



19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

11 Número de publicación: **2 266 474**

51 Int. Cl.:

C07D 261/04 (2006.01)

C07D 413/10 (2006.01)

C07D 413/14 (2006.01)

A61K 31/42 (2006.01)

A61K 31/44 (2006.01)

A61K 31/445 (2006.01)

A01N 43/80 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Número de solicitud europea: **02716830 .1**

86 Fecha de presentación : **09.03.2002**

87 Número de publicación de la solicitud: **1390356**

87 Fecha de publicación de la solicitud: **25.02.2004**

54

Título: **Derivados de arilisoaxazolina, procedimiento para su obtención y su empleo como agentes pesticidas.**

30

Prioridad: **23.03.2001 DE 101 14 597**

45

Fecha de publicación de la mención BOPI:
01.03.2007

45

Fecha de la publicación del folleto de la patente:
01.03.2007

73

Titular/es: **Bayer CropScience GmbH**
Bruningstrasse 50
65929 Frankfurt/Main, DE

72

Inventor/es: **Braun, Ralf;**
Ort, Oswald;
Haack, Karl-Josef;
Eckhardt, Matthias;
Hempel, Waltraud y
Thönessen, Maria-Theresia

74

Agente: **Carvajal y Urquijo, Isabel**

ES 2 266 474 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 de arilisoxazolina, procedimiento para su obtención y su empleo como agentes pesticidas.

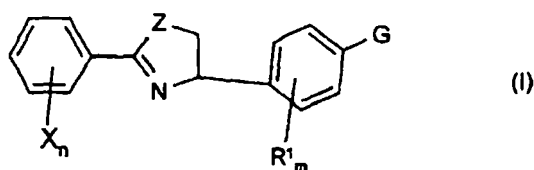
5 La invención se refiere a derivados de arilisoxazolina; procedimientos para su obtención, agentes que contienen éstos y su empleo para lucha contra animales dañinos, especialmente contra artrópodos, tales como insectos y ácaros, y helmintos.

10 Determinadas 1,3-oxazolininas, 1,3-tiazolininas, pirrolinas e imidazolininas son adecuadas para la lucha contra las plagas animales debido a su actividad biológica (véanse, por ejemplo, las publicaciones WO-A-93/24470, WO-A-95/04726 y WO-A-96/22283). En la publicación EP-A 0 174 685 y en la publicación EP-A 0 611 760 se han descrito derivados de isoxazolina con actividad herbicida o bien fungicida.

15 Debido a la multiplicidad de exigencias que se requieren de los agentes pesticidas modernos, por ejemplo en lo que se refiere al nivel de actividad, a la duración de la actividad, al espectro de actividad, al espectro de aplicación, a la toxicidad, a la combinación con otros productos activos, a la combinación con agentes para la formulación o de síntesis, y debido a la posible aparición de resistencias, no puede considerarse nunca como concluido el desarrollo de tales productos y existe permanentemente una elevada necesidad de nuevos compuestos que presenten, al menos, en aspectos parciales ventajas sobre los conocidos.

20 La tarea de la presente invención consistía en poner a disposición compuestos mediante los cuales se amplía el espectro de los agentes pesticidas bajo diversos aspectos.

25 Esta tarea, así como otras tareas no citadas explícitamente, que se derivan o que pueden aparecer como consecuencia de las correlaciones aquí consideradas, se resuelven por medio de derivados de arilisoxazolina de la fórmula (I),



en la que los símbolos y los índices tienen los siguientes significados:

40 X son iguales o diferentes y significan

a) halógeno, ciano, nitro;

45 b) alquilo (con 1 a 4 átomos de carbono), alcoxi (con 1 a 4 átomos de carbono), alquiltio (con 1 a 4 átomos de carbono), alquilsulfinilo (con 1 a 4 átomos de carbono), estando substituidos los restos del grupo b, en caso dado, por uno o varios, preferentemente por uno, por dos o por tres restos del grupo de los halógenos;

50 R¹ son iguales o diferentes y significan halógeno, halógenoalquilo (con 1 a 4 átomos de carbono), alquilo (con 1 a 4 átomos de carbono), alcoxi (con 1 a 4 átomos de carbono), halógenoalcoxi (con 1 a 4 átomos de carbono) o ciano;

m significa 0, 1, 2, 3 o 4;

55 n significa 1, 2, 3, 4 o 5;

Z significa oxígeno, azufre, CH₂ o NR²;

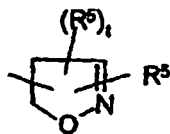
60 R² significa CN, alcoxi (con 1 a 4 átomos de carbono)-alquilo (con 1 a 4 átomos de carbono), CHO, alquilcarbonilo (con 1 a 6 átomos de carbono), alcóxicarbonilo (con 1 a 6 átomos de carbono)- o (CW)NR³R⁴;

R³, R⁴ son iguales o diferentes y significan H, alquilo (con 1 a 6 átomos de carbono);

65 W significa O o S;

ES 2 266 474 T3

G significa



10 t significa 0,1,2 o 3;

R⁵ son iguales o diferentes y significan

15 a) halógeno, CN, NO₂

b) un grupo alquilo de cadena lineal o de cadena ramificada con 1 hasta 12 átomos de carbono, estando substituidos uno o varios grupos (CH₂), en caso dado, por -O-, -S(O)_{-0,1,2}-, -NH-, -NR⁶-, -CO-, -CS-, -CH=CH-, -C≡C-, aril-diilo, heterocicliil-diilo, cicloalcanodiilo (con 3 a 8 átomos de carbono) o cicloalquendiilo (con 3 a 8 átomos de carbono), con la condición de que no pueden ser contiguos los chalcógenos, estando reemplazados, en caso dado, átomos individuales de halógeno por átomos de hidrógeno;

20 c) en el caso de dos restos, situados en α, R⁵ significa también (=Y) donde Y significa (=O), (=S), (=NOR⁶) o (=CR₂⁶);

25 con la condición de que el o los restos R⁵ no contengan, en conjunto, mas de un sistema anular con cinco o más miembros;

R⁶ significa alquilo (con 1 a 4 átomos de carbono), fenilo o bencilo;

30 arilo es un resto carbocíclico aromático con 6 a 14 átomos de carbono;

heterocicliilo es un sistema anular heteroaromático o heteroalifático, debiéndose entender por “sistema anular heteroaromático” un resto arilo, en el que está reemplazado, al menos, un grupo CH- por N y/o estando reemplazados, al menos, dos grupos CH- contiguos por S, NH u O y debiéndose entender por “sistema anular heteroalifático” un resto cicloalquilo (con 3 a 8 átomos de carbono), en el que está reemplazado, al menos, una unidad de carbono por O, S o por un grupo NR¹¹ y R¹¹ significa hidrógeno, alquilo (con 1 a 4 átomos de carbono), alcoxi (con 1 a 4 átomos de carbono) o arilo,

40 estando substituidos los restos cíclicos en la significado de R⁵, R⁶, en caso dado, por uno o varios restos del grupo formado por halógeno, ciano, nitro, amino, hidroxilo, tio, alquilo (con 1 a 4 átomos de carbono), halógenoalquilo (con 1 a 4 átomos de carbono), cicloalquilo (con 3 a 8 átomos de carbono), alcoxi (con 1 a 4 átomos de carbono), halógenoalcoxi (con 1 a 4 átomos de carbono), alquiltio (con 1 a 4 átomos de carbono), halógenoalquiltio (con 1 a 4 átomos de carbono), alquilamino (con 1 a 4 átomos de carbono), halógenoalquilamino (con 1 a 4 átomos de carbono) y alcanoil (con 1 a 4 átomos de carbono);

sus estereoisómeros puros en dobles enlaces, enantiómeros o diastereómeros así como sus mezclas, sus N-óxidos sus sales adecuadas para el empleo como agentes pesticidas.

50 Sorprendentemente, los compuestos de la fórmula (I) tienen una actividad acaricida e insecticida, en cuanto a su espectro de actividad y a la potencia de su actividad, mayor que la de los derivados de 1,3-oxazolina, de 1,3-tiazolina, de pirrolina o de imidazolina conocidos.

Preferentemente, los símbolos y los índices en la fórmula (I) tienen los significados siguientes:

55 X significa, preferentemente, halógeno, especialmente Cl, Br o F, ciano, nitro, alquilo (con 1 a 4 átomos de carbono), halógenoalquilo (con 1 a 3 átomos de carbono), alcoxi (con 1 a 4 átomos de carbono) o halógenoalcoxi (con 1 a 3 átomos de carbono).

60 X significa, de forma especialmente preferente, halógeno, especialmente Cl, Br o F, alquilo (con 1 a 4 átomos de carbono), halógenoalquilo (con 1 a 3 átomos de carbono), alcoxi (con 1 a 4 átomos de carbono) halógenoalcoxi o (con 1 a 3 átomos de carbono).

m significa, preferentemente, 0 o 1.

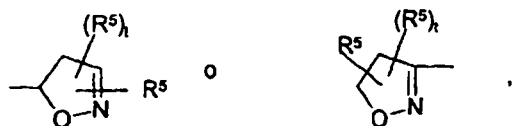
65 n significa, preferentemente, 1, 2 o 3.

ES 2 266 474 T3

Z significa, preferentemente, oxígeno o CH₂.

R¹ significa preferentemente H, halógeno, halógenoalquilo (con 1 a 4 átomos de carbono), alquilo (con 1 a 4 átomos de carbono), alcoxi (con 1 a 4 átomos de carbono), halógenoalcoxi (con 1 a 4 átomos de carbono).

5 G preferentemente significa



15 significa de forma muy especialmente preferente



25 significa en particular



t significa, preferentemente, 0 o 1.

Como sustituyentes en el resto de isoxazolina, los restos R⁵ tienen, preferentemente, los significados siguientes:

35 R⁵ son iguales o diferentes y significan, D-R⁷ o dos restos R⁵ forman en conjunto con el átomo, con el que están enlazados, un sistema anular con tres hasta ocho miembros, saturado o insaturado, sustituido, en caso dado, con uno o varios restos R⁷, que contienen, en caso dado, también otros heteroátomos, preferentemente O, N, S, SO y/o SO₂;

40 D significa un enlace directo o alcanodiilo (con 1 a 6 átomos de carbono), sustituido en caso dado por uno o varios átomos de halógeno;

45 R⁷ son iguales o diferentes y significan, R⁸, R⁹, -C(W)R⁸, -C(=NOR⁸)R⁸, -C(=NNR⁸)R⁸, -C(=W)OR⁸, -C(=W)NR⁸, -OC(=W)R⁸, -OC(=W)OR⁸, -NR⁸C(=W)R⁸, -N[C(=W)R⁸]₂, -NR⁸C(=W)OR⁸, -C(=W)NR⁸-NR⁸, -C(=W)NR⁸-N, R⁸[C(=W)R⁸], -NR⁸-C(=W)NR⁸, -NR⁸-NR⁸C(=W)R⁸, -NR⁸-N[C(=W)R⁸]₂, -N[(C=W)R⁸]-NR⁸, -NR⁸-N[(C=W)WR⁸], -NR⁸[(C=W)NR⁸]₂, -NR⁸(C=NR⁸)R⁸, -NR⁸(C=NR⁸)NR⁸, -O-NR⁸, -O-NR⁸(C=W)R⁸, -SO₂NR⁸, -NR⁸SO₂R⁸, -SO₂OR⁸, -OSO₂R⁸, -OR⁸, -NR⁸, -SR⁸, -SiR⁸₃, -PR⁸₂, -P(=W)R⁸₂, -SOR⁸, -SO₂R⁸, -PW₂R⁸₂, -PW₃R⁸₂ o dos restos R⁷ significan conjuntamente (=Y), (=N-R⁸), (=CR⁸) o (=CHR⁸);

50 W significa O o S;

55 R⁸ son iguales o diferentes y significan, H, alquilo (con 1 a 6 átomos de carbono), alqueno (con 2 a 6 átomos de carbono), alquino (con 2 a 6 átomos de carbono), cicloalquilo (con 3 a 8 átomos de carbono), cicloalqueno (con 4 a 8 átomos de carbono), cicloalquilo (con 3 a 8 átomos de carbono)-alquilo (con 1 a 4 átomos de carbono), cicloalqueno (con 3 a 8 átomos de carbono)-alqueno (con 2 a 4 átomos de carbono), cicloalqueno (con 4 a 8 átomos de carbono)-alqueno (con 2 a 4 átomos de carbono), alquilo (con 1 a 6 átomos de carbono)-cicloalquilo (con 3 a 8 átomos de carbono), alqueno (con 2 a 6 átomos de carbono)-cicloalquilo (con 3 a 8 átomos de carbono), alquino (con 2 a 6 átomos de carbono)-cicloalquilo (con 3 a 8 átomos de carbono), alquilo (con 1 a 6 átomos de carbono)-cicloalqueno (con 4 a 8 átomos de carbono), alqueno (con 2 a 6 átomos de carbono)-cicloalqueno (con 4 a 8 átomos de carbono), arilo, heterociclilo; estando sustituidos los restos citados, en caso dado, con uno o varios restos R⁹ y, en caso dado, dos restos forman R⁸ un sistema anular;

65 R⁹ son iguales o diferentes y significan halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, tio, amino, alcanilo (con 1 a 6 átomos de carbono), halógenoalcanilo (con 2 a 6 átomos de carbono), alcoxi (con 1 a 6 átomos de carbono), alquinoxilo (con 3 a 6 átomos de carbono), alquinoxilo (con 3 a 6 átomos de carbono), halógenoalquinoxilo (con 1 a 6 átomos de carbono), halógenoalquinoxilo (con 3 a 6 átomos de carbono), halógenoalquinoxilo (con 3 a 6 átomos de carbono);


ES 2 266 474 T3

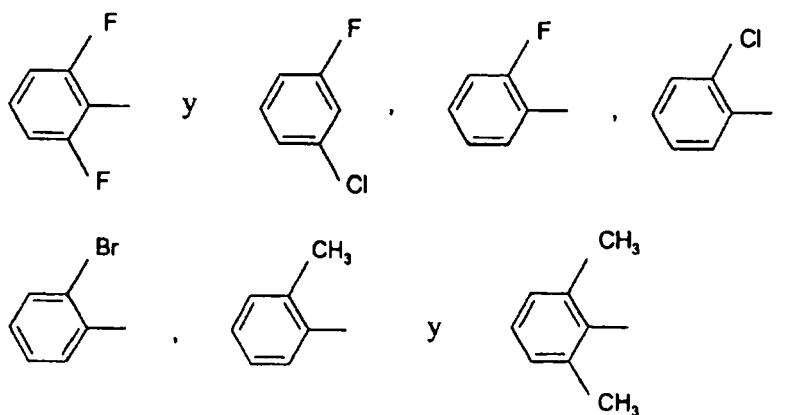
de carbono)-cicloalquenilamino (con 4 a 8 átomos de carbono), trialquilsililo (con 1 a 6 átomos de carbono), arilo, ariloxi, ariltio, arilamino, aril-alcoxi (con 1 a 4 átomos de carbono), aril-alcanoilo (con 1 a 6 átomos de carbono), aril-alquenilo (con 3 a 4 átomos de carbono), arilo (con 1 a 4 átomos de carbono)-alquiltio, arilo (con 2 a 4 átomos de carbono)-alqueniltio, aril-alquilamino (con 1 a 4 átomos de carbono), aril-alquenilamino (con 3 a 4 átomos de carbono), aril-dialquilsililo (con 1 a 6 átomos de carbono), diaril-alquilsililo (con 1 a 6 átomos de carbono), triarilsililo y heterociclilo con 5 o 6 miembros, estando substituidos los restos cíclicos, en caso dado, por uno o varios restos elegidos del grupo halógeno, ciano, nitro, amino, hidroxilo, tio, alquilo (con 1 a 4 átomos de carbono), halógenoalquilo (con 1 a 4 átomos de carbono), cicloalquilo (con 3 a 8 átomos de carbono), alcoxi (con 1 a 4 átomos de carbono), halógenoalcoxi (con 1 a 4 átomos de carbono), alquiltio (con 1 a 4 átomos de carbono), halógenoalquiltio (con 1 a 4 átomos de carbono), alquilamino (con 1 a 4 átomos de carbono), halógenoalquilamino (con 1 a 4 átomos de carbono) y alcanoilo (con 1 a 4 átomos de carbono).

De forma especialmente preferente,

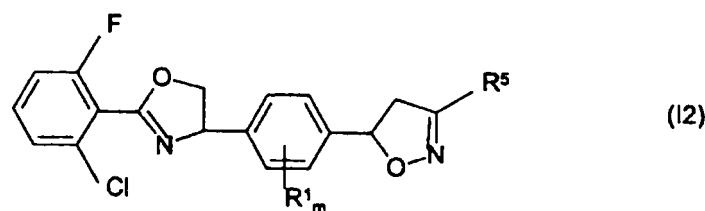
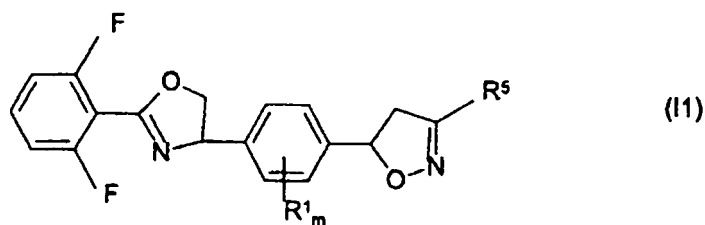
R^5 significa CN, fenilo en caso dado substituido, fenoxi en caso dado substituido, alquilo (con 1 a 6 átomos de carbono), alquenilo (con 1 a 6 átomos de carbono), halógenoalquilo (con 1 a 6 átomos de carbono), halógenoalquenilo (con 1 a 6 átomos de carbono), alcanodiilo (con 1 a 6 átomos de carbono)-arilo, estando substituido, en caso dado, el grupo arilo, y estando substituido, en caso dado, una unidad $-CH_2$ por $-C(O)-NR^{10}$ -, $NR^{10}-(CO)$, NR^{10} u O.

R^{10} significa H, alquilo (con 1 a 6 átomos de carbono), halógenoalquilo (con 1 a 6 átomos de carbono), fenilo substituido en caso dado, bencilo substituido en caso dado.

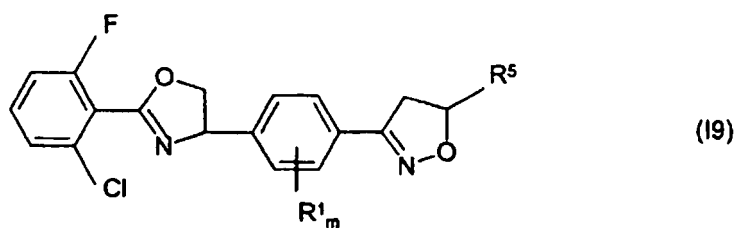
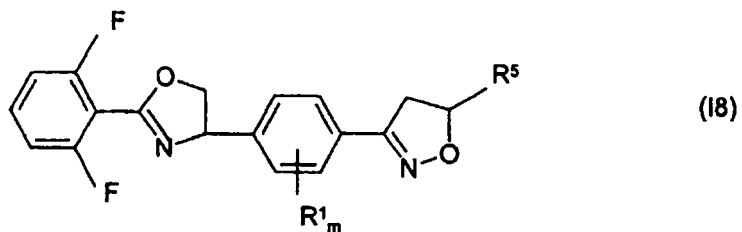
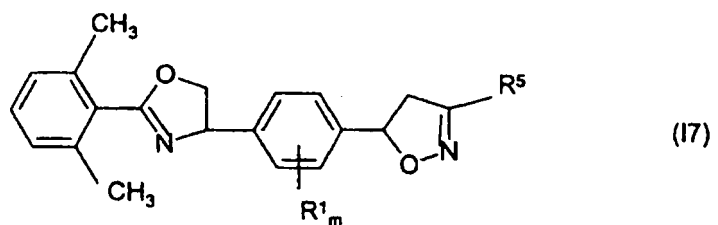
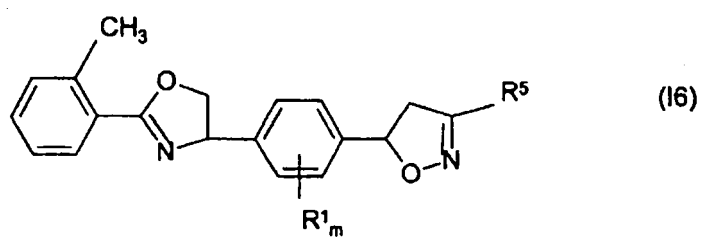
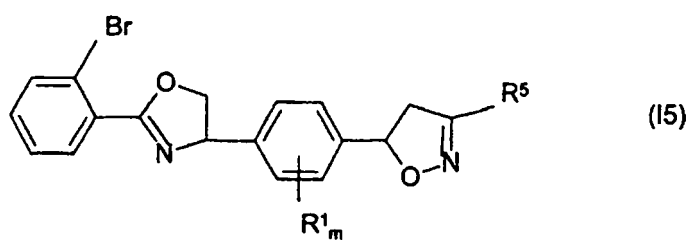
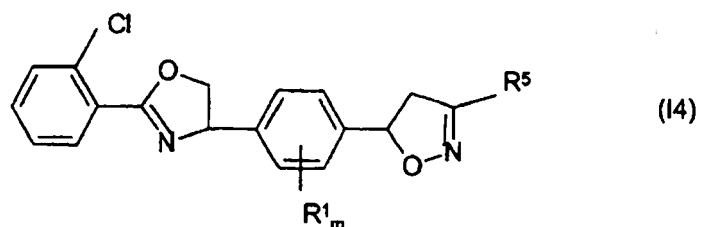
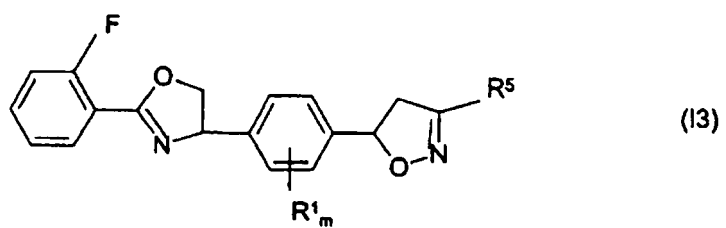
De forma especialmente preferente  significa los grupos



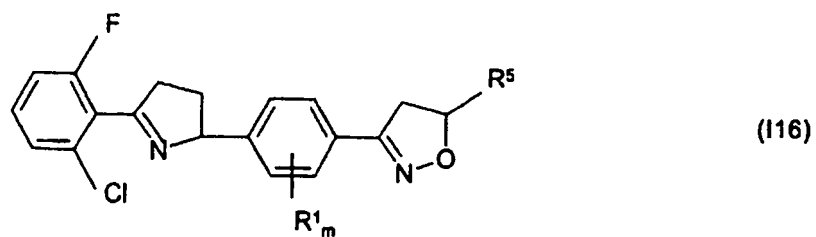
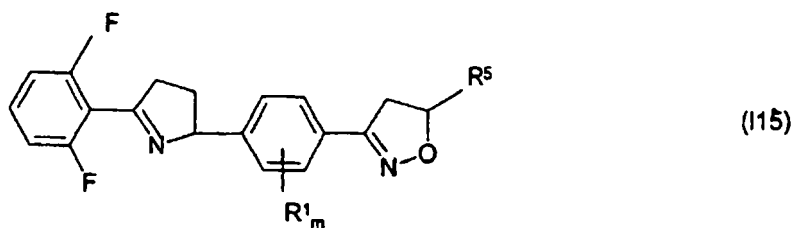
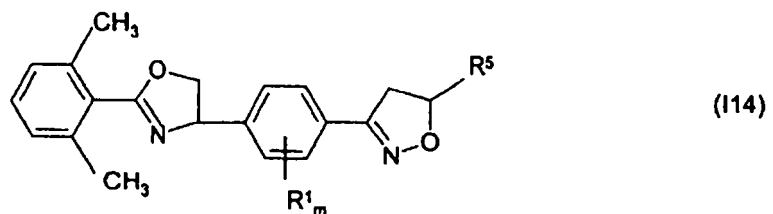
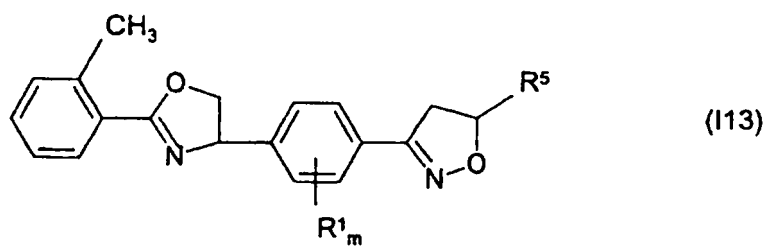
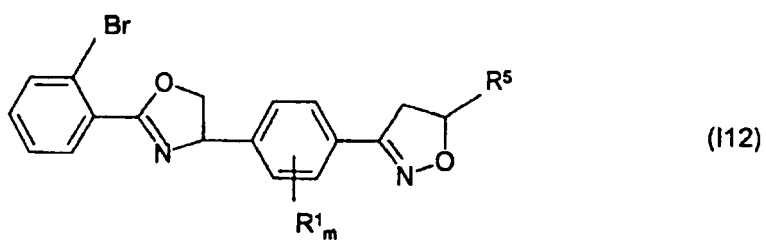
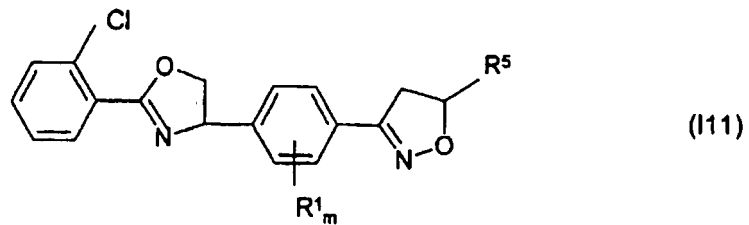
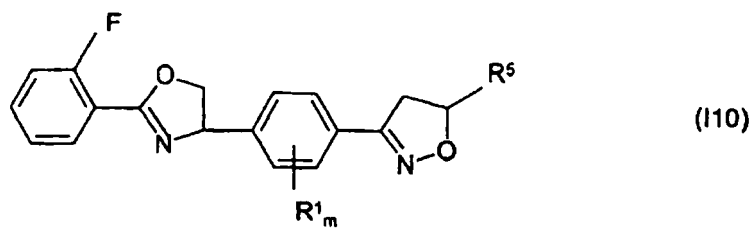
De forma especialmente preferente los grupos de los compuestos de la fórmula (I) son aquellos de las fórmulas (I1) hasta (I28):



