

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 987 367**

51 Int. Cl.:

C07D 471/04 (2006.01)
C07D 498/04 (2006.01)
C07D 473/40 (2006.01)
C07D 213/74 (2006.01)
C07D 213/73 (2006.01)
C07D 487/04 (2006.01)
A61P 33/00 (2006.01)
A01N 43/90 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- 86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **05.02.2015** **PCT/EP2015/052351**
 87 Fecha y número de publicación internacional: **20.08.2015** **WO15121136**
 96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **05.02.2015** **E 15702765 (7)**
 97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **10.07.2024** **EP 3107912**

54 Título: **Derivados de heterociclos bicíclicos condensados sustituidos con 2-(het)arilo como agentes para combatir parásitos**

30 Prioridad:

17.02.2014 EP 14155372

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:
14.11.2024

73 Titular/es:

BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT
(100.0%)
Alfred-Nobel-Strasse 50
40789 Monheim am Rhein, DE

72 Inventor/es:

FISCHER, RÜDIGER;
ALIG, BERND;
ILG, KERSTIN;
MALSAM, OLGA;
GÖRGENS, ULRICH;
TURBERG, ANDREAS;
LI, JUN;
ZHERSH, SERGEY y
ARLT, ALEXANDER

74 Agente/Representante:

GONZÁLEZ PECES, Gustavo Adolfo

Observaciones:

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

ES 2 987 367 T3

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

DESCRIPCIÓN

Derivados de heterociclos bicíclicos condensados sustituidos con 2-(het)arilo como agentes para combatir parásitos

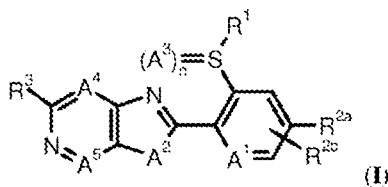
La presente invención se refiere a nuevos derivados de heterociclos bicíclicos condensados sustituidos con 2-(het)arilo de la fórmula (I), su aplicación como acaricidas y/o insecticidas para el combate de parásitos animales, sobre todo artrópodos y en especial de insectos y arácnidos y procedimientos y productos intermediarios para su preparación.

Los derivados de heterociclos bicíclicos condensados sustituidos con 2-(het)arilo con propiedades insecticidas se describen ya en la literatura, por ejemplo, en los documentos WO 2010/125985, WO 2012/074135, WO 2012/086848, WO 2013/018928, WO 2014/142292 y WO 2014/148451, así como WO 2015/000715.

Los principios activos ya conocidos según los documentos antes mencionados presentan en su aplicación en parte desventajas, ya que presentan sólo un escaso ámbito de aplicación, o ya que no presentan una acción insecticida o acaricida satisfactoria.

Ahora se hallaron nuevos derivados de heterociclos bicíclicos condensados sustituidos con 2-(het)arilo que, respecto de los compuestos ya conocidos, presentan ventajas, por ejemplo, se han de mencionar a modo de ejemplo mejores propiedades biológicas o ecológicas, métodos de mayor aplicación, una mejor acción insecticida, acaricida, así como una buena tolerancia respecto de plantas útiles. Los derivados de heterociclos bicíclicos condensados sustituidos con 2-(het)arilo se pueden usar en combinación con otros agentes para mejorar la eficacia en especial contra insectos de difícil combate.

Por ello, son objeto de la presente invención nuevos compuestos de la fórmula (I)



en la que

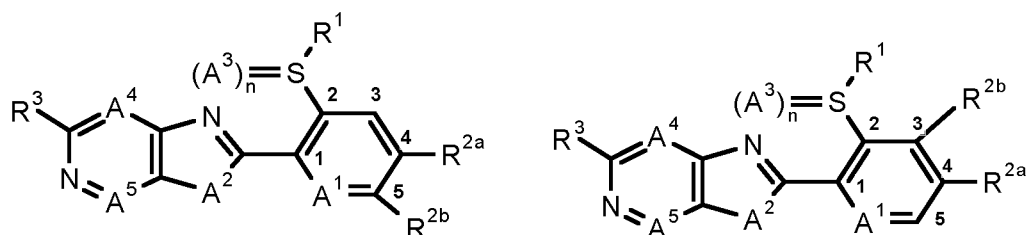
en la que R¹, R^{2a}, R^{2b}, R³, A¹, A², A⁴, A⁵ y n tienen los significados indicados en la tabla y A³ representa oxígeno:

Bsp.	R ¹	n	A ⁴	A ⁵	R ³	A ²	A ¹	R ^{2a}	R ^{2b}
I-1	CH ₃	0	N	CH	CF ₃	O	CH	Cl	H
I-4	CH ₃	0	CH	CH	CF ₃	N-Metilo	CH	F	H
I-6	CH ₃	0	N	CH	CF ₃	N-Metilo	CH	Cl	H
I-7	-(CH ₂) ₂ -SO ₂ -C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-Metilo	N	CF ₃	H
I-8	i-C ₃ H ₇	1	CH	CH	CF ₃	N-Metilo	N	CF ₃	H
I-9	C ₂ H ₅	0	N	CH	CF ₃	O	CH	H	H
I-12	CH ₃	1	CH	CH	CF ₃	N-Metilo	CH	F	H
I-13	C ₂ H ₅	1	CH	CH	CF ₃	N-Metilo	CH	H	5-Cl*
I-16	i-C ₃ H ₇	2	CH	CH	CF ₃	N-Metilo	N	CF ₃	H
I-19	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-Metilo	CH	H	5-Cl*
I-20	CH ₃	2	CH	CH	CF ₃	N-Metilo	CH	F	H

Bsp.	R ¹	n	A ⁴	A ⁵	R ³	A ²	A ¹	R ^{2a}	R ^{2b}
I-23	-(CH ₂) ₂ -S-C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-Metilo	N	CF ₃	H
I-27	Oxetan-3-ilo	2	CH	CH	CF ₃	N-Metilo	CH	H	H
I-28	C ₂ H ₅	0	N	CH	CF ₃	N-Metilo	N	CF ₃	H
I-29	CF ₃	0	CH	CH	CF ₃	N-Metilo	N	H	H
I-31	n-C ₃ H ₇	0	CH	CH	CF ₃	N-Metilo	N	CF ₃	H
I-32	n-C ₃ H ₇	2	CH	CH	CF ₃	N-Metilo	N	CF ₃	H
I-34	CH ₃	0	CH	CH	CF ₃	O	CH	Cl	H
I-35	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	O	CH	H	H
I-38	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-Metilo	CH	H	5-Cl*
I-39	n-C ₃ H ₇	1	CH	CH	CF ₃	N-Metilo	N	CF ₃	H
I-40	Oxetan-3-ilo	0	CH	CH	CF ₃	O	CH	H	H
I-41	i-C ₃ H ₇	0	CH	CH	CF ₃	N-Metilo	N	CF ₃	H

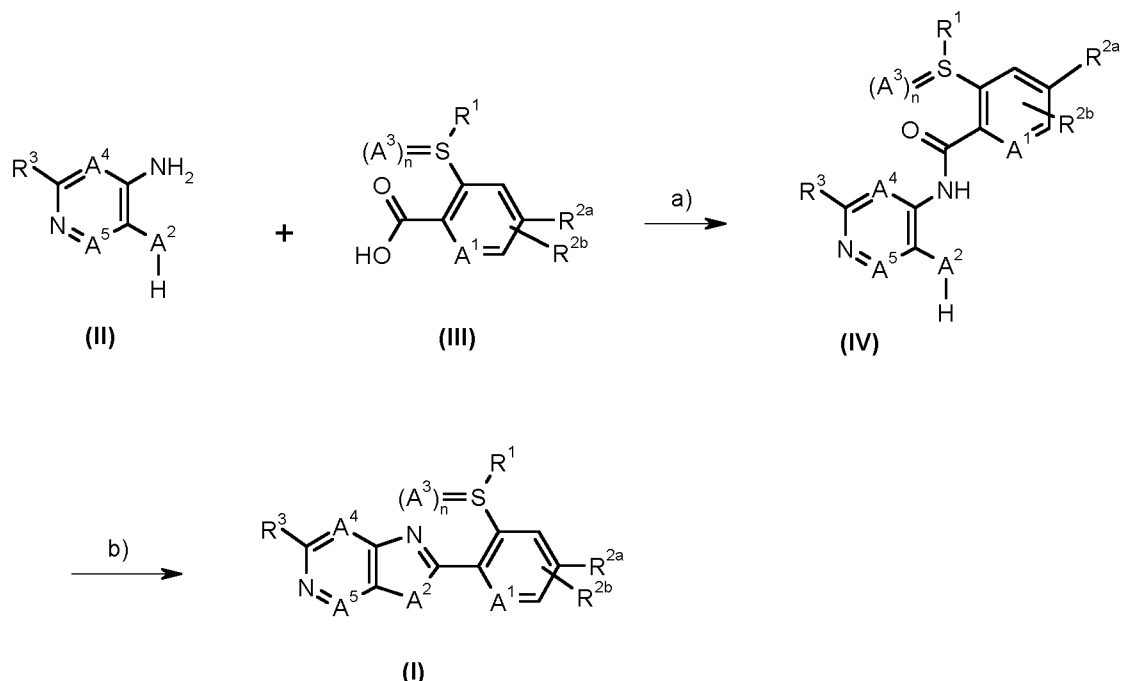
Además, se encontró que los compuestos de fórmula (I) tienen una muy buena eficacia como pesticidas, preferiblemente como insecticidas y/o acaricidas, y en general son muy bien tolerados por las plantas, en particular por las plantas cultivadas.

- 5 La unión de R^{2b} se realiza en la posición 3 o 5:



Según la naturaleza de los sustituyentes, los compuestos de la fórmula (I) pueden estar en la forma de isómeros geométricos y/u ópticamente activos o las correspondientes mezclas isoméricas en diferentes composiciones. Estos estereoisómeros son, por ejemplo, enantiómeros, diastereómeros, atropisómeros o isómeros geométricos. Conforme a ello, la invención comprende tanto estereoisómeros puros como cualquier mezcla de estos isómeros.

Los compuestos de la fórmula (I) según la invención se pueden obtener por medio de los procedimientos representados en los siguientes esquemas:

Procedimiento A

Los radicales R^1 , R^{2a} , R^{2b} , R^3 , A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 y n tienen los significados antes descritos.

Etapas a)

- 5 Los compuestos de la fórmula (IV) se pueden preparar análogamente al procedimiento descrito en el documento US5576335 por reacción de compuestos de la fórmula (II) con ácidos carboxílicos de la fórmula (III) en presencia de un agente de condensación.

Los compuestos de la fórmula (II) se pueden obtener en comercios o se pueden preparar según métodos conocidos, por ejemplo, análogamente a los procedimientos descritos en los documentos US2003/69257 o WO2006/65703.

- 10 Los ácidos carboxílicos de la fórmula (III) se pueden obtener en comercios o se pueden preparar según métodos conocidos, por ejemplo, análogamente a los procedimientos descritos en los documentos US2010/234604, WO2012/61926 o Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters, **18** (2008), 5023-5026.

- 15 La reacción de los compuestos de la fórmula (II) con ácidos carboxílicos de la fórmula (III) se puede llevar a cabo en sustancia o en un disolvente, con preferencia, la reacción se lleva a cabo en un disolvente, que está seleccionado de disolventes usuales inertes en las condiciones de reacción imperantes. Se prefieren éteres tales como, por ejemplo, éter diisopropílico, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano; hidrocarburos haloados tales como, por ejemplo, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; nitrilos tales como, por ejemplo, acetonitrilo o propionitrilo; hidrocarburos aromáticos tales como, por ejemplo, tolueno o xileno; disolventes polares apróticos tales como, por ejemplo, N,N-dimetilformamida o N-metilpirrolidona o compuestos con contenido de nitrógeno tales como, por ejemplo, piridina.

Los agentes de condensación apropiados son, por ejemplo, carbodiimidas tales como clorhidrato de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida (EDCI) o 1,3-diciclohexilcarbodiimida.

La reacción se puede llevar a cabo al vacío, a presión normal o a sobrepresión y a temperaturas de 0 °C a 180 °C, con preferencia, la reacción se lleva a cabo a presión normal y temperaturas de 20 a 140 °C.

Etapas b)

Los compuestos de la fórmula (I) se pueden preparar por condensación de los compuestos de la fórmula (IV) por ejemplo, análogamente a los procedimientos descritos en el documento WO2012/86848.

- 30 La reacción en los compuestos de la fórmula (I) se puede llevar a cabo en sustancia o en un disolvente, con preferencia, la reacción se lleva a cabo en un disolvente, que está seleccionado de disolventes usuales inertes en las condiciones de reacción imperantes. Se prefieren éteres tales como, por ejemplo, éter diisopropílico, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, éter ter.-butilmetílico; hidrocarburos haloados tales como, por ejemplo, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; nitrilos tales como, por ejemplo, acetonitrilo o propionitrilo;

hidrocarburos aromáticos tales como, por ejemplo, tolueno o xileno; disolventes polares apróticos tales como, por ejemplo, N,N-dimetilformamida o N-metilpirrolidona o compuestos con contenido de nitrógeno tales como, por ejemplo, piridina.

- 5 La reacción se puede llevar a cabo en presencia de un agente de condensación, de un ácido, de una base o de un agente de cloración.

Los ejemplos de agentes de condensación apropiados son carbodiimidas tales como clorhidrato de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida (EDCI) o 1,3- diciohexilcarbodiimida; anhídridos tales como anhídrido de ácido acético, anhídrido de ácido trifluoroacético; una mezcla de trifenilfosfina, de una base y tetracloruro de carbono o una mezcla de trifenilfosfina y un diéster azoico tal como, por ejemplo, ácido dietilazodicarboxílico.

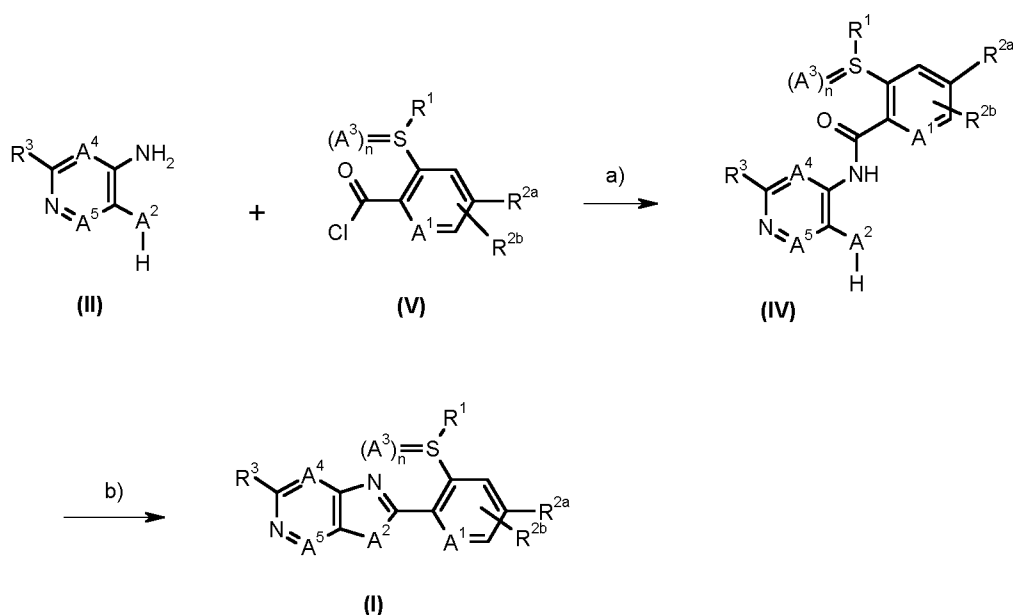
- 10 Los ejemplos de ácidos apropiados, que se pueden usar en la reacción descrita, son ácidos sulfónicos tales como ácido para-toluensulfónico; ácidos carboxílicos tales como ácido acético o ácidos polifosfóricos.

Los ejemplos de bases apropiadas son heterociclos con contenido de nitrógeno tales como piridina, picolina, 2,6-lutidina, 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-7-undeceno (DBU); aminas terciarias tales como trietilamina y N,N-diisopropiletilamina; bases inorgánicas tales como fosfato de potasio, carbonato de potasio e hidruro de sodio.

- 15 Un ejemplo de un agente de cloración apropiado es oxiclورو de fósforo.

La reacción se puede llevar a cabo al vacío, a presión normal o a sobrepresión y a temperaturas de 0 °C a 200 °C.

Procedimiento B



Los radicales R¹, R^{2a}, R^{2b}, R³, A¹, A², A³, A⁴, A⁵ y n tienen los significados antes descritos.

Etapa a)

En otra realización según la invención, los compuestos de la fórmula (IV) se pueden preparar por reacción de compuestos de la fórmula (II) con cloruros de ácido carboxílico de la fórmula (V) en presencia de un agente de condensación.

- 25 Los cloruros de ácido carboxílico de la fórmula (V) se pueden obtener en comercios o se pueden preparar según métodos conocidos, por ejemplo, análogamente a los procedimientos descritos en los documentos US2010/234603 o US2010/234604.

- 30 La reacción de los compuestos de la fórmula (II) con cloruros de ácido carboxílico de la fórmula (V) se puede llevar a cabo en sustancia o en un disolvente, con preferencia, la reacción se lleva a cabo en un disolvente, que está seleccionado de disolventes usuales inertes en las condiciones de reacción imperantes. Se prefieren éteres tales como, por ejemplo, éter diisopropílico, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano; hidrocarburos haloalados tales como, por ejemplo, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; hidrocarburos alifáticos tales como hexano, heptano u octano; hidrocarburos aromáticos tales como, por ejemplo, tolueno o xileno; nitrilos tales como, por ejemplo, acetonitrilo o propionitrilo; disolventes polares apróticos tales como, por ejemplo, N,N-dimetilformamida o N-metilpirrolidona o compuestos con contenido de nitrógeno tales como, por

ejemplo, piridina.

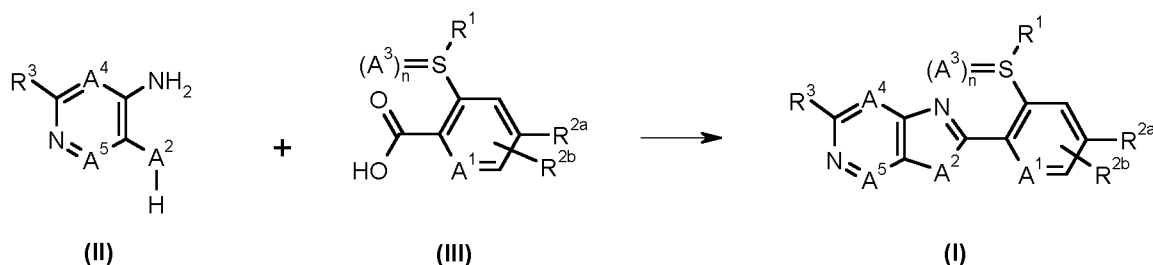
La reacción se lleva a cabo, con preferencia, en presencia de una base. Las bases apropiadas son bases inorgánicas, que usualmente se usan en esas reacciones. Con preferencia, se usan bases que, por ejemplo, están seleccionadas del grupo compuesto por acetatos, fosfatos, carbonatos e hidrógeno-carbonatos de metales alcalinos o alcalinotérreos. Se prefieren en especial, en este caso, acetato de sodio, fosfato de sodio, fosfato de potasio, carbonato de cesio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, hidrógeno-carbonato de sodio, hidrógeno-carbonato de potasio. Otras bases apropiadas son aminas terciarias tales como trietilamina y N,N-diisopropiletilamina y heterociclos con contenido de nitrógeno tales como piridina, picolina, 2,6-lutidina, 4-dimetilaminopiridina y 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-7-undeceno (DBU).

La reacción se puede llevar a cabo al vacío, a presión normal o a sobrepresión y a temperaturas de -20 °C a 100 °C, con preferencia, la reacción se lleva a cabo a presión normal y temperaturas de 0 °C a 80 °C.

Etapa b)

La posterior reacción de los compuestos de la fórmula (IV) en los compuestos de la fórmula (I) se lleva a cabo tal como se describe en el procedimiento A, etapa b).

Procedimiento C



Los radicales R^1 , R^{2a} , R^{2b} , R^3 , A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 y n tienen los significados antes descritos.

En otra realización según la invención, los compuestos de la fórmula (I) se pueden preparar en un proceso de una etapa a partir de los compuestos intermedios de las fórmulas (II) y (III) en presencia de un agente de condensación.

La reacción en los compuestos de la fórmula (I) se puede llevar a cabo en sustancia o en un disolvente, con preferencia, la reacción se lleva a cabo en un disolvente, que está seleccionado de disolventes usuales inertes en las condiciones de reacción imperantes. Se prefieren éteres tales como, por ejemplo, éter diisopropílico, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, éter ter.-butilmetílico; hidrocarburos haloados tales como, por ejemplo, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; alcoholes tales como metanol, etanol o iso-propanol; nitrilos tales como, por ejemplo, acetonitrilo o propionitrilo; hidrocarburos aromáticos tales como, por ejemplo, tolueno o xileno; disolventes polares apróticos tales como, por ejemplo, N,N-dimetilformamida o N-metilpirrolidona o compuestos con contenido de nitrógeno tales como, por ejemplo, piridina.

Los ejemplos de agentes de condensación apropiados son carbodiimidas tales como clorhidrato de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida (EDCI) o 1,3-diciclohexilcarbodiimida; anhídridos tales como anhídrido de ácido acético, anhídrido de ácido trifluoroacético; una mezcla de trifenilfosfina, de una base y tetracloruro de carbono o una mezcla de trifenilfosfina y un diéster azoico tal como, por ejemplo, ácido dietilazodicarboxílico.

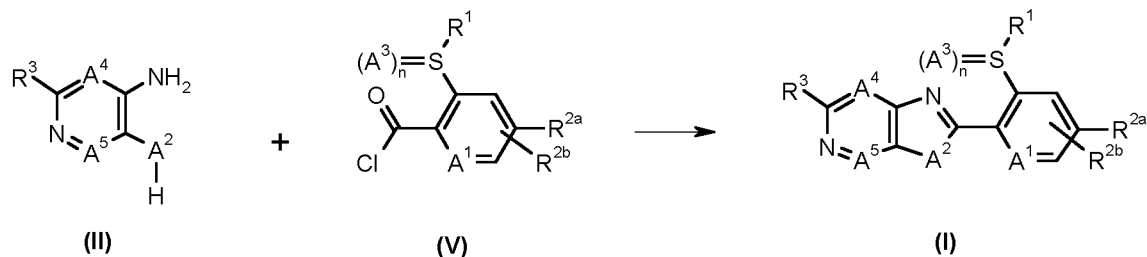
La reacción se puede llevar a cabo en presencia de un ácido o de una base.

Los ejemplos de un ácido, que se puede usar en la reacción descrita, son ácidos sulfónicos tales como ácido metansulfónico o ácido para-toluensulfónico; ácidos carboxílicos tales como ácido acético o ácidos polifosfóricos.

Los ejemplos de bases apropiadas son heterociclos con contenido de nitrógeno tales como piridina, picolina, 2,6-lutidina, 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-7-undeceno (DBU); aminas terciarias tales como trietilamina y N,N-diisopropiletilamina; bases inorgánicas tales como fosfato de potasio, carbonato de potasio e hidruro de sodio.

La reacción se puede llevar a cabo en presencia de un catalizador apropiado como, por ejemplo, 1-hidroxibenzotriazol.

La reacción se puede llevar a cabo al vacío, a presión normal o a sobrepresión y a temperaturas de 0 °C a 200 °C.

Procedimiento D

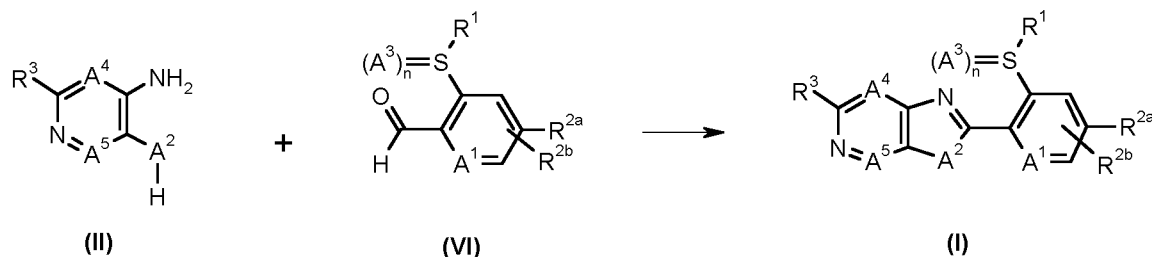
Los radicales R^1 , R^{2a} , R^{2b} , R^3 , A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 y n tienen los significados antes descritos.

