

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 910 854**

51 Int. Cl.:

C07D 487/04 (2006.01)

A01N 43/90 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **07.05.2018** **PCT/EP2018/061652**

87 Fecha y número de publicación internacional: **15.11.2018** **WO18206479**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **07.05.2018** **E 18724807 (5)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **19.01.2022** **EP 3621967**

54 Título: **Compuestos pesticidas bicíclicos**

30 Prioridad:

10.05.2017 EP 17170404

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

13.05.2022

73 Titular/es:

BASF SE (100.0%)
Carl-Bosch-Strasse 38
67056 Ludwigshafen am Rhein, DE

72 Inventor/es:

MCLAUGHLIN, MARTIN JOHN;
NARINE, ARUN;
VON DEYN, WOLFGANG y
GOCKEL, BIRGIT

74 Agente/Representante:

CARVAJAL Y URQUIJO, Isabel

Observaciones:

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

ES 2 910 854 T3

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

DESCRIPCIÓN

Compuestos pesticidas bicíclicos

5 La presente invención se refiere a compuestos bicíclicos sustituidos de la fórmula I como pesticidas agroquímicos. Además, la presente invención se refiere a procesos y compuestos intermedios para la preparación de compuestos de la fórmula I y a combinaciones de compuestos activos que los comprenden. Además, la presente invención se refiere a composiciones agrícolas o veterinarias que comprenden los compuestos de la fórmula I, y al uso de los compuestos de la fórmula I o composiciones que los comprenden para combatir o controlar plagas de invertebrados y/o para proteger

10 cultivos, plantas, material de propagación vegetal y/o plantas en crecimiento de ataque y/o infestación por plagas de invertebrados. La presente invención también se refiere a métodos para aplicar los compuestos de la fórmula I. Además, la presente invención se refiere a semillas que comprenden compuestos de acuerdo con la invención.

15 Las plagas de invertebrados y, en particular, insectos, arácnidos y nematodos destruyen cultivos y cosechas y atacan las viviendas de madera y estructuras comerciales, causando de esta manera grandes pérdidas económicas al suministro de alimentos y a los bienes. En consecuencia, existe la necesidad permanente de nuevos agentes para combatir plagas de invertebrados.

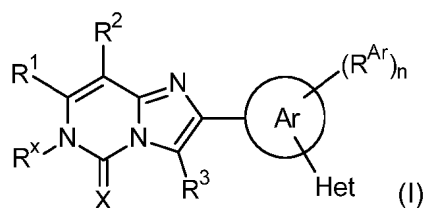
20 Se conocen heterociclos 5,6-fusionados para uso en pesticidas, por ejemplo, en las publicaciones de patente WO 2012/086848, WO 2013/180193 y WO 2014/119670 y representan una clase importante de insecticidas. Además, se hace referencia a las publicaciones WO 2017/043386, WO 2017/043386, WO 2017/025419, WO 2017/001314, y WO 2016/023954.

25 Debido a la capacidad de las plagas diana para desarrollar resistencia a agentes activos como pesticidas, existe la necesidad permanente de identificar otros compuestos, que sean adecuados para combatir plagas de invertebrados tal como insectos, arácnidos y nematodos. Además, existe la necesidad de nuevos compuestos que tengan una alta actividad pesticida y que muestren un amplio espectro de actividad contra un gran número de diferentes plagas de invertebrados, especialmente contra insectos, arácnidos y nematodos difíciles de controlar.

30 Por lo tanto, un objeto de la presente invención es identificar y proporcionar compuestos, que exhiban una alta actividad pesticida y tengan un amplio espectro de actividad contra plagas de invertebrados.

35 Se ha encontrado que estos objetos se pueden lograr mediante compuestos bicíclicos sustituidos de la fórmula I, tal como se ilustra y define posteriormente, incluidos sus estereoisómeros, sus sales, en particular sus sales aceptables desde el punto de vista agrícola o veterinario, sus tautómeros y sus N-óxidos.

En un primer aspecto, la presente invención se refiere al compuesto bicíclico de la fórmula I,



40 en donde

X es O o S;

45 R^x se selecciona del grupo que consiste de C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alcoxi, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalcoxi-C₁-C₄-alquilo, que están insustituídos o sustituidos con halógeno, C(O)-OR^a, NR^bR^c, C₁-C₆-alquilen-NR^bR^c, O-C₁-C₆-alquilen-NR^bR^c, C₁-C₆-alquilen-CN, NH-C₁-C₆-alquilen-NR^bR^c, C(O)-NR^bR^c, C(O)-R^d, SO₂NR^bR^c, S(=O)_mR^e, fenilo y bencilo, en donde el anillo de fenilo está insustituído o sustituido con radicales R^f;

50 R¹ es H, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalcoxi, C₁-C₆-alquilsulfenilo, C₁-C₆-alquilsulfenilo, o C₁-C₆-alquilsulfonilo que están sustituidos o insustituidos con halógeno;

55 R², R³ se seleccionan independientemente entre sí del grupo que consiste de H, halógeno, N₃, CN, NO₂, -SCN, -SF₅, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alquenilo, tri-C₁-C₆-alquilsililo, C₂-C₆-alquinilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alcoxi, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalcoxi, C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalcoxi-C₁-C₄-alquilo, que están insustituídos o sustituidos con halógeno, C(O)-OR^a, NR^bR^c, C₁-C₆-alquilen-NR^bR^c, O-C₁-C₆-alquilen-NR^bR^c, C₁-C₆-alquilen-CN, NH-C₁-C₆-alquilen-NR^bR^c, C(O)-NR^bR^c, C(O)-R^d, SO₂NR^bR^c y S(=O)_mR^e, un radical puede ser también fenilo,

fenoxi, fenilcarbonilo, feniltio o bencilo, en donde el anillo de fenilo está insustituido o sustituido con radicales R^f;

Ar es fenilo o heteroarilo de 5 o 6 miembros,

- 5 R^{Ar} se selecciona, independientemente entre sí del grupo que consiste de halógeno, N₃, OH, CN, NO₂, -SCN, -SF₅, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alqueno, tri-C₁-C₆-alquilsililo, C₂-C₆-alquino, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alcoxi, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalcoxi, C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalcoxi-C₁-C₄-alquilo, que están insustituidos o sustituidos con halógeno, C(O)-OR^a, NR^bR^c, C₁-C₆-alquilen-NR^bR^c, O-C₁-C₆-alquilen-NR^bR^c, C₁-C₆-alquilen-CN, NH-C₁-C₆-alquilen-NR^bR^c, C(O)-NR^bR^c, C(O)-R^d, SO₂NR^bR^c y S(=O)_mR^e, un radical puede ser también fenilo, fenoxi, fenilcarbonilo, feniltio o bencilo, en donde el anillo de fenilo está insustituido o sustituido con radicales R^f;

Het es heteroarilo de 5 o 6 miembros o heterociclilo de 5 o 6 miembros, que está insustituido o sustituido con R;

- 15 R es halógeno, oxo (=O), N₃, OH, CN, NO₂, SCN, SF₅, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquino, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₆-alcoxycarbonilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalcoxi, C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalcoxi-C₁-C₄-alquilo, fenilo, heteroarilo de 5 o 6 miembros, o heterociclilo de 5 o 6 miembros, en donde los grupos cíclicos de R están insustituidos o sustituidos con radicales R^f; siempre que R^{Ar} y Het no estén presentes en el mismo átomo de Ar;

- 20 cada R^a se selecciona de H, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquino, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalcoxi-C₁-C₄-alquilo, que están insustituidos o sustituidos con halógeno, C₁-C₆-alquilen-NR^bR^c, C₁-C₆-alquilen-CN, fenilo y bencilo, en donde el anillo de fenilo está insustituido o sustituido con radicales R^f;

- 25 cada R^b se selecciona de H, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquino, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalcoxi-C₁-C₄-alquilo, que están insustituidos o sustituidos con halógeno, -(C=O)R, -(C=O)OR, y -(C=O)NR, C₁-C₆-alquilen-CN, fenilo y bencilo, en donde el fenilo está insustituido o sustituido con radicales R^f;

- 30 cada R^c se selecciona de H, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquino, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalcoxi-C₁-C₄-alquilo, que están insustituidos o sustituidos con halógeno, C₁-C₆-alquilen-CN, fenilo y bencilo, en donde el anillo de fenilo está insustituido o sustituido con radicales R^f;

- 35 cada porción NR^bR^c también puede formar un heterociclo saturado de 3 a 8 miembros unido a N, que además del átomo de nitrógeno puede tener 1 o 2 heteroátomos o porciones de heteroátomo adicionales seleccionadas de O, S(=O)_m y N-R', en donde R' es H o C₁-C₆-alquilo y en donde el heterociclo unido a N está insustituido o sustituido con radicales seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi;

- 40 cada R^d se selecciona de H, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquino, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalcoxi-C₁-C₄-alquilo, que están insustituidos o sustituidos con halógeno, fenilo y bencilo, en donde el anillo de fenilo está insustituido o sustituido con radicales R^f;

- 45 cada R^e se selecciona de C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₄-alquilo, que están insustituidos o sustituidos con halógeno, fenilo y bencilo, en donde el anillo de fenilo está insustituido o sustituido con R^f;

- 50 cada R^f se selecciona de halógeno, N₃, OH, CN, NO₂, SCN, SF₅, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquino, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alcoxi, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalcoxi, C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalcoxi-C₁-C₄-alquilo, que están insustituidos o sustituidos con halógeno;

- 55 m es 0, 1 o 2;

n es 0, 1 o 2;

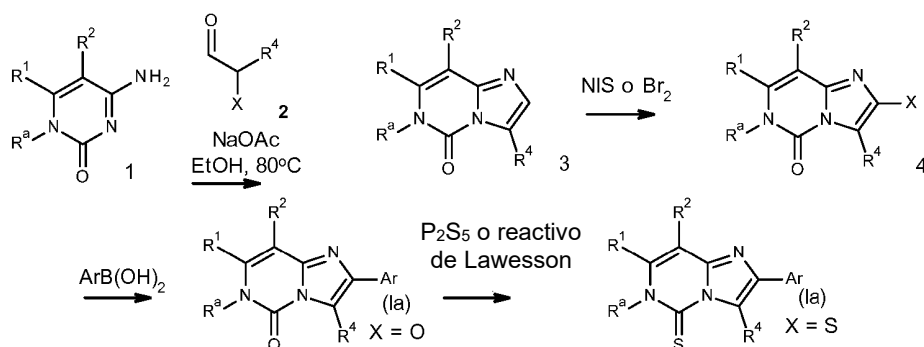
y los N-óxidos, estereoisómeros, tautómeros y sales aceptables desde el punto de vista agrícola o veterinario del mismo.

- 60 Con la debida modificación de los compuestos de inicio, los compuestos de la fórmula I se pueden preparar mediante procedimientos como se indica en los esquemas posteriormente.

- 65 6H-imidazo[1,2-c]pirimidin-5-ona la (X = S) se puede preparar en síntesis de 4 pasos a partir de citidinas 1 (Esquema 1). La condensación de las citidinas 1 con alfa-haloaldehídos 2 por analogía con el método descrito en Jansa et al. Journal of Heterocyclic Chemistry, 52(5), 1382-1389; 2015 conduce a biclos 3, que se pueden halogenar, por ejemplo, con NIS o NBS, por analogía con el método descrito en Jansa et al. Tetrahedron, 71(1), 27-36; 2015. Los haluros 4 a su vez se pueden someter a una reacción de acoplamiento de Suzuki con un ácido arilborónico para formar 6H-imidazo[1,2-c]pirimidin-5-onas la (X = O) por analogía con el método descrito en Lee et al. Solicitud Internacional PCT., 2009093981, 30 de jul de 2009. Finalmente, la reacción de los compuestos la (X = O) con un agente de tiolización tal como P2S5 o reactivo de Lawesson proporcionará fácilmente los compuestos la (X = S) por analogía con el método descrito en Bigot et

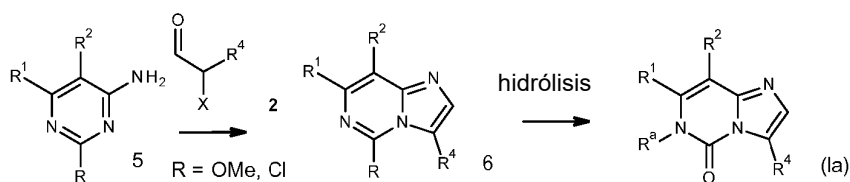
al. Solicitud internacional PCT., 2015052103, 16 de abril de 2015. La preparación de citidina 1 sustituida con trifluorometilo ($R^1 = CF_3$, $R^2 = H$, $R^a = H$) se ha preparado previamente (Gershon et al. Journal of Heterocyclic Chemistry, 20(1), 219-23; 1983).

Esquema 1



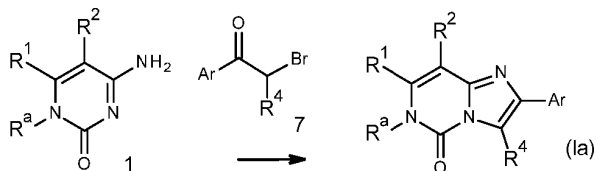
De manera alternativa, los compuestos 6 se pueden preparar mediante condensación de aminopiridinas 5 con un aldehído 2 por analogía con respecto al método descrito en Wade et al. U.S., 4503050, 5 de marzo de 1985 (Esquema 2). La hidrólisis del grupo cloro o metoxi en los compuestos 6 ($R = Cl$, OMe) bajo condiciones conocidas en la literatura puede proporcionar los compuestos (la).

Esquema 2



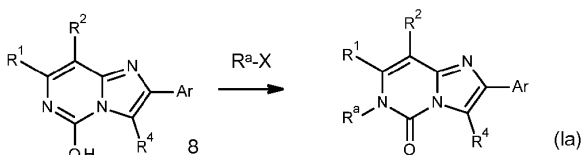
La condensación directa de alfa-halo-alfa-cetonas (por ejemplo, 7) y citidinas 1 puede proporcionar directamente los compuestos (la) por analogía al método descrito en Meng et al. Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, 23(10), 2863-2867; 2013 (Esquema 3).

Esquema 3



Los compuestos la se pueden preparar por N-alcalinización de los compuestos 8 con un agente de alquilación R^a-X por analogía al método descrito en Martin-Martin et al. Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, 25(6), 1310-1317; 2015 (Esquema 4).

Esquema 4



Los procedimientos descritos anteriormente se pueden usar individualmente o en combinación entre sí para obtener los compuestos de la fórmula I.

5 Los materiales de inicio necesarios para preparar los compuestos de la fórmula I están disponibles comercialmente o se pueden preparar de acuerdo con los procedimientos conocidos en la literatura.

Las mezclas de reacción se elaboran de una manera habitual, por ejemplo, al mezclar con agua, separar las fases y, si corresponde, por purificación cromatográfica de los productos crudos.

10 Algunos de los compuestos intermedios y productos finales se obtienen en forma de aceites viscosos incoloros o ligeramente marrones que se purifican o liberan de componentes volátiles bajo presión reducida y a temperatura moderadamente elevada. Si los productos finales y compuestos intermedios se obtienen como sólidos, la purificación también se puede llevar a cabo por recristalización o digestión.

15 Si los compuestos individuales de la fórmula I no se pueden obtener por las vías descritas anteriormente, se pueden preparar mediante derivatización de otros compuestos de la fórmula I o compuestos intermedios de la misma.

20 Si la síntesis produce mezclas de isómeros, en general no se requiere necesariamente una separación, ya que en algunos casos los isómeros individuales se pueden interconvertir durante el procesamiento para su uso o durante la aplicación (por ejemplo, bajo la acción de la luz, ácidos o bases). Estas conversiones también pueden tener lugar después del uso, por ejemplo, en el tratamiento de plantas en la planta tratada, o en el hongo dañino que se va a controlar.

25 Un experto en la técnica entenderá fácilmente que las preferencias para los sustituyentes, también en particular las que se proporcionan en las tablas posteriormente para los sustituyentes respectivos, que se proporcionan en la presente en relación con los compuestos se aplican a los compuestos intermedios en consecuencia. De este modo, los sustituyentes en cada caso tienen independientemente entre sí o más preferentemente en combinación los significados como se definen en la presente. Los procedimientos descritos anteriormente se pueden usar individualmente o en combinación entre sí para obtener compuestos de la fórmula I.

30 Los N-óxidos se pueden preparar a partir de los compuestos de la invención de acuerdo con métodos de oxidación convencionales, por ejemplo, al tratar los compuestos I con un perácido orgánico tal como ácido metacloroperbenzoico (cf. WO 03/64572 o J. Med. Chem. 38(11), 1892-903, 1995); o con agentes oxidantes inorgánicos tal como peróxido de hidrógeno (cf. J. Heterocyc. Chem. 18(7), 1305-8, 1981) u oxona (cf. J. Am. Chem. Soc. 123(25), 5962-5973, 2001). La oxidación puede conducir a mono-N-óxidos puros o a una mezcla de diferentes N-óxidos, que se pueden separar mediante métodos convencionales tal como cromatografía.

35 A menos que se indique lo contrario, el término "compuesto(s) de acuerdo con la invención" o "compuesto(s) de la invención" o "compuesto(s) de la fórmula (I)", se refiere a los compuestos de la fórmula I.

40 El término "compuesto(s) de acuerdo con la invención", o "compuestos de la fórmula I" comprende los compuestos como se definen en la presente, así como un estereoisómero, sal, tautómero o N-óxido de los mismos. El término "compuesto(s) de la presente invención" se debe entender como equivalente al término "compuesto(s) de acuerdo con la invención", por lo tanto también comprende un estereoisómero, sal, tautómero o N-óxido de los mismos.

45 El término "composición(es) de acuerdo con la invención" o "composición(es) de la presente invención" comprende composición(es) que comprenden al menos un compuesto de la fórmula I de acuerdo con la invención como se definió anteriormente. Las composiciones de la invención son preferentemente composiciones agrícolas o veterinarias.

50 Dependiendo del patrón de sustitución, los compuestos de acuerdo con la invención pueden tener uno o más centros de quiralidad, en cuyo caso están presentes como mezclas de enantiómeros o diastereómeros. La invención proporciona tanto los enantiómeros puros simples y los diastereómeros puros de los compuestos de acuerdo con la invención, como sus mezclas y el uso de acuerdo con la invención de los enantiómeros puros o diastereómeros puros de los compuestos de acuerdo con la invención o sus mezclas. Los compuestos adecuados de acuerdo con la invención también incluyen todos los estereoisómeros geométricos posibles (isómeros cis/trans) y mezclas de los mismos. Los isómeros cis/trans pueden estar presentes con respecto a un grupo alquileo, doble enlace carbono-nitrógeno o amida. El término "estereoisómero(s)" abarca tanto isómeros ópticos, tal como enantiómeros o diastereómeros, este último existente debido a más de un centro de quiralidad en la molécula, así como isómeros geométricos (isómeros cis/trans). La presente invención se refiere a cada posible estereoisómero de los compuestos de la fórmula I, es decir, a enantiómeros individuales o diastereómeros, así como a mezclas de los mismos.

60 Los compuestos de acuerdo con la invención pueden ser amorfos o pueden existir en uno o más estados cristalinos diferentes (polimorfos) que pueden tener diferentes propiedades macroscópicas tal como estabilidad o mostrar diferentes propiedades biológicas tal como actividades. La presente invención se refiere a compuestos amorfos y cristalinos de acuerdo con la invención, mezclas de diferentes estados cristalinos de los compuestos respectivos de acuerdo con la invención, así como sales amorfas o cristalinas de los mismos.

65

Las sales de los compuestos de acuerdo con la invención son preferentemente sales aceptables desde el punto de vista agrícola y/o veterinario, preferentemente sales aceptables desde el punto de vista agrícola. Se pueden formar de una manera habitual, por ejemplo, al hacer reaccionar el compuesto con un ácido del anión en cuestión si los compuestos de acuerdo con la invención tienen una funcionalidad básica o al hacer reaccionar los compuestos ácidos de acuerdo con la invención con una base adecuada.

Las sales útiles veterinarias y/o agrícolas de los compuestos de acuerdo con la invención abarcan especialmente las sales de adición de ácido de aquellos ácidos cuyos cationes y aniones, respectivamente, no tienen ningún efecto adverso sobre la acción pesticida de los compuestos de acuerdo con la invención.

Los cationes adecuados son en particular los iones de los metales alcalinos, preferentemente Li, Na y K, de los metales alcalinotérreos, preferentemente Ca, Mg y Ba, y de los metales de transición, preferentemente Mn, Cu, Zn y Fe, y también amonio (NH_4^+) y amonio sustituido en el que de uno a cuatro de los átomos de H se reemplazan por C_1 - C_4 -alquilo, C_1 - C_4 -hidroxialquilo, C_1 - C_4 -alcoxi, C_1 - C_4 -alcoxi- C_1 - C_4 -alquilo, hidroxi- C_1 - C_4 -alcoxi- C_1 - C_4 -alquilo, fenilo o bencilo. Los ejemplos de iones de amonio sustituidos comprenden metilamonio, isopropilamonio, dimetilamonio, diisopropilamonio, trimetilamonio, tetrametilamonio, tetraetilamonio, tetrabutilamonio, 2-hidroxietilamonio, 2-(2-hidroxietoxi)etil-amonio, bis(2-hidroxietil)amonio, benziltrimetilamonio y benziltriethylamonio, además de iones de fosfonio, iones de sulfonio, preferentemente tri(C_1 - C_4 -alquil)sulfonio y iones de sulfoxonio, preferentemente tri(C_1 - C_4 -alquil)sulfoxonio.

Los aniones de sales de adición de ácido útiles son principalmente cloruro, bromuro, fluoruro, hidrogensulfato, sulfato, fosfato diácido, fosfato ácido, fosfato, nitrato, bicarbonato, carbonato, hexafluorosilicato, hexafluorofosfato, benzoato y los aniones de ácidos C_1 - C_4 -alcanoicos, preferentemente formiato, acetato, propionato y butirato. Se pueden formar al hacer reaccionar compuestos de acuerdo a la invención con un ácido del anión correspondiente, preferentemente de ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico o ácido nítrico.

El término "N-óxido" incluye cualquier compuesto de la presente invención que tiene al menos un átomo de nitrógeno terciario que se oxida a una porción de N-óxido.

Las porciones orgánicas mencionadas en las definiciones anteriores de las variables son, como el término halógeno, términos colectivos para listados individuales de los miembros individuales del grupo. El prefijo C_n - C_m indica en cada caso el número posible de átomos de carbono en el grupo.

El término "halógeno" denota en cada caso F, Br, Cl o I, en particular F, Br o Cl.

El término "alquilo" como se usa en la presente y en las porciones alquilo de alquilamino, alquilcarbonilo, alquiltio, alquilsulfonilo, alquilsulfonilo y alcoxialquilo denota en cada caso un grupo alquilo de cadena recta o ramificada que tiene en general de 1 a 10 átomos de carbono, con frecuencia de 1 a 6 átomos de carbono, preferentemente 1 a 4 átomos de carbono, más preferentemente de 1 a 3 átomos de carbono. Los ejemplos de un grupo alquilo son CH_3 , C_2H_5 , n-propilo, iso-propilo, n-butilo, 2-butilo, iso-butilo, terc-butilo, n-pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-dimetilpropilo, 1-etilpropilo, n-hexilo, 1,1-dimetilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, 1-metilpentilo, 2-metilpentilo, 3-metilpentilo, 4-metilpentilo, 1,1-dimetilbutilo, 1,2-dimetilbutilo, 1,3-dimetilbutilo, 2,2-dimetilbutilo, 2,3-dimetilbutilo, 3,3-dimetilbutilo, 1-etilbutilo, 2-etilbutilo, 1,1,2-trimetilpropilo, 1,2,2-trimetilpropilo, 1-etil-1-metilpropilo, y 1-etil-2-metilpropilo.

El término "haloalquilo" como se usa en la presente y en las porciones haloalquilo de haloalquilcarbonilo, haloalcoxycarbonilo, haloalquiltio, haloalquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, haloalcoxi y haloalcoxialquilo, denota en cada caso un grupo alquilo de cadena recta o ramificada que tiene usualmente de 1 a 6 átomos de carbono, preferentemente de 1 a 4 átomos de carbono, en donde los átomos H de este grupo se reemplazan parcial o completamente con átomos de halógeno. Las porciones haloalquilo preferidas se seleccionan de C_1 - C_4 -haloalquilo, más preferentemente de C_1 - C_3 -haloalquilo o C_1 - C_2 -haloalquilo, en particular de C_1 - C_2 -fluoroalquilo tal como fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, pentafluoroetilo y similares.

El término "alcoxi", tal como se usa en la presente, denota en cada caso un grupo alquilo de cadena recta o ramificada que se une mediante un átomo de oxígeno y en general tiene de 1 a 6 átomos de carbono, preferentemente de 1 a 4 átomos de carbono. Los ejemplos de un grupo alcoxi son metoxi, etoxi, n-propoxi, iso-propoxi, n-butiloxi, 2-butiloxi, iso-butiloxi, ter-butiloxi y similares.

El término "alcoxialquilo" como se usa en la presente se refiere a alquilo que en general comprende 1 a 4, preferentemente 1 a 2 átomos de carbono, en donde 1 átomo de carbono lleva un radical alcoxi que en general comprende 1 a 4, preferentemente 1 o 2 átomos de carbono como se definió anteriormente. Los ejemplos son CH_2OCH_3 , $\text{CH}_2\text{-OC}_2\text{H}_5$, 2-(metoxi)etilo y 2-(etoxi)etilo.

El término "haloalcoxi" tal como se usa en la presente denota en cada caso un grupo alcoxi de cadena recta o ramificada que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, preferentemente 1 a 4 átomos de carbono, en donde los átomos de H de este grupo se reemplazan parcial o totalmente con átomos de halógeno, en particular átomos de flúor. Las porciones haloalcoxi preferidas incluyen C_1 - C_4 -haloalcoxi, en particular C_1 - C_2 -fluoroalcoxi, tal como fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, 1-fluoroetoxi, 2-fluoroetoxi, 2,2-difluoroetoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2-fluoroetoxi, 2-cloro-2,2-difluoroetoxi, 2,2-dicloro-

2-fluoroetoxi, 2,2,2-tricloroetoxi, pentafluoroetoxi y similares.

El término "alquiltio" (alquilsulfanil: alquil-S-) como se usa en la presente se refiere a un grupo alquilo saturado de cadena recta o ramificada que tiene 1 a 6 átomos de carbono, preferentemente 1 a 4 átomos de carbono (= C₁-C₄-alquiltio), más preferentemente 1 a 3 átomos de carbono, que se une mediante un átomo de azufre. Los ejemplos incluyen metiltio, etiltio, propiltio, isopropiltio y n-butiltio.

El término "haloalquiltio" como se usa en la presente se refiere a un grupo alquiltio como se mencionó anteriormente en donde los átomos de H están parcial o totalmente sustituidos por flúor, cloro, bromo y/o yodo. Los ejemplos incluyen clorometiltio, bromometiltio, diclorometiltio, triclorometiltio, fluorometiltio, difluorometiltio, trifluorometiltio, clorofluorometiltio, diclorofluorometiltio, clorodifluorometiltio, 1-cloroetiltio, 1-bromoetiltio, 1-fluoroetiltio, 2-fluoroetiltio, 2,2-difluoroetiltio, 2,2,2-trifluoroetiltio, 2-cloro-2-fluoroetiltio, 2-cloro-2,2-difluoroetiltio, 2,2-di-cloro-2-fluoroetiltio, 2,2,2-tricloroetiltio y pentafluoroetiltio y similares.

El término "alquilsulfonilo" (alquilsulfoxilo: C₁-C₆-alquil-S(=O)-), tal como se usa en la presente se refiere a un grupo alquilo saturado de cadena recta o ramificada (tal como se mencionó anteriormente) que tiene 1 a 6 átomos de carbono, preferentemente 1 a 4 átomos de carbono (= C₁-C₄-alquilsulfonilo), más preferentemente 1 a 3 átomos de carbono enlazados a través del átomo de azufre del grupo sulfonilo en cualquier posición en el grupo alquilo.

El término "alquilsulfonilo" (alquil-S(=O)₂-) tal como se usa en la presente se refiere a un grupo alquilo saturado de cadena recta o ramificada que tiene 1 a 6 átomos de carbono, preferentemente 1 a 4 átomos de carbono (= C₁-C₄-alquilsulfonilo), preferentemente 1 a 3 átomos de carbono, que se une mediante el átomo de azufre del grupo sulfonilo en cualquier posición en el grupo alquilo.

El término "alcoxycarbonilo" se refiere a un grupo alquilcarbonilo como se definió anteriormente, que se une a través de un átomo de oxígeno al resto de la molécula.

El término "alquenilo" tal como se usa en la presente denota en cada caso un radical de hidrocarburo insaturado de forma individual que en general tiene 2 a 6, preferentemente 2 a 4 átomos de carbono, en donde el doble enlace puede estar presente en cualquier posición, por ejemplo, vinilo, alilo (2-propen-1-ilo), 1-propen-1-ilo, 2-propen-2-ilo, metalilo (2-metilprop-2-en-1-ilo), 2-buten-1-ilo, 3-buten-1-il, 2-penten-1-ilo, 3-penten-1-ilo, 4-penten-1-ilo, 1-metilbut-2-en-1-ilo, 2-etilprop-2-en-1-ilo y similares.

El término "haloalquenilo" como se usa en la presente se refiere a un grupo alquenilo como se definió anteriormente, en donde los átomos de H se reemplazan parcial o totalmente con átomos de halógeno.

El término "alquinilo" tal como se usa en la presente denota en cada caso un radical de hidrocarburo insaturado de forma individual que en general tiene 2 a 6, preferentemente 2 a 4 átomos de carbono, en donde el enlace triple puede estar presente en cualquier posición, por ejemplo, etinilo, propargilo (2-propin-1-ilo), 1-propin-1-ilo, 1-metilprop-2-in-1-ilo, 2-butin-1-ilo, 3-butin-1-ilo, 1-pentin-1-ilo, 3-pentin-1-ilo, 4-pentin-1-ilo, 1-metilbut-2-in-1-ilo, 1-etilprop-2-in-1-ilo y similares.

El término "haloalquinilo" como se usa en la presente se refiere a un grupo alquinilo como se definió anteriormente, en donde los átomos de H se reemplazan parcial o totalmente con átomos de halógeno.

El término "cicloalquilo" tal como se usa en la presente y en las porciones cicloalquilo de cicloalcoxi y cicloalquiltio denota en cada caso un radical cicloalifático monocíclico que en general tiene de 3 a 8 o de 3 a 6 átomos de carbono, tal como ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo, ciclooctilo, ciclononilo y ciclodecilo o ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo.

El término "halocicloalquilo" tal como se usa en la presente y en las porciones halocicloalquilo de halocicloalcoxi y halocicloalquiltio denota en cada caso un radical cicloalifático monocíclico que tiene en general de 3 a 8 átomos de carbono o 3 a 6 átomos de carbono, en donde al menos uno, por ejemplo, 1, 2, 3, 4 o 5 de los átomos de H, se reemplazan por halógeno, en particular por flúor o cloro. Los ejemplos son 1- y 2- fluorociclopropilo, 1,2-, 2,2- y 2,3-difluorociclopropilo, 1,2,2-trifluorociclopropilo, 2,2,3,3-tetrafluorociclopropilo, 1- y 2-clorociclopropilo, 1,2-, 2,2- y 2,3-diclorociclopropilo, 1,2,2-triclorociclopropilo, 2,2,3,3-tetraclorociclopropilo, 1-, 2- y 3-fluorociclopentilo, 1,2-, 2,2-, 2,3-, 3,3-, 3,4-, 2,5-difluorociclopentilo, 1-, 2- y 3-clorociclopentilo, 1,2-, 2,2-, 2,3-, 3,3-, 3,4-, 2,5-diclorociclopentilo y similares.

El término "cicloalquenilo" tal como se usa en la presente y en las porciones de cicloalquenilo de cicloalquenilo y cicloalqueniltio denota en cada caso un radical no aromático monocíclico insaturado de forma individual que en general tiene de 3 a 8, por ejemplo, 3 o 4 o de 5 a 10 átomos de carbono, preferentemente de 3 a 8 átomos de carbono. Ejemplos de grupos cicloalquenilo incluyen ciclopropenilo, cicloheptenilo o ciclooctenilo.

El término "sustituido", si no se especifica de otra manera, se refiere a sustituido por 1, 2 o la cantidad máxima posible de sustituyentes. Si los sustituyentes tal como se definen en los compuestos de la fórmula I son más de uno, entonces son independientes entre sí son iguales o diferentes si no se menciona lo contrario.

El término “carbociclo” o “carbociclilo” incluye, a menos que se indique lo contrario, en general un anillo no aromático monocíclico de 3 a 12 miembros, preferentemente de 3 a 8 miembros o de 5 a 8 miembros, más preferentemente un anillo no aromático monocíclico de 5 o 6 miembros que comprende de 3 a 12, preferentemente de 3 a 8 o de 5 a 8, más preferentemente de 5 o 6 átomos de carbono. Preferentemente, el término “carbociclo” cubre grupos cicloalquilo y cicloalqueno como se definió anteriormente, por ejemplo, anillos de ciclopropano, ciclobutano, ciclopentano y ciclohexano.

El término “heterociclo” o “heterociclilo” incluye, a menos que se indique lo contrario, en general radicales heterocíclicos no aromáticos heterocíclicos monocíclicos de 3 a 10 miembros, preferentemente de 3 a 8 miembros o de 5 a 8 miembros, más preferentemente de 5 o 6 miembros, en particular de 6 miembros. Los radicales heterocíclicos no aromáticos en general comprenden 1, 2, 3, 4 o 5, preferentemente 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de N, O y S como miembros de anillo, donde los átomos de S como miembros de anillo pueden estar presentes como S, SO o SO₂. Si no se menciona lo contrario, los átomos N y S del heterociclo se pueden oxidar. Los ejemplos de radicales heterocíclicos de 5 o 6 miembros comprenden anillos heterocíclicos saturados o insaturados, no aromáticos, tal como oxiranilo, oxetanilo, tetanilo, tetanil-S-óxido (S-oxotietanilo), tetanil-S-dióxido (S-dioxotietanilo), pirrolidinilo, pirrolinilo, pirazolinilo, tetrahidrofuranilo, dihidrofuranilo, 1,3-dioxolanilo, tiolanilo, S-oxotiolanilo, S-dioxotiolanilo, dihidrotienilo, S-oxodihidrotienilo, S-dioxodihidrotienilo, oxazolidinilo, oxazolinilo, tiazolinilo, oxatiolanilo, piperidinilo, piperazinilo, piranilo, dihidropiranilo, tetrahidropiranilo, 1,3- y 1,4-dioxanilo, tiopiranilo, S-oxotiopiranilo, S-dioxotiopiranilo, dihidrotiopiranilo, S-oxodihidrotiopiranilo, S-dioxodihidrotiopiranilo, tetrahidrotiopiranilo, S-oxotetrahidrotiopiranilo, S-dioxotetrahidrotiopiranilo, morfolinilo, tiomorfolinilo, S-oxotiomorfolinilo, S-dioxotiomorfolinilo, tiazinilo y similares. Los ejemplos para el anillo heterocíclico que también comprenden 1 o 2 grupos carbonilo como miembros del anillo comprenden pirrolidin-2-onilo, pirrolidin-2,5-dionilo, imidazolidin-2-onilo, oxazolidin-2-onilo, tiazolidin-2-onilo y similares.

El término “heterociclo parcial o completamente insaturado” o “anillo heterocíclico parcial o completamente insaturado” se refiere a un heterociclo que está parcialmente insaturado o un heterociclo que está completamente insaturado. El heterociclo parcialmente insaturado incluye radicales heterocíclicos parcialmente insaturados de 3 o 6 miembros que comprenden como miembros de anillo 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados de N, O y S. Los ejemplos de heterociclos parcialmente insaturados de 3 a 6 miembros incluyen azirina, oxeteen, dihidropirol, dihidrofurano, dihidrotiofeno, dihidrooxazol, dihidroimidazol, dihidrotiazol, tetrahidropirazina, dihidrooxazina. El heterociclo completamente insaturado incluye radicales heterocíclicos completamente insaturados de 5 o 6 miembros que comprenden como miembros del anillo 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados de N, O y S. Los ejemplos de heterociclos completamente insaturados de 5 o 6 miembros incluyen piridilo, es decir., 2-, 3-, o 4-piridilo, pirimidinilo, es decir., 2-, 4- o 5-pirimidinilo, pirazinilo, piridazinilo, es decir., 3- o 4-piridazinilo, tienilo, es decir., 2- o 3-tienilo, furilo, es decir., 2- o 3-furilo, pirrolilo, es decir., 2- o 3-pirrolilo, oxazolilo, es decir., 2-, 3- o 5-oxazolilo, isoxazolilo, es decir., 3-, 4- o 5-isoxazolilo, tiazolilo, es decir., 2-, 3- o 5-tiazolilo, isotiazolilo, es decir., 3-, 4- o 5-isotiazolilo, pirazolilo, es decir., 1-, 3-, 4- o 5-pirazolilo, es decir., 1-, 2-, 4- o 5-imidazolilo, oxadiazolilo, por ejemplo, 2- o 5-[1,3,4]oxadiazolilo, 4- o 5-(1,2,3-oxadiazol)ilo, 3- o 5-(1,2,4-oxadiazol)ilo, 2- o 5-(1,3,4-tiadiazol)ilo, tiadiazolilo, por ejemplo, 2- o 5-(1,3,4-tiadiazol)ilo, 4- o 5-(1,2,3-tiadiazol)ilo, 3- o 5-(1,2,4-tiadiazol)ilo, triazolilo, por ejemplo, 1H-, 2H- o 3H-1,2,3-triazol-4-ilo, 2H-triazol-3-ilo, 1H-, 2H-, o 4H-1,2,4-triazolilo y tetrazolilo, es decir., 1H- o 2H-tetrazolilo. El término “heterociclo parcial o totalmente insaturado” o “anillo heterocíclico parcial o totalmente insaturado” también incluye radicales heterocíclicos bicíclicos parcial o totalmente insaturados de 8 a 10 miembros que comprenden como miembros de anillo 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados de N, O y S, en donde un anillo heterocíclico de 5 o 6 miembros se fusiona a un anillo fenilo o a un radical heteroaromático de 5 o 6 miembros. Los ejemplos de un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros fusionado a un anillo de fenilo o a un radical heteroaromático de 5 o 6 miembros incluyen benzofuranilo, benzotienilo, indolilo, indazolilo, bencimidazolilo, benzoxatiazolilo, benzoxadiazolilo, benzotiadiazolilo, benzoxazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, purinilo, 1,8-naftiridilo, pteridilo, pirido[3,2-d]pirimidilo o piridoimidazolilo y similares. Estos radicales hetarilo fusionados se pueden unir al resto de la molécula mediante cualquier átomo de anillo de anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros o mediante un átomo de carbono de la porción fenilo fusionado.

El término oxo (=O) como una sustitución se refiere al reemplazo de dos H por un radical oxo (=O).

El término “heteroarilo” se refiere a “heterociclo completamente insaturado”.

Los términos “alquilenilo”, “alquenileno” y “alquinileno” se refieren a alquilo, alquenilo y alquinilo como se definió anteriormente, respectivamente, que están unidos al resto de la molécula, mediante dos átomos, preferentemente mediante dos átomos de carbono, del grupo respectivo, de modo que representan un enlazador entre dos porciones de la molécula. En particular, el término “alquilenilo” puede referirse a cadenas de alquilo tal como -CH₂CH₂-, -CH(CH₃)-, -CH₂CH₂CH₂-, -CH(CH₃)CH₂-, -CH₂CH(CH₃)-, -CH₂CH₂CH₂CH₂-, -CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂-, -CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂-, y -CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂-. De manera similar, “alquenileno” y “alquinileno” pueden hacer referencia a cadenas de alquenilo y alquinilo, respectivamente.

