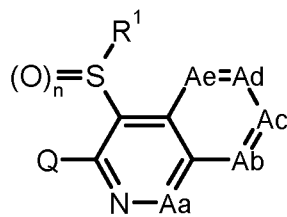
Los productos fitosanitarios deben cumplir muchos requisitos, por ejemplo, en referencia a su grado, duración y alcance de su eficacia y uso posible. Son importantes las cuestiones relativas a la toxicidad, la protección de insectos beneficiosos y polinizadores, las características ambientales, las cantidades utilizadas, las posibilidades de combinación con otros principios activos o ayudas de formulación, al igual que el esfuerzo que debe realizarse para la síntesis del principio activo, además de las resistencias que pueden producirse, para nombrar solo algunos parámetros. Debido a todos estos motivos, la búsqueda de nuevos productos fitosanitarios no debe considerarse finalizada, y existe la constante necesidad de nuevos compuestos frente a los compuestos ya conocidos, al menos en referencia a los aspectos particulares de las propiedades mejoradas.

La tarea de la presente invención consistía en disponer compuestos a través de los cuales se pueda ampliar el espectro de los plaguicidas de acuerdo con determinados aspectos y/o mejorar su actividad.

Ahora, se descubrieron nuevos derivados heterociclos bicíclicos condensados, que frente a los compuestos ya conocidos presentan ventajas, p. ej., con mejores propiedades biológicas o ecológicas, métodos de aplicación más amplios, una mejor acción insecticida y acaricida, además de una buena tolerancia frente a las plantas útiles, por citar algunos ejemplos. Los derivados heterociclos pueden utilizarse en combinación con otros recursos para mejorar la eficacia, especialmente contra insectos difíciles de combatir.

Los pasajes que se relacionan con procedimientos para el tratamiento quirúrgico o terapéutico del cuerpo humano o animal no son objeto de la invención.

El objeto de la presente invención es, entonces, nuevos compuestos de la Fórmula (I)



(I)

en la que (realización 1-1)

Aa significa nitrógeno o =C(R⁷)-,

Ab significa nitrógeno o =C(R⁸)-,

Ac significa nitrógeno o =C(R⁹)-,

Ad significa nitrógeno o =C(R¹⁰)-,

Aa significa nitrógeno o = C (R¹¹),

a lo cual, Ab, Ac, Ad y Ae no pueden representar simultáneamente nitrógeno,

R¹ se refiere a (C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)halógeno alquilo, (C₂-C₆)alqueno, (C₂-C₆)halógenoalqueno, (C₂-C₆)alquino, (C₂-C₆)halógenoalquino, (C₃-C₈)cicloalquilo, halógeno(C₃-C₈)cicloalquilo, (C₃-C₈)cicloalquilo-(C₁-C₆)alquilo, (C₃-C₈)cicloalquilo-(C₁-C₆)halógeno alquilo, (C₁-C₆)alquilo-(C₃-C₈)cicloalquilo, (C₁-C₆)halógeno alquilo-(C₃-C₈)cicloalquilo, (C₃-C₈)cicloalquilo-(C₃-C₈)cicloalquilo, espiro-(C₃-C₈)cicloalquilo-(C₃-

Además, se descubrió que los compuestos de la Fórmula (I) tienen una muy buena eficacia como plaguicida, preferentemente como insecticida y/o acaricida; por lo general, también son muy bien toleradas por las plantas, especialmente frente a las plantas de cultivo.

5 Los compuestos acordes a la invención se definen en forma general por la Fórmula (I). En lo sucesivo, se explican los sustituyentes preferentes o las áreas de los radicales indicados en las Fórmulas mencionadas más arriba y a continuación.

Realización 2-1

Aa se refiere preferentemente al nitrógeno o =C(R⁷)-,

Ab se refiere preferentemente al nitrógeno o =C(R⁸)-,

10 Ac se refiere preferentemente al nitrógeno o =C(R⁹)-,

Ad se refiere preferentemente al nitrógeno o =C(R¹⁰)-,

Ae se refiere preferentemente al nitrógeno o =C(R¹¹)-,

a lo cual, Ab, Ac, Ad y Ae no pueden representar simultáneamente nitrógeno,

15 de lo que resultan las siguientes unidades estructurales preferentes: A1, A2, A3, A4, A5, A6, A7, A8, A9, A10, A11, A12, A13, A14, A15, A16, A17,

R¹ se refiere preferentemente a (C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)halógenoalquilo, (C₂-C₆)alquenoilo, (C₂-C₆)halógenoalquenoilo, (C₂-C₆)alquinoilo, (C₂-C₆)halógenoalquinoilo, (C₃-C₈)cicloalquilo, halógeno(C₃-C₈)cicloalquilo, (C₃-C₆)cicloalquilo-(C₁-C₆)alquilo, (C₃-C₆)cicloalquilo-(C₁-C₆)halógenoalquilo, (C₁-C₆)alquilo-(C₃-C₈)cicloalquilo, (C₁-C₆)halógenoalquilo-(C₃-C₈)cicloalquilo, (C₁-C₆)cianoalquilo, (C₁-C₆)hidroxialquilo, (C₁-C₆)alcoxi-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)halógenoalcoxi-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alquilotio-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alquilosulfinilo-(C₁-C₆)alquilo o (C₁-C₆)alquilosulfonilo-(C₁-C₆)alquilo,

R⁷ se refiere preferentemente al hidrógeno, ciano, halógeno, acetilo, hidroxilo, amino, (C₃-C₆)cicloalquilo, halógeno(C₃-C₆)cicloalquilo, (C₁-C₄)alquilo, (C₁-C₄)halógenoalquilo, (C₁-C₄)cianoalquilo, (C₂-C₄)alquenoilo, (C₂-C₄)halógenoalquenoilo, (C₂-C₄)alquinoilo, (C₂-C₄)halógenoalquinoilo, (C₁-C₄)alcoxi, (C₁-C₄)halógeno alcoxi, (C₁-C₄)alquilotio, (C₁-C₄)halógenoalquilo tio, (C₁-C₄)alquilosulfinilo, (C₁-C₄)halógenos de alquilosulfinilo, (C₁-C₄)alquilosulfonilo o (C₁-C₄)halógenoalquilosulfonilo,

R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹ independientemente entre sí se refieren preferentemente al hidrógeno, halógeno, (C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)halógenoalquilo, (C₁-C₆)alcoxi, (C₁-C₆)halógeno alcoxi, (C₁-C₆)halógeno alquilotio, (C₁-C₆)halógenoalquilo sulfinilo, (C₁-C₆)halógenoalquilo sulfonilo o

30 al (C₁-C₆)halógenoalquilo-(C₃-C₈)cicloalquilo, al cianoalquilo (C₁-C₆) dado el caso mono o polisustituido por halógeno, (C₁-C₆)cianoalquilo-(C₃-C₈)cicloalquilo, (C₁-C₆)halógenoalquilo-(C₃-C₈)cianocicloalquilo, (C₁-C₆)halógenoalquilo-(C₃-C₈)halógeno cicloalquilo, dado el caso ciano(C₃-C₄)cicloalquilo mono o polisustituido por (C₁-C₆)alquilo o halógeno, dado el caso, espiro-(C₃-C₈)cicloalquilo-(C₃-C₈)cicloalquilo mono o polisustituido por ciano o halógeno, respectivamente o (C₄-C₁₂)bicicloalquilo,

35 mientras que se debe elegir uno de los radicales R⁸, R⁹, R¹⁰ o R¹¹ de (C₁-C₆)halógenoalquilo-(C₃-C₈)cicloalquilo, (C₁-C₆)cianoalquilo-(C₃-C₈)cicloalquilo, (C₁-C₆)halógenoalquilo-(C₃-C₈)cianocicloalquilo, (C₁-C₆)halógenoalquilo-(C₃-C₈)halógeno cicloalquilo, dado el caso, ciano(C₃-C₄)cicloalquilo mono o polisustituido por (C₁-C₆)alquilo o halógeno; dado el caso, espiro (C₃-C₈)cicloalquilo-(C₃-C₈)cicloalquilo o (C₄-C₁₂)bicicloalquilo mono o polisustituido por ciano o halógeno, respectivamente.

40 donde solo uno o dos de los radicales donde uno de los radicales R⁸, R⁹, R¹⁰ o R¹¹ representa un sustituyente no igual a hidrógeno,

Q se refiere preferentemente a un compuesto bicíclico o tricíclico heteroaromático condensado de 8, 9, 10, 11 o 12 anillos, mientras que el compuesto cíclico dado el caso puede ser mono o polisustituido, de manera igual o diversa, que al menos puede contener un grupo de carbonilo como mínimo y/o en donde los sustituyentes pueden elegirse independientemente entre sí entre hidrógeno, ciano, halógeno, nitro, acetilo, hidroxilo, amino, SCN, Tri-(C₁-C₆)alquilsilil, (C₃-C₈)cicloalquilo, (C₃-C₈)cicloalquilo-(C₃-C₈)cicloalquilo, (C₁-C₆)alquilo-(C₃-C₈)cicloalquilo, halógeno(C₃-C₈)cicloalquilo, (C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)halógenoalquilo, (C₁-C₆)cianoalquilo, (C₁-C₆)hidroxialquilo, (C₁-C₆)alcoxi-(C₁-C₆)alquilo, (C₂-C₆)alquenoilo, (C₂-C₆)halógenoalquenoilo, (C₂-C₆)cianoalquenoilo, (C₂-C₆)alquinoilo, (C₂-C₆)alquinoiloxi-(C₁-C₄)alquilo, (C₂-C₆)halógenoalquinoilo, (C₁-C₆)alcoxi, (C₁-C₆)halógenoalcoxi, (C₁-C₆)halógenoalcoxi-(C₁-C₆)alquilo, (C₂-C₆)alquenoiloxi-(C₁-C₆)alquilo, (C₂-C₆)halógenoalquenoiloxi-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)cianoalcoxi, (C₁-C₆)alcoxi-(C₁-C₆)alcoxi, (C₁-C₆)alquiloalcoxi, (C₁-C₆)alcoxiimino, (C₁-C₆)alquilo-(C₁-C₆)alcoxiimino, (C₁-C₆)alquilotio, (C₁-C₆)halógenoalquilotio, (C₁-C₆)alcoxi-(C₁-C₆)alquilotio, (C₁-C₆)alquilotio-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alquilosulfinilo,

5 (C₁-C₆)halógenoalquilosulfinilo, (C₁-C₆)alcoxi-(C₁-C₆)alquilosulfinilo, (C₁-C₆)alquilosulfinilo-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alquilosulfonilo, (C₁-C₆)halógenoalquilosulfonilo, (C₁-C₆)alcoxi-(C₁-C₆)alquilosulfonilo, (C₁-C₆)alquilosulfonilo-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alquilosulfonilo, (C₁-C₆)alquilocarbonilo, (C₁-C₆)alquilocarbonilo-(C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alquilotiocarboneo, (C₁-C₆)halógenoalquilocarbonilo, (C₁-C₆)aluilocarbonilo, (C₁-C₆)alcoxicarbonilo, (C₁-C₆)halógenoalcoxicarbonilo, aminocarbonilo, (C₁-C₆)alquiloaminocarbonilo, (C₁-C₆)alquiloaminotiocarboneo, Di-(C₁-C₆)alquilo-aminocarbonilo, Di-(C₁-C₆)alquilo-aminotiocarboneo, (C₃-C₈)cicloalquiloaminocarbonilo, (C₁-C₆)alquilosulfonilamino, (C₁-C₆)alquiloamino, Di-(C₁-C₆)alquiloamino, aminosulfonilo, (C₁-C₆)alquilaminosulfonilo, Di-(C₁-C₆)alquil-aminosulfonilo, (C₁-C₆)sulfoximino-alquil, aminotiocarboneo, (C₁-C₆)alquiloaminotiocarboneo, Di-(C₁-C₆)alquil-aminotiocarboneo, (C₃-C₈)cicloalquil-amino, NHCO-(C₁-C₆)alquilo((C₁-C₆)alquil-carbonil-amino),

10 o donde los sustituyentes pueden elegirse independientemente entre sí entre fenilo o un compuesto heteroaromático de 5 o 6 eslabones, mientras que el fenilo o el compuesto pueden ser mono o polisustituidos, de manera igual o diversa por C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquino, C₃-C₆-cicloalquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₂-C₆-haloalqueno, C₂-C₆-haloalquino, C₃-C₆-halocicloalquilo, halógeno, CN, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi,

15 n se refiere a 0, 1 o 2,

Realización 3-1

Aa se refiere de manera especialmente preferente al nitrógeno o =C(R⁷)-,

Ab se refiere de manera especialmente preferente al nitrógeno o =C(R⁸)-,

20 Ac se refiere de manera especialmente preferente al nitrógeno o =C(R⁹)-,

Ad se refiere de manera especialmente preferente al nitrógeno o =C(R¹⁰)-,

Ae se refiere de manera especialmente preferente al nitrógeno o =C(R¹¹)-,

a lo cual, Ab, Ac, Ad y Ae no pueden representar simultáneamente nitrógeno,

de lo que resultan las siguientes unidades estructurales preferentes: A1, A2, A6, A7, A9, A11, A13, A16,

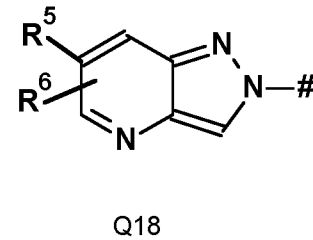
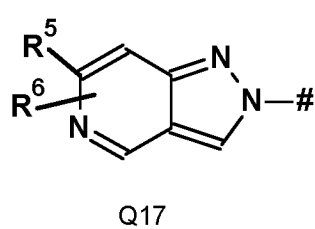
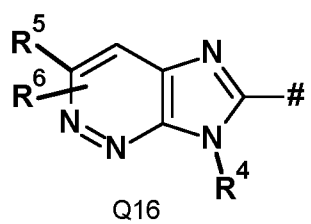
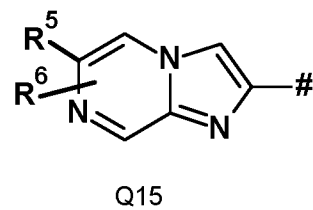
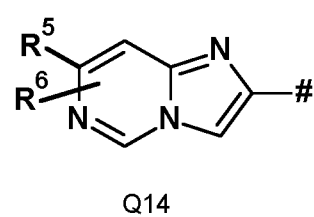
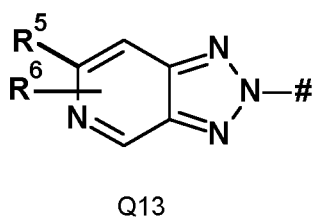
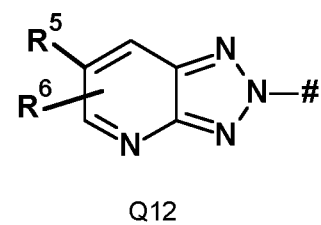
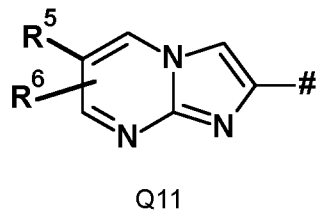
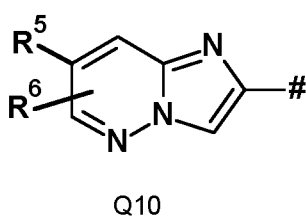
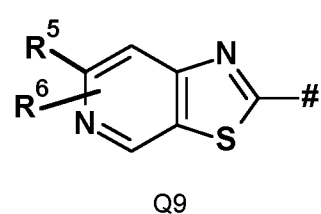
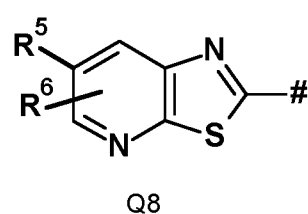
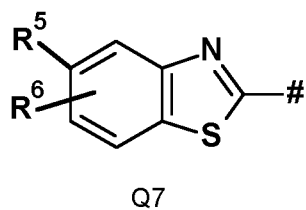
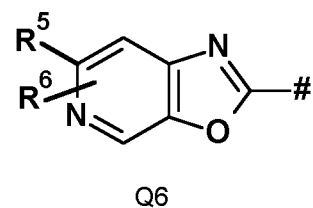
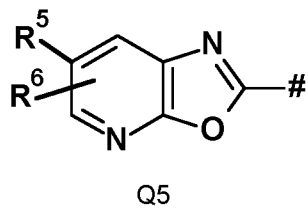
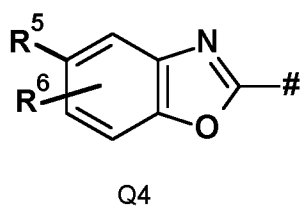
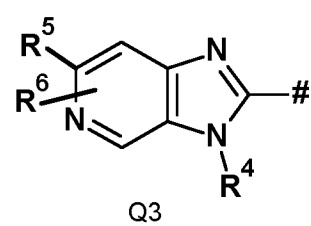
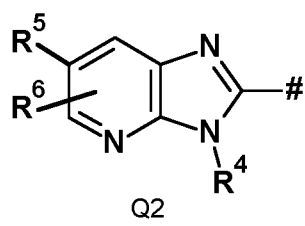
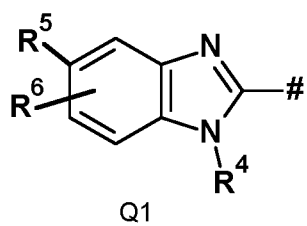
25 R¹ se refiere de manera especialmente preferente a (C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)halógeno alquilo o (C₃-C₈)cicloalquilo,

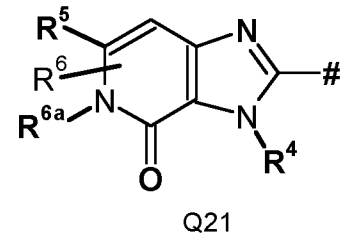
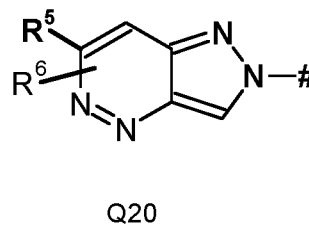
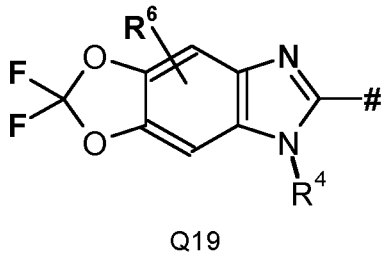
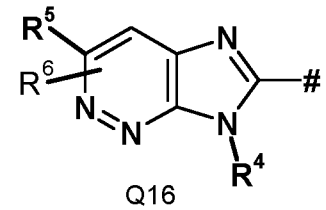
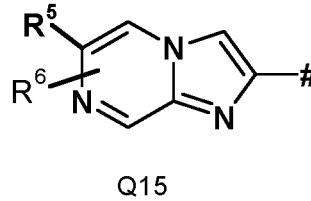
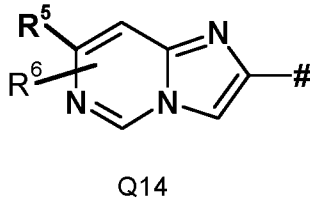
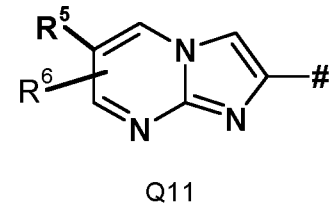
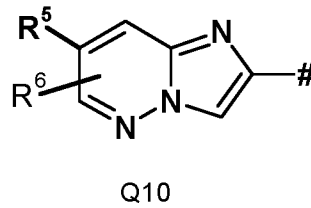
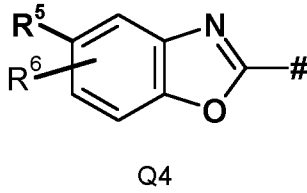
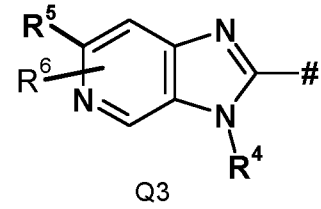
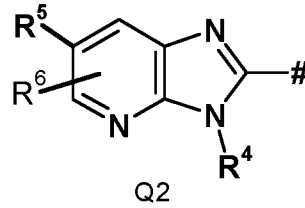
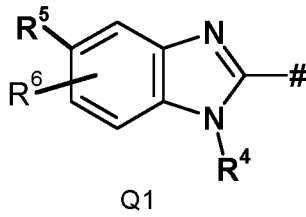
R⁷ se refiere de manera especialmente preferente al hidrógeno, halógeno, ciano, (C₁-C₄)alquilo, (C₁-C₄)halógeno alquilo,

30 R⁸, R¹⁰, R¹¹, independientemente entre sí se refieren de manera especialmente preferente al hidrógeno, halógeno, (C₁-C₄)alquilo, (C₁-C₄)halógeno alquilo, (C₁-C₄)alcoxi, (C₁-C₄)halógeno alcoxi, (C₁-C₄)halógeno alquiloti, (C₁-C₄)halógeno alquilo sulfinilo, (C₁-C₄)halógeno alquilo sulfonilo,

R⁹ se refiere de manera especialmente preferente a (C₁-C₄)halógenoalquilo-(C₃-C₈)cicloalquilo, espiro-(C₃-C₈)cicloalquilo-(C₃-C₈)cicloalquilo, (C₄-C₁₂)bicicloalquilo o, dado el caso, a ciano(C₃-C₆)cicloalquilo sustituido de manera simple o doble por (C₁-C₄)alquilo o halógeno,

35 Q se refiere de manera especialmente preferente a un compuesto bicíclico o tricíclico heteroaromático condensado de 9 o 12 eslabones de la serie Q1 hasta Q21,





R⁴ se refiere de manera muy especialmente preferente a (C₁-C₄)alquilo o (C₁-C₄)alcoxi-(C₁-C₄)alquilo,

5 R⁵ se refiere de manera muy especialmente preferente al hidrógeno, ciano, halógeno (C₁-C₄)alquilo, (C₁-C₄)halogenoalquilo, (C₃-C₆)cicloalquilo, (C₁-C₄)alcoxi, (C₁-C₄)halogenalcoxi, (C₁-C₄)alcoxiimino, (C₁-C₄)alquiltio, (C₁-C₄)halogenalquiltio, (C₁-C₄)alquilsulfinilo, (C₁-C₄)halogenalquilsulfinilo, (C₁-C₄)alquilsulfonilo, (C₁-C₄)halogenalquilsulfonilo, (C₁-C₄)alquilcarbonilo o (C₁-C₄)halogenalquilcarbonilo,

R⁶ se refiere de manera muy especialmente preferente al hidrógeno,

10 R^{6a} se refiere de manera muy especialmente preferente al (C₁-C₄)alquilo, (C₁-C₄)halógenoalquilo, (C₂-C₄)alqueno, (C₂-C₄)halógenoalqueno, (C₁-C₄)alcoxi-(C₁-C₄)alquilo, (C₂-C₄)alquinilo, (C₂-C₄)halógenoalquinilo o (C₃-C₆)cicloalquilo,

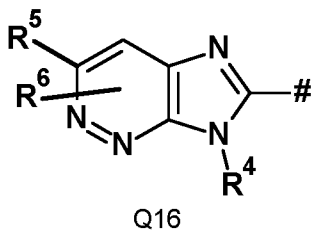
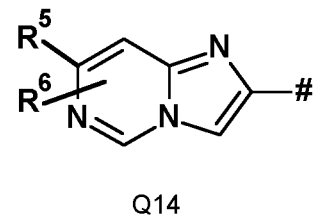
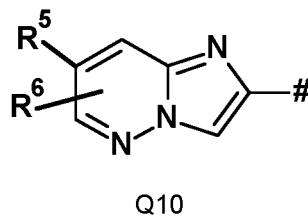
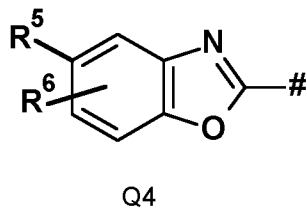
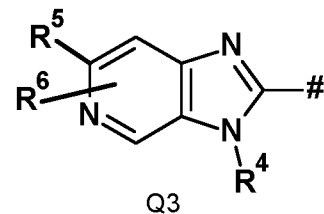
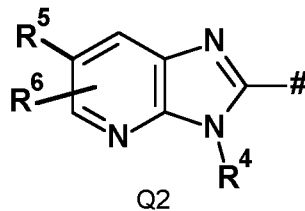
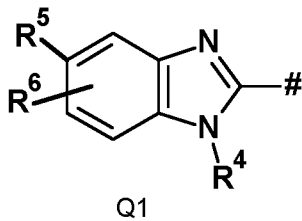
n se refiere de manera muy especialmente preferente a 0, 1 o 2.

Realización 5-1

Aa se refiere de manera destacada a =C(R⁷)-,

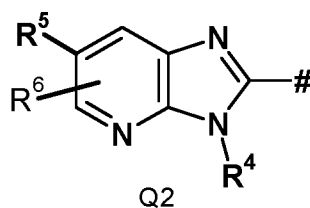
15 Ab se refiere de manera destacada a =C(R⁸)-,

- Ac se refiere de manera destacada a =C(R⁹)-,
 Ad se refiere de manera destacada a =C(R¹⁰)-,
 Ae se refiere de manera destacada a =C(R¹¹)-,
 R¹ se refiere de manera destacada al metilo, etilo, n-propil, i-propil, n- butil, i-butil o tert-butil,
 5 R⁷ se refiere de manera destacada al hidrógeno,
 R⁸ se refiere de manera destacada al hidrógeno,
 R⁹ se refiere de manera destacada al cianociclopropilo o al cianociclobutilo,
 R¹⁰ se refiere de manera destacada al hidrógeno,
 R¹¹ se refiere de manera destacada al hidrógeno,
 10 Q se refiere de manera destacada a un compuesto bicíclico heteroaromático condensado de 9 eslabones de la serie Q1, Q2, Q3, Q4, Q10, Q14 o Q16,



- R⁴ se refiere de manera destacada al metilo, etilo, i-propilo, metoximetilo o metoxietilo,
 R⁵ se refiere de manera destacada al flúor, cloro, bromo, flúormetilo, diflúormetilo, triflúormetilo, flúoroetilo (CH₂CFH₂, CHFCH₃), diflúoretilo (CF₂CH₃, CH₂CHF₂, CHFCHF₂), triflúoretilo, (CH₂CF₃, CHFCHF₂, CF₂CFH₂), tetraflúoretilo (CHFCH₃, CF₂CHF₂), pentaflúoretilo, triflúormetoxi, pentaflúoretoxi, diflúorclorometoxi, dicloroflúormetoxi, triflúormetilto, triflúormetilosulfinil o triflúormetilosulfonil,
 15 R⁶ se refiere de manera destacada al hidrógeno,
 n se refiere de manera destacada a 0, 1 o 2.
 20 Realización 5-2
 Aa se refiere de manera destacada a =C(R⁷)-,
 Ab se refiere de manera destacada a =C(R⁸)-,

- Ac se refiere de manera destacada a =C(R⁹)-,
- Ad se refiere de manera destacada a =C(R¹⁰)-,
- Ae se refiere de manera destacada a =C(R¹¹)-,
- R¹ se refiere de manera destacada al metilo, etilo, n-propil, i-propil, n- butil, i-butil o tert-butil,
- 5 R⁷ se refiere de manera destacada al hidrógeno,
- R⁸ se refiere de manera destacada al hidrógeno,
- R⁹ se refiere de manera destacada al cianociclopropilo o al cianociclobutilo,
- R¹⁰ se refiere de manera destacada al hidrógeno,
- R¹¹ se refiere de manera destacada al hidrógeno,
- 10 Q se refiere de manera destacada a un compuesto bicíclico heteroaromático condensado de 9 eslabones de la serie Q1, Q2, Q3, Q4, Q16 o Q21,
- R⁴ se refiere de manera destacada al metilo, etilo, i-propilo, metoximetilo o metoxietilo,
- R⁵ se refiere de manera destacada al flúor, cloro, bromo, flúormetilo, diflúormetilo, triflúormetilo, flúoetilo (CH₂CFH₂, CHFCH₃), diflúoretilo (CF₂CH₃, CH₂CHF₂, CHFCHF₂), triflúoretilo, (CH₂CF₃, CHFCHF₂, CF₂CFH₂), tetraflúoretilo (CHFCH₃, CF₂CHF₂), pentaflúoretilo, triflúormetoxi, pentaflúoretoxi, diflúorclorometoxi, dicloroflúormetoxi, triflúormetilto, triflúormetilosulfinil o triflúormetilosulfonyl,
- 15 R⁶ se refiere de manera destacada al hidrógeno,
- R^{6a} se refiere de manera destacada al metilo,
- n se refiere de manera destacada a 0, 1 o 2.
- 20 Realización 6-1
- Aa se refiere particularmente a =C(R⁷)-,
- Ab se refiere particularmente a =C(R⁸)-,
- Ac se refiere particularmente a =C(R⁹)-,
- Ad se refiere particularmente a =C(R¹⁰)-,
- 25 Ae se refiere particularmente a =C(R¹¹)-,
- R¹ se refiere particularmente al etilo,
- R⁷ se refiere particularmente al hidrógeno,
- R⁸ se refiere particularmente al hidrógeno,
- R⁹ se refiere particularmente al 1-ciano-ciclopropil,
- 30 R¹⁰ se refiere particularmente al hidrógeno,
- R¹¹ se refiere particularmente al hidrógeno,
- Q se refiere particularmente a un compuesto bicíclico heteroaromático condensado de 9 eslabones de la serie Q2,



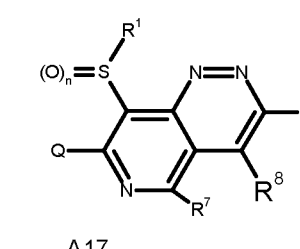
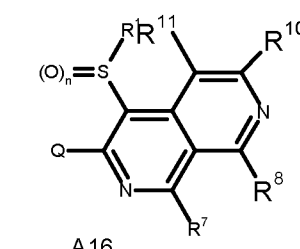
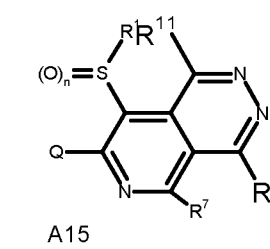
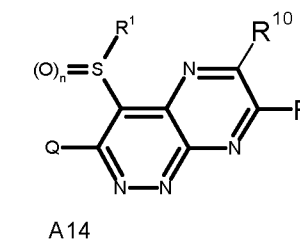
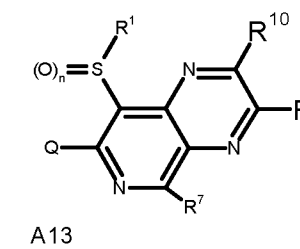
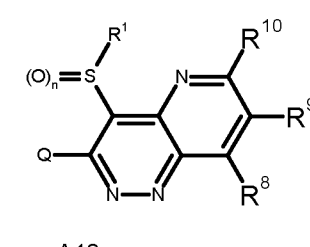
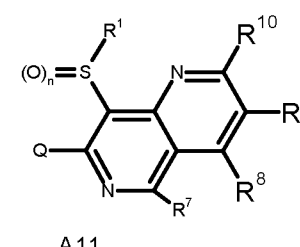
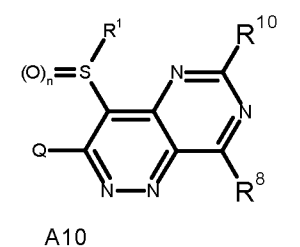
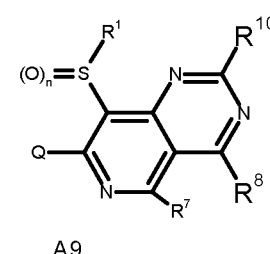
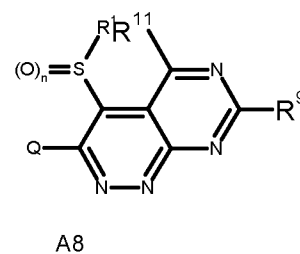
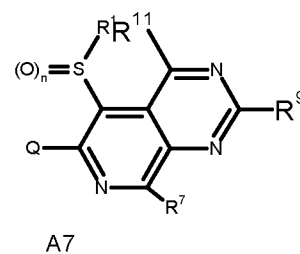
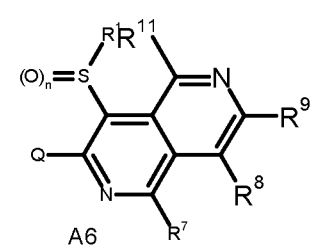
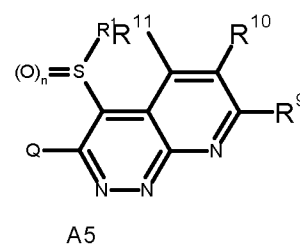
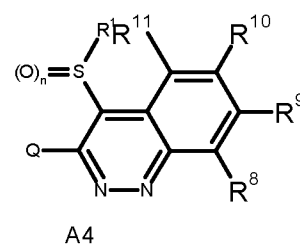
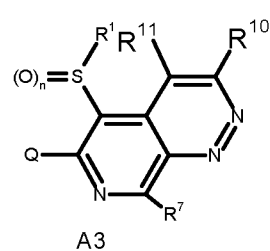
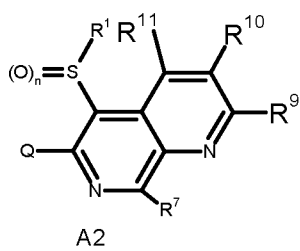
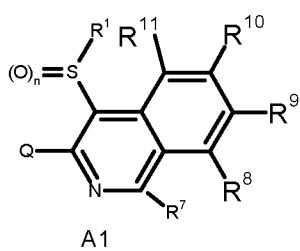
- 35 R⁴ se refiere particularmente al metilo,

ES 2 980 245 T3

- R⁵ se refiere particularmente al trifluórometilo,
R⁶ se refiere particularmente al hidrógeno,
n se refiere particularmente al 2.

Realización 6-2

- 5 Aa se refiere particularmente a =C(R⁷)-,
Ab se refiere particularmente a =C(R⁸)-,
Ac se refiere particularmente a =C(R⁹)-,
Ad se refiere particularmente a =C(R¹⁰)-,
Ae se refiere particularmente a =C(R¹¹)-,
10 R¹ se refiere particularmente al etilo,
R⁷ se refiere particularmente al hidrógeno,
R⁸ se refiere particularmente al hidrógeno,
R⁹ se refiere particularmente al 1-ciano-ciclopropil,
R¹⁰ se refiere particularmente al hidrógeno,
15 R¹¹ se refiere particularmente al hidrógeno,
Q se refiere particularmente a un compuesto bicíclico heteroaromático condensado de 9 eslabones de la serie Q1, Q2, Q3, Q4, Q16 o Q21,
R⁴ se refiere particularmente al metilo,
20 R⁵ se refiere particularmente al trifluórometilo, pentafluóretilo, trifluórometoxi, pentafluóretoxi o trifluórometilo sulfonilo,
R⁶ se refiere particularmente al hidrógeno,
R^{6a} se refiere particularmente al metilo,
n se refiere particularmente al 2.
- 25 Considerando las unidades estructurales A1 hasta A17, resultan las siguientes estructuras principales de las Fórmulas (I):



En una forma de presentación preferente, la invención se refiere a los compuestos de la Fórmula (I), mientras que R¹, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, Q, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae y n significan lo indicado en la realización (1) o en la realización (2).

En una forma de presentación preferente, la invención se refiere a los compuestos de la Fórmula (I), mientras que R¹,

o en la realización (4-1) o en la realización (5-1) o en la realización (5-2) o en la realización (6-1) o en la realización (6-2).

5 En una forma de presentación preferente, la invención se refiere a los compuestos de la Fórmula (I), mientras que Q se refiere a Q12 y R¹, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae y n significan lo indicado en la realización (3-1) o en la realización (4-1) o en la realización (5-1) o en la realización (5-2) o en la realización (6-1) o en la realización (6-2).

10 En una forma de presentación preferente, la invención se refiere a los compuestos de la Fórmula (I), mientras que Q se refiere a Q13 y R¹, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae y n significan lo indicado en la realización (3-1) o en la realización (4-1) o en la realización (5-1) o en la realización (5-2) o en la realización (6-1) o en la realización (6-2).

En una forma de presentación preferente, la invención se refiere a los compuestos de la Fórmula (I), mientras que Q se refiere a Q14 y R¹, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae y n significan lo indicado en la realización (3-1) o en la realización (4-1) o en la realización (5-1) o en la realización (5-2) o en la realización (6-1) o en la realización (6-2).

15 En una forma de presentación preferente, la invención se refiere a los compuestos de la Fórmula (I), mientras que Q se refiere a Q15 y R¹, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae y n significan lo indicado en la realización (3-1) o en la realización (4-1) o en la realización (5-1) o en la realización (5-2) o en la realización (6-1) o en la realización (6-2).

20 En una forma de presentación preferente, la invención se refiere a los compuestos de la Fórmula (I), mientras que Q se refiere a Q16 y R¹, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae y n significan lo indicado en la realización (3-1) o en la realización (4-1) o en la realización (5-1) o en la realización (5-2) o en la realización (6-1) o en la realización (6-2).

25 En una forma de presentación preferente, la invención se refiere a los compuestos de la Fórmula (I), mientras que Q se refiere a Q17 y R¹, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae y n significan lo indicado en la realización (3-1) o en la realización (4-1) o en la realización (5-1) o en la realización (5-2) o en la realización (6-1) o en la realización (6-2).

30 En una forma de presentación preferente, la invención se refiere a los compuestos de la Fórmula (I), mientras que Q se refiere a Q18 y R¹, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae y n significan lo indicado en la realización (3-1) o en la realización (4-1) o en la realización (5-1) o en la realización (5-2) o en la realización (6-1) o en la realización (6-2).

En una forma de presentación preferente, la invención se refiere a los compuestos de la Fórmula (I), mientras que Q se refiere a Q19 y R¹, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae y n significan lo indicado en la realización (3-1) o en la realización (4-1) o en la realización (5-1) o en la realización (5-2) o en la realización (6-1) o en la realización (6-2).

35 En una forma de presentación preferente, la invención se refiere a los compuestos de la Fórmula (I), mientras que Q se refiere a Q20 y R¹, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae y n significan lo indicado en la realización (3-1) o en la realización (4-1) o en la realización (5-1) o en la realización (5-2) o en la realización (6-1) o en la realización (6-2).

40 En una forma de presentación preferente, la invención se refiere a los compuestos de la Fórmula (I), mientras que Q se refiere a Q21 y R¹, R⁴, R⁵, R⁶, R^{6a}, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, Aa, Ab, Ac, Ad, Ae y n significan lo indicado en la realización (3-1) o en la realización (4-1) o en la realización (5-1) o en la realización (5-2) o en la realización (6-1) o en la realización (6-2).

45 En las definiciones generales o en aquellas indicadas en las áreas de preferencia, salvo que se indique otra cosa, el halógeno se selecciona de la serie flúor, cloro, bromo y yodo, preferentemente nuevamente de la serie flúor, cloro y bromo.

El arilo (también como parte de una unidad mayor, como por ejemplo el arilalquilo) se selecciona, salvo que se indique otra cosa, de la serie fenil, naftil, antiril, fenantrenil y nuevamente se refiere preferentemente al fenil.

50 Salvo que en otro lugar se defina otra cosa, por el concepto "alquilo", ya sea por sí solo o en combinación con otros conceptos, como halógenoalquilo, en el marco de la presente invención significa un grupo de hidrocarburos residuales alifáticos y saturados con 1 hasta 12 átomos de carbono, que puede estar ramificado o no ramificado. Ejemplos de radicales alquílicos C₁-C₁₂ son el metil, etil, n-propil, iso-propil, n-butil, iso-butil, sec-butil, ter-butil, n-pentil, iso-pentil, neopentil, ter-pentil, 1-metilbutil, 2-metilbutil, 1-etilpropil, 1,2-dimetilpropil, hexil n-heptil, n-octil, n-nonil, n-decil, n-undecil y n-dodecil. De estos radicales alquilo, los radicales alquilo C₁-C₆ son especialmente preferentes. Son especialmente preferentes los radicales alquilo C₁-C₄.

5 Salvo que en otro lugar se defina otra cosa, el concepto "alquenilo", ya sea por sí solo o en combinación con otros conceptos, de acuerdo a la invención se refiere a un radical alquenilo C_2-C_{12} -lineal o ramificado, que al menos presenta un enlace doble, por ejemplo, vinilo, alilo, 1-propenilo, isopropenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1,3-butadienilo, 1-pentenilo, 2-pentenilo, 3-pentenilo, 4-pentenilo, 1,3-pentadienilo, 1-hexenil, 2-hexenil, 3-hexenil, 4-hexenil, 5-hexenil y 1,4-hexadienilo. De estos, son preferentes los radicales alquenilo C_2-C_6 , y son especialmente preferentes los radicales alquenilo C_2-C_4 .

10 Salvo que en otro lugar se defina otra cosa, el concepto "alquinilo", ya sea por sí solo o en combinación con otros conceptos, de acuerdo a la invención se refiere a un radical alquinilo C_2-C_{12} lineal o ramificado, que al menos presenta un enlace triple, por ejemplo, etinil, 1-propinil y propargil. De estos, son preferentes los radicales alquinilo C_3-C_6 , y son especialmente preferentes los radicales alquinilo C_3-C_4 . El radical alquinilo también puede presentar al menos un enlace doble.

15 Salvo que en otro lugar se defina otra cosa, el concepto "cicloalquilo", ya sea por sí solo o en combinación con otros conceptos, de acuerdo a la invención se refiere a un radical cicloalquilo C_3-C_8 , por ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo y ciclooctilo. Son especialmente preferentes los radicales cicloalquilo C_3-C_6 .

El concepto "alcoxi", ya sea por sí solo o en combinación con otros conceptos, como halógenoalcoxi, se refiere aquí a un radical O-alquilo, mientras que el concepto "alquilo" significa lo indicado más arriba.

Los radicales sustituidos por halógeno, por ejemplo, halógenoalquilo (=haloalquilo), están mono o poli-halogenados hasta un número máximo posible de sustituyentes. En caso de poli-halogenación, los átomos de halógeno pueden ser idénticos o diferentes. El halógeno se refiere al flúor, cloro, bromo o yodo, especialmente para flúor, cloro o bromo.

20 Dado el caso, siempre que no se indique otra cosa los radicales estar mono o polisustituidos, mientras que en caso de sustituciones múltiples los sustituyentes pueden ser idénticos o diferentes.

25 Las definiciones generales mencionadas más arriba o las definiciones de radicales o explicaciones detalladas en las áreas de preferencia se refieren a productos terminados y a los productos básicos y productos intermedios, correspondientemente. Estas definiciones de radicales pueden combinarse a discreción entre sí, es decir, también entre las áreas de preferencia correspondientes.

De acuerdo con la invención, preferentemente se utilizan los compuestos de la Fórmula (I), en los que existe una combinación de los significados anteriormente indicados como preferentes.