En otra realización según la invención, los compuestos de la fórmula (I) se pueden preparar en un proceso de una etapa a partir de los compuestos intermediarios de las fórmulas (II) y (V).

La reacción en los compuestos de la fórmula (I) se puede llevar a cabo en sustancia o en un disolvente, con preferencia, la reacción se lleva a cabo en un disolvente, que está seleccionado de disolventes usuales inertes en las condiciones de reacción imperantes. Se prefieren éteres tales como, por ejemplo, éter diisopropílico, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, éter ter.-butilmetílico; hidrocarburos haloados tales como, por ejemplo, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; alcoholes tales como metanol, etanol o iso-propanol; nitrilos tales como, por ejemplo, acetonitrilo o propionitrilo; hidrocarburos aromáticos tales como, por ejemplo, tolueno o xileno; disolventes polares apróticos tales como, por ejemplo, N,N-dimetilformamida o N-metilpirrolidona o compuestos con contenido de nitrógeno tales como, por ejemplo, piridina.

La reacción se lleva a cabo, con preferencia, en presencia de una base. Las bases apropiadas son bases inorgánicas, que usualmente se usan en esas reacciones. Con preferencia, se usan bases que, por ejemplo, están seleccionadas del grupo compuesto por acetatos, fosfatos, hidróxidos, carbonatos e hidrógeno-carbonatos de metales alcalinos o alcalinotérreos. Se prefieren en este caso carbonato de cesio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, hidróxido de sodio e hidróxido de potasio. Otras bases apropiadas son aminas terciarias tales como trietilamina y N,N-diisopropiletilamina, heterociclos con contenido de nitrógeno tales como piridina, picolina, 2,6-lutidina, 4-dimetilaminopiridina y 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-7-undeceno (DBU).

La reacción se puede llevar a cabo al vacío, a presión normal o a sobrepresión y a temperaturas de 0 °C a 200 °C.

Procedimiento E

Los radicales R^1 , R^{2a} , R^{2b} , R^3 , A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 y n tienen los significados antes descritos.

En otra realización según la invención, los compuestos de la fórmula (I) se pueden preparar a partir de los compuestos de la fórmula (II) y los aldehídos de la fórmula (VI) en presencia de un agente de oxidación.

Los aldehídos de la fórmula (VI) se pueden obtener en comercios o se pueden preparar según métodos conocidos, por ejemplo, análogamente a los procedimientos descritos en los documentos US2009/192195, US2010/227894 o Angewandte Chemie, International Edition, **48** (2009), 7064 – 7068.

La reacción en los compuestos de la fórmula (I) se puede llevar a cabo en sustancia o en un disolvente, con preferencia, la reacción se lleva a cabo en un disolvente. Se prefieren éteres tales como, por ejemplo, éter diisopropílico, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, éter ter.-butilmetílico; hidrocarburos haloados tales como, por ejemplo, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; alcoholes tales como metanol, etanol o iso-propanol; ésteres tales como acetato de etilo; nitrilos tales como, por ejemplo, acetonitrilo o propionitrilo; hidrocarburos aromáticos tales como, por ejemplo, tolueno o xileno; disolventes polares apróticos tales como, por ejemplo, N,N-dimetilformamida o N-metilpirrolidona o compuestos con contenido de nitrógeno tales como, por ejemplo, piridina.

La reacción se puede llevar a cabo en presencia de un ácido. Los ejemplos de ácidos que se pueden usar en la reacción descrita son ácidos sulfónicos tales como ácido metansulfónico o ácido para-toluensulfónico; ácidos

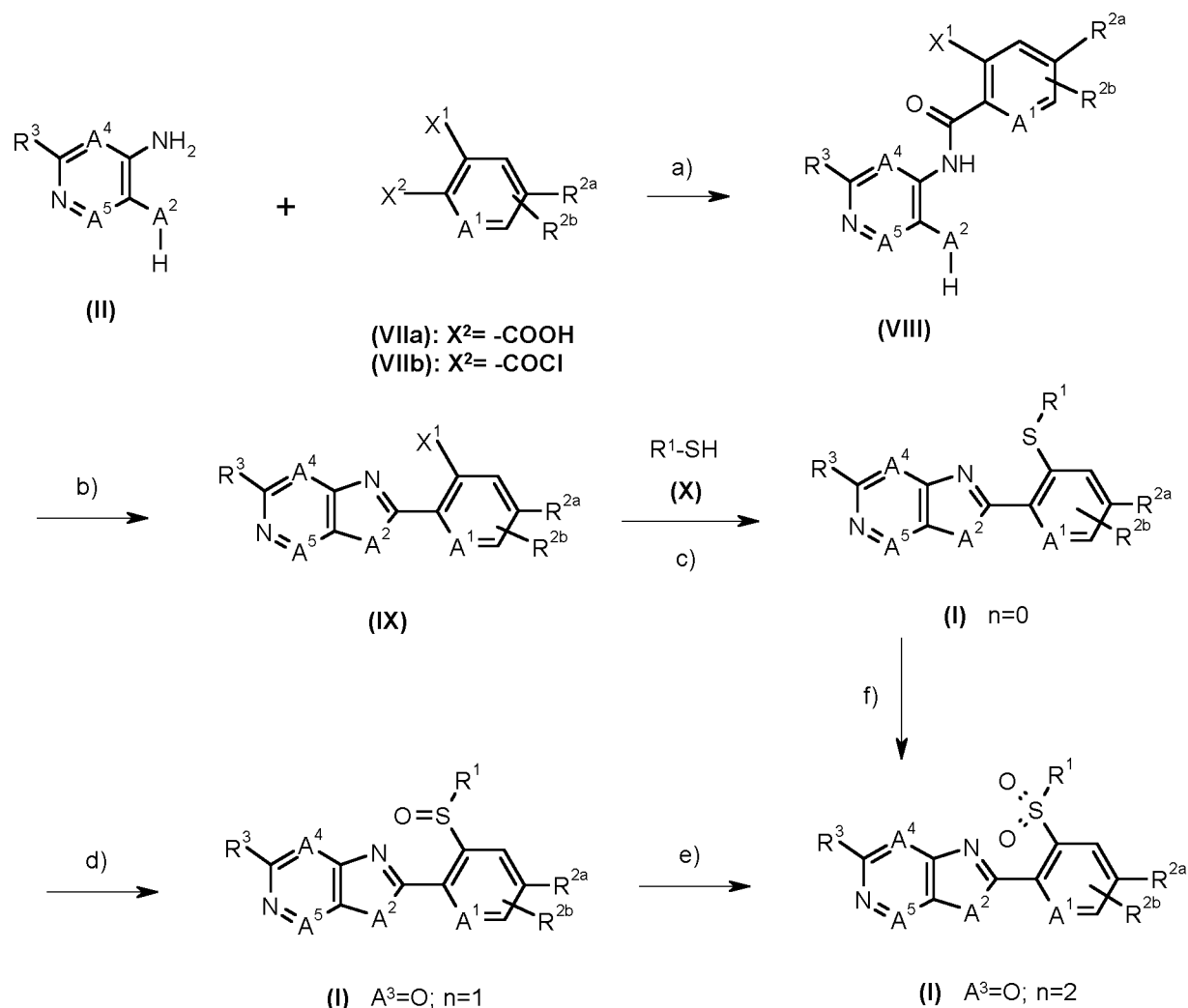
carboxílicos tales como ácido acético o ácidos polifosfóricos.

La reacción también se puede llevar a cabo en presencia de un sulfito. Los ejemplos de sulfitos que se pueden usar en la reacción descrita son hidrógeno-sulfito de sodio o sulfito de sodio.

Los ejemplos de agentes de oxidación, que se usan en la reacción descrita, son oxígeno, cloruro de cobre (II) o DDQ.

- 5 La reacción se puede llevar a cabo al vacío, a presión normal o a sobrepresión y a temperaturas de 0 °C a 200 °C, con preferencia, la reacción se lleva a cabo a presión normal y temperaturas de 20 a 150 °C.

Procedimiento F



- 10 Los radicales R^1 , R^{2a} , R^{2b} , R^3 , A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 y n tienen los significados antes descritos y X^1 representa halógeno.

Etapa a)

Los compuestos de la fórmula (VIII) se pueden preparar análogamente al procedimiento descrito en el documento US5576335 por reacción de compuestos de la fórmula (II) con un ácido carboxílico de la fórmula (VIIa) o con un cloruro de ácido carboxílico de la fórmula (VIIb) en presencia de un agente de condensación o bien de una base.

- 15 Los compuestos de la fórmula (II) se pueden obtener en comercios o se pueden preparar según métodos conocidos, por ejemplo, análogamente a los procedimientos descritos en los documentos US2003/69257 o WO2006/65703.

Los ácidos carboxílicos de la fórmula (VIIa) se pueden obtener en comercios o se pueden preparar según métodos conocidos, por ejemplo, análogamente a los procedimientos descritos en los documentos US2010/234604, WO2012/61926 o Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters, **18** (2008), 5023-5026.

- 20 Los cloruros de ácido carboxílico de la fórmula (VIIb) se pueden obtener en comercios o se pueden preparar según

métodos conocidos, por ejemplo, análogamente a los procedimientos descritos en los documentos US2010/234603 o US2010/234604.

La reacción de los compuestos de la fórmula (II) con ácidos carboxílicos de la fórmula (VIIa) o cloruros de ácido carboxílico de la fórmula (VIIb) se puede llevar a cabo en sustancia o en un disolvente, con preferencia, la reacción se lleva a cabo en un disolvente, que está seleccionado de disolventes usuales inertes en las condiciones de reacción imperantes. Se prefieren éteres tales como, por ejemplo, éter diisopropílico, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano; hidrocarburos haloalados tales como, por ejemplo, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; nitrilos tales como, por ejemplo, acetonitrilo o propionitrilo; hidrocarburos aromáticos tales como, por ejemplo, tolueno o xileno; disolventes polares apróticos tales como, por ejemplo, N,N-dimetilformamida o N-metilpirrolidona o compuestos con contenido de nitrógeno tales como, por ejemplo, piridina.

Los agentes de condensación apropiados son, por ejemplo, carbodiimidas tales como clorhidrato de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida (EDCI) o 1,3-diciclohexilcarbodiimida.

Las bases apropiadas son bases inorgánicas, que usualmente se usan en esas reacciones. Con preferencia, se usan bases que, por ejemplo, están seleccionadas del grupo compuesto por acetatos, fosfatos, carbonatos e hidrógeno-carbonatos de metales alcalinos o alcalinotérreos. Se prefieren en especial, en este caso, acetato de sodio, fosfato de sodio, fosfato de potasio, carbonato de cesio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, hidrógeno-carbonato de sodio, hidrógeno-carbonato de potasio.

La reacción se puede llevar a cabo al vacío, a presión normal o a sobrepresión y a temperaturas de 0 °C a 180 °C, con preferencia, la reacción se lleva a cabo a presión normal y temperaturas de 20 a 140 °C.

Etapa b)

Los compuestos de la fórmula (IX) se pueden preparar por condensación de los compuestos intermediarios de la fórmula (VIII) por ejemplo, análogamente a los procedimientos descritos en el documento WO2012/86848.

La reacción en los compuestos de la fórmula (IX) se puede llevar a cabo en sustancia o en un disolvente, con preferencia, la reacción se lleva a cabo en un disolvente, que está seleccionado de disolventes usuales inertes en las condiciones de reacción imperantes. Se prefieren éteres tales como, por ejemplo, éter diisopropílico, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, éter ter.-butilmetílico; hidrocarburos haloalados tales como, por ejemplo, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; nitrilos tales como, por ejemplo, acetonitrilo o propionitrilo; hidrocarburos aromáticos tales como, por ejemplo, tolueno o xileno; disolventes polares apróticos tales como, por ejemplo, N,N-dimetilformamida o N-metilpirrolidona o compuestos con contenido de nitrógeno tales como, por ejemplo, piridina.

La reacción se puede llevar a cabo en presencia de un agente de condensación, de un ácido, de una base o de un agente de cloración.

Los ejemplos de agentes de condensación apropiados son carbodiimidas tales como clorhidrato de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida (EDCI) o 1,3-diciclohexilcarbodiimida; anhídridos tales como anhídrido de ácido acético, anhídrido de ácido trifluoroacético; una mezcla de trifenilfosfina, de una base y tetracloruro de carbono o una mezcla de trifenilfosfina y un diéster azoico tal como, por ejemplo, ácido dietilazodicarboxílico.

Los ejemplos de ácidos apropiados, que se pueden usar en la reacción descrita, son ácidos sulfónicos tales como ácido para-toluensulfónico; ácidos carboxílicos tales como ácido acético o ácidos polifosfóricos.

Los ejemplos de bases apropiadas son heterociclos con contenido de nitrógeno tales como piridina, picolina, 2,6-lutidina, 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-7-undeceno (DBU); aminas terciarias tales como trietilamina y N,N-diisopropiletilamina; bases inorgánicas tales como fosfato de potasio, carbonato de potasio e hidruro de sodio.

Un ejemplo de un agente de cloración apropiado es oxiclорuro de fósforo.

La reacción se puede llevar a cabo al vacío, a presión normal o a sobrepresión y a temperaturas de 0 °C a 200 °C.

Etapa c)

Los compuestos de la fórmula (I), en donde n representa 0, se pueden preparar por reacción de los compuestos intermediarios de la fórmula (IX) con los compuestos intermediarios de la fórmula (X) en presencia de una base.

Los derivados de mercaptano de la fórmula (X) tales como, por ejemplo, metilmercaptano, etilmercaptano o isopropilmercaptano se pueden obtener en comercios o se pueden preparar según métodos conocidos, por ejemplo, análogamente a los procedimientos descritos en los documentos US2006/25633, US2006/111591, US2820062, Chemical Communications, **13** (2000), 1163-1164 o Journal of the American Chemical Society, **44** (1922), p. 1329.

La reacción en los compuestos de la fórmula (I), en donde n representa 0, se puede llevar a cabo en sustancia o en un disolvente, con preferencia, la reacción se lleva a cabo en un disolvente, que está seleccionado de disolventes

usuales inertes en las condiciones de reacción imperantes. Se prefieren éteres tales como, por ejemplo, éter diisopropílico, dioxano, tetrahydrofurano, 1,2-dimetoxietano, éter ter.-butilmetílico; nitrilos tales como, por ejemplo, acetonitrilo o propionitrilo; hidrocarburos aromáticos tales como, por ejemplo, tolueno o xileno; disolventes polares apróticos tales como, por ejemplo, N,N-dimetilformamida, N-metilpirrolidona o dimetilsulfóxido.

- 5 Los ejemplos de bases apropiadas son bases inorgánicas del grupo compuesto por acetatos, fosfatos y carbonatos de metales alcalinos o alcalinotérreos. Se prefieren en este caso carbonato de cesio, carbonato de sodio y carbonato de potasio. Otras bases apropiadas son hidruros de metal alcalino tales como, por ejemplo, hidruro de sodio.

La reacción se puede llevar a cabo al vacío, a presión normal o a sobrepresión y a temperaturas de 0 °C a 200 °C.

En la reacción descrita, X¹ representa preferentemente un átomo de flúor o cloro.

10 Etapa d)

Los compuestos de la fórmula (I), en donde A³ representa oxígeno y n representa 1, se pueden preparar por oxidación de los compuestos de la fórmula (I), en donde n representa 0. La oxidación se lleva a cabo, en general, en un disolvente que está seleccionado de disolventes usuales inertes en las condiciones de reacción imperantes. Se prefieren hidrocarburos haloados tales como, por ejemplo, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; alcoholes tales como metanol o etanol; ácido fórmico, ácido acético, ácido propiónico o agua.

Los ejemplos de agentes de oxidación apropiados son peróxido de hidrógeno, ácido meta-cloroperbenzoico o peryodato de sodio.

La reacción se puede llevar a cabo al vacío, a presión normal o a sobrepresión y a temperaturas de -20 °C a 120 °C.

Etapa e)

- 20 Los compuestos de la fórmula (I), en donde A³ representa oxígeno y n representa 2, se pueden preparar por oxidación de los compuestos de la fórmula (I), en donde A³ representa oxígeno y n representa 1. La oxidación se lleva a cabo, en general, en un disolvente. Se prefieren hidrocarburos haloados tales como, por ejemplo, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; alcoholes tales como metanol o etanol; ácido fórmico, ácido acético, ácido propiónico o agua.

- 25 Los ejemplos de agentes de oxidación apropiados son peróxido de hidrógeno y ácido meta-cloroperbenzoico.

La reacción se puede llevar a cabo al vacío, a presión normal o a sobrepresión y a temperaturas de -20 °C a 120 °C.

Etapa f)

- 30 Los compuestos de la fórmula (I), en donde A³ representa oxígeno y n representa 2, se pueden preparar también en un proceso de una etapa por oxidación de los compuestos de la fórmula (I), en donde n representa 0. La oxidación se lleva a cabo, en general, en un disolvente. Se prefieren hidrocarburos haloados tales como, por ejemplo, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno; alcoholes tales como metanol o etanol; ácido fórmico, ácido acético, ácido propiónico o agua.

Los ejemplos de agentes de oxidación apropiados son peróxido de hidrógeno y ácido meta-cloroperbenzoico.

La reacción se puede llevar a cabo al vacío, a presión normal o a sobrepresión y a temperaturas de -20 °C a 120 °C.

35

Procedimiento G

Los compuestos de la fórmula (I), para los que R³ = es halógeno, se pueden convertir en otros compuestos de la fórmula (I), para los que R³ equivale a otro radical según la definición.

- 40 Los compuestos de la fórmula (I) para los que R³ representa un radical unido a C según la definición de la serie de arilo o hetarilo, se pueden preparar, por ejemplo, a partir de compuestos de la fórmula (I), para los que R³ representa preferentemente halógeno de la serie de cloro o bromo, de acuerdo con métodos conocidos en general (comp. *Chem. Rev.* **1995**, 95, 2457-2483; *Tetrahedron* **2002**, 58, 9633-9695; *Metal-Catalyzed Cross-Coupling Reactions* (Eds.: A. de Meijere, F. Diederich), 2nd ed., Wiley-VCH, Weinheim, **2004**).

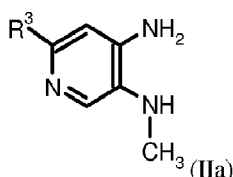
- 45 A modo de ejemplo, los compuestos en los que R³ representa preferentemente cloro o bromo, se hacen reaccionar con ácidos arilborónicos apropiados o sus ésteres de acuerdo con métodos conocidos (comp. WO2010071819) en presencia de catalizadores apropiados de la serie de las sales de metales de transición en los compuestos de la fórmula (I), en los que R³ representa un radical de la serie arilo. Como catalizadores de acoplamiento se tienen en cuenta, por ejemplo, con preferencia, catalizadores de paladio tales como [1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno]dicloropaladio (II) o tetrakis(trifenilfosfina)paladio. Como agentes auxiliares de reacción
- 50 básicos apropiados para la realización del procedimiento se usan preferentemente carbonatos de sodio o de potasio.

Los ácidos (hetero)arilborónicos o ésteres de ácido (hetero)arilborónicos apropiados se conocen en parte y/o se pueden obtener en comercios o bien se pueden preparar de acuerdo con métodos conocidos en general (comp. *Boronic Acids* (Eds.: D. G. Hall), 2nd ed., Wiley-VCH, Weinheim, **2011**).

La preparación de compuestos de la fórmula (I), en los que R³ representa un hetarilo unido con N como, por ejemplo, imidazol-1-ilo y pirazol-1-ilo, se puede llevar a cabo según métodos conocidos en la literatura (ver, por ejemplo, Journal of Organic Chemistry (2010), 69, 5578) preferentemente en presencia yoduro de cobre (I) y agentes auxiliares de reacción básicos como, por ejemplo, *trans*-N,N'-dimetilciclohexan-1,2-diamina y carbonato de potasio, en un disolvente o diluyente apropiado. Como disolventes o diluyentes se tienen en cuenta todos los disolventes orgánicos inertes, por ejemplo, hidrocarburos alifáticos o aromáticos. Preferentemente se usa tolueno.

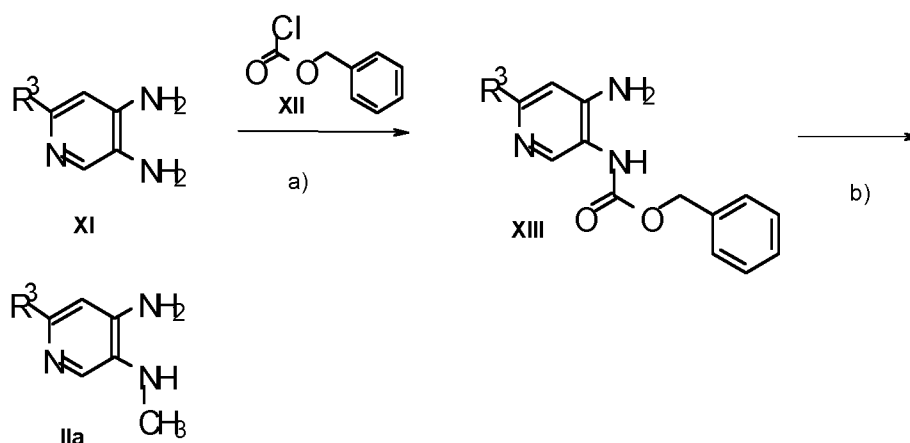
10 Los compuestos de la fórmula (II) son parcialmente nuevos.

Los compuestos de fórmula (IIa) son nuevos.



en la que R^3 representa C_2F_5 .

15 Procedimiento H



El radical R^3 tiene los significados antes descritos.

Etapas a)

Los compuestos de la fórmula (XIII) se pueden preparar análogamente a los procedimientos descritos en el documento WO2005/55928 o Journal of Medicinal Chemistry, **48** (2005), p. 6128-6139 por reacción de compuestos de la fórmula (XI) con bencilclorocarbonato (éster bencílico de ácido clorofórmico) de la fórmula (XII) por ejemplo, en presencia de una base.

Los compuestos de la fórmula (XI) se pueden obtener en comercios o se pueden preparar según métodos conocidos, por ejemplo, análogamente a los procedimientos descritos en los documentos WO2012/3576, WO2007/47793 o WO2006/65703.

La reacción en los compuestos de la fórmula (XIII) se puede llevar a cabo en sustancia o en un disolvente, con preferencia, la reacción se lleva a cabo en un disolvente, que está seleccionado de disolventes usuales inertes en las condiciones de reacción imperantes. Se prefieren éteres tales como, por ejemplo, éter diisopropílico, dioxano, tetrahydrofurano, 1,2-dimetoxietano, éter ter.-butilmetílico; nitrilos tales como, por ejemplo, acetonitrilo o propionitrilo o hidrocarburos aromáticos tales como, por ejemplo, tolueno o xileno;

Los ejemplos de bases apropiadas son bases inorgánicas del grupo compuesto por acetatos, fosfatos y carbonatos de metales alcalinos o alcalinotérreos. Se prefieren en este caso carbonato de cesio, carbonato de sodio y carbonato de potasio.

La reacción se puede llevar a cabo al vacío, a presión normal o a sobrepresión y a temperaturas de 0 °C a 120 °C.

Etapa b)

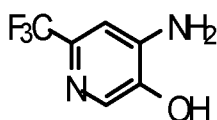
Los compuestos de la fórmula (IIa) se pueden preparar por reducción de los compuestos de la fórmula (XIII), por ejemplo, análogamente a los procedimientos descritos en *Journal of Heterocyclic Chemistry*, **22** (1985), p. 313-318.

- 5 Un ejemplo de un agente de reducción apropiado es un hidruro de litio y aluminio.

La reacción en los compuestos de la fórmula (IIa) se puede llevar a cabo en sustancia o en un disolvente, con preferencia, la reacción se lleva a cabo en un disolvente, que está seleccionado de disolventes usuales inertes en las condiciones de reacción imperantes. Se prefieren éteres tales como, por ejemplo, éter dietílico, éter diisopropílico, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano o éter ter.-butilmetílico.

- 10 La reacción se puede llevar a cabo al vacío, a presión normal o a sobrepresión y a temperaturas de 0 °C a 100 °C.

Nuevo es también el compuesto de la fórmula (II-02)



Procedimientos y usos

- 15 La invención también se refiere a métodos para controlar plagas animales, en donde compuestos de la fórmula (I) se dejan actuar sobre plagas animales y/o su hábitat. El control de las plagas animales se lleva a cabo, con preferencia, en agricultura y foresta y en la protección de materiales. Con preferencia se excluyen de esto los métodos para el tratamiento quirúrgico o terapéutico del cuerpo humano o animal y métodos de diagnóstico se lleva a cabo sobre el cuerpo humano o animal.