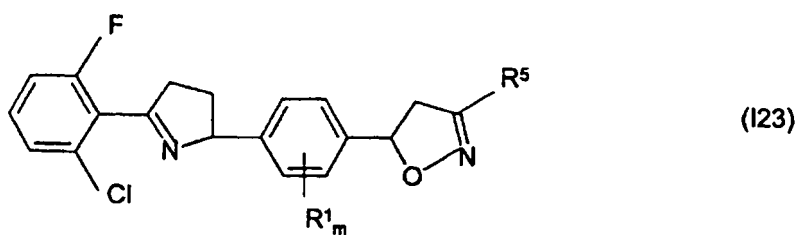
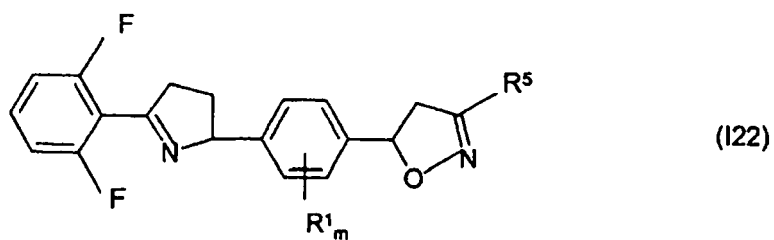
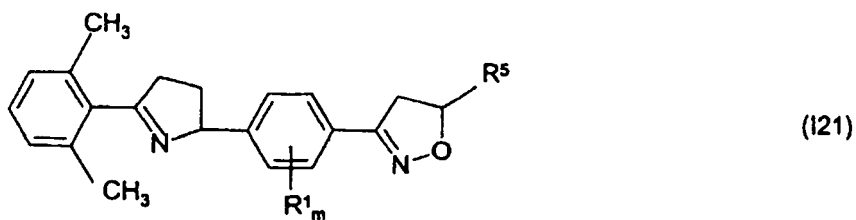
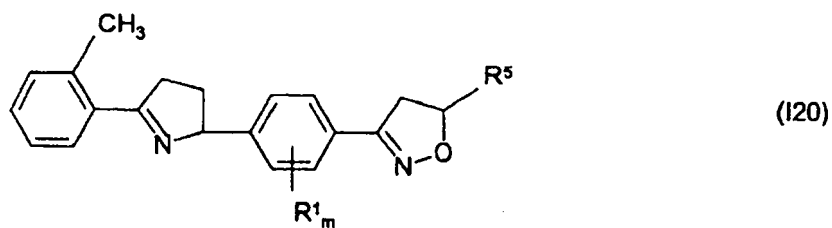
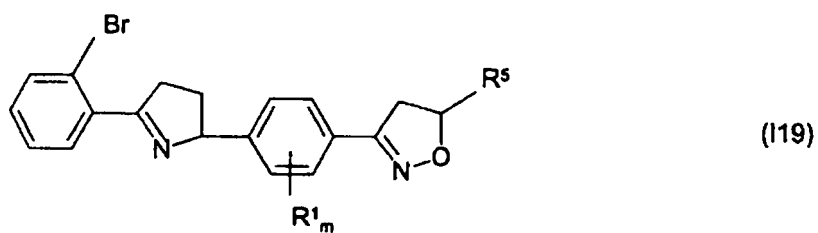
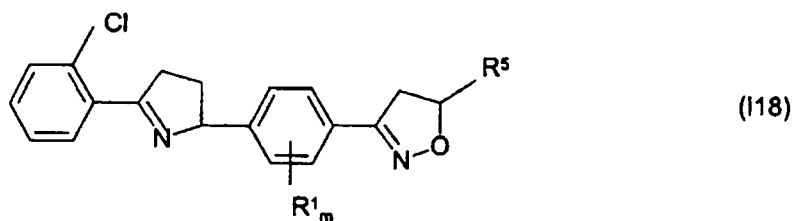
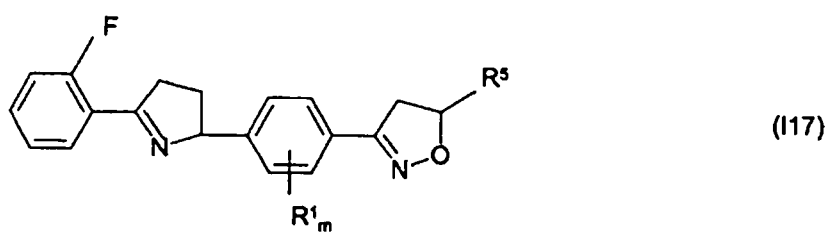
5
10
15
20
25
30
35
40
45
50
55
60
65

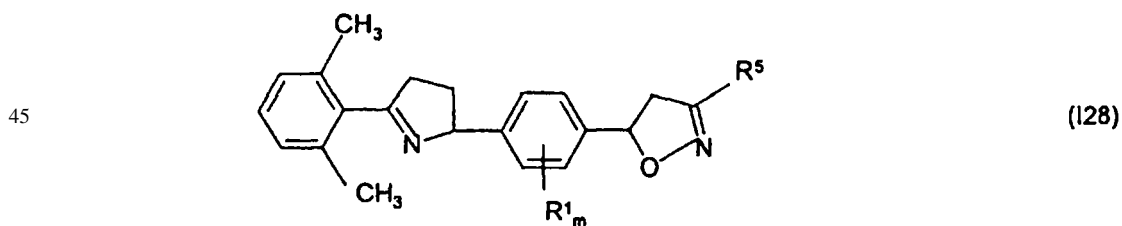
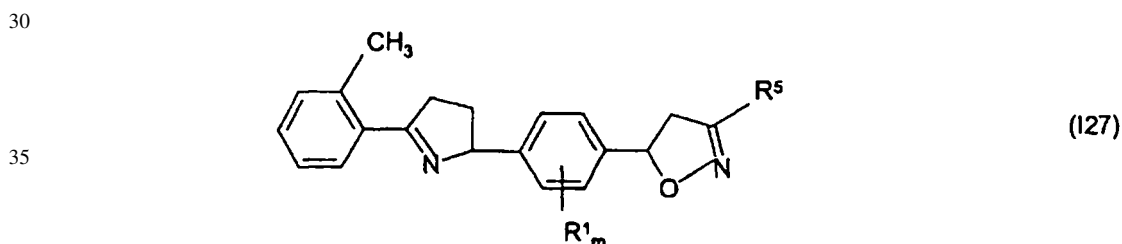
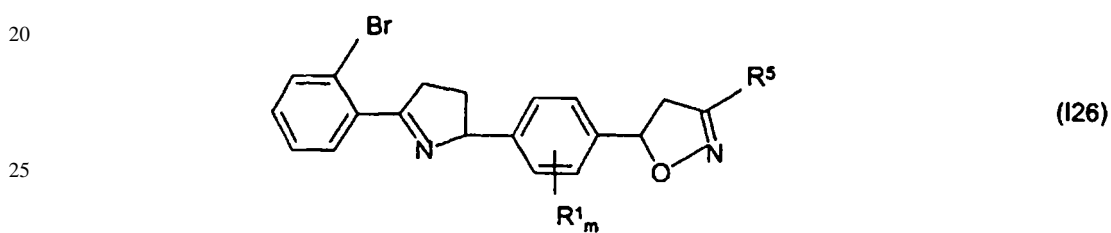
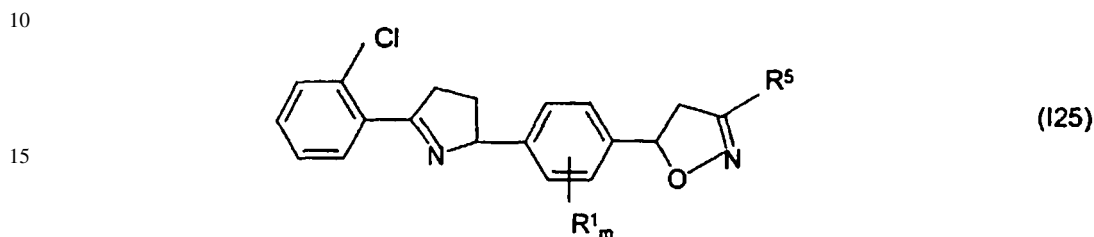
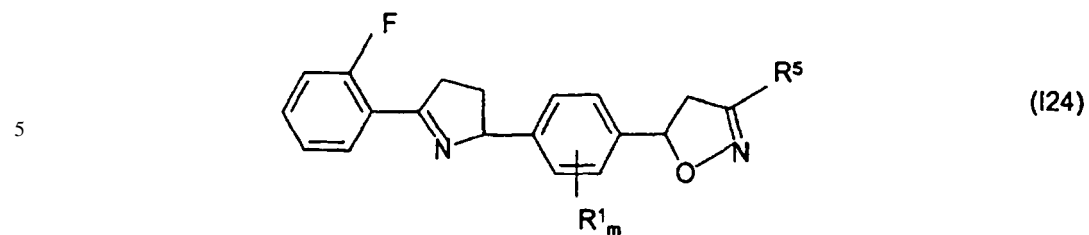


5
10
15
20
25
30
35
40
45
50
55
60
65



5
10
15
20
25
30
35
40
45
50
55
60
65





En las fórmulas anteriores se entenderá por “halógeno” un átomo de flúor, de cloro, de bromo o de yodo;

55 bajo la expresión “alquilo (con 1 a 4 átomos de carbono)” se entenderá un resto hidrocarbonado no ramificado o ramificado con 1 hasta 4 átomos de carbono, tal como por ejemplo el resto metilo, etilo, propilo, isopropilo, 1-butilo, 2-butilo, 2-metilpropilo o terc.-butilo;

60 bajo la expresión “alquilo (con 1 a 8 átomos de carbono)” se entenderán los restos alquilo anteriormente citados así como, por ejemplo, el resto fenilo, 2-metilbutilo, 1,1-dimetilpropilo o el resto hexilo;

bajo la expresión “alcanodiilo (con 1 a 8 átomos de carbono)” se entenderá un resto alcanodiilo no ramificado o ramificado con 1 hasta 6 átomos de carbono, tal como metileno, etano-1,2-diilo, propano-1,2-diilo, propano-1,3-diilo, butano-1,4-diilo, butano-1,3-diilo o 2-metilpropano-1,3-diilo;

65 bajo la expresión “halógenoalquilo (con 1 a 4 átomos de carbono)” se entenderá uno de los grupos alquilo, citado en el caso de la expresión “alquilo (con 1 a 4 átomos de carbono)”, en el cual uno o varios átomos de hidrógeno estén reemplazados por los átomos de halógeno anteriormente indicados, preferentemente por cloro o por flúor, tal como por

ES 2 266 474 T3

ejemplo el grupo trifluórmétilo, el grupo 1-fluórmétilo, el grupo 2,2,2-trifluóretilo, el grupo clorometilo, fluórmétilo, el grupo difluórmétilo o el grupo 1,1,2,2-tetrafluóretilo;

5 se entenderá por la expresión “cicloalquilo (con 3 a 8 átomos de carbono)” por ejemplo el grupo ciclopropilo, ciclobutilo o ciclopentilo; así como el resto ciclohexilo, cicloheptilo o ciclooctilo;

bajo la expresión “halógenocicloalquilo (con 3 a 8 átomos de carbono)” se entenderá uno de los restos cicloalquilo (con 3 a 8 átomos de carbono) anteriormente indicados, en el que se han reemplazado uno o varios átomos de hidrógeno por halógeno, preferentemente por flúor o por cloro, en el caso del flúor en caso dado incluso todos los átomos de hidrógeno, por ejemplo el grupo 2,2-difluór- o 2,2-diclorociclopropano o el resto fluórciclopentano;

bajo la expresión “alqueno (con 2 a 4 átomos de carbono)” se entenderán por ejemplo el grupo vinilo, alilo, 2-metil-2-propenilo o 2-butenilo;

15 bajo la expresión “halógenoalqueno (con 2 a 4 átomos de carbono)” se entenderá un grupo alqueno (con 2 a 4 átomos de carbono), en el que se han reemplazado los átomos de hidrógeno parcialmente por halógeno, preferentemente por flúor o por cloro y, en el caso del flúor, en su totalidad;

20 se entenderá por la expresión “alquino (con 2 a 4 átomos de carbono)” por ejemplo el grupo etinilo, propargilo, 2-metil-2-propinilo o 2-butinilo;

se entenderá por la expresión “alquino (con 2 a 6 átomos de carbono)” por ejemplo los restos citados precedentemente así como por ejemplo el grupo 1-pentinilo, 2-pentinilo, 3-pentinilo o el grupo 4-pentinilo;

25 se entenderá por la expresión “halógenoalquino” un grupo alquino en el que se han reemplazado parcialmente los átomos de hidrógeno por átomos de halógeno, preferentemente por flúor o por cloro y en el caso del flúor incluso en su totalidad;

30 se entenderá por la expresión “alcanoilo (con 1 a 4 átomos de carbono)-alquilo (con 1 a 4 átomos de carbono)” por ejemplo un grupo acetilmetilo, propionilmetilo, 2-acetilmetilo o un grupo butirilmetilo;

se entenderá por la expresión “alcanoilo (con 1 a 4 átomos de carbono)” por ejemplo el grupo formilo, acetilo, propionilo, 2-metilpropionilo o butirilo;

35 se entenderá por la expresión “alcanoilo (con 1 a 6 átomos de carbono)” los restos precedentemente citados así como por ejemplo el grupo valeroilo, pivaloilo o hexanoilo;

40 se entenderá por la expresión “halógenoalcanoilo (con 2 a 6 átomos de carbono)” un grupo alcanoilo (con 2 a 6 átomos de carbono), en el que se han reemplazado los átomos de hidrógeno parcialmente por átomos de halógeno, preferentemente por flúor o por cloro y en el caso del flúor incluso en su totalidad;

se entenderá por la expresión “alcoxycarbonilo (con 1 a 6 átomos de carbono)” por ejemplo el grupo metoxycarbonilo, etoxycarbonilo, propoxycarbonilo, butoxycarbonilo, terc.-butoxycarbonilo, pentiloxycarbonilo o hexiloxycarbonilo;

45 se entenderá por la expresión “halógenoalcoxycarbonilo (con 1 a 6 átomos de carbono)” un grupo alcoxycarbonilo (con 1 a 6 átomos de carbono) en el que se han reemplazado uno o varios átomos de hidrógeno por halógeno, preferentemente por flúor o por cloro y en el caso del flúor, en caso dado, incluso todos los átomos de hidrógeno;

50 se entenderá por la expresión “alquiltio (con 1 a 6 átomos de carbono)” un grupo alquiltio, cuyo resto hidrocarbonado tiene el significado indicado en el caso de la expresión “alquilo (con 1 a 6 átomos de carbono)”;

55 se entenderá por la expresión “halógenoalquiltio (con 1 a 6 átomos de carbono)” un grupo alquiltio (con 1 a 6 átomos de carbono), en el que se han reemplazado uno o varios átomos de hidrógeno de la parte hidrocarbonada por halógeno, especialmente por cloro o por flúor y, en el caso del flúor, en caso dado, incluso todos los átomos de hidrógeno;

se entenderá por la expresión “alquilsulfino (con 1 a 6 átomos de carbono)” por ejemplo el grupo metil-, etil-, propil-, isopropil-, butil-, isobutil-, sec.-butil-, terc.-butil-, pentil-, 2-metilbutil- o hexilsulfino;

60 se entenderá por la expresión “alquilsulfonilo (con 1 a 6 átomos de carbono)” por ejemplo el grupo metil-, etil-, propil-, isopropil-, butil-, isobutil-, sec.-butil-, terc.-butil-, pentil-, 2-metilbutil- o hexilsulfonilo;

65 se entenderá por la expresión “halógenoalquilsulfino (con 1 a 6 átomos de carbono)” y por “halógenoalquilsulfonilo (con 1 a 6 átomos de carbono)” los restos alquilsulfino y alquilsulfonilo (con 1 a 6 átomos de carbono), con los significados anteriormente indicados, en los cuales se han reemplazado uno o varios átomos de hidrógeno de la parte hidrocarbonada por halógeno, especialmente por cloro o por flúor y en el caso del flúor en caso dado incluso todos los átomos de hidrógeno;

ES 2 266 474 T3

se entenderá por la expresión “alcoxi (con 1 a 6 átomos de carbono)” un grupo alcoxi, cuyo resto hidrocarbonado tiene el significado indicado en el caso de la expresión “alquilo (con 1 a 6 átomos de carbono)”;

5 se entenderá por la expresión “alquilamino (con 1 a 6 átomos de carbono)” por ejemplo el grupo metilamino, etilamino, propilamino, isopropilamino, butilamino, isobutilamino, sec.-butilamino, terc.-butilamino, pentilamino o el grupo hexilamino;

10 se entenderá por la expresión “dialquilamino (con 1 a 6 átomos de carbono)” por ejemplo el grupo dimetilamino, metil-etil-amino, dietilamino, dipropilamino, dibutilamino, dipentilamino o el grupo dihexilamino; así como también sistemas cíclicos tales como por ejemplo el grupo pirrolidino o el grupo piperidino,

15 se entenderá por la expresión “halógenoalcoxi (con 1 a 6 átomos de carbono)” un grupo halógenoalcoxi, cuyo resto halógeno-hidrocarbonado tiene el significado indicado en el caso de la expresión “halógenoalquilo (con 1 a 6 átomos de carbono)”;

se entenderá por la expresión “arilo” un resto carbocíclico aromático con 6 hasta 14, especialmente con 6 hasta 12 átomos de carbono, tal como fenilo o naftilo, preferentemente fenilo;

20 se entenderá por la expresión “heterociclilo” un sistema anular heteroaromático o heteroalifático, entendiéndose por “sistema anular heteroaromático” un resto arilo, en el que se ha reemplazado al menos un grupo CH- por NH y/o al menos dos grupos CH- contiguos están reemplazados por S, NH u O, por ejemplo un resto de tiofeno, de furano, de pirrol, de tiazol, de oxazol, de imidazol, de isotiazol, de isoxazol, de pirazol, de 1,3,4-oxadiazol, de 1,3,4-tiadiazol, de 1,3,4-triazol, de 1,2,4-oxadiazol, de 1,2,4-tiadiazol, de 1,2,4-triazol, de 1,2,3-triazol, de 1,2,3,4-tetrazol, de benzo [b]tiofeno, de benzo[b]furano, de indol, de benzo[c]tiofeno, de benzo[c]furano, de isoindol, de benzoxazol, de benzotiazol, de bencimidazol, de bencisoxazol, de bencisotiazol, de benzopirazol, de benzotiadiazol, de benzotriazol, de dibenzofurano, de dibenzotiofeno, de carbazol, de piridina, de pirazina, de pirimidina, de piridazina, de 1,3,5-triazina, de 1,2,4-triazina, de 1,2,4,5-triazina, de quinolina, de isoquinolina, de quinoxalina, de quinazolina, de quinolina, 1,8-naftiridina, de 1,5-naftiridina, de 1,6-naftiridina, de 1,7-naftiridina, de ftalazina, de piridopirimidina, de purina, de pteridina o de 4H-quinolizina;

30 y se entenderá por la expresión “sistema anular heteroalifático” un resto cicloalquilo (con 3 a 8 átomos de carbono) en el cual se ha reemplazado al menos una unidad de carbono por O, S o por un grupo NR¹¹ y R¹¹ significa hidrógeno, alquilo (con 1 a 4 átomos de carbono), alcoxi (con 1 a 4 átomos de carbono) o arilo;

35 se entenderá por la expresión “ariltio” por ejemplo el grupo feniltio;

se entenderá por la expresión “ariloxi” por ejemplo el grupo fenoxi;

40 se entenderá por la expresión “heterociclioxi” o “heterociciltio” uno de los restos heterocíclicos anteriormente citados que están enlazados a través de un átomo de oxígeno o de azufre;

45 se entenderá por la expresión “cicloalcoxi (con 3 a 8 átomos de carbono)” o “cicloalquiltio (con 3 a 8 átomos de carbono)” uno de los restos cicloalquilo (con 3 a 8 átomos de carbono) anteriormente indicados, enlazados a través de un átomo de oxígeno o de azufre;

se entenderá por la expresión “cicloalcoxycarbonilo (con 3 a 8 átomos de carbono)” por ejemplo el grupo ciclobutiloxycarbonilo, ciclopentiloxycarbonilo, ciclohexiloxycarbonilo o el grupo cicloheptiloxycarbonilo;

50 y en la expresión “arilo, heterociclilo, fenilo, etc. substituidos en caso dado” debe entenderse preferentemente la substitución por uno o varios, preferentemente por 1 hasta 3, en el caso de halógeno incluso hasta el número máximo, de restos del grupo formado por halógeno, ciano, nitro, amino, hidroxilo, tio, alquilo (con 1 a 4 átomos de carbono), halógenoalquilo (con 1 a 4 átomos de carbono), cicloalquilo (con 3 a 8 átomos de carbono), halógenoalquiltio (con 3 a 4 átomos de carbono), alquilamino (con 1 a 4 átomos de carbono), halógenoalquilamino (con 1 a 4 átomos de carbono), formilo o alcanilo (con 1 a 4 átomos de carbono).

55 La explicación anteriormente indicada es válida, de manera correspondiente, para los homólogos o bien para los restos derivados de los mismos.

60 La presente invención se refiere a los compuestos de la fórmula (I) en forma de sus bases libres o de una sal de adición con ácido. Los ácidos, que pueden emplearse para la formación de las sales, son, por ejemplo, los ácidos inorgánicos tales como el ácido clorhídrico, el ácido bromhídrico, el ácido nítrico, el ácido sulfúrico, el ácido fosfórico o los ácidos orgánicos, tales como el ácido fórmico, el ácido acético, el ácido propiónico, el ácido malónico, el ácido oxálico, el ácido fumárico, el ácido adípico, el ácido esteárico, el ácido oleico, el ácido metanosulfónico, el ácido bencenosulfónico o el ácido toluenosulfónico.

65 Los compuestos de la fórmula (I) presentan, en parte, uno o varios átomos de carbono quirales o estereoisómeros en los dobles enlaces. Por lo tanto pueden separarse los enantiómeros o los diastereómeros. La invención abarca tanto los isómeros puros como también sus mezclas. Las mezclas de los diastereómeros pueden separarse en los componentes

ES 2 266 474 T3

según los métodos usuales, por ejemplo mediante cristalización selectiva a partir de disolventes adecuados o mediante cromatografía. Los racematos pueden separarse en los enantiómeros según métodos usuales, por ejemplo mediante la formación de sales con un ácido quirál enantiómeramente puro, separación de las sales diastereómeras y liberación de los enantiómeros puros por medio de una base.

5

La obtención de los compuestos según la invención se lleva a cabo según métodos conocidos en sí mismos por la literatura, como los que se han descrito en los manuales de síntesis orgánica, por ejemplo en Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, Georg-Thieme-Verlag, Stuttgart,

10

La obtención se lleva a cabo bajo condiciones de reacción que son conocidas y adecuadas para las reacciones citadas. En este caso pueden emplearse también variantes en sí conocidas, pero que no han sido citadas aquí con mayor detalle.

15

Los productos de partida pueden formarse en caso deseado también *in situ* y concretamente, de tal manera que no se aíslen de la mezcla de la reacción sino que se hagan reaccionar inmediatamente a continuación para dar los compuestos de la fórmula (I).

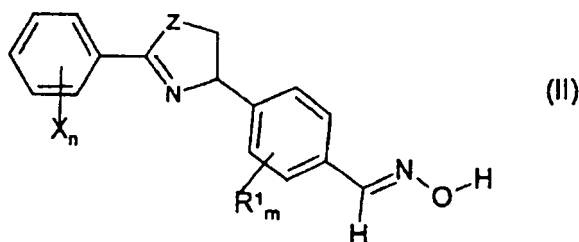
20

La química general de las 1,3-oxazolininas ha sido descrita por ejemplo en la publicación Tetrahedron, 1994, 50, 2297-2360 así como en la publicación Nachr. Chem. Tech. Lab. 1996, 44, 744-750.

25

El objeto de la invención está constituido también por un procedimiento para la obtención de los compuestos de la fórmula (I, G = 3-isoxazolinilo) mediante reacción de 1,3-oxazolininas, 1,3-tiazolininas, pirrolinas e imidazolininas de la fórmula (II) (véase por ejemplo la publicación WO-A-96/22283) (sustituidas adecuadamente con X_n y R^1_m) con un agente de halogenación para dar compuestos de la fórmula (III) y reacción de estos compuestos con una olefina (IV) (sustituida adecuadamente con R^5_t), haciéndose reaccionar en primer lugar una oxima de la fórmula (II),

30



35

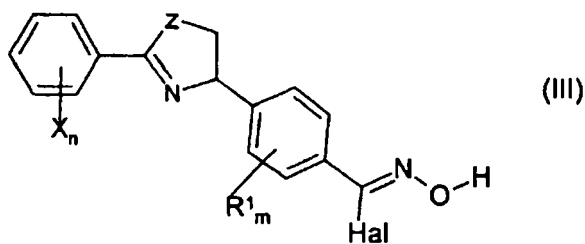
en la que

40

X y Z tienen los significados indicados en el caso de la fórmula (I),

con un agente de halogenación, preferentemente un agente de cloración, para dar un compuesto de la fórmula (III)

45



50

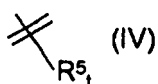
en la que

55

Hal significa halógeno, preferentemente Cl,

y a continuación se continúa la reacción con una olefina de la fórmula (IV)

60



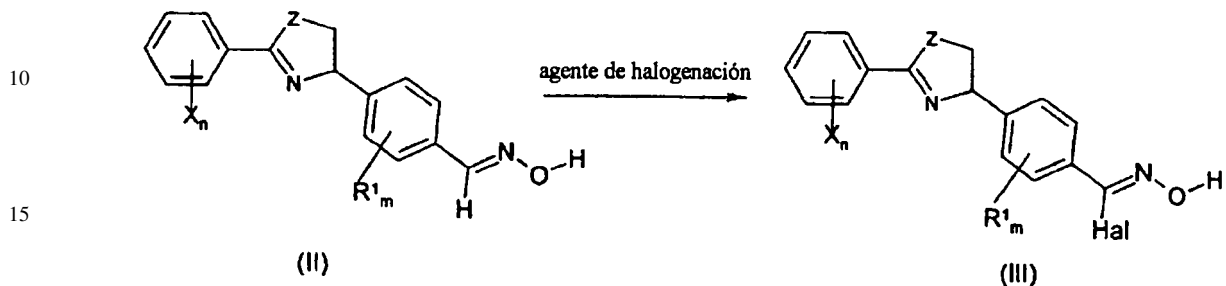
65

en la que

R^5 y t tienen los significados anteriormente indicados.