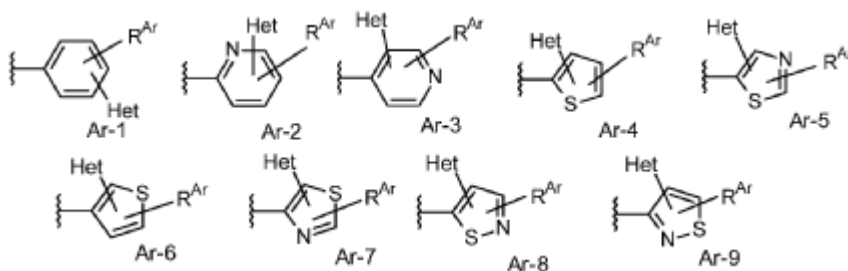
El término “CN” se refiere a un grupo ciano.

Con respecto a las variables, las realizaciones particularmente preferidas de los compuestos de la fórmula I se proporcionan posteriormente.

- En una realización preferida de compuestos de la fórmula I, X es O.
- En otra realización preferida de compuestos de la fórmula I, X es S.
- 5 En una realización preferida de compuestos de la fórmula I, R^x se selecciona de C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-haloalcoxi, C₂-C₆-haloalquenilo, C₂-C₆-haloalquinilo y C₃-C₆-halocicloalquilo.
- 10 En una realización más preferida de compuestos de la fórmula I, R^x se selecciona de C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₃-C₆-cicloalquilo y C₁-C₆-haloalquilo.
- En la realización más preferida de compuestos de la fórmula I, R^x se selecciona de CH₃, C₂H₅, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, alilo y propargilo.
- 15 En una realización particularmente preferida de compuestos de la fórmula I, R^x es CH₃ o C₂H₅.
- En otra realización preferida de compuestos de la fórmula I, R^x se selecciona de C(O)-OR^a, NR^bR^c, C₁-C₆-alquilen-NR^bR^c, O-C₁-C₆-alquilen-NR^bR^c, C₁-C₆-alquilen-CN, NH-C₁-C₆-alquilen-NR^bR^c, C(O)-NR^bR^c, C(O)-R^d, SO₂NR^bR^c, S(=O)_mR^e, fenilo y bencilo, en donde el anillo fenilo está insustituido o sustituido con radicales R^f;
- 20 En una realización preferida de compuestos de la fórmula I, R¹ se selecciona de C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alquilsulfenilo, C₁-C₆-alquilsulfinilo y C₁-C₆-alquilsulfonilo, parcial o completamente halogenados;
- 25 En otra realización preferida de compuestos de la fórmula I, R¹ es C₁-C₆-alquilo parcial o completamente halogenado, más preferentemente C₁-C₄-alquilo, particularmente C₁-C₂-alquilo tal como CF₃, CF₂CF₃ y CF(CF₃)₂.
- En otra realización preferida de compuestos de la fórmula I, R¹ es H.
- 30 En otra realización preferida de los compuestos de la fórmula I, R¹ es C₁-C₆-alcoxi parcial o completamente halogenado, más preferentemente C₁-C₄-alcoxi, particularmente C₁-C₂-alcoxi tal como OCF₃, OCH₂CHF₂ y OCH₂CF₃.
- En otra realización preferida de compuestos de la fórmula I, R¹ es C₂-C₆-alquinilo o C₂-C₆-alquenilo parcial o completamente halogenado.
- 35 En otra realización preferida de compuestos de la fórmula I, R¹ es C₃-C₆-cicloalcoxi o C₃-C₆-cicloalquilo parcial o completamente halogenado.
- En otra realización preferida de compuestos de la fórmula I, R¹ es C₁-C₆-sulfenilo parcial o completamente halogenado tal como SCF₃, C₁-C₆-sulfinilo tal como S(=O)CF₃ o C₁-C₆-sulfonilo tal como S(=O)₂CF₃.
- 40 En una realización más preferida de los compuestos de la fórmula I, R¹ es CF₃, CF₂CF₃, OCHF₂, CF(CF₃)₂, SCF₃, OCF₃, S(=O)CF₃ o S(=O)₂CF₃.
- 45 En una realización particularmente preferida de los compuestos de la fórmula I, R¹ es CF₃, CF₂CF₃, CF(CF₃)₂, SCF₃, OCF₃, S(=O)CF₃ o S(=O)₂CF₃.
- En una realización particular de compuestos de la fórmula I, R¹ es CF₃, CF₂CF₃, OCHF₂, o OCF₃.
- En una realización particular de compuestos de la fórmula I, R¹ es CF₃.
- 50 En una realización preferida de compuestos de la fórmula I, R² se selecciona de H, CN, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-haloalcoxi, C₂-C₆-haloalquenilo, C₂-C₆-haloalquinilo y C₃-C₆-halocicloalquilo.
- 55 En otra realización preferida de los compuestos de la fórmula I, R² se selecciona de H, halógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alquenilo, C₃-C₆-cicloalquilo y C₃-C₆-cicloalcoxi. En una realización más preferida de compuestos de la fórmula I, R² se selecciona de H, CH₃, C₂H₅, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, alilo y propargilo.
- En la realización más preferida de compuestos de la fórmula I, R² se selecciona de H, CH₃ y C₂H₅.
- 60 En una realización particularmente preferida de compuestos de la fórmula I, R² es H.
- En una realización preferida de compuestos de la fórmula I, R³ se selecciona de H, CN, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-haloalcoxi, C₂-C₆-haloalquenilo, C₂-C₆-haloalquinilo y C₃-C₆-halocicloalquilo.
- 65

- En una realización más preferida de compuestos de la fórmula I, R^3 se selecciona de H, halógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alquenilo, C₃-C₆-cicloalquilo y C₃-C₆-cicloalcoxi.
- 5 En la realización más preferida de compuestos de la fórmula I, R^3 se selecciona de H, CH₃, C₂H₅, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, alilo y propargilo.
- En la realización más preferida de los compuestos de la fórmula I, R^3 se selecciona de H, CH₃ y C₂H₅.
- 10 En una realización particularmente preferida de compuestos de la fórmula I, R^3 es H.
- En una realización preferida de los compuestos de la fórmula I, R^a se selecciona de H, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-haloalcoxi, C₂-C₆-haloalquenilo, C₂-C₆-haloalquinilo y C₃-C₆ halocicloalquilo.
- 15 En la realización más preferida de los compuestos de la fórmula I, R^a se selecciona de H, CH₃, C₂H₅, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, alilo y propargilo.
- En una realización preferida de compuestos de la fórmula I, R^b se selecciona de H, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-haloalcoxi, C₂-C₆-haloalquenilo, C₂-C₆-haloalquinilo, C₃-C₆ halocicloalquilo, $-(C=O)R$, $-(C=O)OR$, y $-(C=O)NR$.
- 20 En la realización más preferida de los compuestos de la fórmula I, R^b se selecciona de H, CH₃, C₂H₅, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, alilo y propargilo.
- 25 En una realización preferida de compuestos de la fórmula I, R^c se selecciona de H, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-haloalcoxi, C₂-C₆-haloalquenilo, C₂-C₆-haloalquinilo y C₃-C₆ halocicloalquilo.
- 30 En la realización más preferida de los compuestos de la fórmula I, R^c se selecciona de H, CH₃, C₂H₅, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, alilo y propargilo.
- En una realización preferida de compuestos de la fórmula I, R^d se selecciona de H, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-haloalcoxi, C₂-C₆-haloalquenilo, C₂-C₆-haloalquinilo y C₃-C₆ halocicloalquilo.
- 35 En la realización más preferida de compuestos de la fórmula I, R^d se selecciona de H, CH₃, C₂H₅, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, alilo y propargilo.
- 40 En una realización más preferida de compuestos de la fórmula I, R^e se selecciona de C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₁-C₆-haloalquilo y C₃-C₆ halocicloalquilo.
- En la realización más preferida de compuestos de la fórmula I, R^e se selecciona de CH₃, C₂H₅, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, alilo y propargilo.
- 45 En una realización preferida de compuestos de la fórmula I, R^f se selecciona de halógeno, CN, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-haloalcoxi, C₂-C₆-haloalquenilo, C₂-C₆-haloalquinilo y C₃-C₆ halocicloalquilo.
- 50 En una realización más preferida de compuestos de la fórmula I, R^f se selecciona de Cl, F, Br, OCH₃, OC₂H₅, SCH₃, SC₂H₅, CN, CH₃, C₂H₅, n-propilo, isopropilo, ciclopropilo, alilo, propargilo, CF₃, CHF₂ y CF₂CF₃.
- En una realización preferida de compuestos de la fórmula I, Ar es fenilo.
- 55 En otra realización preferida del compuesto de la fórmula I, Ar es heteroarilo.
- En otra realización preferida del compuesto de la fórmula I, Ar es heteroarilo de 5 o 6 miembros que contiene un heteroátomo seleccionado de O, N y S.
- 60 En una realización más preferida del compuesto de la fórmula I, en donde Ar es fenilo o heteroarilo de 5-6 miembros sustituido con $S(=O)_mR^e$ en la posición orto al enlace que se conecta al heteroarilo de 9 miembros del compuesto de la fórmula I, y opcionalmente sustituido además con 1 R^{Ar} , preferentemente se selecciona de halógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, fenilo y bencilo, en donde el anillo fenilo está insustituido o sustituido por radicales R^f .
- 65 En otra realización preferida de compuestos de la fórmula I, Ar se selecciona de la fórmula Ar-1 a Ar-9, en donde la fórmula Ar-1 a Ar-9 se sustituye con Het y 1, o 2 R^{Ar} , siempre que Het y R^{Ar} se unan a diferentes átomos de carbono, y en donde

un sustituyente de R^{Ar} se encuentra preferentemente en la posición orto al enlace --- ;



- 5 En otra realización preferida de compuestos de la fórmula I, Ar es piridinilo o tiofenilo sustituido con R^{Ar} como $S(=O)_mR^e$ en la posición orto para unir con heteroarilo de 9 miembros del compuesto de la fórmula I, y opcionalmente sustituido además con 1 R^{Ar} seleccionado de halógeno, C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -haloalquilo, C_1 - C_6 -alcoxi, C_1 - C_6 -haloalcoxi, fenilo y bencilo, en donde el anillo fenilo de R^{Ar} está insustituido o sustituido con radicales R^f ;
- 10 En una realización preferida de los compuestos de la fórmula I, R^{Ar} se selecciona de halógeno, C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -haloalquilo, C_1 - C_6 -alcoxi, C_1 - C_6 -haloalcoxi, $S(=O)_mR^e$, fenilo, fenoxi, fenilcarbonilo, feniltio y bencilo, en donde el anillo fenilo está insustituido o sustituido por radicales R^f .

En una realización más preferida de compuestos de la fórmula I, R^{Ar} se selecciona de halógeno, C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -haloalquilo, C_1 - C_6 -alcoxi, C_1 - C_6 -haloalcoxi, $S(=O)_mR^e$, fenilo y bencilo, en donde el anillo fenilo está insustituido o sustituido por radicales R^f .

En una realización preferida de los compuestos de la fórmula I, R^{Ar} se selecciona de halógeno, C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -haloalquilo, C_1 - C_6 -alcoxi y C_1 - C_6 -haloalcoxi.

20 En otra realización preferida de compuestos de la fórmula I, R^{Ar} se selecciona de C_2 - C_6 -alquenoilo, C_2 - C_6 -haloalquenoilo, C_2 - C_6 -alquinilo, C_2 - C_6 -haloalquinilo, C_3 - C_6 -cicloalquilo, C_3 - C_6 -halocicloalquilo, C_3 - C_6 -cicloalcoxi y C_3 - C_6 -halocicloalcoxi.

En otra realización preferida de compuestos de la fórmula I, R^{Ar} se selecciona de C_1 - C_6 -sulfenilo, C_1 - C_6 -sulfinilo y C_1 - C_6 -sulfonilo.

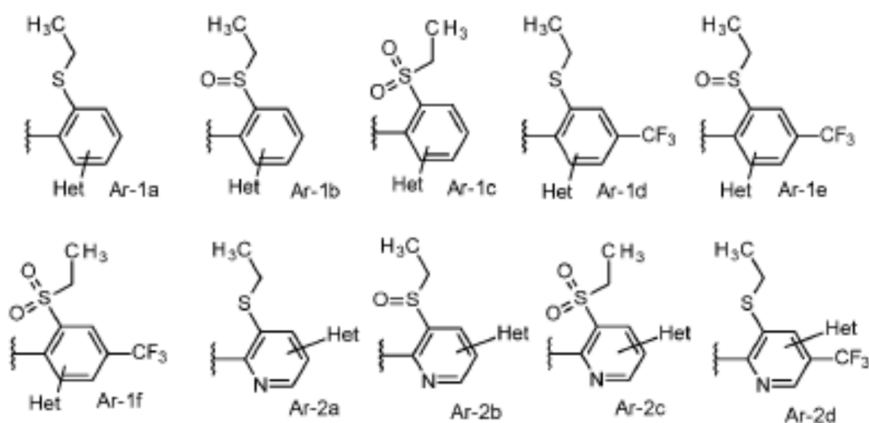
25 En una realización más preferida de compuestos de la fórmula I, R^{Ar} se selecciona de Cl, F, Br, CH_3 , SCH_3 , SC_2H_5 , $S(=O)CH_3$, $S(=O)C_2H_5$, $S(=O)_2CH_3$, $S(=O)_2C_2H_5$.

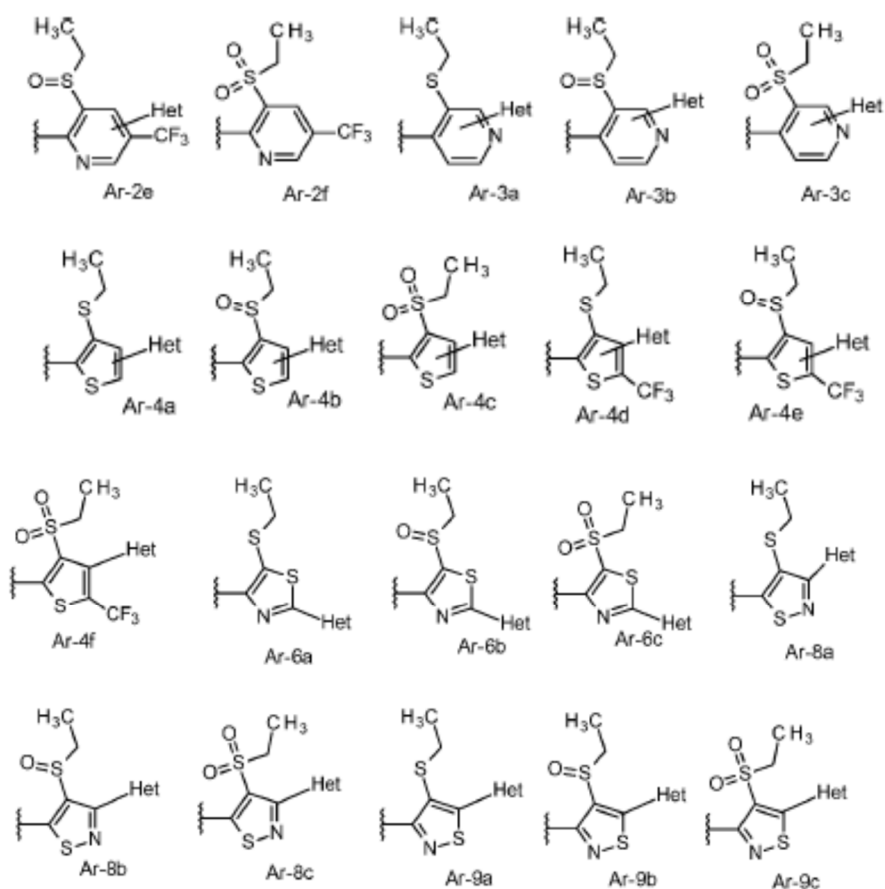
30 En la realización más preferida de compuestos de la fórmula I, R^{Ar} es $S(=O)_2C_2H_5$.

En una realización preferida del compuesto de la fórmula I, n es 1 o 2.

En una realización más preferida del compuesto de la fórmula I, n es 1.

35 En una realización particularmente preferida del compuesto de la fórmula I, Ar se selecciona del grupo de la fórmula Ar-1a a Ar-1f, Ar-2a a Ar-2f, Ar-3a a Ar-3c, Ar-4a a Ar-4f, Ar-6a a Ar-6c, Ar-8a a Ar-8c y Ar-9a a Ar-9c:



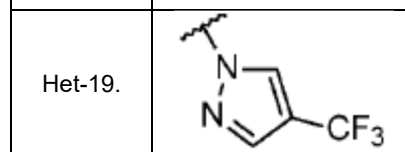
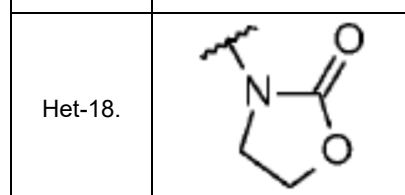
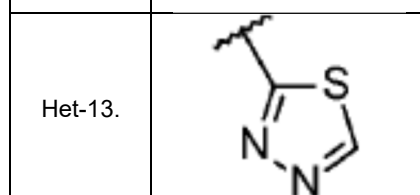
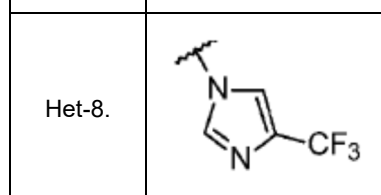
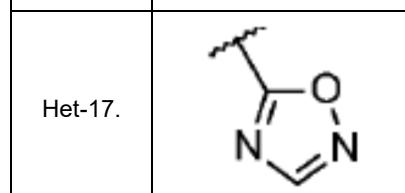
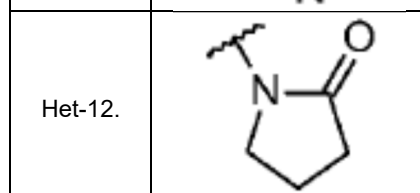
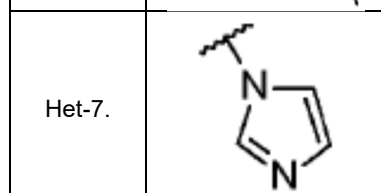
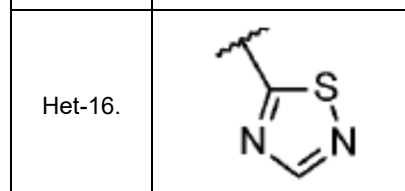
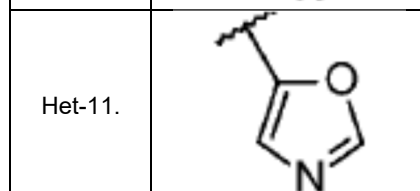
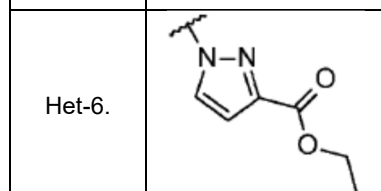
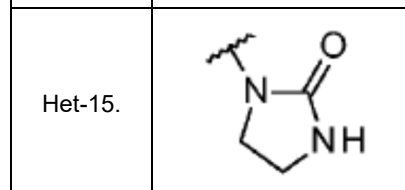
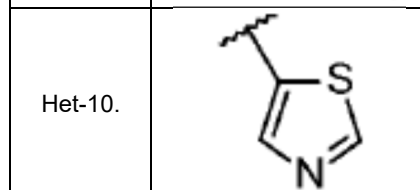
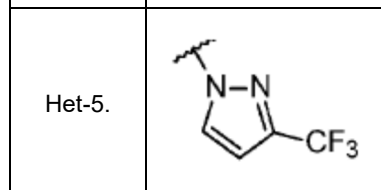
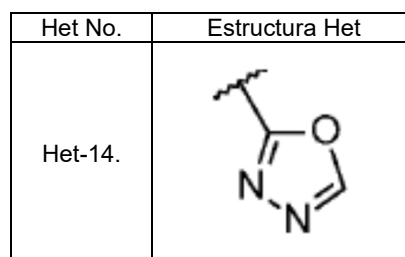
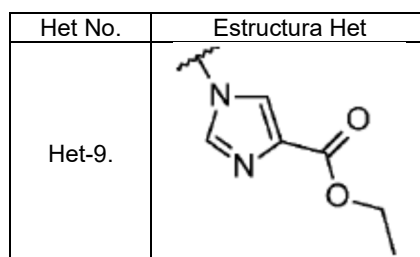
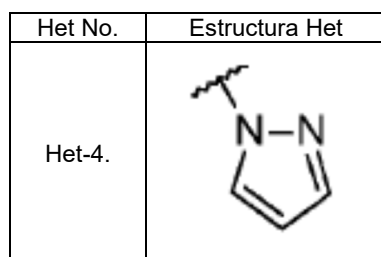
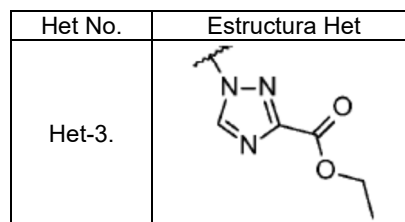
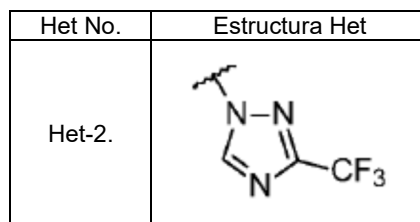
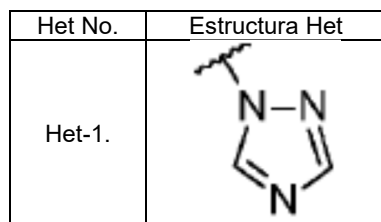


- 5 En una realización preferida del compuesto de la fórmula I, Het es heteroarilo de 5 o 6 miembros que está insustituido o sustituido con R;
- En otra realización preferida del compuesto de la fórmula I, Het es heteroarilo de 5 o 6 miembros que está sustituido con R;
- 10 En otra realización preferida del compuesto de la fórmula I, Het es heteroarilo de 5 o 6 miembros que está insustituido.
- En una realización preferida del compuesto de la fórmula I, Het es heterociclilo de 5 o 6 miembros que está insustituido o sustituido con R;
- 15 En otra realización preferida del compuesto de la fórmula I, Het es heterociclilo de 5 o 6 miembros que está sustituido con R;
- En otra realización preferida del compuesto de la fórmula I, Het es heterociclilo de 5 o 6 miembros que está insustituido.
- 20 En otra realización preferida del compuesto de la fórmula I, Het se selecciona de tiofenilo, oxazolidinilo, imidazolidinilo, pirrolidinilo, piperidinilo, piridinilo, oxazolilo, tiazolilo, pirazolilo, imidazolilo, triazolilo, oxadiazolilo, tetrazolilo y tiadiazolilo; en donde el Het está insustituido o sustituido con R.
- En otra realización preferida del compuesto de la fórmula I, Het se selecciona de tiofenilo, oxazolidinilo, imidazolidinilo, pirrolidinilo, oxazolilo, tiazolilo, pirazolilo, imidazolilo, triazolilo, oxadiazolilo, tetrazolilo y tiadiazolilo; en donde Het está insustituido o sustituido con R;
- 25 En otra realización preferida del compuesto de la fórmula I, Het se selecciona de tiofenilo, pirrolidinilo, piperidinilo, piridinilo, pirazolilo, triazolilo y tetrazolilo; en donde el Het está insustituido o sustituido con R.
- En una realización preferida del compuesto de la fórmula I, R seleccionado de halógeno, oxo (=O), C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₆-alcoxycarbonilo.
- 30 En otra realización preferida del compuesto de la fórmula I, R se selecciona de halógeno, oxo (=O), C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi y C₁-C₆-alcoxycarbonilo.
- 35 En otra realización preferida del compuesto de la fórmula I, R se selecciona de halógeno, oxo (=O) y C₁-C₆-haloalquilo.

En otra realización preferida del compuesto de la fórmula I, R se selecciona de C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalcoxi, C₃-C₆-cicloalquilo-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalcoxi-C₁-C₄-alquilo, fenilo, heteroarilo de 5 o 6 miembros, o heterociclilo de 5 o 6 miembros, en donde los grupos cíclicos de R están insustituídos o sustituidos con radicales R^f;

5 En una realización más preferida del compuesto de la fórmula I, Het se selecciona de tiofenilo, oxazolidinilo, imidazolidinilo, pirrolidinilo, oxazolilo, tiazolilo, pirazolilo, imidazolilo, triazolilo, oxadiazolilo, tetrazolilo y tiadiazolilo; en donde Het está insustituído o sustituido con R seleccionado de halógeno, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₆-alcoxycarbonilo.

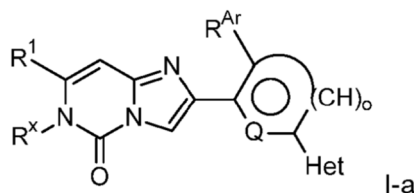
10 Los ejemplos de Het particularmente preferidos se listan en la Tabla H posterior,



En una realización más preferida del compuesto de la fórmula I, en donde

15 Het es como se define en la presente;

- R^x se selecciona de C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquino, C₃-C₆-cicloalquilo y C₁-C₆-haloalquilo;
 R¹ se selecciona de C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alquilsulfenilo, C₁-C₆-alquilsulfinilo y C₁-C₆-alquilsulfonilo parcial o completamente halogenados;
 R² se selecciona de H, halógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alqueno, C₃-C₆-cicloalquilo y C₃-C₆-cicloalcoxi;
 5 R³ se selecciona de H, halógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alqueno, C₃-C₆-cicloalquilo y C₃-C₆-cicloalcoxi;
 Ar es un fenilo o heteroarilo de 5 o 6 miembros;
 n es 1 o 2;
 R^{Ar} se selecciona de halógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, S(=O)_mR^e, fenilo, fenoxi, fenilcarbonilo, feniltio y bencilo, en donde el anillo fenilo está insustituido o sustituido con radicales R^f;
 10 R^e se selecciona de C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₁-C₆-haloalquilo y C₃-C₆-halocicloalquilo;
 R^f se selecciona de halógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₃-C₆-cicloalquilo, C₂-C₆-alqueno y C₂-C₆-alquino, que están insustituidos o sustituidos con halógeno;
 m es 0, 1 o 2.
- 15 En la realización más preferida del compuesto de la fórmula I, en donde
- R^x es C₁-C₆-alquilo;
 R¹ se selecciona de C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alquilsulfenilo, C₁-C₆-alquilsulfinilo y C₁-C₆-alquilsulfonilo, parcial o completamente halogenados;
 20 R² se selecciona de H, halógeno y C₁-C₆-alquilo;
 R³ se selecciona de H, halógeno y C₁-C₆-alquilo;
 Ar es piridinilo o tiofenilo sustituido con R^{Ar} como S(=O)_mR^e en la posición orto para unir con heteroarilo de 9 miembros del compuesto de la fórmula I, y opcionalmente sustituido además con 1 R^{Ar} seleccionado de halógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, fenilo y bencilo, en donde el anillo fenilo de R^{Ar} está insustituido o sustituido con radicales R^f;
 25 R^e se selecciona de C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₁-C₆-haloalquilo y C₃-C₆-halocicloalquilo; R^f se selecciona de halógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₃-C₆-cicloalquilo, C₂-C₆-alqueno y C₂-C₆-alquino, que están insustituidos o sustituidos con halógeno;
 m es 0, 1 o 2;
- 30 Het se selecciona de tiofenilo, oxazolidinilo, imidazolidinilo, pirrolidinilo, piperidinilo, piridinilo, oxazolilo, tiazolilo, pirazolilo, imidazolilo, triazolilo, oxadiazolilo y tiadiazolilo; preferentemente tiofenilo, oxazolidinilo, imidazolidinilo, pirrolidinilo, oxazolilo, tiazolilo, pirazolilo, imidazolilo, triazolilo, oxadiazolilo y tiadiazolilo, en donde el Het está insustituido o sustituido con R; R se selecciona de halógeno, oxo (=O), C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi y C₁-C₆-alcoxycarbonilo.
- 35 En otra realización más preferida del compuesto de la fórmula I, en donde
- X es O;
 R¹ es C₁-C₆-alquilo parcial o completamente halogenado;
 R^x es C₁-C₆-alquilo;
 40 R² es H;
 R³ es H o C₁-C₆-alquilo;
 Het se selecciona de tiofenilo, pirrolidinilo, piperidinilo, pirazolilo, piridinilo, triazolilo y tetrazolilo;
- en donde el Het está insustituido o sustituido con R;
- 45 R se selecciona de halógeno, oxo (=O) y C₁-C₆-haloalquilo;
 Ar es piridinilo sustituido con R^{Ar} como S(=O)_mR^e en la posición orto para unirse al heteroarilo de 9 miembros del compuesto de la fórmula I;
 R^e es C₁-C₆-alquilo.
- 50 En una realización particularmente preferida, el compuesto de la fórmula I corresponde al compuesto de la fórmula I-a,



- 55 en donde el círculo en el anillo que contiene Q denota que el anillo es un anillo aromático;
- Q es S o N;
 R^x es C₁-C₆-alquilo;
 R¹ se selecciona de C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alquilsulfenilo, C₁-C₆-alquilsulfinilo y C₁-C₆-alquilsulfonilo, parcial o completamente halogenado,
- 60

R^{Ar} es $S(=O)_m R^e$; en donde

R^e es C_1 - C_6 -alquilo;

Het se selecciona de tiofenilo, oxazolidinilo, imidazolidinilo, pirrolidinilo, piperidinilo, piridinilo, oxazolilo, tiazolilo, pirazolilo, imidazolilo, triazolilo, oxadiazolilo y tiadiazolilo; preferentemente tiofenilo, oxazolidinilo, imidazolidinilo, pirrolidinilo, oxazolilo, tiazolilo, pirazolilo, imidazolilo, triazolilo, oxadiazolilo y tiadiazolilo.

en donde el Het está insustituído o sustituido con R;

R se selecciona de halógeno, oxo ($=O$), C_1 - C_6 -haloalquilo, C_1 - C_6 -alcoxi y C_1 - C_6 -alcoxycarbonilo;

m es 0, 1 o 2;

o es 1 o 2.

En una realización más particularmente preferida del compuesto de la fórmula I, el compuesto de la fórmula I es el compuesto de la fórmula I-a, en donde

Q es S o N;

R^x es CH_3 o C_2H_5 ;

R^1 se selecciona de CF_3 , CF_2CF_3 , $CF(CF_3)_2$, SCF_3 , OCF_3 , $OCHF_2$, $S(=O)CF_3$, y $S(=O)_2CF_3$;

R^{Ar} es $S-CH_3$, $S(=O)-CH_3$, $S(=O)_2-CH_3$, $S-C_2H_5$, $S(=O)-C_2H_5$, o $S(=O)_2-C_2H_5$;

Het se selecciona de Het-1 a Het-19 de la tabla H;

o es 1 o 2.

Cada uno de los grupos mencionados para un sustituyente en las tablas es además per se, independientemente de la combinación en la que se menciona, un aspecto particularmente preferido del sustituyente en cuestión.

De acuerdo con la realización particularmente preferida del compuesto de la fórmula I, los compuestos de la invención son los compuestos que se compilan en las Tablas 1-1 a 1-18 donde el significado para la combinación de las variables R^x , R^1 y Het para cada compuesto individual de las tablas 1 a 18 corresponde a cada línea de la Tabla A. Cada uno de los grupos mencionados para un sustituyente en las tablas es además per se, independientemente de la combinación en la que se menciona, un aspecto particularmente preferido del sustituyente en cuestión.

Tabla 1-1 Compuestos de la fórmula I-a en los cuales Q es S, R^{Ar} es $S-CH_3$ y o es 1.

Tabla 1-2 Compuestos de la fórmula I-a en los que Q es S, R^{Ar} es $S(=O)-CH_3$ y o es 1.

Tabla 1-3 Compuestos de la fórmula I-a en los que Q es S, R^{Ar} es $S(=O)_2-CH_3$ y o es 1.

Tabla 1-4 Compuestos de la fórmula I-a en los que Q es S, R^{Ar} es $S-C_2H_5$ y o es 1.

Tabla 1-5 Compuestos de la fórmula I-a en los que Q es S, R^{Ar} es $S(=O)-C_2H_5$ y o es 1.

Tabla 1-6 Compuestos de la fórmula I-a en los que Q es S, R^{Ar} es $S(=O)_2-C_2H_5$ y o es 1.

Tabla 1-7 Compuestos de la fórmula I-a en los que Q es N, R^{Ar} es $S-CH_3$ y o es 1.

Tabla 1-8 Compuestos de la fórmula I-a en los que Q es N, R^{Ar} es $S(=O)-CH_3$ y o es 1.

Tabla 1-9 Compuestos de la fórmula I-a en los que Q es N, R^{Ar} es $S(=O)_2-CH_3$ y o es 1.

Tabla 1-10 Compuestos de la fórmula I-a en los que Q es N, R^{Ar} es $S-C_2H_5$ y o es 1.

Tabla 1-11 Compuestos de la fórmula I-a en los que Q es N, R^{Ar} es $S(=O)-C_2H_5$ y o es 1.

Tabla 1-12 Compuestos de la fórmula I-a en los que Q es N, R^{Ar} es $S(=O)_2-C_2H_5$ y o es 1.

Tabla 1-13 Compuestos de la fórmula I-a en los que Q es N, R^{Ar} es $S-CH_3$ y o es 2.

Tabla 1-14 Compuestos de la fórmula I-a en los que Q es N, R^{Ar} es $S(=O)-CH_3$ y o es 2.

Tabla 1-15 Compuestos de la fórmula I-a en los que Q es N, R^{Ar} es $S(=O)_2-CH_3$ y o es 2.

Tabla 1-16 Compuestos de la fórmula I-a en los que Q es N, R^{Ar} es $S-C_2H_5$ y o es 2.

Tabla 1-17 Compuestos de la fórmula I-a en los que Q es N, R^{Ar} es $S(=O)-C_2H_5$ y o es 2.

Tabla 1-18 Compuestos de la fórmula I-a en los que Q es N, R^{Ar} es $S(=O)_2-C_2H_5$ y o es 2.