- 20 La invención también se refiere al uso de los compuestos de la fórmula (I) como pesticidas, en especial agentes de protección de cultivos.

En el contexto de la presente solicitud, el término "pesticida" también comprende siempre la expresión "agente de protección de cultivos".

- 25 Los compuestos de la fórmula (I), dadas una buena tolerancia en plantas, una favorable toxicidad de homeotermos y una buena compatibilidad ambiental, son apropiados para proteger plantas y órganos de plantas contra factores de estrés biótico y abiótico, para incrementar los rendimientos de cosecha, para mejorar la calidad del material cosechado y para controlar las plagas animales, en especial insectos, arácnidos, helmintos, nematodos y moluscos, que se encuentran en agricultura, en horticultura, en ganadería, en cultivos acuáticos, en forestas, en jardines e instalaciones de ocio, en la protección de productos almacenados y de materiales y en el sector de higiene. Se pueden usar, con preferencia, como pesticidas. Son efectivos contra especies normalmente sensibles y resistentes y contra todos o algunos estadios de desarrollo. Las plagas antes mencionadas incluyen:

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

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

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

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

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

- del orden de Coleoptera, por ejemplo, *Acalymma vittatum*, *Acanthoscelides obtectus*, *Adoretus* spp., *Agelastica alni*,
 5 *Agriotes* spp., por ejemplo, *Agriotes linneatus*, *Agriotes mancus*, *Alphitobius diaperinus*, *Amphimallon solstitialis*,
Anobium punctatum, *Anoplophora* spp., *Anthonomus* spp., por ejemplo, *Anthonomus grandis*, *Anthrenus* spp., *Apion*
 spp., *Apogonia* spp., *Atomaria* spp., por ejemplo, *Atomaria linearis*, *Attagenus* spp., *Baris caerulescens*, *Bruchidius*
obtectus, *Bruchus* spp., por ejemplo, *Bruchus pisorum*, *Bruchus rufimanus*, *Cassida* spp., *Cerotoma trifurcata*,
 10 *Ceutorrhynchus* spp., por ejemplo, *Ceutorrhynchus assimilis*, *Ceutorrhynchus quadridens*, *Ceutorrhynchus rapae*,
Chaetocnema spp., por ejemplo, *Chaetocnema confinis*, *Chaetocnema denticulata*, *Chaetocnema ectypa*, *Cleonus*
mendicus, *Conoderus* spp., *Cosmopolites* spp., por ejemplo, *Cosmopolites sordidus*, *Costelytra zealandica*, *Ctenicera*
 spp., *Curculio* spp., por ejemplo, *Curculio caryae*, *Curculio caryatrypes*, *Curculio obtusus*, *Curculio sayi*, *Cryptolestes*
ferrugineus, *Cryptolestes pusillus*, *Cryptorhynchus lapathi*, *Cryptorhynchus mangiferae*, *Cylindrocopturus* spp.,
Cylindrocopturus adpersus, *Cylindrocopturus furnissi*, *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp., por ejemplo, *Diabrotica*
 15 *balteata*, *Diabrotica barberi*, *Diabrotica undecimpunctata howardi*, *Diabrotica undecimpunctata undecimpunctata*,
Diabrotica virgifera virgifera, *Diabrotica virgifera zea*, *Dichrocrocis* spp., *Diadisa armigera*, *Diloboderus* spp.,
Epilachna spp., por ejemplo, *Epilachna borealis*, *Epilachna varivestis*, *Epitrix* spp., por ejemplo, *Epitrix cucumeris*,
Epitrix fuscata, *Epitrix hirtipennis*, *Epitrix subcrinita*, *Epitrix tuberis*, *Faustinus* spp., *Gibbium psyllodes*, *Gnathocerus*
cornutus, *Hellula undalis*, *Heteronychus arator*, *Heteronyx* spp., *Hylamorpha elegans*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera*
 20 *postica*, *Hypomeces squamosus*, *Hypothenemus* spp., por ejemplo, *Hypothenemus hampei*, *Hypothenemus obscurus*,
Hypothenemus pubescens, *Lachnosterna consanguinea*, *Lasioderma serricorne*, *Latheticus oryzae*, *Lathridius* spp.,
Lema spp., *Leptinotarsa decemlineata*, *Leucoptera* spp., por ejemplo, *Leucoptera coffeella*, *Lissorhoptrus oryzophilus*,
Lixus spp., *Luperomorpha xanthodera*, *Luperodes* spp., *Lyctus* spp., *Megascelis* spp., *Melanotus* spp., por ejemplo,
Melanotus longulus oregonensis, *Meligethes aeneus*, *Melolontha* spp., por ejemplo, *Melolontha melolontha*, *Migdolus*
 25 spp., *Monochamus* spp., *Naupactus xanthographus*, *Necrobia* spp., *Niptus hololeucus*, *Oryctes rhinoceros*,
Oryzaephilus surinamensis, *Oryzaphagus oryzae*, *Otiorynchus* spp., por ejemplo, *Otiorynchus cribricollis*,
Otiorynchus ligustici, *Otiorynchus ovatus*, *Otiorynchus rugosostriatus*, *Otiorynchus sulcatus*, *Oxycetonia jucunda*,
Phaedon cochleariae, *Phyllophaga* spp., *Phyllophaga helleri*, *Phyllotreta* spp., por ejemplo, *Phyllotreta armoraciae*,
Phyllotreta pusilla, *Phyllotreta ramosa*, *Phyllotreta striolata*, *Popillia japonica*, *Premnotrypes* spp., *Prostephanus*
 30 *truncatus*, *Psylliodes* spp., por ejemplo, *Psylliodes affinis*, *Psylliodes chrysocephala*, *Psylliodes punctulata*, *Ptinus* spp.,
Rhizobius ventralis, *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus* spp., por ejemplo, *Sitophilus granarius*, *Sitophilus linearis*,
Sitophilus oryzae, *Sitophilus zeamais*, *Sphenophorus* spp., *Stegobium paniceum*, *Sternechus* spp., por ejemplo,
Sternechus paludatus, *Symphyletes* spp., *Tanymecus* spp., por ejemplo, *Tanymecus dilaticollis*, *Tanymecus indicus*,
Tanymecus palliatus, *Tenebrio molitor*, *Tenebrioides mauritanicus*, *Tribolium* spp., por ejemplo, *Tribolium auctax*,
 35 *Tribolium castaneum*, *Tribolium confusum*, *Trogoderma* spp., *Tychius* spp., *Xylotrechus* spp., *Zabrus* spp., por ejemplo,
Zabrus tenebrioides;

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

- del orden de Hemiptera, por ejemplo, *Acizzia acaciaebaileyanae*, *Acizzia dodonaeae*, *Acizzia uncatoides*, *Acrida turrita*,
Acyrtosiphon spp., por ejemplo, *Acyrtosiphon pisum*, *Acrogonia* spp., *Aeneolamia* spp., *Agonoscena* spp., *Aleyrodes*
proletella, *Aleurolobus barodensis*, *Aleurothrix floccosus*, *Allocaudata malayensis*, *Amrasca* spp., por ejemplo,
Amrasca bigutulla, *Amrasca devastans*, *Anuraphis cardui*, *Aonidiella* spp., por ejemplo, *Aonidiella aurantii*, *Aonidiella*
 60 *citrina*, *Aonidiella inornata*, *Aphanostigma piri*, *Aphis* spp., por ejemplo, *Aphis citricola*, *Aphis craccivora*, *Aphis fabae*,
Aphis forbesi, *Aphis glycines*, *Aphis gossypii*, *Aphis hederiae*, *Aphis illinoisensis*, *Aphis middletoni*, *Aphis nasturtii*, *Aphis*
nerii, *Aphis pomi*, *Aphis spiraeicola*, *Aphis viburniphila*, *Arboridia apicalis*, *Arytainilla* spp., *Aspidiella* spp., *Aspidiotus*
 spp., por ejemplo, *Aspidiotus nerii*, *Atanus* spp., *Aulacorthum solani*, *Bemisia tabaci*, *Blastopsylla occidentalis*,

- Boreioglycaspis melaleucae, Brachycaudus helichrysi, Brachycolus spp., Brevicoryne brassicae, Cacopsylla spp., por ejemplo, Cacopsylla pyricola, Calligypona marginata, Carneiocephala fulgida, Ceratovacuna lanigera, Cercopidae, Ceroplastes spp., Chaetosiphon fragaefolii, Chionaspis tegalensis, Chlorita onukii, Chondracris rosea, Chromaphis juglandicola, Chrysomphalus ficus, Cicadulina mbila, Cocomytilus halli, Coccus spp., por ejemplo, Coccus hesperidum, Coccus longulus, Coccus pseudomagnoliarum, Coccus viridis, Cryptomyzus ribis, Cryptoneossa spp., Ctenarytaina spp., Dalbulus spp., Dialeurodes citri, Diaphorina citri, Diaspis spp., Drosicha spp., Dysaphis spp., por ejemplo, Dysaphis apiifolia, Dysaphis plantaginea, Dysaphis tulipae, Dysmicoccus spp., Empoasca spp., por ejemplo, Empoasca abrupta, Empoasca fabae, Empoasca maligna, Empoasca solana, Empoasca stevensi, Eriosoma spp., por ejemplo, Eriosoma americanum, Eriosoma lanigerum, Eriosoma pyricola, Erythroneura spp., Eucalyptolyma spp., Euphyllura spp., Euscelis bilobatus, Ferrisia spp., Geococcus coffeae, Glycaspis spp., Heteropsylla cubana, Heteropsylla spinulosa, Homalodisca coagulata, Hyalopterus arundinis, Hyalopterus pruni, Icerya spp., por ejemplo, Icerya purchasi, Idiocerus spp., Idioscopus spp., Laodelphax striatellus, Lecanium spp., por ejemplo, Lecanium corni (= Parthenolecanium corni), Lepidosaphes spp., por ejemplo, Lepidosaphes ulmi, Lipaphis erysimi, Lycorma delicatula, Macrosiphum spp., por ejemplo, Macrosiphum euphorbiae, Macrosiphum lillii, Macrosiphum rosae, Macrosteles facifrons, Mahanarva spp., Melanaphis sacchari, Metcalfiella spp., Metcalfa pruinosa, Metopolophium dirhodum, Monellia costalis, Monelliopsis pecanis, Myzus spp., por ejemplo, Myzus ascalonicus, Myzus cerasi, Myzus ligustri, Myzus ornatus, Myzus persicae, Myzus nicotianae, Nasonovia ribisnigri, Nephotettix spp., por ejemplo, Nephotettix cincticeps, Nephotettix nigropictus, Nilaparvata lugens, Oncometopia spp., Orthezia praelonga, Oxya chinensis, Pachypsylla spp., Parabemisia myricae, Paratrioza spp., por ejemplo, Paratrioza cockerelli, Parlatoria spp., Pemphigus spp., por ejemplo, Pemphigus bursarius, Pemphigus populivenae, Peregrinus maidis, Phenacoccus spp., por ejemplo, Phenacoccus madeirensis, Phloeomyzus passerinii, Phorodon humuli, Phylloxera spp., por ejemplo, Phylloxera devastatrix, Phylloxera notabilis, Pinnaspis aspidistrae, Planococcus spp., por ejemplo, Planococcus citri, Prosopidopsylla flava, Protopulvinaria pyriformis, Pseudaulacaspis pentagona, Pseudococcus spp., por ejemplo, Pseudococcus calceolariae, Pseudococcus comstocki, Pseudococcus longispinus, Pseudococcus maritimus, Pseudococcus viburni, Psyllopsis spp., Psylla spp., por ejemplo, Psylla buxi, Psylla mali, Psylla pyri, Pteromalus spp., Pyrrilla spp., Quadraspidiotus spp., por ejemplo, Quadraspidiotus juglansregiae, Quadraspidiotus ostreaeformis, Quadraspidiotus perniciosus, Quesada gigas, Rastrococcus spp., Rhopalosiphum spp., por ejemplo, Rhopalosiphum maidis, Rhopalosiphum oxyacanthae, Rhopalosiphum padi, Rhopalosiphum rufiabdominale, Saissetia spp., por ejemplo, Saissetia coffeae, Saissetia miranda, Saissetia neglecta, Saissetia oleae, Scaphioideus titanus, Schizaphis graminum, Selenaspidus articulatus, Sitobion avenae, Sogata spp., Sogatella furcifera, Sogatodes spp., Stictocephala festina, Siphoninus phillyreae, Tenalaphara malayensis, Tetragonocephala spp., Tinocallis caryaefoliae, Tomaspis spp., Toxoptera spp., por ejemplo, Toxoptera aurantii, Toxoptera citricidus, Trialeurodes vaporariorum, Trioza spp., por ejemplo, Trioza diospyri, Typhlocyba spp., Unaspis spp., Viteus vitifolii, Zyginia spp.;
- del suborden de Heteroptera, por ejemplo, Anasa tristis, Antestiopsis spp., Boisea spp., Blissus spp., Calocoris spp., Campylomma livida, Cavalerius spp., Cimex spp., por ejemplo, Cimex adjunctus, Cimex hemipterus, Cimex lectularius, Cimex pilosellus, Collaria spp., Creontiades dilutus, Dasynus piperis, Dichelops furcatus, Diconocoris hewetti, Dysdercus spp., Euschistus spp., por ejemplo, Euschistus heros, Euschistus servus, Euschistus tristigmus, Euschistus variolarius, Eurygaster spp., Halyomorpha halys, Heliopeltis spp., Horcias nobilellus, Leptocoris spp., Leptocoris varicornis, Leptoglossus occidentalis, Leptoglossus phyllopus, Lygocoris spp., por ejemplo, Lygocoris pabulinus, Lygus spp., por ejemplo, Lygus elisus, Lygus hesperus, Lygus lineolaris, Macropes excavatus, Monalonion atratum, Nezara spp., por ejemplo, Nezara viridula, Oebalus spp., Piesma quadrata, Piezodorus spp., por ejemplo, Piezodorus guildinii, Psallus spp., Pseudacysta perseae, Rhodnius spp., Sahlbergella singularis, Scaptocoris castanea, Scotinophora spp., Stephanitis nashi, Tibraca spp., Triatoma spp.;
- del orden de Hymenoptera, por ejemplo, Acromyrmex spp., Athalia spp., por ejemplo, Athalia rosae, Atta spp., Diprion spp., por ejemplo, Diprion similis, Hoplocampa spp., por ejemplo, Hoplocampa cookei, Hoplocampa ensayoudinea, Lasius spp., Linepithema humile, Monomorium pharaonis, Sirex spp., Solenopsis invicta, Tapinoma spp., Urocerus spp., Vespa spp., por ejemplo, Vespa crabro, Xeris spp.;
- del orden de Isopoda, por ejemplo, Armadillidium vulgare, Oniscus asellus, Porcellio scaber;
- del orden de Isoptera, por ejemplo, Coptotermes spp., por ejemplo, Coptotermes formosanus, Cornitermes cumulans, Cryptotermes spp., Incisitermes spp., Microtermes obesi, Odontotermes spp., Reticulitermes spp., por ejemplo, Reticulitermes flavipes, Reticulitermes hesperus;
- del orden de Lepidoptera, por ejemplo, Achroia grisella, Acronicta major, Adoxophyes spp., por ejemplo, Adoxophyes orana, Aedia leucomelas, Agrotis spp., por ejemplo, Agrotis segetum, Agrotis ipsilon, Alabama spp., por ejemplo, Alabama argillacea, Amyelopsis transitella, Anarsia spp., Anticarsia spp., por ejemplo, Anticarsia gemmatilis, Argyroploce spp., Barathra brassicae, Borbo cinnara, Bucculatrix thurberiella, Bupalus piniarius, Busseola spp., Cacoecia spp., Caloptilia theivora, Capua reticulana, Carpocapsa pomonella, Carposina niponensis, Cheimantobia brumata, Chilo spp., por ejemplo, Chilo plejadellus, Chilo suppressalis, Choristoneura spp., Clysia ambiguella, Cnaphalocerus spp., Cnaphalocrocis medinalis, Cnephasia spp., Conopomorpha spp., Conotrachelus spp., Copitarsia spp., Cydia spp., por ejemplo, Cydia nigricana, Cydia pomonella, Dalaca noctuides, Diaphania spp., Diatraea saccharalis, Earias spp., Ecdytolopha aurantium, Elasmopalpus lignosellus, Eldana saccharina, Ephestia spp., por ejemplo, Ephestia elutella, Ephestia kuehniella, Epinotia spp., Epiphyas postvittana, Etiella spp., Eulia spp., Eupoecilia ambiguella, Euproctis spp., por ejemplo, Euproctis chrysorrhoea, Euxoa spp., Feltia spp., Galleria mellonella,

- Gracillaria spp., Grapholita spp., por ejemplo, Grapholita molesta, Grapholita prunivora, Hedylepta spp., Helicoverpa spp., por ejemplo, Helicoverpa armigera, Helicoverpa zea, Heliothis spp., por ejemplo, Heliothis virescens, Hofmannophila pseudospretella, Homoeosoma spp., Homona spp., Hyponomeuta padella, Kakivoria flavofasciata, Laphygma spp., Leucinodes orbonalis, Leucoptera spp., por ejemplo, Leucoptera coffeella, Lithocolletis spp., por ejemplo, Lithocolletis blancardella, Lithophane antennata, Lobesia spp., por ejemplo, Lobesia botrana, Loxagrotis albicosta, Lymantria spp., por ejemplo, Lymantria dispar, Lyonetia spp., por ejemplo, Lyonetia clerkella, Malacosoma neustria, Maruca ensayoulalis, Mamestra brassicae, Melanitis leda, Mocis spp., Monopis obviella, Mythimna separata, Nemapogon cloacellus, Nymphula spp., Oiketicus spp., Oria spp., Orthaga spp., Ostrinia spp., por ejemplo, Ostrinia nubilalis, Oulema melanopus, Oulema oryzae, Panolis flammea, Parnara spp., Pectinophora spp., por ejemplo, Pectinophora gossypiella, Perileucoptera spp., Phthorimaea spp., por ejemplo, Phthorimaea operculella, Phyllocnistis citrella, Phyllonorycter spp., por ejemplo, Phyllonorycter blancardella, Phyllonorycter crataegella, Pieris spp., por ejemplo, Pieris rapae, Platynota stultana, Plodia interpunctella, Plusia spp., Plutella xylostella (= Plutella maculipennis), Prays spp., Prodenia spp., Protoperce spp., Pseudaletia spp., por ejemplo, Pseudaletia unipuncta, Pseudoplusia includens, Pyrausta nubilalis, Rachiplusia nu, Schoenobius spp., por ejemplo, Schoenobius bipunctifer, Scirpophaga spp., por ejemplo, Scirpophaga innotata, Scotia segetum, Sesamia inferens, Sparganothis spp., Spodoptera spp., por ejemplo, Spodoptera eridania, Spodoptera exigua, Spodoptera frugiperda, Spodoptera praefica, Stathmopoda spp., Stomopteryx subsecivella, Synanthedon spp., Tecia solanivora, Thermesia gemmatilis, Tinea cloacella, Tinea pellionella, Tineola bisselliella, Tortrix spp., Trichophaga tapetzella, Trichoplusia spp., por ejemplo, Trichoplusia ni, Tryporyza incertulas, Tuta absoluta, Virachola spp.;
- 20 del orden de Orthoptera o Saltatoria, por ejemplo, Acheta domesticus, Dichroplus spp., Gryllotalpa spp., por ejemplo, Gryllotalpa gryllotalpa, Hieroglyphus spp., Locusta spp., por ejemplo, Locusta migratoria, Melanoplus spp., por ejemplo, Melanoplus devastator, Paratlanticus ussuriensis, Schistocerca gregaria;
- del orden de Phthiraptera, por ejemplo, Damalinia spp., Haematopinus spp., Linognathus spp., Pediculus spp., Phylloxera vastatrix, Phthirus pubis, Trichodectes spp.;
- 25 del orden de Psocoptera, por ejemplo, Lepinotus spp., Liposcelis spp.;
- del orden de Siphonaptera, por ejemplo, Ceratophyllus spp., Ctenocephalides spp., por ejemplo, Ctenocephalides canis, Ctenocephalides felis, Pulex irritans, Tunga penetrans, Xenopsylla cheopis;
- del orden de Thysanoptera, por ejemplo, Anaphothrips obscurus, Baliothrips biformis, Drepanothrips reuteri, Enneothrips flavens, Frankliniella spp., por ejemplo, Frankliniella fusca, Frankliniella occidentalis, Frankliniella schultzei, Frankliniella tritici, Frankliniella vaccinii, Frankliniella williamsi, Heliothrips spp., Hercinothrips femoralis, Rhipiphorotheus cruentatus, Scirtothrips spp., Taeniothrips cardamomi, Thrips spp., por ejemplo, Thrips palmi, Thrips tabaci;
- 30 del orden de Zygentoma (= Thysanura), por ejemplo, Ctenolepisma spp., Lepisma saccharina, Lepismodes inquilinus, Thermobia domestica;
- 35 de la clase de Symphyla, por ejemplo, Scutigera spp., por ejemplo, Scutigera immaculata;
- plagas del filo de Mollusca, por ejemplo, de la clase de Bivalvia, por ejemplo, Dreissena spp.,
- y también de la clase de Gastropoda, por ejemplo, Arion spp., por ejemplo, Arion ater rufus, Biomphalaria spp., Bulinus spp., Deroceras spp., por ejemplo, Deroceras laeve, Galba spp., Lymnaea spp., Oncomelania spp., Pomacea spp., Succinea spp.;
- 40 parásitos animales y humanos de las cepas de Platyhelminthes y Nematoda, por ejemplo, Aelurostrongylus spp., Amidostomum spp., Ancylostoma spp., Angiostrongylus spp., Anisakis spp., Anoplocephala spp., Ascaris spp., Ascaridia spp., Baylisascaris spp., Brugia spp., Bunostomum spp., Capillaria spp., Chabertia spp., Clonorchis spp., Cooperia spp., Crenosoma spp., Cyathostoma spp., Dicrocoelium spp., Dictyocaulus spp., Diphylobothrium spp., Dipylidium spp., Dirofilaria spp., Dracunculus spp., Echinococcus spp., Echinostoma spp., Enterobius spp., Eucoleus spp., Fasciola spp., Fascioloides spp., Fasciolopsis spp., Filaroides spp., Gongylonema spp., Gyrodactylus spp., Habronema spp., Haemonchus spp., Heligmosomoides spp., Heterakis spp., Hymenolepis spp., Hyostrongylus spp., Litomosoides spp., Loa spp., Metastrongylus spp., Metorchis spp., Mesocostoides spp., Moniezia spp., Muellerius spp., Necator spp., Nematodirus spp., Nippostrongylus spp., Oesophagostomum spp., Ollulanus spp., Onchocerca spp., Opisthorchis spp., Oslerus spp., Ostertagia spp., Oxyuris spp., Paracapillaria spp., Parafilaria spp., Paragonimus spp., Paramphistomum spp., Paranoplocephala spp., Parascaris spp., Passalurus spp., Protostrongylus spp., Schistosoma spp., Setaria spp., Spirocerca spp., Stephanofilaria spp., Stephanurus spp., Strongyloides spp., Strongylus spp., Syngamus spp., Taenia spp., Teladorsagia spp., Thelazia spp., Toxascaris spp., Toxocara spp., Trichinella spp., Trichobilharzia spp., Trichostrongylus spp., Trichuris spp., Uncinaria spp., Wuchereria spp.;
- 55 plagas de plantas del filo de Nematoda, es decir, nematodos fitoparásitos, en especial, Aglenchus spp., por ejemplo, Aglenchus agricola, Anguina spp., por ejemplo, Anguina tritici, Aphelenchoides spp., por ejemplo, Aphelenchoides arachidis, Aphelenchoides fragariae, Belonolaimus spp., por ejemplo, Belonolaimus gracilis, Belonolaimus longicaudatus, Belonolaimus nortoni, Bursaphelenchus spp., por ejemplo, Bursaphelenchus cocophilus,

Bursaphelenchus eremus, Bursaphelenchus xylophilus, Cacopaurus spp., por ejemplo, Cacopaurus pestis, Criconemella spp., por ejemplo, Criconemella curvata, Criconemella onoensis, Criconemella ornata, Criconemella rusium, Criconemella xenoplax (= Mesocriconema xenoplax), Criconemoides spp., por ejemplo, Criconemoides ferniae, Criconemoides onoense, Criconemoides ornatum, Ditylenchus spp., por ejemplo, Ditylenchus dipsaci, Dolichodorus spp., Globodera spp., por ejemplo, Globodera pallida, Globodera rostochiensis, Helicotylenchus spp., por ejemplo, Helicotylenchus dihystra, Hemicriconemoides spp., Hemicyclophora spp., Heterodera spp., por ejemplo, Heterodera avenae, Heterodera glycines, Heterodera schachtii, Hoplolaimus spp., Longidorus spp., por ejemplo, Longidorus africanus, Meloidogyne spp., por ejemplo, Meloidogyne chidosodi, Meloidogyne fallax, Meloidogyne hapla, Meloidogyne incognita, Meloinema spp., Nacobbus spp., Neotylenchus spp., Paraphelenchus spp., Paratrichodorus spp., por ejemplo, Paratrichodorus minor, Pratylenchus spp., por ejemplo, Pratylenchus penetrans, Pseudohalenchus spp., Psilenchus spp., Punctodera spp., Quinisulcius spp., Radopholus spp., por ejemplo, Radopholus citrophilus, Radopholus similis, Rotylenchulus spp., Rotylenchus spp., Scutellonema spp., Subanguina spp., Trichodorus spp., por ejemplo, Trichodorus obtusus, Trichodorus primitivus, Tylenchorhynchus spp., por ejemplo, Tylenchorhynchus annulatus, Tylenchulus spp., por ejemplo, Tylenchulus semipenetrans, Xiphinema spp., por ejemplo, Xiphinema index.