Las oximas de la fórmula (II) se transforman en las halogenoximas (III) mediante agentes de halogenación. Como agentes de halogenación son adecuados, por ejemplo, los halógenos elementales, los hipohalogenitos y las N-halógenoimidias:

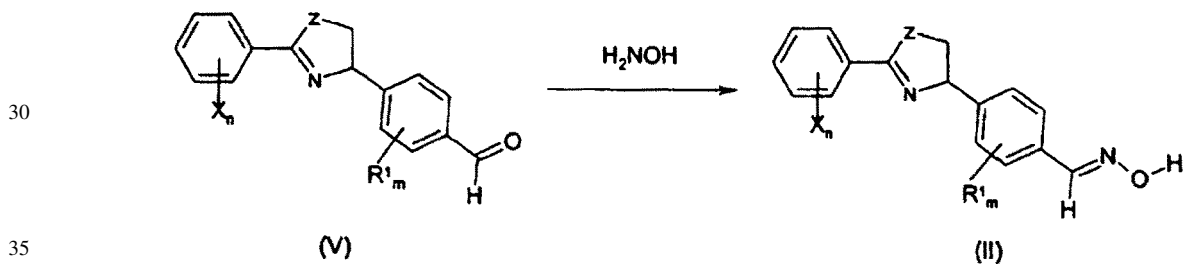
5 Método B



20 Las oximas de la fórmula (II) se preparan mediante reacción de aldehídos (V) con hidroxilamina o con sales de hidroxilamina, en caso dado en presencia de una base:

Método C

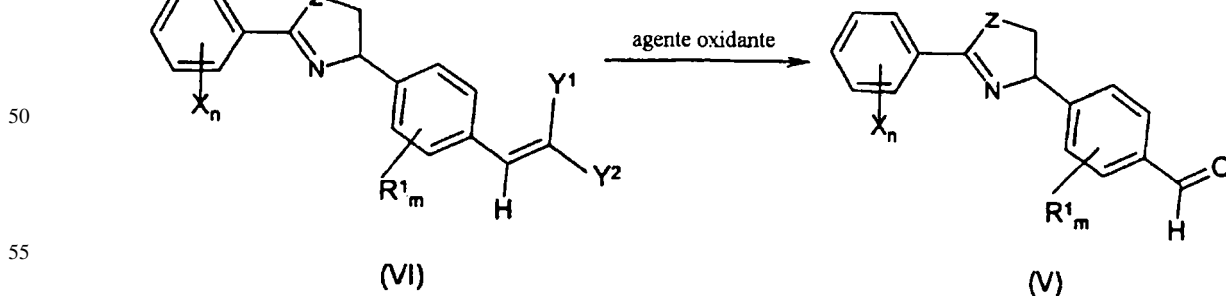
25



40 Los aldehídos de la fórmula (V) se preparan mediante disociación de la olefina de la fórmula (VI) por medio de un agente oxidante. Como agentes oxidantes sirven, por ejemplo, los compuestos de rutenio o de osmio en combinación con un periodato, o el ozono:

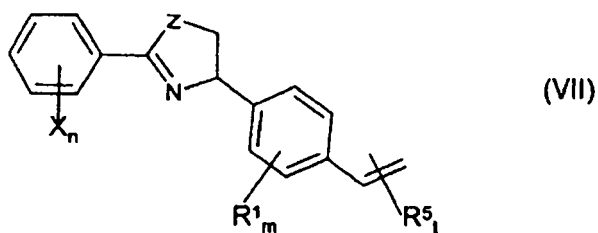
Método D

45



60 Los compuestos de la fórmula (VI) han sido parcialmente descritos (WO-A-95/04726), o bien pueden prepararse de manera análoga.

65 El objeto de la invención está constituido también por un procedimiento para la obtención de los compuestos de la fórmula (I) (G = 5-isoxazinilo) mediante reacción de 1,3-oxazolinas, 1,3-tiazolinas, pirrolinas e imidazolinas de la fórmula (VII) (véase por ejemplo la publicación WO-A-95/04726), substituida adecuadamente con Xn y R1m, con una halogenoxima, haciéndose reaccionar una olefina de la fórmula (VII),



10
en la que

Z y R⁵_i tienen los significados anteriormente indicados, con una halogenoxima de la fórmula (VIII),

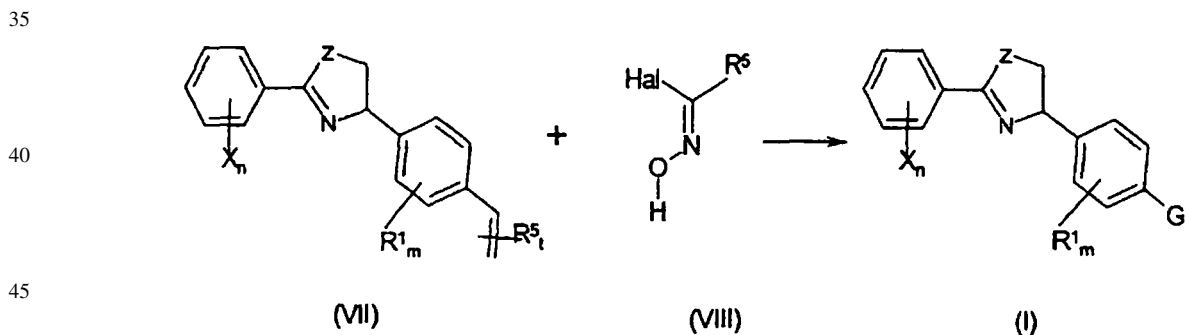


en la que
25 R⁵ tiene los significados anteriormente indicados.

A manera de ejemplo se describirá el método E para la síntesis de los compuestos de la fórmula (I) (G = 3-isoxazinilo):

30 La formación del anillo de isoxazol se lleva a cabo en presencia de una base, por ejemplo del grupo formado por los hidróxidos alcalinos, los carbonatos alcalinos, los alcoholatos y las aminas.

Método E

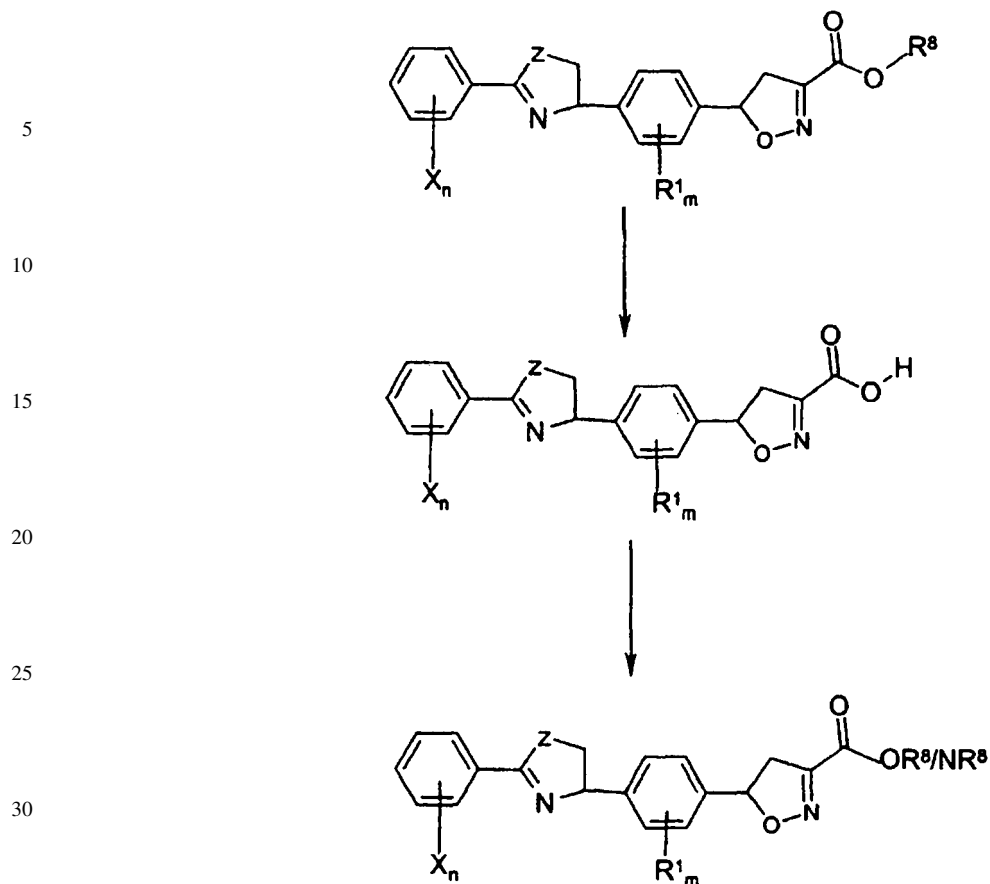


50 Pueden prepararse a partir de los derivados ácidos por ejemplo ésteres y amidas diversos como resto R⁵. Éstos pueden obtenerse, a su vez, por ejemplo mediante saponificación de un éster, por ejemplo

55

60

65



35

Como agentes para la saponificación pueden servir, por ejemplo, lejías acuosas de hidróxidos alcalinos. En el caso de la obtención de las amidas o de los ésteres puede activarse el ácido, por ejemplo con una carbodiimida, con carbonildiimidazol o con un cloruro de ácido inorgánico, por ejemplo cloruro de tionilo.

40

Pueden prepararse también a partir de los derivados hidroxí o bien de los derivados de amina ésteres y amidas diversos como resto R^5 . Éstos se obtienen, a su vez, por ejemplo mediante saponificación de un éster o bien de una amida, por ejemplo:

45

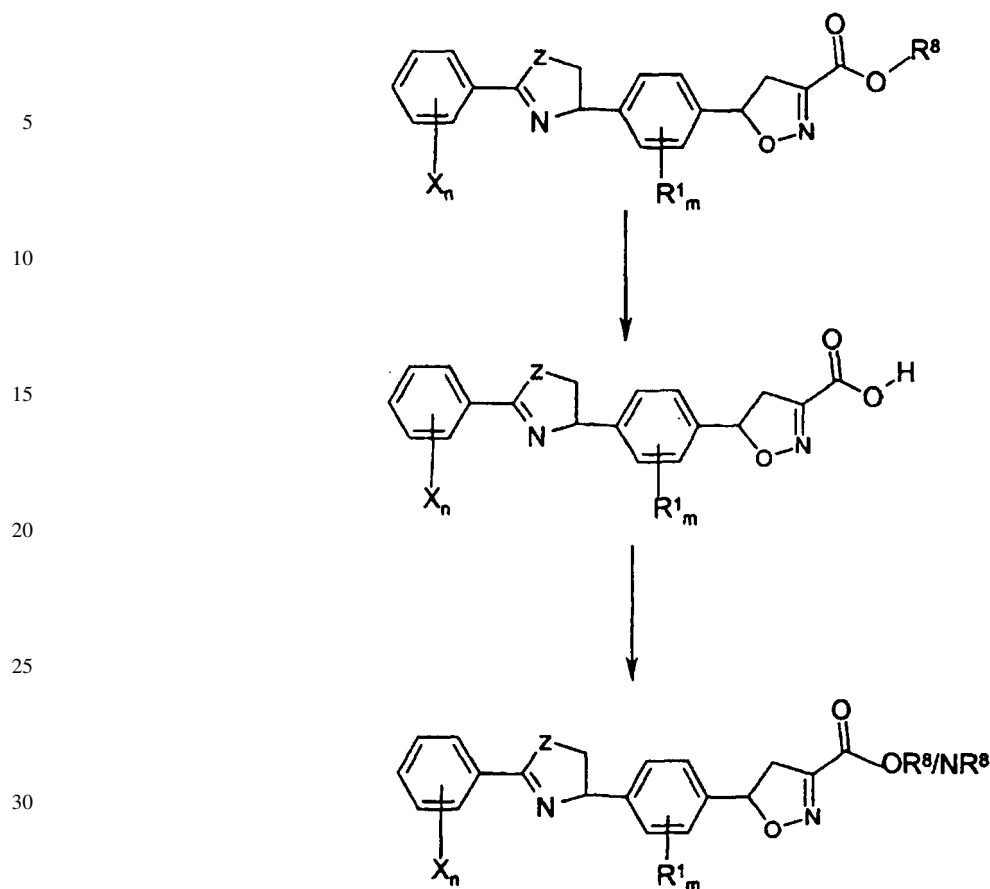
(Esquema pasa a página siguiente)

50

55

60

65



Como agentes para la saponificación pueden servir, por ejemplo, las lejías acuosas de los hidróxidos alcalinos. Para la obtención de las amidas y de los ésteres puede hacerse reaccionar el alcohol o la amina por ejemplo con un ácido activado, por ejemplo con un cloruro de ácido.

También pueden prepararse de manera paralela colecciones de compuestos de la fórmula (I), que pueden ser sintetizados según los esquemas anteriormente indicados, llevándose a cabo esto de manera manual, en parte de manera automatizada o de manera completamente automatizada. En este caso es posible, por ejemplo, automatizar la conducción de la reacción, la elaboración o la purificación de los productos o bien de los productos intermedios. En total se entenderá en este caso una forma de proceder como la que se ha descrito, por ejemplo, por S.H. DeWitt in "Annual Reports in Combinatorial Chemistry and Molecular Diversity: Automated synthesis", tomo 1, Verlag Escom 1997, páginas 69 hasta 77.

Para la conducción paralela de la reacción y la elaboración puede utilizarse una serie de dispositivos obtenibles en el comercio, como los que son ofrecidos, por ejemplo, por las firmas Stem Corporation, Woodrolfe road, Tollesbury, Essex, CM9 8SE, Inglaterra o H+P Labortechnik GmbH, Bruckmannring 28, 85764 Oberschleißheim, Alemania. Para la purificación paralela de los compuestos de la fórmula general (I) o bien de los productos intermedios que se forman durante la obtención, se dispone, entre otros, de aparatos de cromatografía, por ejemplo de la firma ISCO, Inc., 4700 Superior Street, Lincoln, NE 68504, USA.

Los aparatos enumerados conducen a una forma de proceder modular, según la cual las fases individuales de trabajo están automatizadas, teniéndose que llevar a cabo, sin embargo, operaciones manuales entre las etapas de trabajo. Esto puede evitarse mediante el empleo de sistemas de automatización parcial o completamente integrados, en los cuales estén servidos los módulos correspondientes de automatismo por ejemplo por medio de dispositivos autómatas. Tales sistemas de automatización pueden adquirirse, por ejemplo, en la firma Zymark Corporation, Zymark Center, Hopkinton, MA 01748, USA.

Además del método aquí descrito, la obtención de los compuestos de la fórmula general (I) puede llevarse a cabo de manera completa o parcial mediante métodos basados en fases sólidas. Con esta finalidad se enlazarán sobre una resina para síntesis los productos intermedios individuales o todos los productos intermedios de la síntesis o de una síntesis adaptada a la forma de proceder correspondiente. Los métodos de síntesis basados en fases sólidas han sido suficientemente descritos en la literatura del ramo, por ejemplo por Barry A. Bunin in "The Combinatorial Index", Verlag Academic Press, 1998.

ES 2 266 474 T3

El empleo de los métodos de síntesis basados en fases sólidas permite una serie de protocolos conocidos en la literatura, que puede llevarse a cabo, a su vez, de manera manual o de manera automatizada. De manera ejemplificativa puede automatizarse parcialmente el “método de la bolsa de té” (Houghten, US 4,631,211; Houghten *et al.*, Proc. Natl. Acad. Sci., 1985, 82, 5131-5135) con productos de la firma IRORI, 11149 North Torrey Pines Road, La Jolla, CA 92037, USA. La automatización de las síntesis paralelas basadas en fases sólidas se consigue, por ejemplo, por medio de los aparatos de la firma Argonaut Technologies, Inc., 887 Industrial Road, San Carlos, CA 94070, USA o de la firma MultiSynTech GmbH, Wullener Feld 4, 58454 Witten, Alemania.

La obtención según los procedimientos, aquí descritos, proporciona compuestos de la fórmula (I) en forma de colecciones de substancias, que se denominan bibliotecas. El objeto de la presente invención está constituido también por bibliotecas, que contienen al menos dos compuestos de la fórmula (I).

Los compuestos de la fórmula (I) son adecuados, con una buena compatibilidad para con las plantas y con una toxicidad conveniente para los animales de sangre caliente, para la lucha contra las plagas animales, especialmente contra los insectos, arácnidos, helmintos y moluscos, de forma muy especialmente preferente para la lucha contra los insectos y los arácnidos, que se presentan en agricultura, en la cría del ganado, en selvicultura, en la protección de los productos almacenados y de los materiales así como en el sector de la higiene. Éstos son activos contra tipos normalmente sensibles y resistentes así como contra todos o contra algunos de los estadios de desarrollo. A las plagas anteriormente citadas pertenecen:

Del orden de los Acarina por ejemplo *Acarus siro*, *Argas spp.*, *Omithodoros spp.*, *Dermanyssus gallinae*, *Eriophyes ribis*, *Phyllocoptura oleivora*, *Boophilus spp.*, *Rhipicephalus spp.*, *Amblyomma spp.*, *Hyalomma spp.*, *Ixodes spp.*, *Psoroptes spp.*, *Chorioptes spp.*, *Sarcoptes spp.*, *Tarsonemus spp.*, *Bryobia praetiosa*, *Panonychus spp.*, *Tetranychus spp.*, *Eotetranychus spp.*, *Oligonychus spp.*, *Eutetranychus spp.*

Del orden de los Isopoda por ejemplo *Oniscus aselus*, *Armadium vulgare*, *Porcellio scaber*.

Del orden de los Diplopoda, por ejemplo *Blaniulus guttulatus*.

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

Del orden de los Symphyla por ejemplo *Scutigera immaculata*.

Del orden de los Thysanura por ejemplo *Lepisma saccharina*.

Del orden de los Collembola por ejemplo *Onychiurus armatus*.

Del orden de los Orthoptera por ejemplo *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Leucophaea maderae*, *Blattella germanica*, *Acheta domesticus*, *Gryllotalpa spp.*, *Locusta migratoria migratorioides*, *Melanoplus differentialis*, *Schistocerca gregaria*. Aus der Ordnung des Isoptera por ejemplo *Reticulitermes spp.*

Del orden de los Anoplura por ejemplo *Phylloera vastatrix*, *Pemphigus spp.*, *Pediculus humanus corporis*, *Haematopinus spp.*, *Linognathus spp.*

Del orden de los Mallophaga por ejemplo *Trichodectes pp.*, *Damalinea spp.*

Del orden de los Thysanoptera por ejemplo *Hercinothrips femoralis*, *Thrips tabaci*.

Del orden de los Heteroptera por ejemplo *Eurygaster spp.*, *Dysdercus intermedius*, *Piesma quadrata*, *Cimex lectularius*, *Rhodnius prolixus*, *Triatoma spp.*

Del orden de los Homoptera por ejemplo *Aleurodes brassicae*, *Bemisia tabaci*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Aphis gossypii*, *Brevicoryne brassicae*, *Cryptomyzus ribis*, *Doralis fabae*, *Doralis pomi*, *Eriosoma lanigerum*, *Hyalopterus arundinis*, *Macrosiphum avenae*, *Myzus spp.*, *Phorodon humuli*, *Rhopalosiphum padi*, *Empoasca spp.*, *Euscelus bilobatus*, *Nephotettix cincticeps*, *Lecanium corni*, *Saissetia oleae*, *Laodelphax striatellus*, *Nilaparvata lugens*, *Aonidiella aurantii*, *Aspidiotus hederae*, *Pseudococcus spp.*, *Psylla spp.*

Del orden de los Lepidoptera por ejemplo *Pectinophora gossypiella*, *Bupalus piniarius*, *Cheimatobia brumata*, *Lithocolletis blancardella*, *Hyponomeuta padella*, *Plutella maculipennis*, *Malacosoma neustria*, *Euproctis chrysohorea*, *Lymantria spp.*, *Bucculatrix thurberiella*, *Phyllocnistis citrella*, *Agrotis spp.*, *Euxoa spp.*, *Feltia spp.*, *Earias insulana*, *Heliothis spp.*, *Laphygma exigua*, *Mamestra brassicae*, *Panolis flammea*, *Prodenia litura*, *Spodoptera spp.*, *Trichoplusia ni*, *Carpocapsa pomonella*, *Pieris spp.*, *Chilo spp.*, *Pyrausta nubilalis*, *Ephestia kuehniella*, *Galleria mellonella*, *Cacoecia podana*, *Capua reticulana*, *Choristoneura fumiferana*, *Clysia ambiguella*, *Homona magnanima*, *Tortrix viridana*.

Del orden de los Coleoptera por ejemplo *Anobium punctatum*, *Rhizopertha dominica*, *Bruchidius obtectus*, *Acantimoscelides obtectus*, *Hylotrupes bajulus*, *Agelastica alni*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Phaedon cochleariae*, *Diabrotica spp.*, *Psylloides chrysocephala*, *Epilachna varivestis*, *Atomaria spp.*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Anthonomus spp.*, *Si-*

ES 2 266 474 T3

tophilus spp., *Otiorrhynchus sulcatus*, *Cosmopolites sordidus*, *Ceuthorrhynchus assimilis*, *Hypera postica*, *Dermestes* spp., *Trogoderma*, *Anthrenus* spp., *Attagenus* spp., *Lyctus* spp., *Meligethes aeneus*, *Ptinus* spp., *Niptus hololeucus*, *Gibbium psyllodes*, *Tribolium* spp., *Tenebrio molitor*, *Agriotes* spp., *Conoderus* spp., *Melolontha melolontha*, *Amphimallon solstitialis*, *Costelytra zealandica*.

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

10 Del orden de los Diptera por ejemplo *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Drosophila melanogaster*, *Musca* spp., *Fannia* spp., *Calliphora erythrocephala*, *Lucilia* spp., *Chrysomyia* spp., *Cuterebra* spp., *Gastrophilus* spp., *Hypobosca* spp., *Stomoxys* spp., *Oestrus* spp., *Hypoderma* spp., *Tabanus* spp., *Tannia* spp., *Bibio hortulanus*, *Oscinella frit*, *Phorbia* spp., *Pegomyia hyoscyami*, *Ceratitis capitata*, *Dacus oleae*, *Tipula paludosa*.

15 Del orden de los Siphonaptera por ejemplo *Xenopsylla cheopsis*, *Ceratophyllus* spp.

Del orden de los Arachnida por ejemplo *Scorpio maurus*, *Latrodectus mactans*.

20 De la clase de los Helminthen por ejemplo *Haemonchus*, *Trichostrongylus*, *Ostertagia*, *Cooperia*, *Chabertia*, *Strongyloides*, *Oesophagostomum*, *Hyostrongylus*, *Ancylostoma*, *Ascaris* y *Heterakis* así como *Fasciola*.

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

De la clase de los Bivalva por ejemplo *Dreissena* spp.

30 A los nematodos, parasitantes de las plantas, que pueden ser combatidos, según la invención, pertenecen, por ejemplo, los nematodos del terreno parasitantes de las raíces, por ejemplo aquellos del género *Meloidogyne* (nematodos de las vesículas de las raíces, tales como *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne hapla* y *Meloidogyne javanica*), *Heterodera* y *Globodera* (nematodos formadores de quistes, tales como *Globodera rostochiensis*, *Globodera pallida*, *Heterodera trifolii*) así como del género *Radopholus*, tal como *Radopholus similis*, *Pratylenchus*, tales como *Pratylenchus neglectus*, *Pratylenchus penetrans* y *Pratylenchus curvatus*, *Tylenchulus*, tal como *Tylenchulus semipenetrans*, *Tylenchorhynchus*, tales como *Tylenchorhynchus dubius* y *Tylenchorhynchus claytoni*, *Rotylenchus*, tal como *Rotylenchus robustus*, *Heliocotylenchus*, tal como *Haliocotylenchus multicinctus*, *Belonoaimus*, tal como *Belonoaimus longicaudatus*, *Longidorus*, tal como *Longidorus elongatus*, *Trichodorus*, tal como *Trichodorus primitivus* y *Xiphinema*, tal como *Xiphinema index*.

40 Además, pueden combatirse con los compuestos según la invención los géneros de nematodos *Ditylenchus* (parásitos de los tallos, tales como *Ditylenchus dipsaci* y *Ditylenchus destructor*), *Aphelenchoides* (nematodos de las hojas, tal como *Aphelenchoides ritzemabosi*) y *Anguina* (nematodos de las flores, tal como *Anguina tritici*).

45 La invención se refiere también a agentes, por ejemplo agentes para la protección de las plantas, preferentemente a agentes insecticidas, acaricidas, ixodicidas, nematocidas, molusquicidas o fungicidas, de forma especialmente preferente insecticidas y acaricidas, que contengan uno o varios compuestos de la fórmula (I) junto a agentes auxiliares de formulación adecuados.

Los agentes según la invención contienen los productos activos de la fórmula (I), en general, desde un 1 hasta un 95% en peso.

50 Para la obtención de los agentes según la invención se combinan el producto activo y los otros aditivos y se llevan hasta una forma de aplicación adecuada.

Éstos pueden formularse de diversas formas, según se haya previsto por medio de los parámetros biológicos y/o químico-físicos. Como posibilidades de formulación entran en consideración, por ejemplo:

55 polvos pulverizables (WP), concentrados emulsionables (EC), soluciones acuosas (SL), emulsiones, soluciones pulverizables, dispersiones a base de aceite o de agua (SC), suspensiones (SE), agentes de espolvoreo (DP), agentes desinfectantes, granulados en forma de microgranulados, granulados para pulverización, granulados para ser esparcidos y granulados de adsorción, granulados dispersables en agua (WG), formulaciones de volumen ultrabajo (ULV), microcápsulas, ceras o cebos.

60 Estos tipos de formulación individuales son conocidos en principio y se han descrito, por ejemplo, en las publicaciones:

65 Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", tomo 7, C. Hanser Verlag München, 4ª edición 1986; van Falkenberg, "Pesticides Formulations", Marcel Dekker N.Y., 2nd Ed. 1972-73; K. Martens, "Spray Drying Handbook", 3rd Ed. 1979, G. Goodwin Ltd. Londres.

ES 2 266 474 T3

Los agentes auxiliares para la formulación, necesarios, tales como materiales inertes, tensioactivos, disolventes y otros aditivos son, igualmente, conocidos y han sido descritos, por ejemplo, en:

Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers", 2nd Ed., Darland Books, Caldwell N.J.; H. v. Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry", 2nd Ed., J. Wiley & Sons, N.Y.; Marsden, "Solvents Guide", 2nd Ed., Interscience, N.Y. 1950; McCutcheon's, "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N.J.; Sisley and Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964; Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte", Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1967; Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", tomo 7, C. Hanser Verlag München, 4ª edición. 1986.