Tabla A:

Renglón	R^1	R^x	Het
A-1	CF_3	CH_3	Het-1
A-2	CF_3	CH_3	Het-2
A-3	CF_3	CH_3	Het-3
A-4	CF_3	CH_3	Het-4
A-5	CF_3	CH_3	Het-5
A-6	CF_3	CH_3	Het-6
A-7	CF_3	CH_3	Het-7

Renglón	R^1	R^x	Het
A-8	CF_3	CH_3	Het-8
A-9	CF_3	CH_3	Het-9
A-10	CF_3	CH_3	Het-10
A-11	CF_3	CH_3	Het-11
A-12	CF_3	CH_3	Het-12
A-13	CF_3	CH_3	Het-13
A-14	CF_3	CH_3	Het-14

Renglón	R ¹	R ^x	Het
A-15	CF ₃	CH ₃	Het-15
A-16	CF ₃	CH ₃	Het-16
A-17	CF ₃	CH ₃	Het-17
A-18	CF ₃	CH ₃	Het-18
A-19	CF ₃	CH ₃	Het-19
A-20	CF ₃	C ₂ H ₅	Het-1
A-21	CF ₃	C ₂ H ₅	Het-2
A-22	CF ₃	C ₂ H ₅	Het-3
A-23	CF ₃	C ₂ H ₅	Het-4
A-24	CF ₃	C ₂ H ₅	Het-5
A-25	CF ₃	C ₂ H ₅	Het-6
A-26	CF ₃	C ₂ H ₅	Het-7
A-27	CF ₃	C ₂ H ₅	Het-8
A-28	CF ₃	C ₂ H ₅	Het-9
A-29	CF ₃	C ₂ H ₅	Het-10
A-30	CF ₃	C ₂ H ₅	Het-11
A-31	CF ₃	C ₂ H ₅	Het-12
A-32	CF ₃	C ₂ H ₅	Het-13
A-33	CF ₃	C ₂ H ₅	Het-14
A-34	CF ₃	C ₂ H ₅	Het-15
A-35	CF ₃	C ₂ H ₅	Het-16
A-36	CF ₃	C ₂ H ₅	Het-17
A-37	CF ₃	C ₂ H ₅	Het-18
A-38	CF ₃	C ₂ H ₅	Het-19
A-39	CF ₂ CF ₃	CH ₃	Het-1
A-40	CF ₂ CF ₃	CH ₃	Het-2
A-41	CF ₂ CF ₃	CH ₃	Het-3
A-42	CF ₂ CF ₃	CH ₃	Het-4
A-43	CF ₂ CF ₃	CH ₃	Het-5
A-44	CF ₂ CF ₃	CH ₃	Het-6
A-45	CF ₂ CF ₃	CH ₃	Het-7
A-46	CF ₂ CF ₃	CH ₃	Het-8
A-47	CF ₂ CF ₃	CH ₃	Het-9
A-48	CF ₂ CF ₃	CH ₃	Het-10
A-49	CF ₂ CF ₃	CH ₃	Het-11
A-50	CF ₂ CF ₃	CH ₃	Het-12
A-51	CF ₂ CF ₃	CH ₃	Het-13
A-52	CF ₂ CF ₃	CH ₃	Het-14
A-53	CF ₂ CF ₃	CH ₃	Het-15
A-54	CF ₂ CF ₃	CH ₃	Het-16
A-55	CF ₂ CF ₃	CH ₃	Het-17
A-56	CF ₂ CF ₃	CH ₃	Het-18
A-57	CF ₂ CF ₃	CH ₃	Het-19
A-58	CF ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-1
A-59	CF ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-2
A-60	CF ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-3
A-61	CF ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-4
A-62	CF ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-5
A-63	CF ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-6

Renglón	R ¹	R ^x	Het
A-64	CF ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-7
A-65	CF ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-8
A-66	CF ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-9
A-67	CF ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-10
A-68	CF ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-11
A-69	CF ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-12
A-70	CF ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-13
A-71	CF ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-14
A-72	CF ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-15
A-73	CF ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-16
A-74	CF ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-17
A-75	CF ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-18
A-76	CF ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-19
A-77	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	Het-1
A-78	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	Het-2
A-79	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	Het-3
A-80	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	Het-4
A-81	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	Het-5
A-82	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	Het-6
A-83	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	Het-7
A-84	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	Het-8
A-85	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	Het-9
A-86	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	Het-10
A-87	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	Het-11
A-88	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	Het-12
A-89	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	Het-13
A-90	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	Het-14
A-91	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	Het-15
A-92	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	Het-16
A-93	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	Het-17
A-94	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	Het-18
A-95	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	Het-19
A-96	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	Het-1
A-97	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	Het-2
A-98	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	Het-3
A-99	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	Het-4
A-100	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	Het-5
A-101	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	Het-6
A-102	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	Het-7
A-103	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	Het-8
A-104	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	Het-9
A-105	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	Het-10
A-106	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	Het-11
A-107	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	Het-12
A-108	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	Het-13
A-109	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	Het-14
A-110	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	Het-15
A-111	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	Het-16
A-112	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	Het-17

Renglón	R ¹	R ^x	Het
A-113	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	Het-18
A-114	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	Het-19
A-115	SCF ₃	CH ₃	Het-1
A-116	SCF ₃	CH ₃	Het-2
A-117	SCF ₃	CH ₃	Het-3
A-118	SCF ₃	CH ₃	Het-4
A-119	SCF ₃	CH ₃	Het-5
A-120	SCF ₃	CH ₃	Het-6
A-121	SCF ₃	CH ₃	Het-7
A-122	SCF ₃	CH ₃	Het-8
A-123	SCF ₃	CH ₃	Het-9
A-124	SCF ₃	CH ₃	Het-10
A-125	SCF ₃	CH ₃	Het-11
A-126	SCF ₃	CH ₃	Het-12
A-127	SCF ₃	CH ₃	Het-13
A-128	SCF ₃	CH ₃	Het-14
A-129	SCF ₃	CH ₃	Het-15
A-130	SCF ₃	CH ₃	Het-16
A-131	SCF ₃	CH ₃	Het-17
A-132	SCF ₃	CH ₃	Het-18
A-133	SCF ₃	CH ₃	Het-19
A-134	SCF ₃	C ₂ H ₅	Het-1
A-135	SCF ₃	C ₂ H ₅	Het-2
A-136	SCF ₃	C ₂ H ₅	Het-3
A-137	SCF ₃	C ₂ H ₅	Het-4
A-138	SCF ₃	C ₂ H ₅	Het-5
A-139	SCF ₃	C ₂ H ₅	Het-6
A-140	SCF ₃	C ₂ H ₅	Het-7
A-141	SCF ₃	C ₂ H ₅	Het-8
A-142	SCF ₃	C ₂ H ₅	Het-9
A-143	SCF ₃	C ₂ H ₅	Het-10
A-144	SCF ₃	C ₂ H ₅	Het-11
A-145	SCF ₃	C ₂ H ₅	Het-12
A-146	SCF ₃	C ₂ H ₅	Het-13
A-147	SCF ₃	C ₂ H ₅	Het-14
A-148	SCF ₃	C ₂ H ₅	Het-15
A-149	SCF ₃	C ₂ H ₅	Het-16
A-150	SCF ₃	C ₂ H ₅	Het-17
A-151	SCF ₃	C ₂ H ₅	Het-18
A-152	SCF ₃	C ₂ H ₅	Het-19
A-153	OCF ₃	CH ₃	Het-1
A-154	OCF ₃	CH ₃	Het-2
A-155	OCF ₃	CH ₃	Het-3
A-156	OCF ₃	CH ₃	Het-4
A-157	OCF ₃	CH ₃	Het-5
A-158	OCF ₃	CH ₃	Het-6
A-159	OCF ₃	CH ₃	Het-7
A-160	OCF ₃	CH ₃	Het-8
A-161	OCF ₃	CH ₃	Het-9

Renglón	R ¹	R ^x	Het
A-162	OCF ₃	CH ₃	Het-10
A-163	OCF ₃	CH ₃	Het-11
A-164	OCF ₃	CH ₃	Het-12
A-165	OCF ₃	CH ₃	Het-13
A-166	OCF ₃	CH ₃	Het-14
A-167	OCF ₃	CH ₃	Het-15
A-168	OCF ₃	CH ₃	Het-16
A-169	OCF ₃	CH ₃	Het-17
A-170	OCF ₃	CH ₃	Het-18
A-171	OCF ₃	CH ₃	Het-19
A-172	OCF ₃	C ₂ H ₅	Het-1
A-173	OCF ₃	C ₂ H ₅	Het-2
A-174	OCF ₃	C ₂ H ₅	Het-3
A-175	OCF ₃	C ₂ H ₅	Het-4
A-176	OCF ₃	C ₂ H ₅	Het-5
A-177	OCF ₃	C ₂ H ₅	Het-6
A-178	OCF ₃	C ₂ H ₅	Het-7
A-179	OCF ₃	C ₂ H ₅	Het-8
A-180	OCF ₃	C ₂ H ₅	Het-9
A-181	OCF ₃	C ₂ H ₅	Het-10
A-182	OCF ₃	C ₂ H ₅	Het-11
A-183	OCF ₃	C ₂ H ₅	Het-12
A-184	OCF ₃	C ₂ H ₅	Het-13
A-185	OCF ₃	C ₂ H ₅	Het-14
A-186	OCF ₃	C ₂ H ₅	Het-15
A-187	OCF ₃	C ₂ H ₅	Het-16
A-188	OCF ₃	C ₂ H ₅	Het-17
A-189	OCF ₃	C ₂ H ₅	Het-18
A-190	OCF ₃	C ₂ H ₅	Het-19
A-191	OCHF ₂	CH ₃	Het-1
A-192	OCHF ₂	CH ₃	Het-2
A-193	OCHF ₂	CH ₃	Het-3
A-194	OCHF ₂	CH ₃	Het-4
A-195	OCHF ₂	CH ₃	Het-5
A-196	OCHF ₂	CH ₃	Het-6
A-197	OCHF ₂	CH ₃	Het-7
A-198	OCHF ₂	CH ₃	Het-8
A-199	OCHF ₂	CH ₃	Het-9
A-200	OCHF ₂	CH ₃	Het-10
A-201	OCHF ₂	CH ₃	Het-11
A-202	OCHF ₂	CH ₃	Het-12
A-203	OCHF ₂	CH ₃	Het-13
A-204	OCHF ₂	CH ₃	Het-14
A-205	OCHF ₂	CH ₃	Het-15
A-206	OCHF ₂	CH ₃	Het-16
A-207	OCHF ₂	CH ₃	Het-17
A-208	OCHF ₂	CH ₃	Het-18
A-209	OCHF ₂	CH ₃	Het-19
A-210	OCHF ₂	C ₂ H ₅	Het-1

Renglón	R ¹	R ^x	Het
A-211	OCHF ₂	C ₂ H ₅	Het-2
A-212	OCHF ₂	C ₂ H ₅	Het-3
A-213	OCHF ₂	C ₂ H ₅	Het-4
A-214	OCHF ₂	C ₂ H ₅	Het-5
A-215	OCHF ₂	C ₂ H ₅	Het-6
A-216	OCHF ₂	C ₂ H ₅	Het-7
A-217	OCHF ₂	C ₂ H ₅	Het-8
A-218	OCHF ₂	C ₂ H ₅	Het-9
A-219	OCHF ₂	C ₂ H ₅	Het-10
A-220	OCHF ₂	C ₂ H ₅	Het-11
A-221	OCHF ₂	C ₂ H ₅	Het-12
A-222	OCHF ₂	C ₂ H ₅	Het-13
A-223	OCHF ₂	C ₂ H ₅	Het-14
A-224	OCHF ₂	C ₂ H ₅	Het-15
A-225	OCHF ₂	C ₂ H ₅	Het-16
A-226	OCHF ₂	C ₂ H ₅	Het-17
A-227	OCHF ₂	C ₂ H ₅	Het-18
A-228	OCHF ₂	C ₂ H ₅	Het-19
A-229	S(=O)CF ₃	CH ₃	Het-1
A-230	S(=O)CF ₃	CH ₃	Het-2
A-231	S(=O)CF ₃	CH ₃	Het-3
A-232	S(=O)CF ₃	CH ₃	Het-4
A-233	S(=O)CF ₃	CH ₃	Het-5
A-234	S(=O)CF ₃	CH ₃	Het-6
A-235	S(=O)CF ₃	CH ₃	Het-7
A-236	S(=O)CF ₃	CH ₃	Het-8
A-237	S(=O)CF ₃	CH ₃	Het-9
A-238	S(=O)CF ₃	CH ₃	Het-10
A-239	S(=O)CF ₃	CH ₃	Het-11
A-240	S(=O)CF ₃	CH ₃	Het-12
A-241	S(=O)CF ₃	CH ₃	Het-13
A-242	S(=O)CF ₃	CH ₃	Het-14
A-243	S(=O)CF ₃	CH ₃	Het-15
A-244	S(=O)CF ₃	CH ₃	Het-16
A-245	S(=O)CF ₃	CH ₃	Het-17
A-246	S(=O)CF ₃	CH ₃	Het-18
A-247	S(=O)CF ₃	CH ₃	Het-19
A-248	S(=O)CF ₃	CH ₃	Het-1
A-249	S(=O)CF ₃	C ₂ H ₅	Het-2
A-250	S(=O)CF ₃	C ₂ H ₅	Het-3
A-251	S(=O)CF ₃	C ₂ H ₅	Het-4
A-252	S(=O)CF ₃	C ₂ H ₅	Het-5
A-253	S(=O)CF ₃	C ₂ H ₅	Het-6
A-254	S(=O)CF ₃	C ₂ H ₅	Het-7
A-255	S(=O)CF ₃	C ₂ H ₅	Het-8
A-256	S(=O)CF ₃	C ₂ H ₅	Het-9
A-257	S(=O)CF ₃	C ₂ H ₅	Het-10

Renglón	R ¹	R ^x	Het
A-258	S(=O)CF ₃	C ₂ H ₅	Het-11
A-259	S(=O)CF ₃	C ₂ H ₅	Het-12
A-260	S(=O)CF ₃	C ₂ H ₅	Het-13
A-261	S(=O)CF ₃	C ₂ H ₅	Het-14
A-262	S(=O)CF ₃	C ₂ H ₅	Het-15
A-263	S(=O)CF ₃	C ₂ H ₅	Het-16
A-264	S(=O)CF ₃	C ₂ H ₅	Het-17
A-265	S(=O)CF ₃	C ₂ H ₅	Het-18
A-266	S(=O)CF ₃	C ₂ H ₅	Het-19
A-267	S(=O) ₂ CF ₃	CH ₃	Het-1
A-268	S(=O) ₂ CF ₃	CH ₃	Het-2
A-269	S(=O) ₂ CF ₃	CH ₃	Het-3
A-270	S(=O) ₂ CF ₃	CH ₃	Het-4
A-271	S(=O) ₂ CF ₃	CH ₃	Het-5
A-272	S(=O) ₂ CF ₃	CH ₃	Het-6
A-273	S(=O) ₂ CF ₃	CH ₃	Het-7
A-274	S(=O) ₂ CF ₃	CH ₃	Het-8
A-275	S(=O) ₂ CF ₃	CH ₃	Het-9
A-276	S(=O) ₂ CF ₃	CH ₃	Het-10
A-277	S(=O) ₂ CF ₃	CH ₃	Het-11
A-278	S(=O) ₂ CF ₃	CH ₃	Het-12
A-279	S(=O) ₂ CF ₃	CH ₃	Het-13
A-280	S(=O) ₂ CF ₃	CH ₃	Het-14
A-281	S(=O) ₂ CF ₃	CH ₃	Het-15
A-282	S(=O) ₂ CF ₃	CH ₃	Het-16
A-283	S(=O) ₂ CF ₃	CH ₃	Het-17
A-284	S(=O) ₂ CF ₃	CH ₃	Het-18
A-285	S(=O) ₂ CF ₃	CH ₃	Het-19
A-286	S(=O) ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-1
A-287	S(=O) ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-2
A-288	S(=O) ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-3
A-289	S(=O) ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-4
A-290	S(=O) ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-5
A-291	S(=O) ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-6
A-292	S(=O) ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-7
A-293	S(=O) ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-8
A-294	S(=O) ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-9
A-295	S(=O) ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-10
A-296	S(=O) ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-11
A-297	S(=O) ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-12
A-298	S(=O) ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-13
A-299	S(=O) ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-14
A-300	S(=O) ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-15
A-301	S(=O) ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-16
A-302	S(=O) ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-17
A-303	S(=O) ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-18
A-304	S(=O) ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	Het-19

Como se usa en la presente, el término “compuesto(s) de la presente invención” o “compuesto(s) de acuerdo con la invención” se refiere al compuesto(s) de la fórmula (I) como se definió anteriormente, que también se denominan “compuesto(s) de la fórmula I” o “compuesto(s) I” o “compuesto(s) de la fórmula I”, e incluye sus sales, tautómeros, estereoisómeros y N-óxidos.

La presente invención también se refiere a una mezcla de al menos un compuesto de la presente invención con al menos un compañero de mezcla como se define en la presente más adelante. Se prefieren mezclas binarias de un compuesto de la presente invención como el componente I con un compañero de mezcla como se define en la presente después como el componente II. Las relaciones en peso preferidas para estas mezclas binarias son de 5000:1 a 1:5000, preferentemente de 1000:1 a 1:1000, más preferentemente de 100:1 a 1:100, particularmente preferentemente de 10:1 a 1:10. En estas mezclas binarias, los componentes I y II se pueden utilizar en cantidades iguales, o se puede utilizar un exceso del componente I, o un exceso del componente II.

Los compañeros de mezcla se pueden seleccionar de pesticidas, en particular insecticidas, nematocidas y acaricidas, fungicidas, herbicidas, reguladores del crecimiento vegetal, fertilizantes y similares. Los compañeros de mezcla preferidos son insecticidas, nematocidas y fungicidas.

La siguiente lista M de pesticidas, agrupados y numerados de acuerdo con la Clasificación de Modo de Acción del Comité de Acción de Resistencia a Insecticidas (IRAC, por sus siglas en inglés), junto con los cuales se pueden utilizar los compuestos de la presente invención y con los cuales se podrían producir posibles efectos sinérgicos, pretende ilustrar las posibles combinaciones, pero no imponer ninguna limitación:

M.1 Inhibidores de acetilcolin-esterasa (AChE) de la clase de: M.1A carbamatos, por ejemplo aldicarb, alanicarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxicarboxim, carbarilo, carbofuran, carbosulfan, etiofencarb, fenobucarb, formetanato, furatiocarb, isoprocarb, metiocarb, metomilo, metolcarb, oxamilo, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, trimetacarb, XMC, xililcarb y triazamato; o de la clase de M.1B organofosfatos, por ejemplo acefato, azametifos, azinfosetilo, azinfosmetilo, cadusafos, cloretoxifos, clorfenvinfos, clormefos, clorpirifos, clorpirifosmetilo, coumafos, cianofos, demeton-S-metilo, diazinon, diclorvos/ DDVP, dicrotofos, dimetoato, dimetilvinfos, disulfoton, EPN, etión, ethoprosfos, famphur, fenamifos, fenitrotión, fentión, fostiazato, heptenofos, imiciafos, isofenfos, isopropil O-(metoxiaminotio-fosforil) salicilato, isoxatión, malatión, mecarbam, metamidofos, methidatión, mevinfos, monocrotofos, naled, ometoato, oxidemeton-metilo, paratión, paration-metilo, fentoato, forato, fosalona, fosmet, fosfamidon, phoxim, pirimifos-metilo, profenofós, propetamfós, protiofos, piraclofos, piridafentión, quinalfos, sulfotep, tebupirimfos, temefos, terbufós, tetraclorvinfos, tiometon, triazofós, triclorfon y vamidotion;

M.2. Antagonistas de canal de cloruro activados por GABA, tal como: M.2A Compuestos organoclorados de ciclodieno, como por ejemplo endosulfán o clordano; o M.2B fiproles (fenilpirazoles), como por ejemplo etilprol, fipronil, flufiprol, pirafluprol y piriprol;

M.3 Moduladores de canal de sodio de la clase de M.3A, piretroides, por ejemplo, acrinatrina, aletrina, d-cis-transaletrina, d-trans aletrina, bifentrina, bioaletrina, bioaletrina S-ciclopentenilo, bioresmetrina, cicloprotrina, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, lambda-cihalotrina, gamma-cihalotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, beta-cipermetrina, theta-cipermetrina, zeta-cipermetrina, cifenotrina, deltametrina, empentrina, esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fen-valerato, flucitrinato, flumetrina, tau-fluvalinato, halfenprox, heptaflutrina, imiprotrina, meperflutrina, metoflutrina, momfluorotrina, permetrina, fenotrina, praletrina, proflutrina, piretrina (piretrina), resmetrina, silafluofeno, teflutrina, tetrametilflutrina, tetrametrina, talometrina y transflutrina; o M.3B moduladores de los canales de sodio tal como DDT o metoxicloro;

M.4 Agonistas del receptor de acetilcolina de tipo nicotínico (nAChR) de la clase de M.4A neonicotinoides por ejemplo acetamiprid, clotianidina, cicloxaprid, dinotefuran, imidacloprid, nitenpiram, tiacloprid y tiametoxam; o los compuestos M.4A.2: (2E)-1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]-N'-nitro-2-pen-tilidenhidrazincarboximidamida; o M.4A.3: 1-[(6-Cloropiridin-3-il)metil]-7-metil-8-nitro-5-propoxi-1,2,3,5,6,7-hexahidroimidazo[1,2-a]piridina; o de la clase M.4B nicotina;

M.5 Activadores alostéricos del receptor de acetilcolina de tipo nicotínico de la clase de las espinosinas, por ejemplo, espinosad o espinetoram;

M.6 Activadores de canal de cloruro de la clase de las avermectinas y milbemicinas, por ejemplo, abamectina, benzoato de emamectina, ivermectina, lepimectina o milbemectina;

M.7 Imitaciones de hormonas juveniles, tal como análogos de hormonas juveniles M.7A como hidropreno, kinopreno y metopreno; u otros como M.7B fenoxicarb o M.7C piriproxifeno;

M.8 Inhibidores misceláneos no específicos (multisitio), por ejemplo, M.8A haluros de alquilo como bromuro de metilo y otros haluros de alquilo, o cloropicrina M.8B, o M.8C fluoruro de sulfurilo, o M.8D bórax, o M.8E emético tártaro;

M.9 Bloqueadores selectivos de la alimentación de homópteros, por ejemplo, M.9B pimetrozina o M.9C flonicamid;

M.10 Inhibidores del crecimiento de ácaros, por ejemplo, M.10A clofentezina, hexitiazox y diflovidazina, o M.10B etoxazol;

M.11 Perturbadores microbianos de las membranas del intestino medio de los insectos, por ejemplo, *bacillus thuringiensis* o *bacillus sphaericus* y las proteínas insecticidas que producen tal como *bacillus thuringiensis subsp. israelensis*, *bacillus sphaericus*, *bacillus thuringiensis subsp. aizawai*, *bacillus thuringiensis subsp. kurstaki* y *bacillus thuringiensis subsp. tenebrionis*, o las proteínas de cultivo Bt: Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry2Ab, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb y Cry34/35Ab1;

M.12 Inhibidores de ATP sintasa mitocondrial, por ejemplo M.12A diafenthiurón, o M.12B miticidas de organotina tal como azociclotina, cihexatina o óxido de fenbutatina, o M.12C propargita, o M.12D tetradifón;

M.13 Desacopladores de fosforilación oxidativa mediante alteración del gradiente de protones, por ejemplo clorfenapir, DNOC o sulfuramida;

M.14 Bloqueadores de los canales del receptor de acetilcolina de tipo nicotínico (nAChR), por ejemplo, análogos de

- nereistoxina como bentsultap, clorhidrato de cartap, tiociclam o tiosultap sódico;
- M.15 Inhibidores de la biosíntesis de quitina tipo 0, tal como benzoilureas como, por ejemplo, bistriflurón, clorfluazurón, diflubenzurón, flucicloxurón, flufenoxurón, hexaflumurón, lufenurón, novalurón, noviflumurón, teflubenzurón o triflumurón;
- M.16 Inhibidores de la biosíntesis de quitina tipo 1, como por ejemplo la buprofezina;
- 5 M.17 Disruptores de la muda, Dipterano, como por ejemplo ciromazina;
- M.18 Agonistas del receptor Ecdyson tal como diacilhidrazinas, por ejemplo metoxifenoazida, tebufenozida, halofenoazida, fufenozida o cromafenoazida;
- M.19 Agonistas del receptor de la octopamina, como por ejemplo amitraz;
- M.20 Inhibidores del transporte de electrones del complejo III mitocondrial, por ejemplo, M.20A hidrametilnon, o M.20B
- 10 acequinocilo, o M.20C fluaciripirim;
- M.21 Inhibidores del transporte de electrones del complejo I mitocondrial, por ejemplo, M.21A acaricidas e insecticidas METI tal como fenazaquin, fenpiroximate, pirimidifen, piridaben, tebufenpirad o tolfenpirad, o M.21B rotenona;
- M.22 Bloqueadores de canal de sodio dependientes del voltaje, por ejemplo, M.22A indoxacarbo, M.22B metaflumizona o M.22B.1: 2-[2-(4-Cianofenil)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etilideno]-N-[4-(difluorometoxi)fenil]-hidrazincarboxamida o
- 15 M.22B.2: N-(3-cloro-2-metilfenil)-2-[(4-cloro-fenil)[4-[metil(metilsulfonilo)amino]fenil]metilene]-hidrazincarboxamida;
- M.23 Inhibidores de la acetil CoA carboxilasa, tal como derivados del ácido tetrónico y tetrámico, por ejemplo espirodiclofeno, espiromesifeno o espirotetramat;
- M.24 Inhibidores del transporte de electrones del complejo mitocondrial IV, por ejemplo, M.24A fosfina tal como fosfuro de aluminio, fosfuro de calcio, fosfina o fosfuro de zinc, o M.24B cianuro;
- 20 M.25 Inhibidores del transporte de electrones del complejo mitocondrial II, tal como derivados de beta-cetonitrilo, por ejemplo, cienopirafeno o ciflumetofeno;
- M.28 Moduladores del receptor de Ryanodina de la clase de diamidas, como por ejemplo flubendiamida, clorantraniliprol (rynaxypyr ®), ciantraniliprol (cyazypyr ®), tetraniliprol o los compuestos de ftalamida M.28.1: (R)-3-clor-N1-[2-metil-4-[1,2,2,2-tetrafluor-1-(trifluorometil)etil]fenil]-N2-(1-metil-2-metilsulfoniloetil)ftalamid y M.28.2: (S)-3-clor-N1-[2-metil-4-[1,2,2,2-tetrafluor-1-(trifluorometil)etil]fenil]-N2-(1-metil-2-metilsulfoniloetil)ftalamid, o el compuesto M.28.3: 3-bromo-N-[2-bromo-4-cloro-6-[(1-ciclopropiletil)carbamoil]fenil]-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-carboxamida (nombre ISO propuesto: ciclaniliprol), o el compuesto M.28.4: metil-2-[3,5-dibromo-2-[(3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il)carbonil]-amino]benzoil]-1,2-dimetilhidrazincarboxilato; o un compuesto seleccionado de M.28.5a) a M.28.5d) y M.28.5h) a M.28.5l):
- 25 M.28.5a) N-[4,6-dicloro-2-[(dietil-lambda-4-sulfaniliden)carbamoil]fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)-5-(trifluorometil)pirazol-3-carboxamida; M.28.5b) N-[4-cloro-2-[(dietil-lambda-4-sulfaniliden)carbamoil]-6-metil-fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)-5-(trifluorometil)pirazol-3-carboxamida; M.28.5c) N-[4-cloro-2-[(di-2-propil-lambda-4-sulfaniliden)carbamoil]-6-metil-fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)-5-(trifluorometil)pirazol-3-carboxamida; M.28.5d) N-[4,6-dicloro-2-[(di-2-propil-lambda-4-sulfaniliden)carbamoil]fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)-5-(trifluorometil)pirazol-3-carboxamida; M.28.5h) N-[4,6-dibromo-2-[(dietil-lambda-4-sulfaniliden)carbamoil]fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)-5-(trifluorometil)pirazol-3-carboxamida; M.28.5i) N-[2-(5-Amino-1,3,4-tiadiazol-2-il)-4-cloro-6-metilfenil]-3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-carboxamida; M.28.5j) 3-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-N-[2,4-dicloro-6-[(1-ciano-1-metiletil)amino]carbonil]fenil]-1H-pirazol-5-carboxamida; M.28.5k) 3-Bromo-N-[2,4-dicloro-6-(metilcarbamoil)fenil]-1-(3,5-dicloro-2-piridil)-1H-pirazol-5-carboxamida; M.28.5l) N-[4-cloro-2-[(1,1-dimetiletil)amino]carbonil]-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(fluorometoxi)-1H-pirazol-5-carboxamida; o
- 30 M.28.6: Cihalodiamida; o;
- M.29. Compuestos insecticidas activos de modo de acción desconocido o incierto, como por ejemplo afidopiropen, afoxolaner, azadiractin, amidoalumet, benzoximate, bifenazato, broflanilida, bromopropilato, quinometionat, criolita, dicloromezotiaz, dicofol, flufenimer, flometoquin, fluensulfona, fluhexafon, fluopiram, flupiradifurona, fluralaner, metoxadiazona, piperonil butóxido, piflubumida, piridililo, pirifluquinazon, sulfoxaflor, tioxaafen, triflumezopirim, o los
- 35 compuestos
- M.29.3: 11-(4-cloro-2,6-dimetilfenil)-12-hidroxi-1,4-dioxo-9-azadiespiro[4.2.4.2]-tetradec-11-en-10-ona, o el compuesto
- M.29.4: 3-(4'-fluoro-2,4-dimetilbifenil-3-il)-4-hidroxi-8-oxa-1-azaespiro[4.5]dec-3-en-2-ona, o el compuesto
- M.29.5: 1-[2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfonil]fenil]-3-(trifluorometil)-1H-1,2,4-triazol-5-amina, o activos en base a bacillus firmus (Votivo, I-1582); o un compuesto seleccionado del grupo de M.29.6, en donde el compuesto se selecciona de M.29.6a) a M.29.6k): M.29.6a) (E/Z)-N-[1-[(6-cloro-3-piridil)metil]-2-piridiliden]-2,2,2-trifluoro-acetamida; M.29.6b) (E/Z)-N-[1-[(6-cloro-5-fluoro-3-piridil)metil]-2-piridiliden]-2,2,2-trifluoro-acetamida; M.29.6c) (E/Z)-2,2,2-trifluoro-N-[1-[(6-fluoro-3-piridil)metil]-2-piridiliden]acetamida; M.29.6d) (E/Z)-N-[1-[(6-bromo-3-piridil)metil]-2-piridiliden]-2,2,2-trifluoro-acetamida; M.29.6e) (E/Z)-N-[1-[(6-cloro-3-piridil)etil]-2-piridiliden]-2,2,2-trifluoro-acetamida; M.29.6f) (E/Z)-N-[1-[(6-cloro-3-piridil)metil]-2-piridiliden]-2,2,2-difluoro-acetamida; M.29.6g) (E/Z)-2-cloro-N-[1-[(6-cloro-3-piridil)metil]-2-piridiliden]-2,2-difluoro-acetamida; M.29.6h) (E/Z)-N-[1-[(2-cloropirimidin-5-il)metil]-2-piridiliden]-2,2,2-trifluoro-acetamida; M.29.6i) (E/Z)-N-[1-[(6-cloro-3-piridil)metil]-2-piridiliden]-2,2,3,3,3-pentafluoro-propanamida.; M.29.6j) N-[1-[(6-cloro-3-piridil)metil]-2-piridiliden]-2,2,2-trifluoro-tioacetamida; o M.29.6k) N-[1-[(6-cloro-3-piridil)metil]-2-piridiliden]-2,2,2-trifluoro-N'-isopropil-acetamida; o los compuestos M.29.8: fluazaindolizina; o los compuestos M.29.9.a): 4-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4H-isoxazol-3-il]-2-metil-N-(1-oxotietan-3-il)benzamida; o M.29.9.b): fluxametamida; o
- 40 M.29.10: 5-[3-[2,6-dicloro-4-(3,3-dicloroaliloxi)fenoxi]propoxi]-1H-pirazol; o
- un compuesto que se selecciona del grupo de M.29.11, en donde el compuesto se selecciona de
- M.29.11.b) a M.29.11p): M.29.11.b) 3-(benzoilmetilamino)-N-[2-bromo-4-[1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-(trifluorometil)propil]-6-(trifluorometil)fenil]-2-fluoro-benzamida; M.29.11.c) 3-(benzoilmetilamino)-2-fluoro-N-[2-yodo-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]-6-(trifluorometil)fenil]-benzamida; M.29.11.d) N-[3-[[[2-yodo-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]-6-(trifluorometil)amino]carbonil]fenil]-N-metil-benzamida; M.29.11.e) N-[3-[[[2-bromo-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]-6-(trifluorometil)amino]carbonil]-2-fluoro-N-metil-benzamida; M.29.11.f) 4-fluoro-N-[2-fluoro-3-[[[2-yodo-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(tri-fluorometil)etil]-6-(trifluorometil)fenil]amino]carbonil]fenil]-N-metil-
- 45
- 50
- 55
- 60
- 65

benzamida;
 M.29.11.g) 3-fluoro-N-[2-fluoro-3-[[[2-yodo-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]-6-(trifluoro-metil)fenil]amino]-
 carbonil]fenil]-N-metil-benzamida; M.29.11.h) 2-cloro-N-[3-[[[2-yodo-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]-6-
 (trifluorometil)fenil]amino]carbonil]fenil]- 3-piridincarboxamida; M.29.11.i) 4-ciano-N-[2-ciano-5-[[2,6-dibromo-4-
 5 [1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-(trifluorometil)propil]fenil]carbamoil]fenil]-2-metil-benzamida; M.29.11.j) 4-ciano-3-[(4-ciano-2-
 metil-benzoil)amino]-N-[2,6-dicloro-4-[1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-(trifluorometil)propil]fenil]-2-fluoro-benzamida; M.29.11.k)
 N-[5-[[2-cloro-6-ciano-4-[1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-(trifluorometil)propil]fenil]carbamoil]-2-ciano-fenil]-4-ciano-2-metil-
 benzamida; M.29.11.l) N-[5-[[2-bromo-6-cloro-4-[2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-1-(trifluorometil)etil]fenil]carbamoil]-2-ciano-fenil]-
 4-ciano-2-metil-benzamida; M.29.11.m) N-[5-[[2-bromo-6-cloro-4-[1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-
 10 (trifluorometil)propil]fenil]carbamoil]-2-ciano-fenil]-4-ciano-2-metil-benzamida; M.29.11.n) 4-ciano-N-[2-ciano-5-[[2,6-
 dicloro-4-[1,2,2,3,3,3-hexafluoro-1-(trifluorometil)propil]fenil]carbamoil]fenil]-2-metil-benzamida; M.29.11.o) 4-ciano-N-[2-
 ciano-5-[[2,6-dicloro-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil]carbamoil]fenil]-2-metil-benzamida;
 M.29.11.p) N-[5-[[2-bromo-6-cloro-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil]carbamoil]-2-ciano-fenil]-4-ciano-2-metil-
 benzamida; o un compuesto seleccionado del grupo de M.29.12, en donde el compuesto se selecciona de M.29.12a) a
 15 M.29.12.m): M.29.12.a) 2-(1,3-Dioxan-2-il)-6-[2-(3-piridinil)-5-tiazolil]-piridina; M.29.12.b) 2-[6-[2-(5-Fluoro-3-piridinil)-5-
 tiazolil]-2-piridinil]-pirimidina; M.29.12.c) 2-[6-[2-(3-Piridinil)-5-tiazolil]-2-piridinil]-pirimidina; M.29.12.d) N-Metilsulfonil-6-[2-
 (3-piridil)tiazol-5-il]piridin-2-carboxamida; M.29.12.e) N-Metilsulfonil-6-[2-(3-piridil)tiazol-5-il]piridin-2-carboxamida;
 M.29.12.f) N-Etil-N-[4-metil-2-(3-piridil)tiazol-5-il]-3-metiltio-propanamida; M.29.12.g) N-Metil-N-[4-metil-2-(3-piridil)tiazol-
 5-il]-3-metiltio-propanamida; M.29.12.h) N,2-Dimetil-N-[4-metil-2-(3-piridil)tiazol-5-il]-3-metiltio-propanamida;
 20 M.29.12.i) N-Etil-2-metil-N-[4-metil-2-(3-piridil)tiazol-5-il]-3-metiltio-propanamida; M.29.12.j) N-[4-cloro-2-(3-piridil)tiazol-5-
 il]-N-etil-2-metil-3-metiltio-propanamida; M.29.12.k) N-[4-cloro-2-(3-piridil)tiazol-5-il]-N,2-dimetil-3-metiltio-propanamida;
 M.29.12.l) N-[4-cloro-2-(3-piridil)thi-azol-5-il]-N-metil-3-metiltio-propanamida; M.29.12.m) N-[4-cloro-2-(3-piridil)tiazol-5-il]-
 N-etil-3-metiltio-propanamida; o los compuestos
 M.29.14a) 1-[(6-cloro-3-piridinil)metil]-1,2,3,5,6,7-hexahidro-5-metoxi-7-metil-8-nitro-imidazo[1,2-a]piridina; o M.29.14b) 1-
 25 [(6-cloropiridin-3-il)metil]-7-metil-8-nitro-1,2,3,5,6,7-hexahidroimidazo[1,2-a]piridin-5-ol; o los compuestos
 M.29.16a) 1-isopropil-N,5-dimetil-N-piridazin-4-il-pirazol-4-carboxamida; o M.29.16b) 1-(1,2-dimetilpropil)-N-etil-5-metil-N-
 piridazin-4-il-pirazol-4-carboxamida; M.29.16c) N,5-di-metil-N-piridazin-4-il-1-(2,2,2-trifluoro-1-metil-etil)pirazol-4-
 carboxamida; M.29.16d) 1-[1-(1-cianociclopropil)etil]-N-etil-5-metil-N-piridazin-4-il-pirazol-4-carboxamida; M.29.16e) N-
 etil-1-(2-fluoro-1-metil-propil)-5-metil-N-piridazin-4-il-pirazol-4-carboxamida; M.29.16f) 1-(1,2-dimetilpropil)-N,5-dimetil-N-
 30 piridazin-4-il-pirazol-4-carboxamida; M.29.16g) 1-[1-(1-cianociclopropil)etil]-N,5-dimetil-N-piridazin-4-il-pirazol-4-
 carboxamida; M.29.16h) N-metil-1-(2-fluoro-1-metil-propil)-5-metil-N-piridazin-4-il-pirazol-4-carboxamida; M.29.16i) 1-
 (4,4-difluorociclohexil)-N-etil-5-metil-N-piridazin-4-il-pirazol-4-carboxamida; o M.29.16j) 1-(4,4-difluorociclohexil)-N,5-
 dimetil-N-piridazin-4-il-pirazol-4-carboxamida, o
 M.29.17 un compuesto seleccionado de los compuestos M.29.17a) a M.29.17j): M.29.17a) N-(1-metiletil)-2-(3-piridinil)-
 35 2H-indazol-4-carboxamida; M.29.17b) N-ciclopropil-2-(3-piridinil)-2H-indazol-4-carboxamida; M.29.17c) N-ciclohexil-2-(3-
 piridinil)-2H-indazol-4-carboxamida;
 M.29.17d) 2-(3-piridinil)-N-(2,2,2-trifluoroetil)-2H-indazol-4-carboxamida; M.29.17e) 2-(3-piridinil)-N-[(tetrahydro-2-
 furanil)metil]-2H-indazol-5-carboxamida; M.29.17f) 2-[[2-(3-piridinil)-2H-indazol-5-il]carbonil]hidrazincarboxilato de metilo;
 M.29.17g) N-[(2,2-difluorociclopropil)metil]-2-(3-piridinil)-2H-indazol-5-carboxamida; M.29.17h) N-(2,2-difluoropropil)-2-(3-
 40 piridinil)-2H-indazol-5-carboxamida; M.29.17i) 2-(3-piridinil)-N-(2-pirimidinilmetil)-2H-indazol-5-carboxamida;
 M.29.17j) N-[(5-metil-2-pirazinil)metil]-2-(3-piridinil)-2H-indazol-5-carboxamida, o
 M.29.18 un compuesto seleccionado de los compuestos M.29.18a) a M.29.18d): M.29.18a) N-[3-cloro-1-(3-piridil)pirazol-
 4-il]-N-etil-3-(3,3-trifluoropropilsulfanil)propanamida; M.29.18b) N-[3-cloro-1-(3-piridil)pirazol-4-il]-N-etil-3-(3,3,3-
 trifluoropropilsulfanil)propanamida; M.29.18c) N-[3-cloro-1-(3-piridil)pirazol-4-il]-3-[(2,2-difluorociclopropil)metilsulfanil]-N-
 45 etil-propanamida; M.29.18d) N-[3-cloro-1-(3-piridil)pirazol-4-il]-3-[(2,2-difluorociclopropil)metilsulfanil]-N-etil-propanamida;
 o el compuesto
 M.29.19 sarolaner, o el compuesto
 M.29.20 lotilaner.

50 Los compuestos comercialmente disponibles del grupo M listados anteriormente se pueden encontrar en The Pesticide
 Manual, 16ª Edición, C. MacBean, British Crop Protection Council (2013) entre otras publicaciones. El Manual de
 Pesticidas en línea se actualiza regularmente y es accesible a través de <http://bcpdata.com/pesticide-manual.html>.