Además, es posible controlar, del subreino de Protozoa, del orden de Coccidia, por ejemplo, Eimeria spp.

Los compuestos de la fórmula (I) también se puede usar dado el caso en determinadas concentraciones o tasas de aplicación como herbicidas, protectores, reguladores del crecimiento o agentes para mejorar las propiedades de las plantas, como microbicidas o gametocidas, por ejemplo, como fungicidas, antimicóticos, bactericidas, viricidas (que incluyen agentes contra viroides) o como agentes contra MLO (organismos de tipo micoplasma) y RLO (organismos de tipo rickettsia). De ser apropiado, también se pueden usar como intermediarios o precursores para la síntesis de otros compuestos activos.

Formulaciones

La presente invención también se refiere a formulaciones y formas de uso preparadas a partir de ellas como pesticidas, por ejemplo, licores de remojado, inmersión y pulverización, que comprenden al menos un compuesto de la fórmula (I). En algunos casos, las formas de uso comprenden también pesticidas y/o adyuvantes que mejoran la acción, tales como penetrantes, por ejemplo, aceites vegetales, por ejemplo, aceite de colza, aceite de girasol, aceites minerales, por ejemplo, aceites de parafina, ésteres de alquilo de ácidos grasos vegetales, por ejemplo, éster metílico de aceite de colza o éster metílico de aceite de soja o alcóxidos de alcohol y/o esparcidores, por ejemplo, alquilsiloxanos y/o sales, por ejemplo, sales de amonio o fosfonio orgánicas o inorgánicas, por ejemplo, sulfato de amonio o hidrógeno-fosfato de diamonio y/o promotores de la retención, por ejemplo, sulfosuccinato de dioctilo o polímeros de hidroxipropilguar y/o humectantes, por ejemplo, glicerol y/o fertilizantes, por ejemplo, fertilizantes que contienen amonio, potasio o fósforo.

Las formulaciones convencionales son, por ejemplo, líquidos solubles en agua (SL), concentrados en emulsión (EC), emulsiones en agua (EW), concentrados en suspensión (SC, SE, FS, OD), gránulos dispersables en agua (WG), gránulos (GR) y concentrados en cápsula (CS); estos y otros tipos de formulación posibles se describen, por ejemplo, por Crop Life International y en Pesticide Specifications, Manual on development and use of FAO and WHO specifications for pesticides, FAO Plant Production and Protection Papers – 173, preparados por FAO/WHO Joint Meeting on Pesticide Specifications, 2004, ISBN: 9251048576. Las formulaciones, además de uno o varios compuestos de la fórmula (I), (Ia), (Ib) o (Ic), dado el caso comprenden otros principios agroquímicamente activos.

Ellas son preferentemente formulaciones o formas de uso que comprenden auxiliares, por ejemplo, diluyentes, disolventes, promotores de espontaneidad, vehículos, emulsionantes, dispersantes, protectores de heladas, biocidas, espesantes y/u otros auxiliares, por ejemplo, adyuvantes. Un adyuvante en este contexto es un componente que mejora el efecto biológico de la formulación, sin el componente propiamente dicho que tiene cualquier efecto biológico. Los ejemplos de adyuvantes son agentes que promueven la retención, dispersión, unión con la superficie de la hoja o penetración.

Estas formulaciones se preparan de una manera conocida, por ejemplo, mezclando los compuestos de la fórmula (I) con auxiliares tales como, por ejemplo, diluyentes, disolventes y/o portadores sólidos y/u otros auxiliares tales como, por ejemplo, tensioactivos. Las formulaciones se preparan ya sea en instalaciones apropiadas o incluso antes o durante la aplicación.

Los auxiliares usados pueden ser sustancias apropiadas para impartir propiedades especiales, tales como determinadas propiedades físicas, técnicas y/o biológicas a la formulación de los compuestos de la fórmula (I) o las formas de uso preparadas a partir de estas formulaciones (por ejemplo, pesticidas listas para usar tales como licores de pulverización o productos de recubrimiento de semillas).

Los diluyentes apropiados son, por ejemplo, agua, líquidos químicos orgánicos polares y no polares, por ejemplo, de las clases de los hidrocarburos aromáticos y no aromáticos (tales como parafinas, alquilbencenos, alquilnaftalenos, clorobencenos), los alcoholes y polioles (que, de ser apropiado, también pueden ser sustituidos, eterificados y/o esterificados), las cetonas (tales como acetona, ciclohexanona), ésteres (que incluyen grasas y aceites) y (poli)éteres, las aminas, amidas, lactamas (tales como N-alquilpirrolidonas) y lactonas no sustituidas y sustituidas, las sulfonas y

sulfóxidos (tal como dimetilsulfóxido).

Si el extensor usado es agua, también es posible emplear, por ejemplo, disolventes orgánicos como disolventes auxiliares. Esencialmente, los disolventes líquidos apropiados son: compuestos aromáticos tales como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, compuestos aromáticos clorados o hidrocarburos alifáticos clorados tales como clorobencenos, cloroetilenos o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos tales como ciclohexano o parafinas, por ejemplo, fracciones de aceite mineral, aceites minerales y vegetales, alcoholes tales como butanol o glicol y sus éteres y ésteres, cetonas tales como acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona o ciclohexanona, disolventes fuertemente polares tales como dimetilformamida y dimetilsulfóxido y también agua.

En principio, es posible usar todos los disolventes apropiados. Los ejemplos de disolventes apropiados son hidrocarburos aromáticos tales como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, hidrocarburos aromáticos clorados o hidrocarburos alifáticos clorados tales como clorobenceno, cloroetileno o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos tales como ciclohexano, parafinas, fracciones de petróleo, aceites minerales y vegetales, alcoholes, tales como metanol, etanol, isopropanol, butanol o glicol y sus éteres y ésteres, cetonas tales como acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona o ciclohexanona, disolventes fuertemente polares tales como dimetilsulfóxido y agua.

En principio, es posible usar todos los vehículos apropiados. Los vehículos útiles incluyen especialmente: por ejemplo, sales de amonio y minerales naturales molidos tales como caolines, arcillas, talco, tiza, cuarzo, attapulgita, montmorillonita o tierra de diatomeas y materiales sintéticos molidos tales como sílice finamente dividida, alúmina y silicatos naturales o sintéticos, resinas, ceras y/o fertilizantes sólidos. Las mezclas de tales vehículos se pueden usar de mismo modo. Los vehículos de utilidad para gránulos incluyen: por ejemplo, piedras naturales picadas y fraccionadas, tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita y gránulos sintéticos de harinas inorgánicas y orgánicas y también gránulos de material orgánico tales como aserrín, papel, cáscaras de coco, mazorcas de maíz y tallos de tabaco.

También se pueden usar diluyentes gaseosos licuados o disolventes. Los diluyentes o vehículos particularmente apropiados son aquellos que son gaseosos a temperatura ambiente y a presión atmosférica, por ejemplo, gases propelentes en aerosol, tales como halohidrocarburos y también butano, propano, nitrógeno y dióxido de carbono.

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

Otros auxiliares que pueden estar presentes en las formulaciones y las formas de uso derivadas de ellas incluyen tinturas tales como pigmentos inorgánicos, por ejemplo, óxido de hierro, óxido de titanio y azul de Prusia y tinturas orgánicas tales como tintura de alizarina, tinturas azoicas y tinturas de ftalocianina metálica y nutrientes y nutrientes en trazas tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y zinc.

Los componentes adicionales pueden ser estabilizantes, tales como estabilizantes de baja temperatura, conservantes, antioxidantes, fotoestabilizantes u otros agentes que mejoran la estabilidad química y/o física. Los formadores de espuma o antiespumantes también pueden estar presentes.

Además, las formulaciones y las formas de uso derivadas de ellas pueden comprender también, como auxiliares adicionales, espesantes tales como carboximetilcelulosa y polímeros naturales y sintéticos en forma de polvos, gránulos o látex tales como goma arábiga, alcohol polivinílico y acetato de polivinilo o incluso fosfolípidos naturales tales como cefalinas y lecitinas y fosfolípidos sintéticos. Otros posibles auxiliares son aceites minerales y vegetales.

Dado el caso, otros auxiliares pueden estar presentes en las formulaciones y las formas de uso derivadas de ellas. Los ejemplos de tales aditivos incluyen fragancias, coloides protectores, aglutinantes, adhesivos, espesantes, agentes tixotrópicos, penetrantes, promotores de la retención, estabilizantes, secuestrantes, agentes complejizantes, humectantes, dispersantes. En general, los compuestos de la fórmula (I) se pueden combinar con cualquier aditivo sólido o líquido comúnmente usado para fines de formulación.

Los promotores de retención útiles incluyen todas aquellas sustancias que reducen la tensión superficial dinámica, por ejemplo, sulfosuccinato de dioctilo o incremento de la viscoelasticidad, por ejemplo, polímeros de hidroxipropilguar.

Los penetrantes apropiados en el presente contexto son todas aquellas sustancias que se emplean usualmente para mejorar la penetración de principios activos agroquímicos en plantas. Los penetrantes se definen en este contexto por su capacidad de penetrar desde el licor de aplicación (generalmente acuoso) y/o desde el recubrimiento de pulverización en la cutícula de la planta y aumentar así la movilidad de compuestos activos en la cutícula. El método

descrito en la literatura (Baur et al., 1997, Pesticide Science 51, 131-152) se puede usar para determinar su propiedad. Los ejemplos incluyen alcoxilatos de alcohol tales como etoxilato graso de coco (10) o etoxilato de isotridecilo (12), ésteres de ácido graso, por ejemplo, éster metílico de aceite de colza o éster metílico de aceite de soja, alcoxilatos de amina grasos, por ejemplo, etoxilato de tallow amina (15) o sales de amonio y/o de fosfonio, por ejemplo, sulfato de amonio o hidrógeno-fosfato de diamonio.

Las formulaciones comprenden, preferentemente, entre el 0,00000001 y el 98% en peso del respectivo compuesto de la fórmula (I) o, con mayor preferencia, entre el 0,01% y el 95% en peso del compuesto de la fórmula (I), con máxima preferencia, entre el 0,5% y el 90% en peso del compuesto de la fórmula (I), en base al peso de la formulación.

El contenido del compuesto de la fórmula (I) en las formas de uso preparadas a partir de las formulaciones (en especial pesticidas) puede variar dentro de amplios intervalos. La concentración del compuesto de la fórmula (I) en las formas de uso está usualmente entre el 0,00000001 y el 95% en peso, preferentemente, entre el 0,00001 y el 1% en peso, en base al peso de la forma de uso. La aplicación se lleva a cabo de una manera habitual apropiada para las formas de uso.

Mezclas

Los compuestos de la fórmula (I) también se pueden emplear como una mezcla con uno o varios fungicidas, bactericidas, acaricidas, molusquicidas, nematocidas, insecticidas, agentes microbiológicos, especies beneficiosas, herbicidas, fertilizantes, repelentes de insectos, fitotónicos, esterilizantes, protectores, productos semioquímicos y/o reguladores del crecimiento de plantas apropiados, a fin de, por ejemplo, ampliar así el espectro de acción, prolongar la duración de la acción, incrementar la tasa de acción, prevenir la repulsión o prevenir la evolución de la resistencia. Además, las combinaciones de principios activos pueden mejorar el crecimiento de las plantas y/o la tolerancia a factores abióticos, por ejemplo, altas o bajas temperaturas, sequía o elevado contenido de agua o salinidad del suelo. También es posible mejorar el rendimiento de la floración y fructificación, optimizar la capacidad de germinación y el desarrollo de raíces, facilitar la cosecha y mejorar los rendimientos, influir sobre la maduración, mejorar la calidad y/o el valor nutricional de los productos cosechados, prolongar la vida en almacenamiento y/o mejorar la procesabilidad de los productos cosechados.

Además, los compuestos de la fórmula (I) pueden estar presentes en una mezcla con otros principios activos o productos semioquímicos tales como atrayentes y/o repelentes de insectos y/o activadores de plantas y/o reguladores del crecimiento y/o fertilizantes. Del mismo modo, los compuestos de la fórmula (I) se pueden usar en mezclas para mejorar las propiedades de plantas tales como, por ejemplo, crecimiento, rendimiento y calidad del material cosechado.

En una particular realización de la invención, los compuestos de la fórmula (I) están en la forma de formulaciones o las formas de uso preparadas a partir de estas formulaciones en una mezcla con otros compuestos, preferentemente, aquellos que se describen más abajo.

Si uno de los compuestos mencionados más abajo se pueden producir en diferentes formas tautoméricas, estas formas también se incluyen incluso aunque no se mencionen explícitamente en cada caso.

Insecticidas/acaricidas/nematocidas

Los principios activos especificados aquí con sus nombres comunes son conocidos y se describen, por ejemplo, en The Pesticide Manual, 16th Ed., British Crop Protection Council 2012 o se pueden buscar en la Internet (por ejemplo, <http://www.alanwood.net/pesticides>).

(1) Inhibidores de acetilcolinesterasa (AChE), por ejemplo, carbamatos, por ejemplo, alanicarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxicarboxim, carbarilo, carbofurano, carbosulfano, etiofencarb, fenobucarb, formetanato, furatiocarb, isoprocarb, metiocarb, metomilo, metolcarb, oxamilo, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, triazamato, trimetacarb, XMC y xililcarb; u organofosfatos, por ejemplo, acefato, azametifos, azinfos-etilo, azinfos-metilo, cadusafos, cloretosifos, clorfenvinfos, clormefos, clorpirifos, clorpirifos-metilo, coumafos, cianofos, demetona-S-metilo, diazinona, diclorvos/DDVP, dicrotofos, dimetoato, dimetilvinfos, disulfotona, EPN, etiona, etoprofos, famfur, fenamifos, fenitrotona, fentiona, fostiazato, heptenofos, imiciafos, isofenfos, O-(metoxiaminotiofosforil)salicilato de isopropilo, isoxationa, malationa, mecarbam, metamidofos, metidationa, mevinfos, monocrotofos, naled, ometoato, oxidemetona-metilo, parationa, parationa-metilo, fentoato, forato, fosalono, fosmet, fosfamidona, foxim, pirimifos-metilo, profenofos, propetamfos, protiofos, piraclofos, piridafentiona, quinalfos, sulfotep, tebupirimfos, temefos, terbufos, tetraclorvinefos, tiometona, triazofos, triclorfona y vamidotona.

(2) Antagonistas del canal de cloruro regulado por GABA, por ejemplo, ciclodieno-organocloros, por ejemplo, clordano y endosulfano o fenilpirazoles (fiproles), por ejemplo, etiprol y fipronilo.

(3) Moduladores del canal de sodio / bloqueadores del canal de sodio regulado por voltaje, por ejemplo, piretroides, por ejemplo, acrinatrina, aletrina, d-cis-transaletrina, d-transaletrina, bifentrina, bioaletrina, isómero de s-ciclopentenilo de bioaletrina, bioresmetrina, cicloprotrina, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, lambda-

- 5 cihalotrina, gamma-cihalotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, beta-cipermetrina, teta-cipermetrina, zeta-cipermetrina, cifenotrina [isómero (1R)-trans], deltametrina, empentrina [isómero (EZ)-(1R)], esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flumetrina, tau-fluvalinato, halfenprox, imiprotrina, kade-trina, permetrina, fenotrina [isómero (1R)-trans], praletrina, piretrinas (piretro), resmetrina, silafluofeno, teflutrina, tetrametrina, tetrametrina [isómero (1R)], tralometrina y transflutrina o DDT o metoxicloro.
- (4) Agonistas del receptor nicotínrgicos de acetilcolina (nAChR), por ejemplo, neonicotinoides, por ejemplo, acetamiprida, clotianidina, dinotefurano, imidacloprida, nitenpiram, tiacloprida y tiametoxam o nicotina o sulfoxaflor.
- 10 (5) Activadores alostéricos del receptor nicotínrgico de acetilcolina (nAChR), por ejemplo, espinosinas, por ejemplo, espinetoram y espinosad.
- (6) Activadores del canal de cloruro, por ejemplo, avermectinas/milbemicinas, por ejemplo, abamectina, benzoato de emamectina, lepimectina y milbemectina.
- (7) Imitadores de la hormona juvenil, por ejemplo, análogos de la hormona juvenil, por ejemplo, hidropreno, kinopreno y metopreno o fenoxicarb o piriproxifeno.
- 15 (8) Principios activos mecanismos de acción desconocidos o no específicos, por ejemplo, haluros de alquilo, por ejemplo, bromuro de metilo y otros haluros de alquilo; o cloropirina o fluoruro de sulfurilo o bórax o tártaro emético.
- (9) Antialimentantes selectivos, por ejemplo, pimetozina o flonicamida.
- (10) Inhibidores del crecimiento de ácaros, por ejemplo, clofentezina, hexitiazox y diflovidazina o etoxazol.
- 20 (11) Disruptores microbianos de la membrana intestinal de insectos, por ejemplo, *Bacillus thuringiensis* subespecie israelensis, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus thuringiensis* subespecie aizawai, *Bacillus thuringiensis* subespecie kurstaki, *Bacillus thuringiensis* subespecie tenebrionis y proteínas de plantas BT: Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry2Ab, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb, Cry34/35Ab1.
- 25 (12) Inhibidores de la fosforilación oxidativa, disruptores de ATP, por ejemplo, diafenthiurona o compuestos de organoestaño, por ejemplo, azociclotina, cihexatina y óxido de fenbutatina o propargita o tetradifona.
- (13) Desacopladores de la fosforilación oxidativa que interrumpen el gradiente de protón H, por ejemplo, clorfenapir, DNOC y sulfluramida.
- (14) Antagonistas del receptor nicotínrgico de acetilcolina, por ejemplo, bensultap, clorhidrato de cartap, tiocilam y tiosultap-sodio.
- 30 (15) Inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 0, por ejemplo, bistriflurona, clorfluazurona, diflubenzurona, flucicloxurona, flufenoxurona, hexaflumurona, lufenurona, novalurona, noviflumurona, teflubenzurona y triflumurona.
- (16) Inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 1, por ejemplo, buprofezina.
- (17) Inhibidores de la muda (en especial para Diptera, es decir, dípteros), por ejemplo, ciromazina.
- 35 (18) Agonistas del receptor de ecdisoma, por ejemplo, cromafenozida, halofenozida, metoxifenozida y tebufenozida.
- (19) Agonistas octopaminérgicos, por ejemplo, amitraz.
- (20) Inhibidores del transporte de electrones de complejo III, por ejemplo, hidrametilnona o acequinocilo o fluacripirim.
- 40 (21) Inhibidores del transporte de electrones de complejo I, por ejemplo, del grupo de los acaricidas METI, por ejemplo, fenazaquina, fenpiroximato, pirimidifeno, piridabeno, tebufenpirad y tolfenpirad o rotenona (Derris).
- (22) Bloqueadores del canal de sodio regulado por voltaje, por ejemplo, indoxacarb o metaflumizona.
- (23) Inhibidores de la acetil-CoA carboxilasa, por ejemplo, derivados de ácido tetrónico y tetrámico, por ejemplo, espirodiclofeno, espiromesifeno y espirotetramato.
- 45 (24) Inhibidores del transporte de electrones de complejo IV, por ejemplo, fosfinas, por ejemplo, fosfuro de aluminio, fosfuro de calcio, fosfina y fosfuro de zinc o cianuro.
- (25) Inhibidores del transporte de electrones de complejo II, por ejemplo, cienopirafeno y ciflumetofeno.
- (28) Efectores del receptor de rianodina, por ejemplo, diamidas, por ejemplo, clorantraniliprol, ciantraniliprol y

flubendiamida,

otros principios activos, por ejemplo, afidopiropeno, azadiractina, bencloflaz, benzoximato, bifenazato, bromopropilato, chinometionato, criolita,

dicofol, diflovidazina, fluensulfona, flometoquina, flufenerim, flufenoxistrobina, flufiprol, fluopiram, flupiradifurona, fufenozida, heptaflutrina, imidacloz, iprodiona, meperflutrina, paichongding, piflubumida, pirifluquinazona, piriminostrobina, tetrametilflutrina y yodometano; y también preparaciones basadas en *Bacillus firmus* (I-1582, BioNeem, Votivo) y también los siguientes compuestos: 3-bromo-N-{2-bromo-4-cloro-6-[(1-ciclopropiletil)carbamoil]fenil}-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocida del documento WO 2005/077934) y 1-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]fenil}-3-(trifluorometil)-1H-1,2,4-triazol-5-amina (conocida del documento WO 2006/043635), {1'-[(2E)-3-(4-clorofenil)prop-2-en-1-il]-5-fluoro-espiro[indol-3,4'-piperidin]-1(2H)-il}{2-cloropiridin-4-il)metanona (conocida del documento WO 2003/106457), 2-cloro-N-[2-{(2E)-3-(4-clorofenil)prop-2-en-1-il}piperidin-4-il]-4-(trifluorometil)fenil]isonicotinamida (conocida del documento WO 2006/003494), 3-(2,5-dimetilfenil)-4-hidroxi-8-metoxi-1,8-diaespiro[4.5]dec-3-en-2-ona (conocida del documento WO 2009/049851), 3-(2,5-dimetilfenil)-8-metoxi-2-oxo-1,8-diaespiro[4.5]dec-3-en-4-il-etilcarbonato (conocido del documento WO 2009/049851), 4-(but-2-in-1-iloxi)-6-(3,5-dimetilpiperidin-1-il)-5-fluoropirimidina (conocida del documento WO 2004/099160), 4-(but-2-in-1-iloxi)-6-(3-clorofenil)pirimidina (conocida del documento WO 2003/076415), PF1364 (CAS Reg. No. 1204776-60-2), 4-{5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il}-2-metil-N-[2-oxo-2-[(2,2,2-trifluoroetil)amino]etil]benzamida (conocida del documento WO 2005/085216), 4-{5-[3-cloro-5-(trifluorometil)fenil]-5-(trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il}-N-[2-oxo-2-[(2,2,2-trifluoroetil)amino]etil]-1-naftamida (conocida del documento WO 2009/002809), 2-[2-({[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil}amino)-5-cloro-3-metilbenzoil]-2-metilhidrazincarboxilato de metilo (conocido del documento WO 2005/085216), 2-[2-({[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil}amino)-5-ciano-3-metilbenzoil]-2-etilhidrazincarboxilato de metilo (conocido del documento WO 2005/085216), 2-[2-({[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil}amino)-5-ciano-3-metilbenzoil]-2-metilhidrazincarboxilato de metilo (conocido del documento WO 2005/085216), 2-[3,5-dibromo-2-({[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil}amino)benzoil]-2-etilhidrazincarboxilato de metilo (conocida del documento WO 2005/085216), 1-(3-cloropiridin-2-il)-N-[4-ciano-2-metil-6-(metilcarbamoil)fenil]-3-{[5-(trifluorometil)-2H-tetrazol-2-il]metil}-1H-pirazol-5-carboxamida (conocida del documento WO 2010/069502), N-[2-(5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-il)-4-cloro-6-metilfenil]-3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocida del documento CN102057925), 3-cloro-N-(2-cianopropan-2-il)-N-[4-(1,1,1,2,3,3,3-heptafluoropropan-2-il)-2-metilfenil]ftalamida (conocida del documento WO 2012/034472), 8-cloro-N-[(2-cloro-5-metoxifenil)sulfonyl]-6-(trifluorometil)imidazo[1,2-a]piridin-2-carboxamida (conocida del documento WO 2010/129500), 4-{5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il}-2-metil-N-(1-oxidotietan-3-il)benzamida (conocida del documento WO 2009/080250), 4-{5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il}-2-metil-N-(1-oxidotietan-3-il)benzamida (conocida del documento WO 2012/029672), 1-[(2-cloro-1,3-tiazol-5-il)metil]-4-oxo-3-fenil-4H-pirido[1,2-a]pirimidin-1-ilo-2-olato (conocido del documento WO 2009/099929), 1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]-4-oxo-3-fenil-4H-pirido[1,2-a]pirimidin-1-ilo-2-olato (conocido del documento WO 2009/099929), (5S,8R)-1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]-9-nitro-2,3,5,6,7,8-hexahidro-1H-5,8-epoxiimidazo[1,2-a]azepina (conocida del documento WO 2010/069266), (2E)-1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]-N'-nitro-2-pentilidenhidrazincarboximidamida (conocida del documento WO 2010/060231), 4-(3-{2-dicloro-4-[(3,3-dicloroprop-2-en-1-il)oxi]fenoxi}propoxi)-2-metoxi-6-(trifluorometil)pirimidina (conocida del documento CN101337940), N-[2-(ter-butilcarbamoil)-4-cloro-6-metilfenil]-1-(3-cloropiridin-2-il)-3-(fluorometoxi)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocida del documento WO 2008/134969).