De acuerdo con la invención, de manera especialmente preferente se utilizan los compuestos de la Fórmula (I), en los que existe una combinación de los significados anteriormente indicados como especialmente preferentes.

30 De acuerdo con la invención, de manera muy especialmente preferente se utilizan los compuestos de la Fórmula (I), en los que existe una combinación de los significados anteriormente indicados como muy preferentes.

De acuerdo con la invención, de manera destacada se utilizan los compuestos de la Fórmula (I), en los que existe una combinación de los significados anteriormente indicados como destacados.

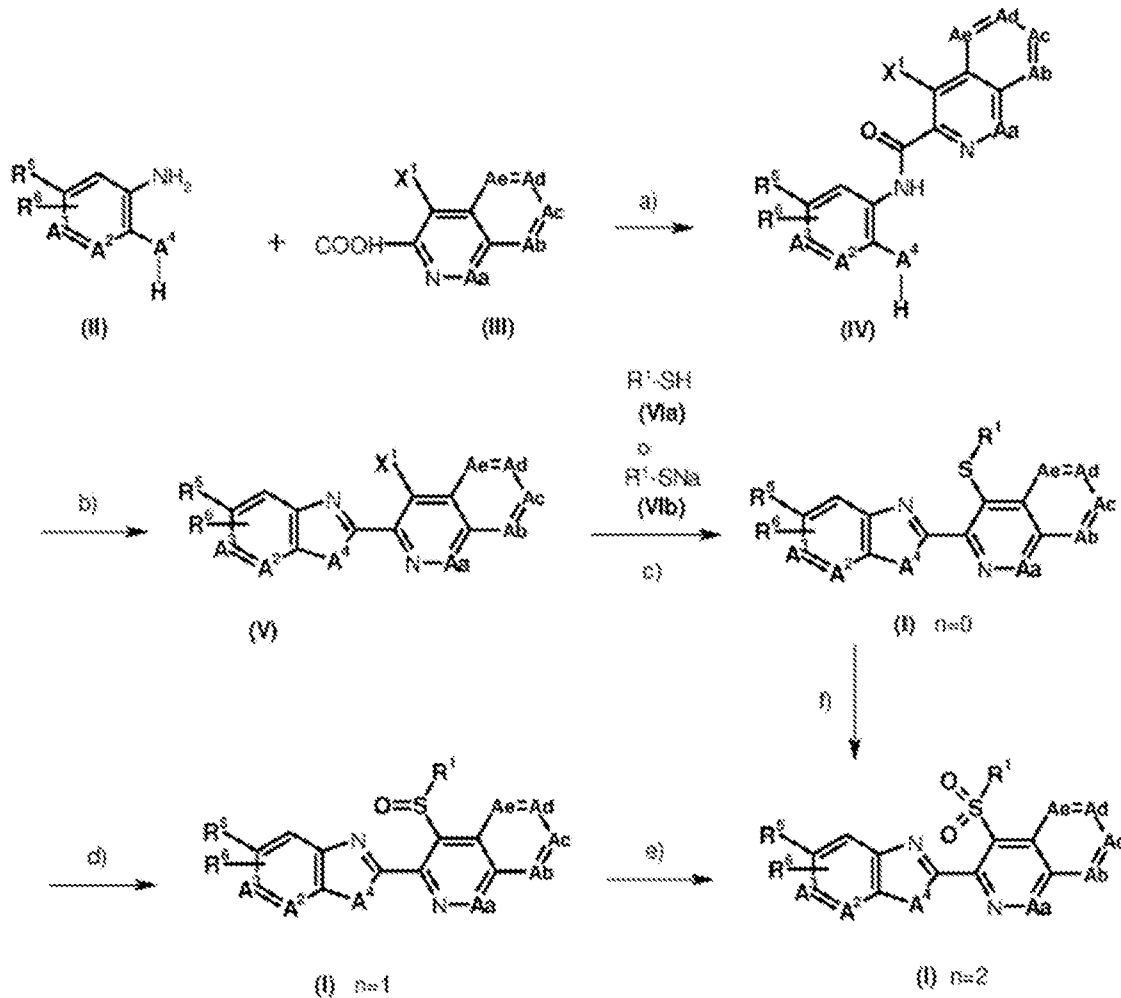
35 De acuerdo con la invención, particularmente se utilizan los compuestos de la Fórmula (I), en los que existe una combinación de los significados anteriormente indicados como particulares.

De acuerdo con el tipo de sustituyentes, los compuestos de la Fórmula (I) pueden estar presentes en diferentes composiciones como isómeros geométrica y/o ópticamente activos, o mezclas de isómeros correspondientes. Estos estereoisómeros son, por ejemplo, enantiómeros, diastereómeros, atropisómeros o isómeros geométricos. Por consiguiente, la invención comprende tanto estereoisómeros puros como también cualquier mezcla de estos isómeros.

40 Los compuestos acordes a la invención de las Fórmulas (I) pueden obtenerse mediante los procedimientos detallados en los siguientes esquemas:

Procedimiento A

45 Los compuestos de la Fórmula (I), en los que Q se refiere a Q1 hasta Q9, Q16, Q19 o Q21, se pueden preparar según los métodos conocidos, por ejemplo, igual que en los procedimientos descritos en WO2009/131237, WO2010/125985, WO2011/043404, WO2011/040629, WO2012/086848, WO2013/018928, WO2015/000715, WO2015/198859, WO2016/039444, WO2016/039441, WO2016/116338 al igual que en WO2015/121136.



Los residuales Aa, Ab, Ac, Ad, Ae, R¹, R⁵, R⁶ y n significan lo descrito más arriba, A² y A³ se refieren a CH o N, A⁴ se refiere a O, S o -NR⁴, X¹ se refiere al halógeno.

Para los compuestos de la Fórmula (I), en los que Q se refiere a Q21, A² se refiere al carbonilo y A³ se refiere a N-R^{6a}.

5 **Paso a)**

De manera análoga al procedimiento descrito en US5576335, los compuestos de la Fórmula (IV) pueden prepararse mediante la reacción de los compuestos de la Fórmula (II) con ácidos carboxílicos de la Fórmula (III) en presencia de un agente de condensación o una base.

10 Los compuestos de la Fórmula (II) pueden conseguirse en el mercado o prepararse según los métodos conocidos, por ejemplo, según los procedimientos descritos en US2003/69257, WO2006/65703, WO2009/131237, WO2010/125985, WO2011/043404, WO2011/040629, WO2012/086848, WO2013/018928 o WO2015/000715.

Los ácidos carboxílicos de la Fórmula (III) pueden conseguirse en el mercado o fabricarse según los métodos conocidos. Las vías de fabricación posibles se describen en el procedimiento H, I y J.

15 La reacción de los compuestos de la Fórmula (II) con ácidos carboxílicos de la Fórmula (III) puede realizarse en una sustancia o un disolvente, preferentemente la reacción se realiza en un disolvente seleccionado entre los disolventes convencionales, inertes ante las condiciones de reacción predominantes. Preferentemente, se utilizan los éteres como el éter diisopropílico, dioxano, el tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano; los hidrocarburos halogenados como el diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, el 1,2-dicloroetano o clorobenceno; nitrilos, como el acetonitrilo o propionitrilo; hidrocarburos aromáticos, tales como el tolueno o el xileno; disolventes polares apróticos, como la N,N-dimetilformamida o la N-metilpirrolidona, o compuestos que contienen nitrógeno, como la piridina.

20 Los agentes de condensación adecuados son, por ejemplo, las carbodiimidas como el clorhidrato de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida (EDCI) o la 1,3-ciclohexilcarbodiimida.

Las bases adecuadas son las bases inorgánicas, que habitualmente se utilizan en reacciones de este tipo. Preferentemente, se utilizan bases que por ejemplo se seleccionan del grupo conformado por acetatos, fosfatos, carbonatos y carbonatos de hidrógeno de metales alcalinos o alcalinotérreos. Se prefieren especialmente el acetato de sodio, el fosfato de sodio, el fosfato de potasio, el carbonato de cesio, el carbonato de sodio, el carbonato de potasio, el carbonato de hidrógeno de sodio y el carbonato de hidrógeno de potasio.

La reacción puede realizarse en vacío, con presión normal o presión excesiva y a temperaturas de 0° C a 180° C, preferentemente la reacción se produce con presión normal y a temperaturas de 20 a 140° C.

Paso b)

Los compuestos de la Fórmula (V) pueden prepararse por condensación de los compuestos de la Fórmula (IV), p. ej., al igual que en los procedimientos descritos en WO2009/131237, WO2010/125985, WO2011/043404, WO2011/040629, WO2012/086848, WO2013/018928, WO2015/000715 y WO2015/121136.

La reacción para dar compuestos de la Fórmula (V) puede realizarse en una sustancia o un disolvente, preferentemente la reacción se realiza en un disolvente seleccionado entre los disolventes convencionales, inertes ante las condiciones de reacción predominantes. Preferentemente, se utilizan los éteres como el éter diisopropílico, dioxano, el tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, terc. Butil metil éter; los hidrocarburos halogenados como el diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, el 1,2-dicloroetano o clorobenceno; nitrilos, como el acetonitrilo o propionitrilo; hidrocarburos aromáticos, tales como el tolueno o el xileno; disolventes polares apróticos, como la N,N-dimetilformamida o la N-metilpirrolidona, o compuestos que contienen nitrógeno, como la piridina.

La reacción puede realizarse en presencia de un agente de condensación, un ácido, una base o un agente de cloración.

Ejemplos de agentes condensación adecuados son las carbodiimidias como el clorhidrato de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida (EDCI) o la 1,3-ciclohexilcarbodiimida; los anhídridos como el anhídrido acético, el anhídrido trifluoroacético; una mezcla de trifenilfosfina, una base y tetracloruro de carbono; o una mezcla de trifenilfosfina y un azodiéster como el ácido dietilazodicarboxílico.

Ejemplos de ácidos adecuados que pueden utilizarse en la reacción descrita son los ácidos sulfónicos como el ácido para-tolueno sulfónico; los ácidos carboxílicos como el ácido acético o los ácidos polifosfóricos.

Ejemplos de bases adecuadas son los heterociclos que contienen nitrógeno, como la piridina, la picolina, la 2,6-lutidina, el 1,8-diazabicyclo[5,4,0]-7-undeceno (DBU); las aminas terciarias, como la trietilamina y la N,N-diisopropilsetamina; las bases inorgánicas, como el fosfato de potasio, el carbonato de potasio y el hidruro de sodio.

Un ejemplo de un agente de cloración adecuado es el oxiclорuro de fósforo.

La reacción puede realizarse en vacío, con presión normal o presión excesiva y a temperaturas de 0° C hasta 200° C.

Paso c)

Los compuestos de la Fórmula (I), donde n se refiere a 0, pueden prepararse mediante la reacción de los compuestos de la Fórmula (V) con los compuestos de la Fórmula (VIa) en presencia de una base o por reacción con los compuestos de la Fórmula (VIb).

Los derivados del mercaptano de la Fórmula (VIa), como el metilmercaptano, etilmercaptano o el isopropilmercaptano, pueden obtenerse en el mercado o fabricarse según los métodos conocidos, por ejemplo, como se describe en los procedimientos en US2006/25633, US2006/111591, US2820062, Chemical Communications, 13 (2000), 1163-1164 o Journal of the American Chemical Society, 44 (1922), pág. 1329.

La reacción del compuesto de la Fórmula (I), en donde n se refiere a 0, puede realizarse en una sustancia o un disolvente, preferentemente la reacción se realiza en un disolvente seleccionado entre los disolventes convencionales, inertes ante las condiciones de reacción predominantes. Preferentemente, se utilizan los éteres como el éter diisopropílico, dioxano, el tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, terc. Butil metil éter; nitrilos, como el acetonitrilo o propionitrilo; hidrocarburos aromáticos, tales como el tolueno o el xileno; disolventes polares apróticos, como la N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona o dimetilsulfóxido.

Ejemplos de bases adecuadas son las bases inorgánicas del grupo formado por acetatos, fosfatos y carbonatos de metales alcalinos o alcalinotérreos. Se prefieren el carbonato de cesio, el carbonato de sodio y el carbonato de potasio. Otras bases adecuadas son los hidruros metálicos alcalinos como el hidruro de sodio.

Como alternativa, se pueden utilizar directamente las sales de los derivados del mercaptano (compuestos de la Fórmula (VIb), por ejemplo, el etanetiolato de sodio, el metanotiolato de sodio o el isopropanetiolato de sodio, sin añadir ninguna otra base. La reacción puede realizarse en vacío, con presión normal o presión excesiva y a temperaturas de 0° C hasta 200° C. Los compuestos de la Fórmula (VIb) se consiguen en el mercado.

En la reacción descrita, X¹ se refiere preferentemente a un átomo de flúor o de cloro.

Paso d)

5 Los compuestos de la Fórmula (I), en donde n se refiere al 1, se pueden preparar por oxidación de los compuestos de la Fórmula (I), en donde n se refiere al 0. Por lo general, la oxidación se realiza en un disolvente, que se selecciona de los disolventes convencionales, inertes ante las condiciones de reacción predominantes. Se prefieren los hidrocarburos halogenados como el diclorometano, el cloroformo, el tetracloruro de carbono, el 1,2-dicloroetano o el clorobenceno; los alcoholes como el metanol o el etanol; el ácido fórmico y el ácido acético. Ácido propiónico o agua.

Ejemplos de agentes de oxidación adecuados son el peróxido de hidrógeno, el ácido metacloroperbenzoico o el periodato de sodio.

10 La reacción puede realizarse en vacío, con presión normal o presión excesiva y a temperaturas de -20° C a 120° C.

Paso e)

15 Los compuestos de la Fórmula (I), en donde n se refiere al 2, se pueden preparar por oxidación de los compuestos de la Fórmula (I), en donde n se refiere al 1. Generalmente, la oxidación se realiza en un disolvente. Se prefieren los hidrocarburos halogenados como el diclorometano, el cloroformo, el tetracloruro de carbono, el 1,2-dicloroetano o el clorobenceno; los alcoholes como el metanol o el etanol; el ácido fórmico y el ácido acético. Ácido propiónico o agua.

Ejemplos de agentes de oxidación adecuados son el peróxido de hidrógeno, el ácido metacloroperbenzoico o el periodato de sodio.

La reacción puede realizarse en vacío, con presión normal o presión excesiva y a temperaturas de -20° C a 120° C.

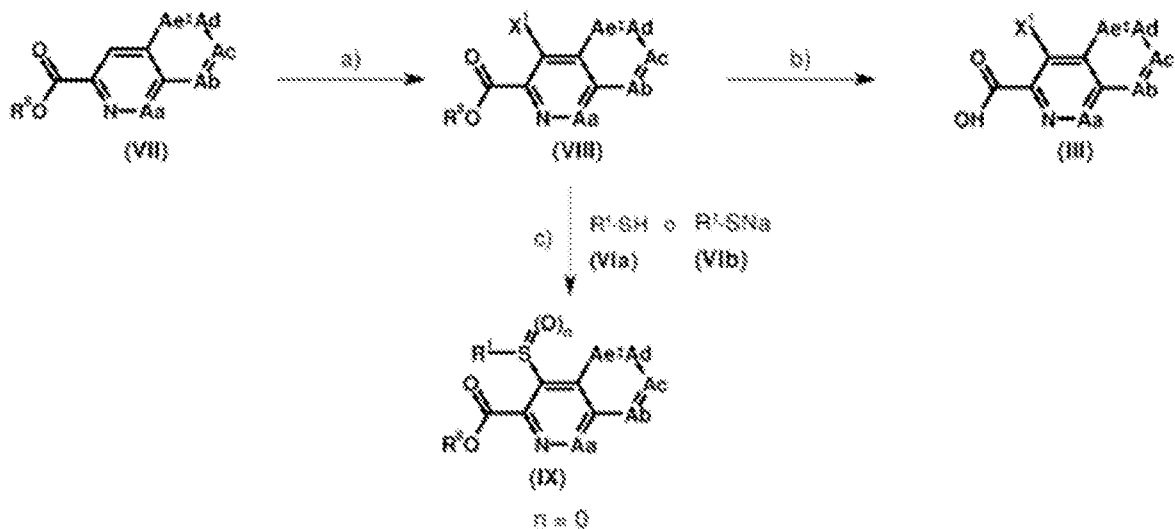
Paso f)

20 Los compuestos de la Fórmula (I), en donde n se refiere al 2, también se pueden fabricar en un proceso de un solo paso por oxidación de los compuestos de la Fórmula (I), en donde n se refiere al 0. Generalmente, la oxidación se realiza en un disolvente. Se prefieren los hidrocarburos halogenados como el diclorometano, el cloroformo, el tetracloruro de carbono, el 1,2-dicloroetano o el clorobenceno; los alcoholes como el metanol o el etanol; el ácido fórmico y el ácido acético. Ácido propiónico o agua.

25 Ejemplos de agentes de oxidación adecuados son el peróxido de hidrógeno, el ácido metacloroperbenzoico o el periodato de sodio.

La reacción puede realizarse en vacío, con presión normal o presión excesiva y a temperaturas de -20° C a 120° C.

Procedimiento B



30 Los radicales Aa, Ab, Ac, Ad, Ae, R¹ y n significan lo indicado más arriba, X¹ se refiere al halógeno y R⁸ se refiere al C₁-C₄ alquilo.

Paso a)

Los compuestos de la Fórmula (VIII) se pueden preparar según los métodos conocidos con los compuestos de la Fórmula (VII) mediante una halogenación. Por ejemplo, mediante la orto-literación dirigida, seguida de la captura del carbanio con un reactivo adecuado de halogenación electrofílica o, alternativamente, mediante la halogenación electrofílica aromática según los procedimientos descritos en *Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters*, 24 (2014), 4236-4238; *Tetrahedron*, 58 (2002), 6723-6728 y en WO2003/010146. Los compuestos de la Fórmula (VII) pueden conseguirse en el mercado o se pueden sintetizar mediante una esterificación de los compuestos de la Fórmula (XXV).

Paso b)

Los compuestos de la Fórmula (III) pueden sintetizarse según los procedimientos descritos en *Synthesis* 1987, 6, 586-587, *Tetrahedron Letters* 2006, 47, 565-567 o *ChemMedChem* 2010, 5, 65-78, mediante saponificación de los compuestos de la Fórmula (VIII).

Las bases adecuadas son, por ejemplo, hidróxido de litio o hidróxido de sodio. Como solvente pueden utilizarse disolventes polares apróticos y próticos además de mezclas de estos, por ejemplo, etanol, tetrahidrofurano o agua.

La reacción puede realizarse en vacío, con presión normal o presión excesiva y a temperaturas de -20° C a 120° C.

Paso c)

Los compuestos de la Fórmula (IX), donde n se refiere a 0, se pueden preparar mediante la reacción de los compuestos de la Fórmula (VIII) con los compuestos de la Fórmula (VIa) en presencia de una base o por reacción con los compuestos de la Fórmula (VIb).

Los derivados del mercaptano de la Fórmula (VIa), como el metilmercaptano, etilmercaptano o el isopropilmercaptano, pueden obtenerse en el mercado o fabricarse según los métodos conocidos, por ejemplo, como se describe en los procedimientos en US2006/25633, US2006/111591, US2820062, *Chemical Communications*, 13 (2000), 1163-1164 o *Journal of the American Chemical Society*, 44 (1922), pág. 1329.

La reacción del compuesto de la Fórmula (IX), en donde n se refiere a 0, puede realizarse en una sustancia o un disolvente, preferentemente la reacción se realiza en un disolvente seleccionado entre los disolventes convencionales, inertes ante las condiciones de reacción predominantes. Preferentemente, se utilizan los éteres como el éter diisopropílico, dioxano, el tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, terc. Butil metil éter; nitrilos, como el acetonitrilo o propionitrilo; hidrocarburos aromáticos, tales como el tolueno o el xileno; disolventes polares apróticos, como la N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona o dimetilsulfóxido.

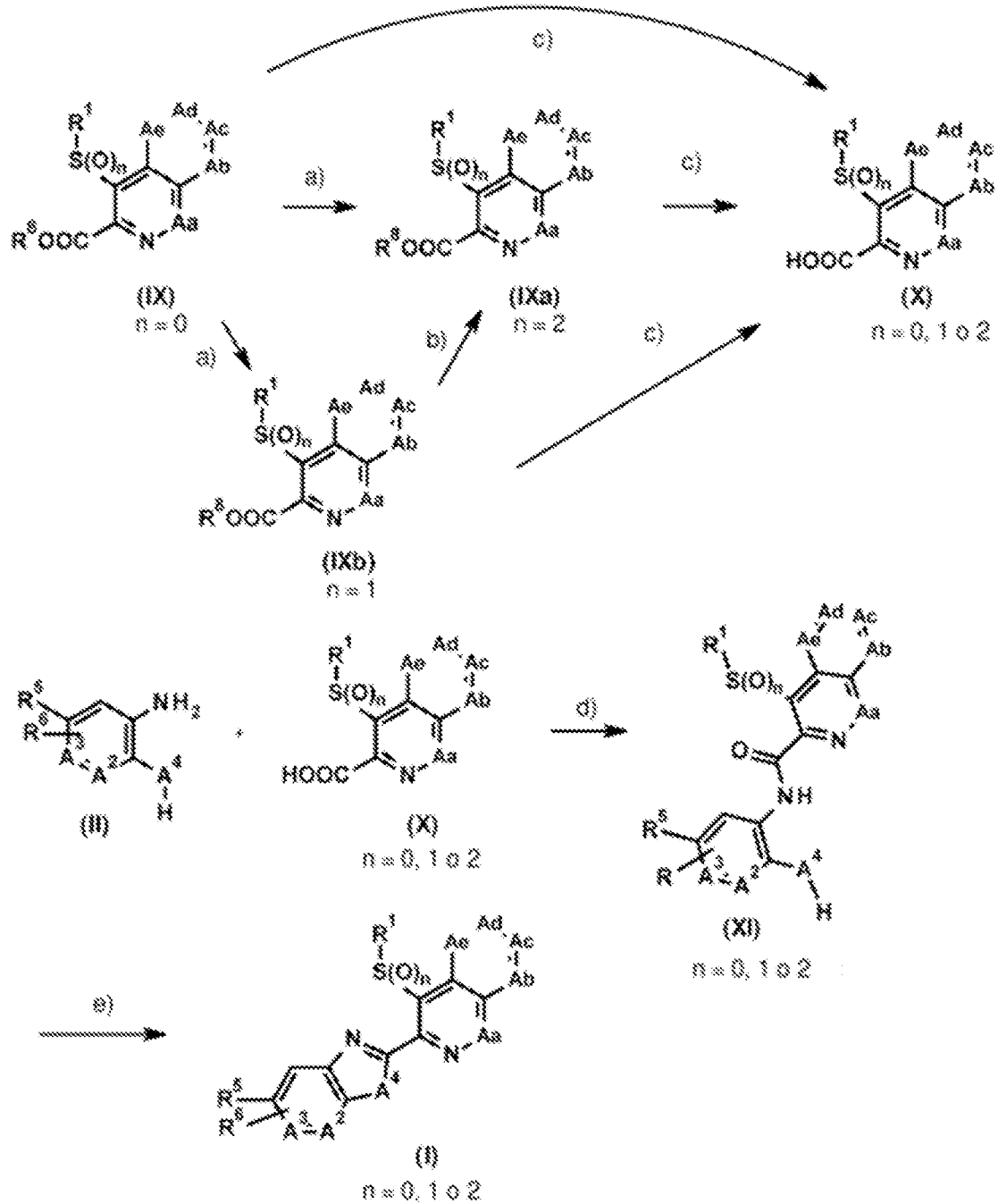
Ejemplos de bases adecuadas son las bases inorgánicas del grupo formado por acetatos, fosfatos y carbonatos de metales alcalinos o alcalinotérreos. Se prefieren el carbonato de cesio, el carbonato de sodio y el carbonato de potasio. Otras bases adecuadas son los hidruros metálicos alcalinos como el hidruro de sodio.

Como alternativa, se pueden utilizar directamente las sales de los derivados del mercaptano de la Fórmula (VIb), por ejemplo, el etanetiolato de sodio, el metanotiolato de sodio o el isopropanetiolato de sodio, sin añadir ninguna otra base. La reacción puede realizarse en vacío, con presión normal o presión excesiva y a temperaturas de 0° C hasta 200° C.

En la reacción descrita, X¹ se refiere preferentemente a un átomo de flúor o de cloro.

Procedimiento C

Los compuestos de la Fórmula (I), en los que Q se refiere a Q1 hasta Q9, Q16, Q19 o Q21, se pueden preparar según los métodos conocidos, por ejemplo, igual que en los procedimientos descritos en WO2009/131237, WO2010/125985, WO2011/043404, WO2011/040629, WO2012/086848, WO2013/018928, WO2015/000715, WO2015/198859, WO2016/039444, WO2016/039441, WO2016/116338 al igual que en WO2015/121136.



Los residuales Aa, Ab, Ac, Ad, Ae, R¹, R⁵, R⁶ y n significan lo descrito más arriba, A² y A³ se refieren a CH o N, X¹ se refiere al halógeno, A⁴ se refiere a O, S o NR⁴, y R⁸ se refiere al (C₁-C₄)alquilo.

Para los compuestos de la Fórmula (I), en los que Q se refiere a Q21, A² se refiere al carbonilo y A³ se refiere a N-R^{6a}.

5 **Paso a, b)**

Los compuestos de la Fórmula (IXa), en donde n se refiere al 2, se pueden preparar por oxidación de los compuestos de la Fórmula (IX), en donde n se refiere al 0. Generalmente, la oxidación se realiza en un disolvente. Se prefieren los hidrocarburos halogenados como el diclorometano, el cloroformo, el tetracloruro de carbono, el 1,2-dicloroetano o el clorobenceno; los alcoholes como el metanol o el etanol; el ácido fórmico y el ácido acético. Ácido propiónico o agua.

10 Ejemplos de agentes de oxidación adecuados son el peróxido de hidrógeno, el ácido metacloroperbenzoico o el periodato de sodio.

La reacción puede realizarse en vacío, con presión normal o presión excesiva y a temperaturas de -20° C a 120° C.

Los compuestos de la Fórmula (IXb), en donde n se refiere al 1, se pueden preparar por oxidación de los compuestos de la Fórmula (IX), en donde n se refiere al 0.

5 Los compuestos de la Fórmula (IXb), en donde n se refiere al 2, se pueden preparar por oxidación de los compuestos de la Fórmula (IX), en donde n se refiere al 1.

Paso c)

10 Los compuestos de la Fórmula (X), en donde n se refiere al 0, 1 o 2, se pueden preparar por saponificación de los compuestos de las Fórmulas (IX, n=0) (IXa, n=2) o (IXb, n=1) en presencia de una base. Generalmente, la saponificación se realiza en un disolvente. Preferentemente, se utilizan alcoholes como metanol o etanol, agua, éteres como el éter diisopropílico, dioxano, el tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, terc. butil metil éter; nitrilos, como el acetonitrilo o propionitrilo; hidrocarburos aromáticos, tales como el tolueno o el xileno; disolventes polares apróticos, como la N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona o dimetilsulfóxido; o mezclas de los disolventes mencionados.

Ejemplos de bases adecuadas son las bases inorgánicas del grupo formado por acetatos, fosfatos y carbonatos de metales alcalinos o alcalinotérreos. Se prefieren el carbonato de cesio, el carbonato de sodio y el carbonato de potasio.

15 La reacción puede realizarse en vacío, con presión normal o presión excesiva y a temperaturas de -20° C hasta 200° C.

Paso d)

Los compuestos de la Fórmula (XI) se pueden preparar mediante la reacción de los compuestos de la Fórmula (II) con ácidos carboxílicos de la Fórmula (X) en presencia de un agente de condensación o una base.

20 Los compuestos de la Fórmula (II) pueden conseguirse en el mercado o fabricarse según los métodos conocidos, por ejemplo, según los procedimientos descritos en US2003/069257, US2012/0319050, WO2011/107998 o WO2010/91310.

25 La reacción de los compuestos de la Fórmula (II) con ácidos carboxílicos de la Fórmula (X), en donde n puede referirse a 0, 1 o 2 puede realizarse en una sustancia o un disolvente, preferentemente la reacción se realiza en un disolvente seleccionado entre los disolventes convencionales, inertes ante las condiciones de reacción predominantes. Preferentemente, se utilizan los éteres como el éter diisopropílico, dioxano, el tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano; los hidrocarburos halogenados como el diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, el 1,2-dicloroetano o clorobenceno; nitrilos, como el acetonitrilo o propionitrilo; hidrocarburos aromáticos, tales como el tolueno o el xileno; disolventes polares apróticos, como la N,N-dimetilformamida o la N-metilpirrolidona, o compuestos que contienen nitrógeno, como la piridina.

30

Los agentes de condensación adecuados son, por ejemplo, las carbodiimidias como el clorhidrato de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida (EDCI), 1,3-diciclohexilcarbodiimida, cloruro de tionilo u cloruro de oxalilo.

35 Las bases adecuadas son las bases inorgánicas, que habitualmente se utilizan en reacciones de este tipo. Preferentemente, se utilizan bases que por ejemplo se seleccionan del grupo conformado por acetatos, fosfatos, carbonatos y carbonatos de hidrógeno de metales alcalinos o alcalinotérreos. Se prefieren especialmente el acetato de sodio, el fosfato de sodio, el fosfato de potasio, el carbonato de cesio, el carbonato de sodio, el carbonato de potasio, el carbonato de hidrógeno de sodio y el carbonato de hidrógeno de potasio. Otras bases adecuadas son los hidruros metálicos alcalinos como el hidruro de sodio.

40 La reacción puede realizarse en vacío, con presión normal o presión excesiva y a temperaturas de 0° C a 180° C, preferentemente la reacción se produce con presión normal y a temperaturas de 20 a 140° C.

Paso e)

Los compuestos de la Fórmula (I), en donde n puede referirse a 0, 1 o 2 se pueden preparar mediante condensación de los compuestos de la Fórmula (XI) en presencia de una base.

45 La reacción para dar compuestos de la Fórmula (I), en donde n puede referirse a 0, 1 o 2, se puede realizar en una sustancia o un disolvente, preferentemente la reacción se realiza en un disolvente seleccionado entre los disolventes convencionales, inertes ante las condiciones de reacción predominantes. Preferentemente, se utilizan los éteres como el éter diisopropílico, dioxano, el tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, terc. Butil metil éter; los hidrocarburos halogenados como el diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, el 1,2-dicloroetano o clorobenceno; nitrilos, como el acetonitrilo o propionitrilo; hidrocarburos aromáticos, tales como el tolueno o el xileno; disolventes polares apróticos, como la N,N-dimetilformamida o la N-metilpirrolidona, o compuestos que contienen nitrógeno, como la piridina.

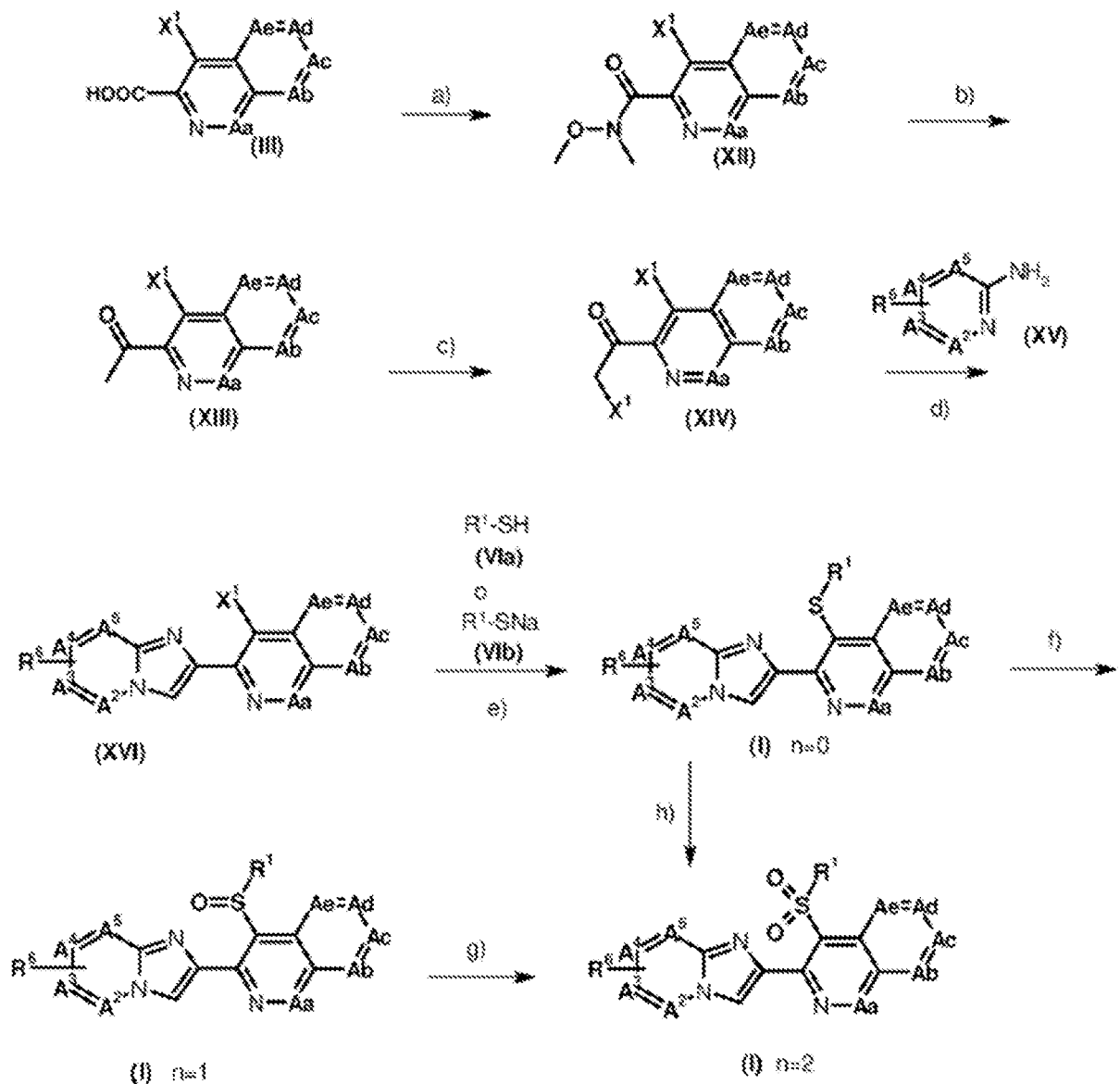
50

Las bases adecuadas son las bases inorgánicas, que habitualmente se utilizan en reacciones de este tipo. Preferentemente, se utilizan bases que por ejemplo se seleccionan del grupo conformado por acetatos, fosfatos, carbonatos y carbonatos de hidrógeno de metales alcalinos o alcalinotérreos. Se prefieren especialmente el acetato de sodio, el fosfato de sodio, el fosfato de potasio, el carbonato de cesio, el carbonato de sodio, el carbonato de potasio, el carbonato de hidrógeno de sodio y el carbonato de hidrógeno de potasio.

La reacción puede realizarse en vacío, con presión normal o presión excesiva y a temperaturas de 0° C hasta 200° C.

Procedimiento D

Los compuestos de la Fórmula (I), en los que Q se refiere a Q10, Q11, Q14 y Q15, se pueden preparar según los métodos conocidos, por ejemplo, según los procedimientos descritos en US2009/203705, US2012/258951, WO2013/3298, WO2016/071214 o J. Med. Chem. **31**, (1988) 1590-1595.



Los radicales Aa, Ab, Ac, Ad, Ae, R¹, R⁵, R⁶ y n significan lo indicado más arriba. A², A³ y A⁵ se refieren a CH o N, A⁴ se refiere a CR⁵ o N (mientras que A², A³, A⁴ y A⁵ no pueden referirse simultáneamente a N) y X¹ se refiere al halógeno.

Paso a)

Los ácidos carboxílicos de la Fórmula (III) se convierten en amidas de la Fórmula (XII) según el proceso descrito en el documento WO2011/75643 o EP2671582, en presencia de clorhidrato de O,N-dimetilhidroxilamina.

Los ácidos carboxílicos de la Fórmula (III) pueden conseguirse en el mercado o fabricarse según los métodos

conocidos. Las vías de fabricación posibles se describen en el procedimiento H, I y J.

Paso b, c)

5 Los compuestos de la Fórmula (XII) pueden convertirse en cetonas de la Fórmula (XIII) a continuación, según los métodos conocidos, por ejemplo, según los procedimientos descritos en el documento WO2011/75643, con un reactivo de Grignard como bromuro de metilmagnesio. Mediante la consecuente halogenación, por ejemplo, como se indica en los métodos conocidos, descritos en US2012/302573, es posible acceder a los compuestos de la Fórmula (XIV).

Paso d)

10 Los compuestos de la Fórmula (XVI) se pueden preparar por ciclización de los compuestos de la Fórmula (XIV) con aminas de la fórmula (XV). La ciclización se realiza, por ejemplo, en etanol, acetonitrilo o N,N-dimetilformamida según los métodos conocidos, por ejemplo, de los métodos descritos en los documentos WO2005/66177, WO2012/88411, WO2013/3298, US2009/203705, US2012/258951, WO2012/168733, WO2014/187762 o J. Med. Chem. **31** (1988) 1590-1595.

Los compuestos de la Fórmula (XV) se consiguen en el mercado.

Paso e)

15 Los compuestos de la Fórmula (I), donde n se refiere a 0, se pueden preparar por la reacción de los compuestos de la Fórmula (XVI) con los compuestos de la Fórmula (VIa) en presencia de una base. Los derivados del mercaptano de la Fórmula (VIa), como el metilmercaptano, etilmercaptano o el isopropilmercaptano, pueden obtenerse en el mercado o fabricarse según los métodos conocidos, por ejemplo, como se describe en los procedimientos en US2006/25633, US2006/111591, US2820062, Chemical Communications, 13 (2000), 1163-1164 o Journal of the American Chemical Society, 44 (1922), pág. 1329.

20

Como alternativa, se pueden utilizar directamente las sales de los derivados del mercaptano de la Fórmula (VIb), por ejemplo, el etanolato de sodio, el metilolato de sodio o el isopropanetiolato sodio, sin añadir ninguna otra base.

Paso f, g)

25 Los compuestos de la Fórmula (I), en donde n se refiere al 1, se pueden preparar por oxidación de los compuestos de la Fórmula (I), en donde n se refiere al 0. La oxidación se realiza según los métodos conocidos con los agentes de oxidación adecuados, por ejemplo, el peróxido de hidrógeno, el ácido metacloroperbenzoico o el periodato de sodio.

Los compuestos de la Fórmula (I), en donde n se refiere al 2, se pueden preparar por oxidación de los compuestos de la Fórmula (I), en donde n se refiere al 1.

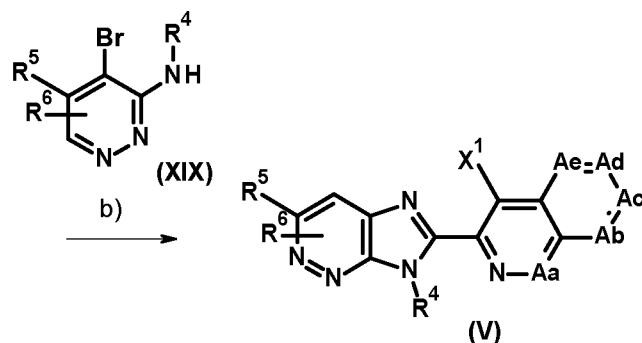
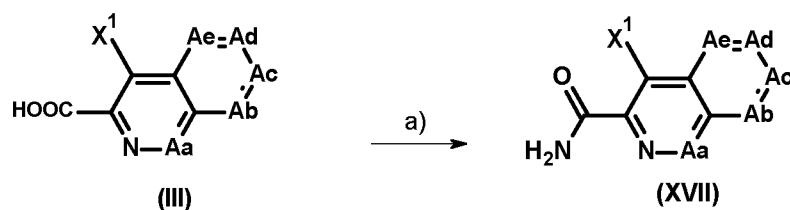
30 Generalmente, la oxidación se realiza en un disolvente. Se prefieren los hidrocarburos halogenados como el diclorometano, el cloroformo, el tetracloruro de carbono, el 1,2-dicloroetano o el clorobenceno; los alcoholes como el metanol o el etanol; el ácido fórmico y el ácido acético. Ácido propiónico o agua. Ejemplos de agentes de oxidación adecuados son el peróxido de hidrógeno, el ácido metacloroperbenzoico o el periodato de sodio.

Paso h)

35 Los compuestos de la Fórmula (I), en donde n se refiere al 2, también se pueden fabricar en un proceso de un solo paso por oxidación de los compuestos de la Fórmula (I), en donde n se refiere al 0. Generalmente, la oxidación se realiza en un disolvente. Se prefieren los hidrocarburos halogenados como el diclorometano, el cloroformo, el tetracloruro de carbono, el 1,2-dicloroetano o el clorobenceno; los alcoholes como el metanol o el etanol; el ácido fórmico y el ácido acético. Ácido propiónico o agua. Ejemplos de agentes de oxidación adecuados son el peróxido de hidrógeno, el ácido metacloroperbenzoico o el periodato de sodio.

40 **Procedimiento E**

Los compuestos de la Fórmula (I), en los que Q se refiere a Q16, se pueden preparar según los métodos conocidos, por ejemplo, según los procedimientos descritos en WO2014/142292.



Los radicales Aa, Ab, Ac, Ad, Ae, R⁴, R⁵ y R⁶ significan lo indicado más arriba. X¹ se refiere al halógeno.

Paso a)

5 Los compuestos de la Fórmula (XVII) pueden prepararse según los procedimientos descritos en US5374646 o en *Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters* 2003, 13, 1093 - 1096, mediante la reacción de los compuestos de la Fórmula (III) con una fuente de amoníaco en presencia de un agente de condensación.

Los ácidos carboxílicos de la Fórmula (III) pueden conseguirse en el mercado o fabricarse según los métodos conocidos. Las vías de fabricación posibles se describen en el procedimiento H, I y J.

10 La reacción de los compuestos de la Fórmula (III) con la fuente de amoníaco se realiza preferentemente en un disolvente seleccionado entre los disolventes convencionales, inertes ante las condiciones de reacción predominantes. Preferentemente, se utilizan etanos como dioxano o tetrahidrofurano.

Un agente de condensación adecuado es, por ejemplo, el carbonildiimidazol.

La reacción se puede realizar en vacío, con presión normal o presión excesiva. Preferentemente, la reacción se realiza con presión normal y temperaturas de 20° C hasta 70 C.

15 Paso b)

De manera análoga al procedimiento descrito en WO2014/142292, los compuestos de la Fórmula (V) se pueden preparar mediante la reacción de los compuestos de la Fórmula (XVII) con compuestos de la Fórmula (XIX) en presencia de un catalizador de paladio en el estado básico.