También, pueden fabricarse, a base de estas formulaciones, combinaciones con otros productos con actividad pesticida, con abonos y/o con reguladores del crecimiento, por ejemplo en forma de una formulación lista para su utilización o como mezcla de tanque. Los polvos pulverizables son preparados que se dispersan homogéneamente en agua, que contienen, además del producto activo, también un diluyente o producto inerte o humectante, por ejemplo alquifenoles polioxitilenados, alcoholes grasos polioxitilenados, sulfonatos de alquilo o de alquilfenol y agentes dispersantes, por ejemplo ligninsulfonato de sodio, 2,2'-dinaftilmetano-6,6'-disulfonato de sodio.

Las concentraciones emulsionantes se preparan mediante disolución del producto activo en un disolvente orgánico, por ejemplo butano, ciclohexanona, dimetilformamida, xileno o incluso hidrocarburos aromáticos de elevado punto de ebullición o hidrocarburos con adición de uno o varios emulsionantes. Como emulsionantes pueden emplearse, por ejemplo: alquilarilsulfonatos de calcio, tales como el dodecibencenosulfonato de Ca, o emulsionantes no iónicos, tales como los ésteres de poliglicol de los ácidos grasos, los alquilarilpoliglicoléteres, los poliglicoléteres de alcoholes grasos, los productos de condensación de óxido de propileno-óxido de etileno, los alquilpoliéteres, los ésteres de sorbitán de ácidos grasos, los ésteres de polioxitilensorbitán de ácidos grasos o los ésteres de sorbita de polioxitileno.

Los agentes pulverizables se obtienen, por ejemplo, por molienda del producto activo con productos finamente divididos, por ejemplo talco o arcillas naturales, tales como caolín, bentonita, pirofilita o tierra de diatomeas. Los granulados pueden fabricarse por pulverización a través de toberas del producto activo sobre material inerte granulado, adsorbente o mediante la aplicación de concentrados del producto activo, por medio de pegamentos, por ejemplo alcohol polivinílico, poliácridato de sodio o incluso aceites minerales, sobre la superficie de productos de soporte, tales como arena o caolinita, o de material inerte granulado. También pueden granularse los productos activos adecuados en la forma usual empleada para la fabricación de los granulados de abonos -en caso deseado en mezcla con abonos-.

En los polvos inyectables la concentración del producto activo se encuentra comprendida por ejemplo desde aproximadamente 10 hasta 90% en peso, estando constituido el resto hasta el 100% por componentes usuales auxiliares para la formulación. En el caso de los concentrados emulsionables la concentración del producto activo puede encontrarse desde aproximadamente un 5 hasta un 80% en peso. Las formulaciones en forma de polvo contienen, al menos, desde un 5 hasta un 20% en peso de producto activo, las soluciones pulverizables contienen desde aproximadamente un 2 hasta un 20% en peso. En el caso de los granulados, el contenido en producto activo depende en parte de que el compuesto activo se presente en forma líquida o en forma sólida y de los agentes auxiliares para la granulación, de las cargas, etc. empleados.

Las formulaciones de los productos activos citadas contienen, además, en caso dado los adhesivos, humectantes, dispersantes, emulsionantes, agentes para la penetración, disolventes, cargas o vehículos usuales en cada caso.

Para la aplicación se diluirán en caso dado de manera usual los concentrados presentes en la forma usual en el comercio, por ejemplo en el caso de los polvos inyectables, de los concentrados emulsionados, de las dispersiones y, en parte, también en el caso de los microgránulos, por medio de agua. Las preparaciones en forma de polvo y en forma de gránulos así como las soluciones pulverizables, ya no se diluyen con productos inertes como paso previo a su utilización.

La cantidad aplicada, necesaria, varía con las condiciones externas, tales como la temperatura o la humedad. Ésta puede encontrarse dentro de amplios límites, por ejemplo entre 0,0005 y 10,0 kg/ha o una cantidad mayor de substancia activa, preferentemente se encuentra comprendida, sin embargo, entre 0,001 y 5 kg/ha.

Los productos activos según la invención pueden presentarse en sus formulaciones usuales en el comercio así como en las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones (véanse los agentes anteriormente indicados) en mezcla con otros productos activos, tales como insecticidas, cebos, esterilizantes, acaricidas, nematocidas, fungicidas, molusquicidas, productos para la regulación del crecimiento o herbicidas.

A los agentes pesticidas pertenecen, por ejemplo, los ésteres del ácido fosfórico, los carbamatos, los ésteres de los ácidos carboxílicos, las formamidinas, los compuestos de estaño y los productos generados por medio de microorganismos.

ES 2 266 474 T3

Los componentes de mezcla preferentes son:

1. del grupo de los compuestos del fósforo

5 Acephate, Azamethiphos, Azinphos-etilo, Azinphos-metilo, Bromophos, Bromophos-etilo, Cadusafos (F-67825), Chlorethoxyphos, Chlorfenvinphos, Chlormephos, Chlorpyrifos, Chlorpyrifos-metilo, Demeton, Demeton-S-metilo, Demeton-S-metilsulfona, Dialifos, Diazinon, Dichlorvos, Dicrotophos, Dimethoate, Disulfoton, EPN, Ethion, Ethoprophos, Etrimfos, Famphur, Fenamiphos, Fenitriothion, Fensulfotiothion, Fenthion, Fonofos, Formothion, Fosthiazate (ASC-66824) Heptenophos, Isazophos, Isothioate, Isoxa-
10 thion, Malathion, Methacrifos, Methamidophos, Methidathion, Salithion, Mevinphos, Monocrotophos, Naled, Omethoate, Oxydemeton-metilo, Parathion, Parathion-metilo, Phenthoate, Phorate, Phosalone, Phosfolan, Phosphocarb (BAS-301), Phosmet, Phosphamidon, Phoxim, Pirimiphos, Pirimiphos-etilo, Pirimiphos-metilo, Profenofos, Propaphos, Proetamphos, Prothiofos, Pyraclofos, Pyridapenthion, Quinalphos, Sulprofos, Temephos, Terbufos, Tebupirimfos, Tetrachlorvinphos, Thiometon, Triazophos, Trichlorphon, Vamido-
15 thion;

2. del grupo de los carbamatos

20 Alanycarb (OK-135), Aldicarb, 2-sec.-butilfenilmetilcarbamato (BPMC), Carbaryl, Carbofuran, Carbosulfan, Cloethocarb, Benfuracarb, Ethiofencarb, Furathiocarb, HCN-801, Isoprocarb, Methomyl, 5-metil-cumenilbutiril(metil)carbamato, Oxamyl, Pirimicarb, Propoxur, Thiodicarb, Thiofanox, 1-metiltio(etilide-noamino)-N-metil-N-(morfolintio)carbamato (UC 51717), Triazamate;

3. del grupo de los ésteres de los ácidos carboxílicos

25 Acrinathrin, Allethrin, Alphametrin, (E)-(1 R)-cis-2,2-dimetil-3-(2-oxotiolan-3-ilidenometil)ciclopropano-carboxilato de 5-bencil-3-furilmetilo, Beta-Cyfluthrin, Beta-Cypermethrin, Bioallethrin, Bioallethrin((S)-ciclopentilisómero), Bioesmethrin, Bifenthrin, 2,2-dimetilciclopropanocarboxilato de (RS)-1-ciano-1-(6-fenoxi-2-piridil)metil-(1RS)-trans-3-(4-terc.-butilfenilo) (NCI 85193), Cycloprothrin, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cythithrin, Cypermethrin, Cyphenothrin, Deltamethrin, Empenthrin, Esfenvalerate, Fenfluthrin, Fenpropathrin, Fenvalerate, Flucythrinate, Flumethrin, Fluvalinate (isómero D), Imiprothrin (S-41311), Lambda-Cyhalothrin, Permethrin, Phenothrin (isómero (R)), Prallethrin, Pyrethrine (productos naturales), Resmethrin, Tefluthrin, Tetramethrin, Theta-Cypermethrin (TD-2344), Tralomethrin, Transfluthrin, Zeta-Cypermethrin (F-56701);
30
35

4. del grupo de las amidinas

Amitraz, Chlordimeform;

5. del grupo de los compuestos del estaño

Cyhexatin, Fenbutatinoxide;

6. otros

45 Abamectin, ABG-9008, Acetamidrid, *Anagrapha falcitera*, AKD-1022, AKD-3059, ANS-118, *Bacillus thuringiensis*, *Beauveria bassiana*, Bensultap, Bifenazate (D-2341), Binapacryl, BJJ-932, Bromopropylate, BTG-504, BTG-505, Buprofezin, Camphechlor, Cartap, Chlorobenzilate, Chlorfenapyr, Chlorflua-zuron, 2-(4-clorofenil)-4,5-difeniltiofeno (UBI-T 930), Chlorfentezine, Chromafenozone (ANS-118), CG-216, CG-217, CG-234, A-184699, ciclopropanocarbonato de (2-naftilmetilo) (Ro12-0470), Cyromazin, Diacloden (Thiamethoxam), Diafenthion, éster de etilo de la N-(3,5-dicloro-4-(1,1,2,3,3,3-hexafluor-1-propiloxi)fenil)carbamoil)-2-clorobenzocarboximida, DDT, Dicofol, Diflubenzuron, N-(2,3-dihidro-3-metil-1,3-tiazol-2-ilideno)-2,4-xilidina, Dinobuton, Dinocap, Diofenolan, DPX-062, Emamectin-Benzoa-
50 te (MK-244), Endosulfan, Ethiprole (Sulfethiprole), Ethofenprox, Etoxazole (YI-5301), Fenazaquin, Fenoxycarb, Fipronil, Fluazuron, Flumite (Flufenzine, SZI-121), 2-flúor-5-(4-(4-etoxifenil)-4-metil-1-pentil)difeniléter (MTI 800), granulovirus y poliedrovirus nucleares, Fenpyroximate, Fenthioicarb, Flubenzimine, Flucycloxuron, Flufenoxuron, Flufenprox (ICI-A5683), Fluproxyfen, Gamma-HCH, Halofenozone (RH-0345), Halofenprox (MTI-732), Hexaflumuron (DE_473), Hexythiazox, HOI-9004, Hydramethylon (AC 217300), IKI 220, Imidacloprid, Indoxacarb (DPX-MP062), Kanemite (AKD-2023), M-020, MTI-446, Ivermectin, Lufenuron, M-020, Methoxyfenozide (Intrepid, RH-2485), Milbemectin, NC-196, Neemgard, Nitenpyram (TI-304), 2-nitrometil-4,5-dihidro-6H-tiazina (DS 52618), 2-nitrometil-3,4-dihidrotiazol (SD 35651), 2-nitrometileno-1,2-tiazinan-3-ilcarmalaldehído (WL 108477), Pyriproxyfen (S-71639), NC-196, NC-1111, NNI-9768, Novaluron (MCW-275), OK-9701, OK-9601, OK-9602, Propargite, Pymethrozine, Pyridaben, Pyrimidifen (SU-8801), RH-0345, RH-2485, RYI-210, S-1283, S-1833, SB7242, SI-8601, Si-
65 lafluofen, Silomadine (CG-177), Spinosad, SU-9118, Tebufenozone, Tebufenpyrad (MK-239), Teflubenzuron, Tetradifon, Tetrasul, Thiacloprid, Thiocyclam, TI-435, Tolfenpyrad (OMI-88); Triazamate (RH-7988), Triflumuron, Verbutin, Vertalec (Mykotal), YI-5301.

ES 2 266 474 T3

El contenido en materia sólida de las fórmulas de aplicación preparadas a partir de las formulaciones usuales en el mercado puede encontrarse entre un 0,00000001 hasta un 95% en peso de producto activo, preferentemente entre un 0,00001 y un 1% en peso. La aplicación se lleva a cabo en una forma usual adaptada a las formas de aplicación.

5 El objeto de la invención está constituido también por un procedimiento para la lucha contra los insectos dañinos, los ácaros, los moluscos y/o los nematodos, en el que se aplican sobre éstos o sobre las plantas, las superficies o los substratos, atacados por los mismos, una cantidad activa de un compuesto según la invención o de un agente según la invención.

10 Igualmente constituye un objeto de la invención el empleo de un compuesto, según la invención, o de un agente, según la invención, para la lucha contra los insectos dañinos, los ácaros, los moluscos y/o los nematodos.

Los productos activos según la invención son adecuados también en el campo de la medicina veterinaria, preferentemente para lucha contra los endoparásitos y contra los ectoparásitos, y en el campo de la cría animal.

15 La aplicación de los productos activos según la invención puede llevarse a cabo aquí de manera conocida, tal como mediante aplicación oral de, por ejemplo, tabletas, cápsulas, bebidas o granulados, mediante aplicación a través de la piel en forma, por ejemplo, de baños (Dippen), pulverizaciones (Sprayen), regado (pour-on and spot-on) y de empolvado, así como mediante aplicación parenteral en forma, por ejemplo, de inyección.

20 Los compuestos de la fórmula (I) según la invención pueden emplearse por lo tanto también de manera especialmente ventajosa en la cría del ganado (por ejemplo vacas, corderos, cerdos y aves de corral tales como gallinas, gansos, etc.). En una forma preferente de realización de la invención se administrarán a los animales los nuevos compuestos, en caso dado en formulaciones adecuadas (véase más arriba) y en caso dado con agua potable o con pienso, por vía oral. Puesto que se verifica una deposición en las heces, de manera eficaz, puede impedirse de este modo, de manera muy simple, el desarrollo de los insectos en las heces de los animales. Las dosis adecuadas en cada caso y las formulaciones dependen especialmente del tipo y del estadio de desarrollo de los animales útiles y también de la forma en que se manifieste el ataque y pueden determinarse y fijarse fácilmente según los métodos usuales. Los compuestos pueden emplearse en el caso de las vacas, por ejemplo en dosis desde 0,01 hasta 1 mg/kg de peso corporal.

30 Así pues, el objeto de la invención es también el empleo de un compuesto de la fórmula (I) o de uno de los agentes, anteriormente citados, para la obtención de un medicamento para los animales.

35 Los compuestos según la invención son adecuados además también para el empleo en el sector industrial, por ejemplo como agentes para la protección de la madera, como agentes para la conservación en pinturas aplicadas a brocha, en agentes lubricantes en frío para la elaboración de los metales o como agentes conservantes en los aceites de taladro y de corte.

40 Los compuestos de la fórmula (I) pueden emplearse en sus formulaciones usuales en el comercio, bien solos o en combinación con otros fungicidas conocidos por la literatura.

Como fungicidas conocidos por la literatura, que pueden combinarse según la invención con los compuestos de la fórmula (I), pueden citarse, por ejemplo, los productos siguientes:

45 Aldimorph, Andoprim, Anilazine, BAS 480F, BAS 450F, Benalaxyl, Benodanil, Benomyl, Binapacryl, Bitertanol, Bromuconazol, Buthiobate, Captafol, Captan, Carbendazim, Carboxin, CGA 173506, Cyprofuram, Dichlofluanid, Dichlomezin, Diclobutrazol, Diethofencarb, Difenconazol (CGA 169374), Difluconazole, Dimethirimol, Dimethomorph, Diniconazole, Dinocap, Dithianon, Dodemorph, Dodine, Edifenfos, Ethirimol, Etridiazol, Fenarimol, Fenfuram, Fenpiclonil, Fenpropidin, Fenpropimorph, Fentinacetate, Fentinhydroxide, Ferimzone (TF164), Fluazinam, Fluobenzimine, Fluquinconazole, Fluorimide, Flusilazole, Flutolanil, Flutriafol, Folpet, Fosetylaluminium, Fuberidazole, Fulsulfamide (MT-F 651), Furalaxyl, Furconazol, Furfencycloz, Guazatine, Hexaconazole, ICI A5504, Imazalil, Imibenconazole, Iprobenfos, Iprodione, Isoprothiolane, KNF 317, compuestos de cobre tales como oxocloruro de Cu, oxina de Cu, óxidos de Cu, Mancozeb, Maneb, Mepanipyrim (KIF 3535), Metconazol, Mepronil, Metalaxyl, Methasulfocarb, Methfuroxam, MON 24000, Myclobutanil, Nabam, Nitrothalidopropyl, Nuarimol, Ofurace, Oxadixyl, Oxycarboxin, Penconazol, Pencycuron, PP 969, Probenazole, Propineb, Prochloraz, Procymidon, Propamocarb, Propiconazol, Prothiocarb, Pyracarbolid, Pyrazophos, Pyrifeno, Pyroquilon, Rabenzazole, RH7592, azufre, Tebuconazole, TF 167, Thiabendazole, Thicyofen, Thiofanatemethyl, Thiram, Tolclofos-metilo, Tolyfluanid, Triadimefon, Triadimenol, Tricyclazole, Tridemorph, Triflumizol, Triforine, Validamycin, Vinchlozolin, XRD 563, Zineb, dodecilsulfonato de cobre, dodecil-sulfato de sodio, étersulfonato de alcoholes grasos con 13/15 átomos de carbono-sodio, cetostearyl-fosfato de sodio, sulfosuccinato de dioctil-sodio, isopropil-naftalenosulfonato de sodio, metilbisenaftalen-sulfonato de sodio, cloruro de cetil-trimetil-amonio, sales de aminas de cadena larga, primarias, secundarias o terciarias, alquil-propilenaminas, bromuro de lauril-pirimidinium, aminas grasas cuaternarias etoxiladas, cloruro de alquil-dimetil-bencil-amonio y 1-hidroxietil-2-alkil-imidazolina.

65 Los componentes de la mezcla anteriormente citados son productos conocidos que han sido descritos en gran parte en la publicación C.D.S. Tomlin, S.B. Walker, The Pesticide Manual, 12ª edición, British Crop Protection Council, Farnham 2000.

ES 2 266 474 T3

El objeto de la invención está constituido, también, por semillas, que contienen un compuesto según la invención o un agente según la invención o que están recubiertas con una cantidad activa de un compuesto según la invención o de un agente según la invención.

5 Los compuestos de la fórmula (I) pueden emplearse, también, para la lucha contra los organismos dañinos en cultivos de plantas conocidas o de plantas genéticamente modificadas a ser desarrolladas todavía. Las plantas transgénicas se caracterizan, por regla general, por propiedades especialmente ventajosas, por ejemplo por la resistencia frente a determinados agentes protectores de las plantas, resistencia contra las enfermedades de las plantas o contra los patógenos de las enfermedades de las plantas así como frente a determinados insectos o microorganismos tales como hongos, bacterias o virus. Otras propiedades especiales se refieren por ejemplo al producto cosechado, en lo que se refiere a la cantidad, a la calidad, a la aptitud al almacenamiento, a la composición y al componente especial. De este modo se conocen plantas transgénicas con un contenido en almidón elevado o con una calidad modificada del almidón o aquellas con otra composición de los ácidos grasos del producto cosechado.

15 Es preferente el empleo en cultivos de plantas útiles y ornamentales transgénicas económicamente significativas, por ejemplo cereales, tales como trigo, cebada, centeno, avena, mijo, arroz, mandioca y maíz, o incluso cultivos de remolacha azucarera, algodón, soja, colza, patatas, tomates, garbanzos y otras variedades de legumbres.

20 En el caso de la aplicación en cultivos transgénicos, especialmente aquellos en los que las plantas expresen un insecticida, se presentan, además de los efectos observados en otros cultivos contra los organismos dañinos, frecuentemente efectos que son específicos de la aplicación en el cultivo transgénico correspondiente, por ejemplo un espectro modificado o especialmente ampliado de los organismos dañinos, que pueden ser combatidos, o cantidades de aplicación modificadas, que pueden emplearse para la aplicación.

25 El objeto de la invención está constituido por lo tanto también por el empleo de los compuestos de la fórmula (I) para la lucha contra microorganismos dañinos en plantas de cultivo transgénicas.

30 El empleo, según la invención, de los compuestos de la fórmula (I) o bien de los agentes que los contienen, por ejemplo como insecticidas, acaricidas, molusquicidas o nematocidas, abarca también el caso en el que el compuesto de la fórmula (I) o su sal se forme sólo después de la aplicación, a partir de una sustancia precursora, por ejemplo sobre el insecto, sobre una planta o sobre el terreno.

Los ejemplos siguientes sirven para explicar la invención sin que ésta quede limitada por los mismos.

35 A. Ejemplos de obtención

3-Arilisoxazolina

Producto de partida VP1: 2-(2,6-difluórfenil)-4-(4-(2-feniletetil)fenil)oxazolina

40 Se calentaron durante 20 horas a reflujo la 2-(2,6-difluórfenil)-4-(4-bromofenil)oxazolina (33,8 g, 0,1 mol) y estireno (22,9 ml, 0,2 moles) con carbonato de sodio (11,66 g, 0,11 moles), fosfito de tris(2,4-di-terc.-butilfenilo) (6,47 g, 10 mmoles) y acetato de paladio (0,45 g, 2 mmoles) en 300 ml de DMF. Tras elaboración por extracción con acetato de etilo se agitó al residuo con heptano/diclorometano (1:1). Se obtuvieron 27 g de cristales, punto de fusión 141°C.

Producto de partida VP2: 2-(2,6-difluórfenil)-4-(4-formilfenil)oxazolina

45 Se suspendieron la 2-(2,6-difluórfenil)-4-(4-(2-feniletetil)fenil)oxazolina (7,22 g, 20 mmoles) y el metaperyodato de sodio (8,55 g, 20 mmoles) a 0°C, en acetonitrilo-acetona-agua (1:1:1, 180 ml) y se combinaron con una cantidad catalítica de hidrato de tricloruro de rutenio. Tras elaboración por extracción con acetato de etilo y cromatografía en columna se obtuvieron 5,6 g del aldehído en forma de aceite viscoso.

Producto de partida VP3: 2-(2,6-difluórfenil)-4-(4-(hidroxiiminometil)fenil)oxazolina

55 Se agitaron la 2-(2,6-difluórfenil)-4-(4-formilfenil)oxazolina (5,6 g), el hidrocloreto de hidroxilamina (1,53 g, 1,1 equivalentes) y el acetato de sodio (4,9 g, 3 equivalentes) a temperatura ambiente en 50 ml de etanol durante 24 h. Tras elaboración por extracción con acetato de etilo y cromatografía en columna se obtuvieron 4,2 g de cristales, punto de fusión 159°C.

2-(2,6-Difluórfenil)-4-(4-(5-terc.-butilisoxazolin-3-il)fenil)oxazolina (ejemplo Nr. 9)

60 Se calentaron la 2-(2,6-difluórfenil)-4-(4-(hidroxiiminometil)fenil)oxazolina (40 mg, 0,13 mmoles) y la N-cloro-succinimida (19 mg, 1,1 equivalentes) en 2 ml de DMF a 50°C durante 4 h. Tras refrigeración hasta la temperatura ambiente se añadieron 3,3-dimetilbuteno (33 mg, 0,4 mmoles) y trietilamina (41 mg, 0,4 mmoles). Tras agitación durante 16 h se elaboró por extracción con acetato de etilo y el residuo se purificó mediante cromatografía en columna. Se obtuvieron 19 mg de producto.

ES 2 266 474 T3

2-(2,6-Difluórfenil)-4-(4-(5-trifluórmethylisoxazolin-3-il)fenil)oxazolina (ejemplo Nr. 43)

Se calentaron la 2-(2,6-difluórfenil)-4-(4-(hidroxiiminometil)fenil)oxazolina (40 mg, 0,13 mmoles) y la N-clorosuccinimida (19 mg, 1,1 equivalentes) en 2 ml de DMF a 50°C durante 4 h. Tras enfriamiento hasta la temperatura ambiente se añadieron 2 ml de una solución de DMF saturada con 3,3,3-trifluorpropeno y trietilamina (41 mg, 0,4 mmoles). Tras agitación durante 16 h se elaboró por extracción con acetato de etilo y el residuo se purificó mediante cromatografía en columna. Se obtuvieron 37 mg de producto.

2-(2,6-Difluórfenil)-4-(4-(5-(trifluoracetamidometil)isoxazolin-3-il)fenil) oxazolina (ejemplo Nr. 115)

Se calentaron la 2-(2,6-difluórfenil)-4-(4-(hidroxiiminometil)fenil)oxazolina (1,2 g, 4 mmoles) y la N-clorosuccinimida (560 mg, 1,05 equivalentes) en 6 ml de DMF a 50°C durante 4h. Tras enfriamiento hasta la temperatura ambiente se añadieron N-alil-trifluoracetamida (2,75 g, 3 equivalentes) y trietilamina (1,66 ml, 3 equivalentes). Tras agitación durante 16 h se elaboró mediante extracción con acetato de etilo y el residuo se purificó mediante cromatografía en columna. Se obtuvieron 920 mg de producto.

2-(2,6-Difluórfenil)-4-(4-(5-(propionilaminometil)isoxazolin-3-il)fenil)oxazolina (ejemplo Nr. 116)

Se combinó la 2-(2,6-difluórfenil)-4-(4-(5-(trifluoracetamidometil) isoxazolin-3-il)fenil)oxazolina (43 mg) en 2 ml de metanol con 0,5 ml de lejía de hidróxido de sodio 2N y se agitaron durante 16 h. Tras elaboración por extracción con diclorometano se combinó la amina, en bruto, con 2 ml de diclorometano a 0°C, con trietilamina (0,05 ml) y con cloruro de propionilo (50 mg). Tras agitación durante 2 h se elaboró mediante extracción con acetato de etilo y el residuo se purificó mediante cromatografía en columna. Se obtuvieron 40 mg de producto.

5-Arilisoxazolininas

Producto de partida VP4: 2-(2,6-difluórfenil)-4-(4-etenilfenil)oxazolina

Se calentó la 2-(2,6-difluórfenil)-4-(4-bromofenil)oxazolina (6,0 g, 18 mmoles) en el autoclave, con carbonato de sodio (2,9 g, 21 mmoles), fosfito de tris(2,4-di-terc.-butilfenilo) (1,2 g, 1,8 mmoles) y acetato de paladio (64 mg, 2% equivalente) en 100 ml de DMF bajo 20 bares de etileno durante 44 h a 150°C. Tras elaboración por extracción con acetato de etilo y cromatografía en columna se obtuvieron 3,75 g de cristales, punto de fusión 76°C.