Otra base de datos en línea para pesticidas que proporciona los nombres comunes ISO es <http://www.alan-wood.net/pesticides>.
 55

El M.4 neonicotinoide cicloxáprido se conoce a partir de WO2010/069266 y WO2011/069456, el neonicotinoide M.4A.2, a
 veces también llamado guadipir, se conoce a partir de WO2013/003977, y el neonicotinoide M.4A.3 (aprobado como
 paichongding en China) se conoce a partir de WO2007/101369. El análogo de metaflumizona M.22B.1 se describe en
 60 CN10171577 y el análogo M.22B.2 en CN102126994. Las ftalamidas M.28.1 y M.28.2 se conocen ambas de
 WO2007/101540. La antranilamida M.28.3 se describe en WO2005/077934. El compuesto de hidrazida M.28.4 se describe
 en WO2007/043677. Las antranilamidas M.28.5a) a M.28.5d) y M.28.5h) se describen en WO 2007/006670,
 WO2013/024009 y WO2013/024010, la antranilamida M.28.5i) se describe en WO2011/085575, M.28.5j) en
 WO2008/134969, M.28.5k) en US2011/046186 y M.28.5l) en WO2012/034403. El compuesto de diamida M.28.6 se puede
 65 encontrar en WO2012/034472. El derivado de ketoenol cíclico sustituido con espiro-cetal M.29.3 se conoce a partir del
 documento WO2006/089633 y el derivado de cetoenol cíclico sustituido con espirofenilo M.29.4 a partir del documento

- WO2008/067911. El triazoilfenilsulfuro M.29.5 se describe en WO2006/043635, y los agentes de control biológico sobre la base de bacillus firmus se describen en WO2009/124707. Los compuestos M.29.6a) a M.29.6i) listados en M.29.6 se describen en WO2012/029672, y M.29.6j) y M.29.6k) en WO2013/129688. El nematocida M.29.8 se conoce a partir de WO2013/055584. La isoxazolina M.29.9.a) se describe en WO2013/050317. La isoxazolina M.29.9.b) se describe en WO2014/126208. El análogo de tipo piridililo M.29.10 se conoce a partir de WO2010/060379. Las carboxamidas broflanilida y M.29.11.b) a M.29.11.h) se describen en WO2010/018714, y las carboxamidas M.29.11.i) a M.29.11.p) en WO2010/127926. Se conocen los piridiltiazoles M.29.12.a) a M.29.12.c) de WO2010/006713, M.29.12.d) y M.29.12.e) de WO2012/000896, y M.29.12.f) a M.29.12.m) de WO2010/129497. Los compuestos M.29.14a) y M.29.14b) se conocen a partir de WO2007/101369. Los pirazoles M.29.16.a) a M.29.16h) se describen en WO2010/034737, WO2012/084670 y WO2012/143317, respectivamente, y los pirazoles M.29.16i) y M.29.16j) se describen en US 61/891437. Los piridinilindazoles M.29.17a) a M.29.17.j) se describen en WO2015/038503. Los piridilpirazoles M.29.18a) a M.29.18d) se describen en US2014/0213448. La isoxazolina M.29.19 se describe en WO2014/036056. La isoxazolina M.29.20 se conoce por WO2014/090918.
- La siguiente lista de fungicidas, junto con la cual se pueden utilizar los compuestos de la presente invención, pretende ilustrar las posibles combinaciones, pero no las limita:

A) Inhibidores de la respiración

- Inhibidores del complejo III en el sitio Q_o (por ejemplo, estrobilurinas): azoxistrobin (A.1.1), coumetoxi-estrobina (A.1.2), coumoxistrobin (A.1.3), dimoxistrobin (A.1.4), enoestrobina (A.1.5), fenaminstrobina (A.1.6), fenoxistrobin/flufenoxistrobin (A.1.7), fluoxastrobin (A.1.8), kresoxim-metil (A.1.9), mandestrobin (A.1.10), metominostrobin (A.1.11), orisaestrobina (A.1.12), picoxiestrobina (A.1.13), pira-clostrobina (A.1.14), pirametoestrobina (A.1.15), piraoxiestrobina (A.1.16), trifloxiestrobina (A.1.17), 2-(2-(3-(2,6-diclorofenil)-1-metil-alilidenaminoximetil)-fenil)-2-metoxiimino-N-metil-acetamida (A.1.18), piribencarb (A.1.19), triclopiricarb/clorodincarb (A.1.20), famoxadona (A.1.21), fenamidona (A.1.21), metil-N-[2-[(1,4-dimetil-5-fenil-pirazol-3-il)oximetil]fenil]-N-meth-oxi-carbamato (A.1.22), 1-[3-cloro-2-[[1-(4-clorofenil)-1H-pirazol-3-il]oximetil]fenil]-4-metil-tetrazol-5-ona (A.1.23), 1-[3-bromo-2-[[1-(4-clorofenil)pirazol-3-il]oximetil]fenil]-4-metil-tetrazol-5-ona (A.1.24), 1-[2-[[1-(4-clorofenil)pirazol-3-il]oximetil]-3-metil-fenil]-4-metil-tetrazol-5-ona (A.1.25), 1-[2-[[1-(4-clorofenil)pirazol-3-il]oximetil]-3-fluoro-fenil]-4-metil-tetrazol-5-ona (A.1.26), 1-[2-[[1-(2,4-diclorofenil)pirazol-3-il]oximetil]-3-fluoro-fenil]-4-metil-tetrazol-5-ona (A.1.27), 1-[2-[[4-(4-clorofenil)tiazol-2-il]oximetil]-3-metil-fenil]-4-metil-tetrazol-5-ona (A.1.28), 1-[3-cloro-2-[[4-(p-tolil)tiazol-2-il]oximetil]fenil]-4-metil-tetrazol-5-ona (A.1.29), 1-[3-ciclopropil-2-[[2-metil-4-(1-metilpirazol-3-il)fenoxi]metil]fenil]-4-metil-tetrazol-5-ona (A.1.30), 1-[3-(difluorometoxi)-2-[[2-metil-4-(1-metilpirazol-3-il)fenoxi]metil]fenil]-4-metil-tetrazol-5-ona (A.1.31), 1-metil-4-[3-metil-2-[[2-metil-4-(1-metilpirazol-3-il)fenoxi]metil]fenil]tetrazol-5-ona (A.1.32), 1-metil-4-[3-metil-2-[[1-[3-(trifluorometil)fenil]-etilidenamino]oximetil]fenil]tetrazol-5-ona (A.1.33), (Z,2E)-5-[1-(2,4-diclorofenil)pirazol-3-il]oxi-2-metoxiimino-N,3-dimetil-pent-3-enamida (A.1.34), (Z,2E)-5-[1-(4-clorofenil)pirazol-3-il]oxi-2-metoxiimino-N,3-dimetil-pent-3-enamida (A.1.35), (Z,2E)-5-[1-(4-cloro-2-fluoro-fenil)pirazol-3-il]oxi-2-metoxiimino-N,3-dimetil-pent-3-enamida (A.1.36),
- inhibidores del complejo III en el sitio Q_i: ciazofamid (A.2.1), amisulbrom (A.2.2), [(3S,6S,7R,8R)-8-benzil-3-[(3-acetoxi-4-metoxi-piridin-2-carbonil)amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-il] 2-metilpropanoato (A.2.3), [(3S,6S,7R,8R)-8-benzil-3-[(3-acetoximetoxi)-4-metoxi-piridin-2-carbonil]amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-il] 2-metilpropanoato (A.2.4), [(3S,6S,7R,8R)-8-benzil-3-[(3-isobutoxicarboniloxi)-4-metoxi-piridin-2-carbonil]amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-il] 2-metilpropanoato (A.2.5), [(3S,6S,7R,8R)-8-benzil-3-[(3-(1,3-benzodioxol-5-ilmetoxi)-4-metoxi-piridin-2-carbonil]amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-il] 2-metilpropanoato (A.2.6); (3S,6S,7R,8R)-3-[[[(3-hidroxi-4-metoxi-2-piridinil)carbonil]amino]-6-metil-4,9-dioxo-8-(fenilmetil)-1,5-dioxonan-7-il] 2-metilpropanoato (A.2.7), (3S,6S,7R,8R)-8-benzil-3-[(3-isobutiriloxi)metoxi]-4-metoxipicolinamido]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-il isobutirato (A.2.8);
- inhibidores del complejo II (por ejemplo, carboxamidas): benodanil (A.3.1), benzovindiflupir (A.3.2), bixafen (A.3.3), boscalid (A.3.4), carboxin (A.3.5), fenfuram (A.3.6), fluopiram (A.3.7), flutolanil (A.3.8), fluxapiroxad (A.3.9), furametpir (A.3.10), isofetamid (A.3.11), isopirazam (A.3.12), me-pronil (A.3.13), oxicarboxin (A.3.14), penflufen (A.3.14), pentiopirad (A.3.15), sedaxano (A.3.16), tecloftalam (A.3.17), tifluzamida (A.3.18), N-(4'-trifluorometiltiobifenil-2-il)-3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida (A.3.19), N-(2-(1,3,3-trimetil-butil)-fenil)-1,3-dimetil-5-fluoro-1H-pirazol-4-carboxamida (A.3.20), 3-(difluorometil)-1-metil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida (A.3.21), 3-(trifluorometil)-1-metil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida (A.3.22), 1,3-dimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida (A.3.23), 3-(trifluorometil)-1,5-dimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida (A.3.24), 1,3,5-trimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida (A.3.25), N-(7-fluoro-1,1,3-trimetil-indan-4-il)-1,3-dimetil-pirazol-4-carboxamida (A.3.26), N-[2-(2,4-diclorofenil)-2-metoxi-1-metil-etil]-3-(difluorometil)-1-metil-pirazol-4-carboxamida (A.3.27);
- otros inhibidores de respiración (por ejemplo, complejo I, desacopladores): diflumetorim (A.4.1), (5,8-difluoro-quinazolin-4-il)-2-[2-fluoro-4-(4-trifluorometilpiridin-2-iloxi)-fenil]-etil]-amina (A.4.2); derivados de nitrofenilo: binapacril (A.4.3), dinobuton (A.4.4), dinocap (A.4.5), fluzinam (A.4.6); ferimzona (A.4.7); compuestos organometálicos: sales de fentina, tal como acetato de fentina (A.4.8), cloruro de fentina (A.4.9) o hidróxido de fentina (A.4.10); ametoctradina (A.4.11); y siltiofam (A.4.12);

B) Inhibidores de la biosíntesis de esteroides (fungicidas SBI)

- inhibidores de C14 demetilasa (DMI fungicidas): triazoles: azaconazol (B.1.1), bitertanol (B.1.2), bromuconazol (B.1.3), ciproconazol (B.1.4), difenoconazol (B.1.5), diniconazol (B.1.6), diniconazol-M (B.1.7), epoxiconazol (B.1.8), fenbuconazol (B.1.9), fluquinconazol (B.1.10), flusilazol (B.1.11), flutriafol (B.1.12), hexaconazol (B.1.13), imibenconazol (B.1.14),

- ipconazol (B.1.15), metconazol (B.1.17), miclobutanil (B.1.18), oxpoconazol (B.1.19), paclobutrazol (B.1.20), penconazol (B.1.21), propiconazol (B.1.22), protioconazol (B.1.23), simeconazol (B.1.24), tebuconazol (B.1.25), tetraconazol (B.1.26), triadimefon (B.1.27), triadimenol (B.1.28), triticonazol (B.1.29), uniconazol (B.1.30), 1-[rel-(2S;3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)-oxiranilmetil]-5-tiocianato-1H-[1,2,4]triazolo (B.1.31), 2-[rel-(2S;3R)-3-(2-cloro-fenil)-2-(2,4-difluorofenil)-oxiranilmetil]-2H-[1,2,4]triazol-3-ol (B.1.32), 2-[2-cloro-4-(4-clorofenoxi)fenil]-1-(1,2,4-triazol-1-il)pentan-2-ol (B.1.33), 1-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluoro-metil)fenil]-1-ciclopropil-2-(1,2,4-triazol-1-il)etanol (B.1.34), 2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol (B.1.35), 2-[2-cloro-4-(4-clorofenoxi)fenil]-1-(1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol (B.1.36), 2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-3-metil-1-(1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol (B.1.37), 2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol (B.1.38), 2-[2-cloro-4-(4-clorofenoxi)fenil]-3-metil-1-(1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol (B.1.39), 2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1,2,4-triazol-1-il)pentan-2-ol (B.1.40), 2-[4-(4-fluorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol (B.1.41), 2-[2-cloro-4-(4-clorofenoxi)fenil]-1-(1,2,4-triazol-1-il)pent-3-in-2-ol (B.1.51); imidazoles: imazalil (B.1.42), pefurazoato (B.1.43), procloraz (B.1.44), triflumizol (B.1.45); pirimidinas, piridinas y piperazinas: fenarimol (B.1.46), nuarimol (B.1.47), pirifenox (B.1.48), triforina (B.1.49), [3-(4-cloro-2-fluoro-fenil)-5-(2,4-difluorofenil)isoxazol-4-il]-(3-piridil)metanol (B.1.50);
- 15 - Inhibidores de delta14-reductasa: aldimofo (B.2.1), dodemorf (B.2.2), dodemorf-acetato (B.2.3), fenpropimorf (B.2.4), tridemorf (B.2.5), fenpropidina (B.2.6), piperalina (B.2.7), espirox-amina (B.2.8);
- Inhibidores de 3-ceto-reductasa: fenhexamida (B.3.1);
- C) Inhibidores de la síntesis de ácidos nucleicos
- 20 - fungicidas de aminoácidos acíclicos o fenilamidas: benalaxil (C.1.1), benalaxil-M (C.1.2), kiralaxil (C.1.3), metalaxil (C.1.4), metalaxil-M (mefenoxam, C.1.5), ofurace (C.1.6), oxadixilo (C.1.7);
- otros: himexazol (C.2.1), octilina (C.2.2), ácido oxolínico (C.2.3), bupirinato (C.2.4), 5-fluorocitosina (C.2.5), 5-fluoro-2-(p-tolilmetoxi)pirimidin-4-amina (C.2.6), 5-fluoro-2-(4-fluorofenilmetoxi)pirimidin-4-amina (C.2.7);
- 25 D) Inhibidores de la división celular y citoesqueleto
- inhibidores de la tubulina, tal como bencimidazoles, tiofanatos: benomilo (D1.1), carbendazima (D1.2), fuberidazol (D1.3), tiabendazol (D1.4), tiofanato-metilo (D1.5); triazolopirimidinas: 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina (D1.6);
- 30 - otros inhibidores de la división celular: dietofencarb (D2.1), etaboxam (D2.2), pencicuron (D2.3), fluopicolida (D2.4), zoxamida (D2.5), metrafenona (D2.6), piriofenona (D2.7);
- E) Inhibidores de la síntesis de aminoácidos y proteínas
- 35 - inhibidores de la síntesis de metionina (anilino-pirimidinas): ciprodinilo (E.1.1), mepanipirima (E.1.2), pirimetanilo (E.1.3);
- inhibidores de la síntesis de proteínas: blasticidina-S (E.2.1), kasugamicina (E.2.2), clorhidrato de kasugamicina-hidrato (E.2.3), mildiomicina (E.2.4), estreptomycin (E.2.5), oxitetraciclina (E.2.6), polioxina (E.2.7), validamicina A (E.2.8);
- 40 F) Inhibidores de la transducción de señales
- MAP /inhibidores de la histidina cinasa: fluoroimida (F.1.1), iprodiona (F.1.2), procimidona (F.1.3), vinclozolina (F.1.4), fenpiclonil (F.1.5), fludioxonil (F.1.6);
- 45 - Inhibidores de la proteína G: quinoxifeno (F.2.1);
- G) Inhibidores de síntesis de lípidos y membranas
- Inhibidores de la biosíntesis de fosfolípidos: edifenfos (G.1.1), iprobenfos (G.1.2), pirazofos (G.1.3), isoprotilano (G.1.4);
- 50 - peroxidación lipídica: dicloran (G.2.1), quintoceno (G.2.2), tecnaceno (G.2.3), tolclorós-metilo (G.2.4), bifenilo (G.2.5), cloroneb (G.2.6), etridiazol (G.2.7);
- biosíntesis de fosfolípidos y depósito en la pared celular: ácido dimetomorfo (G.3.1), flumorf (G.3.2), mandipropamida (G.3.3), pirimorfo (G.3.4), bentiavalcarbo (G.3.5), iprovalicarbo (G.3.6), valifenalato (G.3.7) y éster N-(1-(1-(4-ciano-fenil)etanosulfonil)-but-2-il)carbámico-(4-fluorofenil) (G.3.8);
- 55 - compuestos que afectan la permeabilidad de membrana celular y ácidos grasos: propamocarb (G.4.1);
- inhibidores de la amida hidrolasa de ácido graso: oxatiapiprolin (G.5.1), 2-{3-[2-(1-{[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il}fenil me-tanesulfonate (G.5.2), 2-{3-[2-(1-{[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il) 1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il}-3-clorofenil metanosulfonato (G.5.3);
- 60 H) Inhibidores con acción en múltiples sitios
- sustancias activas inorgánicas: Mezcla de Burdeos (H.1.1), acetato de cobre (H.1.2), hidróxido de cobre (H.1.3), oxiclouro de cobre (H.1.4), sulfato de cobre básico (H.1.5), azufre (H.1.6);
- 65 - tio- y ditiocarbamatos: ferbam (H.2.1), mancoceb (H.2.2), maneb (H.2.3), metam (H.2.4), metiram (H.2.5), propineb (H.2.6), tiram (H.2.7), zineb (H.2.8), ziram (H.2.9);
- compuestos organoclorados (por ejemplo, ftalimidas, sulfamidas, cloronitrilos): anilazina (H.3.1), clorotalonil (H.3.2),

captafol (H.3.3), captan (H.3.4), folpet (H.3.5), diclofluanida (H.3.6), diclorofeno (H.3.7), hexaclorobenceno (H.3.8), pentaclorofenole (H.3.9) y sus sales, ftalida (H.3.10), toliifluanida (H.3.11), N-(4-cloro-2-nitro-fenil)-N-etil-4-metilbencenosulfonamida (H.3.12);

- 5 - guanidinas y otros: guanidina (H.4.1), dodina (H.4.2), base libre de dodina (H.4.3), guazatina (H.4.4), guazatina-acetato (H.4.5), iminotadina (H.4.6), iminotadina-triacetato (H.4.7), iminotadina-tris (albesilato) (H.4.8), ditianona (H.4.9), 2,6-dimetil-1H,5H-[1,4] ditiino [2,3-c:5,6-c']dipirrol-1,3,5,7(2H,6H)-tetraona (H.4.10);

I) Inhibidores de la síntesis de la pared celular

- 10 - inhibidores de la síntesis de glucano: validamicina (I.1.1), polioxina B (I.1.2);
- inhibidores de la síntesis de melanina: piroquilón (I.2.1), triciclazol (I.2.2), carpropamida (I.2.3), diciclotmet (I.2.4), fenoxanilo (I.2.5);

J) Inductores de defensa vegetal

- 15 - acibenzolar-S-metil (J.1.1), probenazol (J.1.2), isotianil (J.1.3), tiadinil (J.1.4), prohexadiona-calcio (J.1.5); fosfonatos: fosetil (J.1.6), fosetil-aluminio (J.1.7), ácido fosforoso y sus sales (J.1.8), bicarbonato de potasio o sodio (J.1.9);

K) Modo desconocido de acción

- 20 - bronopol (K.1.1), chinometonate (K.1.2), ciflufenamida (K.1.3), cimoxanil (K.1.4), dazomet (K.1.5), debacarb (K.1.6), diclomezina (K.1.7), difenzoquat (K.1.8), difenzoquat-metilsulfato (K.1.9), difenilamina (K.1.10), fempirazamina (K.1.11), flumetover (K.1.12), flusulfamida (K.1.13), flutianil (K.1.14), metasulfocarb (K.1.15), nitrapirina (K.1.16), nitroal-isopropil (K.1.18), oxatia-piprolina (K.1.19), tolprocarb (K.1.20), oxo-copin (K.1.21), proquinazid (K.1.22), tequinbuflo (K.1.23),
25 tecloftalam (K.1.24), triazóxido (K.1.25), 2-butoxi-6-yodo-3-propilcromen-4-ona (K.1.26), 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{5-[2-(prop-2-in-1-ilo)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il})piperidin-1-il]etanona (K.1.27), 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{5-[2-fluoro-6-(prop-2-in-1-ilo)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il})piperidin-1-il]etanona (K.1.28), 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{5-[2-cloro-6-(prop-2-in-1-ilo)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il})piperidin-1-il]etanona (K.1.29), N-(ciclopropilmetoxiimino-(6-difluoro-metoxi-2,3-difluoro-fenil)-metil)-2-fenil acetamida (K.1.30), N'-(4-(4-cloro-3-trifluorometil-fenoxi)-2,5-dimetil-fenil)-N-etil-N-metil formamida (K.1.31), N'-(4-(4-fluoro-3-trifluorometil-fenoxi)-2,5-dimetil-fenil)-N-etil-N-metil formamida (K.1.32), N'-(2-metil-5-trifluorometil-4-(3-trimetilsilanil-propoxi)-fenil)-N-etil-N-metil formamida (K.1.33), N'-(5-difluorometil-2-metil-4-(3-trimetilsilanil-propoxi)-fenil)-N-etil-N-metil formamida (K.1.34), metoxi-éster 6-terc-butil-8-fluoro-2,3-dimetil-quinolin-4-il ácido acético (K.1.35), 3-[5-(4-metilfenil)-2,3-dimetil-isoxazolidin-3-il]-piridina (K.1.36), 3-[5-(4-cloro-fenil)-2,3-dimetil-isoxazolidin-3-il]-piridina (pirisoxazol) (K.1.37), amida del ácido N-(6-metoxi-piridin-3-il) ciclopropanocarboxílico (K.1.38), 5-cloro-1-(4,6-dimetoxi-pirimidin-2-il)-2-metil-1H-benzimidazol (K.1.39), 2-(4-cloro-fenil)-N-[4-(3,4-dimetoxi-fenil)-isoxazol-5-il]-2-prop-2-iniloacetamida, (Z)-3-amino-2-ciano-3-fenil-prop-2-enoato de etilo (K.1.40), picarbutrazox (K.1.41), N-[6-[(Z)-[(1-metiltetrazol-5-il)-fenil-metilen]amino]oximetil]-2-piridil]carbamato de pentilo (K.1.42), 2-[2-[(7,8-difluoro-2-metil-3-quinolil)oxi]-6-fluoro-fenil]propan-2-ol (K.1.43), 2-[2-fluoro-6-[(8-fluoro-2-metil-3-quinolil)oxi]fenil]propan-2-ol (K.1.44), 3-(5-fluoro-3,4,4-tetrametil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina (K.1.45), 3-(4,4-difluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina (K.1.46), 3-(4,4,5-trifluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina (K.1.47), 9-fluoro-2,2-dimetil-5-(3-quinolil)-3H-1,4-benzoxazepina (K.1.48).

- 45 Se conocen los fungicidas descritos por nombres comunes, su preparación y su actividad, por ejemplo, contra hongos dañinos (cf.: <http://www.alanwood.net/pesticides/>); estas sustancias están disponibles comercialmente.

- También se conocen los fungicidas descritos por la nomenclatura IUPAC, su preparación y su actividad pesticida (cf. Can. J. Plant Sci.48(6), 587-94, 1968; EP-A 141317; EP-A 152031; EP-A 226917; EP-A 243970; EP-A 256503; EP-A 428941; EP-A 532022; EP-A 1028125; EP-A 1035122; EP-A 1201648; EP-A 1122244, JP 2002316902; DE 19650197; DE 10021412; DE 102005009458; US 3,296,272; US 3,325,503; WO 98/46608; WO 99/14187; WO 99/24413; WO 99/27783; WO 00/29404; WO 00/46148; WO 00/65913; WO 01/54501; WO 01/56358; WO 02/22583; WO 02/40431; WO 03/10149; WO 03/11853; WO 03/14103; WO 03/16286; WO 03/53145; WO 03/61388; WO 03/66609; WO 03/74491; WO 04/49804; WO 04/83193; WO 05/120234; WO 05/123689; WO 05/123690; WO 05/63721; WO 05/87772; WO 05/87773; WO 06/15866; WO 06/87325; WO 06/87343; WO 07/82098; WO 07/90624, WO 11/028657, WO2012/168188, WO 2007/006670, WO 2011/77514; WO13/047749, WO 10/069882, WO 13/047441, WO 03/16303, WO 09/90181, WO 13/007767, WO 13/010862, WO 13/127704, WO 13/024009, WO 13/024010 y WO 13/047441, WO 13/162072, WO 13/092224, WO 11/135833).

Biopesticidas

- 60 Los compañeros de mezcla adecuados para los compuestos de la presente invención también incluyen biopesticidas. Los biopesticidas se han definido como una forma de pesticidas basados en microorganismos (bacterias, hongos, virus, nematodos, etc.) o productos naturales (compuestos, tal como metabolitos, proteínas o extractos de fuentes biológicas u otras fuentes naturales) (Agencia de Protección Ambiental de los Estados Unidos: <http://www.epa.gov/pesticides/biopesticides/>). Los biopesticidas se clasifican en dos clases principales, pesticidas microbianos y bioquímicos:

(1) Los pesticidas microbianos consisten en bacterias, hongos o virus (y a menudo incluyen los metabolitos que producen las bacterias y los hongos). Los nematodos entomopatógenos también se clasifican como pesticidas microbianos, aunque son multicelulares.

(2) Los pesticidas bioquímicos son sustancias naturales o estructuralmente similares y funcionalmente idénticas a una sustancia de origen natural y extractos de fuentes biológicas que controlan las plagas o proporcionan otros usos protectores de los cultivos, tal como se definen posteriormente, pero que tienen un modo de acción no tóxico (como la regulación del crecimiento o del desarrollo, los atrayentes, los repelentes o los activadores de la defensa (por ejemplo, la resistencia inducida) y son relativamente no tóxicos para los mamíferos.

Los biopesticidas contra las enfermedades de los cultivos ya se han establecido en una variedad de cultivos. Por ejemplo, los biopesticidas ya juegan un papel importante en el control de las enfermedades por moho veloso. Sus beneficios incluyen: un intervalo de 0 días antes de la cosecha, la capacidad de usar bajo presión de enfermedad moderada a severa y la capacidad de usar en mezcla o en un programa de rotación con otros pesticidas registrados.

Una importante área de crecimiento para los biopesticidas está en el área de tratamientos de semillas y remediación del suelo. Los tratamientos de semillas biopesticidas se utilizan, por ejemplo, para controlar patógenos fúngicos transmitidos por el suelo que causan podredumbre de semillas, amortiguación, podredumbre de raíces y plagas de plántulas. También se pueden usar para controlar patógenos fúngicos internos transmitidos por semillas, así como patógenos fúngicos que se encuentran en la superficie de la semilla. Muchos productos biopesticidas también muestran capacidades para estimular las defensas del huésped de la planta y otros procesos fisiológicos que pueden hacer que los cultivos tratados sean más resistentes a una variedad de tensiones bióticas y abióticas o pueden regular el crecimiento de la planta. Muchos productos biopesticidas también muestran capacidades para estimular la salud de las plantas, el crecimiento de las plantas y/o la actividad de mejora del rendimiento.

La siguiente lista de biopesticidas, junto con la cual se pueden usar los compuestos de la presente invención, pretende ilustrar las posibles combinaciones, pero no las limita:

L) Biopesticidas

L1) Pesticidas microbianos con actividad activadora fungicida, bactericida, viricida y/o de defensa vegetal: *Ampelomyces quisqualis*, *Aspergillus flavus*, *Aureobasidium pullulans*, *Bacillus altitudinis*, *B. amyloliquefaciens*, *B. megaterium*, *B. mojavensis*, *B. mycoides*, *B. pumilus*, *B. simplex*, *B. solisalsi*, *B. subtilis*, *B. subtilis* var. *amyloliquefaciens*, *Candida oleophila*, *C. saitoana*, *Clavibacter michiganensis* (bacteriófagos), *Coniothyrium minitans*, *Cryphonectria parasitica*, *Cryptococcus albidus*, *Dilofospora alopecuri*, *Fusarium oxysporum*, *Clonostachys rosea* f. *catenulate* (también conocida como *Gliocladium catenulatum*), *Gliocladium roseum*, *Lysobacter antibioticus*, *L. enzymogenes*, *Metschnikowia fructicola*, *Microdochium dimerum*, *Microsphaeropsis ochracea*, *Muscodor albus*, *Paenibacillus alvei*, *Paenibacillus polymyxa*, *Pantoea vagans*, *Penicillium bilaiae*, *Phlebiopsis gigantea*, *Pseudomonas* sp., *Pseudomonas cloraphis*, *Pseudozyma flocculosa*, *Pichia anomala*, *Pythium oligandrum*, *Sphaerodes mycoparasitica*, *Streptomyces griseoviridis*, *S. lydicus*, *S. violaceusniger*, *Talaromyces flavus*, *Trichoderma asperelloides*, *T. asperellum*, *T. atroviride*, *T. fertile*, *T. gamsii*, *T. harmatum*, *T. harzianum*, *T. polysporum*, *T. stromaticum*, *T. virens*, *T. viride*, *Typhula phacorrhiza*, *Ulocladium oudemansii*, *Verticillium dahlia*, virus del mosaico amarillo del calabacín (cepa avirulenta);

L2) Pesticidas bioquímicos con actividad fungicida, bactericida, viricida y/o activadora de la defensa vegetal: proteína harpina, extracto de *Reynoutria sachalinensis*;

L3) Pesticidas microbianos con actividad insecticida, acaricida, molusquicida y/o nematocida: *Agrobacterium radiobacter*, *Bacillus cereus*, *B. firmus*, *B. thuringiensis*, *B. thuringiensis* ssp. *aizawai*, *B. t. ssp. israelensis*, *B. t. ssp. galleriae*, *B. t. ssp. kurstaki*, *B. t. ssp. tenebrionis*, *Beauveria bassiana*, *B. brongniartii*, *Burkholderia* spp., *Chromobacterium subtsugae*, *Cydia pomonella granulovirus* (CpGV), *Cryptophlebia leucotreta granulovirus* (CrleGV), *Flavobacterium* spp., *Helicoverpa armigera* nucleopolyhedrovirus (HearNPV) nucleopolihedrovirus, *Helicoverpa zea* (HzNPV), nucleopolihedrovirus cápsida individual *Helicoverpa zea* (HzSNPV), *Heterorhabditis bacteriophora*, *Isaria fumosorosea*, *Lecanicillium longisporum*, *L. muscarium*, *Metarhizium anisopliae*, *Metarhizium an-isopliae* var. *anisopliae*, *M. anisopliae* var. *acridum*, *Nomuraea rileyi*, *Paecilomyces fumosoroseus*, *P. lilacinus*, *Paenibacillus popilliae*, *Pasteuria* spp., *P. nishizawae*, *P. penetrans*, *P. ramosa*, *P. thornea*, *P. usgae*, *Pseudomonas fluorescens*, *Spodoptera littoralis* nucleopolyhedrovirus (SpliNPV), *Steinernema carpocapsae*, *S. feltiae*, *S. kraussei*, *Streptomyces galbus*, *S. microflavus*;

L4) Pesticidas bioquímicos con actividad insecticida, acaricida, molusquicida, feromona y/o nematocida: L-carvona, citral, (E,Z) -7,9-dodecadien-1-ilo acetato, formiato de etilo, (E,Z)-2,4-etil decadienoato (éster de pera), (Z,Z,E)-7,11,13-hexadecatrienal, butirato de heptilo, miristato de isopropilo, senecioato de lavanulilo, cis-jasmona, 2-metil 1-butanol, metil eugenol, metil jasmonato, (E,Z)-2,13-octadecadien-1-ol, (E,Z)-2,13-octadecadien-1-ol acetato, (E,Z)-3,13-octadecadien-1-ol, R-1-octen-3-ol, pentatermanona, (E,Z,Z)-3,8,11-tetradecatrienil acetato, (Z,E)-9,12-tetradecadien-1-il acetato, Z-7-tetradecen-2-ona, Z-9-tetradecen-1-il acetato, Z-11-tetradecen-1-ol, extracto de *Chenopodium ambrosioides*, aceite de Neem, extracto de Quillay;

L5) Pesticidas microbianos con actividad reductora del estrés vegetal, reguladora del crecimiento vegetal, promotora del crecimiento vegetal y/o potenciadora del rendimiento: *Azospirillum amazonense*, *A. brasilense*, *A. lipoferum*, *A. irakense*, *A. halopraeferens*, *Bradyrhizobium* spp., *B. elkanii*, *B. japonicum*, *B. liaoningense*, *B. lupini*, *Delftia acidovorans*, *Glomus intraradices*, *Mesorhizobium* spp., *Rhizobium leguminosarum* bv. *phaseoli*, *R. l. bv. trifolii*, *R. l. bv. viciae*, *R. tropici*, *Sinorhizobium meliloti*.

- Los biopesticidas del grupo L1) y/o L2) también pueden tener actividad insecticida, acaricida, molusquicida, feromona, nematocida, reductora del estrés vegetal, reguladora del crecimiento vegetal, promotora del crecimiento vegetal y/o potenciadora del rendimiento. Los biopesticidas del grupo L3) y/o L4) también pueden tener actividad fungicida, bactericida, viricida, activadora de defensa vegetal, reductora del estrés vegetal, reguladora del crecimiento vegetal, promotora del crecimiento vegetal y/o potenciadora del rendimiento. Los biopesticidas del grupo L5) también pueden tener actividad fungicida, bactericida, viricida, activador de defensa vegetal, insecticida, acaricida, molusquicida, feromona y/o nematocida.
- Muchos de estos biopesticidas se han depositado bajo los números de depósito mencionados en la presente (los prefijos tal como ATCC o DSM se refieren al acrónimo de la colección de cultivo respectiva, para detalles ver, por ejemplo, aquí: http://www.wfcc.info/ccinfo/collection/by_acronym/), se mencionan en la literatura, se registran y/o están disponibles comercialmente: mezclas de *Aureobasidium pullulans* DSM 14940 y DSM 14941 aislado en 1989 en Konstanz, Alemania (por ejemplo, blastosporas en BlossomProtect® de bio-ferm GmbH, Austria), *Azospirillum brasilense* Sp245 originalmente aislado en el reactor de trigo del sur de Brasil (Passo Fundo) al menos antes de 1980 (BR 11005; por ejemplo, GELFIX® Gramíneas de BASF Agricultural Specialties Ltd., Brasil), cepas de *A. brasilense* Ab-V5 y Ab-V6 (por ejemplo, en AzoMax de Novozymes BioAg Produtos papra Agricultura Ltda., Quattro Barras, Brasil o Simbiose-Maíz® de Simbiose-Agro, Brasil; Plant Soil 331, 413-425, 2010), *Bacillus amyloliquefaciens* cepa AP-188 (NRRL B-50615 y B-50331; US 8,445,255); *B. amyloliquefaciens* spp. plantarum D747 aislado del aire en Kikugawa-shi, Japón (US 20130236522 A1; Ferm BP-8234; por ejemplo, Double Nickel™ 55 WDG de Certis LLC, EE. UU.), *B. amyloliquefaciens* spp. plantarum FZB24 aislado de suelo en Brandeburgo, Alemania (también llamado SB3615; DSM 96-2; J. Plant Dis. Prot. 105, 181-197, 1998; por ejemplo, Taegro® de Novozyme Biologicals, Inc., EUA), *B. amyloliquefaciens* spp. plantarum FZB42 aislado de suelo en Brandeburgo, Alemania (DSM 23117; J. Plant Dis. Prot. 105, 181-197, 1998; por ejemplo, RhizoVital® 42 de AbiTEP GmbH, Alemania), *B. amyloliquefaciens* spp. plantarum MBI600 aislado de frijol faba en Sutton Bonington, Nottinghamshire, Reino Unido al menos antes de 1988 (también llamado 1430; NRRL B-50595; US 2012/0149571 A1; por ejemplo, Integral® de BASF Corp., EE. UU.), *B. amyloliquefaciens* spp. plantarum QST-713 aislado de un huerto de melocotones en 1995 en California, EE. UU. (NRRL B-21661; por ejemplo, Serenade® MAX de Bayer Crop Science LP, EE. UU.), *B. amyloliquefaciens* spp. plantarum TJ1000 aislado en 1992 en South Dakota, EE. UU. (también llamado 1BE; ATCC BAA-390; CA 2471555 A1; por ejemplo, QuickRoots™ de TJ Technologies, Watertown, SD, EUA), *B. firmus* CNCM I-1582, una variante de la cepa parental EIP-N1 (CNCM I-1556) aislada del suelo del área central de la llanura de Israel (WO 2009/126473, US 6,406,690; por ejemplo, Votivo® de Bayer CropScience LP, EUA), *B. pumilus* GHA 180 aislado de rizosfera de manzano en México (IDAC 260707-01; por ejemplo, PRO-MIX® BX de Premier Horticulture, Quebec, Canadá), *B. pumilus* INR-7 denominado BU-F22 y BU-F33 aislado al menos antes de 1993 de pepino infestado por *Erwinia tra-cheiphila* (NRRL B-50185, NRRL B-50153; US 8,445,255), *B. pumilus* KFP9F aislado de la rizósfera de gramíneas en Sudáfrica al menos antes de 2008 (NRRL B-50754; WO 2014/029697; por ejemplo, BAC-UP o FUSION-P de BASF Agricultural Specialties (Pty) Ltd., Sudáfrica), *B. pumilus* QST 2808 se aisló del suelo recogido en Pohnpei, Estados Federados de Micronesia, en 1998 (NRRL B-30087; por ejemplo, Sonata® o Ballad® Plus de Bayer Crop Science LP, EE. UU.), *B. simplex* ABU 288 (NRRL B-50304; US 8,445,255), *B. subtilis* FB17 también llamado UD 1022 o UD10-22 aislado de raíces de remolacha roja en América del Norte (ATCC PTA-11857; Sistema. Appl. Microbiol. 27, 372-379, 2004; US 2010/0260735; WO 2011/109395); *B. thuringiensis* ssp. aizawai ABTS-1857 aislado de suelo tomado de un césped en Ephraim, Wisconsin, EE. UU., en 1987 (también llamado ABG-6346; ATCC SD-1372; por ejemplo, XenTari® de BioFa AG, Münsingen, Alemania), *B. t. ssp. kurstaki* ABTS-351 idéntico a HD-1 aislado en 1967 de larvas negras de gusano rosado enfermo en Brownsville, Texas, EE. UU. (ATCC SD-1275; por ejemplo, Dipel® DF de Valent BioSciences, IL, EE. UU.), *B. t. ssp. kurstaki* SB4 aislado de cadáveres de larvas de *E. saccharina* (NRRL B-50753; por ejemplo, Beta Pro® de BASF Agricultural Specialties (Pty) Ltd., Sudáfrica), *B. t. ssp. tenebrionis* NB-176-1, un mutante de la cepa NB-125, una cepa de tipo salvaje aislada en 1982 de una pupa muerta del escarabajo *Tenebrio molitor* (DSM 5480; EP 585215 B1; por ejemplo, Novodor® de Valent BioSciences, Suiza), *Beauveria bassiana* GHA (ATCC 74250; por ejemplo, BotaniGard® 22WGP de Laverlam Int. Corp., EE. UU.), *B. bassiana* JW-1 (ATCC 74040; por ejemplo, Naturalis® de CBC (Europa) S.R.L., Italia), *B. bassiana* PPRI 5339 aislado de la larva del escarabajo de la tortuga *Conchyloctenia punctata* (NRRL 50757; por ejemplo, BroadBand® de BASF Agricultural Specialties (Pty) Ltd., Sudáfrica), *Bradyrhizobium elkanii* cepas SEMIA 5019 (también llamada 29W) aislada en Río de Janeiro, Brasil y SEMIA 587 aislada en 1967 en el Estado de Rio Grande do Sul, de un área previamente inoculada con un aislado norteamericano, y utilizada en inoculantes comerciales desde 1968 (Appl. Environ. Microbiol. 73(8), 2635, 2007; por ejemplo, GELFIX 5 de BASF Agri-cultural Specialties Ltd., Brasil), *B. japonicum* 532c aislado del campo de Wisconsin en EE. UU. (Nitragin 61A152; Can. J. Plant. Sci. 70, 661-666, 1990; por ejemplo, en Rhizoflo®, Histick®, Hicoat® Super de BASF Agricultural Specialties Ltd., Canadá), *B. japonicum* E-109 variante de la cepa USDA 138 (INTA E109, SEMIA 5085; Eur. J. Soil Biol. 45, 28-35, 2009; Biol. Fertil. Soils 47, 81-89, 2011); cepas de *B. japonicum* depositadas en SEMIA conocidas a partir de Appl. Environ. Microbiol. 73(8), 2635, 2007: SEMIA 5079 aislado del suelo en la región de Cerrados, Brasil por Embrapa-Cerrados utilizado en inocuos comerciales desde 1992 (CPAC 15; por ejemplo, GELFIX 5 o SE ADHIEREN 60 de BASF Agricultural Specialties Ltd., Brasil), *B. japonicum* SEMIA 5080 obtenido bajo condiciones de laboratorio por Embrapa-Cerrados en Brasil y utilizado en inoculantes comerciales desde 1992, siendo una variante natural de SEMIA 586 (CB1809) originalmente aislado en EE. UU. (CPAC 7; por ejemplo, GELFIX 5 o ADHERE 60 de BASF Agricultural Specialties Ltd., Brasil); Burkholderia sp. A396 aislado de suelo en Nikko, Japón, en 2008 (NRRL B-50319; WO 2013/032693; Marrone Bio Innovations, Inc., EUA), Coniothyrium MINITANS CON/M/91-08 aislado de colza oleaginosa (WO 1996/021358; DSM 9660; por ejemplo, Contans® WG, Intercept® WG de Bayer CropScience AG, Alemania), proteína harpina (alfa-beta) (Science 257, 85-88, 1992; por ejemplo, Messenger™ o HARP-N-Tek de Plant Health Care plc, Reino Unido), nucleo-polihedrovirus de

Helicoverpa armigera (HearNPV) (J. Invertebrate Pathol.107, 112–126, 2011; por ejemplo, Helicovex® de Ader-matt Biocontrol, Suiza; Diplomata® de Koppert, Brasil; Vivus® Max de AgBiTech Pty Ltd., Queensland, Australia), nucleopolihedrovirus cápsida individual *Helicoverpa zea* (HzSNPV) (por ejemplo, Gemstar® de Certis LLC, EE. UU.), nucleopoliedrovirus de *Helicoverpa zea* ABA-NPV-U (p. ej. Heli-gen® de AgBiTech Pty Ltd., Queensland, Australia), *Heterorhabditis bacteriophora* (por ejemplo, Nemasys® G de BASF Agricultural Specialities Limited, Reino Unido), *Isaria fumosorosea* Apopka-97 aislada de chinche harinosa en gynura en Apopka, Florida, EE. UU. (ATCC 20874; Biocontrol Science Technol. 22(7), 747-761, 2012; por ejemplo, PFR-97™ o PreFeRal® de Certis LLC, EE. UU.), *Metarhizium anisopliae* var. *anisopliae* F52 también llamado 275 o V275 aislado de polilla de codel en Austria (DSM 3884, ATCC 90448; por ejemplo, Met52® Novozymes Biologicals BioAg Group, Canadá), *Metschnikowia fructicola* 277 aislado de uvas en la parte central de Israel (US 6,994,849; NRRL y-30752; por ejemplo, anteriormente Shemer® de Agrogreen, Israel), *Paecilomyces ilacinus* 251 aislado de huevos de nematodo infectados en Filipinas (AGAL 89/030550; WO1991/02051; Crop Protection 27, 352-361, 2008; por ejemplo, BioAct® de Bayer CropScience AG, Alemania y MeloCon® de Certis, EE. UU.), *Paenibacillus alvei* NAS6G6 aislado de la rizosfera de gramíneas en Sudáfrica al menos antes de 2008 (WO 2014/029697; NRRL B-50755; por ejemplo, BAC-UP de BASF Agricultural Specialities (Pty) Ltd., Sudáfrica), *Pasteuria nishizawae* Pn1 aislado de un campo de soja a mediados de la década del 2000 en Illinois, EE. UU. (ATCC SD-5833; Registro Federal 76(22), 5808, 2 de febrero de 2011; por ejemplo, Clariva™ PN de Syngenta Crop Protección, LLC, EE. UU.), *Penicillium bilaiae* (también llamada P. bilaii) cepas ATCC 18309 (= ATCC 74319), ATCC 20851 y/o ATCC 22348 (= ATCC 74318) originalmente aisladas de suelo en Alberta, Canadá (Fertilizer Res.39, 97-103, 1994; Can. J. Plant Sci.78(1), 91-102, 1998; US 5.026.417, WO 1995/017806; por ejemplo, Jump Start®, Provide® de Novozymes Biologicals BioAg Group, Canadá), Extracto de *Reynoutria sachalinensis* (EP 0307510 B1; p. ej. Regalia® SC de Marrone BioInnovations, Davis, CA, EUA o Milsana® de BioFa AG, Alemania), *Steinernema carpocapsae* (por ejemplo, Millenium® de BASF Agricultural Specialities Limited, Reino Unido), *S. feltiae* (por ejemplo, Nemashield® de BioWorks, Inc., EUA; Nemasys® de BASF Agricultural Specialities Limited, Reino Unido), *Streptomyces microflavus* NRRL B-50550 (WO 2014/124369; Bayer CropScience, Alemania), *Trichoderma asperelloides* JM41R aislado en Sudáfrica (NRRL 50759; también denominado T. fertile; por ejemplo, Trichoplus® de BASF Agricultural Specialities (Pty) Ltd., Sudáfrica), *T. harzianum* T-22 también llamado KRL-AG2 (ATCC 20847; BioControl 57, 687-696, 2012; por ejemplo, Plantshield® de Bio-Works Inc., EE. UU. o SabrEx™ de Advanced Biological Marketing Inc., Van Wert, OH, EE. UU.).