20 Los compuestos de la Fórmula (XIX) pueden prepararse, por ejemplo, según los procedimientos descritos en WO2014/142292. Como catalizador paladio se puede utilizar, por ejemplo, [1,1'-Bis-(difenilfosfino)ferroceno]dicloropaladio(II). Como base, frecuentemente se utiliza bases inorgánicas como tert-butanolato de potasio.

La reacción se realiza en un disolvente. Frecuentemente, se utiliza el tolueno.

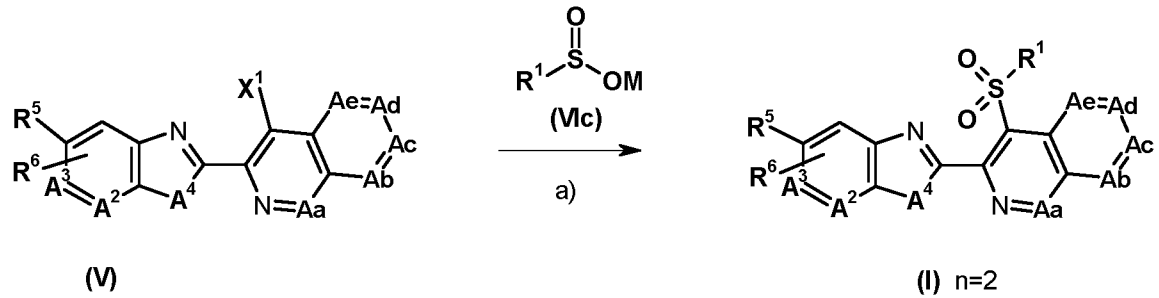
25 La reacción se puede realizar en vacío, con presión normal o presión excesiva. Preferentemente, la reacción se realiza con presión normal y temperaturas de 20° C hasta 110 C.

La siguiente reacción de compuestos de la Fórmula (V) para dar compuestos de la Fórmula (I) se realiza como en el procedimiento A.

Procedimiento F

30 Los compuestos de la Fórmula (I), en los que n se refiere a 2 y Q se refiere a Q1 hasta Q9, Q16, Q19 o Q21, se pueden preparar según los métodos conocidos, por ejemplo, al igual que en los procedimientos descritos en , WO2009/131237, WO2010/125985, WO2011/043404, WO2011/040629, WO2012/086848, WO2013/018928, WO2015/000715 al igual

que en WO2015/121136.



Los radicales Aa, Ab, Ac, Ad, Ae, R¹, R⁵, R⁶, A² y A³ significan lo descrito más arriba, A⁴ se refiere a O, S o N-R⁴ y X¹ se refiere al halógeno, preferentemente bromo o yodo.

5 **Paso a)**

Como alternativa, los compuestos de la Fórmula (I), en donde n se refiere al 2, también se pueden preparar en un proceso de un solo paso, por ejemplo, al igual que los procedimientos descritos en *Journal of Organic Chemistry* 2005, 70, 2696-2700 mediante un intercambio de halógenos y sulfonas con un compuesto de la Fórmula (Vlc) partiendo de la base de compuestos de la Fórmula (V). Generalmente, el intercambio se realiza en un disolvente. Preferentemente, se utilizan disolventes apróticos, por ejemplo, sulfóxido de dimetilo y N,N-dimetilformamida.

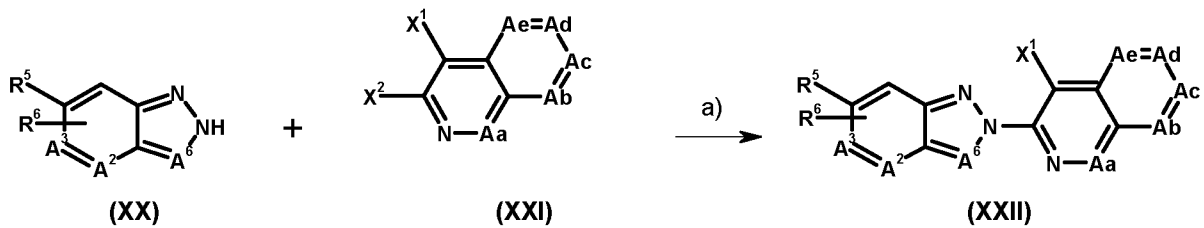
Los compuestos de la Fórmula (Vlc) se pueden conseguir en el mercado o fabricar según los métodos conocidos, por ejemplo, como se describe en los procedimientos en *Organic Synthesis* 1977, 57, 88-92; *Tetrahedron Letters* 1979, 9, 821-824 Bulletin de la Societe *Chimique de France* 1958, 4, 447-450.

Ejemplos de reactivos azufrados adecuados son las sales de litio, sodio o potasio del ácido sulfínico.

15 La reacción puede realizarse en vacío, con presión normal o presión excesiva y a temperaturas de -20° C a 120° C.

Procedimiento G

Los compuestos de la Fórmula (I), en los que Q se refiere a Q12, Q13, Q17, Q18 y Q20, se pueden preparar según los métodos conocidos, por ejemplo, según los procedimientos descritos en WO2010/091310, WO 2012/66061 o WO2013/099041.



Los radicales Aa, Ab, Ac, Ad, Ae, R⁵ y R⁶ significan lo indicado más arriba. A², A³ y A⁶ se refieren a CH o N. X¹ y X² se refieren al halógeno.

Paso a)

25 Los compuestos de la Fórmula (XXII) se pueden preparar por reacción de los compuestos de la Fórmula (XX) con compuesto de la Fórmula (XXI) en condiciones básicas, por ejemplo, según los procedimientos descritos en WO2010/091310, WO 2012/66061, WO2013/099041 o *Tetrahedron* 1993, 49, 10997-11008.

Los compuestos de la Fórmula (XX) se pueden conseguir en el mercado o se pueden preparar según los métodos conocidos, por ejemplo, según los procedimientos descritos en WO2005/100353, WO 2012/66061 o en *European Journal of Medicinal Chemistry* 2010, 45, 2214 - 2222.

30 Los compuestos de la Fórmula (XXI) se pueden conseguir en el mercado o se pueden preparar según los métodos conocidos, por ejemplo, según los procedimientos descritos en WO2013/43518, EP2168965 o en *Journal of Medicinal Chemistry* 2003, 46, 1449 - 1455.

Como bases, se utilizan en su mayoría bases inorgánicas como hidruro de sodio, carbonato de potasio o carbonato de cesio.

35 La reacción para dar compuestos de la Fórmula (XXII) se realiza en su mayoría en un disolvente, preferentemente en

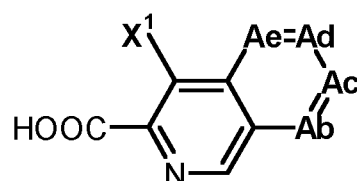
un nitrilo, como acetonitrilo o propionitrilo o en un disolvente aprótico, polar, como por ejemplo, N,N-dimetilformamida o N-metilpirrolidona.

La reacción puede realizarse en vacío, con presión normal o presión excesiva y a temperaturas de 0° C hasta 200° C.

5 Como alternativa, la reacción de los compuestos de la Fórmula (XX) con los compuestos de la Fórmula (XXI) para dar compuestos de la Fórmula (XXII) también se puede realizar mediante la N-arilación catalizada por el paladio, por ejemplo, como se describe en los procedimientos en *Angewandte Chemie* Int. Ed. 2011, (50) 8944-8947.

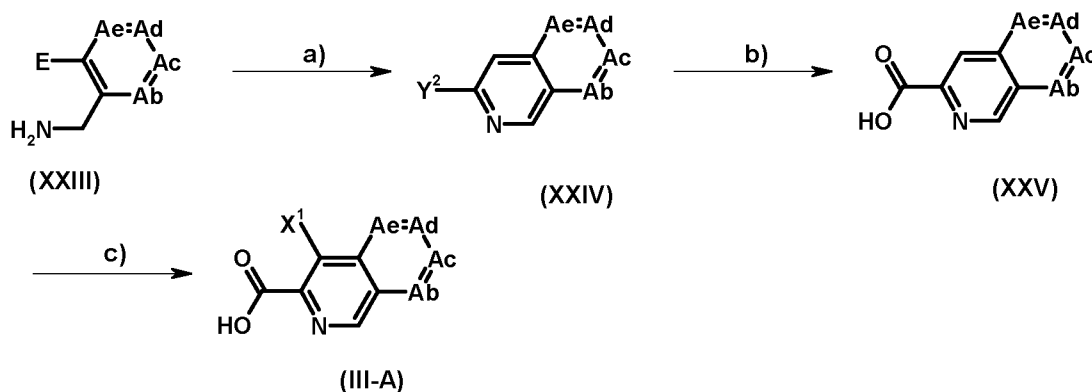
La siguiente reacción de compuestos de la Fórmula (XXII) para dar compuestos de la Fórmula (I) se realiza como en el procedimiento A.

Procedimiento H



(III-A)

10 Los ácidos carboxílicos de la Fórmula (III-A), en la que Aa se refiere a =C(H), se consiguen en el mercado o pueden prepararse mediante métodos conocidos, por ejemplo, a partir de bencilaminas o hetarilmetanaminas según los procedimientos descritos en *Tetrahedron*, **40** (1984), 311-314, *Monatshefte für Chemie*, **139** (2008), 673-684, Synlett, **3** (2006), 379-382; *Indian Journal of Chemistry, Section B: Organic Chemistry Including Medicinal Chemistry*, **22B** (1983), 178-179; *Journal of Organic Chemistry*, **55** (1990), 2838-2842; *Heterocycles*, **60** (2003), 953-957; *Chemical Communications*, **2** (2002), 180-181, WO2015/071178, *Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters*, **24** (2014), 4236-4238; *Tetrahedron*, **58** (2002), 6723-6728 además de WO2003/010146.



20 Los radicales Ab, Ac, Ad y Ae significan lo indicado más arriba. E se refiere al hidrógeno o halógeno y X¹ se refiere al halógeno. Y² se refiere al metilo, C(O)OR⁸ o ciano. R⁸ se refiere al hidrógeno o C₁-C₆-alquilo.

Paso a)

25 Los compuestos de la Fórmula (XXIV) se pueden sintetizar según los procesos descritos en *Tetrahedron*, **40** (1984), 311-314 o en *Monatshefte für Chemie*, **139** (2008), 673-684 mediante la condensación de bencilaminas o hetarilmetanaminas de la Fórmula (XXIII) con los correspondientes compuestos de carbonilo en condiciones ácidas o básicas.

Los compuestos de la Fórmula (XXIII) se pueden conseguir en el mercado o se pueden preparar según los métodos conocidos, por ejemplo, según los procedimientos descritos en WO1997/41846; US2011/0105753; *Journal of Medicinal Chemistry*, **46** (2003), 461-473; WO2010/024430; WO2005/111003; *Journal of Heterocyclic Chemistry*, **23** (1986), 989-990.

30 Paso b)

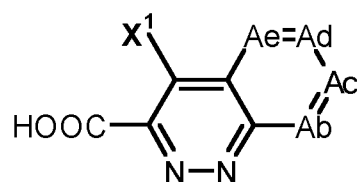
Los compuestos de la Fórmula (XXV) se pueden preparar según los métodos conocidos, por ejemplo mediante una hidrólisis de los compuestos de la Fórmula (XXIV) (para el caso Y² = C(O)OR⁸ o ciano) en condiciones ácidas, básicas o térmicas.

Los compuestos de la Fórmula (XXV) se pueden preparar según *Synlett*, **3** (2006), 379-382; *Indian Journal of Chemistry, Section B: Organic Chemistry Including Medicinal Chemistry*, **22B** (1983), 178-179; *Journal of Organic Chemistry*, **55** (1990), 2838-2842; *Heterocycles*, **60** (2003), 953-957; *Chemical Communications*, **2** (2002), 180-181 además de WO2015/071178.

5 Paso c)

Los compuestos de la Fórmula (III-A) pueden prepararse según los métodos conocidos compuestos de la Fórmula (XXV) mediante una halogenación. Por ejemplo, mediante la orto-literación dirigida, seguida de la captura del carbanio con una halogenación realizada con un reactivo adecuado de halogenación electrofílica o, como alternativa, a través de un derivado de ácido carboxílico según los procedimientos descritos en *Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters*, **24** (2014), 4236-4238; *Tetrahedron*, **58** (2002), 6723-6728 y en WO2003/010146.

10 Procedimiento I

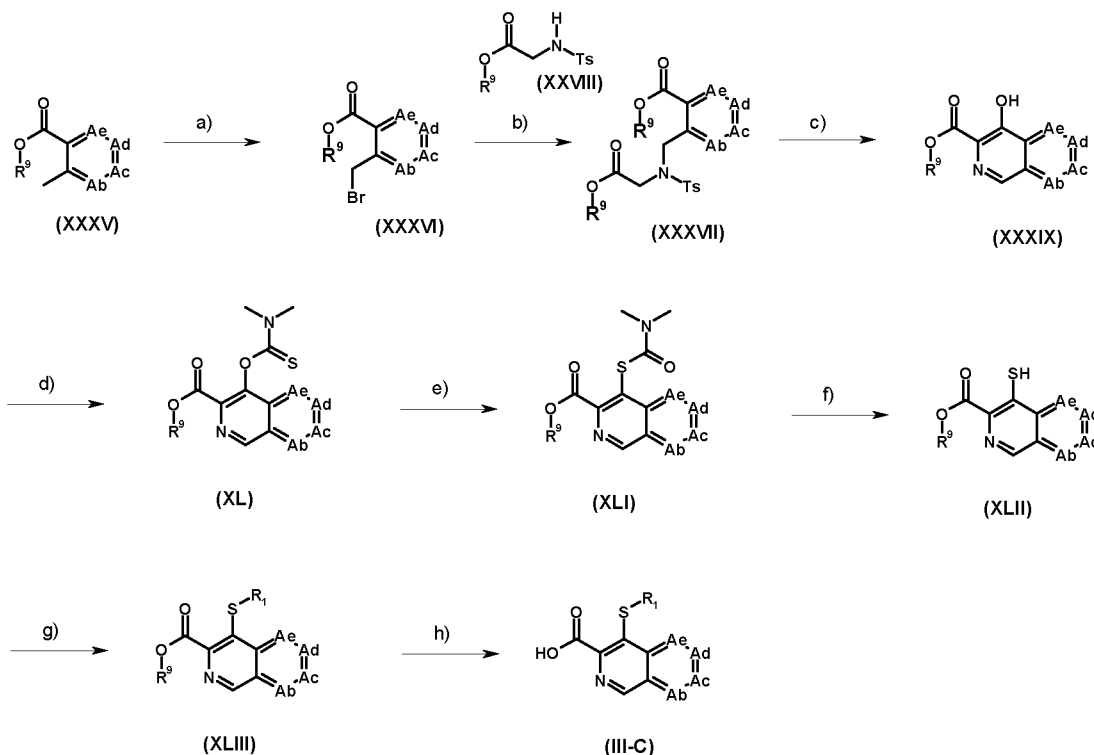


(III-B)

Los ácidos carboxílicos de la Fórmula (III-B), en los que Aa se refiere al nitrógeno, Ab, Ac, Ad y Ae significan lo descrito más arriba y X¹ se refiere al halógeno, pueden conseguirse en el mercado o prepararse según los métodos conocidos, por ejemplo, como se describe en el procedimiento H del documento WO2017/072039.

15 Procedimiento J

Los ácidos carboxílicos de la Fórmula (III-C) en la que Aa se refiere al carbono, Ab, Ac, Ad, Ae y R¹ significan lo descrito más arriba, R⁹ se refiere al C₁-C₄ alquilo y Ts se refiere al tosil Tosil (CH₃C₆H₄SO₂-) y uno de los sustituyentes R⁸, R⁹, R¹⁰ o R¹¹ se refiere al halógeno (preferentemente bromo o yodo), pueden prepararse, por ejemplo, mediante el procedimiento descrito a continuación.



Paso a)

Los compuestos de la Fórmula (XXXVI) se pueden conseguir en el mercado o prepararse según los procedimientos

descritos en *Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters* 2016, 26, 2526-2530 o *Tetrahedron Letters* 2012, 53, 3654-3657, de compuestos de la Fórmula (XXXV) sobre una bromación radical.

5 Como reacción de bromación puede utilizarse, por ejemplo, la N-bromosuccinimida. Los compuestos azules como el azoisobutironitrilo (AIBN) o los peróxidos como el peróxido de dibenzoilo pueden utilizarse como iniciadores de radicales.

Preferentemente, como disolvente puede utilizarse un disolvente aprótico, como el tetracloruro de carbono.

La reacción puede realizarse en vacío, con presión normal o presión excesiva y a temperaturas de -20° C a 120° C.

Los compuestos de la Fórmula (XXXV) se consiguen en el mercado.

Paso b)

10 Los compuestos de Fórmula (XXXVII) pueden prepararse según los procedimientos descritos en el documento WO2007/090068 mediante aminación con un compuesto de Fórmula (XXXVI) y el compuesto de Fórmula (XXXVIII) en presencia de una base.

Los compuestos de la Fórmula (XXXVIII) se consiguen en el mercado.

15 Las bases apropiadas son, por ejemplo, bases inorgánicas como las bases de carbonato. Como disolventes, se pueden utilizar los disolventes apróticos polares como la N,N-dimetilformamida o el tetrahidrofurano.

La reacción puede realizarse en vacío, con presión normal o presión excesiva y a temperaturas de -20° C a 120° C.

Paso c)

20 Los compuestos de la Fórmula (XXXIX) pueden sintetizarse mediante la ciclización de los compuestos de la Fórmula (XXXVII) según los procedimientos descritos en el documento WO2007/090068. La reacción puede tener lugar en presencia de una base, por ejemplo, pueden utilizarse bases de alcóxido como el meóxido o el etóxido de sodio o de potasio.

Los disolventes adecuados son los disolventes protéticos, como los alcoholes de cadena corta, como el metanol o el etanol.

La reacción puede realizarse en vacío, con presión normal o presión excesiva y a temperaturas de -20° C a 120° C.

25 **Paso d)**

Los compuestos de la Fórmula (XL) pueden prepararse según los procedimientos descritos en *Tetrahedron*, 2007, 63, 4120-4125 o en *Journal of the American Chemical Society* 2015, 137, 15684-15687, utilizando como reactivo el cloruro de dimetiltiocarbamoilo en presencia de una base, a partir de compuestos de la Fórmula (XXXIX).

30 Las bases adecuadas son, por ejemplo, el hidruro de sodio o 1,4-diazabicyclo[2,2.2]octano (DABCO). Los disolventes apróticos polares como la N,N-dimetilformamida o el tetrahidrofurano pueden utilizarse como disolventes.

La reacción puede realizarse en vacío, con presión normal o presión excesiva y a temperaturas de -20° C a 120° C.

Paso e)

35 Los compuestos de la Fórmula (XLI) pueden prepararse mediante un reordenamiento denominado Newman-Kwart según los procedimientos descritos en *Tetrahedron*, 2007, 63, 4120-4125, WO2001/000206 o WO2008/018427 a partir de los compuestos de la Fórmula (XL).

Como disolventes pueden utilizarse, por ejemplo, el éter de difenilo, la N,N-dimetilformamida o la N-metil-2-pirrolidona.

La reacción puede realizarse en vacío, con presión normal o presión excesiva y a temperaturas de 100 C a 250° C.

Paso f)

40 Los compuestos de Fórmula (XLII) pueden prepararse a partir de compuestos de Fórmula (XLI) según los procedimientos descritos en WO2001/000206, *Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters*, 2014, 24, 72-76 o WO2008/061741 en presencia de una base, por ejemplo pueden utilizarse bases de alcóxido como el meóxido o el etóxido de sodio o de potasio.

Los disolventes adecuados son los disolventes protéticos, como los alcoholes de cadena corta, como el metanol o el etanol.

45 La reacción puede realizarse en vacío, con presión normal o presión excesiva y a temperaturas de -20° C a 120° C.

Paso g)

Los compuestos de Fórmula (XLIII) pueden prepararse a partir de compuestos de Fórmula (XLII) según los procedimientos descritos en *Organic Letters*, 2016, 18, 2966-2969, *Journal of the American Chemical Society*, 2017, 139, 9605-9614 o *Synthesis*, 2017, 49, 917-924, en presencia de una base, por ejemplo, pueden utilizarse bases de alcóxido como el meóxido o el etóxido de sodio o de potasio.

Como agentes alquilantes se utilizan los halogenuros de alquilo, como los cloruros, bromuros o yoduros de alquilo.

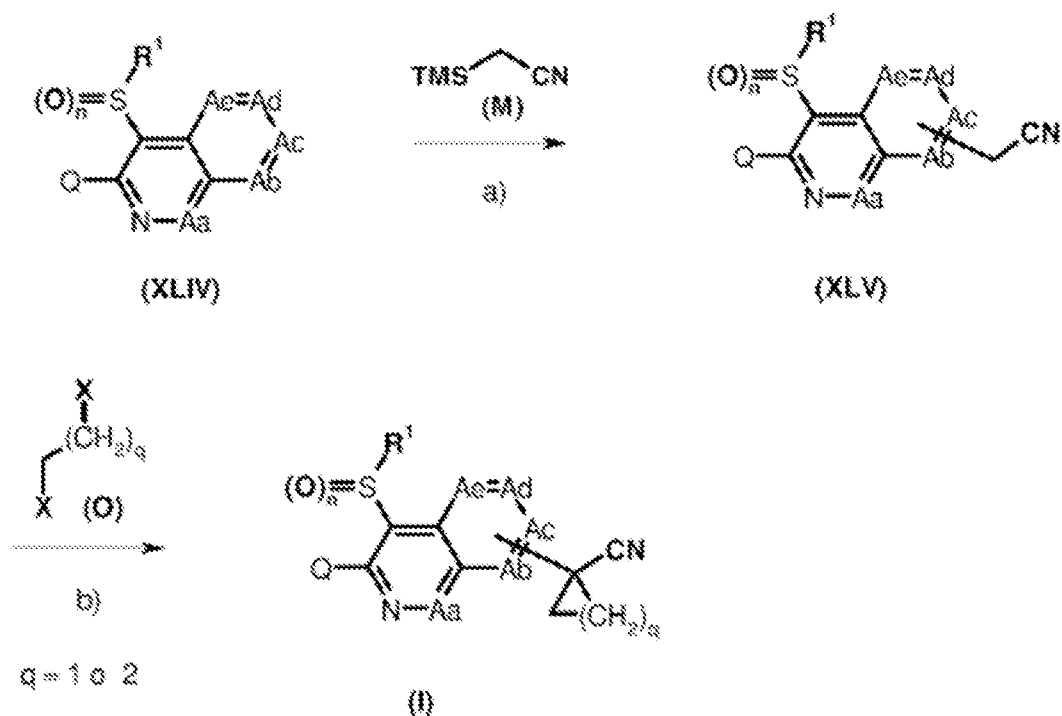
La reacción puede realizarse en vacío, con presión normal o presión excesiva y a temperaturas de -20° C a 120° C.

Paso h)

Los compuestos de la Fórmula (III-C) pueden sintetizarse según los procedimientos descritos en *Synthesis* 1987, 6, 586-587, *Tetrahedron Letters* 2006, 47, 565-567 o *ChemMedChem* 2010, 5, 65-78, mediante saponificación de los compuestos de la Fórmula (XLIII).

Las bases adecuadas son, por ejemplo, hidróxido de litio o hidróxido de sodio. Como solvente pueden utilizarse disolventes polares apróticos y próticos además de mezclas de estos, por ejemplo, etanol, tetrahidrofurano o agua.

La reacción puede realizarse en vacío, con presión normal o presión excesiva y a temperaturas de -20° C a 120° C.

15 **Procedimiento L**

Los radicales Aa, Ab, Ac, Ad, Ae, Q, R1 y n significan lo descrito más arriba. q se refiere a 1 o 2 y X se refiere al halógeno, donde uno de los sustituyentes R⁸, R⁹, R¹⁰ o R¹¹ se refiere al halógeno (preferentemente bromo o yodo).

20 **Paso a)**

Los compuestos de la Fórmula (XLV) pueden prepararse mediante cianometilación de los compuestos de la Fórmula (XLIV) con un compuesto de Fórmula (M) en presencia de un catalizador, un ligando y una base, por ejemplo, según los procedimientos descritos en *J. Am. Chem. Soc.* (2002), 124, 9330, *J. Am. Chem. Soc.* (2005), 127, 15824 o WO2016/041819.

25 Los compuestos de la Fórmula (M) se consiguen en el mercado.

La reacción para dar compuestos de la Fórmula (XLV) se realiza generalmente en un disolvente. Son preferentes los disolventes polares apróticos como la N,N-dimetilformamida, la N-metilpirrolidona o el dimetilsulfóxido.

Los complejos de paladio pueden utilizarse como catalizadores, como el tris(acetona dibenilideno)dipaladio(0) o el [1,1'-bis(difenilfosfina)ferroceno]-dicloropaladio(II), y los compuestos organofosforados suelen utilizarse como ligandos, como el bis(difenilfosfina)-9,9-dimetilxanteno (xanfos).

Una base adecuada es, por ejemplo, el fluoruro de cinc.

- 5 La reacción puede realizarse en vacío, con presión normal o presión excesiva y a temperaturas de 0° C hasta 200° C.
- Como alternativa, la cianometilación también puede realizarse con ayuda de un acoplamiento Suzuki, por ejemplo, según el procedimiento descrito en *J. Am. Chem. Soc.* (2011), (133) 6948-6951.

Paso b)

- 10 Los compuestos de la Fórmula (I), donde n se refiere a 2, pueden prepararse mediante la reacción de los compuestos de la Fórmula (XLV) con los compuestos de la Fórmula (O) en presencia de una base según los procedimientos descritos en WO2016/041819.

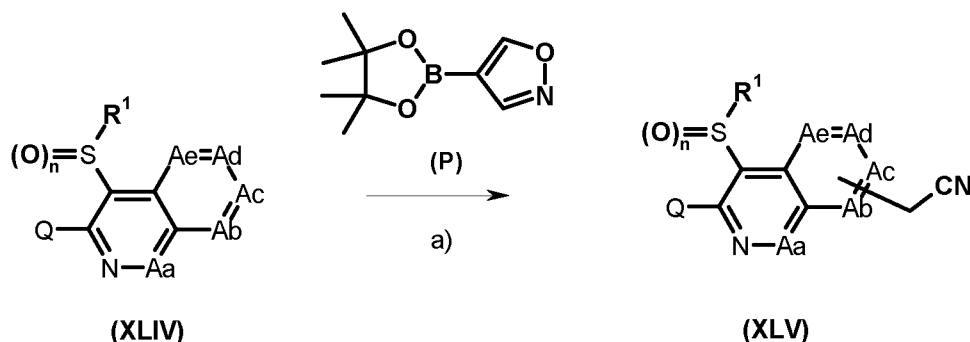
Los compuestos de la Fórmula (O) se consiguen en el mercado.

- 15 La reacción para dar compuestos de la Fórmula (I), donde n se refiere al 2, se realiza generalmente en un disolvente. Son preferentes los hidrocarburos halogenados como el diclorometano, el cloroformo, el tetracloruro de carbono, el 1,2-dicloroetano o el clorobenceno, los disolventes polares apróticos como la acetona, la N,N-dimetilformamida, la N-metilpirrolidona, el dimetilsulfóxido, los nitrilos como el acetonitrilo, o los ésteres como el acetato de etilo.

Ejemplos de bases adecuadas son los heterociclos que contienen nitrógeno, como la piridina, el 1,8-diazabicyclo[5,4,0]-7-undeceno (DBU); las aminas terciarias, como la trietilamina y la N,N-diisopropilamina; las bases inorgánicas, como el fosfato de potasio, el carbonato de cesio, el carbonato de potasio y el hidruro de sodio.

- 20 La reacción puede realizarse en vacío, con presión normal o presión excesiva y a temperaturas de 0° C hasta 200° C.
- Los compuestos correspondientes con n=0 o n=1 pueden prepararse de manera análoga.

Procedimiento M



- 25 Los radicales Aa, Ab, Ac, Ad, Ae, Q, R¹ y n significan lo descrito más arriba, donde uno de los sustituyentes R⁸, R⁹, R¹⁰ o R¹¹ se refiere al halógeno (preferentemente bromo o iodo).

Paso a)

- 30 Los compuestos de la Fórmula (XLV) pueden prepararse mediante cianometilación de los compuestos de la Fórmula (XLIV) con un compuesto de Fórmula (P) en un procedimiento Mulligan en presencia de un catalizador, un ligando y una base, por ejemplo, según el procedimiento descrito en *J. Am. Chem. Soc.* (2011), (133) -6948.

La reacción se realiza mediante un acoplamiento Suzuki con la subsiguiente fragmentación del isoxazol inducida por la base.

Los complejos de fosfato de paladio, como el 1,1-bis(difenilfosfina)ferroceno dicloropaladio(II), pueden utilizarse como catalizadores de la reacción. Las bases preferentes son, por ejemplo, el fluoruro de potasio o el fluoruro de cesio.

- 35 La reacción para dar compuestos de la Fórmula (XLV) se realiza generalmente en un disolvente. Son preferentes las mezclas de un disolvente polar aprótico como la N,N-dimetilformamida o el dimetilsulfóxido con agua.

La reacción puede realizarse en vacío, con presión normal o presión excesiva y a temperaturas de 20° C hasta 200° C. Las temperaturas preferentes son 130-140 C.

El compuesto de la Fórmula (P) (éster de pinacol de ácido borónico 4-isoxazol) se consigue en el mercado.

La siguiente reacción para dar compuestos de la Fórmula (I) se realiza como en el procedimiento L.

Procedimientos y usos

5 La invención también se refiere al procedimiento para combatir las plagas animales, que permite que los compuestos de la Fórmula (I) actúen sobre las plagas animales y/o en su hábitat. Es preferente combatir las plagas animales en la agricultura y silvicultura y en la protección de materiales. Preferentemente, se excluyen los procedimientos quirúrgicos o terapéuticos para el cuerpo humano o animal y los procedimientos de diagnóstico realizados en el cuerpo humano o animal.

10 La invención también incluye el uso de los compuestos de la Fórmula (I) como plaguicida, especialmente como producto fitosanitario.

En el marco de la presente solicitud, el término plaguicida siempre comprende también el concepto de producto fitosanitario, correspondientemente.

15 Siempre que presenten una buena tolerancia para las plantas, una toxicidad favorable para los animales de sangre caliente y una buena compatibilidad ambiental, los compuestos de la Fórmula (I) son adecuados para proteger las plantas y los órganos vegetales contra los factores de estrés bióticos y abióticos, para aumentar el rendimiento de las cosechas, mejorar la calidad de los cultivos y combatir las plagas animales, en particular insectos, arácnidos, helmintos, especialmente nematodos, y moluscos, que se encuentran en la agricultura, la horticultura, la ganadería, la acuicultura, la silvicultura, los jardines y las instalaciones recreativas, en la protección de productos almacenados y de materiales y también en el sector de higiene.

20 En el marco de la presente solicitud de patente, el concepto "higiene" debe entenderse como todas y cada una de las medidas, disposiciones y procedimientos, cuya finalidad consiste en prevenir las enfermedades, en particular las infecciosas, y que sirven para proteger la salud humana y animal y/o proteger el medio y/o mantener la limpieza. De acuerdo con la invención, esto incluye especialmente medidas de limpieza, desinfección y esterilización, por ejemplo de textiles o superficies duras, especialmente superficies de vidrio, madera, cemento, porcelana, cerámica, plástico o también metal(es), para garantizar que estén libres de plagas higiénicas y/o sus excrementos. En este sentido, quedan preferentemente excluidos del ámbito de protección de la invención los tratamientos quirúrgicos o terapéuticos practicados en el cuerpo humano o animal y las pruebas de diagnóstico realizadas en el cuerpo humano o animal.

25 El concepto "sector de higiene" comprende todos los ámbitos, campos técnicos y aplicaciones industriales en los que estas medidas, disposiciones y procedimientos de higiene son importantes, por ejemplo, en lo que respecta a la higiene de las cocinas, panaderías, aeropuertos, baños, piscinas, grandes centros de compra, hoteles, hospitales, establos, cría de animales, entre otros.

30 Por lo tanto, el concepto "plaga higiénica" debe entenderse como una o más plagas animales, cuya presencia en el sector de la higiene es problemática, en particular por razones sanitarias. Por ese motivo, un objetivo principal consiste en prevenir o minimizar la presencia y/o exposición a las plagas higiénicas en el sector de la higiene. Esto se puede lograr especialmente utilizando un pesticida que sirva tanto para evitar una infestación como también para prevenir una infestación ya existente. También es posible utilizar preparados que prevengan o reduzcan la exposición a las plagas. Por ejemplo, entre las plagas higiénicas se encuentran los organismos que se mencionan a continuación.

35 Por lo tanto, el término "protección higiénica" comprende todas las acciones que mantienen y/o mejoran estas medidas, disposiciones y procedimientos relativos a la higiene.

40 Los compuestos de la Fórmula (I) pueden utilizarse preferentemente como plaguicidas. Son eficaces contra las especies normalmente sensibles y resistentes y contra todas o algunas etapas de desarrollo. Entre las plagas mencionadas más arriba, se encuentran las siguientes:

45 Plagas del filo Arthropoda, en particular de la clase Arachnida, por ejemplo *Acarus* spp., por ejemplo, *Acarus siro*, *Aceria kuko*, *Aceria sheldoni*, *Aculops* spp., *Aculus* spp., por ejemplo *Aculus fockeui*, *Aculus schlechtendali*, *Amblyomma* spp., *Amphitetranychus viennensis*, *Argas* spp., *Boophilus* spp., *Brevipalpus* spp., por ejemplo *Brevipalpus phoenicis*, *Bryobia graminum*, *Bryobia praetiosa*, *Centruroides* spp., *Choriotptes* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Dermatophagoides pteronyssinus*, *Dermatophagoides farinae*, *Dermacentor* spp., *Eotetranychus* spp., por ejemplo, *Eotetranychus hicorniae*, *Epitrimerus pyri*, *Eutetranychus* spp., p. ej. *Eriophyes pyri*, *Glycyphagus domesticus*, *Halotydeus destructor*, *Hemitarsonemus* spp., p. ej. *Hemitarsonemus latus* (=Polyphagotarsonemus latus), *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Latrodectus* spp., *Loxosceles* spp., *Neutrombicula autumnalis*, *Nuphessa* spp., *Oligonychus* spp., por ejemplo, *Oligonychus coffeae*, *Oligonychus coniferarum*, *Oligonychus ilicis*, *Oligonychus indicus*, *Oligonychus mangiferus*, *Oligonychus pratensis*, *Oligonychus punicae*, *Oligonychus yothersi*, *Ornithodoros* spp., *Ornithonyssus* spp., *Panonychus* spp., por ejemplo *Panonychus citri* (=Metatetranychus citri), *Panonychus ulmi* (=Metatetranychus ulmi), *Philoloptruta oleivora*, *Platytetranychus multidigituli*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Psoroptes* spp.,
50 *Rhipicephalus* spp., *Rhizoglyphus* spp., *Sarcoptes* spp., *Scorpio maurus*, *Steneotarsonemus* spp., *Steneotarsonemus spinki*, *Tarsonemus* spp., por ejemplo, *Tarsonemus confusus*, *Tarsonemus pallidus*, *Tetranychus* spp., por ejemplo,

Tetranychus canadensis, *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus turkestanii*, *Tetranychus urticae*, *Trombicula alfreddugesi*, *Vaejovis* spp., *Vasates lycopersici*;

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

del orden o clase de Collembola, por ejemplo, *Onychiurus armatus*; *Sminthurus viridis*;

5 de la clase de Diplopoda, por ejemplo, *Blaniulus guttulatus*;

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

10 del orden de los coleópteros, por ejemplo, *Acalymma vittatum*, *Acanthoscelides obtectus*, *Adoretus* spp., *Aethina tumida*, *Agelastica alni*, *Agrilus* spp., por ejemplo, *Agrilus planipennis*, *Agrilus coxalis*, *Agrilus bilineatus*, *Agrilus anxius*, *Agriotes* spp., p. ej. *Agriotes linneatus*, *Agriotes mancus*, *Alphitobius diaperinus*, *Amphimallon solstitialis*, *Anobium punctatum*, *Anoplophora* spp., p. ej. *Anoplophora glabripennis*, *Anthonomus* spp., p. ej. *Anthonomus grandis*, *Anthrenus* spp., *Apion* spp., *Apogonia* spp., *Atomaria* spp., p. ej. *Atomaria linearis*, *Attagenus* spp., *Baris caerulescens*, *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp., p. ej. *Bruchus pisorum*, *Bruchus rufimanus*, *Cassida* spp., *Cerotoma trifurcata*, *Ceutorrhynchus* spp., p. ej. *Ceutorrhynchus assimilis*, *Ceutorrhynchus quadridens*, *Ceutorrhynchus rapae*, *Chaetocnema* spp., p. ej. *Chaetocnema confinis*, *Chaetocnema denticulata*, *Chaetocnema ectypa*, *Cleonus mendicus*, *Conoderus* spp., *Cosmopolites* spp., p. ej. *Cosmopolites sordidus*, *Costelytra zealandica*, *Ctenicera* spp., *Curculio* spp., por ejemplo *Curculio caryae*, *Curculio caryatipes*, *Curculio obtusus*, *Curculio sayi*, *Cryptolestes ferrugineus*, *Cryptolestes pusillus*, *Cryptorhynchus lapathi*, *Cryptorhynchus mangiferae*, *Cylindrocopturus* spp., *Cylindrocopturus adpersus*, *Cylindrocopturus furnissi*, *Dendroctonus* spp., por ejemplo, *Dendroctonus ponderosae*, *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp., por ejemplo, *Diabrotica balteata*, *Diabrotica barberi*, *Diabrotica undecimpunctata howardi*, *Diabrotica undecimpunctata*, *Diabrotica virgifera virgifera*, *Diabrotica virgifera zaeae*, *Dichocrocis* spp., *Dicladispa armigera*, *Diloboderus* spp., *Epicaerus* spp., *Epilachna* spp., p. ej. *Epilachna borealis*, *Epilachna varivestis*, *Epitrix* spp., p. ej. *Epitrix cucumeris*, *Epitrix fuscata*, *Epitrix hirtipennis*, *Epitrix subcrinita*, *Epitrix tuberis*, *Faustinus* spp., *Gibbium psylloides*, *Gnathocerus cornutus*, *Hellula undalis*, *Heteronychus arator*, *Heteronyx* spp., *Hylamorpha elegans*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera postica*, *Hypomeces squamosus*, *Hypothenemus* spp., por ejemplo, *Hypothenemus hampei*, *Hypothenemus obscurus*, *Hypothenemus pubescens*, *Lachnosterna consanguinea*, *Lasioderma serricorne*, *Latheticus oryzae*, *Lathridius* spp., *Lema* spp., *Leptinotarsa decemlineata*, *Leucoptera* spp., como *Leucoptera coffeella*, *Limoniopsis ectypus*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Listronotus (=Hiperodes)* spp., *Lixus* spp., *Luperodes* spp., *Luperomorpha xanthodera*, *Lyctus* spp., *Megacyllene* spp., p. ej. *Megacyllene robiniae*, *Megascelis* spp., *Melanotus* spp., p. ej. *Melanotus longulus oregonensis*, *Meligethes aeneus*, *Melolontha* spp., por ejemplo, *Melolontha melolontha*, *Migdolus* spp., *Monochamus* spp., *Naupactus xanthographus*, *Necrobia* spp., *Neogalerucella* spp., *Niptus hololeucus*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Oryzaphagus oryzae*, *Otiorhynchus* spp., por ejemplo, *Otiorhynchus cribricollis*, *Otiorhynchus ligustici*, *Otiorhynchus ovatus*, *Otiorhynchus rugosostriatus*, *Otiorhynchus sulcatus*, *Oulema* spp., por ejemplo, *Oulema melanopus*, *Oulema oryzae*, *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllophaga* spp., *Phyllophaga helleri*, *Phyllotreta* spp., p. ej. *Phyllotreta armoraciae*, *Phyllotreta pusilla*, *Phyllotreta ramosa*, *Phyllotreta striolata*, *Popillia japonica*, *Premnotrypes* spp., *Prostephanus truncatus*, *Psylliodes* spp., por ejemplo, *Psylliodes affinis*, *Psylliodes chrysocephala*, *Psylliodes punctulata*, *Ptinus* spp., *Rhizobius ventralis*, *Rhizophora dominica*, *Rhynchophorus* spp., *Rhynchophorus ferrugineus*, *Rhynchophorus palmarum*, *Scolytus* spp., por ejemplo, *Scolytus multistriatus*, *Sinoxylon perforans*, *Sitophilus* spp., p. ej. *Sitophilus granarius*, *Sitophilus linearis*, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Sphenophorus* spp., *Stegobium paniceum*, *Sternechus* spp., p. ej. *Sternechus paludatus*, *Symphyletes* spp., *Tanymecus* spp., por ejemplo, *Tanymecus dilaticollis*, *Tanymecus indicus*, *Tanymecus palliatus*, *Tenebrio molitor*, *Tenebrioides mauretanicus*, *Tribolium* spp., por ejemplo, *Tribolium audax*, *Tribolium castaneum*, *Tribolium confusum*, *Trogoderma* spp., *Tychius* spp., *Xylotrechus* spp., *Zabrus* spp., por ejemplo *Zabrus tenebrioides*;

del orden Dermaptera p. ej. *Anisolabis maritime*, *Forficula auricularia*, *Labidura riparia*;

del orden Dípteros, p. ej. *Aedes* spp., p. ej. *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes sticticus*, *Aedes vexans*, *Agromyza* spp., p. ej. *Agromyza frontella*, *Agromyza parvicornis*, *Anastrepha* spp., *Anopheles* spp., p. ej. *Anopheles quadrimaculatus*, *Anopheles gambiae*, *Asphondylia* spp., *Bactrocera* spp., como *Bactrocera cucurbitae*, *Bactrocera dorsalis*, *Bactrocera oleae*, *Bibio hortulanus*, *Calliphora erythrocephala*, *Calliphora vicina*, *Ceratitis capitata*, *Chironomus* spp., *Chrysomya* spp., *Chrysops* spp., *Chrysozona pluvialis*, *Cochliomya* spp., *Contarinia* spp., p. ej. *Contarinia johnsoni*, *Contarinia nasturtii*, *Contarinia pyrivora*, *Contarinia schulzi*, *Contarinia sorghicola*, *Contarinia tritici*, *Cordylobia anthropophaga*, *Cricotopus sylvestris*, *Culex* spp., por ejemplo *Culex pipiens*, *Culex quinquefasciatus*, *Culicoides* spp., *Culiseta* spp., *Cuterebra* spp., *Dacus oleae*, *Dasineura* spp., por ejemplo *Dasineura brassicae*, *Delia* spp., por ejemplo *Delia antiqua*, *Delia coarctata*, *Delia florilega*, *Delia platura*, *Delia radicum*, *Dermatobia hominis*, *Drosophila* spp., por ejemplo, *Drosophila melanogaster*, *Drosophila suzukii*, *Echinocnemus* spp., *Euleia heraclei*, *Fannia* spp., *Gasterophilus* spp., *Glossina* spp., *Haematopota* spp., *Hydrellia* spp., *Hydrellia griseola*, *Hylemya* spp., *Hippobosca* spp., *Hypoderma* spp., *Liriomyza* spp., por ejemplo, *Liriomyza brassicae*, *Liriomyza huidobrensis*, *Liriomyza sativae*, *Lucilia* spp., por ejemplo, *Lucilia cuprina*, *Lutzomyia* spp., *Mansonia* spp., *Musca* spp., por ejemplo, *Musca domestica*, *Musca domestica vicina*, *Oestrus* spp., *Oscinella frit*, *Paratanytarsus* spp., *Paralauterborniella*