2-(2,6-Difluórfenil)-4-(4-(3-metilisoxazolin-5-il)fenil)oxazolina (ejemplo Nr. 566)

Se agitaron durante 3 h, a temperatura ambiente, la acetaldoxima (30 mg, 0,5 mmoles) y la N-clorosuccinimida (67 mg, 1 equivalente) en 3 ml de DMF. A continuación se añadieron la 2-(2,6-difluórfenil)-4-(4-etenilfenil)oxazolina (43 mg, 0,15 mmoles) y la trietilamina (46 mg, 0,45 mmoles) y se agitaron durante 16 h. Tras elaboración por extracción con acetato de etilo y cromatografía en columna se obtuvieron 32 mg del producto.

2-(2,6-Difluórfenil)-4-(4-(3-terc.-butylisoxazolin-5-il)fenil)oxazolina (ejemplo Nr. 573)

Se agitaron durante 3 h, a temperatura ambiente, la pivalinaldehídoxima (51 mg, 0,5 mmoles) y la N-clorosuccinimida (67 mg, 1 equivalente) en 3 ml de DMF. A continuación se añadieron la 2-(2,6-difluórfenil)-4-(4-etenilfenil)oxazolina (43 mg, 0,15 mmoles) y la trietilamina (46 mg, 0,45 mmoles) y se agitaron durante 16 h. Tras elaboración por extracción con acetato de etilo y cromatografía en columna se obtuvieron 30 mg de producto.

2-(2,6-Difluórfenil)-4-(4-(3-etoxicarbonilisoxazolin-5-il)fenil)oxazolina (ejemplo Nr. 614)

Se combinaron la 2-(2,6-difluórfenil)-4-(4-etenilfenil)oxazolina (570 mg, 2 mmoles) y el 2-cloro-2-hidroxiiminoacetato de etilo (320 mg, 1,05 equivalentes) en 10 ml de dicloroetano a 0°C con trietilamina (0,33 ml, 1,2 equivalentes) y se agitaron durante 16 h a la temperatura ambiente. Tras elaboración por extracción con acetato de etilo y cromatografía en columna se obtuvieron 420 mg de producto.

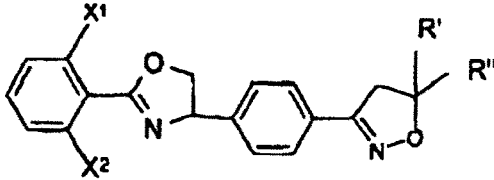
2-(2,6-Difluórfenil)-4-(4-(3-(2,2,2-trifluoetilaminocarbonil)isoxazolin-5-il)fenil)oxazolina (ejemplo Nr. 628)

Se agitó la 2-(2,6-difluórfenil)-4-(4-(3-etoxicarbonilisoxazolin-5-il)fenil)oxazolina (769 mg, 1,9 mmoles) en 20 ml de etanol y 6,5 ml de lejía de hidróxido de sodio 2N durante 3 h, a temperatura ambiente. Tras acidificación con ácido clorhídrico 2N se elaboró por extracción con diclorometano. Se obtuvieron 715 mg del ácido en bruto, que se emplearon directamente a continuación.

Se combinaron 47 mg, 0,13 mmoles del mismo, en 2 ml de DMF, con hidroxibenzotriazol (18 mg, 1 equivalente) y con N-etil-N'-(3-dimetilaminopropil)carbodiimida (25 mg, 1 equivalente). A continuación se añadió etildiisopropilamina (17 mg, 1 equivalente) en 1 ml de THF y 2,2,2-trifluoetilamina (0,015 ml) en 1 ml de THF. Tras agitación a 50°C durante 16 h, elaboración por extracción con acetato de etilo y cromatografía en columna se obtuvieron 41 mg de producto.

B. Ejemplos químicos (tablas 1-4)

TABLA 1

Oxazolinas de la fórmula (I), Z= O, G = 3-isoxazolinilo


Ej.-Nr.	X ¹	X ²	R ⁶	R ⁶⁶	Datos físicos
2	F	F	H	CH ₃	NMR
3	"	"	"	C ₂ H ₅	
4	"	"	"	n-C ₃ H ₇	
5	"	"	"	i-C ₃ H ₇	NMR
6	"	"	"	n-C ₄ H ₉	
7	"	"	"	i-C ₄ H ₉	
8	"	"	"	s-C ₄ H ₉	
9	"	"	"	t-C ₄ H ₉	NMR
10	"	"	"	n-C ₆ H ₁₃	NMR
11	"	"	"	CH ₂ -t-Bu	NMR
12	"	"	"	CH ₂ Cl	NMR
13	"	"	"	CH ₂ Br	NMR
14	F	F	CH ₃	CH ₃	
15	"	"	"	C ₂ H ₅	
16	"	"	"	n-C ₃ H ₇	
17	"	"	"	i-C ₃ H ₇	
18	"	"	"	s-C ₄ H ₉	NMR
19	"	"	"	i-C ₄ H ₉	NMR
20	"	"	"	t-C ₄ H ₉	NMR
21	"	"	"	n-C ₆ H ₁₃	

ES 2 266 474 T3

	22	"	"	"	CH ₂ -t-Bu	NMR
5	23	"	"	"	CH ₂ Cl	NMR
	24	F	F	H	OCH ₃	
10	25	"	"	"	OC ₂ H ₅	
	26	"	"	"	O-n-C ₃ H ₇	
15	27	"	"	"	O-n-C ₄ H ₉	
	28	"	"	"	O-i-C ₄ H ₉	NMR
20	29	" "	"	"	CN	NMR
	30	"	"	"	CH ₂ CN	NMR
25	31	"	"	"	CH ₂ OCH ₃	
	32	"	"	"	CH ₂ OC ₂ H ₅	NMR
30	33	"	"	"	CH ₂ O-n-C ₃ H ₇	NMR
	34	"	"	"	CH ₂ O-i-C ₃ H ₇	
35	35	"	"	"	CH ₂ O-n-C ₄ H ₉	NMR
	36	"	"	"	CH ₂ O-i-C ₄ H ₉	
40	37	"	"	"	CH ₂ O-s-C ₄ H ₉	
	38	"	"	"	CH ₂ O-t-C ₄ H ₉	
45	39	"	"	"	CH ₂ OCF ₂ CF ₂ H	NMR
	40	"	"	"	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	NMR
50	41	"	"	"	CH ₂ O-fenilo	NMR
	42	"	"	"	CH ₂ O-2-piridilo	NMR
55	43	"	"	"	CF ₃	NMR
	44	"	"	"	C ₂ F ₅	
60	45	"	"	"	n-C ₃ F ₇	NMR
	46	"	"	"	n-C ₄ F ₉	NMR
65						

ES 2 266 474 T3

	47	"	"	"	n-C ₅ F ₁₁	
5	48	"	"	"	n-C ₆ F ₁₃	NMR
	49	"	"	"	Fenilo	NMR
10	50	"	"	"	2-F-fenilo	NMR
	51	"	"	"	3-F-fenilo	NMR
15	52	"	"	"	4-F-fenilo	NMR
	53	"	"	"	2-Cl-fenilo	NMR
20	54	"	"	"	3-Cl-fenilo	
	55	"	"	"	4-Cl-fenilo	NMR
25	56	"	"	"	2,4-Cl ₂ -fenilo	
	57	"	"	"	3,4-Cl ₂ -fenilo	
30	58	"	"	"	2,6-Cl ₂ -fenilo	NMR
	59	"	"	"	4-Br-fenilo	NMR
35	60	"	"	"	2-CF ₃ -fenilo	NMR
	61	"	"	"	3-CF ₃ -fenilo	
40	62	"	"	"	3,5-(CF ₃) ₂ -fenilo	NMR
	63	"	"	"	4-CF ₃ -fenilo	NMR
45	64	"	"	"	2-CH ₃ -fenilo	NMR
	65	"	"	"	4-CH ₃ -fenilo	NMR
50	66	"	"	"	2,4-(CH ₃) ₂ -fenilo	NMR
	67	"	"	"	2,6-(CH ₃) ₂ -fenilo	
55	68	"	"	"	2,4,6-(CH ₃) ₃ -fenilo	NMR
	69	"	"	"	2-CH ₃ O-fenilo	
60	70	"	"	"	4-CH ₃ O-fenilo	NMR
	71	"	"	"	4-C ₂ H ₅ O-fenilo	
65						

ES 2 266 474 T3

	72	"	"	"	4-CF ₃ O-fenilo	NMR
5	73	"	"	"	4-CN-fenilo	NMR
	74	"	"	"	4-t-Bu-fenilo	NMR
10	75	"	"	"	4-NO ₂ -fenilo	
	76	"	"	"	CH ₂ -fenilo	NMR
15	77	"	"	"	CH ₂ -(4-F-fenilo)	
	78	"	"	"	C ₂ H ₄ Br	NMR
20	79	"	"	"	CH ₂ SCH ₃	NMR
	80	"	"	"	CH ₂ SOCH ₃	
25	81	"	"	"	CH ₂ SO ₂ CH ₃	
	82	"	"	"	CH ₂ SC ₂ H ₅	
30	83	"	"	"	CH ₂ S-n-C ₃ H ₇	
	84	"	"	"	COOCH ₃	NMR
35	85	"	"	"	COOC ₂ H ₅	
	86	"	"	"	COOCH ₂ CF ₃	NMR
40	87	"	"	"	COOC ₂ H ₄ CF ₃	NMR
	88	"	"	"	C ₂ F ₄ Br	NMR
45	89	"	"	"	CONHCH ₃	
	90	"	"	"	CONHC ₂ H ₅	NMR
50	91	"	"	"	CON(CH ₃) ₂	NMR
	92	"	"	"	CON(C ₂ H ₅) ₂	NMR
55	93	"	"	"	CONH(n-C ₃ H ₇)	NMR
	94	"	"	"	CONHCH ₂ C ₂ F ₅	NMR
60	95	"	"	"	CONHCH ₂ C ₂ H ₃	NMR
	96	"	"	"	CONH-t-C ₄ H ₉	NMR
65						

ES 2 266 474 T3

	97	"	"	"	CONH-n-C ₃ H ₁₁	NMR
5	98	"	"	"	CONHC ₃ H ₆ OCH ₃	NMR
	99	"	"	"	CONHCH ₂ C ₃ F ₇	NMR
10	100	"	"	"	CONHCH ₂ -(2-tetrahidrofuranilo)	NMR
	101	"	"	"	CONH-fenilo	
15	102	"	"	"	CONH(4-F-fenilo)	
	103	"	"	"	CONH(4-CF ₃ -fenilo)	NMR
20	104	"	"	"	CONCH ₃ (fenilo)	
	105	"	"	"	CONCH ₃ (4-F-fenilo)	
25	106	"	"	"	CONH(4-Cl-fenilo)	
	107	"	"	"	CONHC ₂ H ₄ (1-piperidinilo)	NMR
30	108	"	"	"	CONHCH ₂ CF ₃	NMR
	109	"	"	"	CONHCH ₂ fenilo	
35	110	"	"	"	CONHCH ₂ (2,6-F ₂ -fenilo)	NMR
	111	"	"	"	CONHCH ₂ (4-F-fenilo)	
40	112	"	"	"	CONHCH ₂ (4-CF ₃ -fenilo)	
	113	"	"	"	CONHCH ₂ (3-CF ₃ -fenilo)	NMR
45	114	"	"	"	CH ₂ NHCOCH ₃	NMR
	115	"	"	"	CH ₂ NHCOCF ₃	NMR
50	116	"	"	"	CH ₂ NHCOC ₂ H ₅	NMR
	117	"	"	"	CH ₂ NHCOC ₂ F ₅	NMR
55	118	"	"	"	CH ₂ NHCO-n-C ₃ H ₇	
	119	"	"	"	CH ₂ NHCO-i-C ₃ H ₇	
60	120	"	"	"	CH ₂ NHCO-n-C ₃ F ₇	NMR
	121	"	"	"	CH ₂ NHCOC ₂ H ₄ CF ₃	NMR
65						

ES 2 266 474 T3

122	"	"	"	CH ₂ NHCO-t-C ₄ H ₉	
123	"	"	"	CH ₂ NHCOfenilo	
124	"	"	"	CH ₂ NHCO(4-Cl-fenilo)	NMR
125	"	"	"	CH ₂ NHCO(2-Cl-5-piridilo)	NMR
126	F	H	H	CH ₃	
127	"	"	"	C ₂ H ₅	
128	"	"	"	n-C ₃ H ₇	
129	"	"	"	i-C ₃ H ₇	
130	"	"	"	n-C ₄ H ₉	
131	"	"	"	i-C ₄ H ₉	
132	"	"	"	s-C ₄ H ₉	
133	"	"	"	t-C ₄ H ₉	
134	"	"	"	n-C ₆ H ₁₃	
135	"	"	"	CH ₂ -t-Bu	
136	"	"	"	CF ₃	
137	"	"	"	C ₂ F ₅	
138	"	"	"	n-C ₃ F ₇	
139	"	"	"	n-C ₄ F ₉	NMR
140	"	"	"	n-C ₅ F ₁₁	
141	"	"	"	n-C ₆ F ₁₃	NMR
142	"	"	"	fenilo	
143	"	"	"	2-F-fenilo	
144	"	"	"	3-F-fenilo	
145	"	"	"	4-F-fenilo	
146	"	"	"	2-Cl-fenilo	

ES 2 266 474 T3

	147	"	"	"	3-Cl-fenilo	
5	148	"	"	"	4-Cl-fenilo	NMR
	149	"	"	"	2,4-Cl ₂ -fenilo	
10	150	"	"	"	3,4-Cl ₂ -fenilo	
	151	"	"	"	2,5-Cl ₂ -fenilo	
15	152	"	"	"	2,6-Cl ₂ -fenilo	
	153	"	"	"	2-CF ₃ -fenilo	
20	154	"	"	"	3-CF ₃ -fenilo	
	155	"	"	"	3,5-(CF ₃) ₂ -fenilo	
25	156	"	"	"	4-CF ₃ -fenilo	
	157	"	"	"	2-CH ₃ -fenilo	
30	158	"	"	"	4-CH ₃ -fenilo	
	159	"	"	"	2,4-(CH ₃) ₂ -fenilo	
35	160	"	"	"	2,6-(CH ₃) ₂ -fenilo	
	161	"	"	"	2,4,6-(CH ₃) ₃ -fenilo	
40	162	"	"	"	2-CH ₃ O-fenilo	
	163	"	"	"	4-CH ₃ O-fenilo	
45	164	"	"	"	4-C ₂ H ₅ O-fenilo	
	165	"	"	"	4-CF ₃ O-fenilo	
50	166	"	"	"	4-CN-fenilo	
	167	"	"	"	3-NO ₂ -fenilo	
55	168	"	"	"	4-NO ₂ -fenilo	
	169	F	Cl	H	CH ₃	
60	170	"	"	"	C ₂ H ₅	
	171	"	"	"	n-C ₃ H ₇	
65						

ES 2 266 474 T3

	172	"	"	"	i-C ₃ H ₇	
5	173	"	"	"	n-C ₄ H ₉	
	174	"	"	"	i-C ₄ H ₉	
10	175	"	"	"	S-C ₄ H ₉	
	176	"	"	"	t-C ₄ H ₉	
15	177	"	"	"	n-C ₆ H ₁₃	
	178	"	"	"	CH ₂ -t-Bu	
20	179	"	"	"	CF ₃	
	180	"	"	"	C ₂ F ₅	
25	181	"	"	"	n-C ₃ F ₇	
	182	"	"	"	n-C ₄ F ₉	NMR
30	183	"	"	"	n-C ₅ F ₁₁	
	184	"	"	"	n-C ₆ F ₁₃	NMR
35	185	"	"	"	Fenilo	
	186	"	"	"	2-F-fenilo	
40	187	"	"	"	3-F-fenilo	
	188	"	"	"	4-F-fenilo	
45	189	"	"	"	2-Cl-fenilo	
	190	"	"	"	3-Cl-fenilo	
50	191	"	"	"	4-Cl-fenilo	NMR
	192	"	"	"	2,4-Cl ₂ -fenilo	
55	193	"	"	"	3,4-Cl ₂ -fenilo	
	194	"	"	"	2,5-Cl ₂ -fenilo	
60	195	"	"	"	2,6-Cl ₂ -fenilo	
	196	"	"	"	2-CF ₃ -fenilo	
65						

ES 2 266 474 T3

197	"	"	"	3-CF ₃ -fenilo	
198	"	"	"	3,5-(CF ₃) ₂ -fenilo	
199	"	"	"	4-CF ₃ -fenilo	
200	"	"	"	2-CH ₃ -fenilo	
201	"	"	"	4-CH ₃ -fenilo	
202	"	"	"	2,4-(CH ₃) ₂ -fenilo	
203	"	"	"	2,6-(CH ₃) ₂ -fenilo	
204	"	"	"	2,4,6-(CH ₃) ₃ -fenilo	
205	"	"	"	2-CH ₃ O-fenilo	NMR
206	"	"	"	4-CH ₃ O-fenilo	
207	"	"	"	4-C ₂ H ₅ O-fenilo	
208	"	"	"	4-CF ₃ O-fenilo	
209	"	"	"	4-CN-fenilo	
210	"	"	"	3-NO ₂ -fenilo	
211	"	"	"	4-NO ₂ -fenilo	
212	Cl	H	H	CH ₃	
213	"	"	"	C ₂ H ₅	
214	"	"	"	n-C ₃ H ₇	
215	"	"	"	i-C ₃ H ₇	
216	"	"	"	n-C ₄ H ₉	
217	"	"	"	i-C ₄ H ₉	
218	"	"	"	s-C ₄ H ₉	
219	"	"	"	t-C ₄ H ₉	
220	"	"	"	n-C ₆ H ₁₃	
221	"	"	"	CH ₂ -t-Bu	

ES 2 266 474 T3

	222	"	"	"	CF ₃	
5	223	"	"	"	C ₂ F ₅	
	224	"	"	"	n-C ₃ F ₇	
10	225	"	"	"	n-C ₄ F ₉	NMR
	226	"	"	"	n-C ₅ F ₁₁	
15	227	"	"	"	n-C ₆ F ₁₃	NMR
	228	"	"	"	fenilo	
20	229	"	"	"	2-F-fenilo	
	230	"	"	"	3-F-fenilo	
25	231	"	"	"	4-F-fenilo	
	232	"	"	"	2-Cl-fenilo	
30	233	"	"	"	3-Cl-fenilo	
	234	"	"	"	4-Cl-fenilo	NMR
35	235	"	"	"	2,4-Cl ₂ -fenilo	
	236	"	"	"	3,4-Cl ₂ -fenilo	
40	237	"	"	"	2,5-Cl ₂ -fenilo	
	238	"	"	"	2,6-Cl ₂ -fenilo	
45	239	"	"	"	2-CF ₃ -fenilo	
	240	"	"	"	3-CF ₃ -fenilo	
50	241	"	"	"	3,5-(CF ₃) ₂ -fenilo	
	242	"	"	"	4-CF ₃ -fenilo	
55	243	"	"	"	2-CH ₃ -fenilo	
	244	"	"	"	4-CH ₃ -fenilo	
60	245	"	"	"	2,4-(CH ₃) ₂ -fenilo	
	246	"	"	"	2,6-(CH ₃) ₂ -fenilo	
65						

ES 2 266 474 T3

	247	"	"	"	2,4,6-(CH ₃) ₃ -fenilo	
5	248	"	"	"	2-CH ₃ O-fenilo	
	249	"	"	"	4-CH ₃ O-fenilo	
10	250	"	"	"	4-C ₂ H ₅ O-fenilo	
	251	"	"	"	4-CF ₃ O-fenilo	
15	252	"	"	"	4-CN-fenilo	
	253	"	"	"	3-NO ₂ -fenilo	
20	254	"	"	"	4-NO ₂ -fenilo	
	255	CH ₃	H	H	CH ₃	
25	256	"	"	"	C ₂ H ₅	
	257	"	"	"	n-C ₃ H ₇	
30	258	"	"	"	i-C ₃ H ₇	
	259	"	"	"	n-C ₄ H ₉	
35	260	"	"	"	i-C ₄ H ₉	
	261	"	"	"	s-C ₄ H ₉	
40	262	"	"	"	t-C ₄ H ₉	
	263	"	"	"	n-C ₆ H ₁₃	
45	264	"	"	"	CH ₂ -t-Bu	
	265	"	"	"	CF ₃	
50	266	"	"	"	C ₂ F ₅	NMR
	267	"	"	"	n-C ₃ F ₇	
55	268	"	"	"	n-C ₄ F ₉	
	269	"	"	"	n-C ₅ F ₁₁	
60	270	"	"	"	n-C ₆ F ₁₃	
	271	"	"	"	fenilo	
65						

ES 2 266 474 T3

272	"	"	"	2-F-fenilo	
273	"	"	"	3-F-fenilo	
274	"	"	"	4-F-fenilo	
275	"	"	"	2-Cl-fenilo	
276	"	"	"	3-Cl-fenilo	
277	"	"	"	4-Cl-fenilo	
278	"	"	"	2,4-Cl ₂ -fenilo	
279	"	"	"	3,4-Cl ₂ -fenilo	
280	"	"	"	2,5-Cl ₂ -fenilo	
281	"	"	"	2,6-Cl ₂ -fenilo	
282	"	"	"	2-CF ₃ -fenilo	
283	"	"	"	3-CF ₃ -fenilo	
284	"	"	"	3,5-(CF ₃) ₂ -fenilo	
285	"	"	"	4-CF ₃ -fenilo	
286	"	"	"	2-CH ₃ -fenilo	
287	"	"	"	4-CH ₃ -fenilo	
288	"	"	"	2,4-(CH ₃) ₂ -fenilo	
289	"	"	"	2,6-(CH ₃) ₂ -fenilo	
290	"	"	"	2,4,6-(CH ₃) ₃ -fenilo	
291	"	"	"	2-CH ₃ O-fenilo	
292	"	"	"	4-CH ₃ O-fenilo	
293	"	"	"	4-C ₂ H ₅ O-fenilo	
294	"	"	"	4-CF ₃ O-fenilo	
295	"	"	"	4-CN-fenilo	
296	"	"	"	3-NO ₂ -fenilo	

ES 2 266 474 T3

	297	"	"	"	4-NO ₂ -fenilo	
5	298	Br	H	H	CH ₃	
	299	"	"	"	C ₂ H ₅	
10	300	"	"	"	n-C ₃ H ₇	
	301	"	"	"	i-C ₃ H ₇	
15	302	"	"	"	n-C ₄ H ₉	
	303	"	"	"	i-C ₄ H ₉	
20	304	"	"	"	s-C ₄ H ₉	
	305	"	"	"	t-C ₄ H ₉	NMR
25	306	"	"	"	n-C ₆ H ₁₃	
	307	"	"	"	CH ₂ -t-Bu	
30	308	"	"	"	CF ₃	
	309	"	"	"	C ₂ F ₅	
35	310	"	"	"	n-C ₃ F ₇	
	311	"	"	"	n-C ₄ F ₉	NMR
40	312	"	"	"	n-C ₅ F ₁₁	
	313	"	"	"	n-C ₆ F ₁₃	NMR
45	314	"	"	"	Fenilo	
	315	"	"	"	2-F-fenilo	
50	316	"	"	"	3-F-fenilo	
	317	"	"	"	4-F-fenilo	
55	318	"	"	"	2-Cl-fenilo	
	319	"	"	"	3-Cl-fenilo	
60	320	"	"	"	4-Cl-fenilo	
	321	"	"	"	2,4-Cl ₂ -fenilo	
65						

ES 2 266 474 T3

	322	"	"	"	3,4-Cl ₂ -fenilo	
5	323	"	"	"	2,5-Cl ₂ -fenilo	
	324	"	"	"	2,6-Cl ₂ -fenilo	
10	325	"	"	"	2-CF ₃ -fenilo	
	326	"	"	"	3-CF ₃ -fenilo	
15	327	"	"	"	3,5-(CF ₃) ₂ -fenilo	
	328	"	"	"	4-CF ₃ -fenilo	NMR
20	329	"	"	"	2-CH ₃ -fenilo	
	330	"	"	"	4-CH ₃ -fenilo	
25	331	"	"	"	2,4-(CH ₃) ₂ -fenilo	
	332	"	"	"	2,6-(CH ₃) ₂ -fenilo	
30	333	"	"	"	2,4,6-(CH ₃) ₃ -fenilo	
	334	"	"	"	2-CH ₃ O-fenilo	NMR
35	335	"	"	"	4-CH ₃ O-fenilo	
	336	"	"	"	4-C ₂ H ₅ O-fenilo	
40	337	"	"	"	4-CF ₃ O-fenilo	
	338	"	"	"	4-CN-fenilo	
45	339	"	"	"	3-NO ₂ -fenilo	
	340	"	"	"	4-NO ₂ -fenilo	
50	341	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	
	342	"	"	"	C ₂ H ₅	
55	343	"	"	"	n-C ₃ H ₇	
	344	"	"	"	i-C ₃ H ₇	
60	345	"	"	"	n-C ₄ H ₉	
	346	"	"	"	i-C ₄ H ₉	
65						

ES 2 266 474 T3

5	347	"	"	"	S-C ₄ H ₉	
	348	"	"	"	t-C ₄ H ₉	
	349	"	"	"	n-C ₆ H ₁₃	
10	350	"	"	"	CH ₂ -t-Bu	
	351	"	"	"	CF ₃	
15	352	"	"	"	C ₂ F ₅	
	353	"	"	"	n-C ₃ F ₇	
20	354	"	"	"	n-C ₄ F ₉	NMR
	355	"	"	"	n-C ₅ F ₁₁	
25	356	"	"	"	n-C ₆ F ₁₃	NMR
	357	"	"	"	Fenilo	
30	358	"	"	"	2-F-fenilo	
	359	"	"	"	3-F-fenilo	
35	360	"	"	"	4-F-fenilo	
	361	"	"	"	2-Cl-fenilo	
40	362	"	"	"	3-Cl-fenilo	
	363	"	"	"	4-Cl-fenilo	NMR
	364	"	"	"	2,4-Cl ₂ -fenilo	
50	365	"	"	"	3,4-Cl ₂ -fenilo	
	366	"	"	"	2,5-Cl ₂ -fenilo	
55	367	"	"	"	2,6-Cl ₂ -fenilo	
	368	"	"	"	2-CF ₃ -fenilo	
60	369	"	"	"	3-CF ₃ -fenilo	
	370	"	"	"	3,5-(CF ₃) ₂ -fenilo	
65	371	"	"	"	4-CF ₃ -fenilo	