De acuerdo con la invención, el material sólido (materia seca) de los biopesticidas (con la excepción de aceites tal como aceite de Neem) se consideran como componentes activos (por ejemplo, que se obtendrán después del secado o evaporación del medio de extracción o suspensión en caso de formulaciones líquidas de los pesticidas microbianos).

De acuerdo con la presente invención, las relaciones en peso y los porcentajes utilizados en la presente para un extracto biológico tal como extracto de Quillay se basan en el peso total del contenido seco (material sólido) de los respectivos extractos.

Las relaciones de peso total de las composiciones que comprenden al menos un pesticida microbiano en forma de células microbianas viables que incluyen formas latentes, se pueden determinar usando la cantidad de CFU del microorganismo respectivo para calcular el peso total del componente activo respectivo con la siguiente ecuación de que 1×10^{10} CFU equivale a un gramo de peso total del componente activo respectivo. La unidad formadora de colonias es la medición de células microbianas viables, en particular células fúngicas y bacterianas. Además, en la presente "CFU" también se puede entender como la cantidad de nematodos individuales (juveniles) en caso de biopesticidas de nematodos (entomopatógenos), tal como *Steinernema feltiae*.

Cuando se emplean mezclas que comprenden pesticidas microbianos en la protección de cultivos, las tasas de aplicación varían preferentemente de aproximadamente 1×10^6 a 5×10^{15} (o más) CFU/ha, preferentemente de aproximadamente 1×10^8 a aproximadamente 1×10^{13} CFU/ha, e incluso más preferentemente de aproximadamente 1×10^9 a aproximadamente 1×10^{12} CFU/ha. En el caso de nematodos (entomopatógenos) como pesticidas microbianos (p. ej. *Steinernema feltiae*), las tasas de aplicación preferentemente varían de aproximadamente 1×10^5 a 1×10^{12} (o más), más preferentemente de 1×10^8 a 1×10^{11} , incluso más preferentemente de 5×10^8 a 1×10^{10} individuos (por ejemplo, en forma de huevos, juveniles o cualquier otra etapa viva, preferentemente en una etapa juvenil infectiva) por hectárea.

Cuando se emplean mezclas que comprenden pesticidas microbianos en el tratamiento de semillas, las tasas de aplicación con respecto al material de propagación vegetal preferentemente varían de aproximadamente 1×10^6 a 1×10^{12} (o más) CFU/semilla. Preferentemente, la concentración es de aproximadamente 1×10^6 a aproximadamente 1×10^9 CFU/semilla. En el caso de los pesticidas microbianos II, las tasas de aplicación con respecto al material de propagación vegetal también varían preferentemente de aproximadamente 1×10^7 a 1×10^{14} (o más) CFU por 100 kg de semilla, preferentemente de 1×10^9 a aproximadamente 1×10^{12} CFU por 100 kg de semilla.

La invención también se refiere a composiciones agroquímicas que comprenden un auxiliar y al menos un compuesto de la presente invención o una mezcla de los mismos.

Una composición agroquímica comprende una cantidad efectiva como pesticida de un compuesto de la presente invención o una mezcla del mismo. El término "cantidad efectiva como pesticida" se define posteriormente.

Los compuestos de la presente invención o las mezclas de los mismos se pueden convertir en tipos habituales de

- composiciones agroquímicas, por ejemplo, soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, polvos, pastas, gránulos, prensados, cápsulas y mezclas de los mismos. Los ejemplos de tipos de composición son suspensiones (por ejemplo, SC, OD, FS), concentrados emulsionables (por ejemplo, EC), emulsiones (por ejemplo, EW, EO, ES, ME), cápsulas (por ejemplo, CS, ZC), pastas, pastillas, polvos o polvos humectables (por ejemplo, WP, SP, WS, DP, DS), prensas (por ejemplo, BR, TB, DT), gránulos (por ejemplo, WG, SG, GR, FG, GG, MG), artículos insecticidas (por ejemplo, LN), así como formulaciones en gel para el tratamiento de materiales de propagación vegetal tal como semillas (por ejemplo, GF). Estos y otros tipos de composiciones se definen en el "Catalogue of pesticide formulation types y international coding system", Technical Monograph No.2, 6th Ed. Mayo de 2008, CropLife International.
- Las composiciones se preparan de una manera conocida, tal como se describe en Mollet y Grubemann, Formulation technology, Wiley VCH, Weinheim, 2001; o Knowles, New developments in crop protection product formulation, Agrow Reports DS243, T&F Informa, Londres, 2005.
- Los ejemplos de auxiliares adecuados son solventes, portadores líquidos, portadores o agentes de relleno sólidos, agentes tensioactivos, dispersantes, emulsionantes, humectantes, adyuvantes, solubilizantes, potenciadores de penetración, coloides protectores, agentes de adhesión, espesantes, humectantes, repelentes, atrayentes, estimulantes de alimentación, compatibilizantes, bactericidas, agentes anticongelantes, agentes antiespumantes, colorantes, adhesivos y aglutinantes.
- Los solventes y portadores líquidos adecuados son agua y solventes orgánicos, tal como fracciones de aceite mineral de punto de ebullición medio a alto, por ejemplo, queroseno, aceite diésel; aceites de origen vegetal o animal; hidrocarburos alifáticos, cíclicos y aromáticos, por ejemplo, tolueno, parafina, tetrahidronaftaleno, naftalenos alquilados; alcoholes, por ejemplo, etanol, propanol, butanol, alcohol bencílico, ciclohexanol; glicoles; DMSO; cetonas, por ejemplo, ciclohexanona; ésteres, por ejemplo, lactatos, carbonatos, ésteres de ácidos grasos, tono gamma-butirolaco; ácidos grasos; fosfonatos; aminas; amidas, por ejemplo, N-metilpirrolidona, dimetilamidas de ácidos grasos; y mezclas de los mismos.
- Los portadores o agentes de relleno sólidos adecuados son tierras minerales, por ejemplo, silicatos, geles de sílice, talco, caolines, piedra de cal, cal, tiza, arcillas, dolomita, tierra de diatomeas, bentonita, sulfato de calcio, sulfato de magnesio, óxido de magnesio; polvos de polisacáridos, por ejemplo, celulosa, almidón; fertilizantes, por ejemplo, sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, ureas; productos de origen vegetal, por ejemplo, harina de cereales, harina de corteza de árbol, harina de madera, harina de cáscara de nuez y mezclas de los mismos.
- Los agentes tensioactivos adecuados son compuestos activos en la superficie, tal como agentes tensioactivos aniónicos, catiónicos, no iónicos y anfóteros, polímeros en bloque, polielectrolitos y mezclas de los mismos. Estos agentes tensioactivos se pueden usar como emulsificante, dispersante, solubilizante, más húmedo, potenciador de la penetración, coloide protector o adyuvante. Los ejemplos de agentes tensioactivos se listan en McCutcheon's, Vol.1: Emulsifiers & Detergents, McCutcheon's Directories, Glen Rock, USA, 2008 (International Ed. o North American Ed.).
- Los agentes tensioactivos aniónicos adecuados son sales alcalinas, alcalinotérreas o de amonio de sulfonatos, sulfatos, fosfatos, carboxilatos y mezclas de los mismos. Los ejemplos de sulfonatos son alquilarilsulfonatos, difenilsulfonatos, sulfonatos de alfa-olefina, sulfonatos de lignina, sulfonatos de ácidos grasos y aceites, sulfonatos de alquilfenoles etoxilados, sulfonatos de arilfenoles alcoxilados, sulfonatos de naftalenos condensados, sulfonatos de dodecil y tridecibencenos, sulfonatos de naftalenos y alquilnaftalenos, sulfosuccinatos o sulfosuccinamatos. Los ejemplos de sulfatos son sulfatos de ácidos grasos y aceites, de alquilfenoles etoxilados, de alcoholes, de alcoholes etoxilados o de ésteres de ácidos grasos. Ejemplos de fosfatos son ésteres de fosfato. Ejemplos de carboxilatos son carboxilatos de alquilo y alcohol carboxilado o etoxilatos de alquilfenol.
- Los agentes tensioactivos no iónicos adecuados son alcoxilatos, amidas de ácidos grasos N-sustituidos, óxidos de amina, ésteres, agentes tensioactivos a base de azúcar, agentes tensioactivos poliméricos y mezclas de los mismos. Ejemplos de alcoxilatos son compuestos tal como alcoholes, alquilfenoles, aminas, amidas, arilfenoles, ácidos grasos o ésteres de ácidos grasos que se han alcoxilado con 1 a 50 equivalentes. Se puede emplear óxido de etileno y/o óxido de propileno para la alcoxilación, preferentemente óxido de etileno. Ejemplos de amidas de ácidos grasos N-sustituidos son glucamidas de ácidos grasos o alcanolamidas de ácidos grasos. Los ejemplos de ésteres son ésteres de ácidos grasos, ésteres de glicerol o monoglicéridos. Ejemplos de agentes tensioactivos a base de azúcar son sorbitanos, sorbitanos etoxilados, ésteres de sacarosa y glucosa o alquilpoliglucósidos. Ejemplos de agentes tensioactivos poliméricos son homo o copolímeros de vinilpirrolidona, vinilalcoholes o vinilacetato.
- Los agentes tensioactivos catiónicos adecuados son agentes tensioactivos cuaternarios, por ejemplo, compuestos de amonio cuaternario con uno o dos grupos hidrofóbicos, o sales de aminas primarias de cadena larga. Los agentes tensioactivos anfóteros adecuados son alquilbetainas e imidazolina. Los polímeros en bloque adecuados son polímeros en bloque del tipo A-B o A-B-A que comprenden bloques de óxido de polietileno y óxido de polipropileno, o del tipo A-B-C que comprende alcohol, óxido de polietileno y óxido de polipropileno. Los polielectrolitos adecuados son poliácidos o polibases. Los ejemplos de poliácidos son sales alcalinas de ácido poliacrílico o polímeros de peine de poliácido. Los ejemplos de polibases son polivinilaminas o polietilenaminas.
- Los adyuvantes adecuados son compuestos, que tienen una actividad descuidada o incluso ninguna actividad pesticida

por sí mismos, y que mejoran el rendimiento biológico de los compuestos de la presente invención en la diana. Los ejemplos son agentes tensioactivos, aceites minerales o vegetales y otros auxiliares. Otros ejemplos se listan en Knowles, Adjuvants and additives, Agrow Reports DS256, T&F Informa RU, 2006, capítulo 5.

5 Los espesantes adecuados son polisacáridos (por ejemplo, goma xantana, carboximetilcelulosa), arcillas anorgánicas (modificadas orgánicamente o no modificadas), policarboxilatos y silicatos.

Los bactericidas adecuados son bronopol e derivados de isotiazolinonas tal como alquilisotiazolinonas y benzisotiazolinonas.

10 Los agentes anticongelantes adecuados son etilenglicol, propilenglicol, urea y glicerina.

Los agentes antiespumantes adecuados son siliconas, alcoholes de cadena larga y sales de ácidos grasos.

15 Los colorantes adecuados (por ejemplo, en rojo, azul o verde) son pigmentos de baja solubilidad en agua y tintes solubles en agua. Los ejemplos son colorantes inorgánicos (por ejemplo, óxido de hierro, óxido de titanio, tasa de hexacianoferro de hierro) y colorantes orgánicos (por ejemplo, colorantes de alizarina, azo y ftalocianina).

20 Los adhesivos o aglutinantes adecuados son polivinilpirrolidonas, polivinilacetatos, alcoholes polivinílicos, poliácridatos, ceras biológicas o sintéticas y éteres de celulosa.

Ejemplos para los tipos de composición y su preparación son:

25 i) Concentrados solubles en agua (SL, LS)

10-60% en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención y 5-15% en peso de agente humectante (por ejemplo, alcoxilatos de alcohol) se disuelven en agua y/o en un solvente soluble en agua (por ejemplo, alcoholes) hasta 100% en peso. El principio activo se disuelve al diluirse con agua.

30 ii) Concentrados dispersables (DC)

5-25% en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención y 1-10% en peso de dispersante (por ejemplo, polivinilpirrolidona) se disuelven en hasta 100% en peso de solvente orgánico (por ejemplo, ciclohexanona). La dilución con agua da una dispersión.

35 iii) Concentrados emulsionables (EC)

15-70% en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención y 5-10% en peso de emulsionantes (por ejemplo, dodecibencenosulfonato de calcio y etoxilato de aceite de ricino) se disuelven en hasta 100% en peso de solvente orgánico insoluble en agua (por ejemplo, hidrocarburo aromático). La dilución con agua da una emulsión.

40 iv) Emulsiones (EW, EO, ES)

5-40% en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención y 1-10% en peso de emulsionantes (por ejemplo, dodecibencenosulfonato de calcio y etoxilato de aceite de ricino) se disuelven en 20-40% en peso de solvente orgánico o insoluble en agua (por ejemplo, hidrocarburo aromático). Esta mezcla se introduce en hasta 100% en peso de agua por medio de una máquina emulsionante y se convierte en una emulsión homogénea. La dilución con agua da una emulsión.

50 v) Suspensiones (SC, OD, FS)

En un molino de bolas agitado, el 20-60% en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención se trituran con la adición de dispersantes y agentes humectantes al 2-10% en peso (por ejemplo, lignosulfonato de sodio y etoxilato de alcohol), 0,1-2% en peso de espesante (por ejemplo, goma xantana) y hasta 100% en peso de agua para dar una suspensión de sustancia activa fina. La dilución con agua proporciona una suspensión estable del principio activo. Para la composición de tipo FS se adiciona un aglutinante de hasta 40% en peso (por ejemplo, alcohol polivinílico).

vi) Gránulos dispersables en agua y gránulos solubles en agua (WG, SG)

50-80% en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención se muele finamente con la adición de hasta 100% en peso de dispersantes y agentes humectantes (por ejemplo, lignosulfonato de sodio y etoxilato de alcohol) y se prepara previamente como gránulos dispersables en agua o solubles en agua por medio de aparatos técnicos (por ejemplo, extrusión, torre de pulverización, lecho fluidizado). La dilución con agua proporciona una dispersión o solución estable de la sustancia activa.

65 vii) Polvos dispersables en agua y polvos solubles en agua (WP, SP, WS)

50-80% en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención se muele en un molino de rotor-estator con adición de 1-5% en peso de dispersantes (por ejemplo, lignosulfonato de sodio), 1-3% en peso de agentes humectantes (por ejemplo, etoxilato de alcohol) y hasta 100% en peso de portador sólido, por ejemplo, gel de sílice. La dilución con agua proporciona una dispersión o solución estable del principio activo.

5

viii) Gel (GW, GF)

En un molino de bolas agitado, 5-25% en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención se trituran con adición de 3-10% en peso de dispersantes (por ejemplo, lignosulfonato de sodio), 1-5% en peso de espesante (por ejemplo, carboximetilcelulosa) y hasta 100% en peso de agua para dar una suspensión fina de la sustancia activa. La dilución con agua proporciona una suspensión estable del principio activo.

10

ix) Microemulsión (ME)

5-20% en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención se adicionan a 5-30% en peso de mezcla de solventes orgánicos (por ejemplo, dimetilamida de ácidos grasos y ciclohexanona), 10-25% en peso de mezcla de agentes tensioactivos (por ejemplo, etoxilato de alcohol y etoxilato de arilfenol), y agua hasta 100%. Esta mezcla se agita durante 1 h para producir espontáneamente una microemulsión termodinámicamente estable.

15

x) Microcápsulas (CS)

Una fase oleosa que comprende 5-50% en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención, 0-40% en peso de solvente orgánico soluble en agua (por ejemplo, hidrocarburo aromático), 2-15% en peso de monómeros acrílicos (por ejemplo, metil-metacrilato, ácido metacrílico y un di- o triacrilato) se dispersan en una solución acuosa de un coloide protector (por ejemplo, alcohol polivinílico). La polimerización radical iniciada por un iniciador radical da como resultado la formación de microcápsulas de poli(met)acrilato. De manera alternativa, una fase oleosa que comprende 5-50% en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención, 0-40% en peso de solvente orgánico insoluble en agua (por ejemplo, hidrocarburo aromático) y un monómero de isocianato (por ejemplo, difenilmeten-4,4'-diisocianato) se dispersan en una solución acuosa de un coloide protector (por ejemplo, alcohol polivinílico). La adición de una poliamina (por ejemplo, hexametilendiamina) da como resultado la formación de una microcápsula de poliurea. Los monómeros ascienden a 1-10% en peso. El % en peso se refiere a la composición CS total.

25

30

xi) Polvos secos (DP, DS)

1-10% en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención se muele finamente y se mezcla íntimamente con hasta 100% en peso de portador sólido, por ejemplo, caolín finamente dividido.

35

xii) Gránulos (GR, FG)

0,5-30% en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención se muele finamente y se asocia con hasta 100% en peso de portador sólido (por ejemplo, silicato). La granulación se logra por extrusión, secado por pulverización o por el lecho fluidizado.

40

xiii) Líquidos de volumen ultra bajo (UL)

1-50% en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención se disuelven en hasta 100% en peso de solvente orgánico, por ejemplo, hidrocarburo aromático.

45

Las composiciones de los tipos i) a xi) pueden comprender opcionalmente auxiliares adicionales, tal como bactericidas al 0,1-1% en peso, agentes anticongelantes al 5-15% en peso, agentes antiespumantes al 0,1-1% en peso y colorantes al 0,1-1% en peso.

50

Las composiciones agroquímicas en general comprenden entre 0,01 y 95%, preferentemente entre 0,1 y 90%, y más preferentemente entre 0,5 y 75%, en peso de sustancia activa. Las sustancias activas se emplean con una pureza del 90% al 100%, preferentemente del 95% al 100% (según el espectro de RMN).

55

Se pueden adicionar varios tipos de aceites, humectantes, adyuvantes, fertilizante o micronutrientes y otros pesticidas (por ejemplo, herbicidas, insecticidas, fungicidas, reguladores de crecimiento, protectores) a las sustancias activas o las composiciones que las comprenden como premezcla o, si corresponde, no hasta inmediatamente antes de su uso (mezcla de tanques). Estos agentes se pueden mezclar con las composiciones de acuerdo con la invención en una relación en peso de 1:100 a 100:1, preferentemente de 1:10 a 10:1.

60

El usuario aplica la composición de acuerdo con la invención en general desde un dispositivo de dosificación previa, un rociador de mochila, un tanque de pulverización, un plano de pulverización o un sistema de irrigación. Por lo general, la composición agroquímica se compone de agua, amortiguador y/o auxiliares adicionales a la concentración de aplicación deseada y, por lo tanto, se obtiene el licor en aerosol listo para usar o la composición agroquímica de acuerdo con la

65

invención. Por lo general, se aplican de 20 a 2000 litros, preferentemente de 50 a 400 litros, del licor en aerosol listo para usar por hectárea de área útil agrícola.

5 De acuerdo con una realización, los componentes individuales de la composición de acuerdo con la invención tal como partes de un kit o partes de una mezcla binaria o ternaria pueden ser mezclados por el propio usuario en un tanque de pulverización y se pueden adicionar auxiliares adicionales, si corresponde.

10 En una realización adicional, el usuario puede mezclar componentes individuales de la composición de acuerdo con la invención o componentes parcialmente premezclados, por ejemplo, componentes que comprenden compuestos de la presente invención y/o compañeros de mezcla como se definió anteriormente, en un tanque de pulverización y se pueden adicionar aditivos y auxiliares adicionales, si corresponde.

15 En una realización adicional, cualquiera de los componentes individuales de la composición de acuerdo con la invención o componentes parcialmente premezclados, por ejemplo, componentes que comprenden compuestos de la presente invención y/o compañeros de mezcla como se definió anteriormente, se pueden aplicar conjuntamente (por ejemplo, después de la mezcla de tanque) o consecutivamente.

20 Los compuestos de la presente invención son adecuados para su uso en la protección de cultivos, plantas, materiales de propagación de plantas, tal como semillas, o suelo o agua, en los cuales las plantas están creciendo, de ataque o infestación por plagas animales. Por lo tanto, la presente invención también se refiere a un método de protección de plantas, que comprende poner en contacto cultivos, plantas, materiales de propagación de plantas, tal como semillas, o suelo o agua, en los cuales las plantas están creciendo, para ser protegidas contra el ataque o la infestación por plagas animales, con una cantidad efectiva como pesticida de un compuesto de la presente invención.

25 Los compuestos de la presente invención también son adecuados para su uso en el combate o el control de plagas animales. Por lo tanto, la presente invención también se refiere a un método para combatir o controlar las plagas animales, que comprende poner en contacto las plagas animales, su hábitat, caldo de cultivo o suministro de alimentos, o los cultivos, plantas, materiales de propagación de plantas, tal como semillas, o suelo, o el área, material o entorno en el cual las plagas animales están creciendo o pueden crecer, con una cantidad efectiva como pesticida de un compuesto de la presente invención.

30 Los compuestos de la presente invención son efectivos a través de contacto e ingestión. Adicionalmente, los compuestos de la presente invención se pueden aplicar a cualquiera y todas las etapas de desarrollo, tal como huevo, larva, pupa y adulto.

35 Los compuestos de la presente invención se pueden aplicar como tales o en forma de composiciones que los comprenden como se definió anteriormente. Además, los compuestos de la presente invención se pueden aplicar junto con un compañero de mezcla como se definió anteriormente o en forma de composiciones que comprenden estas mezclas como se definió anteriormente. Los componentes de esta mezcla se pueden aplicar de manera simultánea, conjunta o separada, o de forma sucesiva, que es inmediatamente uno tras otro y de esta manera crear la mezcla "in situ" en la ubicación deseada, por ejemplo, la planta, la secuencia, en el caso de aplicación separada, en general no tiene ningún efecto sobre el resultado de las medidas de control.

40 La aplicación se puede llevar a cabo tanto antes como después de la infestación de los cultivos, plantas, materiales de propagación de plantas, tal como semillas, suelo, o el área, material o entorno por las plagas.

45 Los métodos de aplicación adecuados incluyen, entre otros, el tratamiento del suelo, el tratamiento de semillas, la aplicación en surcos y la aplicación foliar. Los métodos de tratamiento del suelo incluyen mojar el suelo, riego por goteo (aplicación por goteo en el suelo), sumergir raíces, tubérculos o bulbos, o inyección de suelo. Las técnicas de tratamiento de semillas incluyen el apósito de semillas, el recubrimiento de semillas, el espolvoreo de semillas, el remojo de semillas y la granulación de semillas. En aplicaciones de surco típicamente incluyen los pasos de hacer un surco en tierra cultivada, sembrar el surco con semillas, aplicar el compuesto activo como pesticida al surco y cerrar el surco. La aplicación foliar se refiere a la aplicación del compuesto activo como pesticida al follaje de la planta, por ejemplo, a través de un equipo de pulverización. Para aplicaciones foliares, puede ser ventajoso modificar el comportamiento de las plagas mediante el uso de feromonas en combinación con los compuestos de la presente invención. Las feromonas adecuadas para cultivos y plagas específicos son conocidas por un experto y están disponibles públicamente a partir de bases de datos de feromonas y productos semioquímicos, como <http://www.pherobase.com>.

50 Como se usa en la presente, el término "poner en contacto" incluye tanto contacto directo (aplicando los compuestos/composiciones directamente en la plaga animal o planta, - típicamente al follaje, tallo o raíces de la planta) como contacto indirecto (aplicando los compuestos/composiciones al locus, es decir, hábitat, criadero, planta, semilla, suelo, área, material o entorno en el que una plaga está creciendo o puede crecer, de la plaga o planta animal).

55 El término "plaga animal" incluye artrópodos, gasterópodos y nematodos. Las plagas animales preferidas de acuerdo con la invención son artrópodos, preferentemente insectos y arácnidos, en particular insectos. Los insectos, que son de particular relevancia para los cultivos, se refieren típicamente como plagas de insectos de cultivo. El término "cultivo" se

refiere tanto al cultivo como a la cosecha.

El término "planta" incluye cereales, por ejemplo, trigo duro y otros trigos, centeno, cebada, triticale, avena, arroz o maíz (maíz forrajero y maíz azucarado/maíz dulce y de campo); remolacha, por ejemplo, remolacha azucarera o remolacha forrajera; frutas, tal como pompas, frutas de hueso o frutos blandos, por ejemplo, manzanas, peras, ciruelas, melocotones, nectarinas, almendras, cerezas, papayas, fresas, frambuesas, moras o grosellas; plantas leguminosas, tal como frijoles, lentejas, guisantes, alfalfa o soja; plantas oleaginosas, tal como colza (colza oleaginosa), nabo, mostaza, aceitunas, girasoles, coco, cacao, ricino, palmas oleaginosas, nueces molidas o soja; cucurbitáceas, tal como calabazas, calabazas, calabazas, pepino o melones; plantas de fibra, como algodón, lino, cáñamo o yute; cítricos, como naranjas, limones, pomelos o mandarinas; verduras, como berenjena, espinacas, lechuga (por ejemplo, lechuga iceberg), achicoria, repollo, espárragos, coles, zanahorias, cebollas, ajos, puerros, tomates, patatas, cucurbitáceas o pimientos dulces; plantas lauráceas, como aguacates, canela o alcanfor; plantas energéticas y de materias primas, como maíz, soja, colza, caña de azúcar o palma aceitera; tabaco; nueces, por ejemplo, nueces; pistachos; café; té; plátanos; vides (uvas de mesa y vides de uva zumo); lúpulo; hoja dulce (también llamada Estevia); plantas de caucho o plantas ornamentales y forestales, plantas, tal como flores (por ejemplo, clavel, petunias, geranio/pelargonios, pensamientos e impacientes), arbustos, árboles de hoja ancha (por ejemplo, álamo) o siempre verdes, por ejemplo, coníferas; eucalipto; césped; césped; hierba como hierba para alimentación animal o usos ornamentales. Las plantas preferidas incluyen papas, remolacha azucarera, tabaco, trigo, centeno, cebada, avena, arroz, maíz, algodón, soja, colza, legumbres, girasoles, café o caña de azúcar; frutas; vides; ornamentales; o verduras, tal como pepinos, tomates, frijoles o calabazas.

El término "planta" se debe entender que incluye plantas y plantas de tipo salvaje, que han sido modificadas ya sea por reproducción convencional, mutagénesis o ingeniería genética, o por una combinación de las mismas.

Las plantas, que han sido modificadas por mutagénesis o ingeniería genética, y son de particular importancia comercial, incluyen alfalfa, colza (por ejemplo, colza), frijol, clavel, achicoria, algodón, berenjena, eucalipto, lino, lenteja, maíz, melón, papaya, petunia, ciruela, álamo, patata, arroz, soja, calabaza, remolacha azucarera, caña de azúcar, girasol, pimienta dulce, tabaco, tomate y cereales (por ejemplo, trigo), en particular maíz, soja, algodón, trigo y arroz. En plantas, que han sido modificadas por mutagénesis o ingeniería genética, uno o más genes han sido mutagenizados o integrados en el material genético de la planta. El uno o más genes mutagenizados o integrados se seleccionan preferentemente de Pat, epsps, cry1Ab, bar, cry1Fa2, cry1Ac, cry34Ab1, cry35AB1, cry3A, cryF, cry1F, mcry3a, cry2Ab2, cry3Bb1, cry1A.105, dfr, barnase, vip3Aa20, barstar, ALS, bxn, bp40, asn1 y ppo5. La mutagénesis o integración del uno o más genes se realiza con el fin de mejorar ciertas propiedades de la planta. Estas propiedades, también conocidas como rasgos, incluyen tolerancia al estrés abiótico, crecimiento/rendimiento alterado, resistencia a enfermedades, tolerancia a herbicidas, resistencia a insectos, calidad de producto modificada y control de polinización. De estas propiedades, la tolerancia a herbicidas, por ejemplo, tolerancia a imidazolinonas, tolerancia a glifosato o tolerancia a glufosinato, es de particular importancia. Varias plantas se han vuelto tolerantes a herbicidas por mutagénesis, por ejemplo, la colza oleaginosa Clearfield® es tolerante a imidazolinonas, por ejemplo, imazamox. De manera alternativa, se han utilizado métodos de ingeniería genética para hacer que las plantas, como soja, algodón, maíz, remolacha y colza de semillas oleaginosas, sean tolerantes a herbicidas, como glifosato y glufosinato, algunos de los cuales están disponibles comercialmente con los nombres comerciales RoundupReady® (glifosato) y LibertyLink® (glufosinato). Además, la resistencia a los insectos es importante, en particular la resistencia a los insectos lepidópteros y la resistencia a los insectos coleópteros. La resistencia de los insectos se logra típicamente modificando las plantas mediante la integración de genes Cry y/o Vip, que se aislaron de *Bacillus thuringiensis* (Bt), y codifican para las toxinas de Bt respectivas. Las plantas modificadas genéticamente con resistencia a insectos están disponibles comercialmente bajo nombres comerciales que incluyen WideStrike®, Bollgard®, Agrisure®, Herculex®, yieldGard®, Genuity® e Intacta®. Las plantas pueden ser modificadas por mutagénesis o ingeniería genética ya sea en términos de una propiedad (rasgos singulares) o en términos de una combinación de propiedades (rasgos apilados). Los rasgos apilados, por ejemplo, la combinación de tolerancia a los herbicidas y resistencia a los insectos, son de creciente importancia. En general, todas las plantas modificadas relevantes en relación con rasgos singulares o apilados, así como información detallada sobre los genes mutagenizados o integrados y los eventos respectivos, están disponibles en los sitios web de las organizaciones "Servicio Internacional para la Adquisición de Aplicaciones de Agribiotech (ISAAA)" (<http://www.isaaa.org/gmaprovaldatabase>) y "Centro para la Evaluación de Riesgos Ambientales (CERA)" (<http://cera-gmc.org/GMCropDatabase>).

Sorprendentemente se ha encontrado que la actividad pesticida de los compuestos de la presente invención se puede mejorar por el rasgo insecticida de una planta modificada. Además, se ha encontrado que los compuestos de la presente invención son adecuados para evitar que los insectos se vuelvan resistentes al rasgo insecticida o para combatir plagas, que ya se han vuelto resistentes al rasgo insecticida de una planta modificada. Además, los compuestos de la presente invención son adecuados para combatir plagas, contra las cuales el rasgo insecticida no es efectivo, de modo que se puede utilizar ventajosamente una actividad insecticida complementaria.

El término "material de propagación de plantas" se refiere a todas las partes generadoras de la planta tal como semillas y material vegetal tal como esquejes y tubérculos (por ejemplo, papas), que se pueden usar para la multiplicación de la planta. Esto incluye semillas, raíces, frutos, tubérculos, bulbos, rizomas, brotes, brotes y otras partes de plantas. También se pueden incluir plántulas y plantas jóvenes que se van a trasplantar después de la germinación o después de la emergencia del suelo. Estos materiales de propagación vegetal se pueden tratar profilácticamente con un compuesto fitosanitario ya sea en o antes de la plantación o trasplante.

El término "semilla" abarca semillas y propágulos de plantas de todo tipo incluyendo pero no limitado a semillas verdaderas, trozos de semilla, ventosas, cormos, bulbos, frutas, tubérculos, granos, esquejes, brotes cortados y similares, y significa en una realización preferida semillas verdaderas.

En general, "cantidad efectiva como pesticida" significa la cantidad de ingrediente activo necesaria para lograr un efecto observable sobre el crecimiento, incluidos los efectos de necrosis, muerte, retraso, prevención y remoción, destrucción o disminución de la aparición y actividad del organismo diana. La cantidad efectiva como pesticida puede variar para los diversos compuestos/composiciones utilizados en la invención. Una cantidad efectiva como pesticida de las composiciones también variará de acuerdo con las condiciones prevalecientes tal como el efecto y la duración pesticida deseados, el clima, la especie diana, el locus, el modo de aplicación y similares.

En el caso del tratamiento del suelo, en la aplicación del surco o de la aplicación a la vivienda o nido de plagas, la cantidad de ingrediente activo varía de 0,0001 a 500 g por 100 m², preferentemente de 0,001 a 20 g por 100 m².

Para su uso en el tratamiento de plantas de cultivo, por ejemplo, mediante aplicación foliar, la tasa de aplicación de los ingredientes activos de la presente invención puede estar en el intervalo de 0,0001 g a 4000 g por hectárea, por ejemplo, de 1 g a 2 kg por hectárea o de 1 g a 750 g por hectárea, deseablemente de 1 g a 100 g por hectárea, más deseablemente de 10 g a 50 g por hectárea, por ejemplo, de 10 a 20 g por hectárea, 20 a 30 g por hectárea, 30 a 40 g por hectárea o 40 a 50 g por hectárea.

Los compuestos de la presente invención son particularmente adecuados para su uso en el tratamiento de semillas con el fin de proteger las semillas de plagas de insectos, en particular de plagas de insectos vivos en el suelo, y las raíces y brotes de la plántula resultante contra plagas de suelo e insectos foliares. Por lo tanto, la presente invención también se refiere a un método para la protección de semillas de insectos, en particular de las secciones del suelo, y de las raíces y brotes de la plántula de insectos, en particular de insectos del suelo y foliares, este método comprende tratar las semillas antes de la siembra y/o después de la pregerminación con un compuesto de la presente invención. Se prefiere la protección de las raíces y brotes de la plántula. Más preferido es la protección de los brotes de plántulas contra insectos perforantes y chupadores, insectos masticadores y nematodos.

El término "tratamiento de semillas" comprende todas las técnicas de tratamiento de semillas adecuadas conocidas en la técnica, tal como apósito de semillas, recubrimiento de semillas, espolvoreo de semillas, remojo de semillas, granulación de semillas y métodos de aplicación en surco. Preferentemente, la aplicación de tratamiento de semillas del compuesto activo se lleva a cabo mediante pulverización o espolvoreo de las semillas antes de la siembra de las plantas y antes de la aparición de las plantas.

La presente invención también comprende semillas recubiertas con o que contienen el compuesto activo. El término "recubierto con y/o que contiene" en general significa que el ingrediente activo se encuentra en su mayor parte en la superficie del producto de propagación en el momento de la aplicación, aunque una mayor o menor parte del ingrediente puede penetrar en el producto de propagación, dependiendo del método de aplicación. Cuando este producto de propagación se (re)planta, puede absorber el ingrediente activo.

Las semillas adecuadas son, por ejemplo, semillas de cereales, cultivos de raíces, cultivos oleaginosos, vegetales, especias, productos ornamentales, por ejemplo, semillas de trigo duro y otros trigos, cebada, avena, centeno, maíz (maíz forrajero y maíz azucarero/maíz dulce y de campo), soja, cultivos oleaginosos, crucíferos, algodón, girasoles, plátanos, arroz, colza oleaginosa, nabo, remolacha azucarera, remolacha forrajera, berenjenas, patatas, hierba, césped, césped, hierba forrajera, tomates, puerros, calabaza/calabaza, repollo, lechuga iceberg, pimienta, pepinos, melones, especies de Brassica, melones, frijoles, guisantes, ajo, cebolla, cebollas, zanahorias, plantas tuberosas tal como patatas, caña de azúcar, tabaco, uvas, petunias, geranios/pelargonios, pensamientos e impacencias.

Además, el compuesto activo también se puede usar para el tratamiento de semillas de plantas, que han sido modificadas por mutagénesis o modificación genética, y que, por ejemplo, toleran la acción de herbicidas o fungicidas o insecticidas. Estas plantas modificadas se han descrito en detalle anteriormente. Las formulaciones de tratamiento de semillas convencionales incluyen, por ejemplo, concentrados fluidos FS, soluciones LS, suspoemulsiones (SE), polvos para tratamiento en seco DS, polvos dispersables en agua para tratamiento en suspensión WS, polvos solubles en agua SS y emulsión ES y EC y formulación en gel GF. Estas formulaciones se pueden aplicar a la semilla diluida o sin diluir. La aplicación a las semillas se lleva a cabo antes de la siembra, ya sea directamente sobre las semillas o después de haber pregerminado estas últimas. Preferentemente, las formulaciones se aplican de manera que no se incluya la germinación.

Las concentraciones de sustancia activa en formulaciones listas para usar, que pueden obtenerse después de una dilución de dos a diez veces, son preferentemente de 0,01 a 60% en peso, más preferentemente de 0,1 a 40% en peso.

En una realización preferida, se utiliza una formulación de FS para el tratamiento de semillas. Típicamente, una formulación de FS puede comprender 1-800 g/l de ingrediente activo, 1-200 g/l de agente tensioactivo, 0 a 200 g/l de agente anticongelante, 0 a 400 g/l de aglutinante, 0 a 200 g/l de un pigmento y hasta 1 litro de un solvente, preferentemente agua.

Las formulaciones de FS especialmente preferidas de los compuestos de la presente invención para el tratamiento de semillas en general comprenden de 0,1 a 80% en peso (1 a 800 g/l) del ingrediente activo, de 0,1 a 20% en peso (1 a 200 g/l) de al menos un agente tensioactivo, por ejemplo, 0,05 a 5% en peso de un más húmedo y de 0,5 a 15% en peso de un agente dispersante, hasta 20% en peso, por ejemplo, de 5 a 20% de un agente anticongelante, de 0 a 15% en peso, por ejemplo, de 1 a 15 % en peso de un pigmento y/o un tinte, de 0 a 40 % en peso, por ejemplo, de 1 a 40 % en peso de un aglutinante (adhesivo /agente de adhesión), opcionalmente hasta 5 % en peso, por ejemplo, de 0,1 a 5 % en peso de un espesante, opcionalmente de 0,1 a 2 % de un agente antiespumante, y opcionalmente un conservante tal como un biocida, antioxidante o similar, por ejemplo, en una cantidad de 0,01 a 1 % en peso y un agente de relleno/vehículo hasta 100 % en peso.