- subcincta, Pegomya o Pegomyia spp., como Pegomya betae, Pegomya hyoscyami, Pegomya rubivora, Phlebotomus spp., Phorbia spp., Phormia spp., Piophilha casei, Platyparea poeciloptera, Prodiplosis spp., Psila rosae, Rhagoletis spp., por ejemplo, Rhagoletis cingulata, Rhagoletis completa, Rhagoletis fausta, Rhagoletis indifferens, Rhagoletis mendax, Rhagoletis pomonella, Sarcophaga spp., Simulium spp., por ejemplo Simulium meridionale, Stomoxys spp.,
5 Tabanus spp., Tetanops spp., Tipula spp., por ejemplo Tipula paludosa, Tipula simplex, Toxotrypana curvicauda;
- del orden Hemípteros, por ejemplo, Acizzia acaciaebaileyanae, Acizzia dodonaeae, Acizzia uncatoides, Acrida turrita, Acyrthosipon spp., por ejemplo, Acyrthosiphon pisum, Acrogonia spp., Aeneolamia spp., Agonosцена spp., Aleurocanthus spp., Aleyrodes proletella, Aleurolobus barodensis, Aleurothrixus floccosus, Allocaridara malayensis, Amrasca spp., p. ej. Amrasca bigutulla, Amrasca devastans, Anuraphis cardui, Aonidiella spp., p. ej. Aonidiella aurantii,
10 Aonidiella citrina, Aonidiella inornata, Aphanostigma piri, Aphis spp., por ejemplo, Aphis citricola, Aphis craccivora, Aphis fabae, Aphis forbesi, Aphis glycines, Aphis gossypii, Aphis hederiae, Aphis illinoisensis, Aphis middletoni, Aphis nasturtii, Aphis nerii, Aphis pomi, Aphis spiraeicola, Aphis viburniphila, Arboridia apicalis, Arytainilla spp., Aspidiella spp., Aspidiotus spp., Aspidiotus nerii, Atanus spp., Aulacorthum solani, Bemisia tabaci, Blastopsylla occidentalis, Boreioglycaspis melaleucae, Brachycaudus helichrysi, Brachycolus spp., Brevicoryne brassicae, Cacopsylla spp., por
15 ejemplo Cacopsylla pyricola, Calligypona marginata, Capulnia spp., Carneiocephala fulgida, Ceratovacuna lanigera, Cercopidae, Ceroplastes spp., Chaetosiphon fragaefolii, Chionaspis tegalensis, Chlorita onukii, Chondracris rosea, Chromaphis juglandicola, Chrysomphalus anidum, Chrysomphalus ficus, Cicadulina mbila, Cocomytilus halli, Coccus spp., por ejemplo, Coccus hesperidum, Coccus longulus, Coccus pseudomagnoliarum, Coccus viridis, Cryptomyzus ribis, Cryptoneossa spp., Ctenarytaina spp., Dalbulus spp., Dialeurodes chittendeni, Dialeurodes citri,
20 Diaphorina citri, Diaspis spp., Diuraphis spp., Doralis spp., Drosicha spp., Dysaphis spp., p. ej. Dysaphis apiifolia, Dysaphis plantaginea, Dysaphis tulipae, Dysmicoccus spp., Empoasca spp., por ejemplo, Empoasca abrupta, Empoasca fabae, Empoasca maligna, Empoasca solana, Empoasca stevensi, Eriosoma spp., p. ej. Eriosoma americanum, Eriosoma lanigerum, Eriosoma pyricola, Erythroneura spp., Eucalyptolyma spp., Euphyllura spp., Euscelis bilobatus, Ferrisia spp., Fiorinia spp., Furcaspis oceanica, Geococcus coffeae, Glycaspis spp., Heteropsylla cubana, Heteropsylla spinulosa, Homalodisca coagulata, Hyalopterus arundinis, Hyalopterus pruni, Icerya spp., p. ej. Icerya purchasi, Idiocerus spp., Idioscopus spp., Laodelphax striatellus, Lecanium spp., por ejemplo, Lecanio córnico (=Partenolecanio córnico), Lepidosaphes spp., por ejemplo Lepidosaphes ulmi, Lipaphis erysimi, Lopholeucaspis japonica, Lycorma delicatula, Macrosiphum spp., Macrosiphum euphorbiae, Macrosiphum lillii, Macrosiphum rosae, Macrosteles facifrons, Mahanarva spp., Melanaphis sacchari, Metcalfiella spp., Metcalfa pruinosa, Metopolophium dirhodum, Monellia costalis, Monelliopsis pecanis, Myzus spp., p. ej. Myzus ascalonicus, Myzus cerasi, Myzus ligustri, Myzus ornatus, Myzus persicae, Myzus nicotianae, Nasonovia ribisnigri, Neomaskellia spp., Nephrotettix spp., como Nephrotettix cincticeps, Nephrotettix nigropictus, Nettigoniclla spectra, Nilaparvata lugens, Oncometopia spp., Orthezia praelonga, Oxya chinensis, Pachyipsylla spp., Parabemisia myricae, Paratrioza spp., p. ej. Paratrioza cockerelli, Parlatoria spp., Pemphigus spp., por ejemplo, Pemphigus bursarius, Pemphigus populivinae, Peregrinus maidis, Perkinsiella spp., Phenacoccus spp., por ejemplo, Phenacoccus madeirensis, Phloeomyzus passerinii, Phorodon humuli, Phylloxera spp., por ejemplo, Phylloxera devastatrix, Phylloxera notabilis, Pinnaspis aspidistrae, Planococcus spp., por ejemplo, Planococcus citri, Prosopidopsylla flava, Protospulvinaria pyriformis, Pseudaulacaspis pentagona, Pseudococcus spp., por ejemplo, Pseudococcus calceolariae, Pseudococcus comstocki, Pseudococcus longispinus, Pseudococcus maritimus, Pseudococcus viburni, Psyllopsis spp., Psylla spp., por ejemplo, Psylla buxi, Psylla mali, Psylla pyri, Pteromalus spp., Pulvinaria spp., Pyrilla spp., Quadraspidiotus spp., p. ej. Quadraspidiotus juglansregiae, Quadraspidiotus ostreaeformis, Quadraspidiotus perniciosus, Quesada gigas, Rastrococcus spp., Rhopalosiphum spp., por ejemplo, Rhopalosiphum maidis, Rhopalosiphum oxyacanthae, Rhopalosiphum padi, Rhopalosiphum rufiabdominale, Saissetia spp., por ejemplo, Saissetia coffeae, Saissetia miranda, Saissetia neglecta, Saissetia oleae, Scaphoideus titanus, Schizaphis graminum, Selenaspis articulatus, Siphia flava, Sitobion avenae, Sogata spp., Sogatella furcifera, Sogatodes spp., Stictocephala festina, Siphoninus phillyreae, Tenalaphara malayensis, Tetrangolocephala spp., Tinocallis caryaefoliae, Tomaspis spp., Toxoptera spp., p. ej. Toxoptera aurantii, Toxoptera citricidus, Trialeurodes vaporariorum, Trioza spp., p. ej. Trioza diospyri, Typhlocyba spp., Unaspis spp., Viteus vitifolii, Zyginia spp;
- del suborden de los heterópteros, por ejemplo, Aelia spp., Anasa tristis, Antestiopsis spp., Boisea spp., Blissus spp., Calocoris spp., Campylomma livida, Cavelerius spp., Cimex spp., por ejemplo, Cimex adjunctus, Cimex hemipterus, Cimex lectularius, Cimex pilosellus, Collaria spp., Creontiades dilutus, Dasynus piperis, Dichelops furcatus, Diconocoris hewetti, Dysdercus spp., Euschistus spp., p. ej. Euschistus heros, Euschistus servus, Euschistus tristigmus, Euschistus variolarius, Eurydema spp., Eurygaster spp., Halyomorpha halys, Heliopeltis spp., Horcias nobilellus, Leptocoris spp., Leptocoris varicornis, Leptoglossus occidentalis, Leptoglossus phyllopus, Lygocoris spp., p. ej. Lygocoris pabulinus, Lygus spp., p. ej. Lygus elisus, Lygus hesperus, Lygus lineolaris, Macropes excavatus, Megacopta cribraria, Miridae, Monalonion atratum, Nezara spp., por ejemplo, Nezara viridula, Nysius spp., Oebalus spp., Pentomidae, Piesma quadrata, Piezodorus spp., por ejemplo, Piezodorus guildinii, Psallus spp., Pseudacysta perseae, Rhodnius spp., Sahlbergella singularis, Scaptocoris castanea, Scotinophora spp., Stephanitis nashi, Tibraca spp., Triatoma spp;
- 60 del orden Himenópteros, por ejemplo Acromyrmex spp., Athalia spp., por ejemplo Athalia rosae, Atta spp., Camponotus spp., Dolichovespula spp., Diprion spp., por ejemplo Diprion similis, Hoplocampa spp., por ejemplo Hoplocampa cookei, Hoplocampa testudinea, Lasius spp., Linepithema (Iridomyrmex) humile, Monomorium pharaonis, Paratrechina spp., Paravespula spp., Plagiolepis spp., Sirex spp., por ejemplo Sirex noctilio, Solenopsis invicta,

Tapinoma spp., Technomyrmex albipes, Urocerus spp., Vespa spp., por ejemplo Vespa crabro, Wasmannia auropunctata, Xeris spp.;

del orden de los isópodos p. ej. Armadillidium vulgare, Oniscus asellus, Porcellio scaber;

5 del orden de los isópteros p. ej. Coptotermes spp., p. ej. Coptotermes formosanus, Cornitermes cumulans, Cryptotermes spp., Incisitermes spp., Kaloterme spp., Microtermes obesi, Nasutitermis spp., Odontotermes spp., Porotermes spp., Reticulitermes spp., p. ej. Reticulitermes flavipes, Reticulitermes hesperus;

10 del orden de los lepidópteros p. ej. Achroia grisella, Acronicta major, Adoxophyes spp., p. ej. Adoxophyes orana, Aedia leucomelas, Agrotis spp., p. ej. Agrotis segetum, Agrotis ipsilon, Alabama spp., p. ej. Alabama argillacea, Amyeloides transitella, Anarsia spp., Anticarsia spp., p. ej. Anticarsia gemmatalis, Argyroploce spp., Autographa spp., Barathra brassicae, Blastodacna atra, Borbo cinnara, Bucculatrix thurberiella, Bupalus piniarius, Busseola spp., Cacoecia spp., Caloptilia theivora, Capua reticulana, Carpocapsa pomonella, Carposina niponensis, Cheimantobia brumata, Chilo spp., p. ej. Chilo plejadellus, Chilo suppressalis, Choreutis pariana, Choristoneura spp., Chrysodeixis chalcites, Clysia ambiguella, Cnaphalocerus spp., Cnaphalocrocis medinalis, Cnephasia spp., Conopomorpha spp., Conotrachelus spp., Copitarsia spp., cidia spp., p. ej. cidia nigricana, cidia pomonella, Dalaca noctuides, Diaphania spp., Diparopsis spp., Diatraea saccharalis, Dioryctria spp., p. ej. Dioryctria zimmermani, Earias spp., Ecdytolopha aurantium, Elasmopalpus lignosellus, Eldana saccharina, Ephestia spp., p. ej. Ephestia elutella, Ephestia kuehniella, Epinotia spp., Epiphyas postvittana, Erannis spp., Erschoviella musculana, Etiella spp., Eudocima spp., Eulia spp., Eupoecilia ambiguella, Euproctis spp., p. ej. Euproctis chryorrhoea, Euxoa spp., Feltia spp., Galleria mellonella, Gracillaria spp., Grapholitha spp., p. ej. Grapholita molesta, Grapholita prunivora, Hedylepta spp., Helicoverpa spp., p. ej. Helicoverpa armigera, Helicoverpa zea, Heliothis spp., p. ej. Heliothis virescens, Hofmannophila pseudospretella, Homoeosoma spp., Homona spp., Hyponomeuta padella, Kakivoria flavofasciata, Lampides spp., Laphygma spp., Laspeyresia molesta, Leucinodes orbonalis, Leucoptera spp., p. ej. Leucoptera coffeella, Lithocolletis spp., p. ej. Lithocolletis blancardella, Lithophane antennata, Lobesia spp., p. ej. Lobesia botrana, Loxagrotis albicosta, Lymantria spp., p. ej. Lymantria dispar, Lyonetia spp., p. ej. Lyonetia clerkella, Malacosoma neustria, Maruca testulalis, Mamestra brassicae, Melanitis leda, Mocis spp., Monopis obviella, Mythimna separata, Nemapogon cloacellus, Nymphula spp., Oiketis spp., Omphisa spp., Operophtera spp., Oria spp., Orthaga spp., Ostrinaia spp., p. ej. Ostrinaia nubilalis, Panolis flammea, Parnara spp., Pectinophora spp., p. ej. Pectinophora gossypiella, Perileucoptera spp., Phthorimaea spp., p. ej. Phthorimaea operculella, Phyllocnistis citrella, Phyllonorycter spp., p. ej. Phyllonorycter blancardella, Phyllonorycter crataegella, Pieris spp., p. ej. Pieris rapae, Platynota stultana, Plodia interpunctella, Plusia spp., Plutella xylostella (=Plutella maculipennis), Podesia spp., p. ej. Podesia syringae, Prays spp., Prodenia spp., Protoperce spp., Pseudaletia spp., p. ej. Pseudaletia unipuncta, Pseudoplusia includens, Pyrausta nubilalis, Rachiplusia nu, Schoenobius spp., p. ej. Schoenobius bipunctifer, Scirpophaga spp., p. ej. Scirpophaga innotata, Scotia segetum, Sesamia spp., p. ej. Sesamia inferens, Sparganothis spp., Spodoptera spp., p. ej. Spodoptera eradiana, Spodoptera exigua, Spodoptera frugiperda, Spodoptera praefica, Stathmopoda spp., Stenoma spp., Stomopteryx subsecivella, Synanthedon spp., Tecia solanivora, Thaumetopoea spp., Thermesia gemmatalis, Tinea cloacella, Tinea pellionella, Tineola bisselliella, Tortrix spp., Trichophaga tapetzella, Trichoplusia spp., p. ej. Trichoplusia ni, Tryporyza incertulas, Tuta absoluta, Virachola spp.;

40 del orden de los ortópteros o Saltatoria p. ej. Acheta domesticus, Dichroplus spp., Gryllotalpa spp., p. ej. Gryllotalpa gryllotalpa, Hieroglyphus spp., Locusta spp., p. ej. Locusta migratoria, Melanoplus spp., p. ej. Melanoplus devastator, Paratlanticus ussuriensis, Schistocerca gregaria;

del orden de los fitirópteros p. ej. Damalinia spp., Haematopinus spp., Linognathus spp., Pediculus spp., Phylloxera vastatrix, Phthirus pubis, Trichodectes spp.;

del orden de los psocópteros p. ej. Lepinotus spp., Liposcelis spp.;

45 del orden de la sifonápteros p. ej. Ceratophyllus spp., Ctenocephalides spp., p. ej. Ctenocephalides canis, Ctenocephalides felis, Pulex irritans, Tunga penetrans, Xenopsylla cheopis;

50 del orden de los tisanópteros p. ej. Anaphothrips obscurus, Bliothrips biformis, Chaetanaphothrips leeuweni, Drepanothrips reuteri, Enneothrips flavens, Frankliniella spp., p. ej. Frankliniella fusca, Frankliniella occidentalis, Frankliniella schultzei, Frankliniella tritici, Frankliniella vaccinii, Frankliniella williamsi, Haplothrips spp., Heliothrips spp., Hercinothrips femoralis, Kakothrips spp., Rhipiphorothers cruentatus, Scirtothrips spp., Taeniothrips cardamomi, Thrips spp., p. ej. Thrips palmi, Thrips tabaci;

del orden de los zigentomos (= Thysanura), p. ej. Ctenolepisma spp., Lepisma saccharina, Lepismodes inquilinus, Thermobia domestica;

de la clase de los sinfilos p. ej. Scutigera spp., p. ej. Scutigera immaculata;

parásitos del filum de los moluscos, p. ej. de la clase de los bivalvos, p. ej. Dreissena spp.;

55 así como de la clase de los gasterópodos p. ej. Arion spp., p. ej. Arion ater rufus, Biomphalaria spp., Bulinus spp., Deroceras spp., p. ej. Deroceras laeve, Galba spp., Lymnaea spp., Oncomelania spp., Pomacea spp., Succinea spp.;

parásitos vegetales del filum de los nematodos, es decir nematodos parásitos de plantas especialmente *Aglenchus* spp., p. ej. *Aglenchus agricola*, *Anguina* spp., p. ej. *Anguina tritici*, *Aphelenchoides* spp., p. ej. *Aphelenchoides arachidis*, *Aphelenchoides fragariae*, *Belonolaimus* spp., p. ej. *Belonolaimus gracilis*, *Belonolaimus longicaudatus*, *Belonolaimus nortoni*, *Bursaphelenchus* spp., p. ej. *Bursaphelenchus cocophilus*, *Bursaphelenchus eremus*,
 5 *Bursaphelenchus xylophilus*, *Cacopaurus* spp., p. ej. *Cacopaurus pestis*, *Criconemella* spp., p. ej. *Criconemella curvata*, *Criconemella onoensis*, *Criconemella ornata*, *Criconemella rusium*, *Criconemella xenoplax* (= *Mesocriconema xenoplax*), *Criconemoides* spp., p. ej. *Criconemoides ferniae*, *Criconemoides onoense*, *Criconemoides ornatum*, *Ditylenchus* spp., p. ej. *Ditylenchus dipsaci*, *Dolichodorus* spp., *Globodera* spp., p. ej. *Globodera pallida*, *Globodera rostochiensis*, *Helicotylenchus* spp., p. ej. *Helicotylenchus dihystra*, *Hemicriconemoides* spp., *Hemicicliophora* spp.,
 10 *Heterodera* spp., p. ej. *Heterodera avenae*, *Heterodera glycines*, *Heterodera schachtii*, *Hirschmaniella* spp., *Hoplolaimus* spp., *Longidorus* spp., p. ej. *Longidorus africanus*, *Meloidogyne* spp., p. ej. *Meloidogyne chitwoodi*, *Meloidogyne fallax*, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne incognita*, *Meloinema* spp., *Nacobbus* spp., *Neotylenchus* spp., *Paralongidorus* spp., *Paraphelenchus* spp., *Paratrichodorus* spp., p. ej. *Paratrichodorus minor*, *Paratylenchus* spp., *Pratylenchus* spp., p. ej. *Pratylenchus penetrans*, *Pseudohalenchus* spp., *Psilenchus* spp., *Punctodera* spp.,
 15 *Quinisulcius* spp., *Radopholus* spp., p. ej. *Radopholus citrophilus*, *Radopholus similis*, *Rotylenchulus* spp., *Rotylenchus* spp., *Scutellonema* spp., *Subanguina* spp., *Trichodorus* spp., p. ej. *Trichodorus obtusus*, *Trichodorus primitivus*, *Tylenchorhynchus* spp., p. ej. *Tylenchorhynchus annulatus*, *Tylenchulus* spp., p. ej. *Tylenchulus semipenetrans*, *Xiphinema* spp., p. ej. *Xiphinema index*.

Dado el caso, los compuestos de la Fórmula (I) también se pueden utilizar en determinadas concentraciones o dosis
 20 como herbicidas, protectores, reguladores de crecimiento o medios para mejorar las propiedades de las plantas, como microbicidas o agentes de hibridación, por ejemplo como fungicidas, antimicóticos, bactericidas, viricidas (inclusive medios contra viroides) o como medios contra MLO (organismos similares a micoplasmas) y RLO (organismos similares a rickettsias). Dado el caso se pueden emplear también productos intermedios o productos primarios para la síntesis de otras sustancias activas.

25 Formulaciones

La presente invención atañe además también formulaciones y formas de aplicación preparadas con base en ellas como plaguicidas como p. ej. líquidos de reciado, goteo y pulverización, comprendiendo como mínimo un compuesto de la Fórmula (I). Dado el caso las formas de aplicación contiene otros plaguicidas y/o el efecto de adyuvantes
 30 mejoradores como intensificadores de penetración, p. ej. aceites vegetales como por ejemplo aceite de colza, aceite de girasol, aceites minerales como por ejemplo aceites de parafinas, alquiléster de ácidos grasos vegetales como por ejemplo metiléster de aceite de colza o de aceite de soja o alcoxilato de alcanol y/o agentes de dispersión como por ejemplo alquilsiloxano y/o sales, p. ej. Sales de amonio o fosfonio orgánicas e inorgánicas como por ejemplo sulfato de amonio o hidrogenofosfato de diamonio y/o los agentes que facilitan la retención como p. ej. sulfosuccinato de dioctilo o polímero hidroxipropil-guar y/o humectantes como p. ej. glicerina y/o fertilizantes como por ejemplo
 35 fertilizantes que contienen amonio, potasio o fósforo.

Formulaciones habituales son por ejemplo líquidos hidrosolubles (SL), concentrados emulsionables (EC), emulsiones en agua (EW), concentrados en suspensión (SC, SE, FS, OD), granulados dispresables en agua (WG), granulados (GR) y concentrados en cápsulas (CS); estos y otros tipos posibles de formulación están descritas por ejemplo por
 40 Crop Life International en Pesticide Specifications, Manual on development and use of FAO and WHO specifications for pesticides, FAO Plant Production and Protection Papers – 173, prepared by the FAO/WHO Joint Meeting on Pesticide Specifications, 2004, ISBN: 9251048576. Dado el caso, junto a uno o varios compuestos de la Fórmula (I), las formulaciones contienen otras sustancias agroquímicas.

Se trata preferentemente de formulaciones o formas de aplicación, que contienen excipientes como por ejemplo
 45 expansores, solventes, fomentadores de espontaneidad, agentes vehiculizantes, emulsionantes, dispersantes, anticongelantes, biocidas, espesantes y/o otros excipientes como por ejemplo adyuvantes. En este contexto un adyuvante es un componente, que mejora el efecto biológico de la formulación, sin que el componente en sí tenga un efecto biológico. Ejemplos de adyuvantes son agentes que favorecen la retención, el comportamiento de dispersión, la adherencia a la superficie de la hoja o la penetración.

Estas formulaciones se producen de una manera conocida, p. ej. mediante mezcla de los compuestos de la Fórmula (I) con excipientes como por ejemplo expansores, solventes y/o agentes vehiculizantes sólidos y/u otros excipientes como por ejemplo surfactantes. La producción de las formulaciones se realiza en instalaciones adecuadas o antes o durante la aplicación.

Como excipientes encuentran aplicación también sustancias que son aptas para otorgar propiedades especiales (como determinadas propiedades físicas, técnicas y/o biológicas) a la formulación de los compuestos de la Fórmula (I) o a las formas de aplicación preparadas con base en estas formulaciones (como p. ej. plaguicidas utilizables como
 55 líquidos de pulverización o tratamientos de semillas).

Como expansores son idóneos p. ej. agua, líquidos químicos orgánicos polares y no polares p. ej. de las clases de los hidrocarburos aromáticos y no aromáticos (como parafinas, alquilbencenos, alquilnaftalinas, clorobencenos), de los alcoholes y polialcoholes (que, dado el caso, también pueden ser sustituidos, eterificados y/o esterificados), de las

cetonas (como acetona, ciclohexanona), de los ésteres (también grasas y aceites) y (poli)éter, de las aminas simples y sustituidas, amidas, lactamas (como N-alquilpirrolidona) y lactonas, de las sulfonas y sulfóxidos (como dimetilsulfóxido), de los carbonatos y de los nitritos.

5 En caso de utilizar agua como expansor se pueden usar también p. ej. disolventes orgánicos como disolventes auxiliares. Como disolventes líquidos se pueden considerar esencialmente: Aromáticos como xileno, toluol o alquilnaftalina, aromáticos clorados o hidrocarburos alifáticos clorados como clorobenzenos, cloroetilenos o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos, como ciclohexano o parafinas, p. ej. fracciones de petróleo, aceites minerales y vegetales, alcoles como butanol o glicol así como sus éteres y ésteres, cetonas como acetona, metiletilcetona, metil-isobutil-cetona o ciclohexanona, disolventes fuertemente polares como dimetilformamida o dimetilsulfóxido, carbonatos como carbonato de propileno, carbonato de butileno, carbonato de dietilo o carbonato de dibutilo, o nitritos como acetonitrilo o propanonitrilo.

15 Básicamente se pueden usar todos los disolventes adecuados. Disolventes adecuados son por ejemplo los hidrocarburos aromáticos como xileno, toluol o alquilnaftalina, hidrocarburos aromáticos clorados o hidrocarburos alifáticos clorados como p. ej. clorobenceno, cloroetileno o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos, como p. ej. ciclohexano, parafinas, fracciones de petróleo, aceites minerales y vegetales, alcoles como metanol, etanol, isopropanol, butanol o glicol así como sus éteres y ésteres, cetonas como p. ej. acetona, metiletilcetona, metil-isobutil-cetona o ciclohexanona, disolventes fuertemente polares como dimetilsulfóxido, carbonatos como carbonato de propileno, carbonato de butileno, carbonato de dietilo o carbonato de dibutilo, nitritos como acetonitrilo o propanonitrilo, así como agua.

20 Básicamente se pueden usar todos los excipientes adecuados. Como agentes vehiculizantes se consideran especialmente: p. ej. sales de amonio y piedra molida natural como caolinita, arcilla, talco, tiza, cuarzo, atapulgita, montmorillonita o tierra de diatomeas, como ácido silícico, altamente disperso, óxido de aluminio o y silicatos naturales o sintéticos, resinas, ceras y/o fertilizantes sólidos. También se pueden utilizar mezclas de estos agentes vehiculizantes. Como agentes vehiculizantes para granulados se consideran: p. ej. roca molida o fraccionada natural como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita así como granulados sintéticos de harinas orgánicas e inorgánicas así como granulados de material orgánico como aserrín, papel, cáscaras de nuez, mazorcas y tallos de tabaco.

30 También se pueden emplear expansores o disolventes licuados gaseosos. En especial son aptos aquellos expansores o agentes vehiculizantes que a temperatura normal o presión normal son gaseosos, p. ej. gases propelentes en aerosol como hidrocarburos halogénicos así como butano, propano, nitrógeno y dióxido de carbono.

35 Ejemplo de agentes emulsionantes y/o que generan espuma, dispersantes o agentes reticulantes con propiedades iónicas y aniónicas o mezclas de estos surfactantes son sales de ácido poliacrílico, sales de ácido lignosulfónico, sales de ácido fenolsulfónico o ácido naftalensulfónico, policondensados de óxido de etileno con alcoholes grasos o ácidos grasos o con aminas grasas, con fenoles sustituidos (preferentemente alquilfenoles o arilfenoles), sales de ésteres de ácido de ámbar sulfurado, derivados de la taurina (preferentemente alquiltauratos), derivados de isetonatos, éster de ácido fosfórico de alcoholes polietioxilados o fenoles, éster de ácidos grasos de polioles y derivados de compuestos que contienen sulfatos, sulfonatos y fosfatos, p. ej. éter de alquilarilpoliglicol, alquilsulfonatos, alquilsulfatos, arilsulfonatos, proteínas hidrolizadas, lejís de lignosulfitos y metilcelulosa. La presencia de una sustancia surfactante es ventajosa si uno de los compuestos de la Fórmula (I) y/o uno de los agentes vehiculizantes inertes no es soluble en agua y la aplicación se realiza en agua.

40 Como otros excipientes puede haber en las formulaciones y las formas de aplicación resultantes de ellas colorantes como pigmentos inorgánicos, p. j. óxido de hierro, óxido de titanio, pigmento azul de ferrocianuro y colorantes orgánicos como colorantes de alizarina, azoico y de metalftalocianina y nutrientes y micronutrientes como sales, hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc.

45 Además, pueden contener estabilizantes como estabilizantes de frío, conservantes, antioxidantes o fotoprotectores u otros agentes que mejoran la estabilidad química y/o física. Además, pueden contener agentes espumantes o antiespumantes.

50 Además, las formulaciones y las formas de aplicación resultantes de ellas pueden contener como excipientes adicionales también adhesivos como carboximetilcelulosa, polímeros naturales y sintéticos en polvo, granulado o en forma de látex, como goma arábiga, alcohol de polivinilo, acetato de polivinilo así como fosfolípidos naturales como cefalina y lecitina y fosfolípidos sintéticos. Otros excipientes pueden ser aceites minerales y vegetales.

55 Dado el caso, pueden contener otros excipientes en las formulaciones y las formas de aplicación resultantes de ellas. Tales aditivos son por ejemplo sustancias odoríferas, coloides protectores, aglutinantes, pegamentos, espesantes, sustancias tixotrópicas, intensificadores de penetración, intensificadores de retención, estabilizantes, secuestrantes, complejizantes, humectantes, agentes de dispersión. En general, los compuestos de la Fórmula (I) se pueden combinar con cualquier aditivo sólido o líquido que se utiliza habitualmente para los fines de la formulación.

Como intensificadores de retención se consideran todas las sustancias que disminuyen la tensión superficial dinámica como por ejemplo sulfosuccinato de dioctilo o que aumentan la viscoelasticidad como por ejemplo polímeros hidroxipropil-guar.

5 Como intensificadores de penetración se consideran en el presente contexto todas las sustancias que se emplean habitualmente para mejorar la penteración de principios activos agroquímicos en las plantas. En este contexto los intensificadores de penetración se definen por el hecho de que penetran en la cutícula de la planta desde el líquido de aplicación (por regla general, acuoso) y/o desde la capa de rociado y, con ello, pueden aumentar la movilidad de las sustancias activas en la cutícula. El método descrito en la literatura (Baur et al., 1997, Pesticide Science 51, 131-152) se puede emplear para determinar esta propiedad. De forma ejemplar se nombran alcoxilato de alcohol como por ejemplo etoxilatos de aceite de coco (10) o etioxilatos de isotridecil (12), éster de ácidos grasos como por ejemplo metiléster de aceite de colza o de aceite de soja, etoxilatos de amina grasa como por ejemplo etioxilato de sebo (15) o sales de amonio y/o de fosfonio como por ejemplo sulfato de amonio o hidrogenofosfato de diamonio.

15 Las formulaciones contienen preferentemente 0,00000001 y 98% p/p del compuesto de la Fórmula (I), preferentemente en especial entre 0,01 y 95% p/p del compuesto de la Fórmula (I), especialmente preferente entre 0,5 y 90% p/p del compuesto de la Fórmula (I), referido al peso de la formulación.

20 El contenido del compuesto de la Fórmula (I) en las formas de aplicación preparadas a partir de las formulaciones (en especial plaguicidas) puede variar en otros rangos. La concentración del compuesto de la Fórmula (I) en las formas de aplicación puede estar habitualmente entre 0,00000001 y 95% p/p del compuesto de la Fórmula (I), preferentemente entre 0,00001 y 1% p/p, referido al peso de la forma de aplicación. La aplicación tiene lugar de una manera habitual adaptada a las formas de aplicación.

Mezclas

25 Los compuestos de la Fórmula (I) se pueden utilizar también en mezcla con uno o varios fungicidas, bactericidas, acaricidas, molusquicidas, nematocidas, insecticidas, organismos microbiológicos, insectos benéficos, Herbiziden, fertilizantes, repelentes de aves, fitotónicos, esterilizantes, protectores, semiquímicos y/o reguladores de fitocrecimiento, para así p. ej. Ampliar el espectro de acción, prolongar la duración del efecto, aumentar la velocidad de acción, impedir la repelencia o prevenir el desarrollo de resistencia. Por lo demás, tales combinaciones de principios activos mejoran el fitocrecimiento y/o la tolerancia frente a factores abióticos como p. ej. Temperaturas altas o bajas, contra la sequía o exceso de agua o el contenido de sal del suelo. También se puede mejorar la floración y generación de frutos, optimizar la capacidad germinativa y el desarrollo de las raíces, facilitar la cosecha y aumentar el rendimiento del cultivo, influir en la madurez, aumentar la calidad y/o el valor nutricional de los productos cosechados, prolongar la capacidad de almacenamiento y/o la capacidad de procesamiento de los productos cosechados.

35 Además, los compuestos de la Fórmula (I) estar presentes en la mezcla con otras sustancias activas o semiquímicos, como cebos y/o repelentes de aves y/o fitoactivadores y/o reguladores de crecimiento y/o fertilizantes. Del mismo modo los compuestos de la Fórmula (I) pueden emplearse para mejorar las propiedades de la planta como por ejemplo el crecimiento, el rendimiento y la calidad del producto cosechado.

Según la invención, en una forma de presentación especial los compuestos de la Fórmula (I), en formulaciones o en las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones, están mezclados con otros compuestos, preferentemente los que se describen a continuación.

40 Si alguno de los compuestos que se enuncian a continuación puede presentarse en diversas formas tautoméricas, estas formas también están comprendidas, incluso cuando no se las enuncia explícitamente en cada caso. Al unirlos con bases o ácidos adecuados, todos los productos de mezcla pueden formar sales, siempre que se encuentren en condiciones de hacerlo gracias a sus grupos funcionales.

Insecticidas/acaricidas/nematocidas

45 Las sustancias activas nombradas aquí con su "nombre común" son conocidas y están especialmente descritas en el manual de pesticidas („The Pesticide Manual" 16th Ed., British Crop Protection Council 2012) o se pueden consultar en Internet (p. ej. <http://www.alanwood.net/pesticides>). La clasificación se basa en el IRAC Mode of Action Classification Scheme válido al momento de la presentación de esta solicitud de patente.

50 (1) Inhibidores de la acetilcolinesterasa (AChE), preferentemente carbamatos seleccionados de alanicarbo, aldicarbo, bendiocarbo, benfuracarbo, butocarboxim, butoxicarboxim, carbaril, carbofurano, carbosulfano, etiofencarb, fenobucarb, formetanato, furatiocarb, isoprocarb, metiocarb, metomilo, metolcarb, oxamil, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, triazamato, trimetacarb, XMC y xililcarb, o fosfato orgánico seleccionado de acefato, azametifos, azinfos-etilo, zinfos-metilo, cadusafos, cloroetoxifos, clorfenvinfós, clormefos, cloropirifos-metilo, coumafos, cianofos, demeton-S-metilo, diazinona, diclorvos/DDVP, dicrotofos, dimetoato, dimetilvinfos, disulfoton, EPN, etián, etoprop, famfur, fenamifos, fenitrotión, fentián, fostiazato, heptenofos, imiciafos, isofenfos, salicilato de isopropil-O(metoxiaminotio-fosforil), isoxationa, malationa, mecarbam, metamidofos, metidation, mevinfos, monocrotofos, naled, Ometoato, oxidemetón-methilo, paratión-metilo, fenthoato, forato, fosalon, fosmet, fosfamidón, foxim, pirimifos-

metil, profenofos, propetamfos, protiofos, piraclufos, piridafentión, quinalfos, sulfotep, tebupirimfos, Temefos, terbufos, tetraclorovinifos, tiometón, triazofos, triclorofón y vamidotion.

(2) Bloqueadores de los canales de cloruro controlados por GABA, preferentemente ciclodieno organoclorado seleccionado de clordano y endosulfano, o fenilpirazoles (fiproles) seleccionados de etiprol y fipronil.

5 (3) Moduladores de los canales de sodio, preferentemente piretroides seleccionados de acrinatrina, allertrina, d-cis-trans-allertrina, d-trans-allertrina, bifentrina, bioallertrina, bioallertrina-S-ciclopentenil-isómero, bioresmetrina, cicloprotrina, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, lambda-cihalotrina, gamma-cihalotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, beta-cipermetrina, theta-cipermetrina, zeta-cipermetrina, cifenotrina [(1R)-trans-isómero], deltametrina, empentrina [(EZ)-(1R)-isómero], esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flumetrina, tau-
10 fluvalinato, halfenprox, imiprotrina, cadetrina, momfluotrina, permetrina, fenotrina [(1R)-trans-isómero], prallertrina, piretrinae (pyrethrum), resmetrina, silafluofeno, teflutrina, tetrametrina, tetrametrina [(1R)-isómero], tralometrina y transflutrina, o DDT o methoxiclo.

15 (4) Moduladores competitivos del receptor de acetilcolina nicotínico (nAChR), preferentemente neonicotinoides seleccionados de acetamiprida, clotianidina, dinotefurano, imidacloprid, nitenpiram, tiacloprid y tiametoxam, o nicotina, o sulfoximinas seleccionadas de sulfoxaflor, o butenolides seleccionados de flupiradifurone, o mesoionics seleccionados de triflumezopyrim.

(5) Moduladores alostéricos del receptor de acetilcolina nicotínico (nAChR), preferentemente espinosinos seleccionados de espinetoram y espinosad.

20 (6) Moduladores alostéricos del canal de cloruro dependiente del glutamato (GluCl), preferentemente avermectina/milbemicina seleccionadas de abamectina, benzoato de emamectina, lepimectina y milbemectina.

(7) Mimética de la hormona juvenil, preferentemente análogos de la hormona juvenil seleccionados de hidropreno, cinopreno y metopreno, o fenoxicarb o piriproxifeno.

25 (8) Diversos inhibidores no específicos (multi-site), preferentemente alquilhalogenuros seleccionados de metilbromida y otros alquilhalogenuros, o cloropicrina o fluoruro de sulfurilo o bórax o tártaro emético o generador de metilisocianato seleccionado de diazometano y metam.

(9) Moduladores de los canales de TRPV de órganos cordotomales seleccionados de pimetrozina y pirifluquinazona.

(10) Inhibidores de crecimiento de ácaros seleccionados de clofentezine, hexitiazox, diflovidazin y etoxazol.

30 (11) Alteradores microbianos de la membrana intestinal de los insectos, seleccionados de *Bacillus thuringiensis* subespecie *israelensis*, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus thuringiensis* subespecie *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subespecie *kurstaki*, *Bacillus thuringiensis* subespecie *tenebrionis* y *B.t.*-proteínas vegetales seleccionadas de Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry1A.105, Cry2Ab, VIP3A, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb y Cry34Ab1/35Ab1.

(12) Inhibidores del complejo ATP sintasa mitocondrial, preferentemente alteradores de ATP seleccionados de diafentiuuron, o compuestos organoestánicos seleccionados de azoclotina, cihexatina y óxido de fenbutatin, o propargit o tetradifon.

35 (13) Desacopladores de la fosforilación oxidativa por alteración de los gradientes de protones seleccionados de clorfenapir, DNOC y sulfluramida.

(14) Bloqueadores del canal receptor de acetilcolina nicotínico seleccionados de bensultap, hidrocloreuro de cartap, tiociclam y tiosultap-sodio.

40 (15) Inhibidores de la biosíntesis de la quitina, tipo 0, seleccionados de bistrifluron, clorofluazuron, diflubenzuron, flucicloخورon, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, teflubenzuron y triflumuron.

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

(17) Alteradores de la muda de piel (especialmente en el caso de los dípteros, es decir: de dos alas) seleccionados de ciromazina.

45 (18) Agonistas del receptor de la ecdisona seleccionados de cromafenozida, halofenozida, metoxifenozida y tebufenozida.

(19) Agonistas del receptor de la octopamina seleccionados de amitraz.

(20) Inhibidores del transporte de electrones del complejo III mitocondrial seleccionados de hidrametilnona, acequinocilo y fluacirpirim.