372	"	"	"	2-CH ₃ -fenilo	
373	"	"	"	4-CH ₃ -fenilo	
374	"	"	"	2,4-(CH ₃) ₂ -fenilo	
375	"	"	"	2,6-(CH ₃) ₂ -fenilo	
376	"	"	"	2,4,6-(CH ₃) ₃ -fenilo	
378	"	"	"	2-CH ₃ O-fenilo	
379	"	"	"	4-CH ₃ O-fenilo	
380	"	"	"	4-C ₂ H ₅ O-fenilo	
381	"	"	"	4-CF ₃ O-fenilo	
382	"	"	"	4-CN-fenilo	
383	"	"	"	3-NO ₂ -fenilo	
384	"	"	"	4-NO ₂ -fenilo	

TABLA 2

Oxazolinas, pirrolinas e imidazolinas de la fórmula (I), G = 3-isoxazolinilo

Ej.-Nr.	X ¹	X ²	Z	R ⁵	Datos físicos
385	F	F	CH ₂	CH ₃	
386	"	"	"	C ₂ H ₅	
387	"	"	"	n-C ₃ H ₇	
388	"	"	"	i-C ₃ H ₇	
389	"	"	"	n-C ₄ H ₉	
390	"	"	"	i-C ₄ H ₉	

ES 2 266 474 T3

400	"	"	"	S-C ₄ H ₉	
5	401	"	"	t-C ₄ H ₉	
402	"	"	"	n-C ₆ H ₁₃	
10	403	"	"	CH ₂ -t-Bu	
404	"	"	"	CF ₃	
15	405	"	"	C ₂ F ₅	
406	"	"	"	n-C ₃ F ₇	
20	407	"	"	n-C ₄ F ₉	
408	"	"	"	n-C ₅ F ₁₁	
25	409	"	"	n-C ₆ F ₁₃	
410	"	"	"	Fenilo	
30	411	"	"	2-F-fenilo	
412	"	"	"	3-F-fenilo	
35	413	"	"	4-F-fenilo	
414	"	"	"	2-Cl-fenilo	
40	415	"	"	3-Cl-fenilo	
416	"	"	"	4-Cl-fenilo	
45	417	"	"	2,4-Cl ₂ -fenilo	
50	418	"	"	3,4-Cl ₂ -fenilo	
419	"	"	"	2,5-Cl ₂ -fenilo	
55	420	"	"	2,6-Cl ₂ -fenilo	
421	"	"	"	2-CF ₃ -fenilo	
60	422	"	"	3-CF ₃ -fenilo	
423	"	"	"	3,5-(CF ₃) ₂ -fenilo	
65	424	"	"	4-CF ₃ -fenilo	

ES 2 266 474 T3

	425	"	"	"	2-CH ₃ -fenilo	
5	426	"	"	"	4-CH ₃ -fenilo	
	427	"	"	"	2,4-(CH ₃) ₂ -fenilo	
10	428	"	"	"	2,6-(CH ₃) ₂ -fenilo	
	429	"	"	"	2,4,6-(CH ₃) ₃ -fenilo	
15	430	"	"	"	2-CH ₃ O-fenilo	
	431	"	"	"	4-CH ₃ O-fenilo	
20	432	"	"	"	4-C ₂ H ₅ O-fenilo	
	433	"	"	"	4-CF ₃ O-fenilo	
25	434	"	"	"	4-CN-fenilo	
	435	"	"	"	3-NO ₂ -fenilo	
30	436	"	"	"	4-NO ₂ -fenilo	
	437	F	H	CH ₂	CH ₃	
35	438	"	"	"	C ₂ H ₅	
	439	"	"	"	n-C ₃ H ₇	
40	440	"	"	"	i-C ₃ H ₇	
	441	"	"	"	n-C ₄ H ₉	
45	442	"	"	"	i-C ₄ H ₉	
	443	"	"	"	s-C ₄ H ₉	
50	444	"	"	"	t-C ₄ H ₉	
	445	"	"	"	n-C ₆ H ₁₃	
55	446	"	"	"	CH ₂ -t-Bu	
	447	"	"	"	CF ₃	
60	448	"	"	"	C ₂ F ₅	
	449	"	"	"	n-C ₃ F ₇	
65						

ES 2 266 474 T3

450	"	"	"	n-C ₄ F ₉	
5 451	"	"	"	n-C ₅ F ₁₁	
452	"	"	"	n-C ₆ F ₁₃	
10 453	"	"	"	Fenilo	
454	"	"	"	2-F-fenilo	
15 455	"	"	"	3-F-fenilo	
456	"	"	"	4-F-fenilo	
20 457	"	"	"	2-Cl-fenilo	
458	"	"	"	3-Cl-fenilo	
25 459	"	"	"	4-Cl-fenilo	
460	"	"	"	2,4-Cl ₂ -fenilo	
30 461	"	"	"	3,4-Cl ₂ -fenilo	
462	"	"	"	2,5-Cl ₂ -fenilo	
35 463	"	"	"	2,6-Cl ₂ -fenilo	
464	"	"	"	2-CF ₃ -fenilo	
40 465	"	"	"	3-CF ₃ -fenilo	
466	"	"	"	3,5-(CF ₃) ₂ -fenilo	
45 467	"	"	"	4-CF ₃ -fenilo	
468	"	"	"	2-CH ₃ -fenilo	
50 469	"	"	"	4-CH ₃ -fenilo	
470	"	"	"	2,4-(CH ₃) ₂ -fenilo	
55 471	"	"	"	2,6-(CH ₃) ₂ -fenilo	
472	"	"	"	2,4,6-(CH ₃) ₃ -fenilo	
60 473	"	"	"	2-CH ₃ O-fenilo	
65 474	"	"	"	4-CH ₃ O-fenilo	

ES 2 266 474 T3

	475	"	"	"	4-C ₂ H ₅ O-fenilo	
5	476	"	"	"	4-CF ₃ O-fenilo	
	477	"	"	"	4-CN-fenilo	
10	478	"	"	"	3-NO ₂ -fenilo	
	479	"	"	"	4-NO ₂ -fenilo	
15	480	F	Cl	CH ₂	CH ₃	
	481	"	"	"	C ₂ H ₅	
20	482	"	"	"	n-C ₃ H ₇	
	483	"	"	"	i-C ₃ H ₇	
25	484	"	"	"	n-C ₄ H ₉	
	485	"	"	"	i-C ₄ H ₉	
30	486	"	"	"	s-C ₄ H ₉	
	487	"	"	"	t-C ₄ H ₉	
35	488	"	"	"	n-C ₆ H ₁₃	
	489	"	"	"	CH ₂ -t-Bu	
40	490	"	"	"	CF ₃	
	491	"	"	"	C ₂ F ₅	
45	492	"	"	"	n-C ₃ F ₇	
	493	"	"	"	n-C ₄ F ₉	
50	494	"	"	"	n-C ₅ F ₁₁	
	495	"	"	"	n-C ₆ F ₁₃	
55	496	"	"	"	Fenilo	
	497	"	"	"	2-F-fenilo	
60	498	"	"	"	3-F-fenilo	
	499	"	"	"	4-F-fenilo	
65						

ES 2 266 474 T3

500	"	"	"	2-Cl-fenilo	
501	"	"	"	3-Cl-fenilo	
502	"	"	"	4-Cl-fenilo	
503	"	"	"	2,4-Cl ₂ -fenilo	
504	"	"	"	3,4-Cl ₂ -fenilo	
505	"	"	"	2,5-Cl ₂ -fenilo	
506	"	"	"	2,6-Cl ₂ -fenilo	
507	"	"	"	2-CF ₃ -fenilo	
508	"	"	"	3-CF ₃ -fenilo	
509	"	"	"	3,5-(CF ₃) ₂ -fenilo	
510	"	"	"	4-CF ₃ -fenilo	
511	"	"	"	2-CH ₃ -fenilo	
512	"	"	"	4-CH ₃ -fenilo	
513	"	"	"	2,4-(CH ₃) ₂ -fenilo	
514	"	"	"	2,6-(CH ₃) ₂ -fenilo	
515	"	"	"	2,4,6-(CH ₃) ₃ -fenilo	
516	"	"	"	2-CH ₃ O-fenilo	
517	"	"	"	4-CH ₃ O-fenilo	
518	"	"	"	4-C ₂ H ₅ O-fenilo	
519	"	"	"	4-CF ₃ O-fenilo	
520	"	"	"	4-CN-fenilo	
521	"	"	"	3-NO ₂ -fenilo	
522	"	"	"	4-NO ₂ -fenilo	
523	F	F	NCOOEt	CH ₃	
524	"	"	"	C ₂ H ₅	

ES 2 266 474 T3

525	"	"	"	n-C ₃ H ₇	
526	"	"	"	i-C ₃ H ₇	
527	"	"	"	n-C ₄ H ₉	
528	"	"	"	i-C ₄ H ₉	
529	"	"	"	s-C ₄ H ₉	
530	"	"	"	t-C ₄ H ₉	
531	"	"	"	n-C ₆ H ₁₃	
532	"	"	"	CH ₂ -t-Bu	
533	"	"	"	CF ₃	
534	"	"	"	C ₂ F ₅	
535	"	"	"	n-C ₃ F ₇	
536	"	"	"	n-C ₄ F ₉	
537	"	"	"	n-C ₅ F ₁₁	
538	"	"	"	n-C ₆ F ₁₃	
539	"	"	"	Fenilo	
540	"	"	"	2-F-fenilo	
541 "	"	"	"	3-F-fenilo	
542	"	"	"	4-F-fenilo	
543	"	"	"	2-Cl-fenilo	
544	"	"	"	3-Cl-fenilo	
545	"	"	"	4-Cl-fenilo	
546	"	"	"	2,4-Cl ₂ -fenilo	
547	"	"	"	3,4-Cl ₂ -fenilo	
548	"	"	"	2,5-Cl ₂ -fenilo	
549	"	"	"	2,6-Cl ₂ -fenilo	

ES 2 266 474 T3

550	"	"	"	2-CF ₃ -fenilo	
551	"	"	"	3-CF ₃ -fenilo	
552	"	"	"	3,5-(CF ₃) ₂ -fenilo	
553	"	"	"	4-CF ₃ -fenilo	
554	"	"	"	2-CH ₃ -fenilo	
555	"	"	"	4-CH ₃ -fenilo	
556	"	"	"	2,4-(CH ₃) ₂ -fenilo	
557	"	"	"	2,6-(CH ₃) ₂ -fenilo	
558	"	"	"	2,4,6-(CH ₃) ₃ -fenilo	
559	"	"	"	2-CH ₃ O-fenilo	
560	"	"	"	4-CH ₃ O-fenilo	
561	"	"	"	4-C ₂ H ₅ O-fenilo	
562	"	"	"	4-CF ₃ O-fenilo	
563	"	"	"	4-CN-fenilo	
564	"	"	"	3-NO ₂ -fenilo	
565	"	"	"	4-NO ₂ -fenilo	

TABLA 3

Oxazolinas de la fórmula (I), Z= O, G = 5-isoxazolinilo

Ej.-Nr.	X¹	X²	R⁵	Datos físicos
566	F	F	CH ₃	NMR
567	"	"	C ₂ H ₅	NMR

ES 2 266 474 T3

	568	"	"	n-C ₃ H ₇	NMR
5	569	"	"	i-C ₃ H ₇	NMR
	570	"	"	n-C ₄ H ₉	NMR
10	571	"	"	i-C ₄ H ₉	
	572	"	"	S-C ₄ H ₉	
15	573	"	"	t-C ₄ H ₉	NMR
	574	"	"	n-C ₅ H ₁₁	NMR
20	575	"	"	n-C ₆ H ₁₃	
	576	"	"	CH(C ₂ H ₅) ₂	NMR
25	577	"	"	CH ₂ -t-Bu	
	578	"	"	CH ₂ CF ₃	NMR
30	579	"	"	C ₂ H ₄ CF ₃	NMR
	580	"	"	CF ₃	
35	581	"	"	C ₂ F ₅	
	582	"	"	n-C ₃ F ₇	
40	583	"	"	n-C ₄ F ₉	
	584	"	"	n-C ₅ F ₁₁	
45	585	"	"	n-C ₆ F ₁₃	
	586	"	"	Fenilo	
50	587	"	"	2-F-fenilo	
	588	"	"	3-F-fenilo	
55	589	"	"	4-F-fenilo	NMR
	590	"	"	2-Cl-fenilo	
60	591	"	"	3-Cl-fenilo	
	592	"	"	4-Cl-fenilo	NMR
65					

ES 2 266 474 T3

593	"	"	2,4-Cl ₂ -fenilo	
594	"	"	3,4-Cl ₂ -fenilo	
595	"	"	2,5-Cl ₂ -fenilo	
596	"	"	2,6-Cl ₂ -fenilo	
597	"	"	2-CF ₃ -fenilo	
598	"	"	3-CF ₃ -fenilo	
599	"	"	3,5-(CF ₃) ₂ -fenilo	
600	"	"	4-CF ₃ -fenilo	NMR
601	"	"	2-CH ₃ -fenilo	
602	"	"	4-CH ₃ -fenilo	
603	"	"	2,4-(CH ₃) ₂ -fenilo	
604	"	"	2,6-(CH ₃) ₂ -fenilo	
605	"	"	2,4,6-(CH ₃) ₃ -fenilo	NMR
606	"	"	2-CH ₃ O-fenilo	
607	"	"	4-CH ₃ O-fenilo	
608	"	"	4-C ₂ H ₅ O-fenilo	
609	"	"	4-CF ₃ O-fenilo	
610	"	"	4-CN-fenilo	
611	"	"	3-NO ₂ -fenilo	
612	"	"	4-NO ₂ -fenilo	
613	"	"	COOH	NMR
614	"	"	COOC ₂ H ₅	NMR
615	"	"	COOCH ₂ CF ₃	NMR
616	"	"	COOC ₂ H ₄ CF ₃	NMR
617	"	"	CONH ₂	

ES 2 266 474 T3

	618	"	"	CONHCH ₃	
5	619	"	"	CONHC ₂ H ₅	NMR
	620	"	"	CON(CH ₃) ₂	
10	621	"	"	CON(C ₂ H ₅) ₂	NMR
	622	"	"	CONH(n-C ₃ H ₇)	NMR
15	623	"	"	CONHCH ₂ C ₂ F ₅	NMR
	624	"	"	CONH-t-C ₄ H ₉	NMR
20	625	"	"	CONHCH ₂ C ₂ H ₃	NMR
	626	"	"	CONHCH ₂ C ₃ F ₇	NMR
25	627	"	"	CONH-s-C ₅ H ₁₁	NMR
	628	"	"	CONHCH ₂ CF ₃	NMR
30	629	"	"	CONHC ₃ H ₆ OCH ₃	NMR
	630	"	"	CONHCH ₂ -(2-tetrahydrofuranilo)	NMR
35	631	"	"	CONHCH ₂ -(2,6-F ₂ -fenilo)	NMR
	632	"	"	CONHCH ₂ -(4-F-fenilo)	
40	633	"	"	CONHCH ₂ -(3-CF ₃ -fenilo)	NMR
	634	"	"	CONHCH ₂ -(4-CF ₃ -fenilo)	
45	635	"	"	CONH(2,5-F ₂ -fenilo)	
	636	"	"	CONH(4-F-fenilo)	
50	637	"	"	CONH(3-CF ₃ -fenilo)	
	638	"	"	CONH(4-CF ₃ -fenilo)	
55	639	F	H	CH ₃	
	640	"	"	C ₂ H ₅	
60	641	"	"	n-C ₃ H ₇	
	642	"	"	i-C ₃ H ₇	
65					

ES 2 266 474 T3

5	643	"	"	n-C ₄ H ₉	
	644	"	"	i-C ₄ H ₉	
	645	"	"	s-C ₄ H ₉	
10	646	"	"	t-C ₄ H ₉	
	647	"	"	n-C ₅ H ₁₁	
15	648	"	"	n-C ₆ H ₁₃	
	649	"	"	CH(C ₂ H ₅) ₂	
20	650	"	"	CH ₂ -t-Bu	
	651	"	"	CH ₂ CF ₃	
25	652	"	"	C ₂ H ₄ CF ₃	
	653	"	"	CF ₃	
30	654	"	"	C ₂ F ₅	
	655	"	"	n-C ₃ F ₇	
35	656	"	"	n-C ₄ F ₉	
	657	"	"	n-C ₅ F ₁₁	
40	658	"	"	n-C ₆ F ₁₃	
	659	"	"	Fenilo	
45	660	"	"	2-F-fenilo	
	661	"	"	3-F-fenilo	
50	662	"	"	4-F-fenilo	
	663	"	"	2-Cl-fenilo	
55	664	"	"	3-Cl-fenilo	
	665	"	"	4-Cl-fenilo	
60	666	"	"	2,4-Cl ₂ -fenilo	
	667	"	"	3,4-Cl ₂ -fenilo	
65					

ES 2 266 474 T3

	668	"	"	2,5-Cl ₂ -fenilo	
5	669	"	"	2,6-Cl ₂ -fenilo	
	670	"	"	2-CF ₃ -fenilo	
10	671	"	"	3-CF ₃ -fenilo	
	672	"	"	3,5-(CF ₃) ₂ -fenilo	
15	673	"	"	4-CF ₃ -fenilo	
	674	"	"	2-CH ₃ -fenilo	
20	675	"	"	4-CH ₃ -fenilo	
	676	"	"	2,4-(CH ₃) ₂ -fenilo	
25	677	"	"	2,6-(CH ₃) ₂ -fenilo	
	678	"	"	2,4,6-(CH ₃) ₃ -fenilo	
30	679	"	"	2-CH ₃ O-fenilo	
	680	"	"	4-CH ₃ O-fenilo	
35	681	"	"	4-C ₂ H ₅ O-fenilo	
	682	"	"	4-CF ₃ O-fenilo	
40	683	"	"	4-CN-fenilo	
	684	"	"	3-NO ₂ -fenilo	
45	685	"	"	4-NO ₂ -fenilo	
	686	F	H	CH ₃	
50	687	"	"	C ₂ H ₅	
	688	"	"	n-C ₃ H ₇	
55	689	"	"	i-C ₃ H ₇	
	690	"	"	n-C ₄ H ₉	
60	691	"	"	i-C ₄ H ₉	
	692	"	"	s-C ₄ H ₉	
65					

ES 2 266 474 T3

693	"	"	t-C ₄ H ₉	
694	"	"	n-C ₅ H ₁₁	
695	"	"	n-C ₆ H ₁₃	
696	"	"	CH(C ₂ H ₅) ₂	
697	"	"	CH ₂ -t-Bu	
698	"	"	CH ₂ CF ₃	
699	"	"	C ₂ H ₄ CF ₃	
700	"	"	CF ₃	
701	"	"	C ₂ F ₅	
702	"	"	n-C ₃ F ₇	
703	"	"	n-C ₄ F ₉	
704	"	"	n-C ₅ F ₁₁	
705	"	"	n-C ₆ F ₁₃	
706	"	"	Fenilo	
707	"	"	2-F-fenilo	
708	"	"	3-F-fenilo	
709	"	"	4-F-fenilo	
710	"	"	2-Cl-fenilo	
711	"	"	3-Cl-fenilo	
712	"	"	4-Cl-fenilo	
713	"	"	2,4-Cl ₂ -fenilo	
714	"	"	3,4-Cl ₂ -fenilo	
715	"	"	2,5-Cl ₂ -fenilo	
716	"	"	2,6-Cl ₂ -fenilo	
717	"	"	2-CF ₃ -fenilo	

ES 2 266 474 T3

	718	"	"	3-CF ₃ -fenilo	
5	719	"	"	3,5-(CF ₃) ₂ -fenilo	
	720	"	"	4-CF ₃ -fenilo	
10	721	"	"	2-CH ₃ -fenilo	
	722	"	"	4-CH ₃ -fenilo	
15	723	"	"	2,4-(CH ₃) ₂ -fenilo	
	724	"	"	2,6-(CH ₃) ₂ -fenilo	
20	725	"	"	2,4,6-(CH ₃) ₃ -fenilo	
	726	"	"	2-CH ₃ O-fenilo	
25	727	"	"	4-CH ₃ O-fenilo	
	728	"	"	4-C ₂ H ₅ O-fenilo	
30	729	"	"	4-CF ₃ O-fenilo	
	730	"	"	4-CN-fenilo	
35	731	"	"	3-NO ₂ -fenilo	
	732	"	"	4-NO ₂ -fenilo	
40	733	Cl	H	CH ₃	
	734	"	"	C ₂ H ₅	
45	735	"	"	n-C ₃ H ₇	
	736	"	"	i-C ₃ H ₇	
50	737	"	"	n-C ₄ H ₉	
	738	"	"	i-C ₄ H ₉	
55	739	"	"	s-C ₄ H ₉	
	740	"	"	t-C ₄ H ₉	
60	741	"	"	n-C ₅ H ₁₃	
	742	"	"	n-C ₆ H ₁₃	
65					

ES 2 266 474 T3

5	743	"	"	CH(C ₂ H ₅) ₂	
	744	"	"	CH ₂ -t-Bu	
	745	"	"	CH ₂ CF ₃	
10	746	"	"	C ₂ H ₄ CF ₃	
	747	"	"	CF ₃	
15	748	"	"	C ₂ F ₅	
	749	"	"	n-C ₃ F ₇	
20	750	"	"	n-C ₄ F ₉	
	751	"	"	n-C ₅ F ₁₁	
25	752	"	"	n-C ₆ F ₁₃	
	753	"	"	Fenilo	
30	754	"	"	2-F-fenilo	
	755	"	"	3-F-fenilo	
35	756	"	"	4-F-fenilo	
	757	"	"	2-Cl-fenilo	
40	758	"	"	3-Cl-fenilo	
	759	"	"	4-Cl-fenilo	
45	760	"	"	2,4-Cl ₂ -fenilo	
	761	"	"	3,4-Cl ₂ -fenilo	
50	762	"	"	2,5-Cl ₂ -fenilo	
	763	"	"	2,6-Cl ₂ -fenilo	
55	764	"	"	2-CF ₃ -fenilo	
	765	"	"	3-CF ₃ -fenilo	
60	767	"	"	3,5-(CF ₃) ₂ -fenilo	
65	768	"	"	4-CF ₃ -fenilo	

ES 2 266 474 T3

5	769	"	"	2-CH ₃ -fenilo	
	770	"	"	4-CH ₃ -fenilo	
	771	"	"	2,4-(CH ₃) ₂ -fenilo	
10	772	"	"	2,6-(CH ₃) ₂ -fenilo	
	773	"	"	2,4,6-(CH ₃) ₃ -fenilo	
15	774	"	"	2-CH ₃ O-fenilo	
	776	"	"	4-CH ₃ O-fenilo	
20	777	"	"	4-C ₂ H ₅ O-fenilo	
	778	"	"	4-CF ₃ O-fenilo	
25	779	"	"	4-CN-fenilo	
	780	"	"	3-NO ₂ -fenilo	
30	781	"	"	4-NO ₂ -fenilo	
	782	CH ₃	H	CH ₃	
35	783	"	"	C ₂ H ₅	
	784	"	"	n-C ₃ H ₇	
40	785	"	"	i-C ₃ H ₇	
	786	"	"	n-C ₄ H ₉	
45	787	"	"	i-C ₄ H ₉	
	788	"	"	S-C ₄ H ₉	
50	789	"	"	t-C ₄ H ₉	
	790	"	"	n-C ₅ H ₁₁	
55	791	"	"	n-C ₆ H ₁₃	
	792	"	"	CH(C ₂ H ₅) ₂	
60	793	"	"	CH ₂ -t-Bu	
	794	"	"	CH ₂ CF ₃	
65					

ES 2 266 474 T3

795	"	"	$C_2H_4CF_3$	
5 796	"	"	CF_3	
797	"	"	C_2F_5	
10 798	"	"	n- C_3F_7	
799	"	"	n- C_4F_9	
15 800	"	"	n- C_5F_{11}	
801	"	"	n- C_6F_{13}	
20 802	"	"	Fenilo	
803	"	"	2-F-fenilo	
25 804	"	"	3-F-fenilo	
805	"	"	4-F-fenilo	
30 806	"	"	2-Cl-fenilo	
807	"	"	3-Cl-fenilo	
35 808	"	"	4-Cl-fenilo	
809	"	"	2,4- Cl_2 -fenilo	
40 810	"	"	3,4- Cl_2 -fenilo	
811	"	"	2,5- Cl_2 -fenilo	
45 812	"	"	2,6- Cl_2 -fenilo	
813	"	"	2- CF_3 -fenilo	
50 814	"	"	3- CF_3 -fenilo	
815	"	"	3,5- $(CF_3)_2$ -fenilo	
55 816	"	"	4- CF_3 -fenilo	
817	"	"	2- CH_3 -fenilo	
60 818	"	"	4- CH_3 -fenilo	
65 819	"	"	2,4- $(CH_3)_2$ -fenilo	

ES 2 266 474 T3

5	820	"	"	2,6-(CH ₃) ₂ -fenilo	
	821	"	"	2,4,6-(CH ₃) ₃ -fenilo	
	822	"	"	2-CH ₃ O-fenilo	
10	823	"	"	4-CH ₃ O-fenilo	
	824	"	"	4-C ₂ H ₅ O-fenilo	
15	825	"	"	4-CF ₃ O-fenilo	
	826	"	"	4-CN-fenilo	
20	827	"	"	3-NO ₂ -fenilo	
	828	"	"	4-NO ₂ -fenilo	
25	829	Br	H	CH ₃	
	830	"	"	C ₂ H ₅	
30	831	"	"	" n-C ₃ H ₇	
	832	"	"	i-C ₃ H ₇	
35	833	"	"	n-C ₄ H ₉	
	834	"	"	i-C ₄ H ₉	
40	835	"	"	s-C ₄ H ₉	
	836	"	"	t-C ₄ H ₉	
45	837	"	"	n-C ₅ H ₁₁	
	838	"	"	n-C ₆ H ₁₃	
50	839	"	"	CH(C ₂ H ₅) ₂	
	840	"	"	CH ₂ -t-Bu	
55	841	"	"	CH ₂ CF ₃	
	842	"	"	C ₂ H ₄ CF ₃	
60	843	"	"	CF ₃	
	844	"	"	C ₂ F ₅	
65					