En el tratamiento de semillas, las tasas de aplicación de los compuestos de la invención son en general de 0,1 g a 10 kg por 100 kg de semilla, preferentemente de 1 g a 5 kg por 100 kg de semilla, más preferentemente de 1 g a 1000 g por 100 kg de semilla y en particular de 1 g a 200 g por 100 kg de semilla, por ejemplo, de 1 g a 100 g o de 5 g a 100 g por 100 kg de semilla.

Por lo tanto, la invención también se refiere a semillas que comprenden un compuesto de la presente invención, o una sal útil para la agricultura del mismo, como se define en la presente. La cantidad del compuesto de la presente invención o la sal útil para la agricultura de este variará en general de 0,1 g a 10 kg por 100 kg de semilla, preferentemente de 1 g a 5 kg por 100 kg de semilla, en particular de 1 g a 1000 g por 100 kg de semilla. Para cultivos específicos como la lechuga la tasa puede ser mayor.

Los compuestos de la presente invención también se pueden utilizar para mejorar la salud de una planta. Por lo tanto, la presente invención también se refiere a un método para mejorar la salud de las plantas mediante el tratamiento de una planta, material de propagación vegetal y/o el locus donde la planta está creciendo o va a crecer con una cantidad efectiva y no fitotóxica de un compuesto de la presente invención.

Como se usa en la presente, "una cantidad efectiva y no fitotóxica" significa que el compuesto se usa en una cantidad que permite obtener el efecto deseado, pero que no da lugar a ningún síntoma fitotóxico en la planta tratada o en la planta cultivada a partir del propágulo tratado o suelo tratado.

Los términos "planta" y "material de propagación vegetal" se definen anteriormente.

"Salud vegetal" se define como una condición de la planta y/o sus productos que se determina por varios aspectos solos o en combinación entre sí, tal como rendimiento (por ejemplo, aumento de la biomasa y/o aumento del contenido de ingredientes valiosos), calidad (por ejemplo, mejora del contenido o composición de ciertos ingredientes o vida útil), vigor de la planta (por ejemplo, mejora del crecimiento de la planta y/u hojas más verdes ("efecto de reverdecimiento"), tolerancia al estrés abiótico (por ejemplo, sequía) y/o biótico (por ejemplo, enfermedad) y eficiencia de producción (por ejemplo, eficiencia de cosecha, procesabilidad). Los indicadores identificados anteriormente para el estado de salud de una planta pueden ser interdependientes y pueden resultar uno del otro. Cada indicador se define en la técnica y se puede determinar mediante métodos conocidos por un experto en la técnica.

Los compuestos de la invención también son adecuados para su uso contra plagas de insectos que no son de cultivo. Para su uso contra estas plagas no relacionadas con los cultivos, los compuestos de la presente invención se pueden usar como composición de cebo, gel, pulverizador de insectos general, aerosol, como aplicación de volumen ultrabajo y red de lecho (impregnada o aplicada sobre la superficie). Además, se pueden usar métodos de empapado y varillaje.

Como se usa en la presente, el término "plaga de insectos no cultivados" se refiere a plagas, que son particularmente relevantes para dianas no cultivadas, tal como hormigas, termitas, avispas, moscas, garrapatas, mosquitos, grillos o cucarachas. El cebo puede ser una preparación líquida, sólida o semisólida (por ejemplo, un gel). El cebo empleado en la composición es un producto, lo suficientemente atractivo como para incitar a insectos como hormigas, termitas, avispas, moscas, mosquitos, grillos etc. o cucarachas a comerlo. El atractivo se puede manipular mediante el uso de estimulantes de alimentación o feromonas sexuales. Los estimulantes alimentarios se eligen, por ejemplo, pero no exclusivamente, de proteínas animales y/o vegetales (harina de carne, pescado o sangre, partes de insectos, yema de huevo), de grasas y aceites de origen animal y/o vegetal, o mono, oligo o poliorganosacáridos, especialmente de sacarosa, lactosa, fructosa, dextrosa, glucosa, almidón, pectina o incluso melaza o miel. Las partes frescas o en descomposición de frutas, cultivos, plantas, animales, insectos o partes específicas de los mismos también pueden servir como un estimulante de la alimentación. Se sabe que las feromonas sexuales son más específicas de los insectos. Las feromonas específicas se describen en la bibliografía (por ejemplo, <http://www.pherobase.com>), y son conocidas por los expertos en la técnica.

Para su uso en composiciones de cebo, el contenido típico de ingrediente activo es de 0,001% en peso a 15% en peso, deseablemente de 0,001% en peso a 5% en peso de compuesto activo.

Las formulaciones de los compuestos de la presente invención como aerosoles (por ejemplo, en latas de aerosol), aerosoles de aceite o aerosoles de bomba son altamente adecuados para el usuario no profesional para controlar plagas tal como moscas, pulgas, garrapatas, mosquitos o cucarachas. Las recetas de aerosol se componen preferentemente del

compuesto activo, solventes, además auxiliares tal como emulsionantes, aceites de perfume, si corresponde estabilizadores y, si se requiere, propulsores.

Las formulaciones de aerosol de aceite difieren de las recetas de aerosol en que no se utilizan propulsores.

Para su uso en composiciones de pulverización, el contenido de ingrediente activo es de 0,001 a 80% en peso, preferentemente de 0,01 a 50% en peso y más preferentemente de 0,01 a 15% en peso.

Los compuestos de la presente invención y sus respectivas composiciones también se pueden usar en espirales de fumigación y de mosquitos, cartuchos de humo, placas vaporizadoras o vaporizadores a largo plazo y también en papeles de polilla, almohadillas de polilla u otros sistemas vaporizadores independientes del calor.

Los métodos para controlar enfermedades infecciosas transmitidas por insectos (por ejemplo, malaria, dengue y fiebre amarilla, filariasis linfática y leishmaniasis) con compuestos de la presente invención y sus respectivas composiciones comprenden tratar superficies de chozas y casas, pulverización de aire e impregnación de cortinas, tiendas de campaña, prendas de vestir, mosquiteros, trampa de mosca tsetsé o similares. Las composiciones insecticidas para su aplicación a fibras, tela, artículos de punto, no tejidos, material de red o láminas y lonas preferentemente comprenden una mezcla que incluye el insecticida, opcionalmente un repelente y al menos un aglutinante. Los compuestos de la presente invención y sus composiciones se pueden utilizar para proteger materiales de madera tal como árboles, vallas de tablero, traviesas, marcos, artefactos artísticos, etc. y edificios, pero también materiales de construcción, muebles, cueros, fibras, artículos de vinilo, alambres y cables eléctricos, etc. de hormigas y/o termitas, y para controlar que las hormigas y termitas causen daño a cultivos o seres humanos (por ejemplo, cuando las plagas invaden casas e instalaciones públicas).

Las tasas de aplicación habituales en la protección de materiales son, por ejemplo, de 0,001 g a 2000 g o de 0,01 g a 1000 g de compuesto activo por m² de material tratado, de forma deseable de 0,1 g a 50 g por m².

Las composiciones insecticidas para su uso en la impregnación de materiales típicamente contienen de 0,001 a 95% en peso, preferentemente de 0,1 a 45% en peso, y más preferentemente de 1 a 25% en peso de al menos un repelente y/o insecticida.

Los compuestos de la presente invención son en especial adecuados para combatir efectivamente plagas animales tal como artrópodos, gastrópodos y nematodos incluyendo pero no limitado a:

insectos del orden de los lepidópteros, por ejemplo, *Achroia grisella*, *Acleris* spp. tal como *A. fimbriana*, *A. gloverana*, *A. variana*; *Acrolepiopsis assectella*, *Acronicta major*, *Adoxophyes* spp. tal como *A. cyrtosema*, *A. orana*; *Aedia leucomelas*, *Agrotis* spp. tal como *A. exclamationis*, *A. fucosa*, *A. ipsilon*, *A. orthogoma*, *A. segetum*, *A. subterranea*; *Alabama argillacea*, *Aleurodicus dispersus*, *Alsophila pometaria*, *Ampelophaga rubiginosa*, *Amyeloides transitella*, *Anacampsis sarcitella*, *Anagasta kuehniella*, *Anarsia lineatella*, *Anisota senatoria*, *Antheraea pernyi*, *Anticarsia* (= *Thermesia*) spp. tal como *A. gemmatilis*; *Apamea* spp., *Aproaerema modicella*, *Archips* spp. tal como *A. argyrospila*, *A. fuscocupreanus*, *A. rosana*, *A. xylosteus*; *Argyrestia conjugella*, *Argyroplote* spp., *Argyrotaenia* spp. tal como *A. velutinana*; *Athetis mindara*, *Austroasca viridigrisea*, *Autographa gamma*, *Autographa nigrisigna*, *Barathra brassicae*, *Bedellia* spp., *Bonagota salubricola*, *Borbo cinnara*, *Bucculatrix thurberiella*, *Bupalus piniarius*, *Busseola* spp., *Cacoecia* spp. tal como *C. murinana*, *C. podana*; *Cactoblastis cactorum*, *Cadra cautella*, *Calingo braziliensis*, *Caloptilis theivora*, *Capua reticulana*, *Carpocapsa* spp. tal como *C. niponensis*, *C. sasakii*; *Cephus* spp., *Chaetocnema aridula*, *Chei-matobia brumata*, *Chilo* spp. tal como *C. indicus*, *C. suppressalis*, *C. partellus*; *Choreutis pariana*, *Choristoneura* spp. tal como *C. conflictana*, *C. fumiferana*, *C. longicellana*, *C. murinana*, *C. occidentalis*, *C. rosaceana*; *Chrysodeixis* (= *Pseudoplusia*) spp. tal como *C. eriosoma*, *C. includens*; *Cirphis unipuncta*, *Clysia ambiguella*, *Cnaphalocerus* spp., *Cnaphalocrocis medinalis*, *Cnephasia* spp., *Cochylis hospes*, *Coleophora* spp., *Colias eurytheme*, *Conopomorpha* spp., *Conotrachelus* spp., *Copitarsia* spp., *Corcyra cephalonica*, *Crambus caliginosellus*, *Crambus teterrellus*, *Crocosema* (= *Epi-notia*) *aporema*, *Cydalima* (= *Diaphania*) *perspectalis*, *Cydia* (= *Carpocapsa*) spp. tal como *C. pomonella*, *C. latiferreana*; *Dalaca noctuides*, *Datana integerrima*, *Dasychira pinicola*, *Dendrolimus* spp. tal como *D. pini*, *D. spectabilis*, *D. sibiricus*; *Desmia funeralis*, *Diaphania* spp. tal como *D. nitidalis*, *D. hyalinata*; *Diatraea grandiosella*, *Diatraea saccharalis*, *Diphthera festiva*, *Earias* spp. tal como *E. insulana*, *E. vittella*; *Ecdytophaga aurantiana*, *Egira* (= *Xylomyges*) *curialis*, *Elasmopalpus lignosellus*, *Eldana saccharina*, *Endopiza viteana*, *Ennomos subsignaria*, *Eoreuma loftini*, *Ephestia* spp. tal como *E. cautella*, *E. elutella*, *E. kuehniella*; *Epinotia aporema*, *Epiphyas postvittana*, *Erannis tiliaria*, *Erionota thrax*, *Etiella* spp., *Eulia* spp., *Eupoecilia ambiguella*, *Euproctis chrysorrhoea*, *Euxoa* spp., *Evetria bouliana*, *Faronta albilinea*, *Feltia* spp. tal como *F. subterranean*; *Galleria mellonella*, *Gacillaria* spp., *Grapholita* spp. tal como *G. funebrana*, *G. molesta*, *G. inopinata*; *Halysidota* spp., *Harrisina americana*, *Hedylepta* spp., *Helicoverpa* spp. tal como *H. armigera* (= *Heliothis armigera*), *H. zea* (= *Heliothis zea*); *Heliothis* spp. tal como *H. assulta*, *H. subflexa*, *H. virescens*; *Hellula* spp. tal como *H. undalis*, *H. rogatalis*; *Helocoverpa gelatopoeon*, *Hemileuca oliviae*, *Herpetogramma licarsisalis*, *Hibernia defoliaria*, *Hofmannophila pseudospretella*, *Homoeosoma electellum*, *Homona magnanima*, *Hypantria cunea*, *Hyponomeuta padella*, *Hyponomeuta malinellus*, *Kakivoria flavofasciata*, *Keiferia lycopersicella*, *Lambdina fiscellaria fiscellaria*, *Lambdina fiscellaria lugubrosa*, *Lamprosema indicata*, *Laspeyresia molesta*, *Leguminivora glycinivorella*, *Lerodea eufala*, *Leucinodes orbonalis*, *Leucoma salicis*, *Leucoptera* spp. tal como *L. coffeella*, *L. scitella*; *Luminivora lycinivorella*, *Lithocolletis blancardella*, *Lithophane antennata*, *Llattia octo* (= *Amyna axis*), *Lobesia botrana*, *Lophocampa* spp., *Loxagrotis albicosta*, *Loxostege* spp. tal como *L. sticticalis*, *L. cerealis*; *Lymantria* spp. tal como *L. dispar*, *L. monacha*; *Lyonetia clerkella*, *Lyonetia pruni-foliella*,

- Malacosoma* spp. tal como *M. americanum*, *M. californicum*, *M. constrictum*, *M. neustria*; *Mamestra* spp. tal como *M. brassicae*, *M. configurata*; *Mamestra brassicae*, *Manduca* spp. tal como *M. quinquemaculata*, *M. sexta*; *Marasmia* spp., *Marmara* spp., *Maruca testulalis*, *Megalopyge la-nata*, *Melanchra picta*, *Melanitis leda*, *Mocis* spp. tal como *M. lapites*, *M. repanda*; *Mocis latipes*, *Monochroa fragariae*, *Mythimna separata*, *Nemapogon cloacella*, *Neoleucinodes elegantalis*,
5 *Nepytia* spp., *Nymphula* spp., *Oiketicus* spp., *Omiodes indicata*, *Omphis anastomosalis*, *Oper-ophtera brumata*, *Orgyia pseudotsugata*, *Oria* spp., *Orthaga thyrisalis*, *Ostrinia* spp. tal como *O. nubilalis*; *Oulema oryzae*, *Paleacrita vernata*, *Panolis flammea*, *Parnara* spp., *Papaipema nebris*, *Papilio cressphontes*, *Paramyelois transitella*, *Paranthrene regalis*, *Paysandisia archon*, *Pectinophora* spp. tal como *P. gossypiella*; *Peridroma saucia*, *Perileucoptera* spp., tal como *P. coffeella*; *Phalera bucephala*, *Phryganidia californica*, *Phthorimaea* spp. tal como *P. operculella*; *Phyllocnistis citrella*,
10 *Phyllonorycter* spp. tal como *P. blancardella*, *P. crataegella*, *P. issikii*, *P. ringoniella*; *Pieris* spp. tal como *P. brassicae*, *P. rapae*, *P. napi*; *Pilocrocis tripunctata*, *Plathypena scabra*, *Platynota* spp. tal como *P. flavedana*, *P. idaeusalis*, *P. stultana*; *Platyptilia carduidactyla*, *Plebejus argus*, *Plodia interpunctella*, *Plusia* spp., *Plutella maculipennis*, *Plutella xylostella*, *Pontia protodica*, *Prays* spp., *Prodenia* spp., *Proxenus lepigone*, *Pseudaletia* spp. tal como *P. sequax*, *P. unipuncta*; *Pyrausta nubilalis*, *Rachiplusia nu*, *Richia albicosta*, *Rhizobius ventralis*, *Rhyacionia frustrana*, *Sabulodes ae-grotata*, *Schizura concinna*, *Schoenobius* spp., *Schreckensteinia festaliella*, *Scirpophaga* spp. tal como *S. incertulas*, *S. innotata*; *Scotia segetum*, *Sesamia* spp. tal como *S. inferens*, *Seudya subflava*, *Sitotroga cerealella*, *Sparganothis pilleriana*, *Spilonota lechriaspis*, *S. ocellana*, *Spodoptera* (=Lamphygma) spp. tal como *S. cosmoides*, *S. eridania*, *S. exigua*, *S. frugiperda*, *S. latifascia*, *S. littoralis*, *S. litura*, *S. omithogalli*; *Stigmella* spp., *Stomopteryx subsecivella*, *Strymon bazochii*, *Sylepta derogata*, *Synanthedon* spp. tal como *S. exitiosa*, *Tecia solanivora*, *Telehin licus*, *Thaumatopoea pityocampa*,
20 *Thaumatotibia* (=Cryptophlebia) *leucotreta*, *Thaumetopoea pityocampa*, *Thecla* spp., *Theresimima ampelophaga*, *Thyrintina* spp., *Tildenia inconspicua*, *Tinea* spp. tal como *T. cloacella*, *T. pellionella*; *Tineola bisselliella*, *Tortrix* spp. tal como *T. viridana*; *Trichophaga tapetzella*, *Trichoplusia* spp. tal como *T. ni*; *Tuta* (=Scrobipalpula) *absoluta*, *Udea* spp. tal como *U. rubigalis*, *U. rubigalis*; *Virachola* spp., *yponomeuta padella*, y *Zeiraphera canadensis*;
25 insectos del orden de Coleoptera, por ejemplo *Acalymma vittatum*, *Acanthoscehdes obtectus*, *Adoretus* spp., *Agelastica alni*, *Agrilus* spp. tal como *A. anxius*, *A. planipennis*, *A. sinuatus*; *Agriotes* spp. tal como *A. fuscicollis*, *A. lineatus*, *A. obscurus*; *Alphitobius diaperinus*, *Amphimallus solstitialis*, *Anisandrus dispar*, *Anisoplia austriaca*, *Anobium punctatum*, *Anomala corpulenta*, *Anomala rufocuprea*, *Anoplophora* spp. tal como *A. glabripennis*; *Anthonomus* spp. tal como *A. eugenii*, *A. grandis*, *A. pomorum*; *Anthrenus* spp., *Aphthona euphoridae*, *Apion* spp., *Apogonia* spp., *Athous haemorrhoidalis*, *Atomaria* spp. tal como *A. linearis*; *Attagenus* spp., *Aulacophora femoralis*, *Blastophagus piniperda*,
30 *Blitophaga undata*, *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp. tal como *B. lentis*, *B. pisorum*, *B. rufimanus*; *Byctiscus betulae*, *Callidiellum rufipenne*, *Callopietria floridensis*, *Callosobruchus chinensis*, *Cameraria ohridella*, *Cassida nebulosa*, *Ceratomya trifurcata*, *Cetonia aurata*, *Ceutho-rhynchus* spp. tal como *C. assimilis*, *C. napi*; *Chaetocnema tibialis*, *Cleonus mendicus*, *Conoderus* spp. tal como *C. vespertinus*; *Conotrachelus nenuphar*, *Cosmopolites* spp., *Costelytra zealandica*, *Crioceris asparagi*, *Cryptolestes ferrugineus*, *Cryptorhynchus lapathi*, *Ctenicera* spp. tal como *C. de-structor*; *Curculio* spp.,
35 *Cylindrocaptus* spp., *Cyclocephala* spp., *Dactylispa balyi*, *Dectes texanus*, *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp. tal como *D. undecimpunctata*, *D. speciosa*, *D. longicornis*, *D. semi-punctata*, *D. virgifera*; *Diaprepes abbreviatus*, *Dichocrocis* spp., *Diadraspa armigera*, *Diloboderus abderus*, *Diocalandra frumenti* (*Diocalandra stigmaticollis*), *Enaphalodes rufulus*, *Epilachna* spp. tal como *E. varivestis*, *E. vigintioctomaculata*; *Epitrix* spp. tal como *E. hirtipennis*, *E. similis*; *Eutheola humilis*, *Eutinobothrus brasiliensis*, *Faustinus cubae*, *Gibbium psyllodes*, *Gnathocerus cornutus*, *Hellula undalis*,
40 *Heteronychus arator*, *Hylamorpha elegans*, *Hylobius abietis*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera* spp. tal como *H. brunneipennis*, *H. postica*; *Hypomeces squamosus*, *Hypothenemus* spp., *Ips typographus*, *Lachnosterna consanguinea*, *Lasioderma serricornis*, *Latheticus oryzae*, *Lathridius* spp., *Lema* spp. tal como *L. bilineata*, *L. melanopus*; *Leptinotarsa* spp. tal como *L. decemlineata*; *Leptispa pygmaea*, *Limonius californicus*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lixus* spp., *Luperodes* spp., *Lycetus* spp. tal como *L. bruneus*; *Liogenys fuscus*, *Macroductylus* spp. tal como *M. subspinosus*; *Maladera matrida*, *Megaplatypus mutates*, *Megascelis* spp., *Melanotus communis*, *Meligethes* spp. tal como *M. aeneus*; *Melolontha* spp. tal como *M. hippocastani*, *M. melolontha*; *Meta-masius hemipterus*, *Microtheca* spp., *Migdolus* spp. tal como *M. fryanus*, *Monochamus* spp. tal como *M. alternatus*; *Naupactus xanthographus*, *Niptus hololeucus*, *Oberia brevis*, *Oemona hirta*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Oryzaphagus oryzae*, *Otiorrhynchus sulcatus*, *Otiorrhynchus ovatus*,
50 *Otiorrhynchus sulcatus*, *Oulema melanopus*, *Oulema oryzae*, *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon* spp. tal como *P. brassicae*, *P. cochleariae*; *Phoracantha recurva*, *Phyllobius piri*, *Phyllopertha horticola*, *Phyllophaga* spp. tal como *P. helleri*; *Phyllotreta* spp. tal como *P. chrysocephala*, *P. nemorum*, *P. striolata*, *P. vittula*; *Phyllopertha horticola*, *Popillia japonica*, *Premnotypes* spp., *Psacothia hilaris*, *Psylliodes chrysocephala*, *Prostephanus truncatus*, *Psylliodes* spp., *Ptinus* spp., *Pulga saltona*, *Rhizopertha dominica*, *Rhynchophorus* spp. tal como *R. bilineatus*, *R. ferrugineus*, *R. palmarum*, *R. phoenicis*, *R. vulneratus*; *Saperda candida*, *Scolytus schevyrewi*, *Scyphophorus acupunctatus*, *Sitona lineatus*, *Sitophilus* spp. tal como *S. granaria*, *S. oryzae*, *S. zeamais*; *Sphe-nophorus* spp. tal como *S. levis*; *Stegobium paniceum*, *Sternechus* spp. tal como *S. subsignatus*; *Strophomorphus ctenotus*, *Symphyletes* spp., *Tanymecus* spp., *Tenebrio molitor*, *Tenebrioides laurentianus*, *Tribolium* spp. tal como *T. castaneum*; *Trogoderma* spp., *Tychius* spp., *Xylotrechus* spp. tal como *X. pyrrhoderus*; y, *Zabrus* spp. tal como *Z. tenebrioides*;
60 insectos del orden de Diptera por ejemplo *Aedes* spp. tal como *A. aegypti*, *A. albopictus*, *A. vexans*; *Anastrepha ludens*, *Anopheles* spp. tal como *A. albimanus*, *A. crucians*, *A. freeborni*, *A. gambiae*, *A. leucosphyrus*, *A. maculipennis*, *A. minimus*, *A. quadrimaculatus*, *A. sinensis*; *Bactrocera invadens*, *Bibio hortulanus*, *Calliphora erythrocephala*, *Calliphora vicina*, *Ceratitis capitata*, *Chrysomya* spp. tal como *C. bezziana*, *C. hominivorax*, *C. macellaria*; *Chrysops atlanticus*, *Chrysops discalis*, *Chrysops silacea*, *Cochliomyia* spp. tal como *C. hominivorax*; *Contarinia* spp. tal como *C. sorghicola*; *Cordylobia anthropophaga*, *Culex* spp. tal como *C. nigripalpus*, *C. pipiens*, *C. quinquefasciatus*, *C. tarsalis*, *C. tritaeniorhynchus*; *Culicoides furens*, *Culiseta inornata*, *Culiseta melanura*, *Cuterebra* spp., *Dacus cucurbitae*, *Dacus oleae*,
65 *Dasineura brassicae*, *Dasineura oxycoccana*, *Delia* spp. tal como *D. antique*, *D. coarctata*, *D. platura*, *D. radicum*;

- Dermatobia hominis*, *Drosophila* spp. tal como *D. suzukii*, *Fannia* spp. tal como *F. canicularis*; *Gastrophilus* spp. tal como *G. intestinalis*; *Geomyza tipunctata*, *Glossina* spp. tal como *G. fuscipes*, *G. morsitans*, *G. palpalis*, *G. tachinoides*; *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hippelates* spp., *Hylemyia* spp. tal como *H. platura*; *Hypoderma* spp. tal como *H. lineata*; *Hyppobosca* spp., *Hydrellia philippina*, *Leptoconops torrens*, *Liriomyza* spp. tal como *L. sativae*, *L. trifolii*; *Lucilia* spp. tal como *L. caprina*, *L. cuprina*, *L. sericata*; *Lycoria pectoralis*, *Mansonia titillans*, *Mayetiola* spp. tal como *M. destructor*; *Musca* spp. tal como *M. autumnalis*, *M. domestica*; *Muscina stabulans*, *Oestrus* spp. tal como *O. ovis*; *Opomyza florum*, *Oscinella* spp. tal como *O. frit*; *Orseolia oryzae*, *Pegomya hysocyami*, *Phlebotomus argentipes*, *Phorbia* spp. tal como *P. antiqua*, *P. brassicae*, *P. coarctata*; *Phytomyza gymnostoma*, *Prosimulium mixtum*, *Psila rosae*, *Psorophora columbiae*, *Psorophora discolor*, *Rhagoletis* spp. tal como *R. cerasi*, *R. cingulate*, *R. indifferens*, *R. mendax*, *R. pomonella*; *Rivellia quadrifasciata*, *Sarcophaga* spp. tal como *S. haemorrhoidalis*; *Simulium vittatum*, *Sitodiplosis mosellana*, *Stomoxis* spp. tal como *S. calcitrans*; *Tabanus* spp. tal como *T. atratus*, *T. bovinus*, *T. lineola*, *T. similis*; *Tannia* spp., *Thecodiplosis japonensis*, *Tipula oleracea*, *Tipula paludosa*, y *Wohlfahrtia* spp;
- insectos del orden de Thysanoptera por ejemplo, *Baliothrips biformis*, *Dichromothrips corbetti*, *Dichromothrips* spp., *Echinothrips americanus*, *Enneothrips flavens*, *Frankliniella* spp. tal como *F. fusca*, *F. occidentalis*, *F. tritici*; *Heliethrips* spp., *Hercinothrips femoralis*, *Kakothrips* spp., *Microcephalothrips abdominalis*, *Neohydatothrips samayunkur*, *Pezothrips kellyanus*, *Rhipiphorotherips cruentatus*, *Scirtothrips* spp. tal como *S. citri*, *S. dorsalis*, *S. perseae*; *Stenchaetothrips* spp., *Taeniothrips cardamoni*, *Taeniothrips inconsequens*, *Thrips* spp. tal como *T. imagines*, *T. hawaiiensis*, *T. oryzae*, *T. palmi*, *T. parvispinus*, *T. tabaci*;
- insectos del orden de Hemiptera por ejemplo, *Acizzia jamatonica*, *Acrosternum* spp. tal como *A. hilare*; *Acyrtosipon* spp. tal como *A. onobrychis*, *A. pisum*; *Adelges laricis*, *Adelges tsugae*, *Adelphocoris* spp., tal como *A. rapidus*, *A. superbus*; *Aeneolamia* spp., *Agonoscena* spp., *Aulacorthum solani*, *Aleurocanthus woglumi*, *Aleurodes* spp., *Aleurodicus disperses*, *Aleurolobus barodensis*, *Aleurothrixus* spp., *Amrasca* spp., *Anasa tristis*, *Antestiopsis* spp., *Anuraphis cardui*, *Aonidiella* spp., *Aphanostigma piri*, *Aphidula nasturtii*, *Aphis* spp. tal como *A. craccivora*, *A. fabae*, *A. forbesi*, *A. gossypii*, *A. grossulariae*, *A. maidiradicis*, *A. pomi*, *A. sambuci*, *A. schneideri*, *A. spiraecola*; *Arboridia apicalis*, *Arilus critatus*, *Aspidiella* spp., *Aspidiotus* spp., *Atanus* spp., *Aulacaspis yasumatsui*, *Aulacorthum solani*, *Bactericera cockerelli* (*Paratrioza cockerelli*), *Bemisia* spp. tal como *B. argentifolii*, *B. tabaci* (*Aleurodes tabaci*); *Blissus* spp. tal como *B. leucopterus*; *Brachycaudus* spp. tal como *B. cardui*, *B. helichrysi*, *B. persicae*, *B. prunicola*; *Brachycolus* spp., *Brachycorynella asparagi*, *Brevicoryne brassicae*, *Cacopsylla* spp. tal como *C. fulguralis*, *C. piricola* (*Psylla piri*); *Cal-ligypona marginata*, *Calocoris* spp., *Campylomma livida*, *Capitophorus horni*, *Carneiocephala fulgida*, *Cavelerius* spp., *Ceraplastes* spp., *Ceratovacuna lanigera*, *Ceroplastes ceriferus*, *Cerosipha gossypii*, *Chaetosiphon fragaefolii*, *Chionaspis tegalensis*, *clorita onukii*, *Chromaphis juglandicola*, *Chrysomphalus ficus*, *Cicadulina mbila*, *Cimex* spp. tal como *C. hemipterus*, *C. lectularius*; *Coccoxymytilus halli*, *Coccus* spp. tal como *C. hesperidum*, *C. pseudomagnoliarum*; *Corythucha arcuata*, *Creontiades dilutus*, *Cryptomyzus ribis*, *Chrysomphalus aonidum*, *Cryptomyzus ribis*, *Ctenarytaina spatulata*, *Cyrtopeltis notatus*, *Dalbulus* spp., *Dasynus piperis*, *Dialeurodes* spp. tal como *D. citrifolii*; *Dalbulus maidis*, *Diaphorina* spp. tal como *D. citri*; *Diaspis* spp. tal como *D. bromeliae*; *Dichelops fur-catus*, *Diconocoris hewetti*, *Doralis* spp., *Dreyfusia nordmannianae*, *Dreyfusia piceae*, *Drosicha* spp., *Dysaphis* spp. tal como *D. plantaginea*, *D. piri*, *D. radicola*; *Dysaulacorthum pseudosolani*, *Dysdercus* spp. tal como *D. cingulatus*, *D. intermedius*; *Dysmicoccus* spp., *Edessa* spp., *Geocoris* spp., *Empoasca* spp. tal como *E. fabae*, *E. solana*; *Epidiaspis leperii*, *Eriosoma* spp. tal como *E. lanigerum*, *E. piricola*; *Erythroneura* spp., *Eurygaster* spp. tal como *E. integriceps*; *Euscelis bilobatus*, *Euschistus* spp. tal como *E. heros*, *E. impictiventris*, *E. servus*; *Fiorinia theae*, *Geococcus coffeae*, *Glycaspis brimblecombei*, *Halyomorpha* spp. tal como *H. halys*; *Heliopeltis* spp., *Homalodisca vit-ripennis* (= *H. coagulata*), *Horcias nobilellus*, *Hyalopterus pruni*, *Hyperomyzus lactucae*, *Icerya* spp. tal como *I. purchase*; *Idiocerus* spp., *Idioscopus* spp., *Laodelphax striatellus*, *Lecanium* spp., *Lecanoideus floccissimus*, *Lepidosaphes* spp. tal como *L. ulmi*; *Leptocoris* spp., *Leptoglossus phyl-lopus*, *Lipaphis erysimi*, *Lygus* spp. tal como *L. hesperus*, *L. lineolaris*, *L. pratensis*; *Macronelliococcus hirsutus*, *Marchalina hellenica*, *Macropes excavatus*, *Macrosiphum* spp. tal como *M. rosae*, *M. avenae*, *M. euphorbiae*; *Macrosteles quadrilineatus*, *Mahanarva fimbriolata*, *Megacopta cribraria*, *Megoura viciae*, *Melanaphis pirarius*, *Melanaphis sacchari*, *Melanocallis* (= *Tinocallis*) *caryaefoliae*, *Metcafiella* spp., *Metopolophium dirhodum*, *Monellia costalis*, *Monelliopsis pecanis*, *Myzocallis corili*, *Murgantia* spp., *Myzus* spp. tal como *M. ascalonicus*, *M. cerasi*, *M. nicotianae*, *M. persicae*, *M. varians*; *Nasonovia ribis-nigri*, *Neotoxoptera formosana*, *Neomegalotomus* spp., *Nephotettix* spp. tal como *N. malayanus*, *N. nigropictus*, *N. parvus*, *N. virescens*; *Nezara* spp. tal como *N. viridula*; *Nilaparvata lugens*, *Nysius huttoni*, *Oebalus* spp. tal como *O. pugnax*; *Oncometopia* spp., *Orthezia praelonga*, *Oxycaraenus hyalinipennis*, *Parabemisia myricae*, *Parlatoria* spp., *Parthenolecanium* spp. tal como *P. corni*, *P. persicae*; *Pemphigus* spp. tal como *P. bursarius*, *P. populivenerae*; *Peregri-nus maidis*, *Perkinsiella saccharicida*, *Phenacoccus* spp. tal como *P. aceris*, *P. gossypii*; *Phloeomyzus passerinii*, *Phorodon humuli*, *Phylloxera* spp. tal como *P. devastatrix*, *Piesma quadrata*, *Piezodorus* spp. tal como *P. guildinii*; *Pinnaspis aspidistrae*, *Planococcus* spp. tal como *P. citri*, *P. ficus*; *Prosapia bicincta*, *Protopulvinaria piriformis*, *Psallus seriatus*, *Pseudacysta perseae*, *Pseudaulacaspis pentagona*, *Pseudococcus* spp. tal como *P. comstocki*; *Psylla* spp. tal como *P. mali*; *Pteromalus* spp., *Pulvinaria amygdali*, *Pyrilla* spp., *Quadraspidiotus* spp., tal como *Q. perniciosus*; *Quesada gigas*, *Rastrococcus* spp., *Reduvius senilis*, *Rhizococcus americanus*, *Rhodnius* spp., *Rhopalomyzus ascalonicus*, *Rhopalosiphum* spp. tal como *R. pseudobrassicae*, *R. insertum*, *R. maidis*, *R. padi*; *Sagatodes* spp., *Sahlbergella singularis*, *Saissetia* spp., *Sappaphis mala*, *Sappaphis mali*, *Scaptocoris* spp., *Scaphoides titanus*, *Schizaphis graminum*, *Schizoneura lanuginosa*, *Scotinophora* spp., *Selenaspis articulatus*, *Sitobion avenae*, *Sogata* spp., *Sogatella furcifera*, *Sol-ubea insularis*, *Spissistilus festinus* (= *Stictocephala festina*), *Stephanitis nashi*, *Stephanitis piri-oideis*, *Stephanitis takeyai*, *Tenalaphara malayensis*, *Tetraleurodes perseae*, *Therioaphis maculata*, *Thyanta* spp. tal como *T. accerra*, *T. perditor*; *Tibraca* spp., *Tomaspsis* spp., *Toxoptera* spp. tal como *T. aurantii*; *Trialeurodes* spp. tal como *T. abutilonea*, *T. ricini*, *T. vaporariorum*; *Triatoma* spp., *Triozia* spp., *Typhlocyba* spp., *Unaspis* spp. tal como *U. citri*, *U. yanonensis*; y *Viteus vitifolii*,
- Insectos del orden de Hymenoptera por ejemplo *Acanthomyops interjectus*, *Athalia rosae*, *Atta* spp. tal como *A. capiguara*,