- (21) Inhibidores del transporte de electrones del complejo III mitocondrial del complejo I mitocondrial, preferentemente acaricidas METI seleccionados de fenazaquin, fenpiroximato, pirimidifen, piridaben, tebufenpiradund tolfenpirad o rotenona (Derris).
- (22) Bloqueadores de los canales de sodio dependientes de voltaje seleccionados de indoxacarb y metaflumizona.
- 5 (23) Inhibidores de la acetil-CoA carboxilasa, preferentemente derivados de ácidos tetrónicos y tetrámicos seleccionados de espirodiclofeno, espiromesifeno y espirotetramat.
- (24) Inhibidores del transporte de electrones del complejo IV mitocondrial, preferentemente fosfinas seleccionadas de fosfuro de aluminio, fosfuro de calcio, fosfina y fosfuro de zinc, o cianuros seleccionados de cianuro de calcio, cianuro de potasio y cianuro de sodio.
- 10 (25) Inhibidores del transporte de electrones del complejo II mitocondrial, preferentemente derivados de beta-cetonitrilo seleccionados de cienopirafenya y ciflumetofeno, o carboxanilida seleccionada de piflubumida.
- (28) Moduladores de los receptores de rianodina, preferentemente diamidas seleccionadas de clorantraniliprol, ciantraniliprol y flubendiamide.
- (29) Moduladores de los órganos cordotonaes (con estructura de destino indefinida) seleccionados de flonicamid.
- 15 (30) Otras sustancias activas seleccionadas de acinonapir, afidopiropen, afoxolaner, azadiractina, benclotiaz, benzoximato, benzpirimoxano, bifenazato, broflanilide, bromopropilato, quinometionato, cloropraletin, criolita, ciclaniliprol, cicloxaprida, cihalodiamida, ciclomezotiaz, dicofol, dimpropiridaz, epsilon-metofluthrin, epsilon-momfluthrin, flometoquina, fluazaindolizina, fluensulfone, flufenerim, flufenoxistrobin, flufiprol, Fluhexafon, fluopiram, flupirimin, fluralaner, fluxametamida, fufenozida, Guadipir, heptafluthrin, imidaclotiz, iprodione, isocicloseram, kappa-bifentrina, kappa-tefluthrin, lotilaner, meperflutrina, oxazosulfilo, paichongding, piridalilo, pirifluquinazon, piriminoestrobina, spirobudiclofen, espiropidion, tetrametilflutrina, tetraniliprol, tetraclororaniliprol, tigolaner, tioazafen, tiofluoximat e yodmetano; por lo demás, preparados a base de *Bacillus firmus* (I-1582, BioNeem, Votivo), así como los siguientes compuestos: 1-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]fenil}-3-(trifluorometil)-1H-1,2,4-triazol-5-amina (conocido en virtud de WO2006/043635) (CAS 885026-50-6), {1'-[(2E)-3-(4-clorofenil)prop-2-en-1-il]-5-fluoro-espiro[indol-3,4'-piperidina]-1(2H)-il]}(2-cloropiridina-4-il)metanona (conocido en virtud de WO2003/106457) (CAS 637360-23-7), 2-cloro-N-[2-{1-[(2E)-3-(4-clorofenil)prop-2-en-1-il]piperidin-4-il}-4-(trifluorometil)fenil]isonicotinamida (conocido en virtud de WO2006/003494) (CAS 872999-66-1), 3-(4-cloro-2,6-dimetilfenil)-4-hidroxi-8-metoxi-1,8-diazaspiro[4,5]dec-3-en-2-ona (conocido en virtud de WO 2010052161) (CAS 1225292-17-0), 3-(4-cloro-2,6-dimetilfenil)-8-metoxi-2-oxo-1,8-diazaspiro[4,5]dec-3-en-4-il-etilcarbonato (conocido en virtud de EP 2647626) (CAS-1440516-42-6), 4-(but-2-in-1-iloxi)-6-(3,5-dimetilpiperidin-1-il)-5-fluoropirimidina (conocido en virtud de WO2004/099160) (CAS 792914-58-0), PF1364 (conocido en virtud de JP2010/018586) (CAS-Reg.No. 1204776-60-2), (3E)-3-[1-[(6-cloro-3-piridil)metil]-2-piridiliden]-1,1,1-trifluoropropan-2-ona (conocido en virtud de WO2013/144213) (CAS 1461743-15-6), N-[3-(bencilcarbamoilo)-4-clorofenil]-1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocido en virtud de WO2010/051926) (CAS 1226889-14-0), 5-bromo-4-cloro-N-[4-cloro-2-metil-6-(metilcarbonoil)fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)pirazol-3-carboxamida (conocido en virtud de CN103232431) (CAS 1449220-44-3), 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolilo]-2-metil-N-(cis-1-oxido-3-theatenil)benzamida, 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolilo]-2-metil-N-(trans-1-oxido-3-theatenil)benzamida y 4-[(5S)-5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolilo]-2-metil-N-(cis-1-oxido-3-theatenil)benzamida (conocido en virtud de WO 2013/050317 A1) (CAS 1332628-83-7), N-[3-cloro-1-(3-piridinil)-1H-pirazol-4-il]-N-etil-3-[(3,3,3-trifluoropropil)sulfinil]propanamida, (+)-N-[3-cloro-1-(3-piridinil)-1H-pirazol-4-il]-N-etil-3-[(3,3,3-trifluoropropil)sulfinil]propanamida y (-)-N-[3-cloro-1-(3-piridinil)-1H-pirazol-4-il]-N-etil-3-[(3,3,3-trifluoropropil)sulfinil]propanamida (conocido en virtud de WO 2013/162715 A2, WO 2013/162716 A2, US 2014/0213448 A1) (CAS 1477923-37-7), 5-[[[(2E)-3-cloro-2-propen-1-il]amino]-1-[2,6-dicloro-4-(trifluorometil)fenil]-4-[(trifluorometil)sulfinil]-1H-pirazol-3-carbonitrilo (conocido en virtud de CN 101337937 A) (CAS 1105672-77-2), 3-bromo-N-[4-cloro-2-metil-6-[(metilamino)tioxometil]fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-carboxamida, (liudaibenjiaxuanan, conocido en virtud de CN 103109816 A) (CAS 1232543-85-9); N-[4-cloro-2-[[[(1,1-dimiletiletil)amino]carbonil]-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(fluorometoxi)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocido en virtud de WO 2012/034403 A1) (CAS 1268277-22-0), N-[2-(5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-il)-4-cloro-6-metilfenil]-3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocido en virtud de WO 2011/085575 A1) (CAS 1233882-22-8), 4-[3-[2,6-dicloro-4-[(3,3-dicloro-2-propen-1-il)oxil]fenoxil]propoxil]-2-metoxi-6-(trifluorometil)pirimidina (conocido en virtud de CN 101337940 A) (CAS 1108184-52-6); (2E)- y (2Z)-2-[2-(4-cianofenil)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etiliden]-N-[4-(difluorometoxi)fenil]hidrazinacarboxamida (conocido en virtud de CN 101715774 A) (CAS 1232543-85-9); ciclopropancarbónico-3-(2,2-dicloroetil)-2,2-dimetil-4-(1H-bencimidazol-2-il)feniléster (conocido en virtud de CN 103524422 A) (CAS 1542271-46-4); metiléster de ácido carbónico de (4aS)-7-cloro-2,5-dihidro-2-[[[metoxicarbonil]4-[(trifluorometil)tio]fenil]amino]carbonil]indeno[1,2-e][1,3,4]oxadiazin-4a(3H) (conocido en virtud de CN 102391261 A) (CAS 1370358-69-2); 6-desoxi-3-O-etil-2,4-di-o-metil-1-[N-[4-[1-[4-(1,1,2,2,2-pentafluoroetoxi)fenil]-1H-1,2,4-triazol-3-il]fenil]carbamat]-α-L-mannopiranosose (conocido en virtud de US 2014/0275503 A1) (CAS 1181213-14-8); 8-(2-ciclopropilmetoxi-4-trifluorometilfenoxi)-3-(6-trifluorometilpiridazin-3-il)-3-azabicyclo[3,2,1]octano (CAS 1253850-56-4), (8-anti)-8-(2-ciclopropilmetoxi-4-trifluorometilfenoxi)-3-(6-trifluorometilpiridazin-3-il)-3-azabicyclo[3,2,1]octano (CAS 933798-27-7), (8-syn)-8-(2-Ciclopropilmetoxi-4-trifluorometilfenoxi)-3-(6-trifluorometilpiridazin-3-il)-3-

azabiciclo[3.2.1]octano (conocido en virtud de WO 2007040280 A1, WO 2007040282 A1) (CAS 934001-66-8), N-[3-cloro-1-(3-piridinil)-1H-pirazol-4-il]-N-etil-3-[(3,3,3-trifluoropropil)thio]-propanamida (conocido en virtud de WO 2015/058021 A1, WO 2015/058028 A1) (CAS 1477919-27-9) y N-[4-(aminotioxometil)-2-metil-6-[(metilamino)carbonil]fenil]-3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocido en virtud de CN 103265527 A) (CAS 1452877-50-7), 5-(1,3-dioxan-2-il)-4-[[4-(trifluorometil)fenil]metoxi]-pirimidina (conocido en virtud de WO 2013/115391 A1) (CAS 1449021-97-9), 3-(4-cloro-2,6-dimetilfenil)-8-metoxi-1-metil-1,8-diazaspiro[4,5]decan-2,4-diona (conocido en virtud de WO 2014/187846 A1) (CAS 1638765-58-8), 3-(4-cloro-2,éster etílico de ácido carbónico de 6-dimetilfenil)-8-metoxi-1-metil-2-oxo-1,8-diazaspiro[4,5]dec-3-en-4-il (conocido en virtud de WO 2010/066780 A1, WO 2011151146 A1) (CAS 1229023-00-0), 4-[(5S)-5-(3,5-dicloro-4-fluorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolilo]-N-[(4R)-2-etil-3-oxo-4-isoxazolidinil]-2-metil-benzamida (conocido en virtud de WO 2011/067272, WO2013/050302) (CAS 1309959-62-3).

Fungicidas

Las sustancias activas nombradas aquí con su "nombre común" son conocidas y están descritas, por ejemplo, en el "Pesticide Manual" (16. ed. British Crop Protection Council) o se pueden consultar en Internet (por ejemplo: <http://www.alanwood.net/pesticides>).

Además, todas las sustancias de mezcla de las clases (1) a (15) (si están en condiciones en virtud de su grupo funcional) pueden formar sales, dado el caso con álcalis o ácidos adecuados. Todas las sustancias de mezcla fungicidas de las clases (1) a (15) pueden incluir eventualmente formas tautómeras.

- 1) Inhibidores de la biosíntesis del ergosterol, por ejemplo (1.001) ciproconazol, (1.002) difenoconazol, (1.003) Epoxiconazol, (1.004) Fenhexamida, (1.005) Fenpropidina, (1.006) Fenpropimorf, (1.007) FENPIRAZAMINA, (1.008) FLUQUINCONAZOL, (1.009) Flutriafol, (1.010) Imazalil, (1.011) sulfato de Imazalil, (1.012) Ipconazol, (1.013) Metconazol, (1.014) MICLOBUTANILO, (1.015) PACLOBUTRAZOL, (1.016) PROCLORAZ, (1.017) Propiconazol, (1.018) PROTIOCONAZOL, (1.019) pirisoxazol, (1.020) ESPIROXAMINA, (1.021) Tebuconazol, (1.022) Tetraconazol, (1.023) Triadimenol, (1.024) TRIDEMORF, (1.025) Triticonazol, (1.026) (1R,2S,5S)-5-(4-CLOROBENCIL)-2-(clorometil)-2-metil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ilmetil)ciclopentanol, (1.027) (1S,2R,5R)-5-(4-CLOROBENCIL)-2-(clorometil)-2-metil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ilmetil)ciclopentanol, (1.028) (2R)-2-(1-CLOROCICLOPROPIL)-4-[(1R)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.029) (2R)-2-(1-CLOROCICLOPROPIL)-4-[(1S)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.030) (2R)-2-[4-(4-CLOROFENOXI)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol, (1.031) (2S)-2-(1-CLOROCICLOPROPIL)-4-[(1R)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.032) (2S)-2-(1-CLOROCICLOPROPIL)-4-[(1S)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.033) (2S)-2-[4-(4-CLOROFENOXI)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol, (1.034) (R)-[3-(4-CLORO-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](metanol3-il)metanol, (1.035) (S)-[3-(4-CLORO-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (1.036) [3-(4-CLORO-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (1.037) 1-[(2R,4S)-2-[2-CLORO-4-(4-clorofenoxi)fenil]-4-metil-1,3-dioxolan-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol, (1.038) 1-[(2S,4S)-2-[2-CLORO-4-(4-clorofenoxi)fenil]-4-metil-1,3-dioxolan-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol, (1.039) 1-[[3-(2-CLOROFENIL)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol-5-iltiocianato, (1.040) 1-[[rel(2R,3R)-3-(2-CLOROFENIL)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol-5-iltiocianato, (1.041) 1-[[rel(2R,3S)-3-(2-CLOROFENIL)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol-5-iltiocianato, (1.042) 2-[(2R,4R,5R)-1-(2,4-DICLOROFENIL)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptano-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.043) 2-[(2R,4R,5S)-1-(2,4-DICLOROFENIL)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptano-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.044) 2-[(2R,4S,5R)-1-(2,4-DICLOROFENIL)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptano-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.045) 2-[(2R,4S,5S)-1-(2,4-DICLOROFENIL)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptano-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.046) 2-[(2S,4R,5R)-1-(2,4-DICLOROFENIL)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptano-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.047) 2-[(2S,4R,5S)-1-(2,4-DICLOROFENIL)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptano-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.048) 2-[(2S,4S,5R)-1-(2,4-DICLOROFENIL)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptano-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.049) 2-[(2S,4S,5S)-1-(2,4-DICLOROFENIL)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptano-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.050) 2-[1-(2,4-DICLOROFENIL)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptano-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.051) 2-[2-CLORO-4-(2,4-diclorofenoxi)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol, (1.052) 2-[2-CLORO-4-(4-clorofenoxi)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.053) 2-[4-(4-CLOROFENOXI)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.054) 2-[4-(4-CLOROFENOXI)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)pentan-2-ol, (1.055) mefentrifluconazole, (1.056) 2-[[3-(2-CLOROFENIL)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.057) 2-[[rel(2R,3R)-3-(2-CLOROFENIL)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.058) 2-[[rel(2R,3S)-3-(2-CLOROFENIL)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.059) 5-(4-CLOROBENCIL)-2-(clorometil)-2-metil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ilmetil)ciclopentanol, (1.060) 5-(ALILSULFONIL)-1-[[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol, (1.061) 5-(ALILSULFONIL)-1-[[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol, (1.062) 5-(ALILSULFONIL)-1-[[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol, (1.063) N'-(2,5-DIMETIL-4-[[3-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil]sulfanil]fenil)-N-etil-N-metilimidofornamida, (1.064) N'-(2,5-DIMETIL-4-[[3-(2,2,2-trifluoroetoxi)fenil]sulfanil]fenil)-N-etil-N-metilimidofornamida, (1.065) N'-(2,5-DIMETIL-4-[[3-(2,2,3,3-tetrafluoropropoxi)fenil]sulfanil]fenil)-N-etil-N-metilimidofornamida, (1.066) N'-(2,5-DIMETIL-4-[[3-(pentafluoroetoxi)fenil]sulfanil]fenil)-N-etil-N-metilimidofornamida, (1.067) N'-(2,5-DIMETIL-4-[[3-((1,1,2,2-tetrafluoroetil)sulfanil]fenoxi)fenil]-N-etil-N-metilimidofornamida, (1.068) N'-(2,5-DIMETIL-4-[[3-((2,2,2-

trifluoroetil)sulfanil]fenoxi}fenil)-N-etil-N-metilimidofornamida, (1.069) N'-(2,5-DIMETIL-4-{3-[(2,2,3,3-tetrafluoropropil)sulfanil]fenoxi}fenil)-N-etil-N-metilimidofornamida, (1.070) N'-(2,5-DIMETIL-4-{3-[(pentafluoroetil)sulfanil]fenoxi}fenil)-N-etil-N-metilimidofornamida, (1.071) N'-(2,5-DIMETIL-4-fenoxifenil)-N-etil-N-metilimidofornamida, (1.072) N'-(4-{3-(DIFLUOROMETOXI)fenil}sulfanil}-2,5-dimetilfenil)-N-etil-N-metilimidofornamida, (1.073) N'-(4-{3-[(DIFLUOROMETIL)sulfanil]fenoxi}-2,5-dimetilfenil)-N-etil-N-metilimidofornamida, (1.074) N'-[5-BROMO-6-(2,3-dihidro-1H-inden-2-iloxi)-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidofornamida, (1.075) N'-(4-{[4,5-Dichlor-1,3-tiazol-2-il]oxi}-2,5-dimetilfenil)-N-etil-N-metilimidofornamida, (1.076) N'-(5-BROMO-6-[(1R)-1-(3,5-difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridin-3-il)-N-etil-N-metilimidofornamida, (1.077) N'-(5-BROMO-6-[(1S)-1-(3,5-difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridin-3-il)-N-etil-N-metilimidofornamida, (1.078) N'-(5-BROMO-6-[(cis-4-isopropilciclohexil)oxi]-2-metilpiridin-3-il)-N-etil-N-metilimidofornamida, (1.079) N'-(5-BROMO-6-[(trans-4-isopropilciclohexil)oxi]-2-metilpiridin-3-il)-N-etil-N-metilimidofornamida, (1.080) N'-(5-BROMO-6-[1-(3,5-difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridin-3-il)-N-etil-N-metilimidofornamida, (1.081) ipfentrifluconazol.

2) Inhibidores de la cadena respiratoria en el complejo I o II, por ejemplo (2.001) Benzovindiflupir, (2.002) Bixafen, (2.003) Boscalid, (2.004) Carboxina, (2.005) FLUOPIRAM, (2.006) Flutolanil, (2.007) Fluxapiroxad, (2.008) Furametpir, (2.009) Isofetamid, (2.010) Isopirazam (enantiómero anti-epímero 1R,4S,9S), (2.011) Isopirazam (enantiómero anti-epímero 1S,4R,9R), (2.012) Isopirazam (mezcla racémica anti-epímera 1RS,4SR,9SR), (2.013) Isopirazam (mezcla de mezcla racémica syn-epímera 1RS,4SR,9RS y mezcla racémica anti-epímera 1RS,4SR,9SR), (2.014) Isopirazam (enantiómero syn-epímero 1R,4S,9R), (2.015) Isopirazam (enantiómero syn-epímero 1S,4R,9S), (2.016) Isopirazam (mezcla racémica syn-epímero 1RS,4SR,9RS), (2.017) Penflufen, (2.018) Penthopirad, (2.019) pidiflumetofen, (2.020) piraziflumid, (2.021) Sedaxane, (2.022) 1,3-DIMETIL-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.023) 1,3-dimetil-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.024) 1,3-DIMETIL-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.025) 1-METIL-3-(trifluorometil)-N-[2'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.026) 2-FLUORO-6-(trifluorometil)-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)benzamida, (2.027) 3-(DIFLUOROMETIL)-1-metil-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.028) 3-(DIFLUOROMETIL)-1-metil-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.029) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.030) fluindapir, (2.031) 3-(difluorometil)-N-[(3R)-7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.032) 3-(difluorometil)-N-[(3S)-7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.033) 5,8-difluoro-N-[2-(2-fluoro-4-{4-(trifluorometil)piridin-2-il}oxi)fenil]etil]quinazolina-4-amina, (2.034) N-(2-ciclopentil-5-fluorobencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.035) N-(2-terc.-butil-5-metilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.036) N-(2-terc.-BUTILBENCIL)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.037) N-(5-CLORO-2-etilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.038) isoflucipram, (2.039) N-[(1R,4S)-9-(DICLOROMETILEN)-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalina-5-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.040) N-[(1S,4R)-9-(diclorometilen)-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalina-5-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.041) N-[1-(2,4-diclorofenil)-1-metoxipropan-2-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.042) N-[2-cloro-6-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.043) N-[3-cloro-2-fluoro-6-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.044) N-[5-cloro-2-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.045) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-N-[5-metil-2-(trifluorometil)bencil]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.046) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-fluoro-6-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.047) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropil-5-metilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.048) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.049) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.050) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(5-fluoro-2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.051) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-4,5-dimetilbencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.052) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-5-fluorobencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.053) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-5-metilbencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.054) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropil-5-fluorobencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.055) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropil-5-metilbencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.056) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropilbencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.057) pirapropoy.

3) Inhibidores de la cadena respiratoria en el complejo III, por ejemplo (3.001) Ametoctradin, (3.002) Amisulbrom, (3.003) Azoxistrobin, (3.004) Coumethoxistrobin, (3.005) Coumoxistrobin, (3.006) ciazofamida, (3.007) Dimoxistrobin, (3.008) Enoxastrobin, (3.009) Famoxadon, (3.010) Fenamidon, (3.011) Flufenoxistrobin, (3.012) Fluoxastrobin, (3.013) Kresoxim-metil, (3.014) Metominostrobin, (3.015) Orisastrobin, (3.016) Picoxistrobin, (3.017) Piraclostrobin, (3.018) Pirametrostrobin, (3.019) Piraoxistrobin, (3.020) Trifloxistrobin, (3.021) (2E)-2-{2-[(1E)-1-(3-[(E)-1-FLUORO-2-fenilvinil]oxi)fenil]etiliden]amino}oxi]metil]fenil}-2-(metoximino)-N-metilacetamida, (3.022) (2E,3Z)-5-[[1-(4-CLOROFENIL)-1H-pirazol-3-il]oxi]-2-(metoximino)-N,3-dimetilpent-3-enamida, (3.023) (2R)-2-{2-[(2,5-DIMETILFENOXI)metil]fenil}-2-metoxi-N-metilacetamida, (3.024) (2S)-2-{2-[(2,5-DIMETILFENOXI)metil]fenil}-2-metoxi-N-metilacetamida, (3.025) Metilo de ácido (3S,6S,7R,8R)-2-propiónico-8-bencil-3-[[3-[(isobutiriloxi)metoxi]-4-metoxipiridin-2-il]carbonil]amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-iléster, (3.026) mandestrobin, (3.027) N-(3-ETIL-3,5,5-trimetilciclohexil)-3-formamido-2-hidroxibenzamid, (3.028) (2E,3Z)-5-[[1-(4-CLORO-2-fluorofenil)-1H-pirazol-3-

- il]oxi)-2-(metoximino)-N,3-dimetilpent-3-enamida, (3.029) metiléster de ácido carbámico de {5-[3-(2,4-dimetilfenil)-1H-pirazol-1-il]-2-metilbencil}, (3.030) metiltetraprol, (3.031) florilpicoxamid.
- 4) Inhibidores de la mitosis y división celular, por ejemplo (4.001) Carbendazim, (4.002) Diethofencarb, (4.003) Ethaboxam, (4.004) Fluopicolide, (4.005) Pencycuron, (4.006) Tiabendazol, (4.007) metil Tiofanato, (4.008) Zoxamida, (4.009) 3-COLORO-4-(2,6-difluorofenil)-6-metil-5-fenilpiridazina, (4.010) 3-COLORO-5-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-6-metilpiridazina, (4.011) 3-COLORO-5-(6-cloropiridin-3-il)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorofenil)piridazina, (4.012) 4-(2-BROMO-4-fluorofenil)-N-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.013) 4-(2-BROMO-4-fluorofenil)-N-(2-bromo-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.014) 4-(2-BROMO-4-fluorofenil)-N-(2-bromofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.015) 4-(2-BROMO-4-fluorofenil)-N-(2-cloro-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.016) 4-(2-BROMO-4-fluorofenil)-N-(2-clorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.017) 4-(2-BROMO-4-fluorofenil)-N-(2-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.018) 4-(2-COLORO-4-fluorofenil)-N-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.019) 4-(2-COLORO-4-fluorofenil)-N-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.020) 4-(2-COLORO-4-fluorofenil)-N-(2-clorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.021) 4-(2-COLORO-4-fluorofenil)-N-(2-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.022) 4-(4-COLOROFENIL)-5-(2,6-difluorofenil)-3,6-dimetilpiridazina, (4.023) N-(2-BROMO-6-fluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.024) N-(2-BROMOFENIL)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.025) N-(4-COLORO-2,6-difluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina.
- 5) Compuestos, que pueden tener efecto en varios lugares ("Multisite Action"), por ejemplo (5.001) mezcla de Bordeaux, (5.002) Captafol, (5.003) Captan, (5.004) Clorotalonil, (5.005) hidróxido de cobre, (5.006) naftenato de cobre, (5.007) óxido de cobre, (5.008) oxicloloro de cobre, (5.009) sulfato de cobre(2+), (5.010) ditionona, (5.011) Dodina, (5.012) Folpet, (5.013) Mancozeb, (5.014) Maneb, (5.015) Metiram, (5.016) zinc Metiram, (5.017) cobre Oxine, (5.018) Propineb, (5.019) azufre y preparados de azufre inclusive pOLISULFURO DE CALCIO, (5.020) Thiram, (5.021) Zineb, (5.022) Ziram, (5.023) nitrilo de ácido 6-ETIL-5,7-dioxo-6,7-dihidro-5H-pirrol[3',4':5,6][1,4]ditiino[2,3-c][1,2]tiazol-3-carbónico.
- 6) Verbindungen que sean aptos para inducir una reacción inmunológica del huésped, por ejemplo (6.001) acibenzolar-S-metilo, (6.002) isotianil, (6.003) probenazol, (6.004) tiadinil.
- 7) Inhibidores de la biosíntesis de aminoácidos y proteínas, por ejemplo (7.001) ciprodinil, (7.002) kasugamicina, (7.003) hidrato de clorhidrato de kasugamicina, (7.004) oxitetraciclina, (7.005) pirimetanil, (7.006) 3-(5-fluoro-3,3,4,4-tetrametil-3,4-dihidroisoquinoleín-1-il)quinoleína.
- 8) Inhibidores de la producción de ATP, por ejemplo, (8.001) Silthiofam.
- 9) Inhibidores de la síntesis de la pared celular, por ejemplo (9.001) Benthiavalicarb, (9.002) isopropilo de Benthiavalicarb, (9.003) Dimethomorfo, (9.004) Flumorfo, (9.005) Iprovalicarbo, (9.006) Mandipropamid, (9.007) Pirimorfo, (9.008) Valifenalato, (9.009) (2E)-3-(4-terc.-BUTILFENIL)-3-(2-cloropiridin-4-il)-1-(morfolin-4-il)prop-2-en-1-on, (9.010) (2Z)-3-(4-terc.-BUTILFENIL)-3-(2-cloropiridin-4-il)-1-(morfolin-4-il)prop-2-en-1-on.
- 10) Inhibidores de la síntesis de los lípidos y membranas, por ejemplo (10.001) propamocarb, (10.002) hidrocloreuro de propamocarb, (10.003) metil tolclofos.
- 11) Inhibidores de la biosíntesis de la melamina, por ejemplo (11.001) triciclazol, (11.002) trifluorometiléster de ácido {3-metil-1-[(4-metilbenzoil)amino]butan-2-il}carbámico-2,2.
- 12) Inhibidores de la síntesis del ácido nucleico, por ejemplo (12.001) benalaxilo, (12.002) benalaxil-M (kiralaxil), (12.003) metalaxil, (12.004) metalaxil-M (mefenoxam).
- 13) Inhibidores de la transducción de señales, por ejemplo (13.001) fludioxonil, (13.002) iprodion, (13.003) procimidona, (13.004) proquinazida, (13.005) quinoxifen, (13.006) vinclozolin.
- 14) Compuestos que pueden actuar como desacopladores, por ejemplo (14.001) fluazinam, (14.002) Meptildinocap.
- 15) Otros compuestos, por ejemplo (15.001) ácido abscísico, (15.002) Benthiazole, (15.003) Bethoxazin, (15.004) Capsimycin, (15.005) Carvona, (15.006) QUhinometionato, (15.007) Cufraneb, (15.008) Cyflufenamid, (15.009) Cymoxanil, (15.010) Cyprosulfamid, (15.011) Flutianil, (15.012) Fosetil aluminio, (15.013) Fosetil calcio, (15.014) Fosetil sodio, (15.015) metilisotiocianato, (15.016) Metrafenona, (15.017) Mildiomicina, (15.018) Natamicina, (15.019) Niquel dimethiditiocarbamato, (15.020) Nitrotal isopropilo, (15.021) Oxamocarb, (15.022) oxatiapiprolina, (15.023) Oxifenthiin, (15.024) pentaclorofenol y sales, (15.025) ácido fosfórico y sus sales, (15.026) propamocarb fosetilato, (15.027) piriufenone (Chlazafenon), (15.028) Tebufloquin, (15.029) Tecloftalam, (15.030) Tolnifanida, (15.031) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-DIFLUOROFENIL)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanon, (15.032) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-DIFLUOROFENIL)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanon, (15.033) 2-(6-BENCILPIRIDIN-2-il)quinazolina, (15.034) dipimetitron, (15.035) 2-[3,5-Bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{5-[2-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanon, (15.036) 2-[3,5-Bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{5-[2-cloro-6-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanon, (15.037) 2-[3,5-

Bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{5-[2-fluoro-6-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il]etanon, (15.038) 2-[6-(3-FLUORO-4-metoxifenil)-5-metilpiridin-2-il]quinazolina, (15.039) ácido metano sulfónico-2-[(5R)-3-[2-(1-[[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il]-3-clorofeniléster, (15.040) ácido metano sulfónico-2-[(5S)-3-[2-(1-[[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il]-3-clorofeniléster, (15.041) ipflufenoquin, (15.042) 2-[2-fluoro-6-[(8-fluoro-2-metilquinolin-3-il)oxi]fenil]propan-2-ol, (15.043) ácido metano sulfónico-2-[3-[2-(1-[[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il]-3-clorofeniléster, (15.044) ácido metano sulfónico-2-[3-[2-(1-[[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il]feniléster, (15.045) 2-fenilfenol y sales, (15.046) 3-(4,4,5-trifluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinoleína-1-il)quinoleína, (15.047) quinofumelin, (15.048) 4-amino-5-fluoropirimidin-2-ol (forma tautomérica: 4-amino-5-fluoropirimidin-2(1H)-on), (15.049) 4-oxo-4-[(2-feniletil)amino]ácido butánico, (15.050) 5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-tiol, (15.051) 5-cloro-N'-fenil-N'-(prop-2-in-1-il)tiofen-2-sulfonohidrazida, (15.052) 5-fluoro-2-[(4-fluorobencil)oxi]pirimidin-4-amina, (15.053) 5-fluoro-2-[(4-metilbencil)oxi]pirimidin-4-amina, (15.054) 9-fluoro-2,2-dimetil-5-(quinoleína-3-il)-2,3-dihidro-1,4-benzoxazepina, (15.055) {6-[[{(Z)-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilen]amino}oxi]metil]piridin-2-il}ácido carbámico-but-3-in-1-iléster, (15.056) (2Z)-3-amino-2-ciano-3-etiléster del ácido de fenilacrilato, (15.057) ácido fenazina-1-carbónico, (15.058) propiléster de ácido benzóico 3,4,5-trihidroxi, (15.059) quinolin-8-ol, (15.060) sulfato de quinolin-8-ol (2:1), (15.061) éster terc.-butílico de ácido carbámico {6-[[{(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilen]amino}oxi]metil]piridin-2-il}, (15.062) 5-fluoro-4-imino-3-metil-1-[(4-metilfenil)sulfonil]-3,4-dihidropirimidin-2(1H)-on, (15.063) aminopirifen.

20 **Plaguicidas biológicos como componentes de la mezcla**

Los compuestos de la Fórmula (I) se pueden combinar con plaguicidas biológicos.

Los plaguicidas biológicos comprenden especialmente a bacterias, hongos, levaduras, extractos vegetales y aquellos productos que han sido formados por microorganismos, inclusive proteínas y productos metabólicos secundarios.

25 Los plaguicidas biológicos comprenden a bacterias tales como bacterias formadoras de esporas, rizobacterias y bacterias que tienen efecto de insecticida, fungicida o nematocida biológico.

Ejemplos de tales bacterias que se pueden emplear o que se pueden utilizar como plaguicidas biológicos son:

30 *Bacillus amyloliquefaciens*, cepa FZB42 (DSM 231179), o *Bacillus cereus*, en especial *B. cereus* cepa CNCM I-1562 o *Bacillus firmus*, cepa I-1582 (Accession number CNCM I-1582) o *Bacillus pumilus*, en especial la cepa GB34 (Accession No. ATCC 700814) y cepa QST2808 (Accession No. NRRL B-30087), o *Bacillus subtilis*, en especial cepa GB03 (Accession No. ATCC SD-1397), o *Bacillus subtilis* cepa QST713 (Accession No. NRRL B-21661) o *Bacillus subtilis* cepa OST 30002 (Accession No. NRRL B-50421), *Bacillus thuringiensis*, en especial *B. thuringiensis* subespecie *israelensis* (serotipo H-14), cepa AM65-52 (Accession No. ATCC 1276), o *B. thuringiensis subsp. aizawai*, especialmente cepa ABTS-1857 (SD-1372), o *B. thuringiensis subsp. kurstaki* cepa HD-1, o *B. thuringiensis subsp. tenebrionis* cepa NB 176 (SD-5428), *Pasteuria penetrans*, *Pasteuria spp.* (Rotylenchulus reniformis nematode)-PR3 (Accession Number ATCC SD-5834), *Streptomyces microflavus* cepa AQ6121 (= QRD 31.013, NRRL B-50550), *Streptomyces galbus* cepa AQ 6047 (Accession Number NRRL 30232).

Ejemplos de hongos y levadura que se pueden emplear o que se pueden utilizar como plaguicidas biológicos son:

40 *Beauveria bassiana*, especialmente cepa ATCC 74040, *Coniothyrium minitans*, especialmente cepa CON/M/91-8 (Accession No. DSM-9660), *Lecanicillium spp.*, especialmente cepa HRO LEC 12, *Lecanicillium lecanii* (antes conocida como *Verticillium lecanii*), especialmente cepa KV01, *Metarhizium anisopliae*, especialmente cepa F52 (DSM3884/ATCC 90448), *Metschnikowia fructicola*, especialmente cepa NRRL Y-30752, *Paecilomyces fumosoroseus* (nuevo: *Isaria fumosorosea*), especialmente cepa IFPC 200613, o cepa Apopka 97 (Accession No. ATCC 20874), *Paecilomyces lilacinus*, especialmente *P. lilacinus* cepa 251 (AGAL 89/030550), *Talaromyces flavus*, especialmente cepa V117b, *Trichoderma atroviride*, especialmente cepa SC1 (Accession Number CBS 122089), *Trichoderma harzianum*, especialmente *T. harzianum rifai T39*. (Accession Number CNCM I-952).

Ejemplos de virus que se pueden emplear o que se pueden utilizar como plaguicidas biológicos son:

50 *Adoxophyes orana* (polilla de la piel del fruto) Granulosevirus (GV), *Cydia pomonella* (polilla del manzano) Granulosevirus (GV), *Helicoverpa armigera* (gusano del algodón) Nuklear Polyhedrosis Virus (NPV), *Spodoptera exigua* (gusano soldado) mNPV, *Spodoptera frugiperda* (cogollero del maíz) mNPV, *Spodoptera littoralis* (gusano del algodón africano) NPV.

También comprende bacterias y hongos que se añaden como "inoculante" a las plantas, partes de plantas u órganos de plantas y que, a causa de sus propiedades especiales fomentan el crecimiento y la salud de la planta. Como ejemplos cabe mencionar:

55 *Agrobacterium spp.*, *Azorhizobium caulinodans*, *Azospirillum spp.*, *Azotobacter spp.*, *Bradyrhizobium spp.*, *Burkholderia spp.*, insbepondere *Burkholderia cepacia* (antes conocido como *Pseudomonas cepacia*), *Gigaspora spp.*, o *Gigaspora monosporum*, *Glomus spp.*, *Laccaria spp.*, *Lactobacillus buchneri*, *Paraglomus spp.*, *Pisolithus tinctorius*,

Pseudomonas spp., *Rhizobium spp.*, especialmente *Rhizobium trifolii*, *Rhizopogon spp.*, *Scleroderma spp.*, *Suillus spp.*, *Streptomyces spp.*

Ejemplos de extractos vegetales y tales productos que son formados por microorganismos, inclusive proteínas y productos metabólicos secundarios, que se pueden emplear o que se pueden utilizar como plaguicidas biológicos son:

- 5 *Allium sativum*, *artemisia absinthium*, *azadiractina*, *biokeeper WP*, *cassia nigricans*, *celastrus angulatus*, *chenopodium anthelminticum*, *quitina*, *Armour-Zen*, *dryopteris filix-mas*, *equisetum arvense*, *Fortune Aza*, *Fungastop*, *Heads Up* (*chenopodium* extracto de quinoa y saponina), *piretrina*, *quassia amara*, *quercus*, *quillaja*, *regalia*, „*Requiem*™ *Insecticide*“, *Rotenon*, *rianodina*, *symphytum officinale*, *tanacetum vulgare*, *timol*, *Triact 70*, *TriCon*, *tropaeolum majus*, *urtica dioica*, *Veratrin*, *viscum album*, extracto de *brassicaceae*, particularmente polvo de colza o mostaza.

10 **Protectores como compuestos**

Los compuestos de la Fórmula (I) pueden combinarse con protectores, como por ejemplo *benoxacor*, *cloquintocet* (-mexilo), *cyometrinilo*, *cyprosulfamido*, *diclormid*, *fenclorazol* (-etilo), *fenclorim*, *flurazol*, *fluxofenim*, *furilazol*, *isoxadifen* (-etilo), *mefenpir* (-dietilo), *anhídrido naftálico*, *oxabetrinil*, *2-metoxi-N-({4-[(metilcarbamoil)amino]fenil}sulfonyl)benzamid* (CAS 129531-12-0), *4-(dicloracetil)-1-oxa-4-azaspiro[4,5]decan* (CAS 71526-07-3), *2,2,5-trimetil-3-(dicloracetil)-1,3-oxazolidin* (CAS 52836-31-4).

15

Plantas y partes de plantas

Conforme a la invención, es posible tratar todas las plantas y partes de plantas. El término plantas comprende todas las plantas y poblaciones de plantas tales como plantas silvestres deseadas e indeseadas o cultivos (inclusive cultivos naturales), como por ejemplo cereales (trigo, arroz, *triticale*, cebada, centeno, avena), maíz, soja, papa, remolacha, caña de azúcar, tomate, pimiento, pepino, melón, zahanoria, sandía, cebolla, lechuga, espinaca, puerro, porotos, *Brassica oleracea* (p.ej. repollo) y otro tipo de vegetales, algodón, tabaco, colza, así como plantas frutales (manzanas, peras, cítricos y uvas). Los cultivos pueden ser plantas obtenidas mediante métodos de reproducción y optimización convencional o bien mediante métodos de biotecnología y genética o la combinación de estos métodos, que incluye plantas transgénicas y aquellas especies protegidas o no por un derecho de obtención vegetal. El término plantas comprende todas las fases de desarrollo, desde semillas, esquejes y plantas jóvenes (no maduras) hasta plantas totalmente desarrolladas. El término partes de plantas incluye todas las partes y órganos de plantas sobre y por debajo de la superficie de la tierra, tales como brotes, hojas, flores y raíces. Se nombran no obstante algunos términos como hojas, espinas, tallos, troncos, flores, cuerpos fructíferos, frutos y semillas, así como raíces, tubérculos y rizomas. Pertenecen asimismo al grupo de partes de plantas las plantas o partes de plantas cosechadas y el material de reproducción vegetativo y generativo como esquejes, tubérculos, rizomas, gajos y semillas.

20

25

30

El tratamiento de plantas y partes de plantas con compuestos de la Fórmula (I) basado en esta invención se realiza directa o indirectamente (una vez haya actuado el compuesto) sobre el entorno, biotopo o lugar de almacenado a través de los métodos convencionales de aplicación, a saber, inmersión, rociado, vaporización, pulverización, dispersión, aplicación, inyección y, en el caso de material de reproducción, principalmente en semillas, al recubrir con una o varias capas.

35

Tal y como se afirma anteriormente, el tratamiento basado en esta invención puede aplicarse a todas las plantas y sus partes. En su forma de presentación preferente, el tratamiento se lleva a cabo en especies de plantas silvestres u obtenidas a través de métodos convencionales de reproducción biológica como cruzamiento o fusión de protoplastos. En otra forma de presentación preferente, el tratamiento se lleva a cabo en plantas y especies de plantas transgénicas y sus partes, obtenidas a través de métodos de ingeniería genética, combinados en algunos casos con métodos convencionales (organismos genéticamente modificados). El término "partes" o "partes de plantas" fue desarrollado anteriormente. Especialmente preferente es el tratamiento basado en esta invención que sea realiza sobre plantas pertenecientes a variedades de plantas de uso comercial o uso habitual. El término variedad de planta comprende aquellas plantas con características o rasgos nuevos ("traits"), obtenidas a partir de métodos de reproducción convencional, mutagénesis o técnicas de ADN recombinante. Puede tratarse de variedades, razas, biotipos y genotipos.

40

45

Planta transgénica, tratamiento de semillas e integración

Entre las plantas y/o variedades de plantas transgénicas (obtenidas mediante ingeniería genética) de tratamiento preferente basado en esta invención se encuentran todas aquellas plantas que, como resultado de una modificación genética, hayan obtenido material genético que les confiera ciertos rasgos o cualidades favorables y valiosas ("traits"). Algunos ejemplos de estas cualidades favorables son: mejor crecimiento, mayor tolerancia a temperaturas altas o bajas, mayor resistencia a la sequía o concentración salina del agua y del suelo, mayor producción de flores, recolección o cosecha más sencilla, aceleramiento en el proceso de madurez, mayor rendimiento de la cosecha, mejor calidad y/o mayor valor nutricional del producto, aumento de la vida útil y/o capacidad de manipular el producto cosechado. Otros ejemplos particularmente destacables son la mayor resistencia de estas plantas ante la presencia de parásitos animales y agentes microbianos, tales como insectos, arácnidos, nematodos, ácaros y caracoles, ocasionada por ejemplo por toxinas propias de las plantas, particularmente aquellas generadas por el material genético del *Bacillus Thuringiensis* (p. ej. A través de los genes *CryIA(a)*, *CryIA(b)*, *CryIA(c)*, *CryIIA*, *CryIIIA*, *CryIIIB2*, *Cry9c*

50

55

Cry2Ab, Cry3Bb y Cry1F y sus respectivas combinaciones). Se distingue asimismo una mayor capacidad de defenderse contra hongos patógenos, bacterias y/o virus, gracias, por ejemplo, a la resistencia sistémica adquirida (RSA), la sistemina, fitoalexinas, elicitores, genes de resistencia así como proteínas y toxinas expresadas, una mayor tolerancia a ciertas sustancias herbicidas como imidazolinonas, sulfonilureas, glifosato o fosfinotricina (p.ej. gen pat).

5 Es posible que en las plantas transgénicas se presente asimismo una combinación de los genes que confieren los rasgos o cualidades deseadas ("traits"). Los siguientes cultivos son algunos ejemplos de plantas transgénicas: cereales (trigo, arroz, triticale, cebada, centeno, avena), maíz, soja, papa, remolacha, caña de azúcar, tomate, arvejasy y otro tipo de vegetales, algodón, tabaco, colza, así como plantas frutales (manzanas, peras, cítricos y uvas), aunque se destacan particularmente el maíz, la soja, el trigo, el arroz, la papa, el algodón, la caña de azúcar, el tabaco y la
10 colza. Una de las cualidades ("traits") particularmente destacables es la mayor capacidad de defensa de las plantas ante la presencia de insectos, arácnidos, nematodos y caracoles.

Protección de semillas – Tipos de tratamiento

15 El tratamiento de plantas y partes de plantas con compuestos de la Fórmula (I) basado en esta invención se realiza directa o indirectamente (una vez haya actuado el compuesto) sobre el entorno, biotopo o lugar de almacenado a través de los métodos convencionales de aplicación, a saber inmersión, rociado, irrigación, vaporización, atomización, pulverización, dispersión, espumado, aplicación, inyección, riego (drench), riego por goteo y, en el caso de material de reproducción, principalmente en semillas, utilizando polvos en vía húmeda o seca, tratamientos slurry, incrustación, recubrimiento con una o varias capas, etc. Es posible además esparcir los compuestos de la Fórmula (I) de acuerdo al procedimiento de ultra bajo volumen o inyectar directamente la forma de aplicación o el compuesto de la Fórmula
20 (I) en el suelo.

Los compuestos de la Fórmula (I) deben aplicarse preferentemente de manera directa sobre el follaje; la frecuencia con la que se realiza el tratamiento y la dosis a aplicar dependerá directamente del riesgo de infección de la plaga en cuestión.

25 En el caso de sustancias activas por vía sistémica, los compuestos de la Fórmula (I) irrigan la planta incluso a través de la raíz. El tratamiento de las plantas se produce una vez que los compuestos de la Fórmula (I) hayan actuado sobre el biotopo de las mismas. Existen varias técnicas para dicho tratamiento: la técnica drench, mediante la cual la sustancia se mezcla en el suelo o sustrato, es decir que la superficie donde se ubica la planta (p. ej. suelo o sistemas hidropónicos) se empapa con los compuestos de la Fórmula (I) en forma líquida; la aplicación en suelo, es decir que los compuestos de la Fórmula (I) basados en esta invención se inyectan en forma sólida en la superficie adyacente a la planta (p.ej. en forma de granulado); o la aplicación por goteo ("drip" o también llamada "quimigación"), en la cual los compuestos de la Fórmula (I) basados en esta invención se incorporan por medio de un sistema de riego por goteo instalado sobre o por debajo de la superficie de la tierra que irriga lugares definidos cerca de la planta durante períodos determinados de tiempo y utilizando cantidades variables de agua. En cultivos de zizania, el compuesto de la Fórmula (I) puede dosificarse en una forma de aplicación sólida (p. ej. granulado) en el cultivo sumergido en agua.