Fungicidas

Los principios activos especificados en la presente por su nombre común son conocidos y se describen, por ejemplo, en el "Pesticide Manual" o en la Internet (por ejemplo: <http://www.alanwood.net/pesticides>).

(1) Inhibidores de la biosíntesis de ergosterol, por ejemplo, (1.1) aldimorf, (1.2) azaconazol, (1.3) bitertanol, (1.4) bromuconazol, (1.5) ciproconazol, (1.6) diclobutrazol, (1.7) difenoconazol, (1.8) diniconazol, (1.9) diniconazol-M, (1.10) dodemorf, (1.11) acetato de dodemorf, (1.12) epoxiconazol, (1.13) etaconazol, (1.14) fenarimol, (1.15) fenbuconazol, (1.16) fenhexamida, (1.17) fenpropidina, (1.18) fenpropimorf, (1.19) fluquinconazol, (1.20) flurprimidol, (1.21) flusilazol, (1.22) flutriafol, (1.23) furconazol, (1.24) furconazol-cis, (1.25) hexaconazol, (1.26) imazalilo, (1.27) sulfato de imazalilo, (1.28) imibenconazol, (1.29) ipconazol, (1.30) metconazol, (1.31) miclobutanilo, (1.32) naftifina, (1.33) nuarimol, (1.34) oxpoconazol, (1.35) paclobutrazol, (1.36) pefurazoato, (1.37) penconazol, (1.38) piperalina, (1.39) procloraz, (1.40) propiconazol, (1.41) protioconazol, (1.42) piributicarb, (1.43) pirifenox, (1.44) quinconazol, (1.45) simeconazol, (1.46) espiroamina, (1.47) tebuconazol, (1.48) terbinafina, (1.49) tetraconazol, (1.50) triadimefona, (1.51) triadimenol, (1.52) tridemorf, (1.53) triflumizol, (1.54) triforina, (1.55) triticonazol, (1.56) uniconazol, (1.57) uniconazol-P, (1.58) viniconazol, (1.59) voriconazol, (1.60) 1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)cicloheptanol, (1.61) 1-(2,2-dimetil-2,3-dihidro-1H-inden-1-il)-1H-imidazol-5-carboxilato de metilo, (1.62) N'-{5-(difluorometil)-2-metil-4-[3-(trimetilsilil)propoxi]fenil}-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.63) N-etil-N-metil-N'-{2-metil-5-(trifluorometil)-4-[3-(trimetilsilil)propoxi]fenil}imidoformamida y (1.64) O-[1-(4-metoxifenoxi)-3,3-dimetilbutan-2-il]-1H-imidazol-1-carbotioato, (1.65) pirisoxazol.

(2) Inhibidores de la respiración (inhibidores de la cadena respiratoria), por ejemplo, (2.1) bixafeno, (2.2) boscalida, (2.3) carboxina, (2.4) diflumetorim, (2.5) fenfuram, (2.6) fluopiram, (2.7) flutolanilo, (2.8) fluxapiraxad, (2.9) furametpir, (2.10) furmeciclox, (2.11) mezcla de isopirazam del racemato sin-epimérico 1RS,4SR,9RS y el racemato anti-

empimérico 1RS,4SR,9SR, (2.12) isopirazam (racemato anti-epimérico), (2.13) isopirazam (enantiómero anti-epimérico 1R,4S,9S), (2.14) isopirazam (enantiómero anti-epimérico 1S,4R,9R), (2.15) isopirazam (racemato sin-epimérico 1RS,4SR,9RS), (2.16) isopirazam (enantiómero sin-epimérico 1R,4S,9R), (2.17) isopirazam (enantiómero sin-epimérico 1S,4R,9S), (2.18) mepronilo, (2.19) oxicarboxina, (2.20) penflufeno, (2.21) pentiopirad, (2.22) sedaxano, (2.23) tfluzamida, (2.24) 1-metil-N-[2-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil]-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.25) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[2-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.26) 3-(difluorometil)-N-[4-fluoro-2-(1,1,2,3,3,3-hexafluoropropoxi)fenil]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.27) N-[1-(2,4-diclorofenil)-1-metoxipropan-2-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.28) 5,8-difluoro-N-[2-(2-fluoro-4-[[4-(trifluorometil)piridin-2-il]oxi]fenil)etil]quinazolin-4-amina, (2.29) benzovindiflupir, (2.30) N-[(1S,4R)-9-(diclorometilen)-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida y (2.31) N-[(1R,4S)-9-(diclorometilen)-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.32) 3-(difluorometil)-1-metil-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.33) 1,3,5-trimetil-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.34) 1-metil-3-(trifluorometil)-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.35) 1-metil-3-(trifluorometil)-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.36) 1-metil-3-(trifluorometil)-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.37) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.38) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.39) 1,3,5-trimetil-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.40) 1,3,5-trimetil-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.41) benodanilo, (2.42) 2-cloro-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)piridin-3-carboxamida, (2.43) isofetamida.

(3) Inhibidores de la respiración (inhibidores de la cadena respiratoria) que actúan sobre el complejo III de la cadena respiratoria, por ejemplo, (3.1) ametotradina, (3.2) amisulbrom, (3.3) azoxistrobina, (3.4) ciazofamida, (3.5) coumetoxistrobina, (3.6) coumoxistrobina, (3.5) dimoxistrobina, (3.8) enestroburina, (3.9) famoxadona, (3.10) fenamidona, (3.11) flufenoxistrobina, (3.12) fluoxastrobina, (3.13) kresoxim-metilo, (3.14) metominostrobin, (3.15) orisastrobina, (3.16) picoxistrobina, (3.17) piraclostrobina, (3.18) pirametostrobin, (3.19) piraxistrobina, (3.20) piribencarb, (3.21) triclopiricarb, (3.22) trifloxistrobina, (3.23) (2E)-2-{2-[[6-(3-cloro-2-metilfenoxi)-5-fluoropirimidin-4-il]oxi]fenil}-2-(metoxiimino)-N-metiletanamida, (3.24) (2E)-2-(metoxiimino)-N-metil-2-{2-[[[(1E)-1-{3-(trifluorometil)fenil]etilidene}amino]oxi]metil]fenil}etanamida, (3.25) (2E)-2-(metoxiimino)-N-metil-2-{2-[(E)-{(1-{3-(trifluorometil)fenil}etoxi)imino}metil]fenil}etanamida, (3.26) (2E)-2-{2-[[[(1E)-1-{3-[(E)-1-fluoro-2-feniletetil]oxi]fenil]etiliden}amino]oxi]metil]fenil}-2-(metoxiimino)-N-metiletanamida, (3.27) (2E)-2-{2-[[[(2E,3E)-4-(2,6-diclorofenil)but-3-en-2-iliden]amino]oxi]metil]fenil}-2-(metoxiimino)-N-metiletanamida, (3.28) 2-cloro-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)piridin-3-carboxamida, (3.29) 5-metoxi-2-metil-4-{2-[[[(1E)-1-{3-(trifluorometil)fenil]etiliden}amino]oxi]metil]fenil}-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-ona, (3.30) (2E)-2-{2-[[[ciclopropil[(4-metoxifenil)imino]metil]sulfanil]metil]fenil}-3-metoxiprop-2-enoato de metilo, (3.31) N-(3-etil-3,5,5-trimetilciclohexil)-3-(formilamino)-2-hidroxibenzamida, (3.32) 2-{2-[[2,5-dimetilfenoxi]metil]fenil}-2-metoxi-N-metilacetamida, (4) inhibidores de mitosis y división celular, por ejemplo, (4.1) benomilo, (4.2) carbendazim, (4.3) clorfenazol, (4.4) dietofencarb, (4.5) etaboxam, (4.6) fluopicolida, (4.7) fuberidazol, (4.8) pencicurona, (4.9) tiabendazol, (4.10) tiofanato-metilo, (4.11) tiofanato, (4.12) zoxamida, (4.13) 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina y (4.14) 3-cloro-5-(6-cloropiridin-3-il)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorofenil)piridazina.

(5) Los compuestos que tienen actividad multisitio, por ejemplo, (5.1) mezcla de Bordeaux, (5.2) captafol, (5.3) captano, (5.4) clorotalonilo, (5.5) preparaciones de cobre tales como hidróxido de cobre, (5.6) naftenato de cobre, (5.7) óxido de cobre, (5.8) oxiclورو de cobre, (5.9) sulfato de cobre, (5.10) diclofluanida, (5.11) ditianona, (5.12) dodina, (5.13) base libre de dodina, (5.14) ferbam, (5.15) fluorfolpet, (5.16) folpet, (5.17) guazatina, (5.18) acetato de guazatina, (5.19) iminocadina, (5.20) albesilato de iminocadina, (5.21) triacetato de iminocadina, (5.22) mancobre, (5.23) mancozeb, (5.24) maneb, (5.25) metiram, (5.26) zinc metiram, (5.27) oxina de cobre, (5.28) propamidina, (5.29) propineb, (5.30) azufre y preparaciones de azufre, por ejemplo, polisulfuro de calcio, (5.31) tiram, (5.32) tolilfluánida, (5.33) zineb, (5.34) ziram y (5.35) anilazina.

(6) Inductores de resistencia, por ejemplo, (6.1) acibenzolar-S-metilo, (6.2) isotianilo, (6.3) probenazol, (6.4) tiadinilo y (6.5) laminarina.

(7) Inhibidores de la biosíntesis de aminoácidos y proteínas, por ejemplo, (7.1) androprim, (7.2) blasticidina-S, (7.3) ciprodinilo, (7.4) kasugamicina, (7.5) clorhidrato de kasugamicina, (7.6) mepanipirim, (7.7) pirimetanilo, (7.8) 3-(5-fluoro-3,3,4,4-tetrametil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina y (7.9) oxitetraciclina y (7.10) estreptomina.

(8) Inhibidores de la producción de ATP, por ejemplo, (8.1) acetato de fentina, (8.2) cloruro de fentina, (8.3) hidróxido de fentina y (8.4) siltiofam.

(9) Inhibidores de la síntesis de la pared celular, por ejemplo, (9.1) bentiavalicarb, (9.2) dimetomorf, (9.3) flumorf, (9.4) iprovalicarb, (9.5) mandipropamida, (9.6) polioxinas, (9.7) polioxorim, (9.8) validamicina A, (9.9) valifenalato y (9.10) polioxina B.

(10) Inhibidores de la síntesis de lípidos y de membrana, por ejemplo, (10.1) bifenilo, (10.2) clorneb, (10.3) diclorano, (10.4) edifenfos, (10.5) etridiazol, (10.6) yodocarb, (10.7) iprobenfos, (10.8) isoprotiolano, (10.9) propamocarb, (10.10) clorhidrato de propamocarb, (10.11) protiocarb, (10.12) pirazofos, (10.13) quintoceno, (10.14) tecnaceno y (10.15)

tolclofos-metilo.

(11) Inhibidores de la biosíntesis de melanina, por ejemplo, (11.1) carpropamida, (11.2) diclocimet, (11.3) fenoxanilo, (11.4) ftalida, (11.5) piroquilona, (11.6) triciclazol y (11.7) {3-metil-1-[(4-metilbenzoil)amino]butan-2-il}carbamato de 2,2,2-trifluoroetilo.

5 (12) Inhibidores de la síntesis de ácido nucleico, por ejemplo, (12.1) benalaxilo, (12.2) benalaxil-M (kiralaxilo), (12.3) bupirinato, (12.4) clozilacona, (12.5) dimetirimol, (12.6) etirimol, (12.7) furalaxilo, (12.8) himexazol, (12.9) metalaxilo, (12.10) metalaxil-M (mefenoxam), (12.11) ofurace, (12.12) oxadixilo, (12.13) ácido oxolínico y (12.14) octilina.

(13) Inhibidores de la transducción de señales, por ejemplo, (13.1) clozolinato, (13.2) fenpiclonilo, (13.3) fludioxonilo, (13.4) iprodiona, (13.5) procimidona, (13.6) quinoxifeno, (13.7) vinclozolina y (13.8) proquinazida.

10 (14) Desacopladores, por ejemplo, (14.1) binapacril, (14.2) dinocap, (14.3) ferimzona, (14.4) fluzinam y (14.5) meptildinocap.

(15) Otros compuestos, por ejemplo, (15.1) bentiazol, (15.2) betoxazina, (15.3) capsimicina, (15.4) carvona, (15.5) quinometionam, (15.6) piriofenona (clazafenona), (15.7) cufraneb, (15.8) ciflufenamida, (15.9) cimoxanilo, (15.10) cipro sulfamida, (15.11) dazomet, (15.12) debacarb, (15.13) diclorofeno, (15.14) diclomezina, (15.15) difenzoquat, (15.16) metilsulfato de difenzoquat, (15.17) difenilamina, (15.18) EcoMate, (15.19) fenpirazamina, (15.20) flumetover, (15.21) fluorimida, (15.22) flusulfamida, (15.23) flutianilo, (15.24) fosetil-aluminio, (15.25) fosetil-calcio, (15.26) fosetil-sodio, (15.27) hexaclorobenceno, (15.28) irumamicina, (15.29) metasulfocarb, (15.30) isotiocianato de metilo, (15.31) metrafenona, (15.32) mildiomicina, (15.33) natamicina, (15.34) dimetilditiocarbamato de níquel, (15.35) nitroal-isopropilo, (15.36) octilina, (15.37) oxamocarb, (15.38) oxifentina, (15.39) pentaclorofenol y sus sales, (15.40) fenotrina, (15.41) ácido fosfórico y sus sales, (15.42) propamocarb-fosetilato, (15.43) propanosina-sodio, (15.44) pirimorf, (15.45) (2E)-3-(4-ter-butilfenil)-3-(2-cloropiridin-4-il)-1-(morfolin-4-il)prop-2-en-1-ona, (15.46) (2Z)-3-(4-ter-butilfenil)-3-(2-cloropiridin-4-il)-1-(morfolin-4-il)prop-2-en-1-ona, (15.47) pirrolnitrina, (15.48) tebufloquina, (15.49) tecloftalam, (15.50) tolnifanida, (15.51) triazoxida, (15.52) triclamida, (15.53) zarilamida, (15.54) 2-metilpropanoato de (3S,6S,7R,8R)-8-bencil-3-[(3-[(isobutiriloxi)metoxi]-4-metoxipiridin-2-il)carbonil]amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-ilo, (15.55) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona, (15.56) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona, (15.57) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona, (15.58) 1H-imidazol-1-carboxilato de 1-(4-metoxifenoxi)-3,3-dimetilbutan-2-ilo, (15.59) 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)piridina, (15.60) 2,3-dibutil-6-clorotieno[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona, (15.61) 2,6-dimetil-1H,5H-[1,4]ditiino[2,3-c:5,6-c']dipirrol-1,3,5,7(2H,6H)-tetrona, (15.62) 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(5R)-5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona, (15.63) 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(5S)-5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona, (15.64) 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(5R)-5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona, (15.65) 2-butoxi-6-yodo-3-propil-4H-cromen-4-ona, (15.66) 2-cloro-5-[2-cloro-1-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-4-metil-1H-imidazol-5-il]piridina, (15.67) 2-fenilfenol y sales, (15.68) 3-(4,4,5-trifluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisquinolin-1-il)quinolina, (15.69) 3,4,5-tricloropiridin-2,6-dicarbonitrilo, (15.70) 3-cloro-5-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-6-metilpiridazina, (15.71) 4-(4-clorofenil)-5-(2,6-difluorofenil)-3,6-dimetilpiridazina, (15.72) 5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-tiol, (15.73) 5-cloro-N'-fenil-N'-(prop-2-in-1-il)tiofene-2-sulfonohidrazida, (15.74) 5-fluoro-2-[(4-fluorobencil)oxi]pirimidin-4-amina, (15.75) 5-fluoro-2-[(4-metilbencil)oxi]pirimidin-4-amina, (15.76) 5-metil-6-octil[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-amina, (15.77) (2Z)-3-amino-2-ciano-3-fenilacrilato de etilo, (15.78) N'-(4-{3-(4-clorobencil)-1,2,4-tiadiazol-5-il}oxi)-2,5-dimetilfenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (15.79) N-(4-clorobencil)-3-[3-metoxi-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]propanamida, (15.80) N-[(4-clorofenil)(ciano)metil]-3-[3-metoxi-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]propanamida, (15.81) N-[(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)metil]-2,4-dicloronicotinamida, (15.82) N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2,4-dicloronicotinamida, (15.83) N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2-fluoro-4-yodonicotinamida, (15.84) N-[(E)-(ciclopropilmetoxi)imino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil]-2-fenilacetamida, (15.85) N-[(Z)-(ciclopropilmetoxi)imino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil]-2-fenilacetamida, (15.86) N'-4-[(3-ter-butil-4-ciano-1,2-tiazol-5-il)oxi]-2-cloro-5-metilfenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (15.87) N-metil-2-(1-{[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-N-(1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il)-1,3-tiazol-4-carboxamida, (15.88) N-metil-2-(1-{[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il]-1,3-tiazol-4-carboxamida, (15.89) N-metil-2-(1-{[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-N-[(1S)-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il]-1,3-tiazol-4-carboxamida, (15.90) {6-[[[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metileno]amino]oxi]metil]piridin-2-il}carbamato de pentilo, (15.91) ácido fenazin-1-carboxílico, (15.92) quinolin-8-ol, (15.93) sulfato de quinolin-8-ol (2:1), (15.94) {6-[[[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metileno]amino]oxi]metil]piridin-2-il}carbamato de ter-butilo, (15.95) 1-metil-3-(trifluorometil)-N-[2-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.96) N-(4'-clorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.97) N-(2',4'-diclorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.98) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[4'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.99) N-(2',5'-difluorobifenil-2-il)-1-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.100) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[4'-(prop-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.101) 5-fluoro-1,3-dimetil-N-[4'-(prop-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.102) 2-cloro-N-[4'-(prop-1-in-1-il)bifenil-2-il]nicotinamida, (15.103) 3-(difluorometil)-N-[4'-(3,3-dimetilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.104) N-[4'-(3,3-dimetilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.105) 3-(difluorometil)-N-(4'-etilbifenil-2-il)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.106) N-(4'-etilbifenil-2-il)-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.107) 2-cloro-N-(4'-etilbifenil-2-il)nicotinamida,

- (15.108) 2-cloro-N-[4'-(3,3-dimetilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]nicotinamida, (15.109) 4-(difluorometil)-2-metil-N-[4'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1,3-tiazol-5-carboxamida, (15.110) 5-fluoro-N-[4'-(3-hidroxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.111) 2-cloro-N-[4'-(3-hidroxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]nicotinamida, (15.112) 3-(difluorometil)-N-[4'-(3-metoxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.113) 5-fluoro-N-[4'-(3-metoxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.114) 2-cloro-N-[4'-(3-metoxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]nicotinamida, (15.115) (5-bromo-2-metoxi-4-metilpiridin-3-il)(2,3,4-trimetoxi-6-metilfenil)metanona, (15.116) N-[2-(4-[[3-(4-clorofenil)prop-2-in-1-il]oxi]-3-metoxifenil)etil]-N2-(metilsulfonil)valinamida, (15.117) ácido 4-oxo-4-[[2-feniletil]amino]butanoico, (15.118) {6-[[[(Z)-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilen]amino]oxi]metil]piridin-2-il}carbamato de but-3-in-1-ilo, (15.119) 4-amino-5-fluoropirimidin-2-ol (forma tautomérica: 4-amino-5-fluoropirimidin-2(1H)-ona), (15.120) 3,4,5-trihidroxibenzoato de propilo, (15.121) 1,3-dimetil-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.122) 1,3-dimetil-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.123) 1,3-dimetil-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.124) [3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (15.125) (S)-[3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (15.126) (R)-[3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (15.127) 2-[[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.128) tiocianato de 1-[[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol-5-ilo, (15.129) 5-(alilsulfanil)-1-[[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol, (15.130) 2-[1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.131) 2-[[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.132) 2-[[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.133) tiocianato de 1-[[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol-5-ilo, (15.134) tiocianato de 1-[[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol-5-ilo, (15.135) 5-(alilsulfanil)-1-[[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol, (15.136) 5-(alilsulfanil)-1-[[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol, (15.137) 2-[(2S,4S,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.138) 2-[(2R,4S,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.139) 2-[(2R,4R,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.140) 2-[(2S,4R,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.141) 2-[(2S,4S,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.142) 2-[(2R,4S,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.143) 2-[(2R,4R,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.144) 2-[(2S,4R,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (15.145) 2-fluoro-6-(trifluorometil)-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)benzamida, (15.146) 2-(6-bencilpiridin-2-il)quinazolina, (15.147) 2-[6-(3-fluoro-4-metoxifenil)-5-metilpiridin-2-il]quinazolina, (15.148) 3-(4,4-difluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina, (15.149) ácido abscísico, (15.150) 3-(difluorometil)-N-metoxi-1-metil-N-[1-(2,4,6-triclorofenil)propan-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.151) N'-[5-bromo-6-(2,3-dihidro-1H-inden-2-iloxi)-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoformamida, (15.152) N'-[5-bromo-6-[1-(3,5-difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoformamida, (15.153) N'-[5-bromo-6-[(1R)-1-(3,5-difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoformamida, (15.154) N'-[5-bromo-6-[(1S)-1-(3,5-difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoformamida, (15.155) N'-[5-bromo-6-[(cis-4-isopropilciclohexil)oxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoformamida, (15.156) N'-[5-bromo-6-[(trans-4-isopropilciclohexil)oxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoformamida, (15.157) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.158) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropilbencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.159) N-(2-ter-butilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.160) N-(5-cloro-2-etilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.161) N-(5-cloro-2-isopropilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.162) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-5-fluorobencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.163) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(5-fluoro-2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.164) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropil-5-fluorobencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.165) N-(2-ciclopentil-5-fluorobencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.166) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-fluoro-6-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.167) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-5-metilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.168) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropil-5-metilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.169) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropil-5-metilbencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.170) N-(2-ter-butil-5-metilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.171) N-(5-cloro-2-(trifluorometil)bencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.172) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-N-[5-metil-2-(trifluorometil)bencil]-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.173) N-[2-cloro-6-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.174) N-[3-cloro-2-fluoro-6-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.175) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-4,5-dimetilbencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.176) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.177) 3-(difluorometil)-N-(7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.178) 3-(difluorometil)-N-[(3R)-7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.179) 3-(difluorometil)-N-[(3S)-7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.180) N'-(2,5-dimetil-4-fenoxifenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (15.181) N'-[4-[(4,5-dicloro-1,3-tiazol-2-il)oxi]-2,5-dimetilfenil]-N-etil-N-metilimidoformamida, (15.182) N-(4-cloro-2,6-difluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina. Todos los componentes de mezcla mencionados en las clases (1) a (15), según sea el caso, pueden formar sales con bases o ácidos apropiados si son capaces de hacerlo

sobre la base de sus grupos funcionales.

Pesticidas biológicos como componentes de mezcla

Los compuestos de la fórmula (I) se pueden combinar con pesticidas biológicos.

- 5 Los pesticidas biológicos incluyen en especial bacterias, hongos, levaduras, extractos de plantas y productos formados por microorganismos, que incluyen proteínas y metabolitos secundarios.