- A. cephalotes*, *A. cephalotes*, *A. laevigata*, *A. robusta*, *A. sexdens*, *A. texana*, *Bombus* spp., *Brachymyrmex* spp., *Camponotus* spp. tal como *C. floridanus*, *C. pennsylvanicus*, *C. modoc*; *Cardiocondyla nuda*, *Chalibion* sp, *Crematogaster* spp., *Dasymutilla occidentalis*, *Diprion* spp., *Dolichovespula maculata*, *Dorymyrmex* spp., *Dryocosmus kuriphilus*, *Formica* spp., *Hoplocampa* spp. tal como *H. minuta*, *H. testudinae*; *Iridomyrmex humilis*, *Lasius* spp. tal como *L. niger*, *Linepithema humile*, *Liometopum* spp., *Leptocybe invasa*, *Monomorium* spp. tal como *M. pharaonis*, *Monomorium*, *Nylandria fulva*, *Pachycondyla chinensis*, *Paratrechina longicornis*, *Paravespula* spp., tal como *P. germanica*, *P. pennsylvanica*, *P. vulgaris*; *Pheidole* spp. tal como *P. megacephala*; *Pogonomyrmex* spp. tal como *P. barbatus*, *P. californicus*, *Polistes rubiginosa*, *Prenolepis imparis*, *Pseudomyrmex gracilis*, *Scheliopron* spp., *Sirex cyaneus*, *Solenopsis* spp. tal como *S. geminata*, *S. invicta*, *S. molesta*, *S. richteri*, *S. xyloni*, *Sphecius speciosus*, *Sphex* spp., *Tapinoma* spp. tal como *T. melanocephalum*, *T. sessile*; *Tetramorium* spp. tal como *T. caespitum*, *T. bicarinatum*, *Vespa* spp. tal como *V. crabro*; *Vespula* spp. tal como *V. squamosa*; *Wasmannia auropunctata*, *Xylocopa* sp;
- Insectos del orden de Orthoptera por ejemplo *Acheta domesticus*, *Calliptamus italicus*, *Chortoicetes terminifera*, *Ceuthophilus* spp., *Diastrammena asynamora*, *Dociostaurus maroccanus*, *Gryllotalpa* spp. tal como *G. africana*, *G. gryllotalpa*; *Gryllus* spp., *Hieroglyphus daganensis*, *Kraussaria angulifera*, *Locusta* spp. tal como *L. migratoria*, *L. pardalina*; *Melanoplus* spp. tal como *M. bivittatus*, *M. femurrubrum*, *M. mexicanus*, *M. sanguinipes*, *M. spretus*; *Nomadacris septemfasciata*, *Oedaleus senegalensis*, *Scapteriscus* spp., *Schistocerca* spp. tal como *S. americana*, *S. gregaria*, *Stemopelmatus* spp., *Tachycines asynamor*, y *Zonozerus variegatus*;
- Plagas de la Clase Arácnida por ejemplo Acari, por ejemplo, de las Familias Argasidae, Ixodidae y Sarcoptidae, tal como *Amblyomma* spp. (por ejemplo, *A. americanum*, *A. variegatum*, *A. maculatum*), *Argas* spp. tal como *A. persicu*), *Boophilus* spp. tal como *B. annulatus*, *B. decoloratus*, *B. microplus*, *Dermacentor* spp. tal como *D. silvarum*, *D. andersoni*, *D. variabilis*, *Hyalomma* spp. tal como *H. truncatum*, *Ixodes* spp. tal como *I. ricinus*, *I. rubicundus*, *I. scapularis*, *I. holocyclus*, *I. pacificus*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Ornithodoros* spp. tal como *O. moubata*, *O. hermsi*, *O. turicata*, *Ornithonyssus bacoti*, *Otobius megnini*, *Dermanyssus gallinae*, *Psoroptes* spp. tal como *P. ovis*, *Rhipicephalus* spp. tal como *R. sanguineus*, *R. appendiculatus*, *Rhipicephalus evertsi*, *Rhizoglyphus* spp., *Sarcoptes* spp. tal como *S. Scabiei*; y Familia Eriophyidae que incluye *Aceria* spp. tal como *A. sheldoni*, *A. anthocoptes*, *Acallitus* spp., *Aculops* spp. tal como *A. lycopersici*, *A. pelekassi*; *Aculus* spp. tal como *A. schlehtendali*; *Colomerus vitis*, *Epitrimerus piri*, *Phyllocoptruta oleivora*; *Eriophyes ribis* y *Eriophyes* spp. tal como *Eriophyes sheldoni*; Familia Tarsonemidae que incluye *Hemitarsonemus* spp., *Phytonemus pallidus* y *Polyphagotarsonemus latus*, *Stenotarsonemus* spp. *Steneotarsonemus spinki*; Familia Tenuipalpidae que incluye *Brevipalpus* spp. tal como *B. phoenicis*; Familia Tetranychidae que incluye *Eotetranychus* spp., *Eutetranychus* spp., *Oligonychus* spp., *Petrobia latens*, *Tetranychus* spp. tal como *T. cinnabarinus*, *T. evansi*, *T. kanzawai*, *T. pacificus*, *T. phaseolus*, *T. telarius* y *T. urticae*; *Bryobia praetiosa*; *Panonychus* spp. tal como *P. ulmi*, *P. citri*; *Metatetranychus* spp. y *Oligonychus* spp. tal como *O. pratensis*, *O. perseae*, *Vasates lycopersici*; *Raoiella indica*, Familia Carpoglyphidae que incluye *Carpoglyphus* spp.; *Penthaletidae* spp. tal como *Halotydeus destructor*; Familia Demodicidae con especies tal como *Demodex* spp.; Familia Trombicidae que incluye *Trombicula* spp.; Familia Macronyssidae que incluye *Ornithonyssus* spp.; Familia Pyemotidae que incluye *Pyemotes tritici*; *Tyrophagus putrescentiae*; Familia Acaridae que incluye *Acarus siro*; Familia Araneida que incluye *Latrodectus mactans*, *Tegenaria agrestis*, *Chiracanthium* sp, *Lycosa* sp *Achaearanea tepidariorum* y *Loxosceles reclusa*;
- Plagas del Filo Nematoda, por ejemplo, nematodos fitoparásitos tal como nematodos de raíz, *Meloidogyne* spp. tal como *M. hapla*, *M. incognita*, *M. javanica*; nematodos formadores de quistes, *Globodera* spp. tal como *G. rostochiensis*; *Heterodera* spp. tal como *H. avenae*, *H. glycines*, *H. schachtii*, *H. trifolii*; nematodos de las agallas de la semilla, *Anguina* spp.; nematodos de tallo y hojas, *Aphelenchoides* spp. tal como *A. besseyi*; nematodos de picadura, *Belonolaimus* spp. tal como *B. longicaudatus*; nematodos de pino, *Bursaphelenchus* spp. tal como *B. lignicolus*, *B. xylophilus*; nematodos de anillo, *Criconeima* spp., *Criconeimella* spp. tal como *C. xenoplax* y *C. ornata*; y, *Criconeimoides* spp. tal como *Criconeimoides informis*; *Mesocriconeima* spp.; nematodos de tallo y bulbo, *Ditylenchus* spp. tal como *D. destructor*, *D. dipsaci*; nemátodos de alcachofa, *Dolichodorus* spp.; nematodos en espiral, *Helicotylenchus multicinctus*; nematodos de vaina y de la vaina, *Hemicycliophora* spp. y *Hemicriconeimoides* spp.; *Hirshmanniella* spp.; nematodos lanza, *Hoploaimus* spp.; Falsos nematodos de la raíz, *Nacobbus* spp.; nematodos de aguja, *Longidorus* spp. tal como *L. elongatus*; nematodos de lesiones, *Pratylenchus* spp. tal como *P. brachyurus*, *P. neglectus*, *P. penetrans*, *P. curvatus*, *P. goodeyi*; nematodos barrenadores, *Radopholus* spp. tal como *R. similis*; *Rhadopholus* spp.; *Rhadopholus* spp.; nematodos reniformes, *Rotylenchus* spp. tal como *R. robustus*, *R. reniformis*; *Scutellonema* spp.; nematodos de raíz corta, *Trichodorus* spp. tal como *T. obtusus*, *T. primitivus*; *Paratrichodorus* spp. tal como *P. minor*; nemátodos acrobáticos, *Tylenchorhynchus* spp. tal como *T. claytoni*, *T. dubius*; nematodos de los cítricos, *Tylenchulus* spp. tal como *T. semipenetrans*; nemátodos daga, *Xiphinema* spp.; y otras especies de nematodos fitoparásitos;
- Insectos del orden de Isoptera por ejemplo *Calotermes flavicollis*, *Coptotermes* spp. tal como *C. formosanus*, *C. gestroi*, *C. acinaciformis*; *Cornitermes cumulans*, *Cryptotermes* spp. tal como *C. brevis*, *C. cavifrons*; *Globitermes sulfureus*, *Heterotermes* spp. tal como *H. aureus*, *H. longiceps*, *H. tenuis*; *Leucotermes flavipes*, *Odontotermes* spp., *Incisitermes* spp. tal como *I. minor*, *I. Snyder*; *Marginitermes hubbardi*, *Mastotermes* spp. tal como *M. darwiniensis* *Neocapritermes* spp. tal como *N. opacus*, *N. parvus*; *Neotermes* spp., *Procornitermes* spp., *Zootermopsis* spp. tal como *Z. angusticollis*, *Z. nevadensis*, *Reticulitermes* spp. tal como *R. hesperus*, *R. tibialis*, *R. speratus*, *R. flavipes*, *R. grassei*, *R. lucifugus*, *R. santonensis*, *R. virginicus*; *Termes natalensis*, Insectos del orden de Blattaria por ejemplo *Blatta* spp. tal como *B. orientalis*, *B. lateralis*; *Blattella* spp. tal como *B. asahinae*, *B. germanica*; *Leucophaea maderae*, *Panclora nivea*, *Periplaneta* spp. tal como *P. americana*, *P. australasiae*, *P. brunnea*, *P. fuliginosa*, *P. japonica*; *Supella longipalpa*, *Parcoblatta pennsylvanica*, *Eurycotis floridana*, *Pycnoscelus surinamensis*,
- Insectos del orden de Siphonoptera por ejemplo *Cediopsylla simplex*, *Ceratophyllus* spp., *Ctenocephalides* spp. tal como *C. felis*, *C. canis*, *Xenopsylla cheopis*, *Pulex irritans*, *Trichodectes canis*, *Tunga penetrans*, y *Nosopsyllus fasciatus*,
- Insectos del orden de Thysanura por ejemplo *Lepisma saccharina*, *Ctenolepisma urbana*, y *Thermobia domestica*,

- Pesticidas de la clase Chilopoda por ejemplo *Geophilus spp.*, *Scutigera spp.* tal como *Scutigera coleoptrata*;
- Pesticidas de la clase Diplopoda por ejemplo *Blaniulus guttulatus*, *Julus spp.*, *Narceus spp.*,
- Pesticidas de la clase Symphyla por ejemplo *Scutigera immaculata*,
- 5 Insectos del orden de Dermaptera, por ejemplo *Forficula auricularia*,
- Insectos del orden de Collembola, por ejemplo *Onychiurus spp.*, tal como *Onychiurus armatus*, Pesticidas de order Isopoda por ejemplo, *Armadillidium vulgare*, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*,
- Insectos del orden de Phthiraptera, por ejemplo *Damalinia spp.*, *Pediculus spp.* tal como *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pediculus humanus humanus*; *Pthirus pubis*, *Haematopinus spp.* tal como *Haematopinus eurytetrus*, *Haematopinus suis*; *Linognathus spp.* tal como *Linognathus vituli*; *Bovicola bovis*, *Menopon gallinae*,
- 10 *Menacanthus stramineus* y *Solenopotes capillatus*, *Trichodectes spp.*,
- Ejemplos de otras especies de plagas que pueden ser controladas por compuestos de fórmula (I) que incluye: de Phylum Mollusca, class Bivalvia, por ejemplo, *Dreissena spp.*; class Gastropoda, por ejemplo, *Arion spp.*, *Biomphalaria spp.*, *Bulinus spp.*, *Deroceras spp.*, *Galba spp.*, *Lymnaea spp.*, *Oncomelania spp.*, *Pomacea canaliculata*, *Succinea spp.*; de la clase de the helminths, por ejemplo, *Ancylostoma duodenale*, *Ancylostoma ceylanicum*, *Acylostoma braziliensis*, *Ancylostoma spp.*, *Ascaris lubricoides*, *Ascaris spp.*, *Brugia malayi*, *Brugia timori*, *Bunostomum spp.*, *Chabertia spp.*, *Clonorchis spp.*, *Cooperia spp.*, *Dicrocoelium spp.*, *Dictyocaulus filaria*, *Diphylobothrium latum*, *Dracunculus medinensis*, *Echinococcus granulosus*, *Echinococcus multilocularis*, *Enterobius vermicularis*, *Fasciola spp.*, *Haemonchus spp.* tal como *Haemonchus contortus*; *Heterakis spp.*, *Hymenolepis nana*, *Hyostrogylus spp.*, *Loa Loa*, *Nematodirus spp.*, *Oesophagostomum spp.*, *Opisthorchis spp.*, *Onchocerca volvulus*, *Ostertagia spp.*, *Paragonimus spp.*, *Schistosoma spp.*, *Strongyloides fuelleborni*, *Strongyloides stercoralis*, *Strongyloides spp.*, *Taenia saginata*, *Taenia solium*, *Trichinella spiralis*, *Trichinella nativa*, *Trichinella britovi*, *Trichinella nelsoni*, *Trichinella pseudospiralis*, *Trichostrongylus spp.*, *Trichuris trichuria*, *Wuchereria bancrofti*.
- 25 Los compuestos de la presente invención son adecuados para uso en el tratamiento o protección de animales contra infestación o infección por parásitos. Por lo tanto, la presente invención también se refiere al uso de un compuesto de la presente invención para la elaboración de un medicamento para el tratamiento o protección de animales contra la infestación o infección por parásitos. Además, la presente invención se refiere a un método para tratar o proteger a los animales contra la infestación e infección por parásitos, que comprende administrar o aplicar a los animales por vía oral, tópica o parenteral una cantidad efectiva como parásito de un compuesto de la presente invención.
- 30 La presente invención también se refiere al uso no terapéutico de compuestos de la presente invención para tratar o proteger animales contra la infestación e infección por parásitos. Además, la presente invención se refiere a un método no terapéutico para tratar o proteger a los animales contra la infestación e infección por parásitos, que comprende aplicar a un locus una cantidad parasiticida efectivo de un compuesto de la presente invención.
- 35 Los compuestos de la presente invención son adecuados además para su uso en el combate o control de parásitos en y sobre animales. Además, la presente invención se refiere a un método para combatir o controlar parásitos en y sobre animales, que comprende poner en contacto los parásitos con una cantidad parasitidamente efectiva de un compuesto de la presente invención.
- 40 La presente invención también se refiere al uso no terapéutico de compuestos de la presente invención para controlar o combatir parásitos. Además, la presente invención se refiere a un método no terapéutico para combatir o controlar parásitos, que comprende la aplicación a un locus de una cantidad parasitidamente efectiva de un compuesto de la presente invención.
- 45 Los compuestos de la presente invención pueden ser efectivos a través del contacto (a través de suelo, vidrio, pared, red de cama, alfombra, mantas o partes de animal) e ingestión (por ejemplo, cebos). Además, los compuestos de la presente invención se pueden aplicar a cualquiera y todas las etapas de desarrollo.
- 50 Los compuestos de la presente invención se pueden aplicar como tales o en forma de composiciones que comprenden los compuestos de la presente invención.
- Los compuestos de la presente invención también se pueden aplicar junto con un compañero de mezcla, que actúa contra parásitos patógenos, por ejemplo, con compuestos de coccidiosis sintética, politerantibióticos tal como Amprolium, Robenidin, Toltrazuril, Monensin, Salinomycin, Maduramicina, Lasalocid, Narasina o Semduramicina, o con otros compañeros de mezcla como se definió anteriormente, o en forma de composiciones que comprenden estas mezclas.
- 55 Los compuestos de la presente invención y las composiciones que los comprenden se pueden aplicar por vía oral, parenteral o tópica, por ejemplo, por vía dérmica. Los compuestos de la presente invención pueden ser sistemáticamente o no sistemáticamente efectivos.
- 60 La aplicación se puede llevar a cabo de forma profiláctica, terapéutica o no terapéutica. Además, la aplicación se puede llevar a cabo de manera preventiva en lugares en los que se espera la aparición de los parásitos.
- 65 Como se usa en la presente, el término "poner en contacto" incluye tanto contacto directo (aplicando los compuestos/composiciones directamente sobre el parásito, que incluye la aplicación directamente sobre el animal o

excluyendo la aplicación directamente sobre el animal, por ejemplo, en su locus para este último) como contacto indirecto (aplicando los compuestos/composiciones al locus del parásito). El contacto del parásito a través de la aplicación a su locus es un ejemplo de un uso no terapéutico de los compuestos de la presente invención. El término "locus" significa el hábitat, el suministro de alimentos, el caldo de cultivo, la zona, el material o el medio ambiente en el que un parásito está creciendo o puede crecer fuera del animal.

Como se usa en la presente, el término "parásitos" incluye endoparásitos y ectoparásitos. En algunas realizaciones de la presente invención, se pueden preferir endoparásitos. En otras realizaciones, se pueden preferir ectoparásitos. Las infestaciones en animales y peces de sangre caliente incluyen, pero no se limitan a, piojos, piojos mordedores, garrapatas, bots nasales, keds, moscas mordedoras, moscas moscoides, moscas, larvas de moscas miasóticas, niguas, mosquitos, mosquitos y pulgas.

Los compuestos de la presente invención son especialmente útiles para combatir parásitos de los siguientes órdenes y especies, respectivamente:

pulgas (*Siphonaptera*), por ejemplo, *Ctenocephalides felis*, *Ctenocephalides canis*, *Xenopsylla cheopis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, y *Nosopsyllus fasciatus*; cucarachas (*Blattaria - Blattodea*), por ejemplo, *Blattella germanica*, *Blattella asahinae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta japonica*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Periplaneta australasiae*, y *Blatta orientalis*; moscas, mosquitos (*Diptera*), por ejemplo, *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes vexans*, *Anastrepha ludens*, *Anopheles maculipennis*, *Anopheles crucians*, *Anopheles albimanus*, *Anopheles gambiae*, *Anopheles freeborni*, *Anopheles leucosphyrus*, *Anopheles minimus*, *Anopheles quadrimaculatus*, *Calliphora vicina*, *Chrysomya bezziana*, *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macellaria*, *Chrysops discalis*, *Chrysops silacea*, *Chrysops atlanticus*, *Cochliomyia hominivorax*, *Cordylobia anthropophaga*, *Culicoides furens*, *Culex pipiens*, *Culex nigripalpus*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex tarsalis*, *Culiseta inornata*, *Culiseta melanura*, *Dermatobia hominis*, *Fannia canicularis*, *Gasterophilus intestinalis*, *Glossina morsitans*, *Glossina palpalis*, *Glossina fuscipes*, *Glossina tachinoides*, *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hippelates* spp., *Hypoderma lineata*, *Leptoconops torrens*, *Lucilia caprina*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*, *Lycoria pectoralis*, *Mansonia* spp., *Musca domestica*, *Muscina stabulans*, *Oestrus ovis*, *Phlebotomus argentipes*, *Psorophora columbiae*, *Psorophora discolor*, *Prosimulium mixtum*, *Sarcophaga haemorrhoidalis*, *Sarcophaga* sp., *Simulium vittatum*, *Stomoxys calcitrans*, *Tabanus bovinus*, *Tabanus atratus*, *Tabanus lineola*, y *Tabanus similis*; lice (*Phthiraptera*), por ejemplo, *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pthirus pubis*, *Haematopinus eurytarnus*, *Haematopinus suis*, *Linognathus vituli*, *Bovicola bovis*, *Menopon gallinae*, *Menacanthus stramineus* y *Solenopotes capillatus*; garrapatas y ácaros parásitos (*Parasitiformes*): garrapatas (*Ixodida*), por ejemplo, *Ixodes scapularis*, *Ixodes holocyclus*, *Ixodes pacificus*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Dermacentor andersoni*, *Dermacentor variabilis*, *Amblyomma americanum*, *Amblyomma maculatum*, *Ornithodoros hermsi*, *Ornithodoros turicata* y ácaros parásitos (*Mesostigmata*), por ejemplo, *Ornithonyssus bacoti* y *Dermanyssus gallinae*; *Actinieda* (*Prostigmata*) y *Acaridida* (*Astigmata*), por ejemplo, *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp., *Ornithocheyletia* spp., *Myobia* spp., *Psorergates* spp., *Demodex* spp., *Trombicula* spp., *Listrophorus* spp., *Acarus* spp., *Tyrophagus* spp., *Caloglyphus* spp., *Hypodectes* spp., *Pterolichus* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Otodectes* spp., *Sarcoptes* spp., *Notoedres* spp., *Knemidocoptes* spp., *Cytodites* spp., y *Laminosioptes* spp.; Bugs (*Heteroptera*): *Cimex lectularius*, *Cimex hemipterus*, *Reduvius senilis*, *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongylus* spp., y *Arilus critatus*; Anopluros, por ejemplo, *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Pthirus* spp., y *Solenopotes* spp.; Piojos masticadores (suborden *Amblycerina* y *Ischnocerina*), por ejemplo, *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Trichodectes* spp., y *Felicola* spp.; Roundworms *Nematoda*: *Tricocéfalo* y *Trichinosis* (*Trichosyringida*), por ejemplo, *Trichinellidae* (*Trichinella* spp.), (*Trichuridae*) *Trichuris* spp., *Capillaria* spp.; *Rambatidos*, por ejemplo, *Rhabditis* spp., *Strongyloides* spp., *Helicephalobus* spp.; *Strongylida*, por ejemplo, *Strongylus* spp., *Ancylostoma* spp., *Necator americanus*, *Bunostomum* spp. (*Anquilostomas*), *Trichostrongylus* spp., *Haemonchus contortus*, *Ostertagia* spp., *Cooperia* spp., *Nematodirus* spp., *Dictyocaulus* spp., *Cyathostoma* spp., *Oesophagostomum* spp., *Stephanurus dentatus*, *Ollulanus* spp., *Chabertia* spp., *Stephanurus dentatus*, *Syngamus trachea*, *Ancylostoma* spp., *Uncinaria* spp., *Globocephalus* spp., *Necator* spp., *Metastrongylus* spp., *Muellerius capillaris*, *Protostrongylus* spp., *Angiostrongylus* spp., *Parelafostrogylus* spp., *Aleurostrongylus abstrusus*, y *Diocotophyema renale*; lombrices intestinales (*Ascaridida*), por ejemplo, *Ascaris lumbricoides*, *Ascaris suum*, *Ascaridia galli*, *Parascaris equorum*, *Enterobius vermicularis* (*Gusano de hilo*), *Toxocara canis*, *Toxascaris leonine*, *Skrjabinema* spp., y *Oxyuris equi*; *Camallanida*, por ejemplo, *Dracunculus medinensis* (*lombriz de Guinea*); *Spirurida*, por ejemplo, *Thelazia* spp., *Wuchereria* spp., *Brugia* spp., *Onchocerca* spp., *Diro-filari* spp., *Dipetalonema* spp., *Setaria* spp., *Elaeophora* spp., *Spirocerca lupi*, y *Habronema* spp.; *Gusano de cabeza espinosa* (*Acanthocephala*), por ejemplo, *Acanthocephalus* spp., *Macracanthorhynchus hirudinaceus* y *Oncicola* spp.; *Planarians* (*Plathelminthes*): *Trematodos* (*Trematoda*), por ejemplo, *Faciola* spp., *Fascioloides magna*, *Paragonimus* spp., *Dicrocoelium* spp., *Fasciolopsis buski*, *Clonorchis sinensis*, *Schistosoma* spp., *Trichobilharzia* spp., *Alaria alata*, *Paragonimus* spp., y *Nanocyetes* spp.; *Cercomeromorpha*, en particular *Cestoda* (*Taenias*), por ejemplo, *Diphyllobothrium* spp., *Tenia* spp., *Echinococcus* spp., *Dipylidium caninum*, *Multiceps* spp., *Hymenolepis* spp., *Mesocostoides* spp., *Vampirolepis* spp., *Moniezia* spp., *Anoplocephala* spp., *Sirometra* spp., *Anoplocephala* spp., y *Hymenolepis* spp..

Como se usa en la presente, el término "animal" incluye animales de sangre caliente (incluyendo humanos) y peces. Se prefieren los mamíferos, tal como ganado, ovejas, cerdos, camellos, ciervos, caballos, cerdos, aves de corral, conejos, cabras, perros y gatos, búfalos de agua, burros, ciervos en barbecho y renos, y también en animales con pieles tal como visones, chinchillas y mapaches, aves tal como gallinas, gansos, pavos y patos y peces tal como peces de agua dulce y salada tal como truchas, carpas y anguilas. Particularmente preferidos son los animales domésticos, tal como perros o gatos.

- En general, "cantidad parasiticidamente efectiva" significa la cantidad de ingrediente activo necesaria para lograr un efecto observable sobre el crecimiento, incluidos los efectos de necrosis, muerte, retraso, prevención y remoción, destrucción o disminución de la aparición y actividad del organismo diana. La cantidad parasiticidamente efectiva puede variar para los diversos compuestos/composiciones utilizados en la invención. Una cantidad parasiticidamente efectiva de las composiciones también variará de acuerdo con las condiciones prevaecientes tal como el efecto y la duración parasitica deseada, la especie diana, el modo de aplicación y similares.
- En general, es favorable aplicar los compuestos de la presente invención en cantidades totales de 0,5 mg/kg a 100 mg/kg por día, preferentemente 1 mg/kg a 50 mg/kg por día.
- Para la administración oral a animales de sangre caliente, los compuestos de la fórmula I se pueden formular como alimentos para animales, premezclas de alimento animal, concentrados de alimento para animales, píldoras, soluciones, pastas, suspensiones, solución oral, geles, tabletas, bolos y cápsulas. Además, los compuestos de la fórmula I se pueden administrar a los animales en su agua potable. Para la administración oral, la forma de dosificación elegida debe proporcionar al animal 0,01 mg/kg a 100 mg/kg de peso corporal animal por día del compuesto de la fórmula I, preferentemente con 0,5 mg/kg a 100 mg/kg de peso corporal animal por día. De manera alternativa, los compuestos de la fórmula I se pueden administrar a animales por vía parenteral, por ejemplo, por inyección intraruminal, intramuscular, intravenosa o subcutánea. Los compuestos de la fórmula I se pueden dispersar o disolver en un portador fisiológicamente aceptable para inyección subcutánea. De manera alternativa, los compuestos de la fórmula I se pueden formular en un implante para administración subcutánea. Además, el compuesto de la fórmula I se puede administrar transdérmicamente a animales. Para la administración parenteral, la forma de dosificación elegida debe proporcionar al animal 0,01 mg/kg a 100 mg/kg de peso corporal animal por día del compuesto de la fórmula I.
- Los compuestos de la fórmula I también se pueden aplicar tópicamente a los animales en forma de inmersiones, polvos, polvos, collares, medallones, aerosoles, champús, unción puntual y vertido en formulaciones y en ungüentos o emulsiones de aceite en agua o agua en aceite. Para la aplicación tópica, las inmersiones y los aerosoles en general contienen 0,5 ppm a 5000 ppm y preferentemente 1 ppm a 3000 ppm del compuesto de la fórmula I. Además, los compuestos de la fórmula I se pueden formular como marcas auriculares para animales, particularmente cuadrúpedos tal como ganado vacuno y ovino.
- Las preparaciones adecuadas son:
- Soluciones tal como soluciones orales, concentrados para administración oral después de la dilución, soluciones para uso en la piel o en cavidades corporales, formulaciones de vertido, geles;
 - Emulsiones y suspensiones para administración oral o dérmica; preparaciones semisólidas;
 - Formulaciones en las cuales el compuesto activo se procesa en una base de pomada o en una base de emulsión de aceite en agua o agua en aceite;
 - Preparaciones sólidas tal como polvos, premezclas o concentrados, gránulos, píldoras, tabletas, bolos, cápsulas; aerosoles e inhalantes y artículos con forma de compuesto activo.
- Las composiciones adecuadas para la inyección se preparan al disolver el ingrediente activo en un solvente adecuado y al adicionar opcionalmente otros auxiliares tal como ácidos, bases, sales amortiguadoras, conservantes y solubilizantes. Los auxiliares adecuados para soluciones de inyección se conocen en la técnica. Las soluciones se filtran y llenan estériles.
- Las soluciones orales se administran directamente. Los concentrados se administran por vía oral después de la dilución previa a la concentración de uso. Las soluciones y concentrados orales se preparan de acuerdo con el estado de la técnica y como se describió anteriormente para soluciones de inyección, no siendo necesarios procedimientos estériles. Las soluciones para uso en la piel se gotean, se extienden, se frotan, se espolvorean o se pulverizan. Las soluciones para su uso en la piel se preparan de acuerdo con el estado de la técnica y de acuerdo con lo descrito anteriormente para soluciones inyectables, no siendo necesarios procedimientos estériles.
- Los geles se aplican o se extienden sobre la piel o se introducen en las cavidades corporales. Los geles se preparan tratando soluciones que se han preparado como se describe en el caso de las soluciones de inyección con suficiente espesante como para que un material transparente que tiene una consistencia similar a la pomada resulte. Los espesantes adecuados se conocen en la técnica.
- Las formulaciones de vertido se vierten o pulverizan sobre áreas limitadas de la piel, el compuesto activo penetra en la piel y actúa sistemáticamente. Las formulaciones de vertido se preparan al disolver, suspender o emulsionar el compuesto activo en mezclas o solventes compatibles con la piel, adecuados. Si es apropiado, se adicionan otros auxiliares como colorantes, sustancias promotoras de la bioabsorción, antioxidantes, estabilizadores de la luz, adhesivos. Se conocen en la técnica tales auxiliares adecuados.
- Las emulsiones se pueden administrar de manera oral, dérmica o como inyecciones. Las emulsiones son del tipo agua en aceite o del tipo aceite en agua. Se preparan disolviendo el compuesto activo ya sea en la fase hidrofóbica o en la fase

hidrofílica y homogeneizándolo con el solvente de la otra fase con la ayuda de emulsionantes adecuados y, si procede, otros auxiliares tal como colorantes, sustancias promotoras de la absorción, conservadores, antioxidantes, estabilizadores de la luz, sustancias potenciadoras de la viscosidad. Las fases hidrofóbicas adecuadas (aceites), fases hidrofílicas adecuadas, emulsionantes adecuados y auxiliares adicionales adecuados para emulsiones se conocen en la técnica.

Se pueden administrar suspensiones de manera oral o tópica/dérmica. Se preparan suspendiendo el compuesto activo en un agente de suspensión, si procede con la adición de otros auxiliares tal como agentes humectantes, colorantes, sustancias promotoras de la bioabsorción, conservantes, antioxidantes, estabilizadores de la luz. Se conocen en la técnica agentes de suspensión, adecuados y otros auxiliares adecuados para suspensiones que incluyen agentes humectantes.

Se pueden administrar preparaciones semisólidas de manera oral o tópica/dérmica. Se diferencian de las suspensiones y emulsiones descritas anteriormente solo por su mayor viscosidad.

Para la producción de preparaciones sólidas, el compuesto activo se mezcla con excipientes adecuados, si es apropiado con adición de auxiliares, y se lleva a la forma deseada. Los auxiliares adecuados para este fin se conocen en la técnica.

Las composiciones que se pueden usar en la invención pueden comprender en general de aproximadamente 0,001 a 95% del compuesto de la presente invención.

Las preparaciones listas para el uso contienen los compuestos que actúan contra parásitos, preferentemente ectoparásitos, en concentraciones de 10 ppm a 80 por ciento en peso, preferentemente de 0,1 a 65 por ciento en peso, más preferentemente de 1 a 50 por ciento en peso, más preferentemente de 5 a 40 por ciento en peso.

Las preparaciones que se diluyen antes de su uso contienen los compuestos que actúan contra ectoparásitos en concentraciones de 0,5 a 90 por ciento en peso, preferentemente de 1 a 50 por ciento en peso.

Además, las preparaciones comprenden los compuestos de la fórmula I contra endoparásitos en concentraciones de 10 ppm a 2 por ciento en peso, preferentemente de 0,05 a 0,9 por ciento en peso, muy particularmente preferentemente de 0,005 a 0,25 por ciento en peso.

La aplicación tópica puede llevarse a cabo con artículos con forma de compuesto tal como collares, medallones, marcas auriculares, bandas para fijar en partes del cuerpo y tiras y láminas adhesivas.

En general es favorable aplicar formulaciones sólidas que liberen compuestos de la presente invención en cantidades totales de 10 mg/kg a 300 mg/kg, preferentemente 20 mg/kg a 200 mg/kg, más preferentemente 25 mg/kg a 160 mg/kg de peso corporal del animal tratado en el transcurso de tres semanas.

Ejemplos:

La presente invención ahora se ilustra en más detalles por los siguientes ejemplos, sin imponer ninguna limitación a los mismos.

Con la modificación adecuada de los materiales de inicio, los procedimientos como se describe en los ejemplos posteriormente se utilizaron para obtener compuestos adicionales de la fórmula I. Los compuestos obtenidos de esta manera se listan en las Tablas posteriormente, junto con los datos físicos.

Método LC/MS:

Máquina: Shimadzu Nexera UHPLC + Shimadzu LCMS 20-20, ESI
Columna: Phenomenex Kinetex 1,7µm XB-C18100A, 50 x 2,1mm"

Método:

Fase Móvil: A: agua + 0,1% de TFA; B:ACN
Temperatura: 60°C
Gradiente:5% B a 100% B en 1,50min; 100% B 0,25min
Flujo: 0,8ml/min a 1,0ml/min en 1,51 min
MS método: ESI positiva
Intervalo de masa (m/z): 100-700

Ejemplo 1: síntesis de 2-[3-etilsulfonil-6-[3-(trifluorometil)-1,2,4-triazol-1-il]-2-piridil]-6-metil-7-(trifluorometil)imidazo[1,2-c]pirimidin-5-ona (I-1-1):

a) 2-bromo-1-(5-bromo-3-etilsulfonil-2-piridil)etenona se sintetizó siguiendo los procedimientos publicados: WO2016/71214.

b) 1-(6-cloro-3-etilsulfonil-2-piridil)etenona:

Paso 1: A una solución de ácido 3,6-dicloropicolínico (120 g, 0,628 mol) en tolueno (2L), a temperatura ambiente, se adicionó cloruro de tionilo (68,38 mL, 0,942 mol) y DMF (9,0 mL). La reacción entonces se calentó a 110°C y se agitó durante 2 h. La mezcla de reacción entonces se concentró in vacuo, para proporcionar un residuo. El residuo se disolvió en tolueno (2L) y entonces se adicionó etano tiol (40,8 g, 0,659 mol) en forma de gotas durante 15 min, la reacción se agitó durante 1 h a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se concentró entonces bajo presión reducida para proporcionar un residuo. El residuo se purificó por cromatografía en columna eluyendo con EtOAc-Éter de petróleo al 10% para proporcionar 3,6-dicloropiridina-2-carbotioato de S-etilo como un sólido amarillo (120g, 81% de rendimiento). RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃): δ 7,77 (d, 1H, J = 8,4 Hz), 7,44 (d, 1H, J = 8,4 Hz), 3,03 (q, 2H, J = 7,2 Hz), 1,36 (t, 3H, J = 7,2 Hz).

Paso 2: A una solución de hidróxido de sodio (37,45 g, 0,936 mol) en agua (200 mL) se adicionó etanotiol (67,64 mL, 0,936 mol) en forma de gotas durante 15 min, la reacción entonces se agitó a la misma temperatura durante 30 min. Entonces se adicionó bromuro de tetrabutilamonio (45,27 g, 0,14 mol) y la reacción se agitó durante 30 min. Entonces se adicionó una solución de 3,6-dicloropiridin-2-carbotioato de S-etilo (110 g, 0,468 mol) en tolueno (300 mL) a la mezcla de reacción ne forma de gotas a temperatura ambiente y la reacción se agitó durante 5 h adicionales a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se vertió entonces en agua (500 mL) y se extrajo con acetato de etilo (3x600 mL). Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre Na₂SO₄ anhidro y se concentraron bajo presión reducida para proporcionar un residuo. El residuo crudo se purificó por cromatografía en columna eluyendo con EtOAc-Éter de petróleo al 15% para proporcionar 6-cloro-3-etilsulfanil-piridin-2-carbotioato de S-etilo como un sólido blancuzco (98g, 80% de rendimiento). RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃): δ 7,63 (d, 1H, J = 8,4 Hz), 7,40 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 3,02 (q, 2H, J = 7,2 Hz), 2,96 (q, 2H, J = 7,6 Hz), 1,40 (t, 3H, J = 7,2 Hz), 1,36 (t, 3H, J = 7,2 Hz).

Paso 3: A una solución de 6-cloro-3-etilsulfanil-piridin-2-carbotioato de S-etilo (70 g, 0,268 mol) en etanol (300 mL) se adicionó una solución de hidróxido de litio (17,28 g, 0,402 mol) entonces la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 5 h. La mezcla de reacción entonces se concentró bajo presión reducida para proporcionar un residuo. El residuo se disolvió en agua fría, se acidificó con HCl 2N sobre el cual el ácido 6-cloro-3-etilsulfanil-piridin-2-carboxílico se precipitó como un sólido blancuzco. El ácido 6-cloro-3-etilsulfanil-piridin-2-carboxílico se recolectó, secó y usó sin purificación adicional (55g, 94% de rendimiento). RMN ¹H (400 MHz, DMSO-d₆): δ 13,63 (s, 1H), 7,94 (d, 1H, J = 8,4 Hz), 7,63 (d, 1H, J = 8,4 Hz), 2,99 (q, 2H, J = 7,2 Hz), 1,24 (t, 3H, J = 7,2 Hz).

Paso 4: A una solución de ácido 6-cloro-3-etilsulfanil-piridin-2-carboxílico (55 g, 0,253 mol) en tolueno (600 mL) a temperatura ambiente, se adicionó cloruro de tionilo (27 mL, 0,380 mol) y DMF (1,5 mL) y entonces la mezcla de reacción se calentó a 110°C y se agitó durante 2 h. La mezcla de reacción entonces se enfrió a temperatura ambiente y se concentró bajo presión reducida para obtener un residuo. El residuo se absorbió en DCM (1L) y se adicionó a una solución de clorhidrato de N,O-dimetilhidroxilamina (47,32 g, 0,484 mol) y DIPEA (127,11 mL, 0,727 mol) en DCM (1L) en forma de gotas 0°C durante 2 h. La mezcla de reacción entonces se dejó calentar a temperatura ambiente y se agitó durante 4 h. La mezcla de reacción entonces se vertió en agua (600 mL) y extrajo con DCM (2x600 mL). Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre Na₂SO₄ anhidro y se concentraron bajo presión reducida para proporcionar un residuo. El residuo crudo se purificó por cromatografía en columna eluyendo con EtOAc-Éter de petróleo al 20% para proporcionar 6-cloro-3-etilsulfanil-N-metoxi-N-metil-piridin-2-carboxamida como una goma marrón (54g, 85% de rendimiento). RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃): δ 7,71 (d, 1H, J = 8,4 Hz), 7,31 (d, 1H, J = 8,4 Hz), 3,60 (s, 3H), 3,37 (s, 3H), 2,92 (t, 2H, J = 7,2 Hz), 1,26 (t, 3H, J = 7,2 Hz).

Paso 5: A una solución de 6-cloro-3-etilsulfanil-N-metoxi-N-metil-piridin-2-carboxamida (54 g, 0,207 mol) en THF seco (500 mL) a 0°C se adicionó CH₃ MgBr (207,69 mL, 0,623 mol, 3M en éter dietílico) en forma de gotas, entonces la mezcla de reacción se dejó calentar a temperatura ambiente y se agitó durante 4 h. La reacción se inactivó entonces mediante la adición de una solución acuosa saturada de NH₄Cl (500 mL) y extrajo con EtOAc (2x700 mL). Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre Na₂SO₄ anhidro y se concentraron bajo presión reducida para proporcionar un residuo. El residuo crudo se purificó por cromatografía en columna eluyendo con EtOAc-Éter de petróleo al 15% para proporcionar 1-(6-cloro-3-etilsulfanil-2-piridil) etenona como un sólido blancuzco (38g, 85% de rendimiento). RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃): δ 7,64 (d, 1H, J = 8,8 Hz), 7,39 (d, 1H, J = 8,4 Hz), 2,91 (q, 2H, J = 7,6 Hz), 2,69 (s, 3H), 1,39 (t, 3H, J = 7,6 Hz).

Paso 6: A una solución de 1-(6-cloro-3-etilsulfanil-2-piridil)etanona (38 g, 0,176 mol) en CH₂Cl₂ (500 mL) a 0°C se adicionó m-CPBA (76,25 g, 0,441 mol) en forma de porción, la mezcla de reacción entonces se dejó calentar a temperatura ambiente y se agitó durante 16 h. La mezcla de reacción entonces se vertió en agua (1,0 L) y se extrajo con CH₂Cl₂ (2x1 L). Las capas orgánicas combinadas se lavaron con una solución de NaOH 1M (2x500 mL) y agua (2x500 mL), se secaron sobre Na₂SO₄ anhidro y se concentraron bajo presión reducida para proporcionar un residuo. El residuo crudo se purificó mediante cromatografía en columna eluyendo con EtOAc-Éter de petróleo al 20% para proporcionar 1-(6-cloro-3-etilsulfonil-2-piridil)etanona como un sólido blanco (33g, 75% de rendimiento). RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃): δ 8,29 (d, 1H, J = 8,4 Hz), 7,60 (d, 1H, J = 8,0 Hz), 3,54 (q, 2H, J = 7,6 Hz), 2,70 (s, 3H), 1,35 (t, 3H, J = 7,2 Hz).

c) 2-bromo-1-(5-bromo-3-etilsulfonil-2-piridil)etanona

A una solución de 1-(6-cloro-3-etilsulfonil-2-piridil)etanona (10,00g, 40,4 mmol) en ácido acético (140 mL) a temperatura ambiente, se adicionó secuencialmente HBr (33% en ácido acético) (8,60g, 49,1 mmol) y bromo (6,55g, 50,0 mmol). La reacción entonces se agitó a temperatura ambiente durante la noche y entonces se vertió en 500 mL de agua helada en agitación, sobre la cual se precipitó un sólido blanco. El sólido se recolectó y se secó en un horno de vacío a 50 C durante 18 horas para proporcionar el producto deseado (2-bromo-1-(5-bromo-3-etilsulfonil-2-piridil) etenona) contaminado con 30% del producto que contiene cloruro (2-bromo-1-(6-cloro-3-etilsulfonil-2-piridil)etanona). Esta mezcla se usó en el siguiente paso sin purificación adicional.

LC-MS 2-bromo-1-(5-bromo-3-etilsulfonil-2-piridil)etanona: masa calculada para C₉H₁₀NO₃SB₂ [M+H]⁺ 372,0, encontrado

371,7; t_R = 1,027 min (t_R : tiempo de retención).

LC-MS 2-bromo-1-(6-cloro-3-etilsulfonyl-2-piridil) etenona: masa calculada para $C_9H_{10}NO_3SBrCl$ $[M+H]^+$ 325,9, encontrado 325,8; t_R = 1,007 min (t_R : tiempo de retención).

d) 2-(6-bromo-3-etilsulfonyl-2-piridil)-6-metil-7-(trifluorometil)imidazo[1,2-c]pirimidin-5-ona:

Una solución de 3,0 g de la mezcla 7:3 de 2-bromo-1-(5-bromo-3-etilsulfonyl-2-piridil)etenona y 2-bromo-1-(6-cloro-3-etilsulfonyl-2-piridil)etenona generada anteriormente y 4-amino-1-metil-6-(trifluorometil)pirimidin-2-ona (1,55, 8,02 mmol) se disolvió en 70 ml de 1,4-Dioxan y se calentó a 110°C durante 72 hrs. La reacción entonces se enfrió a temperatura ambiente y se concentró in vacuo para proporcionar un residuo. El residuo se purificó por cromatografía en gel de sílice (25% n-heptano/ CH_2Cl_2) para proporcionar 1,55g de una mezcla 7:3 de 2-(6-bromo-3-etilsulfonyl-2-piridil)-6-metil-7-(trifluorometil)imidazo[1,2-c]pirimidin-5-ona y 2-(6-cloro-3-etilsulfonyl-2-piridil)-6-metil-7-(trifluorometil)imidazo[1,2-c]pirimidin-5-ona como un sólido blancuzco.