35 Tratamiento de semillas

La gestión de plagas mediante el tratamiento de semillas es un método utilizado desde hace mucho tiempo y se encuentra sometido a un proceso de mejora continua. Sin embargo, al tratar las semillas nos encontramos con diversos problemas que no siempre tienen una solución adecuada. Es por ello que resulta conveniente poder desarrollar procedimientos para proteger las semillas y las plantas germinadas y evitar o al menos reducir drásticamente la
40 aplicación adicional de pesticidas durante el almacenaje, después de la siembra o tras la germinación de la planta. Se busca asimismo optimizar la cantidad de sustancia activa que se aplica a fin de proteger lo mejor posible las semillas y plantas germinadas ante una posible infección de plagas, sin por ello dañar la planta con el pesticida. Los procedimientos para el tratamiento de semillas deberían considerar sobre todo las cualidades insecticidas y nematicidas propias de las plantas transgénicas resistentes a plagas, a fin de proteger de manera óptima las semillas y plantas germinadas utilizando la menor cantidad de pesticidas posible.

La presente invención hace por ello especial referencia a un procedimiento de protección de semillas y plantas germinadas ante plagas, utilizando uno de los compuestos de la Fórmula (I). El procedimiento de protección de semillas y plantas germinadas basado en esta invención abarca además un procedimiento, a través del cual se tratan las semillas en una única aplicación o de manera secuencial con un compuesto de la Fórmula (I) y un componente de mezcla
50 con un compuesto de la Fórmula (I) y un componente de mezcla.

La presente invención hace también referencia al uso de compuestos de la Fórmula (I) para el tratamiento de semillas con el fin de proteger las semillas y plantas de posibles plagas.

55 Además, esta invención contempla semillas que fueron ya tratadas con un compuesto de la Fórmula (I) basado en esta invención para protegerlas de posibles plagas. La presente invención hace también referencia a semillas que fueron tratadas simultáneamente con un compuesto de la Fórmula (I) y un componente de mezcla. La presente invención hace referencia asimismo a semillas que fueron tratadas en diferentes momentos con un compuesto de la Fórmula (I) y un componente de mezcla. En las semillas que fueron tratadas en diferentes momentos con un

- 5 compuesto de la Fórmula (I) y un componente de mezcla podrán eventualmente observarse las diferentes sustancias en las diferentes capas. Es posible que las capas que contengan un compuesto de la Fórmula (I) y componentes de mezcla estén separadas por una capa intermedia. La presente invención hace referencia asimismo a semillas, sobre las cuales se han aplicado un compuesto de la Fórmula (I) y un componente de mezcla como parte de un recubrimiento o una o más capas adicionales de recubrimiento.
- Esta invención se refiere además a aquellas semillas que, tras ser tratadas con un compuesto de la Fórmula (I), fueron sometidas a un procedimiento de film coating, en el que se aplica una película de recubrimiento a fin de evitar la abrasión del polvo.
- 10 Una de las ventajas visibles de la eficacia sistémica de un compuesto de la Fórmula (I) es que el tratamiento de las semillas no solo protege a las semillas ante la posible infección de plagas sino también a las plantas que luego germinarán. De esta manera resulta innecesario tratar el cultivo a la hora de sembrar o posteriormente.
- Otra ventaja que podemos observar es que el tratamiento de las semillas con un compuesto de la Fórmula (I) favorece la germinación y el posterior crecimiento de dichas semillas.
- 15 Resulta provechoso además que los compuestos de la Fórmula (I) pueden aplicarse sobre todo en semillas transgénicas.
- Los compuestos de la Fórmula (I) pueden combinarse también con equipos de señalización, lo que facilita la creación de poblaciones de simbioses, como por ejemplo rizobios, micorrizas y/o bacterias endófitas u hongos, y/u optimiza la fijación de nitrógeno.
- 20 Los compuestos de la Fórmula (I) son aptos para proteger las semillas de todas las variedades de plantas utilizadas en la agricultura, silvicultura, en un invernadero o en jardinería. Se trata en particular de semillas de cereales (p. ej. trigo, cebada, centeno, mijo y avena), maíz, algodón, soja, arroz, papas, girasol, café, tabaco, canola, colza, remolacha y remolacha forrajera, maní, verduras (p. ej. tomate, pepino, poroto, coles, cebollas y lechuga), plantas cítricas, césped y plantas ornamentales. El tratamiento de semillas resulta de gran importancia para los cereales, tales como trigo, cebada, centeno y avena, así como para el maíz, la soja, el algodón, la canola, la colza, las verduras y el arroz.
- 25 Tal y como se mencionó anteriormente, el tratamiento de semillas transgénicas con un compuesto de la Fórmula (I) resulta de vital importancia también. En este caso se trata de semillas de plantas que contienen generalmente al menos un gen heterólogo que regula la expresión de un polipéptido con características particularmente insecticidas y/o nematocidas. Los genes heterólogos en semillas transgénicas pueden provenir de microorganismos como bacilos, rizobios, pseudomonas, serratia, tricoxemas, clavibacter, glomus o gliocadium. La presente invención es particularmente apta para el tratamiento de semillas transgénicas que contienen al menos un gen heterólogo proveniente del Bacillus sp. Especialmente preferente es un gen heterólogo proveniente del Bacillus thuringiensis.
- 30 En el marco de la presente invención se aplica el compuesto de la Fórmula (I) sobre las semillas. Las semillas deben encontrarse preferiblemente en un estado de tal estabilidad, que las mismas no puedan sufrir daños durante el tratamiento. En líneas generales, el tratamiento de las semillas puede llevarse a cabo en cualquier momento entre la cosecha y la siembra. Normalmente se utilizan semillas previamente extraídas de la planta y que no contengan espádices, vainas, tallos, lana ni pulpa. Se pueden por ejemplo utilizar semillas que hayan sido cosechadas, limpiadas y secadas para poder almacenarse. Es posible utilizar asimismo semillas que después del proceso de secado hayan sido tratadas con agua, por ejemplo, y luego secadas nuevamente, por ejemplo, mediante priming. En el caso de semillas de arroz, es posible también utilizar semillas previamente sumergidas en agua, por ejemplo, en agua hasta un cierto estadio del embrión de arroz ("Pigeon Breast Stage"), lo que estimula la germinación y un crecimiento uniforme del cultivo.
- 35 En general es importante verificar que durante el tratamiento de las semillas, la cantidad de compuesto de la Fórmula (I) y/u otros aditivos que se aplica sobre las semillas no impida la germinación de las mismas ni dañe la planta naciente. Esto resulta de vital importancia sobre todo al utilizar sustancias activas que puedan tener efectos fitotóxicos en ciertas dosis.
- 40 Los compuestos de la Fórmula (I) se suelen aplicar utilizando una Fórmula adecuada. El experto en la materia conoce en detalle las Fórmulas y procedimientos apropiados para el tratamiento de semillas.
- Los compuestos de la Fórmula (I) pueden ser utilizados en las Fórmulas convencionales de limpieza, tales como soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, espumas, slurrries u otras sustancias de revestimiento de semillas así como Fórmulas ULV.
- 50 Para desarrollar estas Fórmulas se requiere mezclar compuestos de la Fórmula (I) con aditivos convencionales como por ejemplo expansores, disolventes, diluyentes, colorantes, humectantes, dispersantes, emulsionantes, antiespumantes, conservantes, espesantes secundarios, pegamentos, giberelina y agua.

Por colorantes presentes en las Fórmulas de limpieza basadas en esta invención se entiende cualquier tipo de colorante utilizado comúnmente para estos fines. Se utilizan tanto pigmentos poco solubles en agua como colorantes solubles. Algunos ejemplos son rodamina B, C.I. Pigmento Red 112 y C.I. Solvente Red 1.

5 Por humectante en las Fórmulas de sustancias corrosivas basadas en esta invención se entiende cualquier tipo de sustancia utilizada comúnmente en la formulación de sustancias agroquímicas activas que estimule la humectación. Utilizar preferentemente alquil naftalen sulfonato de sodio, diisopropil naftaleno sulfonato de sodio o diisobutil naftaleno sulfonato de sodio.

10 Por dispersante y/o emulsionante en las Fórmulas de limpieza basadas en esta invención se entiende cualquier tipo de dispersante no iónico, aniónico y catiónico utilizado comúnmente en la formulación de sustancias agroquímicas activas. Utilizar preferentemente dispersantes no iónicos o aniónicos o bien mezclas de dispersantes no iónicos o aniónicos. Algunos dispersantes no iónicos apropiados son polímeros bloque de etilenoóxido y propilenoóxido, alquil fenol poliglicol eter y tri-striril fenol poliglicol eter y sus derivados fosfatados o sulfatados. Algunos dispersantes aniónicos aptos para esta tarea son en particular el lignosulfonato, las sales de ácido poliacrílico y el aril sulfonato de formaldehído condensado.

15 Por antiespumante en las Fórmulas de limpieza basadas en esta invención se entiende cualquier tipo de sustancia antiespumante utilizada comúnmente en la formulación de sustancias agroquímicas activas. Utilizar preferentemente antiespumantes siliconados y estearato de magnesio.

20 Por conservantes en las Fórmulas de adobo basadas en esta invención se entiende cualquier tipo de sustancia utilizada comúnmente en sustancias agroquímicas a tales fines. Algunos ejemplos son diclorofos y benzil alcohol hemiformal.

Por espesantes secundarios en las Fórmulas de limpieza basadas en esta invención se entiende cualquier tipo de sustancia utilizada comúnmente en sustancias agroquímicas a tales fines. Utilizar preferentemente derivados de celulosa, derivados de ácido acrílico, xantán, tonos modificados y ácido silícico de alta dispersión.

25 Por pegamentos presentes en las Fórmulas de limpieza basadas en esta invención se entiende cualquier tipo de ligante utilizado en agentes corrosivos. Se nombran preferentemente polivinilpirrolidona, polivinilacetato, alcohol polivinílico y tilosa.

30 Al utilizar giberelina en las Fórmulas de limpieza basadas en esta invención se recomienda utilizar preferentemente giberelina A1, A3 (= ácido de giberelina), A4 y A7, especialmente preferente es el ácido de giberelina. Las giberelinas son conocidas (véase R. Wegler „Chemie der Pflanzenschutz- und Schädlingsbekämpfungsmittel“, tomo 2, Springer Verlag, 1970, pg. 401-412).

35 Las Fórmulas de limpieza basadas en esta invención pueden utilizarse directamente o previamente diluidas en agua para tratar las semillas de diferentes tipos. De esta manera se aplican los concentrados o las preparaciones diluidas con agua para limpiar las semillas de cereales como trigo, cebada, centeno, avena y triticale así como de semillas de maíz, arroz, colza, arvejas, porotos, algodón, girasol, soja y remolacha o también semillas de vegetales de todo tipo. Las Fórmulas de limpieza basadas en esta invención o sus formas de aplicación diluidas pueden utilizarse también para limpiar las semillas de plantas transgénicas.

40 Para tratar las semillas con las Fórmulas de limpieza basadas en esta invención o las formas de aplicación resultantes al añadir agua pueden utilizarse todos los dispositivos mezcladores para limpiar las semillas. Para limpiar las semillas se debe colocar las mismas en un mezclador, ya sea de manera continua o discontinua, añadir la cantidad deseada de agente corrosivo (previamente diluido con agua o concentrado) y mezclar hasta que la Fórmula se haya distribuido de manera uniforme entre las semillas. En caso de ser necesario, secar las semillas una vez finalizada la limpieza.

45 La cantidad de Fórmula de limpieza basada en esta invención puede variar ampliamente, dependiendo del contenido de compuestos de la Fórmula (I) en las Fórmulas y la cantidad de semillas. La dosis de compuestos de la Fórmula (I) a aplicar oscila generalmente entre 0,001 g y 50 g por kilogramo de semillas, preferentemente entre 0,01 g y 15 g por kilogramo de semillas.

Sanidad animal

50 En el campo de la sanidad animal, es decir en el ámbito de la medicina veterinaria, se constata que los compuestos de la Fórmula (I) contra parásitos animales, en particular los ectoparásitos, son eficaces. El término endoparásito abarca principalmente helmintos y protozoos tales como los coccidios. Los ectoparásitos son típica y preferentemente artrópodos, particularmente insectos o acáridos.

En el campo de medicina veterinaria, los compuestos de la Fórmula (I) que presentan una toxicidad favorable respecto a los animales de sangre caliente son especialmente aptos para el control de parásitos en la cría y explotación de animales de granja, de cría, de zoológico, laboratorio y domésticos. Son efectivos contra todas y cada una de las fases de desarrollo de parásitos.

ES 2 980 245 T3

Entre los animales de agricultura se encuentran por ejemplo mamíferos como ovejas, cabras, caballos, burros, camellos, búfalos, conejos, renos, gamos y fundamentalmente vacas y cerdos; aves como pavos, patos, gansos y fundamentalmente gallinas; o peces o crustáceos como p. ej. en la acuicultura, o incluso insectos como las abejas.

5 Entre los animales domésticos se encuentran por ejemplo mamíferos como hámster, cobayos, ratas, ratones, chinchillas, hurones, y fundamentalmente perros, gatos, pájaros, reptiles, anfibios o peces de acuario.

De acuerdo a una forma de presentación determinada, los compuestos de la Fórmula (I) se administran a mamíferos.

De acuerdo a otra forma de presentación, los compuestos de la Fórmula (I) se administran a pájaros o particularmente a las aves.

10 Al utilizar compuestos de la Fórmula (I) como antiparasitarios, se reducen y/o previenen enfermedades, muertes o pérdidas de rendimiento (en la producción de carne, leche, lana, pieles, juevos, miel y afines), lo que favorece económicamente y facilita la producción ganadera y permite lograr una mejor calidad de vida de los animales.

15 En el campo de la sanidad animal, el término "combate" o "combatir" dentro de este contexto significa que gracias a los compuestos de la Fórmula (I) es posible reducir eficientemente la presencia de uno o más parásitos en un animal, que se encuentra ya infectado por parásitos, aunque de manera inofensiva. Dicho de otra manera, "combatir" en este contexto implica que los compuestos de la Fórmula (I) destruyen o eliminan el parásito, previenen su crecimiento o evitan su reproducción.

Entre los artrópodos figuran por ejemplo, sin restringir en número,

del orden de los anopluros, p. ej. los *haematopinus* spp., *linognathus* spp., *pediculus* spp., *phtirus* spp., *solenopotes* spp.

20 del orden de los mallophaga y subórdenes amblicera e ischnóceros, por ejemplo, los *bovicola* spp., *damalina* spp., *felicola* spp.; *lepiquentron* spp., *menopon* spp., *tricodectes* spp., *trimenopon* spp., *trinoton* spp., *werneckiella* spp;

25 del orden de los dípteros y subórdenes nematóceros y braquíceros, por ejemplo el *aedes* spp., *anopheles* spp., *atylotus* spp., *braula* spp., *calliphora* spp., *chrysomyia* spp., *chrysops* spp., *culex* spp., *culicoides* spp., *eusimulium* spp., *fannia* spp., *gasterophilus* spp., *glossina* spp., *haematobia* spp., *haematopota* spp., *hippobosca* spp., *hybomitra* spp., *hydrotaea* spp., *hypoderma* spp., *lipoptena* spp., *lucilia* spp., *lutzomyia* spp., *melophagus* spp., *morellia* spp., *musca* spp., *odagmia* spp., *oestrus* spp., *philipomyia* spp., *phlebotomus* spp., *rhinoestrus* spp., *sarcophaga* spp., *simulium* spp., *stomoxys* spp., *tabanus* spp., *tipula* spp., *wilhelmia* spp., *wohlfarhtia* spp.;

del orden de los sifonápteros, por ejemplo, el *ceratophyllus* spp., *ctenocephalides* spp., *pulex* spp., *tunga* spp., *xenopsylla* spp.;

30 del orden de los heterópteros, por ejemplo, el *cimex* spp., *panstrongylus* spp., *rhodnius* spp., *triatoma* spp.; así como insectos molestos y plagas urbanas del orden de los blatodeos.

Entre los artrópodos debemos mencionar asimismo a los siguientes ácaros:

35 De la subclase de los Acari (Acarina) y el orden de los Metastigmata, por ejemplo, la familia Argasidae y *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Otobius* spp., la familia Ixodidae y *Amblyomma* spp., *Dermacentor* spp., *Haemaphysalis* spp., *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Rhipicephalus* (*Boophilus*) spp., *Rhipicephalus* spp. (la especie originaria de las garrapatas); del orden de los Mesostigmata, como *Dermanyssus* spp., *Ornithonyssus* spp., *Pneumonyssus* spp., *Raillietia* spp., *Sternostoma* spp., *Tropilaelaps* spp., *Varroa* spp.; del orden de los Actinedida (Prostigmata), por ejemplo *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp., *Demodex* spp., *Listrophorus* spp., *Myobia* spp., *Neotrombicula* spp., *Ornithocheyletia* spp., *Psorergates* spp., *Trombicula* spp.; y del orden de los Acaridida (Astigmata), por ejemplo los *Acarus* spp.,
40 *Caloglyphus* spp., *Choriotptes* spp., *Cytodites* spp., *Hypodectes* spp., *Knemidocoptes* spp., *Laminosioptes* spp., *Notoedres* spp., *Otodectes* spp., *Psoroptes* spp., *Pterolichus* spp., *Sarcoptes* spp., *Trixacarus* spp., *Tyrophagus* spp.

Entre los protozoos parasitarios se encuentran, por ejemplo:

los mastigóforos (flagelados), tales como:

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

45 Parabasala: del orden de los Trichomonadida por ejemplo *Histomonas* spp., *Pentatrichomonas* spp., *Tetratrachomonas* spp., *Trichomonas* spp., *Tritrichomonas* spp.

Euglenozoa: del orden de los Trypanosoma por ejemplo *Leishmania* spp., *Trypanosoma* spp.

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

ES 2 980 245 T3

- Alveolata tales como Apicomplexa (Sporozoa): p. ej., *Cryptosporidium* spp.; del orden de los Eimeriida por ejemplo *Besnoitia* spp., *Cystoisospora* spp., *Eimeria* spp., *Hammondia* spp., *Isospora* spp., *Neospora* spp., *Sarcocystis* spp., *Toxoplasma* spp.; del orden de los Adeleida p. ej. *Hepatozoon* spp., *Klossiella* spp.; del orden de los Haemosporida p. ej. *Leucocytozoon* spp., *Plasmodium* spp.; del orden de los Piroplasmida p. ej. *Babesia* spp., *Ciliophora* spp., *Echinozoon* spp., *Theileria* spp.; del orden de los Vesibuliferida p. ej. *Balantidium* spp., *Buxtonella* spp.
- 5 Micrósporas tales como *Encephalitozoon* spp., *Enterocytozoon* spp., *Globidium* spp., *Nosema* spp., y además p. ej. *Myxozoa* spp.
- Entre los helmintos patógenos para humanos y animales se encuentran por ejemplo los Acanthocephala, Nematoden, Pentastoma y Plathelminthos (p.ej. Monogenea, Cestodes y Trematodes).
- 10 Entre los helmintos figuran, por ejemplo, sin restringir en número:
- Monogenea: p. ej.: *Dactylogyrus* spp., *Gyrodactylus* spp., *Microbothrium* spp., *Polystoma* spp., *Troglocephalus* spp.;
- Cestodes: del orden de los Pseudophyllidea por ejemplo: *Bothridium* spp., *Diphyllobothrium* spp., *Diplogonoporus* spp., *Ichthyobothrium* spp., *Ligula* spp., *Schistocephalus* spp., *Spirometra* spp.
- 15 Del orden de los Cyclophyllida por ejemplo: *Andyria* spp., *Anoplocephala* spp., *Avitellina* spp., *Bertiella* spp., *Cittotaenia* spp., *Davainea* spp., *Diorchis* spp., *Diplopylidium* spp., *Dipylidium* spp., *Echinococcus* spp., *Echinocotyle* spp., *Echinolepis* spp., *Hydatigera* spp., *Hymenolepis* spp., *Joyeuxiella* spp., *Mesocestoides* spp., *Moniezia* spp., *Paranoplocephala* spp., *Raillietina* spp., *Stilesia* spp., *Taenia* spp., *Thysaniezia* spp., *Thysanosoma* spp.
- Trematodes: de la clase Digenea por ejemplo: *Austrobilharzia* spp., *Brachylaima* spp., *Calicophoron* spp., *Catantropis* spp., *Clonorchis* spp., *Collyriclum* spp., *Cotylophoron* spp., *Cyclocoelum* spp., *Dicrocoelium* spp., *Diplostomum* spp., *Echinocasmus* spp., *Echinoparyphium* spp., *Echinostoma* spp., *Eurytrema* spp., *Fasciola* spp., *Fasciolides* spp., *Fasciolopsis* spp., *Fischoederius* spp., *Gastrothylacus* spp., *Gigantobilharzia* spp., *Gigantocotyle* spp., *Heterophyes* spp., *Hypoderaeum* spp., *Leucochloridium* spp., *Metagonimus* spp., *Metorchis* spp., *Nanophyetus* spp., *Notocotylus* spp., *Opisthorchis* spp., *Ornithobilharzia* spp., *Paragonimus* spp., *Paramphistomum* spp., *Plagiorchis* spp., *Posthodiplostomum* spp., *Prosthogonimus* spp., *Schistosoma* spp., *Trichobilharzia* spp., *Troglostrongylus* spp., *Typhlocoelum* spp.
- 20 *Typhlocoelum* spp.
- 25 Nematodes: del orden de los Trichinellida por ejemplo: *Capillaria* spp., *Trichinella* spp., *Trichomosoides* spp., *Trichuris* spp.
- Del orden de los Tylenchida por ejemplo: *Micronema* spp., *Parastrongyloides* spp., *Strongyloides* spp.
- 30 Del orden de los Rhabditina por ejemplo: *Aelurostrongylus* spp., *Amidostomum* spp., *Ancylostoma* spp., *Angiostrongylus* spp., *Bronchonema* spp., *Bunostomum* spp., *Chabertia* spp., *Cooperia* spp., *Cooperioides* spp., *Crenosoma* spp., *Cyathostomum* spp., *Cyclococercus* spp., *Cyclodontostomum* spp., *Cylicocycclus* spp., *Cylicostephanus* spp., *Cylindropharynx* spp., *Cystocaulus* spp., *Dictyocaulus* spp., *Elaphostrongylus* spp., *Filaroides* spp., *Globocephalus* spp., *Graphidium* spp., *Gyalocephalus* spp., *Haemonchus* spp., *Heligmosomoides* spp., *Hyostrongylus* spp., *Marshallagia* spp., *Metastrongylus* spp., *Muellerius* spp., *Necator* spp., *Nematodirus* spp., *Neostongylus* spp., *Nippostrongylus* spp., *Obeliscoides* spp., *Oesophagodontus* spp., *Oesophagostomum* spp., *Ollulanus* spp.; *Ornithostrongylus* spp., *Osleria* spp., *Ostertagia* spp., *Paracooperia* spp., *Paracrenosoma* spp., *Parafilaroides* spp., *Parelaphostrongylus* spp., *Pneumocaulus* spp., *Pneumostrongylus* spp., *Poteriostomum* spp., *Protostrongylus* spp., *Spicocaulus* spp., *Stephanurus* spp., *Strongylus* spp., *Syngamus* spp., *Teladorsagia* spp., *Trichonema* spp., *Trichostrongylus* spp., *Triodontophorus* spp., *Troglostrongylus* spp., *Uncinaria* spp.
- 35 *Uncinaria* spp.
- 40 Del orden de los Spirurida por ejemplo: *Acanthocheilonema* spp., *Anisakis* spp., *Ascaridia* spp.; *Ascaris* spp., *Ascarops* spp., *Aspicularis* spp., *Baylisascaris* spp., *Brugia* spp., *Cercopithifilaria* spp., *Crassicauda* spp., *Dipetalonema* spp., *Dirofilaria* spp., *Dracunculus* spp.; *Draschia* spp., *Enterobius* spp., *Filaria* spp., *Gnathostoma* spp., *Gongylonema* spp., *Habronema* spp., *Heterakis* spp.; *Litomosoides* spp., *Loa* spp., *Onchocerca* spp., *Oxyuris* spp., *Parabronema* spp., *Parafilaria* spp., *Parascaris* spp., *Passalurus* spp., *Physaloptera* spp., *Probstmayria* spp., *Pseudofilaria* spp., *Setaria* spp., *Skjrabinema* spp., *Spirocerca* spp., *Stephanofilaria* spp., *Strongyluris* spp., *Syphacia* spp., *Thelazia* spp., *Toxascaris* spp., *Toxocara* spp., *Wuchereria* spp.
- 45 *Wuchereria* spp.
- Acanthocephala: del orden de los Oligacanthorhynchida p.ej: *Macracanthorhynchus* spp., *Prosthenorchis* spp.; del orden de los Moniliformida por ejemplo: *Moniliformis* spp.,
- 50 Del orden de los Polymorphida por ejemplo: *Filicollis* spp.; del orden de los Echinorhynchida por ejemplo *Acanthocephalus* spp., *Echinorhynchus* spp., *Leptorhynchoides* spp.
- Pentastoma: del orden de los Porocephalida por ejemplo *Linguatula* spp.
- En el campo de la medicina veterinaria y la ganadería, los compuestos de la Fórmula (I) se administran de acuerdo a procedimientos generales del área, tales como enteral, parenteral, dermal o nasal en forma de preparados. La administración puede ser profiláctica, metafiláctica o terapéutica.

Una forma de presentación de la presente invención hace referencia a los compuestos de la Fórmula (I) para la administración de medicamentos.

Otro punto se refiere al uso de compuestos de la Fórmula (I) como antiendoparasitarios.

5 Un aspecto particular de esta invención se dedica al uso de compuestos de la Fórmula (I) como antihelmínticos, principalmente su uso como nematocida y antiparasitario para eliminar platelmintos, acantocéfalos o pentastómidos.

Otro aspecto de esta invención se refiere al uso de compuestos de la Fórmula (I) como antiprotozoario.

Otro aspecto se refiere al uso de compuestos de la Fórmula (I) como antiektoparasitarios, particularmente como artropodocida, insecticida o acaricida.

10 La presente invención considera asimismo otros aspectos de la medicina veterinaria, que contengan una dosis efectiva de al menos un compuesto de la Fórmula (I) y al menos uno de las siguientes sustancias: un excipiente farmacéuticamente inocuo (p. ej. diluyentes sólidos o líquidos), un medio farmacéuticamente inocuo (p. ej. Tensoactivos), particularmente un excipiente y/o medio farmacéuticamente inocuos utilizados comúnmente en Fórmulas veterinarias.

15 Otro aspecto de esta invención relacionado con lo anterior es un procedimiento diseñado para fabricar una Fórmula veterinaria que consiste en mezclar al menos un compuesto de la Fórmula (I) con excipientes y/o medios farmacéuticamente inocuos, particularmente con excipientes farmacéuticamente inocuos y/o medios utilizados comúnmente en Fórmulas veterinarias.

20 Otro aspecto especial de la presente invención son las Fórmulas veterinarias seleccionadas a partir del grupo de Fórmulas ecto y endoparasitarias, particularmente del grupo de Fórmulas antihelmínticas, antiprotozoarias, artropodocidas y muy particularmente del grupo de Fórmulas nematocidas y antiparasitarias para eliminar platelmintos, acantocéfalos o pentastómidos, así como Fórmulas insecticidas y acaricidas, y los procedimientos para su fabricación.

25 Otro aspecto se refiere a un procedimiento para tratar/curar infecciones parasitarias, particularmente infecciones ocasionadas por un parásito del grupo de los ecto y endoparásitos recientemente enumerados, para lo cual se debe aplicar al animal, particularmente un animal no humano que lo requiera, una dosis efectiva de un compuesto de la Fórmula (I).

Otro aspecto se refiere a un procedimiento para tratar/curar infecciones parasitarias, particularmente infecciones ocasionadas por un parásito del grupo de los ecto y endoparásitos recientemente enumerados, para lo cual se debe aplicar al animal, particularmente un animal no humano que lo requiera, una Fórmula veterinaria como la aquí descrita.

30 Otro aspecto se refiere al uso de compuestos de la Fórmula (I) para tratar infecciones parasitarias, particularmente infecciones ocasionadas por un parásito del grupo de los ecto y endoparásitos recientemente enumerados en un animal no humano.

En el presente contexto de sanidad animal y medicina veterinaria, el término "tratamiento" incluye el tratamiento profiláctico, metafiláctico y terapéutico.

35 En una forma de presentación determinada, se facilitan mezclas de al menos un compuesto de la Fórmula (I) con otras sustancias activas, particularmente con endo y ectoantiparasitarios para la medicina veterinaria.

40 En el campo de la sanidad animal, el término "mezcla" contempla no solamente la aleación y posterior utilización de dos (o más) sustancias activas diferentes en una única Fórmula, sino también aquellos productos que incluyen Fórmulas separadas para cada sustancia activa. Esto explica que, al utilizar más de dos sustancias activas, todas las sustancias activas se incluyan tanto en una única Fórmula conjunta como en Fórmulas separadas; también sería posible utilizar mezclas que contengan sustancias activas en Fórmulas comunes y sustancias activas en Fórmulas separadas. Las Fórmulas separadas permiten aplicar las sustancias activas en cuestión de forma separada o consecutiva.

45 Las sustancias activas especificadas aquí con su "Common Name" son conocidas y se encuentran descritas por ejemplo en el Manual de Pesticidas ("Pesticide Manual" - véase más arriba) así como en Internet (p.ej. <http://www.alanwood.net/pesticides>).

50 El listado (no excluyente ni completo) de insecticidas y acaricidas expuesto anteriormente constituye algunos ejemplos de sustancias activas del grupo de los ectoantiparasitarios como agentes de mezcla. A continuación se enumeran otras sustancias activas utilizadas, las cuales han sido clasificadas de acuerdo al esquema actual de clasificación del modo de acción del IRAC: (1) Inhibidores de acetilcolinesterasa (AChE); (2) bloqueadores del canal de cloruro activados por GABA; (3) moduladores del canal de sodio; (4) moduladores competitivos de receptores nicotínicos de acetilcolina (nAChR); (5) moduladores alostéricos de receptores nicotínicos de acetilcolina (nAChR); (6) moduladores alostéricos del canal de cloro dependiente de glutamato (GluCl); (7) miméticos de la hormona juvenil; (8) diversos inhibidores (Multisite) no específicos; (9) moduladores de los órganos cordotonales (10) inhibidores del desarrollo de ácaros; (12) inhibición de la síntesis de ATP mitocondrial y disruptores de ATP; (13) desacoplamiento de la fosforilación

- oxidativa mediante la eliminación del gradiente de protones; (14) bloqueadores del canal receptor de nicotínicos de acetilcolina; (15) inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 0; (16) inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 1; (17) disruptor de écdisis (en particular en dípteros); (18) agonistas de los receptores de ecdisona; (19) agonistas de los receptores de octopamina; (21) inhibidores del transporte de electrones del complejo mitocondrial I; (25) inhibidores del transporte de electrones del complejo mitocondrial II; (20) inhibidores del transporte de electrones del complejo mitocondrial III; (22) bloqueador del canal de sodio dependiente de voltaje; (23) inhibidores de la acetil-CoA carboxilasa; (28) moduladores del receptor de rianodina;
- 5 Sustancias activas con mecanismos activos desconocidos o no específicos, p. ej. fentrifanil, fenoxacrim, ciclopren, clorobencilato, clordimeform, flubencimina, diciclanil, amidoflumet, quinometionato, triaratenol, clotiazobeno, tetrasul, oleato potásico, petróleo, metoxadiazona, gossiplur, flutencina, propilato de bromo, criolito;
- 10 compuestos de otras clases, p. ej. butacarb, dimetilano, cloetocarbo, fosfocarbo, pirimfos(-metil), paration (-metil), metacrifos, isopropil-o-salicilato, triclorfon, tigoloner, sulprofos, propafos, sebufos, piridationa, protoato, dichlofention, demeton-S-metilsulfon, isazofos, cianofenos, dialifos, carbofenotion, autatofos, aromfenvinfos(-metil), acinfos(-metil), clorfrifos(-metil), fosmetilan, lodofenos, dioxabenzofos, formoterol, fonofos, flufrazofos, fensulfothion, etrimfos;
- 15 compuestos organoclorados, p. ej. camfecloro, lindano, heptacloro; o fenilpirazol, p. ej. acetoprol, pirafluprol, pirirol, vaniliprol, sisapronil; o isoxazolina, p. ej. Aarolaner, Afoxolaner, Lotilaner, Fluralaner;
- 20 piretroides, p. ej. (cis-, trans-)metoflutrina, proflutrina, flufenprox, flubrocitrinato, fubfenprox, fenflutrina, protrifenbut, piresmetrina, RU15525, talletrina, cis-resmetrina, heptaflutrina, bioetanometrina, biopermetrina, fenpiritrina, cis-cipermetrina, cis-permetrina, clocitrina, cialotrina (lambda-), clovaportrina, o compuestos de hidrocarburos halogenados (HCH),
- neonicotinoides, p. ej. nitiacina
- dicloromezotiaz, triflumezopirin
- lactona macrocíclica, p.ej. nemadectina, ivermectina, latidectina, moxidectina, selamectina, eprinomectina, doramectina, emamectinbenzoato; milbemicinóxima
- 25 tripreno, epofenonano, diofenolano;
- biológicos, hormonas o feromonas, por ejemplo, productos naturales, p.ej. turingiensina, codlemón o componentes neem
- dinitrofenol, p.ej. dinocap, dinobuton, binapacril;
- benzotriazoles, p.ej. fluazuron, penfluron,
- 30 derivados de amidin, p.ej. clormebuform, cimiazol, demiditraz
- acaricidas contra ácaros varroa en colmenas, por ejemplo, ácidos orgánicos, p.ej. ácido fórmico (hormigas), ácido oxálico.
- Las sustancias activas antihelmínticas y antiprotozoarias constituyen algunos ejemplos de sustancias activas del grupo de los endoantiparasitarios como agentes de mezcla, no siendo este listado excluyente.
- 35 Entre las sustancias activas antihelmínticas figuran los siguientes nematocidas, trematocidas y/o cestocidas, no siendo este listado excluyente:
- de la clase de las lactonas macrocíclicas, por ejemplo: eprinomectina, abamectina, nemadectina, moxidectina, doramectina, selamectina, lepimectina, latidectina, milbemectina, ivermectina, emamectina, milbemicina;
- 40 de la clase de los benzimidazoles y probenzimidazoles por ejemplo: oxibendazol, mebendazol, triclabendazol, tiofanato, parabendazol, oxfendazol, netobimina, fenbendazol, febantel, tiabendazol, ciclohexandazol, cambendazol, sulfóxido de albendazol, albendazol, flubendazol;
- de la clase de los depsipéptidos, preferentemente depsipéptidos cíclicos, particularmente depsipéptidos cíclicos de 24 secciones, por ejemplo: emodepsid, PF1022A;
- de la clase de las tetrahidropirimidinas, por ejemplo: morantel, pirantel, oxantel;
- 45 de la clase de los imidazotiazoles por ejemplo: butamisol, levamisol, tetramisol;
- de la clase de las aminofenilamidinas por ejemplo: amidantel, amidantel deacilado (dAMD), tribendimidina;
- de la clase de los aminoacetónitrilos por ejemplo: monepantel;

de la clase de las parahercuamidas por ejemplo: parahercuamida, dercuantel;

de la clase de las salicilanilidas por ejemplo: tribromsalano, bromoxánido, brotiánido, cloxánido, closantel, niclosamid, oxiclozánido, rafoxanid;

5 de la clase de los fenoles sustituidos por ejemplo: nitroxinil, bitionol, disofenol, hexaclorofeno, niclofolano, meniclofolano;

de la clase de los fosfatos orgánicos por ejemplo: trichlorfona, naftalofosa, dichlorvos/DDVP, crufomato, coumafosa, haloxona;

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

de la clase de las piperacinas por ejemplo: piperacina, hidroxicina;

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

de otras clases varias, por ejemplo: bunamidina, niridazol, resorantel, omfalotina, oltipraz, nitroscanato, nitroxinilo, oxamniquina, mirasan, miracil, lucanton, hicanton, hetolin, emetin, dietilcarbamazina, diclorofeno, diamfenetid, clonazepam, befenio, amoscanato, clorsulon.

15 Entre las sustancias antiprotozoarias se encuentran las siguientes sustancias activas, no siendo este listado excluyente:

de la clase de las triacinas por ejemplo: ciclazuril, ponazuril, letrazuril, toltrazuril;

de la clase de los polileterionóforos por ejemplo: monensin, salinomycin, maduramicina, narasina;

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

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

20 de la clase de las quininas por ejemplo: cloroquina;

de la clase de las pirimidinas por ejemplo: pirimetamina;

de la clase de las sulfonamidas por ejemplo: sulfaquinoxalina, trimetoprim, sulfaclocina;

de la clase de las tiaminas por ejemplo: amprolio

de la clase de las lincosamidas por ejemplo: clindamicina;

25 de la clase de las carbanilidas por ejemplo: imidocarbo;

de la clase de los nitrofuranos por ejemplo: nifurtimox;

de la clase de los alcaloides de quinazolinona por ejemplo: halofuginona;

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

30 de la clase de las vacunas o antígenos provenientes de microorganismos, por ejemplo: babesia canis rossi, eimeria tenella, eimeria praecox, eimeria necatrix, eimeria mitis, eimeria maxima, eimeria brunetti, eimeria acervulina, babesia canis vogeli, leishmania infantum, babesia canis canis, dictyocaulus viviparus.

Al unirlos con bases o ácidos adecuados, todos los productos de mezcla pueden formar sales, siempre que se encuentren en condiciones de hacerlo gracias a sus grupos funcionales.

Gestión de vectores

35 Los compuestos de la Fórmula (I) pueden ser utilizados asimismo en la gestión de vectores. En la presente invención, un vector es un artrópodo, particularmente un insecto o arácnido, capaz de transmitir agentes patógenos como por ejemplo virus, gusanos, organismos unicelulares y bacterias de un organismo vivo (planta, animal, humano, etc.) a otro organismo o huésped. Los agentes patógenos pueden transmitirse al huésped de manera mecánica (p.ej. el tracoma por medio de moscas que no pican) o bien por inyección (p.ej. parásitos de la malaria por medio de mosquitos).

40

Algunos ejemplos de vectores y las respectivas enfermedades o agentes patógenos que transmiten:

1) Mosquitos

- Anopheles: malaria, filariosis;

- Culex: encefalitis japonesa, filariasis, enfermedades virales varias, transmisión de otros gusanos;
- Aedes: fiebre amarilla, dengue, enfermedades virales varias, filariasis;
- Simulie: transmisión de gusanos, particularmente onchocerca volvulus;
- Psychodidae: transmisión de leishmaniosis

5 2) Piojos: infecciones cutáneas, tifus epidémico;

3) Pulgas: Peste, tifus endémico, tenia;

4) Moscas: enfermedad del sueño (tripanosomiasis), cólera, enfermedades bacterianas varias;

5) Ácaros: acariosis, tifus epidémico, rickettsiosis, tularemia, encefalitis de San Luis, meningoencefalitis centroeuropea (FSME), fiebre hemorrágica de Crimea-Congo, enfermedad de Lyme o borreliosis;

10 6) Garrapatas: Enfermedad de Lyme o borelliosis como *Borrelia burgdorferi* sensu lato., *Borrelia duttoni*, meningoencefalitis centroeuropea, fiebre Q (*Coxiella burnetii*), babesia (*Babesia canis canis*), ehrliquiosis.

Algunos ejemplos de vectores en el marco de la presente invención son también algunos insectos, por ejemplo áfidos, moscas, chicharras o tripsidos, que pueden transmitir fitovirus a las plantas. Otros vectores capaces de transmitir fitovirus son las arañas rojas, los piojos, escarabajos y nematodos.

15 Otros ejemplos de vectores en el marco de la presente invención son también algunos insectos y arácnidos como mosquitos, particularmente las especies *Aedes*, *Anopheles*, p.ej. *A. gambiae*, *A. arabiensis*, *A. funestus*, *A. dirus* (malaria) y *Culex*, *Psychodidae* tales como flebotomos, *Lutzomyia*, piojos, pulgas, moscas, ácaros y garrapatas, que pueden transmitir agentes patógenos a los animales y/o seres humanos.

Es posible combatir los vectores si los compuestos de la Fórmula (I) son resistentes.

20 Los compuestos de la Fórmula (I) son aptos para prevenir enfermedades y/o agentes patógenos transmitidos por vectores. La presente invención hace por lo tanto referencia al uso de compuestos de la Fórmula (I) para la gestión de vectores p.ej. en la agricultura, jardinería, silvicultura, en parques y espacios de ocio así como para la protección del material y acopio.

Protección de materiales técnicos

25 Los compuestos de la Fórmula (I) son aptos para proteger los materiales técnicos contra el ataque o daño por insectos, p.ej. de los órdenes de los coléopteros, himenópteros, isópteros, lepidópteros, psicópteros y zifentomas.

Por materiales técnicos se comprende en este contexto todo tipo de material inerte, preferentemente plásticos, pegamentos, colas, papeles y cartones, cuero, madera, productos para la producción de madera y pinturas. Es especialmente preferente el uso de esta invención para proteger la madera.

30 En otra forma de presentación, los compuestos de la Fórmula (I) se aplican junto con al menos otro insecticida y/o al menos un fungicida.

En otra forma de presentación, los compuestos de la Fórmula (I) constituyen un pesticida listo para usar (ready to use), es decir que pueden aplicarse sobre el material a tratar sin ninguna modificación o acción adicional. Se prevé asimismo el uso de los insecticidas o fungicidas especificados anteriormente.

35 Se ha podido constatar, que los compuestos de la Fórmula (I) pueden sorprendentemente utilizarse también para proteger ciertos objetos ante posibles incrustaciones, particularmente en buques, filtros y tamices, redes, construcciones, muelles y equipos de señalización, que estén en contacto con agua de mar o salobre. Los compuestos de la Fórmula (I) pueden aplicarse de igual manera tanto solos como en combinación con otras sustancias activas como antiincrustantes.

40 Gestión de parásitos animales en el ámbito sanitario

Los compuestos de la Fórmula (I) son aptos para combatir la presencia de parásitos animales en el ámbito sanitario. La presente invención puede ser utilizada particularmente en el hogar, el ámbito sanitario y lugares de acopio o almacenado, sobre todo para combatir insectos, arácnidos, garrapatas y ácaros, presentes en espacios cerrados como viviendas, fábricas, oficinas, cabinas de vehículos y criaderos de animales. Los compuestos de la Fórmula (I) se utilizan para combatir parásitos animales tanto solos como en combinación con otras sustancias activas y/o excipientes. Se utilizan preferentemente en productos insecticidas para el hogar. Los compuestos de la Fórmula (I) son efectivos contra especies sensibles y resistentes y en todas las fases de desarrollo del parásito.