Los pesticidas biológicos incluyen bacterias tales como bacterias formadoras de esporas, bacterias colonizadoras de raíces y bacterias que actúan como insecticidas, fungicidas o nematocidas biológicos.

Los ejemplos de tales bacterias que se usan o que se pueden usar como pesticidas biológicos son:

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

Los ejemplos de hongos y levaduras que se usan o que se pueden usar como pesticidas biológicos son:

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

Los ejemplos de virus que se usan o se pueden usar como pesticidas biológicos son:

- 30 virus de granulosis *Adoxophyes orana* (GV), virus de granulosis *Cydia pomonella* (GV), virus de polihedrosis nuclear *Helicoverpa armigera* (NPV), mNPV de *Spodoptera exigua*, mNPV de *Spodoptera frugiperda*, NPV de *Spodoptera littoralis*.

También están incluidos bacterias y hongos que se añaden como 'inoculantes' a plantas o partes de plantas u órganos de plantas y que, en virtud de sus propiedades particulares, promueven el crecimiento de plantas y la salud de las plantas. Los ejemplos incluyen:

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

- 40 Los ejemplos de extractos de plantas y aquellos productos que se formaron de microorganismos, incluyendo proteínas y productos metabólicos secundarios, que se usan o se pueden usar como agentes de control de parásitos biológicos, son:

- 45 *Allium sativum*, *Artemisia absinthium*, *Azadirachtin*, *Biokeeper WP*, *Cassia nigricans*, *Celastrus angulatus*, *Chenopodium anthelminticum*, quitina, *Armour-Zen*, *Dryopteris filix-mas*, *Equisetum arvense*, *Fortune Aza*, *Fungastop*, *Heads Up* (extracto de saponina de *Chenopodium quinoa*), piretro/piretrinas, *Quassia amara*, *Quercus*, *Quillaja*, *Regalia*, „*Requiem*™ Insecticide“, *Rotenon*, *riania/rianodina*, *Symphytum officinale*, *Tanacetum vulgare*, timeno, *Triact 70*, *TriCon*, *Tropaeolum majus*, *Urtica dioica*, *veratrina*, *Viscum album*, extracto de *Brassicaceae*, en especial polvo de colza o mostaza.

Protectores como componentes de mezcla

- 50 Los compuestos de la fórmula (I) se pueden combinar con protectores, por ejemplo, benoxacor, cloquintocet (-mexilo), ciometrinilo, ciprosulfamida, dicloromida, fenclorazol (-etilo), fenclorim, flurazol, fluxofenim, furilazol, isoxadifeno (-etilo), mefenpir (-dietilo), anhídrido naftálico, oxabetrinilo, 2-metoxi-N-({4-[(metilcarbamoil)amino]fenil}sulfonil)benzamida (CAS 129531-12-0), 4-(dicloroacetil)-1-oxa-4-azaespiro[4.5]decano (CAS 71526-07-3), 2,2,5-trimetil-3-(dicloroacetil)-

1,3-oxazolidina (CAS 52836-31-4).

Plantas y partes de plantas

Todas las plantas y partes de plantas se pueden tratar de acuerdo con la invención. Aquí, plantas se han de entender como todas las plantas y poblaciones de plantas tales como plantas salvajes o plantas de cultivos deseadas y no deseadas (que incluyen plantas de cultivos naturales), por ejemplo, cereales (trigo, arroz, triticale, cebada, centeno, avena), maíz, frijoles de soja, patata, remolacha, caña de azúcar, tomates, guisantes y otras especies vegetales, algodón, tabaco, colza oleaginosa y también plantas frutales (con las frutas manzanas, peras, cítricos y uvas). Las plantas de cultivo que se pueden obtener por métodos de cría y optimización convencionales o por métodos biotecnológicos y de ingeniería genética o combinaciones de estos métodos, que incluyen las plantas transgénicas y que incluyen los cultivares de plantas que se pueden proteger o no por derechos de los criadores de plantas. Las partes de plantas se han de entender como todas las partes y órganos de las plantas por encima y por debajo del suelo, tales como brotes, hojas, flores y raíces, dando como ejemplos hojas, agujas, troncos, tallos, flores, cuerpos de frutas, frutos y semillas y también tubérculos, raíces y rizomas. Las partes de plantas también incluyen material cosechado y material de propagación vegetativo y generativo, por ejemplo, esquejes, tubérculos, rizomas, cortes y semillas.

El tratamiento de acuerdo con la invención de las plantas y partes de plantas con los compuestos de la fórmula (I) se efectuó directamente o dejando que ellos actuaran sobre los alrededores, el hábitat o su espacio de almacenamiento por medio de los métodos de tratamiento habituales, por ejemplo, por inmersión, pulverización, evaporación, nebulización, dispersión, pintura, inyección y, en el caso del material de propagación, en especial en el caso de semillas, también por aplicación de uno o varios recubrimientos.

Como ya se mencionó con anterioridad, es posible de acuerdo con la invención tratar las plantas y sus partes. En una realización preferida, se tratan especies de plantas silvestres y cultivares de plantas o aquellos obtenidos por cruce biológica convencional, tales como cruce o fusión de protoplastos y sus partes. En otra realización preferida, se tratan plantas transgénicas y cultivares de plantas obtenidos por métodos de ingeniería genética, de ser apropiado, en combinación con métodos convencionales (organismos genéticamente modificados) y sus partes. El término "partes" o "partes de plantas" se han explicado con anterioridad. Se da particular preferencia de acuerdo con la invención al tratamiento de plantas de los respectivos cultivares habituales en comercios o aquellos que están en uso. Los cultivares de plantas se han de entender como plantas que tienen nuevas propiedades ("rasgos") y que fueron obtenidos por técnicas de cría convencionales, por mutagénesis o por técnicas de ADN recombinantes. Pueden ser cultivares, variedades, biotipos o genotipos.

Plantas transgénicas, tratamiento de semillas y eventos de integración

Las plantas transgénicas o cultivares de plantas preferidos (aquellos obtenidos por ingeniería genética) que se han de tratar de acuerdo con la invención incluyen todas las plantas que, a través de la modificación genética, recibieron material genético que imparte particulares rasgos útiles ventajosos a estas plantas. Los ejemplos de tales propiedades son mejor crecimiento de plantas, mayor tolerancia a altas o bajas temperaturas, mayor tolerancia a la sequía o a niveles de agua o salinidad del suelo, mayor rendimiento de floración, cosecha más simple, maduración acelerada, mayores rendimientos, mayor calidad y/o un mayor valor nutricional de los productos cosechados, mejor vida en almacenamiento y/o procesabilidad de los productos cosechados. Otros ejemplos y en particular ejemplos enfatizados de tales propiedades son mayor resistencia de las plantas contra plagas animales y microbianas, tales como contra insectos, arácnidos, nematodos, ácaros, babosas y caracoles debido, por ejemplo, a las toxinas formadas en las plantas, en particular aquellas formadas en las plantas por el material genético de *Bacillus thuringiensis* (por ejemplo, por los genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb y CryIF y también sus combinaciones), y también mayor resistencia de las plantas contra hongos, bacterias y/o virus fitopatógenos causada, por ejemplo, por la resistencia adquirida sistémica (SAR), sistemina, fitoalexinas, elicitores y genes de resistencia y proteínas correspondientemente expresadas y toxinas y también mayor tolerancia de las plantas a determinados principios activos herbicidas, por ejemplo, imidazolinonas, sulfonilureas, glifosato o fosfinotricina (por ejemplo, el gen "PAT"). Los genes que imparten los rasgos deseados en cuestión también pueden estar presentes en combinaciones con otros en las plantas transgénicas. Los ejemplos de plantas transgénicas incluyen las importantes plantas de cultivo, tales como cereales (trigo, arroz, triticale, cebada, centeno, avena), maíz, frijoles de soja, patatas, remolacha, caña de azúcar, tomates, guisantes y otros tipos de vegetales, algodón, tabaco, colza oleaginosa y también plantas frutales (con las frutas manzanas, peras, cítricos y uvas), dando particular énfasis al maíz, frijoles de soja, trigo, arroz, patatas, algodón, caña de azúcar, tabaco y colza oleaginosa. Los rasgos que se enfatizan en particular son la mayor resistencia de las plantas a los insectos, arácnidos, nematodos y babosas y caracoles.

Protección de cultivos – tipos de tratamiento

El tratamiento de las plantas y partes de plantas con los compuestos de la fórmula (I) se lleva a cabo directamente o por acción sobre sus alrededores, hábitat o espacio de almacenamiento por medio de métodos de tratamiento convencionales, por ejemplo, por inmersión, pulverización, atomización, irrigación, evaporación, espolvoreo, nebulización, difusión, formación de espuma, pintura, propagación, inyección, irrigación, irrigación por goteo y, en el caso del material de propagación, en especial en el caso de semillas, también por tratamiento de semillas seco,

tratamiento de semillas líquido, un polvo soluble en agua para tratamiento en suspensión, por incrustación, por recubrimiento con una o varias capas, etc. También es posible aplicar los compuestos de la fórmula (I) por el método de volumen ultrabajo o inyectar la forma de uso o el compuesto de la fórmula (I) propiamente dicho en el suelo.

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

- 10 En el caso de compuestos sistémicamente activos, los compuestos de la fórmula (I) también acceden a las plantas por medio del sistema de raíces. Las plantas se tratan luego por acción de los compuestos de la fórmula (I) sobre el hábitat de la planta. Esto se puede hacer, por ejemplo, por irrigación o por mezcla en el suelo o la solución nutriente, lo que significa que el locus de la planta (por ejemplo, suelo o sistemas hidropónicos) se impregna con una forma líquida de los compuestos de la fórmula (I) o por aplicación en el suelo, es decir, los compuestos de la fórmula (I) se introducen en forma sólida (por ejemplo, en forma de gránulos) en el locus de las plantas. En el caso de cultivos de arrozales, esto se puede hacer dosificando el compuesto de la fórmula (I) en una fórmula de aplicación sólida (por ejemplo, como gránulos) en un campo de arroz inundado.

15 Tratamiento de semillas

- El control de plagas animales por tratamiento de semillas de plantas se ha conocido durante un tiempo largo y es el objeto de constantes mejoras. Sin embargo, el tratamiento de semillas conlleva una serie de problemas que no siempre se pueden resolver de una manera satisfactoria. Así, es deseable desarrollar métodos para proteger las semillas y la planta germinante que dispensa o al menos reduce considerablemente la aplicación adicional de pesticidas durante el almacenamiento, después de la siembra o después de la emergencia de las plantas. Adicionalmente, es deseable optimizar la cantidad de ingrediente usado de modo de proporcionar una óptima protección para las semillas y la planta germinante del ataque por plagas animales, pero sin dañar la planta propiamente dicha por el principio activo empleado. En particular, los métodos para el tratamiento de semillas también tendrán en cuenta las propiedades insecticidas o nematocidas intrínsecas de plantas transgénicas resistentes a plagas o tolerantes a plagas a fin de lograr una protección óptima de las semillas y la planta germinante con un mínimo gasto de productos de protección de cultivos.

- 30 Por ello, la presente invención también se refiere más en particular a un método para la protección de semillas y plantas germinantes, del ataque de plagas, por tratamiento de semillas con uno de los compuestos de la fórmula (I). El método de acuerdo con la invención para proteger semillas y plantas germinantes contra el ataque de plagas también comprende un método en el que la semilla se trata simultáneamente en una operación o secuencialmente con un compuesto de la fórmula (I) y un componente de mezcla. También comprende un método en el que la semilla se trata en diferentes momentos con un compuesto de la fórmula (I) y un componente de mezcla.

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

- 35 Además, los compuestos de fórmula (I) son adecuados para la producción de semillas que han sido tratadas con un compuesto de fórmula (I) para proteger contra plagas animales. Los compuestos de fórmula (I) también son adecuados para la producción de semillas que han sido tratadas al mismo tiempo con un compuesto de fórmula (I) y un compañero de mezcla. Los compuestos de fórmula (I) también son adecuados para la producción de semillas que han sido tratadas en diferentes momentos con un compuesto de fórmula (I) y un componente de mezcla. En el caso de semillas que fueron tratados en diferentes momentos con un compuesto de la fórmula (I) y un componente de mezcla, las sustancias individuales pueden estar presentes en la semilla en diferentes capas. En este caso, las capas que comprenden un compuesto de la fórmula (I) y componentes de mezcla se pueden separar dado el caso por medio de una capa intermediaria. La invención también se refiere a semillas en las que un compuesto de la fórmula (I) y un componente de mezcla fueron aplicados como parte de un recubrimiento o como otra capa u otras capas además de un recubrimiento.

Además, los compuestos de fórmula (I) son adecuados para la producción de semillas que, después del tratamiento con un compuesto de fórmula (I), se someten a un proceso de recubrimiento de película para evitar la abrasión del polvo sobre las semillas.

- 50 Una de las ventajas que se producen cuando uno de los compuestos de la fórmula (I) actúa sistémicamente consiste en que el tratamiento de la semilla protege no sólo la semilla propiamente dicha sino también las plantas resultantes de ella, después de la emergencia, de plagas animales. De esta manera, se puede prescindir del tratamiento inmediato del cultivo al momento de la siembra o poco tiempo después.

Otra ventaja es que el tratamiento de las semillas con un compuesto de la fórmula (I) puede mejorar la germinación y la emergencia de las semillas tratadas.

- 55 Asimismo se considera ventajoso que los compuestos de la fórmula (I) también se puedan usar en especial para semillas transgénicas.

Los compuestos de la fórmula (I) también se pueden usar en combinación con composiciones de tecnología de señalización, que dan como resultado, por ejemplo, una mejor colonización por simbioses, por ejemplo, rizobia, micorrizae y/o bacterias u hongos endofíticos, y/o fijación optimizada de nitrógeno.

Los compuestos de la fórmula (I) son apropiados para la protección de semillas de cualquier variedad de plantas que se usa en agricultura, en el invernadero, en forestas o en horticultura. Más en particular, esto incluye semillas de cereales (por ejemplo, trigo, cebada, centeno, mijo y avena), maíz, algodón, frijoles de soja, arroz, patatas, girasoles, café, tabaco, canola, colza oleaginosa, nabos (por ejemplo, remolachas y remolachas forrajeras), maníes, hortalizas (por ejemplo, tomates, pepinos, guisantes, vegetales crucíferos, cebollas y lechuga), plantas frutales, céspedes y plantas ornamentales. Es de particular importancia el tratamiento de las semillas de cereales (tales como trigo, cebada, centeno y avena), maíz, soja, algodón, canola, colza oleaginosa y arroz.

Como ya se mencionó con anterioridad, el tratamiento de semillas transgénicas con un compuesto de la fórmula (I) también es de particular importancia. Esto implica las semillas de plantas que, en general, contienen al menos un gen heterólogo que controla la expresión de un polipéptido que tiene propiedades en particular insecticidas y/o nematocidas en particular. Los genes heterólogos en semillas transgénicas pueden originarse de microorganismos tales como *Bacillus*, *Rhizobium*, *Pseudomonas*, *Serratia*, *Trichoderma*, *Clavibacter*, *Glomus* o *Glyocladium*. La presente invención es apropiada en particular para el tratamiento de semillas transgénicas que contienen al menos un gen heterólogo que se origina de *Bacillus* sp. Es más preferible un gen heterólogo derivado de *Bacillus thuringiensis*.

En el contexto de la presente invención, el compuesto de la fórmula (I) se aplica a las semillas. Con preferencia, la semilla se trata en un estado en el que es suficientemente estable para evitar que el daño se produzca en el curso del tratamiento. En general, la semilla se puede tratar en cualquier momento entre la siembra y la cosecha. Es habitual usar las semillas que se han separado de la planta y liberado de mazorcas, vainas, tallos, capas, pelos o la pulpa de las frutas. Por ejemplo, es posible usar semillas que fueron cosechadas, limpiadas y secadas hasta un contenido de humedad que permite el almacenamiento. Alternativamente, también es posible usar semillas que, después de secar, se han tratado con, por ejemplo, agua y luego se vuelven a secar, por ejemplo, cebado. En el caso de semillas de arroz, también es posible usar simientes que, por ejemplo, se prehincharían en agua hasta un determinado estadio (estadio de pecho de paloma), lo cual lleva a una mejor germinación y una emergencia más homogénea.

En general, en el tratamiento de las semillas, se ha de asegurar que la cantidad del compuesto de la fórmula (I) y/u otros aditivos aplicados a la semilla se seleccione de modo tal que la germinación de la semilla no se vea alterada y la planta que surge de ella no esté dañada. Esto se debe asegurar en particular en el caso de principios activos que pueden exhibir efectos fitotóxicos en ciertas tasas de aplicación.

Los compuestos de la fórmula (I) se aplican en general a las semillas en una formulación apropiada. Las formulaciones y procesos apropiados para el tratamiento de semillas son conocidos por los expertos en la técnica.

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

Estas formulaciones se producen de una manera conocida, mezclando los compuestos de la fórmula (I) con aditivos habituales, por ejemplo, diluyentes convencionales y disolventes o diluyentes, tinturas, humectantes, dispersantes, emulsionantes, antiespumantes, conservantes, espesantes secundarios, adhesivos, gibberellinas y también agua.

Las tinturas que pueden estar presentes en las formulaciones de desinfección de semillas útiles de acuerdo con la invención son todas tinturas que son habituales para tales fines. Es posible usar ya sea pigmentos, que son poco solubles en agua o tinturas, que son solubles en agua. Los ejemplos incluyen las tinturas conocidas por los nombres Rhodamine B, C.I. Pigment Red 112 y C.I. Solvent Red 1.

Los humectantes útiles que pueden estar presentes en las formulaciones de desinfección de semillas útiles de acuerdo con la invención son todas sustancias que promueven la humectación y que se usan convencionalmente para la formulación de principios agroquímicamente activos. Se da preferencia al uso de naftalensulfonatos de alquilo, tales como naftalensulfonatos de diisopropilo o diisobutilo.

Los dispersantes y/o emulsionantes útiles que pueden estar presentes en las formulaciones de desinfección de semillas útiles de acuerdo con la invención son todos dispersantes no iónicos, aniónicos y catiónicos usados convencionalmente para la formulación de principios agroquímicamente activos. Se da preferencia al uso de dispersantes no iónicos o aniónicos o mezclas de dispersantes no iónicos o aniónicos. Los dispersantes no iónicos apropiados incluyen en particular polímeros de bloque de óxido de etileno / óxido de propileno, alquilfenolpoliglicoléteres y triestirilfenolpoliglicoléteres y sus derivados fosfatados o sulfatados. Los dispersantes aniónicos apropiados son en especial lignosulfonatos, sales de ácido poliacrílico y condensados de sulfonato de arilo / formaldehído.

Los antiespumantes que pueden estar presentes en las formulaciones de desinfección de semillas útiles de acuerdo con la invención son todas sustancias inhibidoras de espuma usadas convencionalmente para la formulación de principios agroquímicamente activos. Los antiespumantes siliconados y estearato de magnesio se pueden usar con

preferencia.

Los conservantes que pueden estar presentes en las formulaciones de desinfección de semillas útiles de acuerdo con la invención son todas sustancias útiles para tales fines en composiciones agroquímicas. Los ejemplos incluyen diclorofeno y alcohol bencílico hemiformal.

- 5 Los espesantes secundarios que pueden estar presentes en las formulaciones de desinfección de semillas útiles de acuerdo con la invención son todas sustancias que se pueden usar para tales fines en composiciones agroquímicas. Los ejemplos preferidos incluyen derivados celulósicos, derivados de ácido acrílico, xantano, arcillas modificadas y sílice finamente dividida.

- 10 Los adhesivos útiles que pueden estar presentes en las formulaciones de desinfección de semillas útiles de acuerdo con la invención son todos aglutinantes habituales útiles en productos de desinfección de semillas. Los ejemplos preferidos incluyen polivinilpirrolidona, acetato de polivinilo, alcohol polivinílico y tilosa.

- 15 Las gibberellinas que pueden estar presentes en las formulaciones de desinfección de semillas útiles de acuerdo con la invención son preferentemente las gibberellinas A1, A3 (= ácido gibberélico), A4 y A7; se da particular preferencia al uso de ácido gibberélico. Las gibberellinas son conocidas (comp. R. Wegler "Chemie der Pflanzenschutz- und Schädlingsbekämpfungsmittel" [Química de la Composiciones de Protección de Cultivos y Pesticidas], vol. 2, Springer Verlag, 1970, p. 401-412).

- 20 Las formulaciones de desinfección de semillas útiles de acuerdo con la invención se pueden usar para tratar una amplia variedad de diferentes tipos de semillas ya sea directamente o después de dilución previa con agua. Por ejemplo, los concentrados o las preparaciones obtenidas de ellos por dilución con agua se pueden usar para desinfectar las semillas de cereales, tales como trigo, cebada, centeno, avena y triticale y también las semillas de maíz, arroz, colza oleaginosa, guisantes, frijoles, algodón, girasoles, frijoles de soja y nabos o incluso una amplia variedad de diferentes semillas vegetales. Las formulaciones de desinfección de semillas útiles de acuerdo con la invención o sus formas de uso diluidas también se pueden usar para desinfectar semillas de plantas transgénicas.

- 25 Para el tratamiento de semillas con las formulaciones de desinfección de semillas útiles de acuerdo con la invención o las formas de uso preparadas de ellas, son de utilidad todas las unidades de mezcla útiles habitualmente para la desinfección de semillas. Específicamente, el procedimiento en la desinfección de las semillas consiste en colocar las semillas en un mezclador, en operación por lotes o de forma continua, para añadir la cantidad deseada particular de las formulaciones de desinfección de semillas, ya sea como tal o después de dilución previa con agua y mezclar hasta que la formulación se distribuya de forma homogénea en la semilla. De ser apropiado, está seguido por una operación de secado.

- 30 La tasa de aplicación de las formulaciones de desinfección de semillas útiles de acuerdo con la invención se puede variar dentro de un rango relativamente amplio. Está guiada por el contenido particular de los compuestos de la fórmula (I) en las formulaciones y las semillas. Las tasas de aplicación del compuesto de la fórmula (I) están en general entre 0,001 y 50 g por kilogramo de semilla, preferentemente, entre 0,01 y 15 g por kilogramo de semilla.

35 **Salud animal**

Las referencias a procedimientos de tratamiento terapéutico o quirúrgico o procedimientos de diagnóstico in vivo en el siguiente texto de esta especificación deben entenderse como referencias a compuestos, preparaciones farmacéuticas y fármacos para uso en estos procedimientos.

- 40 En el campo de la salud animal, es decir, el campo de la medicina veterinaria, los compuestos de la fórmula (I) son activos contra parásitos animales, en especial ectoparásitos o endoparásitos. El término endoparásitos comprende en especial helmintos y protozoos tales como coccidios. Los ectoparásitos son típicamente y con preferencia artrópodos, en especial insectos y ácaros.

- 45 En el campo de la medicina veterinaria, los compuestos de la fórmula (I) son apropiados, que tienen favorable toxicidad en homeotermos, para controlar parásitos que aparecen en la cría de animales y la ganadería, animales de cría, animales de zoológico, animales de laboratorio, animales experimentales y animales domésticos. Son activos contra todas las etapas o las etapas específicas de desarrollo de parásitos.

El ganado agrícola incluye, por ejemplo, mamíferos, tales como ovejas, cabras, caballos, burros, camellos, búfalos, conejos, renos, ciervos y en particular vacas y cerdos; aves tales como pavos, patos, gansos y en particular gallinas; peces y crustáceos, por ejemplo, en acuicultura; y también insectos tales como abejas.

- 50 Los animales domésticos incluyen, por ejemplo, mamíferos, tales como hámsteres, conejillos de Indias, ratas, ratones, chinchillas, hurones y en particular perros, gatos, aves de jaula, reptiles, anfibios y peces de acuario.

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

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

El uso de los compuestos de la fórmula (I) para controlar animal parásitos se pretende reducir o evitar enfermedades, casos de muerte y reducciones de rendimientos (en el caso de carne, leche, lana, cueros, huevos, miel, y similares), de modo que permiten de forma más económica y más simple el cuidado de animales y se puede lograr un mejor bienestar de los animales.

- 5 En relación con el sector de la salud animal, el término “control” o “controla” significa que los compuestos de la fórmula (I) son efectivos para reducir la incidencia del parásito particular en un animal infectado con tales parásitos en un grado inocuo. Más específicamente, “control”, en el presente contexto, significa que el compuesto de la fórmula (I) puede matar el respectivo parásito, inhibir su crecimiento o inhibir su proliferación.