LC-MS 2-(6-bromo-3-etilsulfonyl-2-piridil)-6-metil-7-(trifluorometil)imidazo[1,2-c]pirimidin-5-ona: masa calculada para $C_{15}H_{13}N_4O_3F_3SBr$ $[M+H]^+$ 466,2, encontrado 466,9; t_R = 1,109 min (t_R : tiempo de retención).

LC-MS 2-(6-cloro-3-etilsulfonyl-2-piridil)-6-metil-7-(trifluorometil)imidazo[1,2-c]pirimidin-5-ona: masa calculada para $C_{15}H_{13}N_4O_3F_3$ SCI $[M+H]^+$ 421,0, encontrado 420,9; t_R = 1,089 min (t_R : tiempo de retención).

e) 2-[3-etilsulfonyl-6-[3-(trifluorometil)-1,2,4-triazol-1-il]-2-piridil]-6-metil-7-(trifluorometil)imidazo[1,2-c]pirimidin-5-ona (I-1-1):

A una solución de 3-(trifluorometil)-1H-1,2,4-triazol (0,162g, 1,18 mmol) en NMP (3 mL) a temperatura ambiente, se adicionó NaH (0,072g, 1,18 mmol, 60% de suspensión en aceite mineral usado) en una porción. La reacción se agitó a temperatura ambiente durante 30 min y entonces la mezcla 7:3 de 2-(6-bromo-3-etilsulfonyl-2-piridil)-6-metil-7-(trifluorometil)imidazo[1,2-c]pirimidin-5-ona y 2-(6-cloro-3-etilsulfonyl-2-piridil)-6-metil-7-(trifluorometil)imidazo[1,2-c]pirimidin-5-ona (0,220g, 0,473 mmol) generada anteriormente, se adicionó en una porción. La reacción entonces se dejó agitar a temperatura ambiente durante la noche. La reacción entonces se vertió en agua (50 mL) y extrajo hasta EtOAc (3x50 mL). Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre Na_2SO_4 anhidro y se concentraron bajo presión reducida para proporcionar un residuo. El residuo crudo se purificó por cromatografía en columna eluyendo con 0 → 50% de EtOAc-ciclohexano para proporcionar 2-[3-etilsulfonyl-6-[3-(trifluorometil)-1,2,4-triazol-1-il]-2-piridil]-6-metil-7-(trifluorometil)imidazo[1,2-c]pirimidin-5-ona como un sólido marrón (0,140g, 54% de rendimiento).

LC-MS: masa calculada para $C_{18}H_{14}N_7O_3F_6S$ $[M+H]^+$ 522,4, encontrado 522,0; t_R = 1,270 min (t_R : tiempo de retención).

Ejemplo 2: 2-[3-etilsulfonyl-5-(2-oxopirrolidin-1-il)-2-piridil]-6-metil-7-(trifluorometil)imidazo[1,2-c]pirimidin-5-ona (I-1-3):

a) 4-amino-1-metil-6-(trifluorometil)pirimidin-2-ona

Paso 1: A una solución de trifosgeno (29,6 g) en CH_2Cl_2 (200 mL) se adicionó una solución de p-metoxibencilamina (13,7 g) en CH_2Cl_2 (200 mL), seguido de la adición gota a gota de Et_3N (30 mL) en CH_2Cl_2 (100 mL). La mezcla resultante se agitó a 25 °C durante 14 h. Se adicionó agua (500 mL) y la mezcla de reacción se extrajo con CH_2Cl_2 (3 × 200 mL). Las capas orgánicas se combinaron, se lavaron con NH_4Cl sat. (600 mL), salmuera (600 mL), secado sobre Na_2SO_4 , filtrado y concentrado para proporcionar 1-(isocianatometil)-4-metoxibenceno (17 g, crudo) como aceite amarillo. RMN ^1H ($CDCl_3$, 400 MHz) δ 7,26 (d, J=8,8 Hz, 2H), 6,95 (d, J=8,4 Hz, 2H), 4,45 (s, 2H), 3,85 (s, 3H).

Paso 2: A una solución de (Z) -3-amino-4,4,4-trifluoro-but-2-enoato de etilo (19 g) en DMF (500 mL) se adicionó NaH (6 g) en porciones a 0°C. Entonces, la mezcla de reacción se agitó a 0 °C durante 1 h. Entonces se adicionó la mezcla a 1-(isocianatometil)-4-metoxibenceno (17 g) a 0 °C. La mezcla resultante se agitó a 0°C a 25°C durante 14 h. El solvente se removió bajo presión reducida y se adicionó agua (1 L), y la capa orgánica se separó. La capa acuosa se extrajo con EtOAc (3 × 500 mL). Las capas orgánicas se combinaron, se lavaron con salmuera (500 mL), se secaron sobre Na_2SO_4 , se filtraron y se concentraron para proporcionar 3-[(4-metoxifenil)metil]-6-(trifluorometil)-1H-pirimidina-2,4-diona cruda (15 g) como aceite amarillo. RMN ^1H (MeOD, 400 MHz) δ 7,27 (d, J=8,8 Hz, 2H), 6,77 (d, J=8,4 Hz, 2H), 5,80 (s, 1H), 5,02 (s, 2H) 3,70 (s, 3H).

Paso 3: A una solución de 3-[(4-metoxifenil)metil]-6-(trifluorometil)-1H-pirimidin-2,4-diona (35 g) y K_2CO_3 (16 g) en DMF (300 mL) se adicionó MeI (16,5 g, 7,24 mL, 116,2 mmol) a 25°C. La mezcla resultante entonces se agitó a 25°C durante 12 h. El solvente se removió bajo presión reducida. Se adicionó agua (300 mL) y la capa orgánica se separó. La capa acuosa se extrajo con EtOAc (3 × 300 mL). Las capas orgánicas se combinaron, se lavaron con salmuera (500 mL), se secaron sobre Na_2SO_4 , se filtraron y se concentraron para proporcionar 3-[(4-metoxifenil)metil]-1-metil-6-(trifluorometil)pirimidin-2,4-diona cruda (30 g) como un sólido amarillo. RMN ^1H (MeOD, 400 MHz) δ 7,35 (d, J=8,8 Hz, 2H), 6,83 (d, J=8,8 Hz, 2H), 6,28 (s, 1H), 5,02 (s, 2H), 3,75 (s, 3H), 3,46 (s, 3H).

Paso 4: A una solución de 3-[(4-metoxifenil)metil]-1-metil-6-(trifluorometil)pirimidin-2,4-diona (30 g) en CH_3CN (200 mL) y agua (50 mL) se adicionó nitrato de amonio cérico (78,5 g) a 25°C. Entonces la mezcla de reacción se agitó a 25°C durante 14 h y entonces se adicionó una porción adicional (50 g) de nitrato de amonio cérico. La mezcla resultante se agitó a 25 °C durante 14 h. Se adicionó agua (200 mL) y la capa orgánica se separó. La capa acuosa se extrajo con EtOAc (3 × 100 mL). Las capas orgánicas se combinaron, se lavaron con $NaHCO_3$ ac. (500 mL), se secó sobre Na_2SO_4 , se filtró y concentró. El residuo se purificó por cromatografía en gel de sílice (PE:EtOAc = gradiente 10:1 a 1:1) para proporcionar

1-metil-6-(trifluorometil) pirimidin-2,4-diona (8 g) como un sólido amarillo. RMN ¹H (MeOD, 400 MHz) δ 6,20 (s, 1H), 3,44 (s, 3H).

Paso 5: A una solución de 1-metil-6-(trifluorometil)pirimidina-2,4-diona (8 g) en DCM (150 mL) y piridina (30 mL) se adicionó gota a gota Tf₂O (36,7 g) a 0°C. La mezcla se agitó entonces a 0°C a 25°C durante 3 h. Se pasó amoníaco gaseoso a través de MeOH (50 mL) a -70°C durante 20 minutos y la solución de amoníaco metanol resultante se vertió en la mezcla de reacción. La mezcla resultante se agitó a 25 °C durante 12 h. El solvente se removió bajo presión reducida. El residuo se purificó mediante HPLC preparativa para proporcionar 4-amino-1-metil-6-(trifluorometil)pirimidin-2-ona (3,4 g) como un sólido amarillo. RMN ¹H (DMSO-d₆, 400 MHz) δ 7,62 (s, 1H), 7,52 (s, 1H), 6,24 (s, 1H), 3,30 (s, 3H).

b) 2-(5-bromo-3-etilsulfonil-2-piridil)-6-metil-7-(trifluorometil)imidazo[1,2-c]pirimidin-5-ona:

Se agitó una solución de 4-amino-1-metil-6-(trifluorometil)pirimidin-2-ona (0,900 g, 4,72 mmol) y 2-bromo-1-(5-bromo-3-etilsulfonil-2-piridil)etenona (1,60 g, 2,30 mmol) en 1,4-dioxano (40 mL) a 140°C en un microondas durante 2,5 hrs. La reacción entonces se enfrió a temperatura ambiente, se diluyó con EtOAc (200 mL) y se lavó con NaHCO₃ acuoso saturado (100 mL), se secó sobre Na₂SO₄, se filtró y se concentró in vacuo para proporcionar un residuo. El residuo se purificó por cromatografía en columna sobre gel de sílice (10 → 80% EtOAc/ciclohexano) para proporcionar 2-(5-bromo-3-etilsulfonil-2-piridil)-6-metil-7-(trifluorometil)imidazo[1,2-c]pirimidin-5-ona como un sólido blanco (0,700 g, 35% de rendimiento).

LC-MS: masa calculada para C₁₅H₁₂N₄O₃F₃SBr [M+H]⁺ 364,9, encontrado 364,9; t_R= 1,128 min (t_R: tiempo de retención).

c) 2-[3-etilsulfonil-5-(2-oxopirrolidin-1-il)-2-piridil]-6-metil-7-(trifluorometil)imidazo[1,2-c]pirimidin-5-ona (I-1-3):

A una solución del compuesto 2-(5-bromo-3-etilsulfonil-2-piridil)-6-metil-7-(trifluorometil)imidazo[1,2-c]pirimidin-5-ona (0,150 g, 0,322 mmol), en DMA (1 mL) se adicionó secuencialmente pirrolidin-2-ona (0,082 g, 0,967 mmol), tris(dibencilideno acetona)dipaladio(0) (Pd₂ dba₃) (0,026 g, 0,032 mmol), xantfos (0,056 g, 0,097 mmol) y Cs₂CO₃ (0,210 g, 0,645 mmol). La solución entonces se agitó a temperatura ambiente durante 10 minutos, y además se hizo reaccionar a 150 °C durante 15 minutos en un reactor de microondas (irradiación de 50 W). La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente, se filtró a través de una almohadilla de celite y se concentró in vacuo para proporcionar un residuo. El residuo se purificó por cromatografía en columna en gel de sílice (1 → 20% MeOH/CH₂Cl₂) para proporcionar 2-[3-etilsulfonil-5-(2-oxopirrolidin-1-il)-2-piridil]-6-metil-7-(trifluorometil)imidazo[1,2-c]pirimidin-5-ona como un sólido amarillo pálido (0,070g, 46% de rendimiento).

LC-MS: masa calculada para C₁₉H₁₈N₅O₄F₃S [M+H]⁺ 470,1, encontrado 470,0; t_R= 0,986 min (t_R: tiempo de retención).

Mediante procedimientos análogos al procedimiento descrito anteriormente, se prepararon los siguientes ejemplos de la fórmula I-1 e I-2.

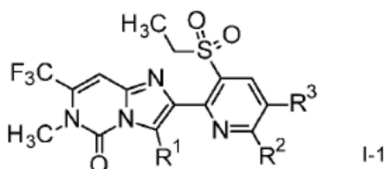
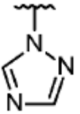
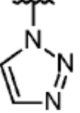
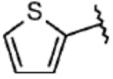
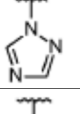
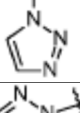
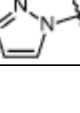
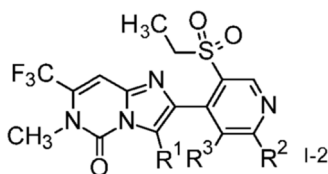


Tabla I-1:

No.	R ¹	R ²	R ³	TR (min)	m/z (M+H)
I-1-1	H		H	1,27	522,0
I-1-2	H		H	1,038	455,1
I-1-3	H	H		0,986	470,0
I-1-4	H	H		1,125	482,0

No.	R ¹	R ²	R ³	TR (min)	m/z (M+H)
I-1-5	H		H	1,033	453,9
I-1-6	H		H	1,048	454,0
I-1-7	H	H		1,198	468,9
I-1-8	CH ₃		H	1,068	467,9
I-1-9	CH ₃		H	1,085	468,0
I-1-10	H		H	1,14	453,0
I-1-11	H	H		1,16	470,1



5

Tabla I-2:

No.	R ¹	R ²	R ³	TR (min)	m/z (M+H)
I-2-1	H		H	1,032	453,9

La actividad biológica de los compuestos de la fórmula (I) de la presente invención se puede evaluar en pruebas biológicas como se describe posteriormente.

10

Si no se especifica lo contrario, la mayoría de las soluciones de prueba se preparan de la siguiente manera:

El compuesto activo se disuelve a la concentración deseada en una mezcla de 1:1 (vol:vol) de agua destilada: acetona. La solución de prueba se prepara el día de uso.

15

Gorgojo del algodón (*Anthonomus grandis*)

Para evaluar el control del gorgojo de algodón (*Anthonomus grandis*), la unidad de prueba consistió en placas de microtitulación de 96 pocillos que contienen una dieta de insectos y 5-10 huevos de *A. grandis*.

20

Los compuestos se formularon usando una solución que contiene 75% v/v de agua y 25% v/v de DMSO. Se rociaron diferentes concentraciones de compuestos formulados en la dieta de insectos a 5 µl, usando un micro atomizador personalizado, en dos repeticiones.

25

Después de la aplicación, las placas de microtitulación se incubaron a aproximadamente 25 + 1°C y aproximadamente 75 + 5% de humedad relativa durante 5 días. La mortalidad de óvulos y larvas se evaluó visualmente.

En esta prueba, los compuestos I-1-1, I-2-1, I-1-2, I-1-3, I-1-4, I-1-5, I-1-6, I-1-7, I-1-9 e I-1-10 a 2500 ppm mostraron más

del 75% de mortalidad en comparación con los controles no tratados.

Gusano de la yema del tabaco (*Heliothis virescens*)

5 Para evaluar el control del gusano de la yema del tabaco (*Heliothis virescens*), la unidad de prueba consistió en placas de microtitulación de 96 pocillos que contienen una dieta para insectos y 15-25 huevos de *H. virescens*.

10 Los compuestos se formularon usando una solución que contiene 75% v/v de agua y 25% v/v de DMSO. Se rociaron diferentes concentraciones de compuestos formulados en la dieta de insectos a 10 µl, usando un micro atomizador personalizado, en dos repeticiones.

Después de la aplicación, las placas de microtitulación se incubaron a aproximadamente 28 + 1°C y aproximadamente 80 + 5% de humedad relativa durante 5 días. La mortalidad de óvulos y larvas se evaluó visualmente.

15 En esta prueba, los compuestos I-1-1, I-2-1, I-1-2, I-1-3, I-1-4, I-1-5, I-1-6, I-1-7, I-1-9 e I-1-10 a 2500 ppm mostraron más del 75% de mortalidad en comparación con los controles no tratados.

Arveja pulgón (*Megoura viciae*)

20 Para evaluar el control del arveja pulgón (*Megoura viciae*) por contacto o por medios sistémicos, la unidad de ensayo consistió en placas microtituladoras de 24 pocillos que contienen discos anchos de hoja de frijol.

25 Los compuestos se formularon usando una solución que contiene 75% v/v de agua y 25% v/v de DMSO. Se pulverizaron diferentes concentraciones de compuestos formulados sobre los discos de hoja a 2,5 µl, usando un micro atomizador personalizado, en dos repeticiones.

30 Después de la aplicación, los discos de hoja se secaron al aire y se colocaron 5-8 áfidos adultos en los discos de hoja dentro de los pocillos de la placa de microtitulación. Entonces se dejó que los áfidos succionaran en los discos de hoja tratados y se incubaron a aproximadamente 23 + 1°C y aproximadamente 50 + 5% de humedad relativa durante 5 días. La mortalidad y la fecundidad de los áfidos se evaluaron visualmente.

En esta prueba, los compuestos I-1-2, I-1-3, I-1-4, I-1-6, I-1-9 e I-1-10 a 2500 ppm mostraron más del 75% de mortalidad en comparación con los controles no tratados.

35 Pulgón del caupí (*Aphis craccivora*)

El compuesto activo se disuelve a la concentración deseada en una mezcla de 1:1 (vol:vol) de agua destilada: acetona. Se adiciona agente tensioactivo (Kinetic® HV) a una velocidad de 0,01% (vol/vol). La solución de prueba se prepara el día de uso.

40 Las plantas de caupí en maceta se colonizaron con aproximadamente 30 - 50 áfidos de varias etapas mediante la transferencia manual de un tejido foliar cortado de la planta infestada 24 horas antes de la aplicación. Las plantas se pulverizaron con las soluciones de prueba usando un atomizador manual DeVilbiss® a 20-30 lb/pulg² (≈ 1,38 a 2,07 bar (137,9 kPa-206,8 kPa)) después de que se haya verificado la población de plagas. Las plantas tratadas se mantienen en carros ligeros a aproximadamente 25- 26°C. El porcentaje de mortalidad se valoró después de 72 horas.

En esta prueba, los compuestos I-1-2, I-1-3, I-1-4, I-1-6, I-1-7, I-1-8 y I-1-9 a 300 ppm mostraron una mortalidad superior al 75% en comparación con los controles no tratados.

50 Saltamontes verde del arroz (*Nephotettix virescens*)

55 Las plántulas de arroz de cuatro a cinco semanas de edad con parte superior cortada de la hoja se limpiaron y lavaron 24 horas antes de la pulverización. Los compuestos activos se formularon en acetona: agua 1: 1 (vol:vol) y se adicionó agente tensioactivo al 0,01% vol/vol (Kinetic® HV). Las plántulas de arroz en macetas se rociaron con 5-6 ml de solución de prueba, se secaron al aire, se cubrieron con jaulas Mylar y se inocularon con 10 adultos. Las plantas de arroz tratadas se mantuvieron a aproximadamente 28-29 °C y una humedad relativa de aproximadamente 50-60%. El porcentaje de mortalidad se registró después de 72 horas.

60 En esta prueba, el compuesto I-1-3 y I-1-8 a 300 ppm mostraron más del 75% de mortalidad en comparación con los controles no tratados.

Saltamontes marrón del arroz (*Nilaparvata lugens*)

65 Las plántulas de arroz de cuatro a cinco semanas de edad se limpiaron y lavaron 24 horas antes de la pulverización. Los compuestos activos se formularon en acetona: agua 1: 1 (vol:vol) y se adicionó agente tensioactivo al 0,01% vol/vol (Kinetic® HV). Las plántulas de arroz en macetas se rociaron con 5-6 ml de solución de prueba, se secaron al aire, se

cubrieron con jaulas Mylar y se inocularon con 10 adultos. Las plantas de arroz tratadas se mantuvieron a aproximadamente 28-29 °C y una humedad relativa de aproximadamente 50-60%. El porcentaje de mortalidad se registró después de 72 horas.

- 5 En esta prueba, el compuesto I-1-3 a 300 ppm mostró más del 75% de mortalidad en comparación con los controles no tratados.

Polilla de diamante (*Plutella xylostella*)

- 10 El compuesto activo se disuelve a la concentración deseada en una mezcla de 1:1 (vol:vol) de agua destilada: acetona. Se adiciona agente tensioactivo (Kinetic® HV) a una velocidad de 0,01% (vol/vol). La solución de prueba se prepara el día de uso.

- 15 Las hojas de repollo se sumergieron en la solución de prueba y se secaron al aire. Las hojas tratadas se colocaron en placas de Petri revestidas con papel de filtro húmedo y se inocularon con diez larvas de 3er estadio. La mortalidad se registró 72 horas después del tratamiento. También se registraron daños en la alimentación utilizando una escala de 0-100%.

- 20 En esta prueba, el compuesto I-1-1, I-1-4, I-1-5, I-1-6 e I-1-8 a 300 ppm mostró más del 75% de mortalidad en comparación con los controles no tratados.

Para evaluar el control del pulgón verde del melocotón (*Myzus persicae*) a través de medios sistémicos, la unidad de prueba consistió en placas microtituladoras de 96 pocillos que contienen dieta artificial líquida bajo una membrana artificial.

- 25 Los compuestos se formularon usando una solución que contiene 75% v/v de agua y 25% v/v de DMSO. Diferentes concentraciones de compuestos formulados se pipetearon en la dieta de áfidos, usando un pipetter personalizado, en dos réplicas.

- 30 Después de la aplicación, se colocaron 5-8 áfidos adultos en la membrana artificial dentro de los pocillos de la placa de microtitulación. Entonces se dejó que los áfidos succionaran en la dieta de áfidos tratada y se incubaron a aproximadamente 23 ± 1 °C y aproximadamente 50 ± 5% de humedad relativa durante 3 días. La mortalidad y la fecundidad de los áfidos se evaluaron visualmente.

- 35 En esta prueba, los compuestos I-1-1, I-2-1, I-1-2, I-1-3, I-1-4, I-1-5, I-1-6, I-1-7, I-1-9 e I-1-10 a 2500 ppm mostraron más del 75 % de mortalidad en comparación con los controles no tratados.

Gusano cogollero del sur (*Spodoptera eridania*)

- 40 Los compuestos activos se formularon mediante un manipulador de líquido Tecan en ciclohexanona al 100% como una solución de 10000 ppm suministrada en tubos. La solución de 10000 ppm se diluyó en serie en ciclohexanona al 100% para producir soluciones provisionales. Estos sirvieron como soluciones madre para las cuales se realizaron diluciones finales por el Tecan en acetona al 50%:50% de agua (v/v) en viales de vidrio de 10 o 20 ml. Se incluyó un agente tensioactivo no iónico (Kinetic®) en la solución a un volumen de 0,01% (v/v). Los viales entonces se insertaron en un pulverizador electrostático automatizado equipado con una boquilla atomizadora para su aplicación a plantas/insectos.

- 45 Las plantas de frijol de Lima (variedad Sieva) se cultivaron 2 plantas en una maceta y se seleccionaron para el tratamiento en la primera etapa de hoja verdadera. Las soluciones de prueba se pulverizaron sobre el follaje mediante un pulverizador de planta electrostática automatizado equipado con una boquilla pulverizadora atomizadora. Las plantas se secaron en la campana de vapor del pulverizador y entonces se removieron del pulverizador. Cada recipiente se colocó en bolsas de plástico perforadas con un cierre de cremallera. Se colocaron entre 10 y 11 larvas de gusanos cogollero en la bolsa y las bolsas se cerraron con cremallera. Las plantas de prueba se mantuvieron en una sala de crecimiento a aproximadamente 25°C y aproximadamente 20-40% de humedad relativa durante 4 días, evitando la exposición directa a la luz fluorescente (fotoperíodo de 24 horas) para evitar la captura de calor dentro de las bolsas. La mortalidad y la alimentación reducida se evaluaron 4 días después del tratamiento, en comparación con las plantas de control no tratadas.

- 55 En esta prueba, los compuestos I-1-1, I-2-1, I-1-2, I-1-3, I-1-4, I-1-5, I-1-6 e I-1-9 a 300 ppm mostraron más del 75% de mortalidad en comparación con los controles no tratados.

Chinche verde apestosa (*Nezara viridula*)

- 60 El compuesto activo se disuelve a la concentración deseada en una mezcla de 1:1 (vol:vol) de agua destilada: acetona. Se adiciona agente tensioactivo (Kinetic® HV) a una velocidad de 0,01% (vol/vol). La solución de prueba se prepara el día de uso.

- 65 Las vainas de soja se colocaron en placas Petri de vidrio de 90 x 50 mm forradas con papel de filtro húmedo y se inocularon con diez estadios tardíos de *N. viridula* del tercer estadio. Usando un atomizador de mano, se rocía una solución de

aproximadamente 2 ml en cada placa de Petri. Los recipientes tratados se mantuvieron a aproximadamente 25-26°C y la humedad relativa de aproximadamente 65-70%. El porcentaje de mortalidad se registró después de 5 días.

5 En esta prueba, los compuestos I-1-3 e I-1-8 a 300 ppm mostraron una mortalidad superior al 75% en comparación con los controles no tratados.

Mosca blanca de la hoja plateada (*Bemisia argentifolii*)

10 Los compuestos activos se formularon mediante un manipulador de líquido Tecan en ciclohexanona al 100% como una solución de 10000 ppm suministrada en tubos. La solución de 10000 ppm se diluyó en serie en ciclohexanona al 100% para producir soluciones provisionales. Estos sirvieron como soluciones madre para las cuales se realizaron diluciones finales por el Tecan en acetona al 50%:50% de agua (v/v) en viales de vidrio de 5 o 10ml. Se incluyó un agente tensioactivo no iónico (Kinetic®) en la solución a un volumen de 0,01% (v/v). Los viales entonces se insertaron en un pulverizador electrostático automatizado equipado con una boquilla atomizadora para su aplicación a plantas/insectos.

15 Las plantas de algodón en la etapa cotiledónea (una planta por maceta) fueron rociadas por un pulverizador de planta electrostática automatizado equipado con una boquilla pulverizadora atomizadora. Las plantas se secaron en la campana de vapor del pulverizador y entonces se removieron del pulverizador. Cada recipiente se colocó en un recipiente de plástico y se introdujeron entre 10 y 12 adultos de mosca blanca (de aproximadamente 3-5 días de edad). Los insectos se recolectaron usando un aspirador y un tubo Tygon® no tóxico conectado a una punta de pipeta de barrera.

20 La punta, que contiene los insectos recolectados, se insertó suavemente en el suelo que contiene la planta tratada, permitiendo que los insectos se arrastraran fuera de la punta para alcanzar el follaje para alimentarse. Los recipientes se cubrieron con una tapa filtrada reutilizable. Las plantas de prueba se mantuvieron en una sala de crecimiento a 25 °C y aproximadamente 20-40% de humedad relativa durante 3 días, evitando la exposición directa a la luz fluorescente (fotoperíodo de 24 horas) para evitar la captura de calor dentro del recipiente. La mortalidad se evaluó 3 días después del tratamiento, en comparación con las plantas de control no tratadas.

25 En esta prueba, los compuestos I-1-1 e I-1-4 a 300 ppm mostraron una mortalidad superior al 75% en comparación con los controles no tratados.

Barrenador rayado del tallo (*Chilo suppressalis*)

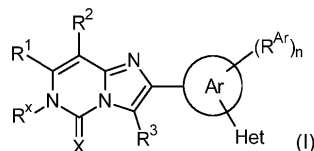
35 El compuesto activo se disuelve a la concentración deseada en una mezcla de 1:1 (vol:vol) de agua destilada: acetona. Se adiciona agente tensioactivo (Kinetic® HV) a una velocidad de 0,01% (vol/vol). La solución de prueba se prepara el día de uso.

40 Se permite que diez larvas de primera estrella se arrastren en placas de petri rociadas durante 1 minuto y entonces se les proporciona una pajita de arroz recién cortada por placa. Después de 10 minutos, cuando todas las larvas estén dentro, se cubrirá la pajita con una tapa Petri. El porcentaje de mortalidad se registra después de 72 horas después del tratamiento.

45 En esta prueba, los compuestos I-1-4 a 300 ppm mostraron una mortalidad superior al 75 % en comparación con los controles no tratados.

REIVINDICACIONES

1. Una compuesto de la fórmula I



donde

X es O o S;

R^x se selecciona del grupo que consiste de C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquino, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alcoxi, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalcoxi-C₁-C₄-alquilo, que están insustituídos o sustituidos con halógeno, C(O)-OR^a, NR^bR^c, C₁-C₆-alquilen-NR^bR^c, O-C₁-C₆-alquilen-NR^bR^c, C₁-C₆-alquilen-CN, NH-C₁-C₆-alquilen-NR^bR^c, C(O)-NR^bR^c, C(O)-R^d, SO₂NR^bR^c, S(=O)_mR^e, fenilo y bencilo, en donde el anillo de fenilo está insustituído o sustituido con radicales R^f;

R^1 es H, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquino, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalcoxi, C₁-C₆-alquilsulfenilo, C₁-C₆-alquilsulfino, o C₁-C₆-alquilsulfonilo que están sustituidos o insustituídos con halógeno; R^2 , R^3 se seleccionan independientemente entre sí del grupo que consiste de H, halógeno, N₃, CN, NO₂, -SCN, -SF₅, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alqueno, tri-C₁-C₆-alquilsililo, C₂-C₆-alquino, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alcoxi, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalcoxi, C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalcoxi-C₁-C₄-alquilo, que están insustituídos o sustituidos con halógeno, C(O)-OR^a, NR^bR^c, C₁-C₆-alquilen-NR^bR^c, O-C₁-C₆-alquilen-NR^bR^c, C₁-C₆-alquilen-CN, NH-C₁-C₆-alquilen-NR^bR^c, C(O)-NR^bR^c, C(O)-R^d, SO₂NR^bR^c y S(=O)_mR^e, un radical puede ser también fenilo, fenoxi, fenilcarbonilo, feniltio o bencilo, en donde el anillo de fenilo está insustituído o sustituido con radicales R^f;

Ar es fenilo o heteroarilo de 5 o 6 miembros,

R^{Ar} se selecciona, independientemente entre sí del grupo que consiste de halógeno, N₃, OH, CN, NO₂, -SCN, -SF₅, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alqueno, tri-C₁-C₆-alquilsililo, C₂-C₆-alquino, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alcoxi, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalcoxi, C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalcoxi-C₁-C₄-alquilo, que están insustituídos o sustituidos con halógeno, C(O)-OR^a, NR^bR^c, C₁-C₆-alquilen-NR^bR^c, O-C₁-C₆-alquilen-NR^bR^c, C₁-C₆-alquilen-CN, NH-C₁-C₆-alquilen-NR^bR^c, C(O)-NR^bR^c, C(O)-R^d, SO₂NR^bR^c y S(=O)_mR^e, un radical puede ser también fenilo, fenoxi, fenilcarbonilo, feniltio o bencilo, en donde el anillo de fenilo está insustituído o sustituido con radicales R^f;

Het es heteroarilo de 5 o 6 miembros o heterociclilo de 5 o 6 miembros, que está insustituído o sustituido con R; siempre que R sea halógeno, oxo (=O), N₃, OH, CN, NO₂, SCN, SF₅, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquino, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₆-alcoxycarbonilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalcoxi, C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalcoxi-C₁-C₄-alquilo, fenilo, heteroarilo de 5 o 6 miembros, o heterociclilo de 5 o 6 miembros, en donde los grupos cíclicos de R están insustituídos o sustituidos con radicales R^f; que R^{Ar} y Het no estén presentes en el mismo átomo de Ar;

cada R^a se selecciona de H, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquino, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalcoxi-C₁-C₄-alquilo, que están insustituídos o sustituidos con halógeno, C₁-C₆-alquilen-NR^bR^c, C₁-C₆-alquilen-CN, fenilo y bencilo, en donde el anillo de fenilo está insustituído o sustituido con radicales R^f;

cada R^b se selecciona de H, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquino, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalcoxi-C₁-C₄-alquilo, que están insustituídos o sustituidos con halógeno, -C(=O)R, -C(=O)OR, y -C(=O)NR, C₁-C₆-alquilen-CN, fenilo y bencilo, en donde el fenilo está insustituído o sustituido con radicales R^f;

cada R^c se selecciona de H, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquino, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalcoxi-C₁-C₄-alquilo, que están insustituídos o sustituidos con halógeno, C₁-C₆-alquilen-CN, fenilo y bencilo, en donde el anillo de fenilo está insustituído o sustituido con radicales R^f;

cada porción NR^bR^c también puede formar un heterociclo saturado de 3 a 8 miembros unido a N, que además del átomo de nitrógeno puede tener 1 o 2 heteroátomos o porciones de heteroátomo adicionales seleccionadas de O, S(=O)_m y N-R', en donde R' es H o C₁-C₆-alquilo y en donde el heterociclo unido a N está insustituído o sustituido con radicales seleccionados de halógeno, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₄-haloalcoxi;

cada R^d se selecciona de H, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquino, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalcoxi-C₁-C₄-alquilo, que están insustituídos o sustituidos con halógeno, fenilo y bencilo, en donde el anillo de fenilo está insustituído o sustituido con radicales R^f;

cada R^e se selecciona de C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₄-alquilo, que están insustituídos o sustituidos con halógeno, fenilo y bencilo, en donde el anillo de fenilo está insustituído o sustituido con R^f;

cada R^f se selecciona de halógeno, N₃, OH, CN, NO₂, SCN, SF₅, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquino, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alcoxi, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalcoxi, C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalcoxi-C₁-C₄-alquilo, que están insustituídos o sustituidos con halógeno;

m es 0, 1 o 2;

n es 0, 1 o 2;

y los N-óxidos, estereoisómeros, tautómeros y sales aceptables desde el punto de vista agrícola o veterinario del mismo.

2. El compuesto de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, donde X es O.

3. El compuesto de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1 o 2, donde Het se selecciona de tiofenilo, oxazolidinilo, imidazolidinilo, pirrolidinilo, piperidinilo, piridinilo, oxazolilo, tiazolilo, pirazolilo, imidazolilo, triazolilo, oxadiazolilo, tetrazolilo y tiadiazolilo;

donde el Het está insustituido o sustituido con R seleccionado de halógeno, oxo (=O), C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₄-alcoxi y C₁-C₆-alcoxycarbonilo.

4. El compuesto de la fórmula I de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, donde

R^x se selecciona de C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquino, C₃-C₆-cicloalquilo y C₁-C₆-haloalquilo;

R¹ se selecciona de C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alquilsulfenilo, C₁-C₆-alquilsulfinilo y C₁-C₆-alquilsulfonilo, parcial o completamente halogenado;

R² se selecciona de H, halógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alqueno, C₃-C₆-cicloalquilo y C₃-C₆-cicloalcoxi;

R³ se selecciona de H, halógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alqueno, C₃-C₆-cicloalquilo y C₃-C₆-cicloalcoxi;

Ar es un fenilo o heteroarilo de 5 o 6 miembros;

n es 1 o 2;

R^{Ar} se selecciona de halógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, S(=O)_mR^e, fenilo, fenoxi, fenilcarbonilo, feniltio y bencilo, donde el anillo fenilo está insustituido o sustituido con radicales R^f;

R^e se selecciona de C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₁-C₆-haloalquilo y C₃-C₆-halocicloalquilo;

R^f se selecciona de halógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₃-C₆-cicloalquilo, C₂-C₆-alqueno y C₂-C₆-alquino, que están insustituidos o sustituidos con halógeno;

m es 0, 1 o 2.

5. El compuesto de la fórmula I de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, donde Ar es de heteroarilo de 5 o 6 miembros que contiene un heteroátomo seleccionado de O, N y S.

6. El compuesto de la fórmula I de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores, donde

R^x es C₁-C₆-alquilo;

R¹ se selecciona de halogenado parcial o completamente, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alquilsulfenilo, C₁-C₆-alquilsulfinilo y C₁-C₆-alquilsulfonilo;

R² se selecciona de entre H, halógeno y C₁-C₆-alquilo;

R³ se selecciona de entre H, halógeno y C₁-C₆-alquilo;

Ar es piridinilo o tiofenilo sustituido con R^{Ar} como S(=O)_mR^e en la posición orto para unir con heteroarilo de 9 miembros del compuesto de la fórmula I, y opcionalmente sustituido además con 1 R^{Ar} seleccionado de halógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, fenilo y bencilo, donde el anillo fenilo de R^{Ar} está insustituido o sustituido con radicales R^f;

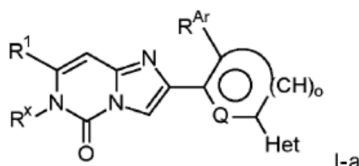
R^e se selecciona de C₁-C₆-alquilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₁-C₆-haloalquilo y C₃-C₆-halocicloalquilo;

R^f se selecciona de halógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₃-C₆-cicloalquilo, C₂-C₆-alqueno y C₂-C₆-alquino, que están insustituidos o sustituidos con halógeno;

m es 0, 1 o 2;

Het se selecciona de tiofenilo, oxazolidinilo, imidazolidinilo, pirrolidinilo, piperidinilo, piridinilo, oxazolilo, tiazolilo, pirazolilo, imidazolilo, triazolilo, oxadiazolilo y tiadiazolilo; donde Het está insustituido o sustituido con R; R se selecciona de halógeno, oxo (=O), C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi y C₁-C₆-alcoxycarbonilo.

7. El compuesto de la fórmula I de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones anteriores que corresponde al compuesto de la fórmula I-a,



donde el círculo en el anillo que contiene Q denota que el anillo es un anillo aromático;

Q es S o N;

R^x es C₁-C₆-alquilo;

R¹ se selecciona de C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alquilsulfenilo, C₁-C₆-alquilsulfinilo y C₁-C₆-alquilsulfonilo, parcial o completamente halogenado,

- R^{Ar} es $S(=O)_mRe$; donde
 R^e es C_1-C_6 -alquilo;
 Het se selecciona de tiofenilo, oxazolidinilo, imidazolidinilo, pirrolidinilo, piperidinilo, piridinilo, oxazolilo, tiazolilo, pirazolilo, imidazolilo, triazolilo, oxadiazolilo y tiadiazolilo; donde el Het está insustituido o sustituido con R;
 5 R se selecciona de halógeno, oxo ($=O$), C_1-C_6 -haloalquilo, C_1-C_6 -alcoxi y C_1-C_6 -alcoxycarbonilo;
 m es 0, 1 o 2;
 o es 1 o 2.
- 10 8. Una composición que comprende el compuesto de la fórmula I, como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7, un N-óxido o una sal aceptable desde el punto de vista agrícola del mismo.
9. La composición de acuerdo con la reivindicación 8, que comprende adicionalmente una sustancia activa adicional.
- 15 10. Un método no terapéutico para combatir o controlar plagas de invertebrados, el método que comprende poner en contacto esta plaga o su suministro de alimentos, hábitat o criaderos con una cantidad efectiva como pesticida de al menos un compuesto de la fórmula I de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7 o la composición de acuerdo con la reivindicación 8 o 9.
- 20 11. Un método para proteger las plantas en crecimiento del ataque o la infestación por plagas de invertebrados, el método que comprende poner en contacto una planta, o suelo o agua en que la planta está creciendo, con una cantidad efectiva como pesticida de al menos un compuesto de la fórmula I, de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7 o la composición de acuerdo con la reivindicación 8 o 9.
- 25 12. Una semilla que comprende un compuesto de la fórmula I, como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7, o los enantiómeros, diastereómeros o sales de los mismos, o la composición, como se define en cualquiera de las reivindicaciones 8 o 9, en una cantidad de 0,1 g a 10 kg por 100 kg de semilla.
- 30 13. Un uso de un compuesto de la fórmula I, como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7, y de una sal agrícolamente aceptable del mismo, o de las composiciones como se define en cualquiera de las reivindicaciones 8 o 9, para proteger plantas en crecimiento del ataque o infestación por plagas de invertebrados.
- 35 14. Un compuesto de la fórmula I como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7, para uso en un método para tratar o proteger un animal de la infestación o infección por plagas de invertebrados que comprende poner al animal en contacto con una cantidad efectiva como pesticida de al menos un compuesto de la fórmula I como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7, un estereoisómero del mismo y/o al menos una sal veterinariamente aceptable del mismo.