Entre estos parásitos se encuentran por ejemplo los de la clase de los arácnidos, del orden de los escorpiones, arañas y opiliones, las clases de los quilópodos y diplópodos, de la clase de los insectos, el orden de los blatodeos, del orden

de los coléopteros, dermápteros, dípteros, heterópteros, himenópteros, isópteros, lepidópteros, fírrípteros, psicópteros, saltadores u orthópteros, sifonápteros y zigentomos, y de la clase de los malacostráceos, el orden de los isópodos.

- 5 La aplicación se realiza comúnmente por medio de aerosoles, pulverizadores sin presión, p.ej. sprays, atomizadores, nebulizadores, foggers, espumas, geles, evaporadores con placas de evaporación de celulosa o plástico, evaporadores de líquido, de gel, membrana, accionados a hélice, sistemas de evaporación sin energía o pasivos, tiras, bolsas y geles antipolilla, en forma de granulado o polvo, en cebo para esparcir o estaciones de cebo.

Determinaciones analíticas

- 10 La ejecución de las determinaciones analíticas descritas a continuación se refiere a todos los datos del documento completo, a no ser que la ejecución de una determinación analítica se encuentre detallada por separado en el pasaje correspondiente.

Espectrometría de masas

- 15 Para determinar $[M+H]^+$ o M^- mediante LC-MS en condiciones ácidas de cromatografía, se utilizaron 1 mL de ácido fórmico por litro de acetonitrilo y 0,9 mL de ácido fórmico por litro de agua Millipore como eluyente. Se utilizó la columna Zorbax Eclipse Plus C18 50 mm * 2,1 mm, 1,8 μ m, con la cámara termostática a una temperatura de 55° C.

Instrumentos:

- LC-MS3:** Waters UPLC con espectrómetro de masas SQD2 y cambiador de muestras SampleManager. Gradiente lineal 0,0 a 1,70 minutos de 10% acetonitrilo a 95% Acetonitril, von 1,70 bis 2,40 Minuten konstant 95% acetonitrilo, caudal 0,85 mL/min.
- 20 **LC-MS6 y LC-MS7:** Agilent 1290 LC, Agilent MSD Espectrómetro de masa, Cambiador de muestras HTS PAL. Gradiente lineal 0,0 a 1,80 minutos de 10% de acetonitrilo a 95% de acetonitrilo, de 1,80 a 2,50 minutos de acetonitrilo constante al 95%, flujo 1,0 ml/min).

La determinación de $[M+H]^+$ por LC-MS en condiciones cromatográficas neutras se realizó con acetonitrilo y agua de milipore con 79 mg/l de carbonato de amonio como eluyente.

- 25 Instrumentos:

LC-MS4: Waters IClass Acquity con espectrómetro de masa QDA y cambiador de muestras FTN (Waters Acquity columna 1,7 μ m 50 mm * 2,1 mm, temperatura del horno de columna 45° C). Gradiente lineal 0,0 a 2,10 minutos de 10% de acetonitrilo a 95% de acetonitrilo, de 2,10 a 3,00 minutos de acetonitrilo constante al 95%, flujo 0,7 ml/min).

- 30 **LC-MS5:** Sistema Agilent 1100 LC con espectrómetro de masa, Cambiador de muestras HTS PAL (columna: Zorbax XDB C18 1,8 μ m 50 mm * 4,6 mm, temperatura del horno de columna 55° C). Gradiente lineal 0,0 a 4,25 minutos de 10% de acetonitrilo a 95% de acetonitrilo, de 4,25 a 5,80 minutos de acetonitrilo constante al 95%, flujo 2,0 ml/min).

Los índices de tiempo de retención se determinaron en todos los casos a partir de una medición de calibración de una serie homóloga de 2 alcanos de cadena lineal con 3 a 16 átomos de carbón, en la que el índice del primer alcano se fijó en 300, el del último en 1600, y se realizó una interpolación lineal entre los valores de los alcanos sucesivos.

- 35 Las mediciones de los espectros $^1\text{H-NMR}$ se llevaron a cabo con un espectrómetro Bruker **Avance III 400 Mhz** equipado con un cabezal de sonda TCI de 1,7 mm con tetrametilsilano como estándar (0,00 ppm) de soluciones en los solventes CD_3CN , CDCl_3 o $d_6\text{-DMSO}$. Como alternativa, para las mediciones se utilizó un espectrómetro **Bruker Avance III 600 MHz** equipado con un cabezal de muestra CPNMP de 5 mm o un espectrómetro Bruker **Avance NEO 600MHz** equipado con un cabezal de sonda TCI de 5 mm. Normalmente las mediciones se realizaron con una temperatura de cabezal de sonda de 298 K. Si se utilizaron otras temperaturas de medición, esto se indica por separado.
- 40

Procedimiento de listas de pico de NMR

- 45 Los datos $^1\text{H-NMR}$ de ejemplos seleccionados se presentarán en forma de listas de pico $^1\text{H-NMR}$. Para cada pico de señal, el δ valor se da primero en ppm y después entre paréntesis, la intensidad de la señal. El valor δ intensidad de la señal-número de pares de diferentes picos de señal, se listan separados por punto y coma.

La lista de picos de un ejemplo tiene entonces la forma:

δ_1 (Intensidad₁); δ_2 (Intensidad₂);; δ_i (Intensidad_i);; δ_n (Intensidad_n)

La intensidad de las señales agudas se correlaciona con la amplitud de las señales en una representación impresa de un espectro de $^1\text{H-NMR}$ en cm y muestra los comportamientos reales de las intensidades de la señal. En señales

amplias señales amplias, se pueden mostrar varios picos o la mitad de la señal y su intensidad relativa comparada con la señal más intensa del espectro.

5 Para calibrar el desplazamiento químico de los espectros de $^1\text{H-NMR}$, se utiliza tetrametilsilano o el desplazamiento químico del solvente en caso de que la muestra no contenga tetrametilsilano. Por lo tanto, en ciertas circunstancias, las listas de picos de $^1\text{H-NMR}$ pueden contener el pico de tetrametilsilano.

Las listas de picos de $^1\text{H-NMR}$ son equivalentes a las representaciones clásicas de $^1\text{H-NMR}$ y, por tanto, suelen contener todos los picos que se enumeran en una interpretación clásica de $^1\text{H-NMR}$.

Además, como las representaciones clásicas de $^1\text{H-NMR}$, pueden mostrar señales de disolventes, señales de estereoisómeros de los compuestos según la presente invención y/o picos de impurezas.

10 Las señales de solvente de NMR, el pico de tetrametilsilano y la señal de agua en el solvente respectivo se excluyen de la calibración de intensidad relativa ya que los valores de intensidad dados para esto pueden ser muy altos.

Los picos de los isómeros (estéreo) de los compuestos de la presente invención y/o los picos de impurezas generalmente tienen una intensidad media más baja que los picos de los compuestos según la presente invención (por ejemplo, con una pureza $>90\%$).

15 Tales estereoisómeros y/o impurezas pueden ser típicos del procedimiento de fabricación en correspondiente. Por consiguiente, sus picos pueden ayudar a identificar la reproducción de un procedimiento de fabricación mediante "huellas digitales de subproductos".

20 Un experto que calcula los picos de los compuestos según la presente invención con procedimientos conocidos (MestreC, simulación ACD, pero también con valores esperados evaluados empíricamente) puede identificar los picos de los compuestos de la presente invención según sea necesario, de ser necesario utilizando filtros de intensidad adicionales. Esta identificación es equivalente a la lista de picos correspondiente en la interpretación clásica de $^1\text{H-NMR}$.

El solvente utilizado puede leerse en el archivo JCAMP con el parámetro "solvente", la frecuencia de medición del espectrómetro con "frecuencia de observación" y el modelo de espectrómetro con "espectrómetro/sistema de datos".

25 Los datos de $^{13}\text{C-NMR}$ se dan de forma análoga a los datos de $^1\text{H-NMR}$ como listas de pico de los espectros de $^{13}\text{C-NMR}$ desacoplados de banda ancha. Aquí también, las señales de solvente de NMR y el tetrametilsilano se excluyen de la calibración de intensidad relativa ya que estas señales pueden tener valores de intensidad muy altos.

Se pueden encontrar más detalles sobre las listas de picos de $^1\text{H-NMR}$ en: "Cita de datos lista de pico de NMR dentro de las solicitudes de patente" en la base de datos de divulgación de investigación número 564025.

30 Valores logP

La determinación de los valores logP se realizó de conformidad con la Directiva 79/831/CEE, anexo V.A8, mediante HPLC (cromatografía líquida de alta resolución por sus siglas en inglés) en una columna de inversión de fase (C18), utilizando los siguientes métodos:

35 ^[a] El valor logP se determina por medición de LC-UV en el rango ácido, con 0,9 ml/l de ácido fórmico en agua y 1,0 ml/l de ácido fórmico en acetonitrilo como eluyentes (gradiente lineal al 10% de acetonitrilo al 95% de acetonitrilo).

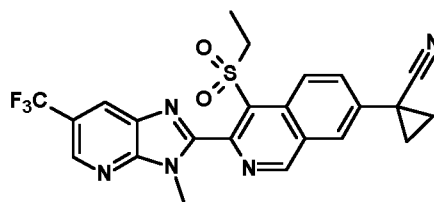
^[b] El valor logP se determina por medición de LC-UV en el rango ácido, con 79 mg/l de carbonato de amonio en agua y acetonitrilo como eluyentes (gradiente lineal al 10% de acetonitrilo al 95% de acetonitrilo).

La calibración se realizó con una serie homóloga de 2 alcanos de cadena lineal (con 3 a 16 átomos de carbono) con valores logP conocidos. Los valores entre alcanos sucesivos se determinan por regresión lineal.

40 Las mediciones de los espectros de NMR (ejemplos III-C-1, XLIII-1, XLII-1, XLI-1, XL.1, XXXIX-1, XXXVIII-1) se llevaron a cabo en un dispositivo Bruker AVANCE DRX 500 MHz y un Bruker AVANCE III 400 Mhz realizado.

Ejemplos de preparación:

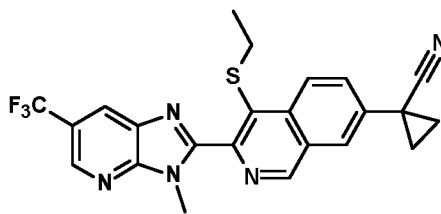
1-[4-etilsulfonil-3-[3-metilo-6-(trifluorometilo)imidazo [4,5-b] piridina-2-il]-7-isoquinolila] ciclopropanocarbonitrilo (I-1)



Se disolvieron 87 mg (0,18 mmol) de 1-[4-etilsulfanil-3-[3-metilo-6-(trifluorometil)imidazo [4,5-b]piridin-2-il] -7-isoquinolil]ciclopropanocarbonitrilo en 6 ml de diclorometano disuelto, 43,5 mg (0,94 mmol) de ácido fórmico a temperatura ambiente y 128,6 mg (1,32 mmol) de peróxido de hidrógeno agregados y agitados a temperatura ambiente durante 16 h. La preparación se diluyó con agua y se mezcló con una solución de bisulfito sódico al 20%, se agitó durante 30 minutos y finalmente se mezcló con 2 ml de solución de bicarbonato de sodio al 20%. Se separó la fase orgánica, la fase acuosa se extrajo dos veces con diclorometano y las fases orgánicas combinadas se liberaron del solvente al vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna utilizando un gradiente de Ciclohexano/acetato de etilo como eluyente.

(logP (neutro): 3,02; MH⁺: 486; ¹H-NMR (400 MHz, D₆-DMSO) □ ppm: 1,27 (t, 3H), 1,79-1,82 (m, 2H), 1,99-2,02 (m, 2H), 3,78-3,83 (m, 2H), 8,02 (d, 1H), 8,52 (s, 1H), 8,62 (s, 1H), 8,88 (s, 1H), 8,95 (d, 1H), 9,83 (s, 1H).

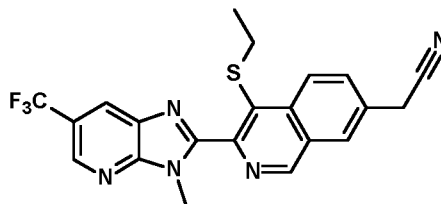
1- [4-etilsulfanil-3-[3-metilo-6- (trifluorometil) imidazo [4,5-b] piridin-2-il] -7-isoquinolilo]ciclopropanocarbonitrilo



140 mg (0,28 mmol) de 2-[4-etilsulfanil-3-[3-metilo-6- (trifluorometil)imidazo [4,5-b] piridin-2-il]-7-isoquinolil]acetone nitrilo y 108 mg (0,57 mmol) de 1,2-dibromoetano se colocaron bajo argón en 3 ml de dimetilformamida, se añadieron 34,2 mg (0,85 mmol) de hidruro de sodio a 0°C y la mezcla se agitó a 0°C durante 1 h. Finalmente se añadió la mezcla de reacción luego a una solución saturada de cloruro de amonio y se extrajo tres veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se lavaron una vez cada una con agua y una solución de cloruro de sodio, se secaron sobre sulfato de sodio y se liberaron del solvente al vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna utilizando un gradiente de Ciclohexano/acetato de etilo como eluyente.

(logP (neutro): 3,67; MH⁺: 454; ¹H-NMR (400 MHz, D₆-DMSO) □ ppm: 0,97 (t, 3H), 1,77-1,80 (m, 2H), 1,95-1,99 (m, 2H), 2,83 (q, 2H), 3,76 (s, 3H), 7,96 (d, 1H), 8,38 (s, 1H), 8,62-8,65 (m, 2H), 8,87 (s, 1H), 9,54 (s, 1H).

2-[4-etilsulfanil-3-[3-metilo-6- (trifluorometil) imidazo [4,5-b]piridin-2-il] -7-isoquinolilo]acetato-nitrilo

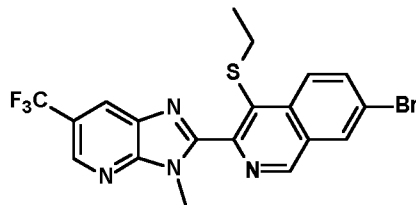


206 mg (0,39 mmol) de 7-bromo-4-etilsulfanil-3-[3-metil-6- (trifluorometil)imidazo[4,5-b]piridin-2-il] isoquinolilina, 390,4 mg (1,96 mmol) 4-Isoxazol ácido bórico éster de pinacol y 417,2 mg (2,74 mmol) de fluoruro de cesio se colocaron bajo argón en una mezcla de 12 ml de DMF y 2 ml de agua y posteriormente 57,4 mg (0,07 mmol) 1, se añadió ferrocendicloropaladio(II) 1-bis (difenilfosfina) y la mezcla se agitó en argón durante 16 h a 130-135°C. El solvente se eliminó por destilación al vacío y el residuo se purificó por cromatografía en columna con un gradiente de agua/acetonitrilo más 0,1 ml/l de ácido fórmico como eluyente.

El producto se agitó en presencia de 37 mg de fluoruro de potasio en una mezcla de 8 ml de agua y 2 ml de metanol durante 1 h a 90° C. Después de destilar el solvente, el residuo se añadió a una mezcla de 10 ml de agua y diclorometano. Se separó la fase orgánica, la fase acuosa se extrajo dos veces con diclorometano y las fases orgánicas combinadas sobre sulfato de sodio y luego se destiló el solvente al vacío.

(logP (neutro): 3,22; MH⁺: 428; ¹H-NMR (400 MHz, D₆-DMSO) □ ppm: 0,98 (t, 3H), 2,84 (q, 2H), 3,77 (s, 3H), 4,42 (s, 2H), 8,02 (d, 1H), 8,35 (s, 1H), 8,65-8,67 (m, 2H), 8,87 (s, 1H), 9,57 (s, 1H).

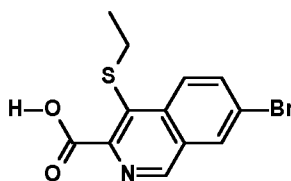
7-bromo-4-etilsulfanil-3-[3-metil0-6-(trifluorometilo)imidazo[4,5-b]piridin-2-il]isoquinolina



- 5 500 mg (2,61 mmol) de N2-metilo-5-(trifluorometilo)piridina-2,3-diamina, 1,021 g (3,27 mmol) 7-bromo-4-etilsulfanil-isoquinolina-3-ácido carbónico y 501 mg (2,61 mmol) 1-etilo-3-(3-dimetilaminopropil) clorhidrato de carbodiimida (EDCI x HCl) se agitó en 9 ml de piridina durante 20 h a 120°C. El solvente se eliminó por destilación al vacío, se añadió agua al residuo y la mezcla se extrajo con acetato de etilo. La fase orgánica se secó sobre sulfato de sodio y el solvente se eliminó por destilación a vacío. El residuo se mezcló con 50 ml de ácido acético glacial y se calentó a ebullición durante 9 h. Se añadió agua a la mezcla de reacción, el sólido precipitado se filtró por succión, se lavó con agua y se secó.

(logP (neutro): 4,36; MH⁺: 467; ¹H-NMR (400 MHz, D₆-DMSO) □ ppm: 0,98 (t, 3H), 2,84 (q, 2H), 3,77 (s, 3H), 4,42 (s, 2H), 8,19 (d, 1H), 8,56 (d, 1H), 8,35 (s, 1H), 8,6 (s, 1H), 8,69 (s, 1H), 8,87 (s, 1H), 9,51 (s, 1H).

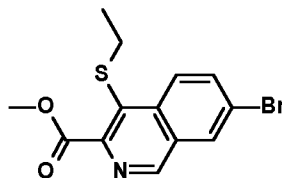
7-Bromo-4-etilsulfanil-isoquinolina-3-ácido carbónico (por ejemplo, III-C-1)



- 15 A una solución de 6,60 g (20,2 mmol) de 7-bromo-4-etilsulfanil-isoquinolina-3-ácido carbónico éster metílico, en 50 ml de tetrahidrofurano (THF) libre de agua, se añadieron 0,867 g (20,7 mmol) de hidróxido de litio monohidratado (LiOH x H₂O) y 70 ml de agua destilada y se agitó la mezcla de reacción durante 6 h a temperatura ambiente. El tetrahidrofurano se destiló y la solución acuosa se ajustó a pH 4 con bisulfato de sodio (NaHSO₄). El sólido precipitado se filtró y se disolvió en 200 ml de acetato de etilo. La solución se secó sobre sulfato de sodio y luego el solvente se eliminó por destilación al vacío.

¹H-NMR (400 MHz, D₆-DMSO) □ ppm: 1,08 (t, 3H), 2,89 (q, 2H), 8,10 (d, 1H), 8,44 (d, 1H), 8,56 (s, 1H), 9,32 (s, 1H), 13,57 (s, 1H).

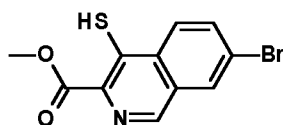
7-Bromo-4-etilsulfanil-isoquinolina-3-ácido carbónico éster metílico (ejemplo, XLIII-1)



- 25 A una solución 7-bromo-4-sulfanil-isoquinolina-3-ácido carbónico éster metílico, que se había obtenido del precursor, se añadieron 20,2 g (130 mmol) de yoduro de etilo y la mezcla de reacción se agitó durante 16 h a temperatura ambiente. El solvente se eliminó por destilación al vacío y el residuo se disolvió en 200 ml de acetato de etilo. La fase orgánica se lavó con 100 ml de agua, se secó sobre sulfato de sodio, se filtró y el solvente se eliminó por destilación al vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna con hexano/acetato de etilo (7:3) como eluyente.

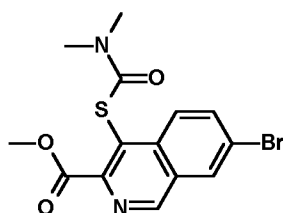
¹H-NMR (400 MHz, cloroformo-*d*) □ ppm: 1,17 (t, 3H), 2,88 (q, 2H), 4,02 (s, 3H), 7,90 (d, 1H), 8,18 (s, 1H) 8,49 (d, 1H), 9,11 (s, 1H).

7-Bromo-4-sulfanil-isoquinolina-3-ácido carbónico éster metílico (ejemplo, XLII-1)



5 A una solución de 12,0 g (32,5 mmol) 7-bromo-4-(dimetilcarbamoilsulfanil)isoquinolina-3-ácido carbónico éster metílico en 40 ml de metanol se le añadió una solución de metilato de sodio en metanol bajo argón (preparado agregando 2,25 g (97,8 mmol) de sodio a 100 ml de metanol). La mezcla de reacción se calentó durante 8 h a 60°C. La solución se enfrió luego a temperatura ambiente y se usó en el siguiente paso sin purificación adicional.

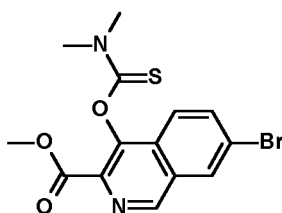
7-Bromo-4-(dimetilcarbamoilsulfanil)isoquinolina-3-ácido carbónico éster metílico (ejemplo, XLI-1)



10 Una solución de 18,0 g (48,7 mmol) 7-bromo-4-(dimetil carbometoxi)isoquinolina-3-ácido carbónico éster metílico en 180 ml de difenil éter se agitó en argón durante 6 h a 190°C, posteriormente se enfrió a temperatura ambiente y se añadió a 1500 ml de hexano. El producto se obtuvo por filtración del precipitado.

¹H-NMR (400 MHz, cloroformo-*d*) □ ppm: 2,99 (s, 3H), 3,22 (s, 3H), 4,00 (s, 3H), 7,86 (d, 1H), 8,18 (s, 1H), 8,26 (d, 1H), 9,20 (s, 1H).

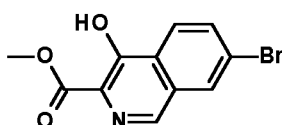
7-Bromo-4-(dime)isoquinolina-3-ácido carbónico éster metílico (ejemplo, XL-1)



15 A una solución de 16,8 g (59,6 mmol) 7-bromo-4-hidroxi-isoquinolin-3-ácido carbónico éster metílico y 26,7 g (238 mmol) de 1,4-diazabicyclo [2,2,2]octano (DABCO), se añadieron 9,60 g (77,7 mmol) de cloruro de dimetiltiocarbamoilo en porciones en 250 ml de DMF. La mezcla de reacción se agitó durante 16 h a temperatura ambiente y luego se añadió a 1 l de agua. La fase acuosa se extrajo tres veces con 400 ml de acetato de etilo, las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y finalmente el solvente se eliminó por destilación al vacío.

20 ¹H-NMR (500 MHz, cloroformo-*d*) □ ppm: 3,54 (s, 3H), 3,56 (s, 3H), 4,00 (s, 3H), 7,87 (d, 1H), 7,94 (d, 1H), 8,25 (s, 1H), 9,14 (s, 1H).

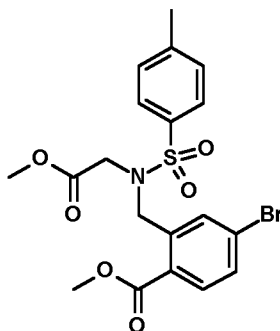
7-Bromo-4-hidroxi-isoquinolina-3-ácido carbónico éster metílico (ejemplo, XXXIX-1)



25 A una solución de 39,0 g (82,9 mmol) 4-bromo-2-[(2-metoxi-2-oxo-etil) - (p-tolilsulfonil)amino]metil]benzoato de metilo en 390 ml de DMSO, se añadió gota a gota, una solución de metilato de sodio en metanol (preparada mediante la adición de 5,90 g (257 mmol) de sodio a 80 ml de metanol) mientras se mantenía la temperatura interna por debajo de 25°C. La mezcla de reacción se agitó durante 5 h a temperatura ambiente, posteriormente se añadió a 2 l de agua y se extrajo tres veces con 300 ml de acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se lavaron con una solución de cloruro de sodio, se secaron sobre sulfato de sodio y el solvente se eliminó por destilación al vacío. El producto se obtuvo lavando el residuo con metanol.

30 ¹H-NMR (500 MHz, cloroformo-*d*) □ ppm: 4,10 (s, 3H), 7,86 (dd, 1H), 8,14 (d, 1H), 8,28 (d, 1H), 8,74 (s, 1H), 11,76 (s, 1H).

4-bromo-2-[[[(2-metoxi-2-oxo-etil)-(p-tolilsulfonil)amino]metil]benzoato de metilo (Ex. XXXVII-1)

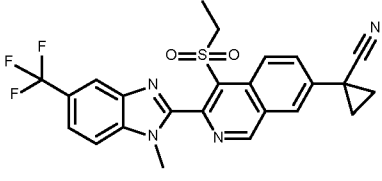
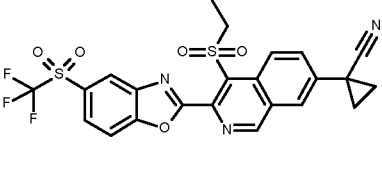
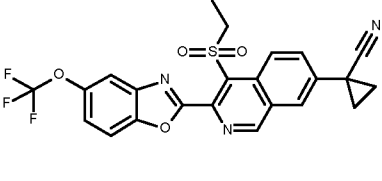
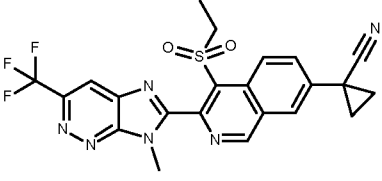
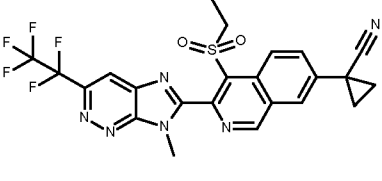
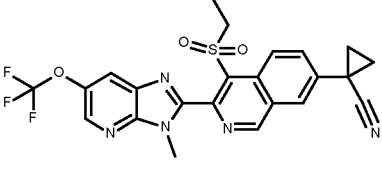
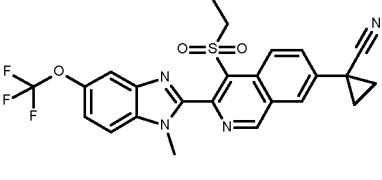


5 Una solución de 39,0 g (127 mmol) 4-bromo-2-(bromuro de metilo) benzoato de metilo, 33,8 g (139 mmol) de metil (tolueno-4-sulfonilamino), 28,5 g (190 mmol) de yoduro de sodio y 26,2 g (190 mmol) de carbonato de potasio, y luego se añadió a 3 l de agua. La fase acuosa se extrajo dos veces con 900 ml de acetato de etilo cada vez, las fases orgánicas combinadas se concentraron a aproximadamente 500 ml, se lavaron con una solución de cloruro de sodio, se secaron sobre sulfato de sodio y el solvente se eliminó por destilación al vacío. El producto se obtuvo lavando el residuo con metil terc-butil éter (MTBE).

10 $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, cloroformo-*d*) \square ppm: 2,41 (s, 3H), 3,55 (s, 3H), 3,81 (s, 3H), 3,97 (s, 2H), 4,83 (s, 2H), 7,28 (m, 2H), 7,44 (d, 1H), 7,71 (m, 4H).

De forma análoga al ejemplo, y según el procedimiento de preparación descrito anteriormente, se pueden obtener los siguientes compuestos de la Fórmula (I):

Ejemplo	Estructura
I-2:	
I-3:	
I-4:	
I-5:	

I-6:	
I-7:	
I-8:	
I-9:	
I-10:	
I-11:	
I-12:	

ES 2 980 245 T3

I-13:	
I-14:	
I-15:	
I-16:	
I-17:	
I-18:	

Espectros ¹H-NMR

I-2: ¹H-NMR(400,2 MHz, d₆-DMSO):

δ= 9,8228 (4,3); 9,2778 (3,9); 8,9542 (2,0); 8,9313 (2,2); 8,5247 (2,5); 8,5195 (2,6); 8,3162 (0,4); 8,2495 (4,0); 8,0380 (1,6); 8,0325 (1,5); 8,0150 (1,5); 8,0095 (1,5); 3,8782 (16,0); 3,7824 (1,0); 3,7650 (1,0); 3,3250 (65,8); 2,6758 (0,7); 2,6713 (1,0); 2,6667 (0,7); 2,5248 (2,8); 2,5200 (4,4); 2,5112 (62,4); 2,5069 (127,5); 2,5023 (167,2); 2,4978 (119,8); 2,4934 (57,4); 2,3337 (0,7); 2,3291 (1,0); 2,3246 (0,7); 2,0748 (0,8); 2,0271 (1,0); 2,0137 (2,9); 2,0066 (3,2); 1,9950 (1,2); 1,8210 (1,3); 1,8085 (3,0); 1,8015 (3,1); 1,7877 (1,0); 1,2692 (3,8); 1,2506 (8,5); 1,2321 (3,8); 0,1459 (0,5); 0,0080 (3,7); -0,0001 (116,8); -0,0085 (3,9); -0,1495 (0,5)

ES 2 980 245 T3

<p>I-3: ¹H-NMR(400,2 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9,8283 (7,5); 8,8941 (3,4); 8,8713 (3,8); 8,5305 (4,5); 8,5253 (4,5); 8,3165 (0,5); 8,3072 (4,2); 8,3040 (4,2); 8,1733 (3,3); 8,1518 (3,9); 8,0567 (2,7); 8,0513 (2,6); 8,0338 (2,6); 8,0283 (2,6); 7,8866 (2,3); 7,8831 (2,3); 7,8650 (2,0); 7,8612 (2,0); 3,7969 (1,9); 3,7784 (6,3); 3,7599 (6,4); 3,7414 (1,9); 3,3269 (110,4); 2,6765 (0,7); 2,6719 (1,0); 2,6673 (0,7); 2,5254 (3,1); 2,5206 (4,8); 2,5119 (58,8); 2,5074 (117,8); 2,5029 (154,2); 2,4983 (112,2); 2,4938 (54,2); 2,3343 (0,7); 2,3297 (0,9); 2,3252 (0,7); 2,3210 (0,3); 2,0314 (1,9); 2,0181 (5,2); 2,0109 (5,7); 1,9992 (2,4); 1,8315 (2,4); 1,8189 (5,4); 1,8119 (5,5); 1,7979 (1,8); 1,2901 (7,2); 1,2716 (16,0); 1,2531 (7,0); 1,2341 (0,5); 0,0080 (1,8); -0,0002 (53,1); -0,0085 (1,7)</p>
<p>I-4: ¹H-NMR(600,1 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9,8246 (3,8); 8,9552 (1,8); 8,9400 (2,0); 8,8072 (2,1); 8,8040 (2,2); 8,5685 (2,1); 8,5653 (2,2); 8,5206 (2,2); 8,5169 (2,3); 8,0366 (1,4); 8,0329 (1,4); 8,0213 (1,4); 8,0176 (1,5); 4,0359 (0,8); 4,0241 (0,8); 3,8160 (0,4); 3,8049 (0,9); 3,7925 (1,0); 3,7825 (16,0); 3,3222 (82,4); 2,6150 (0,4); 2,5240 (0,9); 2,5209 (1,1); 2,5178 (1,0); 2,5090 (19,2); 2,5060 (42,6); 2,5029 (59,9); 2,4999 (43,2); 2,4969 (19,8); 2,3869 (0,4); 2,0198 (0,9); 2,0110 (2,8); 2,0065 (3,0); 1,9985 (1,0); 1,9892 (3,4); 1,8166 (1,2); 1,8080 (2,8); 1,8035 (3,0); 1,7943 (0,9); 1,3976 (0,9); 1,2771 (3,6); 1,2647 (7,9); 1,2524 (3,5); 1,1878 (1,0); 1,1759 (1,9); 1,1640 (1,0); 0,0054 (1,7); -0,0001 (55,4); -0,0057 (1,6)</p>
<p>I-5: ¹H-NMR(600,1 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9,8124 (3,8); 8,9544 (1,7); 8,9391 (2,0); 8,5658 (1,9); 8,5618 (1,9); 8,5112 (2,2); 8,5076 (2,2); 8,3315 (2,0); 8,3278 (1,9); 8,0291 (1,4); 8,0254 (1,4); 8,0138 (1,4); 8,0101 (1,4); 3,8226 (0,4); 3,8105 (1,0); 3,7984 (1,0); 3,7522 (16,0); 3,3192 (99,3); 2,6174 (0,4); 2,6143 (0,5); 2,6113 (0,3); 2,5233 (1,0); 2,5202 (1,3); 2,5171 (1,2); 2,5083 (23,8); 2,5053 (53,6); 2,5022 (76,0); 2,4992 (54,6); 2,4962 (24,7); 2,3893 (0,4); 2,3861 (0,5); 2,3831 (0,3); 2,0156 (1,0); 2,0068 (2,8); 2,0023 (3,0); 1,9943 (1,1); 1,9888 (1,0); 1,8136 (1,2); 1,8050 (2,8); 1,8004 (3,0); 1,7913 (1,0); 1,3980 (0,6); 1,2768 (3,6); 1,2645 (8,1); 1,2521 (3,6); 1,1757 (0,5); 0,0054 (1,9); -0,0001 (73,0); -0,0057 (2,2)</p>
<p>I-6: ¹H-NMR(600,1 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9,7953 (3,6); 9,7947 (3,6); 8,9671 (1,8); 8,9519 (1,9); 8,4978 (2,3); 8,4942 (2,2); 8,0689 (2,0); 8,0120 (1,5); 8,0083 (1,4); 7,9967 (1,5); 7,9930 (1,5); 7,9388 (1,5); 7,9246 (1,7); 7,7139 (1,2); 7,7112 (1,2); 7,6995 (1,1); 7,6970 (1,1); 3,8263 (0,6); 3,7753 (16,0); 3,3193 (91,2); 2,6171 (0,4); 2,6141 (0,5); 2,6111 (0,4); 2,5231 (1,1); 2,5200 (1,4); 2,5169 (1,3); 2,5081 (25,4); 2,5051 (56,6); 2,5020 (79,8); 2,4989 (56,6); 2,4959 (25,2); 2,3889 (0,3); 2,3858 (0,5); 2,3827 (0,3); 2,0108 (0,9); 2,0020 (2,8); 1,9975 (3,0); 1,9887 (2,1); 1,8111 (1,2); 1,8024 (2,7); 1,7979 (3,0); 1,7887 (0,9); 1,2796 (3,6); 1,2672 (8,1); 1,2548 (3,6); 1,1874 (0,4); 1,1755 (0,7); 1,1637 (0,3); 0,0054 (2,2); -0,0001 (81,6); -0,0057 (2,4)</p>
<p>I-7: ¹H-NMR(400,2 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9,8458 (7,6); 8,8851 (3,4); 8,8622 (3,7); 8,7749 (4,3); 8,7707 (4,4); 8,5449 (4,4); 8,5397 (4,5); 8,3932 (3,3); 8,3714 (6,3); 8,3306 (3,1); 8,3262 (3,1); 8,3160 (0,7); 8,3089 (1,6); 8,3043 (1,6); 8,0687 (2,7); 8,0633 (2,7); 8,0458 (2,6); 8,0404 (2,6); 3,7952 (1,8); 3,7767 (6,1); 3,7582 (6,2); 3,7397 (1,9); 3,3284 (151,2); 2,6801 (0,5); 2,6760 (1,1); 2,6714 (1,6); 2,6669 (1,2); 2,6624 (0,6); 2,5248 (5,1); 2,5114 (91,8); 2,5070 (185,3); 2,5024 (247,1); 2,4979 (184,4); 2,4934 (92,4); 2,3384 (0,5); 2,3338 (1,1); 2,3293 (1,6); 2,3248 (1,2); 2,0865 (4,3); 2,0365 (1,9); 2,0231 (5,1); 2,0159 (5,7); 2,0043 (2,4); 1,8348 (2,4); 1,8221 (5,4); 1,8151 (5,6); 1,8012 (1,8); 1,3512 (0,6); 1,2981 (0,8); 1,2850 (7,1); 1,2666 (16,0); 1,2591 (1,9); 1,2480 (7,2); 1,2332 (1,4); 0,1458 (0,5); 0,0080 (5,1); -0,0002 (137,1); -0,0085 (5,4); -0,1497 (0,6)</p>
<p>I-8: ¹H-NMR(400,2 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9,8150 (8,7); 8,8922 (3,8); 8,8694 (4,2); 8,5207 (5,0); 8,5156 (5,2); 8,3160 (0,6); 8,0489 (2,9); 8,0435 (2,9); 8,0334 (5,8); 8,0260 (3,0); 8,0206 (3,0); 8,0111 (6,2); 7,9954 (3,8); 7,9922 (4,0); 7,5864 (2,2); 7,5823 (2,2); 7,5644 (1,9); 7,5600 (2,0); 3,7918 (2,0); 3,7734 (6,8); 3,7549 (6,9); 3,7364 (2,1); 3,3244 (197,0); 2,6754 (1,6); 2,6708 (2,2); 2,6664 (1,7); 2,5241 (6,4); 2,5064 (263,7); 2,5020 (350,2); 2,4976 (265,8); 2,3332 (1,6); 2,3289 (2,2); 2,3245 (1,6); 2,0270 (2,1); 2,0135 (5,9); 2,0063 (6,5); 1,9946 (2,7); 1,8270 (2,6); 1,8145 (6,1); 1,8075 (6,3); 1,7936 (2,0); 1,5877 (0,5); 1,2886 (7,4); 1,2701 (16,0); 1,2516 (7,4); 1,2346 (1,1); 0,1457 (0,8); 0,0078 (5,4); -0,0002 (159,7); -0,0082 (8,1); -0,1500 (0,8)</p>
<p>I-9: ¹H-NMR(400,2 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9,8632 (4,3); 8,9378 (1,9); 8,9150 (2,1); 8,7196 (6,5); 8,5558 (2,5); 8,5506 (2,5); 8,3159 (0,5); 8,0663 (1,5); 8,0609 (1,5); 8,0434 (1,5); 8,0379 (1,5); 5,7562 (0,5); 3,9438 (16,0); 3,7778 (0,6); 3,7592 (1,7); 3,7405 (1,7); 3,7228 (0,6); 3,3252 (162,8); 2,6757 (1,2); 2,6711 (1,6); 2,6666 (1,2); 2,6621 (0,6); 2,5245 (5,0); 2,5197 (7,6); 2,5111 (92,7); 2,5067 (188,4); 2,5021 (250,5); 2,4976 (184,5); 2,4931 (91,3); 2,3379 (0,5); 2,3335 (1,1); 2,3290 (1,6); 2,3245 (1,1); 2,0383 (1,0); 2,0248 (2,9); 2,0178 (3,2); 2,0061 (1,3); 1,8286 (1,3); 1,8161 (3,0); 1,8091 (3,1);</p>