Entre los artrópodos, se cuentan:

- 10 del orden Anoplurida, por ejemplo, *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phtirus* spp., *Solenopotes* spp.; del orden Mallophagida y de los subórdenes Amblycerina e Ischnocerina, por ejemplo, *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Damalina* spp., *Trichodectes* spp., *Felicola* spp.; del orden Diptera y de los subórdenes Nematocerina y Brachycerina, por ejemplo, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Simulium* spp., *Eusimulium* spp., *Phlebotomus* spp., *Lutzomyia* spp., *Culicoides* spp.,
15 *Chrysops* spp., *Odagmia* spp., *Wilhelmia* spp., *Hybomitra* spp., *Atylotus* spp., *Tabanus* spp., *Haematopota* spp., *Philopomyia* spp., *Braula* spp., *Musca* spp., *Hydrotaea* spp., *Stomoxys* spp., *Haematobia* spp., *Morellia* spp., *Fannia* spp., *Glossina* spp., *Calliphora* spp., *Lucilia* spp., *Chrysomyia* spp., *Wohlfahrtia* spp., *Sarcophaga* spp., *Oestrus* spp., *Hypoderma* spp., *Gasterophilus* spp., *Hippobosca* spp., *Lipoptena* spp., *Melophagus* spp., *Rhinoestrus* spp., *Tipula* spp.; del orden Siphonaptera, por ejemplo, *Pulex* spp., *Ctenocephalides* spp., *Tunga* spp., *Xenopsylla* spp.,
20 *Ceratophyllus* spp.;

del orden Heteropterida, por ejemplo, *Cimex* spp., *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongylus* spp.; así como parásitos y parásitos de higiene del orden Blattaria.

Además, se cuentan entre los artrópodos:

- 25 De la subclase ácaros (Acarina) y del orden Metastigmata, por ejemplo, de la familia Argasidae, como *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Otobius* spp., de la familia Ixodidae, como *Ixodes* spp., *Amblyomma* spp., *Rhipicephalus* (*Boophilus*) spp., *Dermacentor* spp., *Haemophysalis* spp., *Hyalomma* spp., *Rhipicephalus* spp. (el género original de las garrapatas polivalentes); del orden Mesostigmata como *Dermanyssus* spp., *Ornithonyssus* spp., *Pneumonyssus* spp., *Raillietia* spp., *Pneumonyssus* spp., *Sternostoma* spp., *Varroa* spp., *Acarapis* spp.; del orden Actiniedida (Prostigmata), por ejemplo, *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp., *Ornithocheyletiella* spp., *Myobia* spp., *Psorergates* spp., *Demodex* spp.,
30 *Trombicula* spp., *Neotrombicula* spp., *Listrophorus* spp.; y del orden Acaridida (Astigmata), por ejemplo, *Acarus* spp., *Tyrophagus* spp., *Caloglyphus* spp., *Hypodectes* spp., *Pterolichus* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Otodectes* spp., *Sarcoptes* spp., *Notoedres* spp., *Knemidocoptes* spp., *Cytodites* spp., *Laminosioptes* spp.

Entre los protozoos parasitarios, se cuentan:

- 35 Mastigophora (Flagellata), tales como, por ejemplo, Trypanosomatidae, por ejemplo, *Trypanosoma* b. *brucei*, T.b. *gambiense*, T.b. *rhodesiense*, T. *congolense*, T. *cruzi*, T. *evansi*, T. *equinum*, T. *lewisii*, T. *percae*, T. *simiae*, T. *vivax*, *Leishmania* *brasilensis*, L. *donovani*, L. *tropica*, como por ejemplo, Trichomonadidae, por ejemplo, *Giardia lamblia*, G. *canis*;

Sarcomastigophora (Rhizopoda), tales como Entamoebidae, por ejemplo, *Entamoeba histolytica*, Hartmannellidae, por ejemplo, *Acanthamoeba* sp., *Hartmannella* sp.;

- 40 Apicomplexa (Sporozoa), como Eimeridae, por ejemplo, *Eimeria* *acervulina*, E. *adenoides*, E. *alabamensis*, E. *anatis*, E. *anserina*, E. *arlogingi*, E. *ashata*, E. *auburnensis*, E. *bovis*, E. *brunetti*, E. *canis*, E. *chinchillae*, E. *clupearum*, E. *columbae*, E. *contorta*, E. *crandallii*, E. *debliecki*, E. *dispersa*, E. *ellipsoides*, E. *falciformis*, E. *faurei*, E. *flavescens*, E. *gallopavonis*, E. *hagani*, E. *intestinalis*, E. *iroquoiana*, E. *irresidua*, E. *labbeana*, E. *leucarti*, E. *magna*, E. *maxima*, E. *media*, E. *meleagridis*, E. *meleagritidis*, E. *mitis*, E. *necatrix*, E. *ninakhlyakimovae*, E. *ovis*, E. *parva*, E. *pavonis*, E. *perforans*, E. *phasani*, E. *piriformis*, E. *praecox*, E. *residua*, E. *scabra*, E. *spec.*, E. *stiedai*, E. *suis*, E. *tenella*, E. *truncata*, E. *truttae*, E. *zuernii*, *Globovium* spec., *Isospora* *belli*, I. *canis*, I. *felis*, I. *ohioensis*, I. *rivolta*, I. *spec.*, I. *suis*, *Cystisporidia* spec., *Cryptosporidium* spec., en especial C. *parvum*; como Toxoplasmatidae, por ejemplo, *Toxoplasma gondii*, *Hammondia heydornii*, *Neospora caninum*, *Besnoitia besnoitii*; como Sarcocystidae, por ejemplo, *Sarcocystis* *bovicanis*, S. *bovihominis*, S. *ovicanis*, S. *ovifelis*, S. *neurona*, S. *spec.*, S. *suihominis*, como Leucosporidia, por ejemplo,
45 *Leucosporidium* *simondi*, como Plasmodiidae, por ejemplo, *Plasmodium* *berghei*, P. *falciparum*, P. *malariae*, P. *ovale*, P. *vivax*, P. *spec.*, como Piroplasmidae, por ejemplo, *Babesia* *argentina*, B. *bovis*, B. *canis*, B. *spec.*, *Theileria* *parva*, *Theileria* spec., como Adeleina, por ejemplo, *Hepatozoon* *canis*, H. spec..

Entre los endoparásitos patógenos en los que se trata de helmintos, se cuentan gusanos planos (por ejemplo, Monogenea, Cestodes y Trematodes), gusanos redondos, Acanthocephala y Pentastoma. Se cuentan entre ellos:

- 55 Monogenea: por ejemplo: *Gyrodactylus* spp., *Dactylogyrus* spp., *Polystoma* spp.;

Cestodes: del orden Pseudophyllidea, por ejemplo: *Diphylobothrium* spp., *Spirometra* spp., *Schistocephalus* spp., *Ligula* spp., *Bothridium* spp., *Diplogonoporus* spp.;

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

- 10 Trematodes: de la clase Digenea por ejemplo: *Diplostomum* spp., *Posthodiplostomum* spp., *Schistosoma* spp., *Trichobilharzia* spp., *Ornithobilharzia* spp., *Austrotrichobilharzia* spp., *Gigantobilharzia* spp., *Leucochloridium* spp., *Brachylaima* spp., *Echinostoma* spp., *Echinoparyphium* spp., *Echinochasmus* spp., *Hypoderaeum* spp., *Fasciola* spp., *Fascioloides* spp., *Fasciolopsis* spp., *Cyclocoelum* spp., *Typhlocoelum* spp., *Paramphistomum* spp., *Calicophoron* spp., *Cotylophoron* spp., *Gigantocotyle* spp., *Fiscoederius* spp., *Gastrothylacus* spp., *Notocotylus* spp., *Catantropis* spp., *Plagiorchis* spp., *Prosthogonimus* spp., *Dicrocoelium* spp., *Eurytrema* spp., *Troglostrongylus* spp., *Paragonimus* spp., *Collyriclum* spp., *Nanophyetus* spp., *Opisthorchis* spp., *Clonorchis* spp., *Metorchis* spp., *Heterophyes* spp., *Metagonimus* spp.;

- 15 gusanos redondos: Trichinellida por ejemplo: *Trichuris* spp., *Capillaria* spp., *Paracapillaria* spp., *Eucoleus* spp., *Trichomosoides* spp., *Trichinella* spp.;

del orden Tylenchida por ejemplo: *Micronema* spp., *Strongyloides* spp.;

- 20 del orden Rhabditida por ejemplo: *Strongylus* spp., *Triodontophorus* spp., *Oesophagodontus* spp., *Trichonema* spp., *Gyaloccephalus* spp., *Cylindropharynx* spp., *Poteriostomum* spp., *Cyclocercus* spp., *Cylicostephanus* spp., *Oesophagostomum* spp., *Chabertia* spp., *Stephanurus* spp., *Ancylostoma* spp., *Uncinaria* spp., *Necator* spp., *Bunostomum* spp., *Globocephalus* spp., *Syngamus* spp., *Cyathostoma* spp., *Metastrongylus* spp., *Dictyocaulus* spp., *Muellerius* spp., *Protostrongylus* spp., *Neostongylus* spp., *Cystocaulus* spp., *Pneumostongylus* spp., *Spicocaulus* spp., *Elaphostongylus* spp., *Parelaphostongylus* spp., *Crenosoma* spp., *Paracrenosoma* spp., *Oslerus* spp., *Angiostrongylus* spp., *Aelurostrongylus* spp., *Filaroides* spp., *Parafilaroides* spp., *Trichostrongylus* spp., *Haemonchus* spp., *Ostertagia* spp., *Teladorsagia* spp., *Marshallagia* spp., *Cooperia* spp., *Nippostrongylus* spp., *Heligmosomoides* spp., *Nematodirus* spp., *Hyostongylus* spp., *Obeliscoides* spp., *Amidostomum* spp., *Ollulanus* spp.;

- 30 del orden Spirurida por ejemplo: *Oxyuris* spp., *Enterobius* spp., *Passalurus* spp., *Syphacia* spp., *Aspiculuris* spp., *Heterakis* spp., *Ascaris* spp., *Toxascaris* spp., *Toxocara* spp., *Baylisascaris* spp., *Parascaris* spp., *Anisakis* spp., *Ascaridia* spp., *Gnathostoma* spp., *Physaloptera* spp., *Thelazia* spp., *Gongylonema* spp., *Habronema* spp., *Parabronema* spp., *Draschia* spp., *Dracunculus* spp., *Stephanofilaria* spp., *Parafilaria* spp., *Setaria* spp., *Loa* spp., *Dirofilaria* spp., *Litomosoides* spp., *Brugia* spp., *Wuchereria* spp., *Onchocerca* spp., *Spirocera* spp.;

Acanthocephala: del orden Oligacanthorhynchida por ejemplo: *Macracanthorhynchus* spp., *Prosthenorchis* spp.; del orden Polymorphida por ejemplo: *Filicollis* spp.; del orden Moniliformida por ejemplo: *Moniliformis* spp.;

del orden Echinorhynchida por ejemplo, *Acanthocephalus* spp., *Echinorhynchus* spp., *Leptorhynchoides* spp.;

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

En el campo de la medicina veterinaria y la ganadería, la administración de los compuestos de la fórmula (I) se produce según procedimientos conocidos en general por los expertos, como enteral, parenteral, dérmico o nasal en forma de preparados apropiados. La administración se puede realizar de modo preventivo o terapéutico.

Así, una realización de la presente invención se refiere al uso de un compuesto de la fórmula (I) como medicamentos.

- 40 Otro aspecto se refiere al uso de un compuesto de la fórmula (I) como agente antiendoparasitario, en especial como un helminticida o un agente contra protozoos. Los compuestos de la fórmula (I) son apropiados para usar como agente antiendoparasitario, en especial como un helminticida o agente contra protozoos, por ejemplo, en la cría de animales, en la ganadería, en establos y en el sector de higiene.

- 45 Otro aspecto, a su vez, se refiere al uso de un compuesto de la fórmula (I) como agente antiendoparasitario, en especial un artropodocida como un insecticida o acaricida. Otro aspecto se refiere al uso de un compuesto de la fórmula (I) como agente antiendoparasitario, en especial un artropodocida como un insecticida o acaricida, por ejemplo, en la cría de animales, en establos o en el sector de higiene.

Control de vectores

- 50 Las referencias a métodos de tratamiento terapéutico o quirúrgico o métodos de diagnóstico in vivo en la siguiente sección de texto de esta especificación deben entenderse como referencias a compuestos, preparaciones farmacéuticas y fármacos para su uso en estos métodos.

Los compuestos de la fórmula (I) también se pueden usar en el control de vectores. En el contexto de la presente invención, un vector es un artrópodo, en especial un insecto o arácnido, capaz de transmitir patógenos, por ejemplo,

virus, gusanos, organismos monocelulares y bacterias de un reservorio (planta, animal, humano, etc.) a un huésped. Los patógenos se pueden transmitir ya sea mecánicamente (por ejemplo, tracoma por moscas no picadoras) a un huésped o después de inyección (por ejemplo, parásitos de paludismo por mosquitos) en un huésped.

Los ejemplos de vectores y las enfermedades o patógenos que transmiten son:

- 5 1) Mosquitos
 - Anopheles: paludismo, filariasis;
 - Culex: encefalitis japonesa, filariasis, otras enfermedades virales, transmisión de gusanos;
 - Aedes: fiebre amarilla, fiebre del dengue, filariasis, otras enfermedades virales;
 - Simuliidae: transmisión de gusanos, en particular *Onchocerca volvulus*;
- 10 2) Piojos: infecciones cutáneas, tifus epidémico;
- 3) Pulgas: plaga, tifus endémico;
- 4) Moscas: tripanosomiasis; cólera, otras enfermedades bacterianas;
- 5) Ácaros: acariosis, tifus epidémico, rickettsialpox, tularaemia, encefalitis de Saint Louis, encefalitis transmitida por garrapatas (TBE), fiebre hemorrágica de Crimea–Congo, borreliosis;
- 15 6) Garrapatas: boreliosis tales como *Borrelia duttoni*, encefalitis transmitida por garrapatas, fiebre Q (*Coxiella burnetii*), babesiosis (*Babesia canis canis*).

Los ejemplos de vectores en el contexto de la presente invención son insectos, por ejemplo, áfidos, moscas, saltamontes o trips, que pueden transmitir virus de plantas a plantas. Otros vectores capaces de transmitir virus de plantas son ácaros de la araña, piojos, escarabajos y nematodos.

- 20 Otros ejemplos de vectores en el contexto de la presente invención son insectos y arácnidos tales como mosquitos, en especial de los géneros *Aedes*, *Anopheles*, por ejemplo, *A. gambiae*, *A. arabiensis*, *A. funestus*, *A. dirus* (paludismo) y *Culex*, piojos, pulgas, moscas, ácaros y garrapatas que pueden transmitir patógenos a animales y/o humanos.

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

- 25 Los compuestos de la fórmula (I) son apropiados para usar en la prevención de enfermedades y/o patógenas transmitidas por vectores. Así, otro aspecto de la presente invención es el uso de compuestos de la fórmula (I) para el control de vectores, por ejemplo, en agricultura, en horticultura, en forestas, en jardines y en instalaciones de ocio y también en la protección de materiales y productos almacenados.

Protección de materiales industriales

- 30 Los compuestos de la fórmula (I) son apropiados para proteger materiales industriales contra el ataque o la destrucción por insectos, por ejemplo, de los órdenes Coleoptera, Hymenoptera, Isoptera, Lepidoptera, Psocoptera y Zygentoma.

Los materiales industriales en el presente contexto se entienden como materiales inanimados, tales como, preferentemente, plásticos, adhesivos, tamaños, papeles y tarjetas, cuero, madera, productos de madera procesados y composiciones de recubrimiento. El uso de la invención para proteger la madera se prefiere en particular.

- 35 En otra realización, los compuestos de la fórmula (I) se usan junto con al menos otro insecticida y/o al menos un fungicida.

En otra realización, los compuestos de la fórmula (I) están en forma de un pesticida listo para usar, lo que significa que se pueden aplicar al material en cuestión sin ulteriores modificaciones. Otros insecticidas o fungicidas apropiados son en particular aquellos mencionados con anterioridad.

- 40 Sorprendentemente, también se halló que los compuestos de la fórmula (I) se pueden emplear para proteger objetos que entran en contacto con agua salina o salobre, en especial cascos, pantallas, redes, edificios, amarres y sistemas de señalización, contra ensuciamiento. Igualmente es posible usar los compuestos de la fórmula (I), solos o en combinación con otros principios activos como agentes antisuciedad.

Control de plagas animales en el sector de higiene

- 45 Los compuestos de la fórmula (I) son apropiados para controlar plagas animales en el sector de higiene. Más en particular, la invención se puede usar en el sector doméstico, en el sector de higiene y en la protección de productos almacenados, en particular para controlar insectos, arácnidos y ácaros hallados en espacios cerrados, por ejemplo, viviendas, naves industriales, oficinas, cabinas ed vehículos. Para controlar plagas animales, los compuestos de la

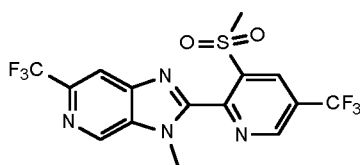
fórmula (I) se usan solos o en combinación con otros principios activos y/o auxiliares. Se usan preferentemente en productos insecticidas domésticos. Los compuestos de la fórmula (I) son efectivos contra especies sensibles y resistentes contra cualquier estadio de desarrollo.

- 5 Estas plagas incluyen, por ejemplo, plagas de la clase Arachnida, de los órdenes Scorpiones, Araneae y Opiliones, de las clases Chilopoda y Diplopoda, de la clase Insecta, el orden Blattodea, de los órdenes Coleoptera, Dermaptera, Diptera, Heteroptera, Hymenoptera, Isoptera, Lepidoptera, Phthiraptera, Psocoptera, Saltatoria u Orthoptera, Siphonaptera y Zygentoma y de la clase Malacostraca, el orden Isopoda.

- 10 La aplicación se efectúa, por ejemplo, en aerosoles, productos de pulverización no presurizados, por ejemplo, sprays de bomba y atomización, sistemas automáticos de nebulización, nebulizadores, espumas, geles, productos de evaporación con comprimidos evaporadores hechos de celulosa o plástico, evaporadores líquidos, evaporadores de gel y membrana, evaporadores accionados por hélice, sistemas de evaporación sin energía o pasivos, papeles de polillas, bolsas de polillas y geles de polillas, como gránulos o polvos, en cebos para dispersión o estaciones de cebo.

Ejemplos de preparación:

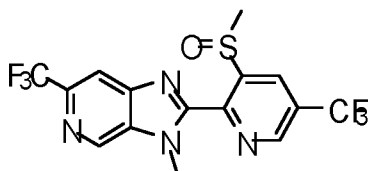
- 15 **Ejemplo de preparación 1: 3-metil-2-[3-(metilsulfinil)-5-(trifluorometil)piridin-2-il]-6-(trifluorometil)-3H-imidazo[4,5-c]piridina (I-36), no según la invención**



- 20 41 mg (0,10 mmol) de 3-metil-2-[3-(metilsulfinil)-5-(trifluorometil)piridin-2-il]-6-(trifluorometil)-3H-imidazo[4,5-c]piridina se disuelven en 4 ml de diclorometano, se añadieron a 0 °C 86,5 mg (0,36 mmol) de ácido meta-cloroperbenzoico y luego se agitan 20 h a temperatura ambiente. La preparación se mezcla con solución de bisulfito de sodio, se agita durante 10 min, se diluye con 30 ml de agua y se regula con solución de lejía de sosa al 45% a pH 9-10. La preparación se extrae tres veces con diclorometano y las fases orgánicas combinadas luego se liberan al vacío del disolvente.

(logP (neutro): 2,64; MH⁺: 425; ¹H-RMN (400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 3,70 (s, 3H), 3,93 (s, 3H), 8,35 (s, 1H), 8,83 (s, 1H), 9,32 (s, 1H), 9,58 (s, 1H).

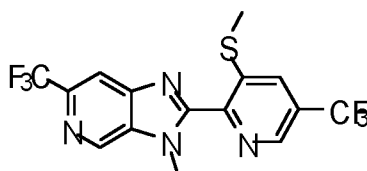
- 25 **Preparación de 3-metil-2-[3-(metilsulfinil)-5-(trifluorometil)piridin-2-il]-6-(trifluorometil)-3H-imidazo[4,5-c]piridina (I-26), no según la invención**



- 30 41 mg (0,10 mmol) de 3-metil-2-[3-(metilsulfinil)-5-(trifluorometil)piridin-2-il]-6-(trifluorometil)-3H-imidazo[4,5-c]piridina se disuelven en 4 ml de diclorometano y se mezclan a temperatura ambiente con 1,92 mg (0,04 mmol) de ácido fórmico y 28,44 mg de una solución al 35% de peróxido de hidrógeno. La preparación se agita durante 5 h a temperatura ambiente, se mezcla con solución de bisulfito de sodio y se agita durante otras 3 h. Luego se agita con solución al 10% de hidrógeno-carbonato de sodio, la fase orgánica se separa, la fase acuosa se extrae dos veces con diclorometano, las fase orgánicas se combinan y luego se liberan del disolvente al vacío.

(logP (neutro): 2,76; MH⁺: 409; ¹H-RMN(400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 3,15 (s, 3H), 4,35 (s, 3H), 8,37 (s, 1H), 8,85 (s, 1H), 9,37 (s, 1H), 9,39 (s, 1H).

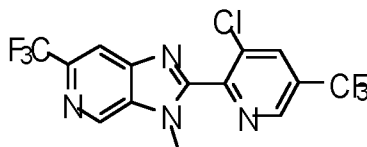
- 35 **Preparación de 3-metil-2-[3-(metilsulfinil)-5-(trifluorometil)piridin-2-il]-6-(trifluorometil)-3H-imidazo[4,5-c]piridina (I-3), no según la invención**



150 mg (0,39 mmol) de 2-[3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il]-3-metil-6-(trifluorometil)-3H-imidazo[4,5-c]piridina y 83 mg (1,18 mmol) de metantolato de sodio se agitan durante 6 h a temperatura ambiente en DMF. La preparación se mezcla con agua y se extrae tres veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se lavan con una solución de cloruro de sodio, se separan, se secan sobre sulfato de sodio y se liberan del disolvente al vacío.

- 5 (logP (neutro): 3,16; MH^+ : 393; 1H -RMN(400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 2,58 (s, 3H), 4,06 (s, 3H), 8,27 (s, 1H), 8,32 (s, 1H), 8,95 (s, 1H), 9,29 (s, 1H).

Preparación de 2-[3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il]-3-metil-6-(trifluorometil)-3H-imidazo[4,5-c]piridina (IX-01)

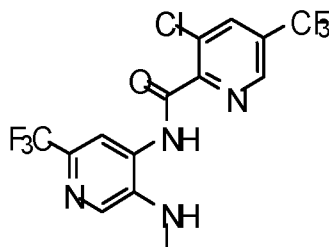


- 10 950 mg (4,97 mmol) de N^3 -metil-6-(trifluorometil)piridin-3,4-diamina (II-01), 1,12 g (4,97 mmol) de ácido 3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-carboxílico y 953 mg (4,97 mmol) de clorhidrato de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida (EDCI) se agitan en 10 ml de piridina 7 h a 115 °C. La mezcla de reacción se libera del disolvente al vacío, luego se añade agua y se extrae tres veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se secan sobre sulfato de sodio, se vuelve a concentrar y se purifica por purificación por cromatografía en columna a través de HPLC preparativa con un gradiente de agua / acetonitrilo como eluyente.

(logP (neutro): 2,96; MH^+ : 381; 1H -RMN (400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 4,00 (s, 3H), 8,35 (s, 1H), 8,86 (s, 1H), 9,22 (s, 1H), 9,30 (s, 1H).

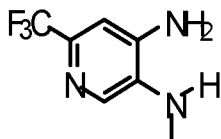
Preparación de 3-cloro-N-[5-(metilamino)-2-(trifluorometil)piridin-4-il]-5-(trifluorometil)-piridin-2-carboxamida (VIII-01)

- 20 Según la disposición anterior para la preparación de 2-[3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il]-3-metil-6-(trifluorometil)-3H-imidazo[4,5-c]piridina (IX-01) de N^3 -metil-6-(trifluorometil)piridin-3,4-diamina (II-01) y ácido 3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-carboxílico también se puede preparar el compuesto 3-cloro-N-[5-(metilamino)-2-(trifluorometil)piridin-4-il]-5-(trifluorometil)-piridin-2-carboxamida (VIII-01) como intermediario del compuesto (IX-01).



- 25 (logP (neutro): 3,09; MH^+ : 399; 1H -RMN(400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 2,87 (d, 3H), 5,97 (q, 1H), 8,10 (s, 1H), 8,18 (s, 1H), 8,73 (s, 1H), 9,09 (s, 1H), 10,40 (br. S, 1H).