ES 2 266 474 T3

845	"	"	n-C ₃ F ₇	
846	"	"	n-C ₄ F ₉	
847	"	"	n-C ₅ F ₁₁	
848	"	"	n-C ₆ F ₁₃	
849	"	"	Fenilo	
850	"	"	2-F-fenilo	
851	"	"	3-F-fenilo	
852	"	"	4-F-fenilo	
853	"	"	2-Cl-fenilo	
854	"	"	3-Cl-fenilo	
855	"	"	4-Cl-fenilo	
856	"	"	2,4-Cl ₂ -fenilo	
857	"	"	3,4-Cl ₂ -fenilo	
858	"	"	2,5-Cl ₂ -fenilo	
859	"	"	2,6-Cl ₂ -fenilo	
860	"	"	2-CF ₃ -fenilo	
861	"	"	3-CF ₃ -fenilo	
862	"	"	3,5-(CF ₃) ₂ -fenilo	
863	"	"	4-CF ₃ -fenilo	
864	"	"	2-CH ₃ -fenilo	
865	"	"	4-CH ₃ -fenilo	
866	"	"	2,4-(CH ₃) ₂ -fenilo	
867	"	"	2,6-(CH ₃) ₂ -fenilo	
868	"	"	2,4,6-(CH ₃) ₃ -fenilo	
869	"	"	2-CH ₃ O-fenilo	

870	"	"	4-CH ₃ O-fenilo	
871	"	"	4-C ₂ H ₅ O-fenilo	
872	"	"	4-CF ₃ O-fenilo	
873	"	"	4-CN-fenilo	
874	"	"	3-NO ₂ -fenilo	
875	"	"	4-NO ₂ -fenilo	

TABLA 4

Pirrolinas e imidazolininas de la fórmula (I), G = 5-isoxazolinilo

Ej.-Nr.	X ¹	X ²	Z	R ⁵	Datos físicos
876	F	F	CH ₂	CH ₃	
877	"	"	"	C ₂ H ₅	
878	"	"	"	n-C ₃ H ₇	
879	"	"	"	i-C ₃ H ₇	
880	"	"	"	n-C ₄ H ₉	
881	"	"	"	i-C ₄ H ₉	
882	"	"	"	s-C ₄ H ₉	
883	"	"	"	t-C ₄ H ₉	
884	"	"	"	n-C ₆ H ₁₃	
885	"	"	"	CH ₂ -t-Bu	
886	"	"	"	CF ₃	
887	"	"	"	C ₂ F ₅	

ES 2 266 474 T3

888	"	"	"	n-C ₃ F ₇	
889	"	"	"	n-C ₄ F ₉	
890	"	"	"	n-C ₅ F ₁₁	
891	"	"	"	n-C ₆ F ₁₃	
892	"	"	"	Fenilo	
893	"	"	"	2-F-fenilo	
894	"	"	"	3-F-fenilo	
895	"	"	"	4-F-fenilo	
896	"	"	"	2-Cl-fenilo	
897	"	"	"	3-Cl-fenilo	
898	"	"	"	4-Cl-fenilo	
899	"	"	"	2,4-Cl ₂ -fenilo	
900	"	"	"	3,4-Cl ₂ -fenilo	
901	"	"	"	2,5-Cl ₂ -fenilo	
902	"	"	"	2,6-Cl ₂ -fenilo	
903	"	"	"	2-CF ₃ -fenilo	
904	"	"	"	3-CF ₃ -fenilo	
905	"	"	"	3,5-(CF ₃) ₂ -fenilo	
906	"	"	"	4-CF ₃ -fenilo	
907	"	"	"	2-CH ₃ -fenilo	
908	"	"	"	4-CH ₃ -fenilo	
909	"	"	"	2,4-(CH ₃) ₂ -fenilo	
910	"	"	"	2,6-(CH ₃) ₂ -fenilo	
911	"	"	"	2,4,6-(CH ₃) ₃ -fenilo	
912	"	"	"	2-CH ₃ O-fenilo	

ES 2 266 474 T3

	913	"	"	"	4-CH ₃ O-fenilo	
5	914	"	"	"	4-C ₂ H ₅ O-fenilo	
	915	"	"	"	4-CF ₃ O-fenilo	
10	916	"	"	"	4-CN-fenilo	
	917	"	"	"	3-NO ₂ -fenilo	
15	918	"	"	"	4-NO ₂ -fenilo	
	919	F	H	CH ₂	CH ₃	
20	920	"	"	"	C ₂ H ₅	
	921	"	"	"	n-C ₃ H ₇	
25	922	"	"	"	i-C ₃ H ₇	
	923	"	"	"	n-C ₄ H ₉	
30	924	"	"	"	i-C ₄ H ₉	
	925	"	"	"	s-C ₄ H ₉	
35	926	"	"	"	t-C ₄ H ₉	
	927	"	"	"	n-C ₆ H ₁₃	
40	928	"	"	"	CH ₂ -t-Bu	
	929	"	"	"	CF ₃	
45	930	"	"	"	C ₂ F ₅	
	931	"	"	"	n-C ₃ F ₇	
50	932	"	"	"	n-C ₄ F ₉	
	933	"	"	"	n-C ₅ F ₁₁	
55	934	"	"	"	n-C ₆ F ₁₃	
	935	"	"	"	Fenilo	
60	936	"	"	"	2-F-fenilo	
	937	"	"	"	3-F-fenilo	
65						

ES 2 266 474 T3

	938	"	"	"	4-F-fenilo	
5	939	"	"	"	2-Cl-fenilo	
	940	"	"	"	3-Cl-fenilo	
10	941	"	"	"	4-Cl-fenilo	
	942	"	"	"	2,4-Cl ₂ -fenilo	
15	943	"	"	"	3,4-Cl ₂ -fenilo	
	944	"	"	"	2,5-Cl ₂ -fenilo	
20	945	"	"	"	2,6-Cl ₂ -fenilo	
	946	"	"	"	2-CF ₃ -fenilo	
25	947	"	"	"	3-CF ₃ -fenilo	
	948	"	"	"	3,5-(CF ₃) ₂ -fenilo	
30	949	"	"	"	4-CF ₃ -fenilo	
	950	"	"	"	2-CH ₃ -fenilo	
35	951	"	"	"	4-CH ₃ -fenilo	
	952	"	"	"	2,4-(CH ₃) ₂ -fenilo	
40	953	"	"	"	2,6-(CH ₃) ₂ -fenilo	
	954	"	"	"	2,4,6-(CH ₃) ₃ -fenilo	
45	955	"	"	"	2-CH ₃ O-fenilo	
	956	"	"	"	4-CH ₃ O-fenilo	
50	957	"	"	"	4-C ₂ H ₅ O-fenilo	
	958	"	"	"	4-CF ₃ O-fenilo	
55	959	"	"	"	4-CN-fenilo	
	960	"	"	"	3-NO ₂ -fenilo	
60	961	"	"	"	4-NO ₂ -fenilo	
65	962	F	Cl	CH ₂	CH ₃	

ES 2 266 474 T3

	963	"	"	"	C ₂ H ₅	
5	964	"	"	"	n-C ₃ H ₇	
	965	"	"	"	i-C ₃ H ₇	
10	966	"	"	"	n-C ₄ H ₉	
	967	"	"	"	i-C ₄ H ₉	
15	968	"	"	"	s-C ₄ H ₉	
	969	"	"	"	t-C ₄ H ₉	
20	970	"	"	"	n-C ₆ H ₁₃	
	071	"	"	"	CH ₂ -t-Bu	
25	972	"	"	"	CF ₃	
	973	"	"	"	C ₂ F ₅	
30	974	"	"	"	n-C ₃ F ₇	
	975	"	"	"	n-C ₄ F ₉	
35	976	"	"	"	n-C ₅ F ₁₁	
	977	"	"	"	n-C ₆ F ₁₃	
40	978	"	"	"	Fenilo	
	979	"	"	"	2-F-fenilo	
45	980	"	"	"	3-F-fenilo	
	981	"	"	"	4-F-fenilo	
50	982	"	"	"	2-Cl-fenilo	
	983	"	"	"	3-Cl-fenilo	
55	984	"	"	"	4-Cl-fenilo	
	985	"	"	"	2,4-Cl ₂ -fenilo	
60	986	"	"	"	3,4-Cl ₂ -fenilo	
	987	"	"	"	2,5-Cl ₂ -fenilo	
65						

ES 2 266 474 T3

	988	"	"	"	2,6-Cl ₂ -fenilo	
5	989	"	"	"	2-CF ₃ -fenilo	
	990	"	"	"	3-CF ₃ -fenilo	
10	991	"	"	"	3,5-(CF ₃) ₂ -fenilo	
	992	"	"	"	4-CF ₃ -fenilo	
15	993	"	"	"	2-CH ₃ -fenilo	
	994	"	"	"	4-CH ₃ -fenilo	
20	995	"	"	"	2,4-(CH ₃) ₂ -fenilo	
	996	"	"	"	2,6-(CH ₃) ₂ -fenilo	
25	997	"	"	"	2,4,6-(CH ₃) ₃ -fenilo	
	998	"	"	"	2-CH ₃ O-fenilo	
30	999	"	"	"	4-CH ₃ O-fenilo	
	1001	"	"	"	4-C ₂ H ₅ O-fenilo	
35	1002	"	"	"	4-CF ₃ O-fenilo	
	1003	"	"	"	4-CN-fenilo	
40	1004	"	"	"	3-NO ₂ -fenilo	
	1005	"	"	"	4-NO ₂ -fenilo	
45	1006	F	F	NCOOEt	CH ₃	
	1007	"	"	"	C ₂ H ₅	
50	1008	"	"	"	n-C ₃ H ₇	
	1009	"	"	"	i-C ₃ H ₇	
55	1010	"	"	"	n-C ₄ H ₉	
	1011	"	"	"	i-C ₄ H ₉	
60	1012	"	"	"	s-C ₄ H ₉	
	1013	"	"	"	t-C ₄ H ₉	
65						

ES 2 266 474 T3

	1014	"	"	"	n-C ₆ H ₁₃	
5	1015	"	"	"	CH ₂ -t-Bu	
	1016	"	"	"	CF ₃	
10	1017	"	"	"	C ₂ F ₅	
	1018	"	"	"	n-C ₃ F ₇	
15	1019	"	"	"	n-C ₄ F ₉	
	1020	"	"	"	n-C ₅ F ₁₁	
20	1021	"	"	"	n-C ₆ F ₁₃	
	1022	"	"	"	Fenilo	
25	1023	"	"	"	2-F-fenilo	
	1024	"	"	"	3-F-fenilo	
30	1025	"	"	"	4-F-fenilo	
	1026	"	"	"	2-Cl-fenilo	
35	1027	"	"	"	3-Cl-fenilo	
	1028	"	"	"	4-Cl-fenilo	
40	1029	"	"	"	2,4-Cl ₂ -fenilo	
	1030	"	"	"	3,4-Cl ₂ -fenilo	
45	1031	"	"	"	2,5-Cl ₂ -fenilo	
	1032	"	"	"	2,6-Cl ₂ -fenilo	
50	1033	"	"	"	2-CF ₃ -fenilo	
	1034	"	"	"	3-CF ₃ -fenilo	
55	1035	"	"	"	3,5-(CF ₃) ₂ -fenilo	
	1036	"	"	"	4-CF ₃ -fenilo	
60	1037	"	"	"	2-CH ₃ -fenilo	
	1038	"	"	"	4-CH ₃ -fenilo	
65						

ES 2 266 474 T3

1039	"	"	"	2,4-(CH ₃) ₂ -fenilo	
1040	"	"	"	2,6-(CH ₃) ₂ -fenilo	
1041	"	"	"	2,4,6-(CH ₃) ₃ -fenilo	
1042	"	"	"	2-CH ₃ O-fenilo	
1043	"	"	"	4-CH ₃ O-fenilo	
1044	"	"	"	4-C ₂ H ₅ O-fenilo	
1045	"	"	"	4-CF ₃ O-fenilo	
1046	"	"	"	4-CN-fenilo	
1047	"	"	"	3-NO ₂ -fenilo	
1048	"	"	"	4-NO ₂ -fenilo	

C. Ejemplos de formulación

- a) Un agente pulverizable se obtiene por mezcla de 10 partes en peso del producto activo y 90 partes en peso de talco como producto inerte y desmenuzado en un molino de masas.
- b) Se obtiene un polvo humectable, fácilmente dispersable en agua, por mezcla de 25 partes en peso del producto activo, 65 partes en peso de cuarzo que contiene caolín como producto inerte, 10 partes en peso de ligninsulfonato de potasio y 1 parte en peso de oleoilmetiltaurinato de sodio como agente humectante y dispersante y molienda en un molino de clavijas.
- c) Se obtiene un concentrado en dispersión, fácilmente dispersable en agua, por mezcla de 40 partes en peso de producto activo con 7 partes en peso de un semiéster del ácido sulfosuccínico, 2 partes en peso de una sal de sodio del ácido ligninsulfónico y 51 partes en peso de agua y molienda en un molino con bolas de rozamiento hasta una finura por debajo de 5 μ m.
- d) Puede obtenerse un concentrado emulsionable a partir de 15 partes en peso de producto activo, 75 partes en peso de ciclohexano como disolvente y 10 partes en peso de nonilfenol oxietileno (10 EO) como emulsionante.
- e) Se prepara un granulado a partir de 2 hasta 15 partes en peso de producto activo y de un material inerte para gránulos tal como attapulgita, granulados de piedra pómez y/o arena de cuarzo. Convenientemente se emplea una suspensión del polvo pulverizable del ejemplo b) con un contenido en materia sólida del 30% y se pulveriza dicha suspensión sobre la superficie de un granulado de attapulgita, se seca y se mezcla íntimamente. En este caso la proporción en peso del polvo pulverizable es del 5% aproximadamente y la del material de soporte inerte es del 95% del granulado acabado.

D. Ejemplos biológicos

Ejemplo 1

Efecto sobre la arañuela roja Tetranychus urticae

Se transfirieron tallos troceados con una hoja de plantas de judías (*Phaseolus vulgaris*) en frascos de vidrio marrón llenos con agua de la cañería y a continuación se cubrieron con aproximadamente 100 ácaros rojos (*Tetranychus urticae*). A continuación se sumergen la hoja de la planta y los ácaros durante 5 segundos en una solución acuosa del preparado a ser ensayado y formulado. Tras el escurrido de las gotas se almacenan las plantas y los animales en una cámara climatizada (16 horas luz/día, 25°C, humedad relativa del aire 40-60%). Al cabo de 6 días de almacenamiento se determina la mortalidad del preparado sobre todos los estadios de los ácaros rojos. A una concentración de 500 ppm

ES 2 266 474 T3

(referido al contenido en producto activo) provocan una mortalidad del 80 al 100% los preparados según los ejemplos Nr. 2, 5, 9, 10, 12, 22, 23, 32, 33, 35, 39, 41, 42, 43, 45, 46, 48, 49, 52, 63, 76, 79, 87, 90, 91, 92, 95, 96, 97, 99, 108, 110, 113, 117, 120, 569, 570, 573, 574, 576, 578, 579, 589, 600, 605, 619, 623, 624, 625, 626, 628, 629, 630, 631.

5 Ejemplo 2

Efecto sobre el pulgón Aphis fabae

Se transfieren tallos troceados con una hoja de plantas de judías (*Phaseolus vulgaris*) a frascos de vidrio marrón cargados con agua de la cañería y a continuación se cubren con aproximadamente 100 pulgones (*Aphis fabae*). La hoja de las plantas y los pulgones se sumergen a continuación durante 5 segundos en una solución acuosa del preparado a ser ensayado y formulado. Tras el escurrido de las gotas se disponen las plantas y los animales en una cámara climatizada (16 horas luz/día, 25°C, humedad relativa del aire 40-60%). Al cabo de 6 días de almacenamiento se determina la mortalidad del preparado sobre todos los estadios de los pulgones. A una concentración de 500 ppm (referido al contenido en producto activo) provocan una mortalidad del 80 al 100% los preparados según los ejemplos Nr. 96, 103.

Ejemplo 3

20 *Efecto sobre el estadio huevo-larvas de Heliothis virescens*

Se prepara una cápsula de Petri, cuyo fondo está cubierto con papel de filtro y que contiene aproximadamente 5 ml de medio nutriente. Se sumergen trozos de papel de filtro con aproximadamente 30 huevos de la polilla de la yema del tabaco americano (*Heliothis virescens*), con una edad de 24 horas, durante 5 segundos en una solución acuosa del preparado a ser ensayado y formulado y a continuación se disponen en las cápsulas de Petri. Se distribuyen otros 200 µl de la solución acuosa a través del medio nutriente. Una vez cerrada la cápsula de Petri, ésta se almacena aproximadamente a 25°C en una cámara climatizada. Al cabo de 6 días de almacenamiento se determina la mortalidad del preparado sobre los huevos y sobre las larvas eventualmente eclosionadas a partir de los mismos. A una concentración de 500 ppm (referido al contenido en producto activo) provocan una mortalidad del 80 - 100% los preparados según los ejemplos Nr. 5, 9, 20, 22, 28, 38, 45, 46, 48, 49, 52, 63, 94, 103, 116, 568, 567, 573, 579, 589, 619, 623.

Ejemplo 4

35 *Efecto sobre la ingestión en las larvas de mariposa de Heliothis virescens*

Se sumerge medio nutriente (tacos secados por liofilización) en una solución acuosa del preparado a ser ensayado y formulado y a continuación se disponen en una cápsula de Petri. A continuación se disponen diez larvas L2 de la polilla de la yema del tabaco americano (*Heliothis virescens*). A continuación se cierra la cápsula de Petri con una tapa. Al cabo de 4 días de almacenamiento a 23°C aproximadamente se determina el efecto del preparado sobre las larvas. A una concentración de 500 ppm (referido al contenido en producto activo) provocan una mortalidad del 80-100% de las larvas los preparados según los ejemplos Nr. 2, 9, 13, 20, 22, 28, 29, 30, 32, 35, 39, 40, 41, 42, 43, 45, 46, 48, 49, 52, 63, 76, 78, 91, 93, 94, 95, 98, 103, 114, 116, 117, 120, 121, 124, 125, 567, 573, 589, 600, 605, 613, 614, 615, 619, 621, 623, 624, 629,

45 Ejemplo 5

Efecto sobre la ingestión de larvas de mariposa de Spodoptera littoralis

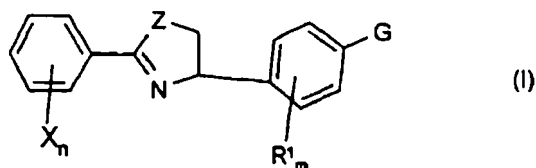
Se sumerge medio nutriente (tacos secados por liofilización) en una solución acuosa del preparado a ser ensayado y formulado y, a continuación, se disponen en una cápsula de Petri. A continuación se disponen diez larvas L2 del cogollero del algodón egipcio (*Spodoptera littoralis*). A continuación se cubre la cápsula de Petri con una tapa. Al cabo de 4 días de almacenamiento a 23°C aproximadamente se determina el efecto del preparado sobre las larvas. A una concentración de 500 ppm (referido al contenido en producto activo) provocan una mortalidad del 80-100% de las larvas los preparados según los ejemplos Nr. 5, 9, 12, 28, 29, 30, 35, 39, 40, 41, 42, 43, 45, 46, 48, 52, 63, 87, 90, 91, 92, 94, 97, 98, 99, 100, 103, 107, 113, 117, 120, 125, 566, 567, 573, 574, 589, 600, 613, 614, 619, 626.

60

65

REIVINDICACIONES

1. Derivados de arilisoaxazolina de la fórmula (I),



en la que los símbolos y los índices tienen los siguientes significados:

15 X son iguales o diferentes y significan

a) halógeno, ciano, nitro;

20 b) alquilo (con 1 a 4 átomos de carbono), alcoxi (con 1 a 4 átomos de carbono), alquiltio (con 1 a 4 átomos de carbono), alquilsulfino (con 1 a 4 átomos de carbono), estando substituidos los restos del grupo b, en caso dado, por uno o varios, preferentemente por uno, por dos o por tres restos del grupo de los halógenos;

25 R¹ son iguales o diferentes y significan halógeno, halógenoalquilo (con 1 a 4 átomos de carbono), alquilo (con 1 a 4 átomos de carbono), alcoxi (con 1 a 4 átomos de carbono), halógenoalcoxi (con 1 a 4 átomos de carbono) o ciano;

m significa 0, 1, 2, 3 o 4;

30 n significa 1, 2, 3, 4 o 5;

Z significa oxígeno, azufre, CH₂ o NR²;

35 R² significa CN, alcoxi (con 1 a 4 átomos de carbono)-alquilo (con 1 a 4 átomos de carbono), CHO, alquilcarbonilo (con 1 a 6 átomos de carbono), alcoxycarbonilo (con 1 a 6 átomos de carbono)- o (CW)NR³R⁴;

R³, R⁴ son iguales o diferentes y significan H, alquilo (con 1 a 6 átomos de carbono);

40 W significa O o S;

G significa



50 t significa 0,1,2 o 3;

R⁵ son iguales o diferentes y significan

a) halógeno, CN, NO₂

55 b) un grupo alquilo de cadena lineal o de cadena ramificada con 1 hasta 12 átomos de carbono, estando substituidos uno o varios grupos (CH₂), en caso dado, por -O-, -S(O)_{-0,1,2}-, -NH-, -NR⁶-, -CO-, -CS-, -CH=CH-, -C≡C-, aril-diilo, heterociclil-diilo, cicloalcanodiilo (con 3 a 8 átomos de carbono) o cicloalquendiilo (con 3 a 8 átomos de carbono), con la condición de que no pueden ser contiguos los chalcógenos, estando reemplazados, en caso dado, átomos individuales de halógeno por átomos de hidrógeno;

60 c) en el caso de dos restos, situados en α ± R⁵ significa también (=Y) donde Y significa (=O), (=S), (=NOR⁶) o (=CR₂⁶);

65 con la condición de que el o los restos R⁵ no contengan, en conjunto, mas de un sistema anular con cinco o más miembros;

ES 2 266 474 T3

R⁶ significa alquilo (con 1 a 4 átomos de carbono), fenilo o bencilo;

arilo es un resto carbocíclico aromático con 6 a 14 átomos de carbono;

5 heterociclilo es un sistema anular heteroaromático o heteroalifático, debiéndose entender por “sistema anular heteroaromático” un resto arilo, en el que está reemplazado, al menos, un grupo CH- por N y/o estando reemplazados, al menos, dos grupos CH- contiguos por S, NH u O y debiéndose entender por “sistema anular heteroalifático” un resto cicloalquilo (con 3 a 8 átomos de carbono), en el que está reemplazado, al menos, una unidad de carbono por O, S o por un grupo NR¹¹ y R¹¹ significa hidrógeno, alquilo (con 1 a 4 átomos de carbono), alcoxi (con 1 a 4 átomos de carbono) o arilo,

estando substituidos los restos cíclicos en la significado de R⁵, R⁶, en caso dado, por uno o varios restos del grupo formado por halógeno, ciano, nitro, amino, hidroxilo, tio, alquilo (con 1 a 4 átomos de carbono), halógenoalquilo (con 1 a 4 átomos de carbono), cicloalquilo (con 3 a 8 átomos de carbono), alcoxi (con 1 a 4 átomos de carbono), halógenoalcoxi (con 1 a 4 átomos de carbono), alquiltio (con 1 a 4 átomos de carbono), halógenoalquiltio (con 1 a 4 átomos de carbono), alquilamino (con 1 a 4 átomos de carbono), halógenoalquilamino (con 1 a 4 átomos de carbono) y alcanilo (con 1 a 4 átomos de carbono);

20 sus estereoisómeros puros en dobles enlaces, enantiómeros o diastereómeros así como sus mezclas,

sus N-óxidos sus sales adecuadas para el empleo como agentes pesticidas.

2. Compuesto de la fórmula (I) según la reivindicación 1, en la que los símbolos y los índices tienen los significados siguientes:

25 X significa halógeno, ciano, nitro, alquilo (con 1 a 4 átomos de carbono), halógenoalquilo (con 1 a 3 átomos de carbono), alcoxi (con 1 a 4 átomos de carbono) o halógenoalcoxi (con 1 a 3 átomos de carbono).

m significa 0 o 1.

30 n significa 1, 2 o 3.

Z significa oxígeno o CH₂.

35 R¹ significa H, halógeno, halógenoalquilo (con 1 a 4 átomos de carbono), alquilo (con 1 a 4 átomos de carbono), alcoxi (con 1 a 4 átomos de carbono) o halógenoalcoxi (con 1 a 4 átomos de carbono).

t significa 0, 1, 2 o 3;

40 R⁵ son iguales o diferentes y significan

a) halógeno, CN, NO₂

45 b) un grupo alquilo de cadena lineal o de cadena ramificada con 1 hasta 12 átomos de carbono, estando substituidos uno o varios grupos (CH₂), en caso dado, por -O-, -S(O)_{-0,1,2}-, -NH-, -NR⁶-, -CO-, -CS-, -CH=CH-, -C≡C-, aril-diilo, heterociclil-diilo, cicloalcanodiilo (con 3 a 8 átomos de carbono) o cicloalquenodiilo (con 3 a 8 átomos de carbono), con la condición de que no pueden ser contiguos los chalcógenos, estando reemplazados, en caso dado, átomos individuales de halógeno por átomos de hidrógeno;

50 c) en el caso de dos restos, situados en α , R⁵ significa también (=Y) donde Y significa (=O), (=S), (=NOR⁶) o (=CR₂⁶);

55 con la condición de que el o los restos R⁵ no contengan, en conjunto, más de un sistema anular con cinco o más miembros;

R⁶ significa alquilo (con 1 a 4 átomos de carbono), fenilo o bencilo;

arilo es un resto carbocíclico aromático con 6 a 14 átomos de carbono;

60 heterociclilo es un sistema anular heteroaromático o heteroalifático, debiéndose entender por “sistema anular heteroaromático” un resto arilo, en el que está reemplazado, al menos, un grupo CH- por N y/o estando reemplazados, al menos, dos grupos CH- contiguos por S, NH u O y debiéndose entender por “sistema anular heteroalifático” un resto cicloalquilo (con 3 a 8 átomos de carbono), en el que está reemplazado, al menos, una unidad de carbono por O, S o por un grupo NR¹¹ y R¹¹ significa hidrógeno, alquilo (con 1 a 4 átomos de carbono), alcoxi (con 1 a 4 átomos de carbono) o arilo,

65

ES 2 266 474 T3

estando substituidos los restos cíclicos en la significado de R⁵, R⁶, en caso dado, por uno o varios restos del grupo formado por halógeno, ciano, nitro, amino, hidroxí, tio, alquilo (con 1 a 4 átomos de carbono), halógenoalquilo (con 1 a 4 átomos de carbono), cicloalquilo (con 3 a 8 átomos de carbono), alcoxi (con 1 a 4 átomos de carbono), halógenoalcoxi (con 1 a 4 átomos de carbono), alquiltio (con 1 a 4 átomos de carbono), halógenoalquiltio (con 1 a 4 átomos de carbono), alquilamino (con 1 a 4 átomos de carbono), halógenoalquilamino (con 1 a 4 átomos de carbono) y alcanóilo (con 1 a 4 átomos de carbono) y

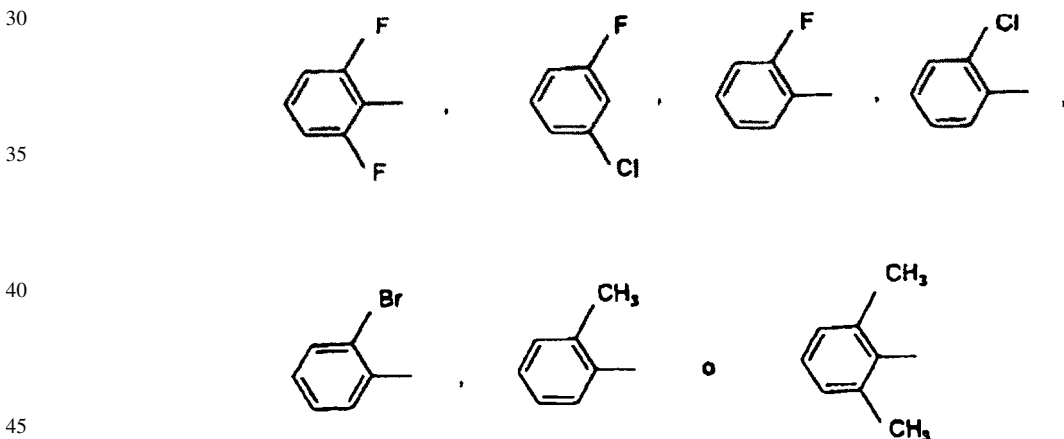
estando enlazado el anillo de isoxazolina en la posición 3 o en la posición 5 con el resto fenilo.