ES 2 980 245 T3

<p>1,7953 (1,0); 1,3509 (0,6); 1,2983 (0,3); 1,2688 (4,0); 1,2584 (1,0); 1,2503 (8,9); 1,2318 (5,5); 0,8535 (0,4); 0,1460 (0,4); 0,0080 (3,0); -0,0002 (96,7); -0,0084 (3,5); -0,1497 (0,4)</p>
<p>I-10: ¹H-NMR(400,2 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9,8657 (4,8); 8,9369 (2,1); 8,9139 (2,3); 8,7628 (6,5); 8,5569 (2,8); 8,5519 (2,8); 8,0684 (1,6); 8,0631 (1,5); 8,0454 (1,5); 8,0401 (1,5); 3,9469 (16,0); 3,7783 (0,7); 3,7603 (1,9); 3,7419 (1,9); 3,7236 (0,7); 3,3261 (77,6); 2,6760 (0,6); 2,6716 (0,8); 2,6674 (0,6); 2,5246 (2,8); 2,5070 (94,6); 2,5026 (122,9); 2,4983 (92,3); 2,3337 (0,6); 2,3295 (0,7); 2,3251 (0,6); 2,0866 (2,1); 2,0400 (1,1); 2,0264 (3,2); 2,0194 (3,6); 2,0076 (1,4); 1,8296 (1,4); 1,8172 (3,3); 1,8102 (3,4); 1,7963 (1,1); 1,2686 (4,0); 1,2500 (8,6); 1,2316 (4,0); 0,0076 (1,3); -0,0002 (35,9); -0,0083 (1,6)</p>
<p>I-11: ¹H-NMR(400,2 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9,8124 (4,3); 8,9575 (2,0); 8,9346 (2,2); 8,5970 (2,1); 8,5920 (2,2); 8,5116 (2,5); 8,5065 (2,5); 8,3410 (2,0); 8,3377 (2,0); 8,0319 (1,5); 8,0264 (1,5); 8,0089 (1,5); 8,0034 (1,5); 3,8302 (0,6); 3,8120 (1,6); 3,7936 (1,7); 3,7759 (0,6); 3,7465 (16,0); 3,3214 (42,1); 2,6754 (0,6); 2,6711 (0,8); 2,6667 (0,6); 2,5246 (2,4); 2,5109 (52,4); 2,5066 (107,2); 2,5022 (141,0); 2,4977 (101,2); 2,4934 (49,0); 2,3334 (0,6); 2,3291 (0,8); 2,3244 (0,6); 2,0224 (1,0); 2,0089 (3,0); 2,0018 (3,2); 1,9892 (2,2); 1,8180 (1,3); 1,8054 (3,0); 1,7984 (3,1); 1,7846 (1,0); 1,3976 (1,6); 1,2821 (3,7); 1,2636 (8,2); 1,2450 (3,7); 1,1752 (0,6); -0,0002 (2,3)</p>
<p>I-12: ¹H-NMR(400,2 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9,7838 (4,5); 8,9686 (2,0); 8,9456 (2,2); 8,4894 (2,6); 8,4843 (2,6); 8,0103 (1,6); 8,0049 (1,5); 7,9873 (1,5); 7,9818 (1,5); 7,8272 (2,6); 7,8051 (2,9); 7,6972 (2,2); 7,3977 (1,2); 7,3756 (1,0); 7,3725 (1,0); 3,8386 (1,1); 3,8206 (1,1); 3,7430 (16,0); 3,3238 (83,0); 2,6757 (0,4); 2,6712 (0,6); 2,6668 (0,4); 2,5246 (1,8); 2,5111 (39,2); 2,5068 (79,6); 2,5023 (104,1); 2,4978 (73,9); 2,4935 (35,3); 2,3334 (0,4); 2,3290 (0,6); 2,3247 (0,4); 2,0146 (1,0); 2,0012 (3,1); 1,9940 (3,4); 1,9891 (2,0); 1,9825 (1,4); 1,8130 (1,4); 1,8005 (3,2); 1,7935 (3,2); 1,7797 (1,0); 1,3976 (0,9); 1,2822 (3,8); 1,2637 (8,2); 1,2452 (3,7); 1,1930 (0,3); 1,1752 (0,7); 1,1574 (0,3); -0,0002 (1,6)</p>
<p>I-13: ¹H-NMR(400,2 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9,8225 (4,3); 9,2995 (4,0); 8,9533 (2,0); 8,9303 (2,2); 8,5238 (2,5); 8,5186 (2,6); 8,2730 (4,0); 8,2711 (4,3); 8,0400 (1,6); 8,0346 (1,5); 8,0170 (1,5); 8,0116 (1,5); 3,8778 (16,0); 3,7817 (1,0); 3,7646 (1,0); 3,3190 (50,9); 2,6752 (0,7); 2,6707 (1,1); 2,6662 (0,8); 2,5242 (2,9); 2,5195 (4,5); 2,5107 (64,5); 2,5063 (134,0); 2,5018 (177,8); 2,4972 (127,7); 2,4927 (61,7); 2,3376 (0,4); 2,3332 (0,8); 2,3286 (1,1); 2,3241 (0,8); 2,0740 (0,4); 2,0269 (1,0); 2,0134 (2,9); 2,0064 (3,2); 1,9947 (1,2); 1,8209 (1,3); 1,8083 (3,0); 1,8013 (3,1); 1,7874 (1,0); 1,2689 (3,8); 1,2503 (8,6); 1,2318 (3,8); 0,0080 (2,1); -0,0002 (67,6); -0,0085 (2,3)</p>
<p>I-14: ¹H-NMR(400,2 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9,8205 (4,5); 9,2622 (4,0); 8,9549 (1,9); 8,9318 (2,2); 8,5215 (2,6); 8,5165 (2,6); 8,3142 (0,7); 8,1618 (4,2); 8,1601 (4,2); 8,0361 (1,5); 8,0308 (1,5); 8,0132 (1,5); 8,0077 (1,4); 7,1851 (0,4); 7,0675 (0,4); 7,0544 (0,7); 7,0389 (0,4); 6,9227 (0,4); 4,0381 (0,6); 4,0202 (0,6); 3,8709 (16,0); 3,7867 (1,0); 3,7678 (1,1); 3,3260 (561,8); 2,6754 (1,7); 2,6709 (2,4); 2,6664 (1,8); 2,6618 (0,8); 2,5243 (7,5); 2,5194 (11,6); 2,5108 (156,5); 2,5065 (318,1); 2,5020 (415,9); 2,4975 (295,9); 2,4931 (141,7); 2,3377 (0,9); 2,3332 (1,8); 2,3288 (2,4); 2,3242 (1,8); 2,0258 (1,0); 2,0123 (3,1); 2,0054 (3,4); 1,9934 (1,4); 1,9886 (2,8); 1,8209 (1,4); 1,8084 (3,1); 1,8013 (3,2); 1,7876 (1,1); 1,3979 (0,8); 1,2717 (3,9); 1,2532 (8,5); 1,2346 (4,1); 1,1928 (0,7); 1,1750 (1,3); 1,1573 (0,7); -0,0002 (6,6)</p>
<p>I-15: ¹H-NMR(400,2 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9,8441 (4,2); 9,1640 (3,0); 9,1587 (3,1); 8,9756 (2,6); 8,9704 (2,5); 8,9468 (1,9); 8,9239 (2,1); 8,5403 (2,5); 8,5351 (2,5); 8,0538 (1,5); 8,0483 (1,5); 8,0308 (1,5); 8,0253 (1,5); 4,0557 (0,5); 4,0379 (1,4); 4,0201 (1,4); 4,0023 (0,5); 3,8234 (16,0); 3,7924 (1,6); 3,7740 (1,5); 3,7560 (0,6); 3,3330 (112,8); 2,6768 (0,6); 2,6722 (0,8); 2,6675 (0,6); 2,5256 (2,5); 2,5208 (3,8); 2,5122 (44,2); 2,5078 (88,5); 2,5032 (116,0); 2,4986 (85,2); 2,4941 (42,1); 2,3345 (0,5); 2,3300 (0,7); 2,3255 (0,5); 2,0339 (1,0); 2,0206 (2,8); 2,0133 (3,3); 2,0017 (1,3); 1,9896 (6,1); 1,8258 (1,3); 1,8130 (2,9); 1,8061 (3,0); 1,7923 (1,0); 1,3974 (1,2); 1,2796 (3,8); 1,2611 (8,4); 1,2426 (3,7); 1,1931 (1,7); 1,1753 (3,3); 1,1575 (1,6); 0,1459 (0,6); 0,0079 (4,5); -0,0002 (128,8); -0,0085 (5,2); -0,1496 (0,6)</p>
<p>I-16: ¹H-NMR(400,2 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9,7957 (4,5); 8,9390 (2,0); 8,9160 (2,2); 8,4967 (2,7); 8,4917 (2,6); 8,0152 (1,5); 8,0098 (1,5); 7,9922 (1,5); 7,9868 (1,4); 7,4037 (4,6); 3,9306 (16,0); 3,7577 (1,1); 3,7420 (1,1); 3,6466 (7,9); 3,3286 (144,6); 2,6759 (0,8); 2,6714 (1,0); 2,6671 (0,7); 2,5247 (3,3); 2,5070 (125,8); 2,5025 (162,7); 2,4980 (118,4); 2,3338 (0,7); 2,3293 (1,0); 2,3248 (0,7); 2,0170 (1,0); 2,0035 (3,1); 1,9965 (3,4); 1,9850 (1,3); 1,8112 (1,4); 1,7987 (3,2); 1,7917 (3,2); 1,7778 (1,0); 1,2643 (3,8); 1,2457 (8,4); 1,2272 (3,8); 0,0079 (2,9); -0,0002 (75,2); -0,0085 (2,8); -0,1497 (0,3)</p>

I-17: ¹H-NMR(400,2 MHz, d₆-DMSO):

δ= 9,8269 (7,6); 8,8963 (3,5); 8,8734 (3,8); 8,5300 (4,5); 8,5248 (4,5); 8,3482 (4,4); 8,3165 (0,4); 8,1413 (3,1); 8,1199 (3,8); 8,0550 (2,8); 8,0495 (2,6); 8,0320 (2,6); 8,0266 (2,6); 7,9362 (2,6); 7,9326 (2,5); 7,9147 (2,1); 7,9109 (2,0); 5,7567 (6,7); 3,7965 (1,9); 3,7780 (6,3); 3,7594 (6,4); 3,7410 (2,0); 3,3302 (191,8); 3,2570 (0,7); 2,6765 (0,9); 2,6720 (1,2); 2,6674 (0,8); 2,6629 (0,4); 2,5253 (3,7); 2,5118 (73,5); 2,5075 (144,8); 2,5030 (187,4); 2,4985 (134,6); 2,4941 (64,8); 2,3343 (0,8); 2,3298 (1,1); 2,3254 (0,8); 2,3209 (0,4); 2,0306 (1,9); 2,0172 (5,4); 2,0100 (5,8); 1,9983 (2,4); 1,8312 (2,5); 1,8187 (5,5); 1,8117 (5,6); 1,7977 (1,8); 1,2908 (7,2); 1,2723 (16,0); 1,2538 (7,2); 1,2338 (0,9); 0,1460 (0,4); 0,0079 (3,0); -0,0001 (84,1); -0,0084 (3,0); -0,1495 (0,4)

I-18: ¹H-NMR(400,2 MHz, d₆-DMSO):

δ= 9,8171 (7,7); 8,8922 (3,4); 8,8693 (3,8); 8,5225 (4,4); 8,5173 (4,5); 8,3159 (0,8); 8,0503 (3,0); 8,0432 (6,1); 8,0274 (2,9); 8,0210 (7,2); 7,9903 (3,9); 7,9845 (4,0); 7,5683 (2,3); 7,5620 (2,2); 7,5459 (2,1); 7,5400 (2,1); 3,7949 (1,8); 3,7763 (6,1); 3,7577 (6,2); 3,7392 (2,0); 3,3300 (566,1); 2,6758 (2,3); 2,6713 (3,2); 2,6669 (2,4); 2,5245 (9,3); 2,5111 (192,6); 2,5068 (385,8); 2,5023 (505,4); 2,4978 (365,7); 2,4934 (177,9); 2,3337 (2,2); 2,3291 (3,0); 2,3246 (2,2); 2,0863 (2,2); 2,0279 (1,9); 2,0145 (5,3); 2,0071 (5,7); 1,9955 (2,4); 1,8281 (2,4); 1,8156 (5,5); 1,8086 (5,6); 1,7947 (1,8); 1,2971 (0,8); 1,2895 (7,3); 1,2710 (16,0); 1,2525 (7,2); 1,2345 (1,1); 0,1459 (1,0); 0,0078 (8,0); -0,0002 (223,5); -0,0084 (8,0); -0,1498 (1,0)

Ejemplos de aplicación

Diabrotica balteata, prueba de rociado

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

Emulsionante: Éter poliglicólico de alquilo

10 Para producir un preparado de sustancia activa apropiado, se disuelve 1 parte en peso de la sustancia con las partes especificadas en peso de solvente y se llena con agua, misma que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm, hasta alcanzar la concentración deseada. Para preparar más concentraciones de prueba, diluir con agua que contenga emulsionante.

Los granos de trigo previamente hinchados (*Triticum aestivum*) se incuban durante un día en un plato multipozo lleno de agar y algo de agua (5 granos saturados por cavidad). Los granos de trigo germinados se rocían con una preparación de ingrediente activo de la concentración deseada. Finalmente se infecta cada cavidad con 10-20 larvas de escarabajo de Diabrotica balteata.

15 Después de 7 días, se determina el efecto en %. 100% significa que todas las plantas de trigo han crecido como en el control no tratado y no infectado; 0% significa que no ha crecido ninguna planta de trigo.

En esta prueba, se muestra por ejemplo, que los siguientes compuestos en los ejemplos de preparación tienen un efecto del 100% a una velocidad de 100 g/ha (= 32 µg/cavidad): ejemplos I-2, I-3, I-4, I-6, I-7, I-8, I-9, I-10, I-11, I-12, I-13, I-14.

Myzus persicae - prueba de rociado

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

Emulsionante: Éter poliglicólico de alquilo

25 Para producir un preparado de sustancia activa apropiado, se disuelve 1 parte en peso de la sustancia con las partes especificadas en peso de solvente y se llena con agua, misma que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm, hasta alcanzar la concentración deseada. Para preparar más concentraciones de prueba, diluir con agua que contenga emulsionante.

Las rodajas de hojas de col china (*Brassica pekinensis*), que se ven afectadas por todas las etapas del pulgón verde del durazno (*Myzus persicae*), se rocían con una preparación de ingrediente activo de la concentración deseada.

30 Después de 5 días, se determina el efecto en %. 100% significa que todos los pulgones murieron; 0% significa que no murio ningún pulgón.

En esta prueba, se muestra por ejemplo, que los siguientes compuestos en los ejemplos de preparación tienen un efecto del 100% a una tasa de aplicación de 100 g/ha: I-4, I-10, I-11, I-12, I-13, I-14.

En esta prueba, se muestra por ejemplo, que los siguientes compuestos en los ejemplos de preparación tienen un efecto del 90% a una tasa de aplicación de 100 g/ha: I-1, I-2, I-5, I-6, I-9.

Myzus persicae - prueba oral

Solvente: 100 partes en peso de acetona

5 Para producir una preparación adecuada de compuesto activo, se disuelve 1 parte en peso de compuesto activo con las partes especificadas en peso de solvente y se completa con agua hasta alcanzar la concentración deseada.

10 Se transfieren 50 µl de la preparación del ingrediente activo a placas de pocillos y se llenan con 150 µl de medio de insecto IPL41 (33% + 15% azúcar) hasta un volumen final de 200 µl. A continuación, las placas se sellan con parafilm a través del cual una población mixta de pulgón verde del durazno (*Myzus persicae*), que se encuentra en una segunda placa de placa de pocillos, puede perforar y absorber la solución.

Después de 5 días, se determina el efecto en %. 100% significa que todos los pulgones murieron; 0% significa que no murio ningún pulgón.

En esta prueba, se muestra por ejemplo, que los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación tienen un efecto del 100% a una tasa de aplicación de 4ppm: ejemplos: I-1, I-2, I-4, I-5, I-6, I-11, I-12, I-13, I-14.

15 En esta prueba, se muestra por ejemplo, que los siguientes compuestos en los ejemplos de preparación tienen un efecto del 100% a una tasa de aplicación de 0.8ppm: Ejemplos: I-4, I-11, I-13, I-14.

En esta prueba, se muestra por ejemplo, que los siguientes compuestos en los ejemplos de preparación tienen un efecto del 90% a una tasa de aplicación de 0.8ppm: ejemplos: I-1, I-2, I-9, I-10, I-12.

Phaedon cochleariae - prueba de rociado

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

Emulsionante: Éter poliglicólico de alquilo

25 Para producir un preparado de sustancia activa apropiado, se disuelve 1 parte en peso de la sustancia con las partes especificadas en peso de solvente y se llena con agua, misma que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm, hasta alcanzar la concentración deseada. Para preparar más concentraciones de prueba, diluir con agua que contenga emulsionante.

Las rodajas de hojas de col china (*Brassica pekinensis*) se rocían con una preparación de ingrediente activo de la concentración deseada y, después del secado, se cubren con larvas del escarabajo de la hoja de rábano picante (*Phaedon cochleariae*).

30 Después de 7 días, se determina el efecto en %. 100% significa que todas las larvas de escarabajo murieron; 0% significa que no murio ninguna larva.

En esta prueba, se muestra por ejemplo, que los siguientes compuestos en los ejemplos de preparación tienen un efecto del 100% a una tasa de aplicación de 100 g/ha: ejemplo: I-1.

Spodoptera frugiperda - prueba de rociado

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

Emulsionante: Éter poliglicólico de alquilo

40 Para producir un preparado de sustancia activa apropiado, se disuelve 1 parte en peso de la sustancia con las partes especificadas en peso de solvente y se llena con agua, misma que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm, hasta alcanzar la concentración deseada. Para preparar más concentraciones de prueba, diluir con agua que contenga emulsionante.

Las rodajas de hojas de maíz (*Zea mays*) se rocían con una preparación de ingrediente activo de la concentración deseada y, después del secado, se cubren con orugas del cogollero del maíz (*Spodoptera frugiperda*).

45 Después de 7 días, se determina el efecto en %. 100% significa que todas las orugas murieron; 0% significa que no murio ninguna oruga.

En esta prueba, se muestra por ejemplo, que los siguientes compuestos en los ejemplos de preparación tienen un efecto del 100% a una tasa de aplicación de 100 g/ha: ejemplos I-1, I-2, I-3, I-4, I-5, I-6, I-7, I-8, I-9, I-10, I-11, I-12, I-13, I-14.

Tetranychus urticae – prueba de rociado, resistente a OP

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

Emulsionante: Éter poliglicólico de alquilo

5 Para producir un preparado de sustancia activa apropiado, se disuelve 1 parte en peso de la sustancia con las partes especificadas en peso de solvente y se llena con agua, misma que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm, hasta alcanzar la concentración deseada. Para preparar más concentraciones de prueba, diluir con agua que contenga emulsionante.

10 Las rodajas de hojas de frijol (*Phaseolus vulgaris*), que se ven afectadas por todas las etapas del ácaro común (*Tetranychus urticae*), se rocían con una preparación de ingrediente activo de la concentración deseada.

Después de 6 días, se determina el efecto en %. 100% significa que todos los ácaros murieron; 0% significa que no murio ningún ácaro.

En esta prueba, se muestra por ejemplo, que los siguientes compuestos en los ejemplos de preparación tienen un efecto del 90% a una tasa de aplicación de 100 g/ha: ejemplo: I-9.

15

Pruebas comparativas

Myzus persicae - prueba de rociado (MYZUPE)

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

20 Emulsionante: Éter poliglicólico de alquilo

Para producir un preparado de sustancia activa apropiado, se disuelve 1 parte en peso de la sustancia con las partes especificadas en peso de solvente y se llena con agua, misma que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm, hasta alcanzar la concentración deseada. Para preparar más concentraciones de prueba, diluir con agua que contenga emulsionante.

25 Las rodajas de hojas de col china (*Brassica pekinensis*), que se ven afectadas por todas las etapas del pulgón verde del durazno (*Myzus persicae*), se rocían con una preparación de ingrediente activo de la concentración deseada.

Después del tiempo deseado, se determina el efecto en %. 100% significa que todos los pulgones murieron; 0% significa que no murio ningún pulgón.

30 En esta prueba, se muestra por ejemplo, que los siguientes compuestos en los ejemplos de preparación tienen un efecto superior en comparación con la tecnología más moderna: ver tabla

Phaedon cochleariae - prueba de rociado (PHAECO)

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

Emulsionante: Éter poliglicólico de alquilo

35 Para producir un preparado de sustancia activa apropiado, se disuelve 1 parte en peso de la sustancia con las partes especificadas en peso de solvente y se llena con agua, misma que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm, hasta alcanzar la concentración deseada. Para preparar más concentraciones de prueba, diluir con agua que contenga emulsionante.

40 Las rodajas de hojas de col china (*Brassica pekinensis*) se rocían con una preparación de ingrediente activo de la concentración deseada y, después del secado, se cubren con larvas del escarabajo de la hoja de rábano picante (*Phaedon cochleariae*).

Después del tiempo deseado, se determina el efecto en %. 100% significa que todas las larvas de escarabajo murieron; 0% significa que no murio ninguna larva.

45 En esta prueba, se muestra por ejemplo, que los siguientes compuestos en los ejemplos de preparación tienen un efecto superior en comparación con la tecnología más moderna: ver tabla

Spodoptera frugiperda - prueba de rociado (SPODFR)

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

Emulsionante: Éter poliglicólico de alquilo

5 Para producir un preparado de sustancia activa apropiado, se disuelve 1 parte en peso de la sustancia con las partes especificadas en peso de solvente y se llena con agua, misma que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm, hasta alcanzar la concentración deseada. Para preparar más concentraciones de prueba, diluir con agua que contenga emulsionante.

10 Las rodajas de hojas de maíz (*Zea mays*) se rocían con una preparación de ingrediente activo de la concentración deseada y, después del secado, se cubren con orugas del cogollero del maíz (*Spodoptera frugiperda*).

Después del tiempo deseado, se determina el efecto en %. 100% significa que todas las orugas murieron; 0% significa que no murio ninguna oruga.

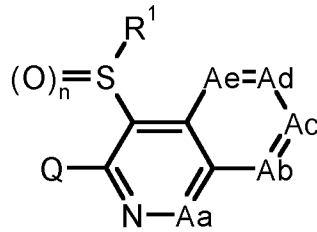
En esta prueba, se muestra por ejemplo, que los siguientes compuestos en los ejemplos de preparación tienen un efecto superior en comparación con la tecnología más moderna: ver tabla

Sustancia	Estructura	Tipo de animal	Concentración	% de efecto dat	
ejemplo: I-1. según la presente invención		PHAECO	20 g ai/ha	100	7 dat
			4 g ai/ha	100	7 dat
		SPODFR	20 g ai/ha	100	7 dat
			4 g ai/ha	100	7 dat
		MYZUPE	0,8 g ai/ha	83	7 dat
			100 g ai/ha	90	5 dat
Ejemplo: I-47 Conocido del documento WO 2017/072039		PHAECO	20 g ai/ha	67	7 dat
			4 g ai/ha	0	7 dat
		SPODFR	20 g ai/ha	67	7 dat
			4 g ai/ha	33	7 dat
Ejemplo: I-51 Conocido del documento WO 2017/072039		MYZUPE	100 g ai/ha	90	5 dat
			20 g ai/ha	0	5 dat
			4 g ai/ha	0	5 dat

15 dat = días después del tratamiento

REIVINDICACIONES

1. Compuestos de la Fórmula (I)



(I)

5 en los que

Aa significa nitrógeno o =C(R⁷)-,

Ab significa nitrógeno o =C(R⁸)-,

Ac significa nitrógeno o =C(R⁹)-,

Ad significa nitrógeno o =C(R¹⁰)-,

10 Aa significa nitrógeno o = C (R¹¹),

a lo cual, Ab, Ac, Ad y Ae no pueden representar simultáneamente nitrógeno,

15 R¹ significa alquilo (C₁-C₆)haloalquilo, (C₁-C₆)alquenilo, (C₂-C₆)haloalquenilo, (C₂-C₆)alquinilo, (C₂-C₆)haloalquinilo, (C₂-C₆)cicloalquilo, (C₃-C₈)cicloalquilo, Halogen(C₃-C₈)cicloalquil-, (C₃-C₈)alquilo (C₁-C₆)cicloalquil-, (C₃-C₈)haloalquilo (C₁-C₆)alquil-, (C₁-C₆)cicloalquilo (C₃-C₈)haloalquil-, (C₁-C₆)cicloalquilo (C₃-C₈)cicloalquil-, (C₃-C₈)cicloalquilo (C₃-C₈)cicloalquilo, Spiro-(C₃-C₈)cicloalquilo-(C₃-C₈)bicicloalquilo, (C₄-C₁₂)cianoalquilo, (C₁-C₆)hidroxialquilo, (C₁-C₆)alcoxi, (C₁-C₆)alquilo-(C₁-C₆)cianoalquenilo, (C₂-C₆)cicloalquilo, (C₃-C₈)alquenilo (C₂-C₆)cianoalquinilo, (C₂-C₆)cicloalquil-, (C₃-C₆)alquil (C₂-C₆)haloalcoxi-, (C₁-C₆)alquilo-(C₁-C₆)alqueniloxi, (C₂-C₆)alquilo (C₁-C₆)haloalqueniloxi-, (C₂-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alquiloxi, (C₂-C₆)alquilo, (C₁-C₄)haloalquiniloxi-, (C₂-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alquiltio-, (C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alquilsulfinil-, (C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)alquilsulfonyl-, (C₁-C₆)alquil, (C₁-C₆)haloalquiltio-, (C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)haloalquilsulfonyl-, (C₁-C₆)alquilo, (C₁-C₆)haloalquilsulfonyl-, (C₁-C₆)alquilo o tri (C₁-C₆) alquilsilil (C₁-C₆),

25 R⁷ significa hidrógeno, ciano, halógeno, acetilo, hidroxilo, amino, cicloalquilo (C₃-C₈), cicloalquilo halógeno (C₃-C₈), alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), cianoalquilo (C₁-C₆), (Alquenil (C₂-C₆), haloalquenilo (C₂-C₆), alquinilo (C₂-C₆), haloalquinilo (C₂-C₆), alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), alquiltio (C₁-C₆), haloalquiltio (C₁-C₆) haloalquiltio, (C₁-C₆) alquilsulfinilo, (C₁-C₆) haloalquilsulfinilo, (C₁-C₆) alquilsulfonyl o (C₁-C₆ haloalquilsulfonyl),

30 R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹ independientemente uno del otro para hidrógeno, halógeno, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), haloalquiltio (C₁-C₆), haloalquilsulfinilo (C₁-C₆), (C₁-C₆) haloalquilsulfonyl o

35 a (C₁-C₆)halógeno alquilo-(C₃-C₈)cicloalquilo, dado el caso, cianoalquilo (C₁-C₆) mono o polisustituido por halógeno, (C₁-C₆)cianoalquilo-(C₃-C₈)cicloalquilo, (C₁-C₆)halógenoalquilo-(C₃-C₈)cianocicloalquilo, (C₁-C₆)halógenoalquilo-(C₃-C₈)halógeno cicloalquilo, dado el caso ciano(C₃-C₈)cicloalquilo mono o polisustituido por (C₁-C₆)alquilo o halógeno, dado el caso, espiro-(C₃-C₈)cicloalquilo-(C₃-C₈)cicloalquilo mono o polisustituido por ciano o halógeno, respectivamente o (C₄-C₁₂)bicicloalquilo,

40 donde uno de los radicales R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹ debe seleccionarse de C₁-C₆ haloalquil- (C₃-C₈) cicloalquilo, (C₁-C₆) cianoalquil- (C₃-C₈) cicloalquilo, (C₁-C₆) haloalquilo- (Cianoalquilo C₃-C₈, haloalquilo (C₁-C₆) - haloalquilo (C₃-C₈), opcionalmente sustituido de forma simple o múltiple con alquilo (C₁-C₆) o ciano sustituido con halógeno (cicloalquilo C₃-C₆), cada uno opcionalmente sustituido de forma simple o múltiple con ciano o Espiro- (C₃-C₈) cicloalquilo- (C₃-C₈) cicloalquilo sustituido con halógeno o (C₄-C₁₂) bicicloalquilo,

donde solo uno o dos de los radicales onde uno de los radicales R⁸, R⁹, R¹⁰ o R¹¹ representa un sustituyente no igual a hidrógeno,

Q se refiere a un compuesto cíclico parcialmente saturado o a un compuesto cíclico saturado

para (C₁-C₆)halogenoalquilo-(C₃-C₈)cicloalquilo, para (C₁-C₆)cianoalquilo opcionalmente mono o polisustituido por halógeno, (C₁-C₆)cianoalquilo-(C₃-C₈)cicloalquilo, (C₁-C₆)halogenoalquilo-(C₃-C₈)cianocicloalquilo, (C₁-C₆)halogenoalquilo-(C₃-C₈)halogenocicloalquilo, ciano(C₁-C₄)cicloalquilo opcionalmente mono o polisustituido por (C₃-C₆)alquilo o halógeno, espiro-(C₃-C₈)cicloalquilo-(C₃-C₈)cicloalquilo o (C₄-C₁₂)bicicloalquilo,

donde uno de los radicales R⁸, R⁹, R¹⁰ o R¹¹ debe seleccionarse de (C₁-C₆)halogenalquil-(C₃-C₈)cicloalquil, (C₁-C₆)cianoalquil-(C₃-C₈)cicloalquil, (C₁-C₆)halogenalquil-(C₃-C₈)cianocicloalquil, (C₁-C₆)halogenalquil-(C₃-C₈)halogencicloalquil, opcionalmente sustituido de forma simple o múltiple con (C₁-C₄)alquilo o ciano(C₃-C₆)cicloalquilo sustituido con halógeno, en cada caso opcionalmente solo o multiplicado por ciano o espiro-(C₃-C₈)cicloalquilo- (C₃-C₈)cicloalquilo sustituido con halógeno o (C₄-C₁₂)bicicloalquilo,

donde solo uno o dos de los radicales onde uno de los radicales R⁸, R⁹, R¹⁰ o R¹¹ representa un sustituyente no igual a hidrógeno,

Q representa un sistema de anillo bicíclico o tricíclico fusionado heteroaromático de 8, 9, 10, 11 o 12 miembros, el sistema de anillo está opcionalmente sustituido de forma simple o múltiple, idéntico o diferente, y opcionalmente contiene al menos un grupo carbonilo y/o donde los sustituyentes pueden seleccionarse independientemente uno de otro de hidrógeno, ciano, halógeno, nitro, acetilo, hidroxilo, amino, SCN, tri- (C₁-C₆) alquilsililo, (C₃-C₈) cicloalquilo, (C₃-C₈) cicloalquilo- (Cicloalquilo (C₃-C₈), alquilo (C₁-C₆) -cicloalquilo (C₃-C₈), halógeno (cicloalquilo (C₃-C₈), alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), cianoalquilo (C₁-C₆), (Hidroxi)alquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆) -alquilo (C₁-C₆), alquenilo (C₁-C₆), haloalquenilo (C₂-C₆), cianoalquenilo (C₂-C₆), alquinilo (C₂-C₆), (C₂-C₆) alquiniloxi- (C₂-C₆) alquilo, (C₁-C₄) haloalquinilo, (C₂-C₆) alcoxi, (C₁-C₆) haloalcoxi, (C₁-C₆) haloalcoxi- (C₁-C₆) alquilo, (C₁-C₆) alqueniloxi- (C₂-C₆) alquilo, (C₁-C₆) haloalqueniloxi- (C₂-C₆) alquilo, (C₁-C₆) cianoalcoxi, (C₁-C₆) alcoholes xi- (C₁-C₆) alcoxi, (C₁-C₆) alquilhidroxiimino, (C₁-C₆) alcoxiiimino, (C₁-C₆) alquil- (C₁-C₆) alcoxiiimino, (C₁-C₆) alquiltio, (C₁-C₆) haloalquiltio, (C₁-C₆) alcoxii- (C₁-C₆) alquiltio, (C₁-C₆) alquiltio- (C₁-C₆) alquilo, (C₁-C₆) alquilsulfinilo, (C₁-C₆) haloalquilsulfinilo, (C₁-C₆) alcoxii- (C₁-C₆) alquilsulfinilo, (C₁-C₆) alquilsulfinil- (C₁-C₆) alquilo, (C₁-C₆) alquilsulfonylo, (C₁-C₆) haloalquilsulfonylo, (C₁-C₆) alcoxii- (C₁-C₆) alquilsulfonylo, (C₁-C₆) alquilsulfonyl- (C₁-C₆) alquilo, (C₁-C₆) alquilsulfonyloxi, (C₁-C₆) alquilcarbonilo, (C₁-C₆) alquilcarbonil- (C₁-C₆) alquilo, (C₁-C₆) alquiltiocarbonilo, (C₁-C₆) haloalquilcarbonilo, (C₁-C₆) alquilcarboniloxi, (C₁-C₆) alcoxycarbonilo, (C₁-C₆) haloalcoxycarbonilo, aminocarbonilo, (C₁-C₆) alquilaminocarbonilo, (C₁-C₆) alquilaminotiocarbonilo, di- (C₁-C₆) alquil -aminocarbonilo, di- (C₁-C₆) alquilaminotiocarbonilo, (C₁-C₆) cicloalquilaminocarbonilo, (C₃-C₈) alquilsulfonylamino, (C₁-C₆) alquilamino, di- (C₁-C₆) alquilamino, aminosulfonylo, (C₁-C₆) Alquilaminosulfonylo, di- (CC₁-C₆) alquilaminosulfonylo, (C₁-C₆) alquilsulfoximino, A minothiocarbonil, (C₁-C₆) alquilaminothiocarbonil, di- (C₁-C₆) alquilaminothiocarbonil, (C₃-C₈) cicloalquilamino, NHCO- (C₁-C₆) alquil ((C₁-C₆) alquilcarbonilamino),

o donde los sustituyentes pueden elegirse independientemente entre sí entre fenilo o un compuesto heteroaromático de 5 o 6 eslabones, mientras que el fenilo o el compuesto pueden ser mono o polisustituidos, de manera igual o diversa por C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₂-C₆-haloalquenilo, C₂-C₆-haloalquinilo, C₃-C₈-halocicloalquilo, halógeno, CN, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi,

n significa 0, 1 o 2,

3. Compuestos de la Fórmula (1) según la reivindicación 1, en los que

Aa significa nitrógeno o =C(R⁷)-,

Ab significa nitrógeno o =C(R⁸)-,

Ac significa nitrógeno o =C(R⁹)-,

Ad significa nitrógeno o =C(R¹⁰)-,

Aa significa nitrógeno o = C (R¹¹),

a lo cual, Ab, Ac, Ad y Ae no pueden representar simultáneamente nitrógeno,

resultando en las siguientes unidades estructurales: A1, A2, A6, A7, A9, A11, A13, A16,

R¹ representa alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆) o cicloalquilo (C₃-C₈),

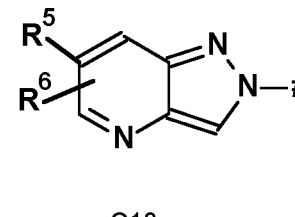
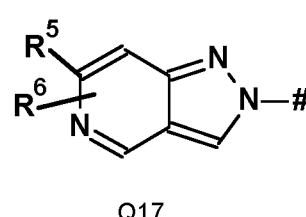
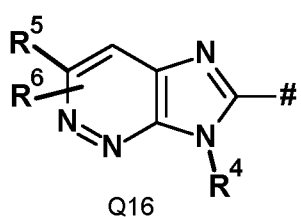
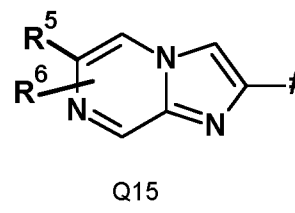
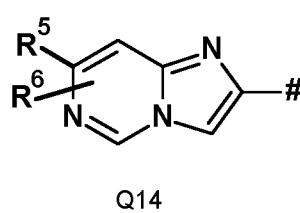
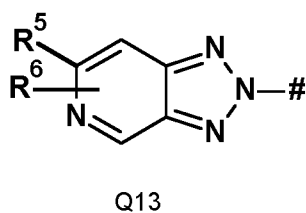
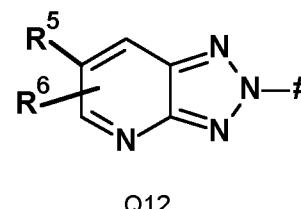
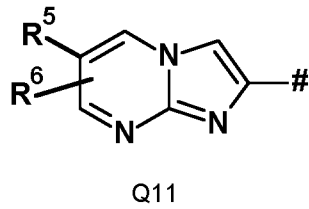
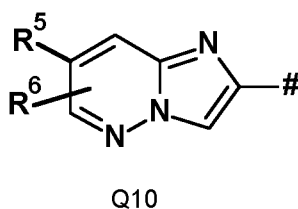
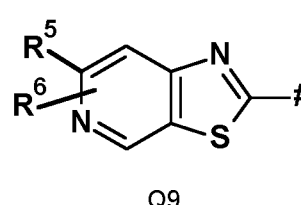
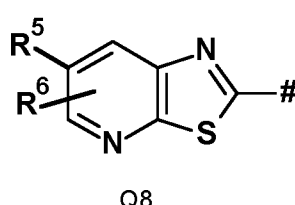
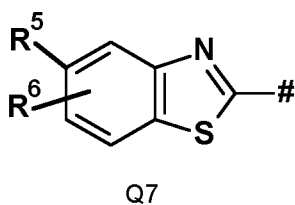
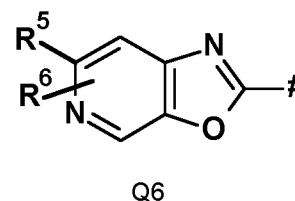
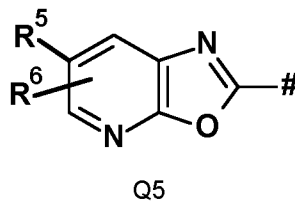
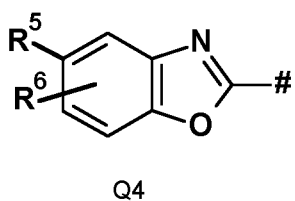
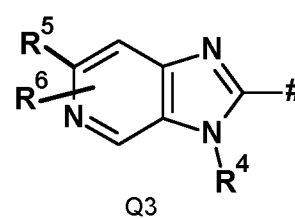
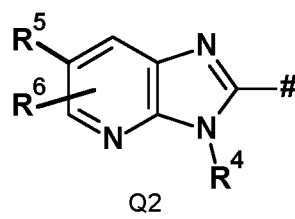
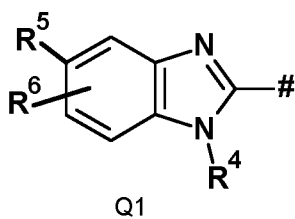
R⁷ representa hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo (C₁-C₄) o haloalquilo (C₁-C₄),

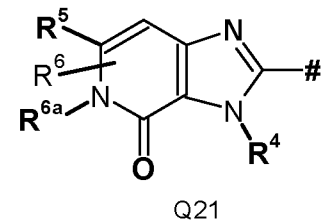
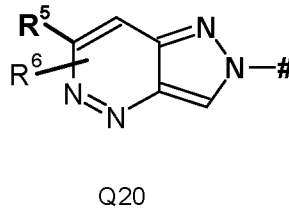
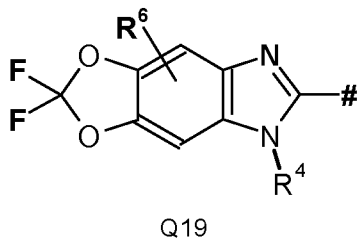
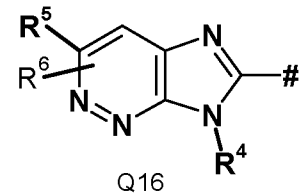
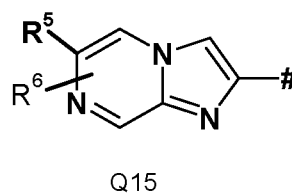
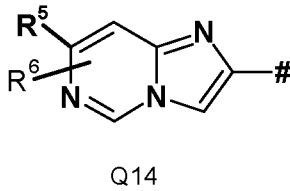
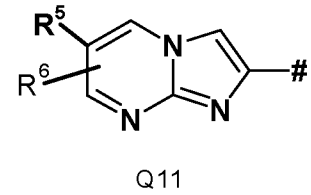
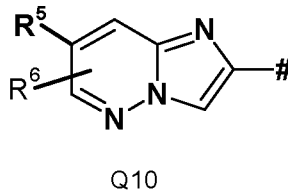
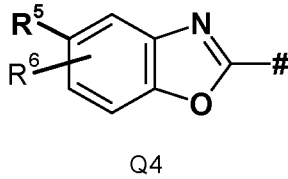
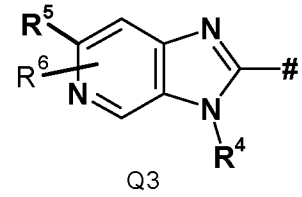
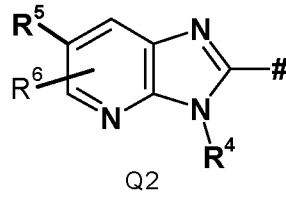
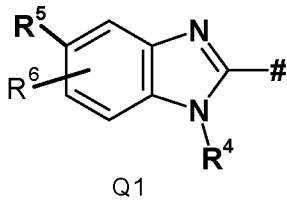
R⁸, R¹⁰, R¹¹ se encuentran independientemente uno del otro para hidrógeno, halógeno, alquilo (C₁-C₄) haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), haloalquiltio (C₁-C₄), haloalquilsulfinilo (C₁-C₄) o (C₁-C₄) haloalquilsulfonylo,

ES 2 980 245 T3

R⁹ representa haloalquil (C₁-C₄)- cicloalquilo (C₃-C₈) , (C₃-C₈) espiro- (C₃-C₈) cicloalquilo, (C₄-C₁₂) bicicloalquilo u opcionalmente simple o doble por (C₁-C₄) alquilo o Cicloalquilo ciano (C₃-C₆) sustituido con halógeno,

5 Q un sistema de anillo bicíclico o tricíclico fusionado heteroaromático de 9 o 12 miembros de la serie Q1 a Q21,





R⁴ representa (C₁-C₄)alquilo o (C₁-C₄)alquioxo-(C₁-C₄)alquilo ,

5 R⁵ representa nitrógeno, ciano, halógeno, (C₁-C₄)alquilo, (C₁-C₄)haloalquilo, (C₃-C₆)cicloalquilo, (C₁-C₄)alcoxi, (C₁-C₄)haloalcoxi, (C₁-C₄)alcoxiimino, (C₁-C₄)alquiltio, (C₁-C₄)halógenoalquiltio, (C₁-C₄)alquilsulfinilo, (C₁-C₄)haloalquilsulfinilo, (C₁-C₄)alquilcarbonilo, (C₁-C₄)halógenoalquilsulfinilo, (C₁-C₄)alquilcarbonilo o (C₁-C₄)haloalquilcarbonilo,

R⁶ representa nitrógeno ,

10 R^{6a} representa (C₁-C₄)alquilo, (C₁-C₄)haloalquilo, (C₂-C₄)alqueno, (C₂-C₄)haloalqueno, (C₁-C₄)alcoxi-(C₁-C₄)alquilo, (C₂-C₄)alquino, (C₂-C₄)haloalquino o (C₃-C₆)cicloalquilo ,

n significa 0, 1 o 2,

5. Compuestos de la Fórmula (1) según la reivindicación 1, en los que

Aa significa nitrógeno o = C (R⁷),

Aa significa nitrógeno o = C (R⁸),

15 Aa significa nitrógeno o = C (R⁹),

Aa significa nitrógeno o = C (R¹⁰),

Aa significa nitrógeno o = C (R¹¹),

R¹ representa metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, n-butilo, i-butilo o tert.-butilo ,

R⁷ representa nitrógeno ,

R⁸ representa nitrógeno ,

5 R⁹ representa-cianociclopropilo o cianociclobutilo ,

R¹⁰ representa nitrógeno ,

R¹¹ representa nitrógeno ,

Q representa un sistema de anillo bicíclico fusionado de 9 miembros heteroaromático de las series Q1, Q2, Q3, Q4, Q16 o Q21,

10 R⁴ representa metilo, etilo, i-propilo, Metoximetilo o metoxietilo ,

R⁵ representa flúor, cloro, bromo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, Fluoroetilo (CH₂CFH₂, CHFCH₃), difluoroetilo (CF₂CH₃, CH₂CHF₂, CHFCHF₂), rifuoroetilo, (CH₂CF₃, CHFCHF₂, CF₂CFH₂), tetrafluoroetilo (CHFCH₃, CF₂CHF₂), pentafluoroetilo, trifluorometoxi, pentafluoroetoxi, difluoroclorometoxi, difluoroclorometoxi, Trifluorometilitio, Trifluorometilsulfinilo o trifluorometilsulfonilo ,

15 R⁶ representa nitrógeno ,

R^{6a} representa metilo ,

n significa 0, 1 o 2,

6. Compuestos de la Fórmula (1) según la reivindicación 1, en los que

Aa significa nitrógeno o = C (R⁷),

20 Aa significa nitrógeno o = C (R⁸),

Aa significa nitrógeno o = C (R⁹),

Aa significa nitrógeno o = C (R¹⁰),

Aa significa nitrógeno o = C (R¹¹),

R¹ representa etilo ,

25 R⁷ representa nitrógeno ,

R⁸ representa nitrógeno ,

R⁹ representa 1-cianocilcopropilo ,

R¹⁰ representa nitrógeno ,

R¹¹ representa nitrógeno ,

30 Q representa un sistema de anillo bicíclico fusionado de 9 miembros heteroaromático de las series Q1, Q2, Q3, Q4, Q16 o Q21,

R⁴ representa metilo ,

R⁵ representa trifluorometilo pentafluoroetilo, trifluorometoxi, pentafluoroetoxi o trifluorometilsulfonilo ,

R⁶ representa nitrógeno ,

35 R^{6a} representa metilo ,

n se refiere al 2.

7. La formulación agroquímica que contiene compuestos de la Fórmula (I) según la reivindicación 1, y medios de expansión y/o sustancias tensioactivas.

8. Formulación agroquímica según la reivindicación 7 que contiene adicionalmente otro ingrediente activo agroquímico.

9. Procedimiento para control de plagas animales, **caracterizado porque** un compuesto de la Fórmula (I) según la reivindicación 1 o una formulación agroquímica según una de las reivindicaciones 7 u 8 puede actuar sobre las plagas animales y/o su hábitat. (excluidos los procedimientos para el tratamiento quirúrgico o terapéutico del cuerpo humano o animal y los procedimientos de diagnóstico realizados en el cuerpo humano o animal).
- 5 10. Uso de compuestos de la Fórmula (I) según la reivindicación 1 o de formulaciones agroquímicas según una de las reivindicaciones 7 u 8 para combatir plagas animales. (excluidos los procedimientos para el tratamiento quirúrgico o terapéutico del cuerpo humano o animal y los procedimientos de diagnóstico realizados en el cuerpo humano o animal).