3. Compuesto según la reivindicación 2, en el que el grupo R⁵ tiene los significados siguientes:

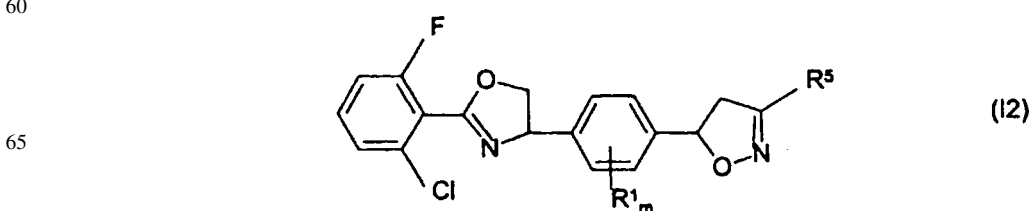
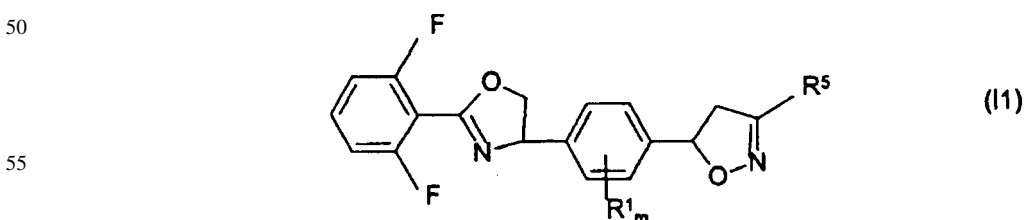
R⁵ significa CN, fenilo en caso dado substituido, fenoxi en caso dado substituido, alquilo (con 1 a 6 átomos de carbono), alquenoilo (con 1 a 6 átomos de carbono), halógenoalquilo (con 1 a 6 átomos de carbono), halógenoalquenoilo (con 1 a 6 átomos de carbono), alcanodiilo (con 1 a 6 átomos de carbono)-arilo, estando substituido, en caso dado, el grupo arilo, y estando substituido, en caso dado, una unidad -CH₂ por -C(O)-NR¹⁰-, NR¹⁰-(CO), NR¹⁰ u O.

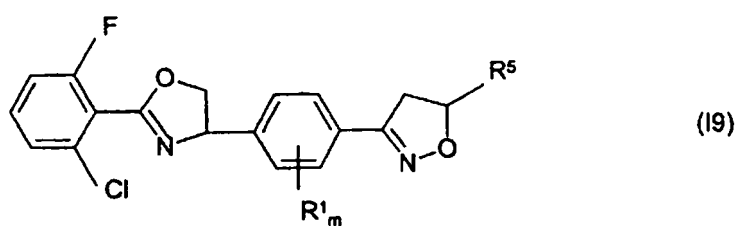
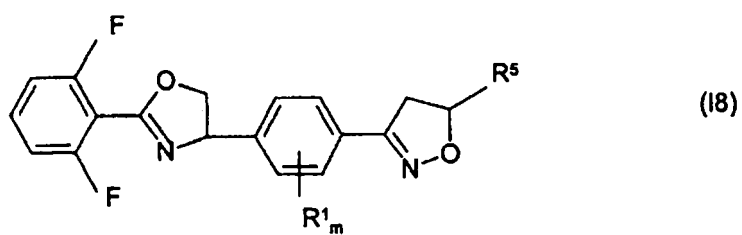
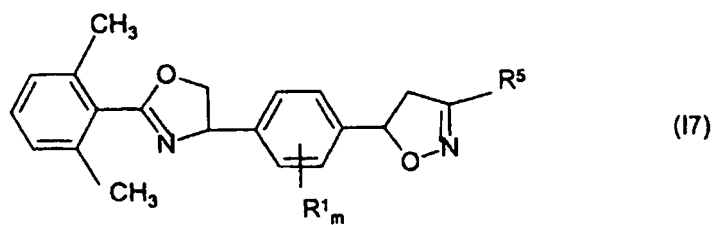
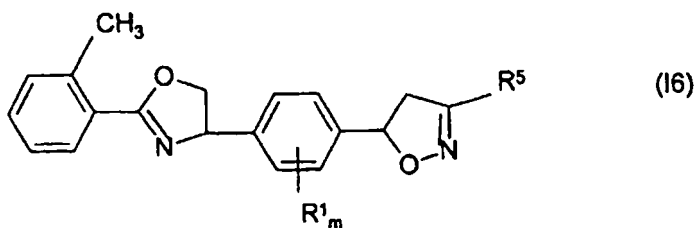
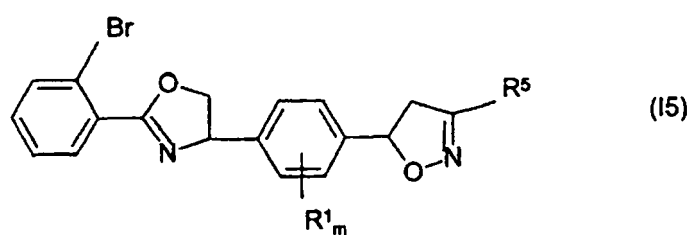
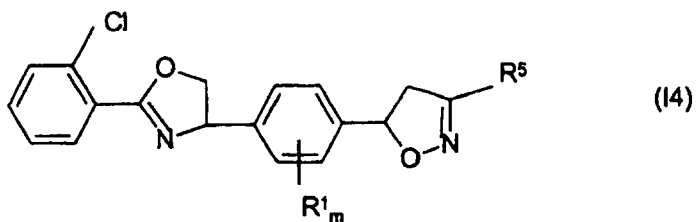
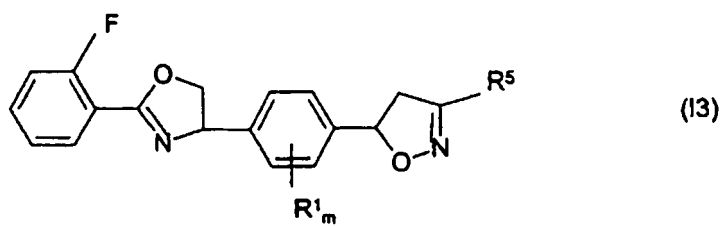
R¹⁰ significa H, alquilo (con 1 a 6 átomos de carbono), halógenoalquilo (con 1 a 6 átomos de carbono), fenilo substituido en caso dado, bencilo substituido en caso dado.

4. Compuestos según una o varias de las reivindicaciones 1 a 3, donde

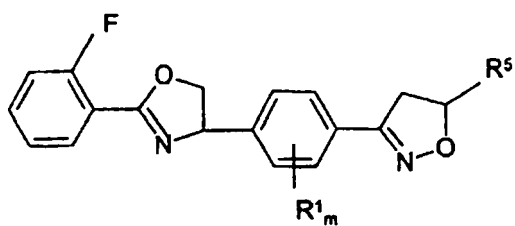


5. Compuestos según una o varias de las reivindicaciones 1 a 4, elegidos entre los grupos (I1) hasta (I28):



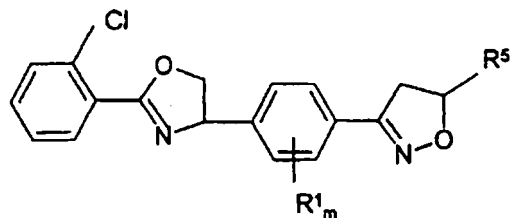


5



(I10)

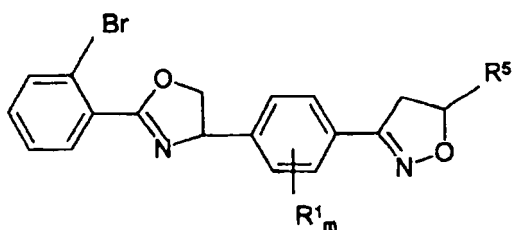
10



(I11)

15

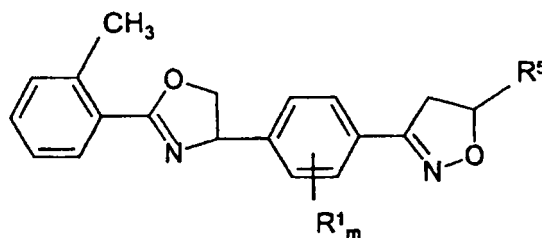
20



(I12)

25

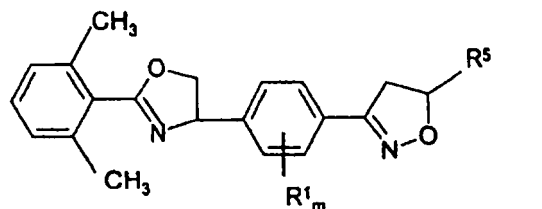
30



(I13)

35

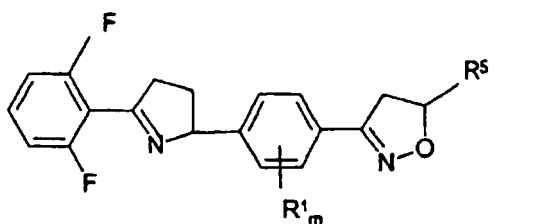
40



(I14)

45

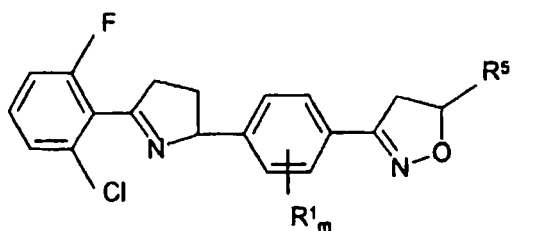
50



(I15)

55

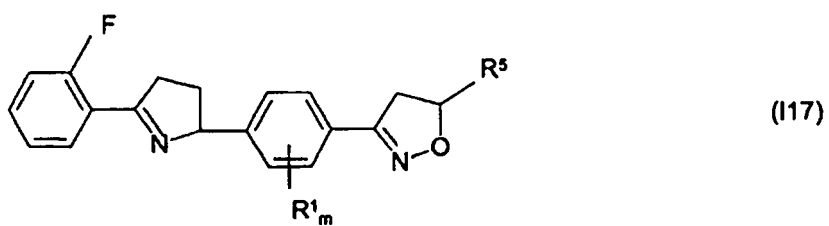
60



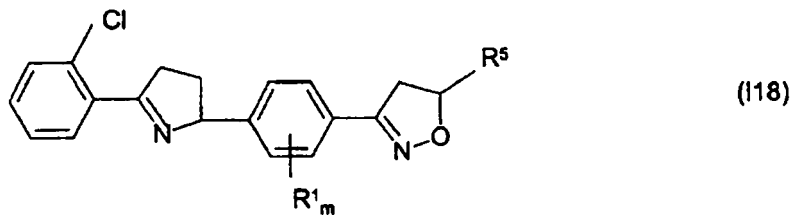
(I16)

65

5

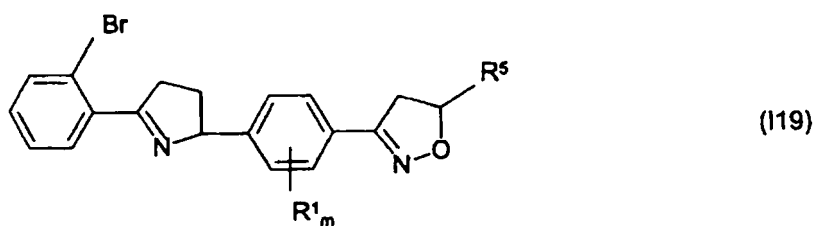


10



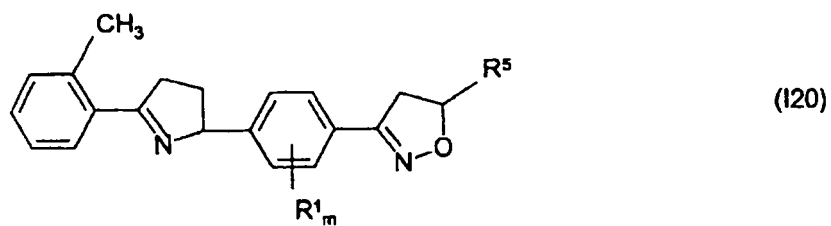
15

20



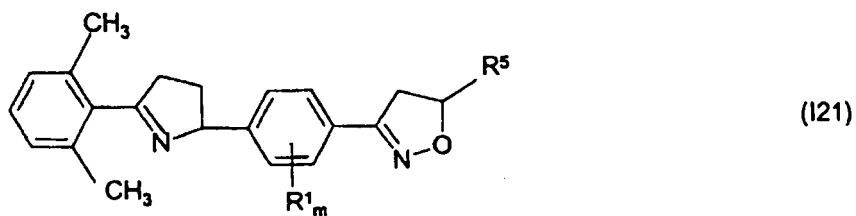
25

30



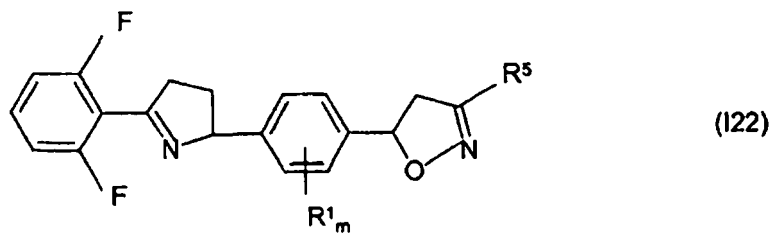
35

40



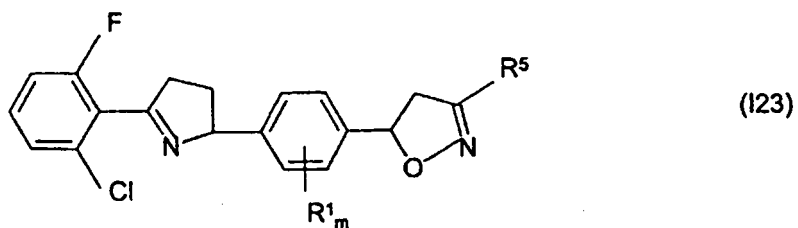
45

50

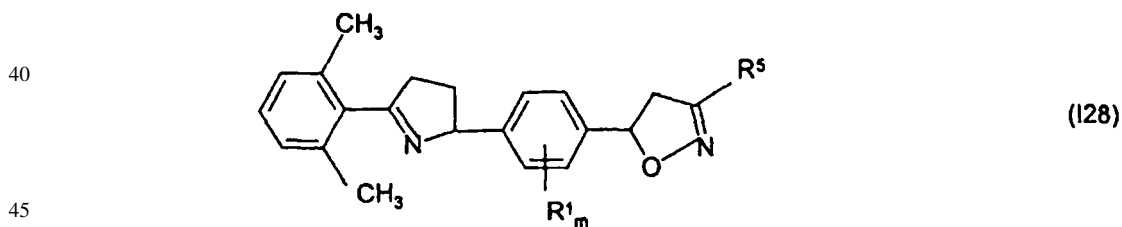
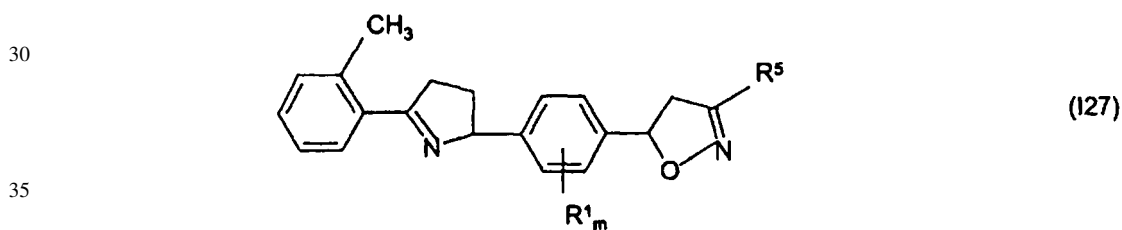
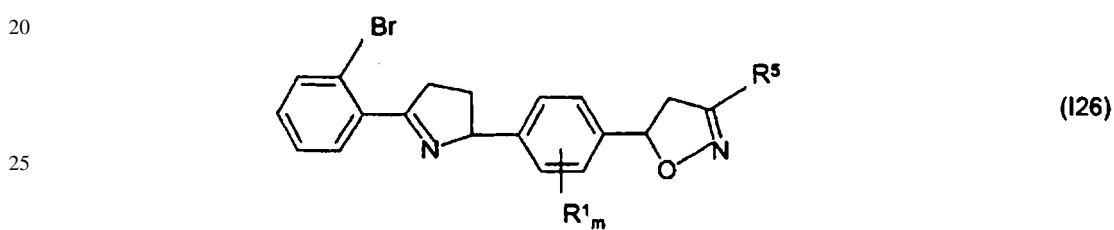
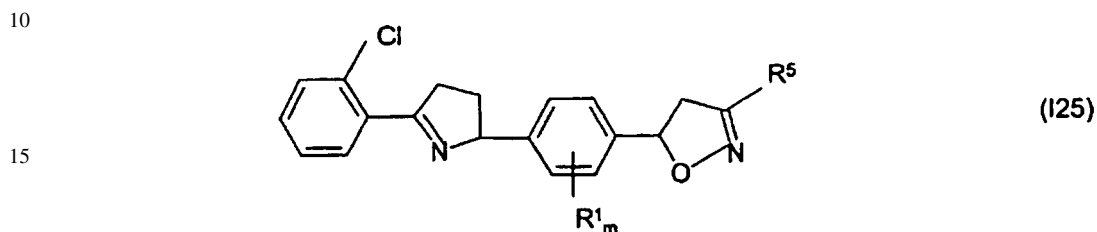
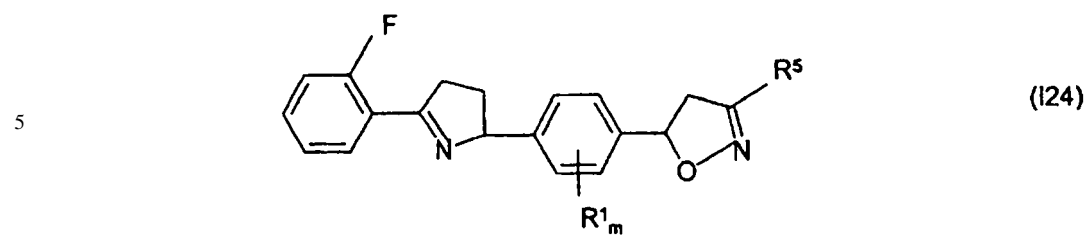


55

60



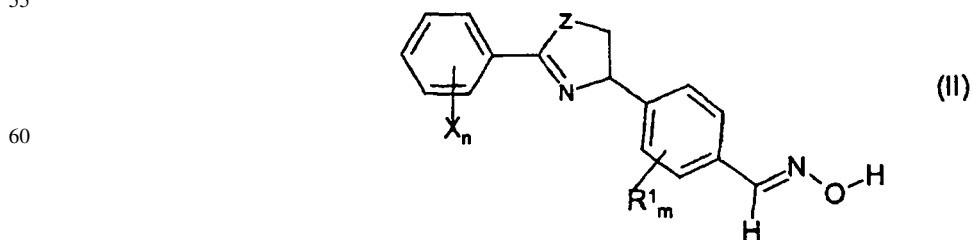
65



donde R^1_m y R^5 tienen los significados indicados en la reivindicación 2.

50 6. Procedimiento para la obtención de los compuestos de la fórmula (I) según una o varias de las reivindicaciones 1 a 5, en el que

a) para la obtención de los compuestos con un resto 3-isoxazolinilo se hace reaccionar una oxima de la fórmula (II),

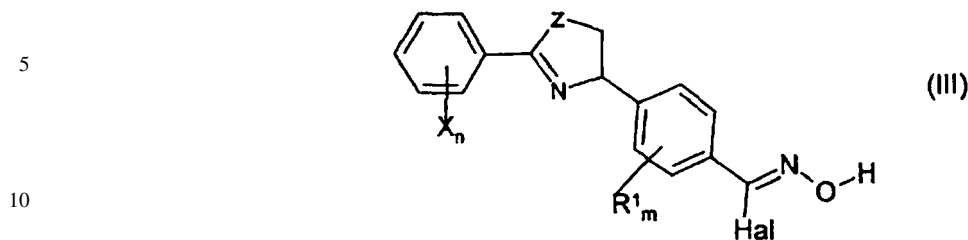


65 en la que

X y Z tienen los significados indicados en el caso de la fórmula (I),

ES 2 266 474 T3

con un agente de halogenación para dar un compuesto de la fórmula (III)



en la que

15 Hal significa halógeno,

y a continuación se hace reaccionar con una olefina de la fórmula (IV)

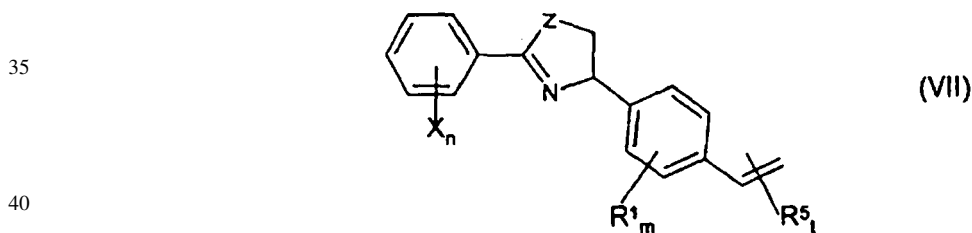


en la que

25 R⁵ y t tienen los significados indicados en la reivindicación 1;

o

30 b) para la obtención de los compuestos con un resto 5-isoxazinilo se hace reaccionar una olefina de la fórmula (VII),



en la que

45 Z y R⁵_t tienen los significados indicados en la reivindicación 2, con una halogenoxima de la fórmula (VIII),



en la que

55 R⁵ tiene los significados indicados en la reivindicación 2.

7. Agente pesticida, que contiene al menos un compuesto según una de las reivindicaciones 1 a 5 y al menos un producto auxiliar para la formulación.

60 8. Agente insecticida, acaricida y/o nematocida según la reivindicación 7, que contiene una cantidad activa de al menos un compuesto según una o varias de las reivindicaciones 1 a 5 junto con aditivos o productos auxiliares usuales para esta aplicación.

65 9. Agente pesticida, que contiene una cantidad insecticida, acaricida y/o nematocida activa de, al menos, un compuesto según una o varias de las reivindicaciones 1 a 5 y de, al menos, otro producto activo junto con agentes auxiliares y aditivos usuales para esta aplicación.

ES 2 266 474 T3

- 5 10. Agente para el empleo en la protección de la madera o como agente para la conservación en masas de sellado, en pinturas aplicables a brocha, en agentes lubricantes en frío para la elaboración de los metales o en aceites para la perforación y el corte, que contienen una cantidad activa de al menos un compuesto según una de las reivindicaciones 1 a 5, junto con productos auxiliares y aditivos usuales para estas aplicaciones.
11. Empleo de un compuesto según una o varias de las reivindicaciones 1 a 5 o de un agente según las reivindicaciones 7, 8 o 9 para la obtención de un medicamento para animales.
- 10 12. Procedimiento para la obtención de un agente según una o varias de las reivindicaciones 7 a 11, en el que se combinan el producto activo y los otros aditivos y se llevan a una forma de aplicación adecuada.
- 15 13. Empleo de un compuesto según una o varias de las reivindicaciones 1 a 5 o de un agente según una o varias de las reivindicaciones 7, 8 y 9 como agente para la protección de la madera, como agente para la conservación en agentes de sellado, en pinturas aplicables a brocha, en agentes lubricantes en frío para la elaboración de los metales y/o en aceites de perforación y de corte.
- 20 14. Empleo de compuestos según una o varias de las reivindicaciones 1 a 5 o de un agente según una de las reivindicaciones, 7, 8, 9 o 10, para la lucha contra los insectos dañinos, los ácaros, los moluscos y los nematodos.
- 25 15. Procedimiento para la lucha contra los insectos dañinos, los ácaros, los moluscos y/o los nematodos, en el que se ponen en contacto los organismos citados con una cantidad activa de uno o varios compuestos según una o varias de las reivindicaciones 1 a 5 o con un agente según una o varias de las reivindicaciones 7, 8, 9 o 10.
- 30 16. Procedimiento para la lucha contra los insectos dañinos, los ácaros, los moluscos y/o los nematodos según la reivindicación 15, en el que se aplica sobre los mismos o sobre las plantas, las superficies o los substratos atacados por los mismos, una cantidad activa de un compuesto según una de las reivindicaciones 1 a 5 o de un agente según una de las reivindicaciones 7, 8 o 9.
- 35 17. Semillas, que contienen o que están recubiertas con una cantidad activa de un compuesto según una de las reivindicaciones 1 a 5 o con un agente según una de las reivindicaciones 7, 8 o 9.
- 40
- 45
- 50
- 55
- 60
- 65