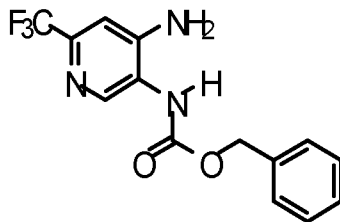
Preparación de N^3 -metil-6-(trifluorometil)piridin-3,4-diamina (II-01)



- 30 Una solución de 0,93 g (3,0 mmol) de [4-amino-6-(trifluorometil)piridin-3-il]carbamato de bencilo en 85 ml de tetrahidrofurano se enfría hasta 0 °C y se mezcla con 0,65 g (17 mmol) de hidruro de litio y aluminio. La mezcla se agita bajo argón durante 15 min a 0 °C y luego se agita durante 4 h a temperatura ambiente. El exceso de hidruro de litio y aluminio se destruye por adición de acetato de etilo, la mezcla se filtra y se extraen dos veces con 50 ml de ácido clorhídrico 2 N por vez. Los extractos combinados de ácido clorhídrico se regulan con carbonato de sodio bajo enfriamiento a pH = 8. Luego se extrae la mezcla dos veces con 100 ml de acetato de etilo por vez, las fases orgánicas se combinan, se secan sobre sulfato de sodio y el disolvente se destila al vacío. La ulterior purificación del producto se produce por recristalización de una mezcla de hexano/iso-propanol.

(MH⁺: 192; ¹H-RMN (400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 2,81 (d, 3H), 5,22 (q, 1H), 5,82 (br. s, 2H), 6,84 (s, 1H), 7,57 (s, 1H).

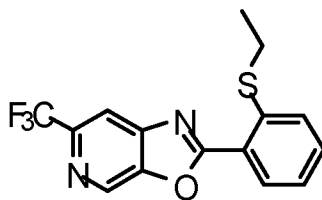
Preparación de [4-amino-6-(trifluorometil)piridin-3-il]carbamato de bencilo



5 0,91 g de 6-(trifluorometil)piridin-3,4-diamina se disuelven en una mezcla de 20 ml de tetrahidrofurano y 2 ml de piridina. Una solución de 1,07 g (6,3 mmol) de clorocarbonato de bencilo (éster bencílico de ácido clorofórmico) en 2 ml de tetrahidrofurano se agita gota a gota bajo agitación. Luego, la mezcla de reacción se agita durante la noche, se diluye con 100 ml de agua y se extrae dos veces con 100 ml de acetato de etilo por vez. Las fases orgánicas combinadas se lavan con 50 ml de agua, se secan sobre sulfato de sodio y se concentran. Por lavado del residuo con 50 ml de cloroformo, se obtiene el producto en forma de un sólido blanco.

10 (¹H-RMN (500 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 5,15 (s, 2H), 6,40 (br. s 2H), 7,05 (s, 1H), 7,30-7,45 (m, 5H), 8,35 (s, 1H), 9,00 (br. s, 1H).

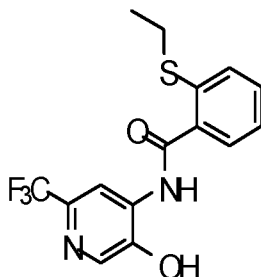
Ejemplo de preparación 2: 2-[2-(etilsulfanil)fenil]-6-(trifluorometil)[1,3]oxazolo[5,4-c]piridina (I-35)



15 400 mg (1,16 mmol) de 2-(etilsulfanil)-N-[5-hidroxi-2-(trifluorometil)piridin-4-il]benzamida y 398 mg (1,51 mmol) de trifenilfosfina se disuelven en 12 ml de THF y se añaden gota a gota 661 mg (1,51 mmol) de dietilazodicarboxilato al 40% (DEAD) en tolueno a temperatura ambiente. La preparación se agita durante 3 h a temperatura ambiente. Luego se destila el disolvente al vacío y el residuo se purifica por purificación por cromatografía en columna con un gradiente de agua / acetonitrilo como eluyente.

20 (logP (neutro): 4,07; MH⁺: 325; ¹H-RMN (400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 1,32 (t, 3H), 3,10 (q, 2H), 7,42 (t, 1H), 7,60-7,69 (m, 2H), 8,21 (d, 1H), 8,54 (s, 1H), 9,33 (s, 1H).

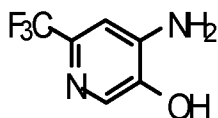
Preparación de 2-(etilsulfanil)-N-[5-hidroxi-2-(trifluorometil)piridin-4-il]benzamida (VIII-02)



25 206 mg (1,12 mmol) de ácido 2-(etilsulfanil)benzoico y 201 mg (1,12 mmol) de 4-amino-6-(trifluorometil)piridin-3-ol se disuelven en 5 ml de piridina, se añaden 325 mg (1,69 mmol) de clorhidrato de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida (EDCI) y se agita durante 2 h a 50 °C, así como 3 h a 80 °C. El disolvente se destila al vacío, el residuo se extrae en agua y se extrae con acetato de etilo. La fase orgánica se lava con una solución de cloruro de sodio, se separa, se seca sobre sulfato de sodio y se concentra. El residuo se purifica por purificación por cromatografía en columna a través de HPLC preparativa con un gradiente de agua / acetonitrilo como eluyente.

30 (logP (neutro): 1,59; MH⁺: 343; ¹H-RMN(400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 1,21 (t, 3H), 2,98 (q, 2H), 7,29-7,34 (m, 1H), 7,48-7,53 (m, 2H), 7,61 (d, 1H), 8,29 (s, 1H), 8,55 (s, 1H), 9,99 (s, 1H), 11,31 (br. S, 1H).

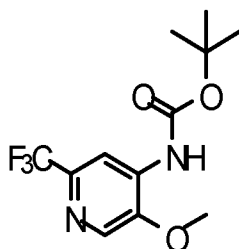
Preparación de 4-amino-6-(trifluorometil)piridin-3-ol (II-02)



12,3 g (42,1 mmol) de [5-metoxi-2-(trifluorometil)piridin-4-il]carbamato de ter-butilo se disuelven en 300 ml de diclorometano, se enfrían hasta -78 °C y se vierten gota a gota a esta temperatura 42,2 g (168 mmol) de tribromuro de boro en 150 ml de diclorometano. Se deja que la preparación llegue a temperatura ambiente durante la noche, luego se añaden 400 ml de solución de hidrógeno-carbonato de sodio y se extrae tres veces con 100 ml de diclorometano por vez. El disolvente se destila y el residuo se purifica por cromatografía de gel de sílice.

(¹H-RMN (90 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 7,00 (s, 1H), 7,9 (s, 1H).

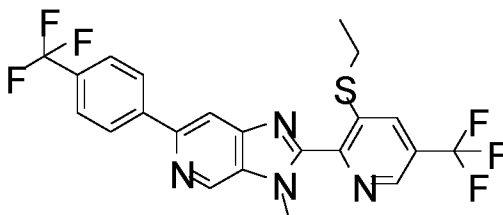
Preparación de [5-metoxi-2-(trifluorometil)piridin-4-il]carbamato de ter-butilo



A una solución de 9,80 g (44,3 mmol) de ácido 5-metoxi-2-(trifluorometil)isonicotínico en 980 ml de ter-butanol se añaden 65 g de tamiz molecular 4A, 14,6 g (53,1 mmol) de difenilfosforilazida (DPPA) y 5,37 g (53,1 mmol) de trietilamina a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se agita durante 23 h a 81 °C y luego se filtra del tamiz molecular 4Å. Después de destilar el ter-butanol al vacío, el residuo se mezcla con 500 ml de acetato de etilo, se lava con 250 ml de ácido clorhídrico 2 N, 250 ml de solución acuosa saturada de hidrógeno-carbonato de sodio, 250 ml de agua y 250 ml de solución de cloruro de sodio y se seca sobre sulfato de sodio. El disolvente se elimina al vacío y el residuo se lava tres veces con 15 ml de acetato de etilo por vez y se seca al vacío. La fase de acetato de etilo se purifica por cromatografía en gel de sílice (hexano / EtOAc 4:1 => 2:1).

(¹H-RMN (90 MHz, CDCl₃) δ ppm: 1,5 (s, 9H), 4,0 (s, 3H), 8,2 (s, 1H), 8,5 (s, 1H).

Preparación de 2-[3-etilsulfanil-5-(trifluorometil)-2-piridil]-3-metil-6-[4-(trifluorometil)-fenil]imidazo[4,5-c]piridina (1-64), no según la invención

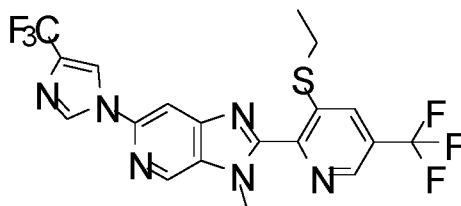


Una solución de 62 mg (0,58 mmol) de carbonato de sodio en 2 mL de una mezcla 4:1 de 1,2-dimetoxietano y agua se desgasifica en baño de ultrasonido y se añaden 73 mg (0,19 mmol) de 6-cloro-2-[3-etilsulfanil-5-(trifluorometil)-2-piridil]-3-metil-imidazo[4,5-c]piridina, así como 67 mg (0,35 mmol) de ácido [4-(trifluorometil)fenil]borónico. El recipiente se inunda con argón y luego se añaden 23 mg (20 μmol) de tetrakis(trifenilfosfina)paladio. La mezcla se calienta en un microondas CEM Discover durante 2 h 10 min hasta 140 °C, luego se mezcla con otros 68 mg (59 μmol) de tetrakis(trifenilfosfina)paladio y se calienta durante otras 4 h hasta 140 °C. La mezcla de reacción se filtra por lecho de Celite, que se enjuagó con acetato de etilo. Tras eliminar el disolvente a presión reducida, el residuo se separa cromatográficamente por MPLC en gel de sílice (gradiente: acetato de etilo / ciclohexano). Luego se separa otra vez por HPLC preparativa (gradiente: H₂O / acetonitrilo). Así se obtienen 14 mg (99% de pureza, 15% de rendimiento) de la 2-[3-etilsulfanil-5-(trifluorometil)-2-piridil]-3-metil-6-[4-(trifluorometil)-fenil]imidazo[4,5-c]piridina.

(logP (neutro): 3,95; MH⁺: 483; ¹H-RMN (400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 9,275 (2,6); 9,271 (2,5); 8,943 (4,3); 8,584 (2,6); 8,580 (2,6); 8,318 (0,5); 7,701 (3,0); 7,680 (3,9); 7,548 (3,8); 7,527 (3,0); 7,410 (4,6); 3,890 (16,0); 3,329 (75,4); 3,140 (1,3); 3,122 (4,2); 3,104 (4,3); 3,086 (1,4); 2,676 (0,9); 2,671 (1,2); 2,667 (0,9); 2,507 (140,3); 2,502 (179,9); 2,498 (134,5); 2,334 (0,9); 2,329 (1,2); 2,325 (0,9); 1,281 (4,6); 1,263 (9,7); 1,245 (4,5); 0,146 (0,4); 0,008 (3,6); 0,000 (84,0); -0,150 (0,4).

Preparación de 2-[3-etilsulfanil-5-(trifluorometil)-2-piridil]-3-metil-6-[4-(trifluorometil)-imidazol-1-il]imidazo[4,5-

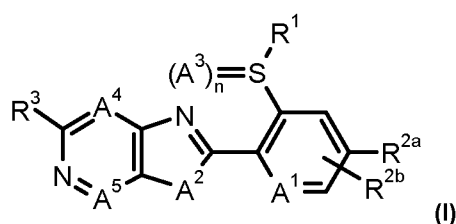
c]piridina (1-74), no según la invención



Bajo argón se añaden 99 mg (0,27 mmol) de 6-cloro-2-[3-etilsulfanil-5-(trifluorometil)-2-piridil]-3-metil-imidazo[4,5-c]piridina, 23 μ L (0,15 mmol) de *trans*-N,N'-dimetilciclohexan-1,2-diamina, 6,8 mg (36 μ mol) de yoduro de cobre (I), 30 mg (0,22 mmol) de 4-(trifluorometil)-1H-imidazol y 64 mg (0,46 mmol) de carbonato de potasio a 1 mL de tolueno desgasificado. El recipiente se cierra y la mezcla de reacción se calienta en un microondas CEM Discover durante 4 h hasta 110 °C. Después de enfriar hasta temperatura ambiente, se añade acetato de etilo y la mezcla se filtra por un lecho de Celite, que luego se enjuaga con acetato de etilo. El disolvente se elimina a presión reducida y el residuo se separa cromatográficamente por MPLC en gel de sílice (gradiente: acetato de etilo/ciclohexano). Así se obtienen 22 mg (100% de pureza, 18% de rendimiento) de la 2-[3-etilsulfanil-5-(trifluorometil)-2-piridil]-3-metil-6-[4-(trifluorometil)imidazol-1-il]imidazo[4,5-c]piridina.

(logP (neutro): 3,36; MH⁺: 473; ¹H-RMN (600 MHz, CD₃CN) δ ppm: 8,905 (3,0); 8,903 (3,0); 8,852 (1,6); 8,850 (1,6); 8,500 (1,9); 8,313 (1,5); 8,311 (2,1); 8,309 (1,4); 8,183 (1,7); 8,181 (1,7); 7,962 (3,4); 7,961 (3,4); 4,001 (16,0); 3,940 (0,4); 3,124 (1,1); 3,111 (3,4); 3,099 (3,5); 3,087 (1,2); 2,639 (0,7); 2,184 (55,7); 2,109 (1,2); 2,005 (2,2); 1,998 (195,7); 1,989 (2,7); 1,985 (1,8); 1,981 (10,0); 1,977 (18,2); 1,973 (26,5); 1,969 (18,0); 1,965 (9,0); 1,882 (1,2); 1,419 (0,4); 1,404 (0,7); 1,373 (0,6); 1,330 (4,1); 1,318 (9,0); 1,309 (1,6); 1,305 (5,2); 1,301 (3,4); 0,914 (0,6).

Análogamente a los ejemplos y según los procedimientos de preparación antes descritos, se pueden obtener los siguientes compuestos de la fórmula (I):



en donde A³ representa oxígeno y los demás sustituyentes, que tienen los siguientes significados indicados en la siguiente tabla:

Ejemplo	R ¹	n	A ⁴	A ⁵	R ³	A ²	A ¹	R ^{2a}	R ^{2b}
I-1	CH ₃	0	N	CH	CF ₃	O	CH	Cl	H
I-2	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-metilo	N	CF ₃	H
I-3	CH ₃	0	CH	CH	CF ₃	N-metilo	N	CF ₃	H
I-4	CH ₃	0	CH	CH	CF ₃	N-metilo	CH	F	H
I-5	CH ₃	0	CH	CH	CF ₃	N-metilo	CH	CF ₃	H
I-6	CH ₃	0	N	CH	CF ₃	N-metilo	CH	Cl	H
I-7	-(CH ₂) ₂ -SO ₂ -C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-metilo	N	CF ₃	H
I-8	i-C ₃ H ₇	1	CH	CH	CF ₃	N-metilo	N	CF ₃	H
I-9	C ₂ H ₅	0	N	CH	CF ₃	O	CH	H	H
I-10	CH ₃	1	CH	CH	CF ₃	N-metilo	CH	Cl	H
I-11	CH ₃	2	CH	CH	CF ₃	N-metilo	CH	Cl	H

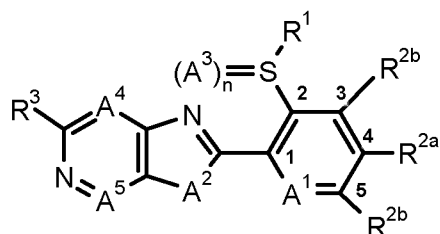
Ejemplo	R ¹	n	A ⁴	A ⁵	R ³	A ²	A ¹	R ^{2a}	R ^{2b}
I-12	CH ₃	1	CH	CH	CF ₃	N-metilo	CH	F	H
I-13	C ₂ H ₅	1	CH	CH	CF ₃	N-metilo	CH	H	5-Cl*
I-14	CH ₃	2	CH	CH	CF ₃	N-metilo	CH	CF ₃	H
I-15	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-metilo	N	H	H
I-16	i-C ₃ H ₇	2	CH	CH	CF ₃	N-metilo	N	CF ₃	H
I-17	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-metilo	CH	H	H
I-18	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-metilo	CH	H	H
I-19	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-metilo	CH	H	5-Cl*
I-20	CH ₃	2	CH	CH	CF ₃	N-metilo	CH	F	H
I-21	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-metilo	N	CF ₃	H
I-22	C ₂ H ₅	1	CH	CH	CF ₃	N-metilo	CH	H	H
I-23	-(CH ₂) ₂ -S-C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-metilo	N	CF ₃	H
I-24	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-metilo	N	H	H
I-25	CH ₃	0	CH	CH	CF ₃	N-metilo	CH	Cl	H
I-26	CH ₃	1	CH	CH	CF ₃	N-metilo	N	CF ₃	H
I-27	oxetan-3-ilo	2	CH	CH	CF ₃	N-metilo	CH	H	H
I-28	C ₂ H ₅	0	N	CH	CF ₃	N-metilo	N	CF ₃	H
I-29	CF ₃	0	CH	CH	CF ₃	N-metilo	N	H	H
I-30	CH ₃	1	CH	CH	CF ₃	N-metilo	CH	CF ₃	H
I-31	n-C ₃ H ₇	0	CH	CH	CF ₃	N-metilo	N	CF ₃	H
I-32	n-C ₃ H ₇	2	CH	CH	CF ₃	N-metilo	N	CF ₃	H
I-33	C ₂ H ₅	1	CH	CH	CF ₃	N-metilo	N	H	H
I-34	CH ₃	0	CH	CH	CF ₃	O	CH	Cl	H
I-35	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	O	CH	H	H
I-36	CH ₃	2	CH	CH	CF ₃	N-metilo	N	CF ₃	H
I-37	C ₂ H ₅	1	CH	CH	CF ₃	N-metilo	N	CF ₃	H
I-38	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-metilo	CH	H	5-Cl*
I-39	n-C ₃ H ₇	1	CH	CH	CF ₃	N-metilo	N	CF ₃	H
I-40	oxetan-3-ilo	0	CH	CH	CF ₃	O	CH	H	H
I-41	i-C ₃ H ₇	0	CH	CH	CF ₃	N-metilo	N	CF ₃	H
I-42	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-metilo	CH	Cl	H
I-43	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-metilo	CH	Cl	H

Ejemplo	R ¹	n	A ⁴	A ⁵	R ³	A ²	A ¹	R ^{2a}	R ^{2b}
I-44	C ₂ H ₅	1	CH	CH	CF ₃	N-metilo	CH	Cl	H
I-45	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-metilo	N	H	5-OMe*
I-46	C ₂ H ₅	0	CH	CH	C ₂ F ₅	N-metilo	N	H	H
I-47	C ₂ H ₅	0	CH	CH	C ₂ F ₅	N-metilo	N	CF ₃	H
I-48	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-metilo	N	H	3-CF ₃ *
I-49	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-metilo	N	H	5-NHCOMe*
I-50	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-metilo	N	H	5-NHCOMe*
I-51	C ₂ H ₅	1	CH	CH	CF ₃	N-metilo	N	H	3-CF ₃ *
I-52	C ₂ H ₅	2	CH	CH	Cl	N-metilo	N	CF ₃	H
I-53	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-metilo	N	H	5-OMe*
I-54	CH ₂ -CH ₂ F	2	CH	CH	CF ₃	N-metilo	N	CF ₃	H
I-55	C ₂ H ₅	0	CH	CH	Cl	N-metilo	N	CF ₃	H
I-56	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-metilo	N	CONH ₂	H
I-57	CH ₂ -CH ₂ F	2	CH	CH	CF ₃	N-metilo	N	CF ₃	H
I-58	CH ₂ -CH ₂ OH	2	CH	CH	CF ₃	N-metilo	N	CF ₃	H
I-59	CH ₂ -CH ₂ OH	0	CH	CH	CF ₃	N-metilo	N	CF ₃	H

Ejemplo	R ¹	n	A ⁴	A ⁵	R ³	A ²	A ¹	R ^{2a}	R ^{2b}
I-60	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-metilo	N	CONH ₂	H
I-61	C ₂ H ₅	1	CH	CH	C ₂ F ₅	N-metilo	N	H	H
I-62	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-metilo	CH	H	3-Cl*
I-63	C ₂ H ₅	1	CH	CH	C ₂ F ₅	N-metilo	N	CF ₃	H
I-64	C ₂ H ₅	0	CH	CH	4-CF ₃ (C ₆ H ₄)	N-metilo	N	CF ₃	H
I-65	C ₂ H ₅	0	CH	CH	4-(CF ₃)pirazol-1-il	N-metilo	N	CF ₃	H
I-66	n-C ₃ H ₇	0	CH	CH	CF ₃	N-metilo	N	H	5-OMe*
I-67	CH ₃	0	CH	CH	CF ₃	N-metilo	N	H	5-OMe*
I-68	C ₂ H ₅	2	CH	CH	C ₂ F ₅	N-metilo	N	H	H
I-69	C ₂ H ₅	0	CH	CH	3-(CF ₃)pirazol-1-ilo	N-metilo	N	CF ₃	H
I-70	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-metilo	N	H	3-CF ₃ *
I-71	n-C ₃ H ₇	2	CH	CH	CF ₃	N-metilo	N	H	5-OMe*
I-72	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-metilo	N	CN	H
I-73	CH ₃	2	CH	CH	CF ₃	N-metilo	N	H	5-OMe*
I-74	C ₂ H ₅	0	CH	CH	4-(CF ₃)imidazol-1-ilo	N-metilo	N	CF ₃	H
I-75	C ₂ H ₅	2	CH	CH	4-(CF ₃)imidazol-1-ilo	N-metilo	N	CF ₃	H
I-76	C ₂ H ₅	2	CH	CH	4-(CF ₃)pirazol-1-ilo	N-metilo	N	CF ₃	H

Ejemplo	R ¹	n	A ⁴	A ⁵	R ³	A ²	A ¹	R ^{2a}	R ^{2b}
I-77	C ₂ H ₅	2	CH	CH	3-(CF ₃)pirazol-1-ilo	N-metilo	N	CF ₃	H

*La unión de R^{2b} se realiza en los ejemplos en la posición 3 o 5:



La medición de los valores logP se realiza según la Directiva EEC 79/831 Anexo V.A8 por HPLC (cromatografía líquida de alto rendimiento) en una columna de inversión de fases (C 18). Temperatura: 55 °C.

- 5 La determinación con LC-MS en el rango ácido se realiza a pH 2,7 con 0,1% de ácido fórmico acuoso y acetonitrilo (contiene 0,1% de ácido fórmico) como eluyente; gradiente lineal del 10% de acetonitrilo al 95% de acetonitrilo. En la tabla, se menciona logP (HCOOH).

- 10 La determinación con LC-MS en el rango neutro se realiza a pH 7,8 con solución acuosa 0,001 molar de hidrógeno-carbonato de amonio y acetonitrilo como eluyente; gradiente lineal del 10% de acetonitrilo al 95% de acetonitrilo. En la tabla se menciona logP (neutro).

La calibración se realiza con alcan-2-onas no ramificadas (con 3 a 16 átomos de carbono), cuyos valores logP son conocidos (determinación de los valores logP por medio de los tiempos de retención por interpolación lineal entre dos alcanonas consecutivas).

- 15 Los datos de RMN de ejemplos seleccionados se enumeran en forma clásica (valores δ , separación de multipletes, cantidad de átomos de H) o como listas de picos de RMN.

El disolvente, en el que se captó el espectro de RMN, se indica en cada caso.

Procedimiento de listas de picos de RMN

- 20 Los datos de RMN de ¹H de ejemplos seleccionados están escritos en forma de listas de picos de RMN de ¹H. El valor de δ en ppm y la intensidad de las señales se enumeran para cada pico de señal entre paréntesis. Los pares de valor de δ –intensidad de señal para diferentes picos de señales se enumeran con separación entre sí por punto y coma.

La lista de picos de un ejemplo tiene, por ende, la forma:

$$\delta_1 (\text{intensidad}_1); \delta_2 (\text{intensidad}_2); \dots; \delta_i (\text{intensidad}_i); \dots; \delta_n (\text{intensidad}_n)$$

- 25 La intensidad de señales agudas se correlaciona con la altura de las señales en un ejemplo impreso de un espectro de RMN en cm y muestra las relaciones actuales de intensidades de señales. De señales amplias, se pueden mostrar varios picos o el medio de la señal y su intensidad relativa en comparación con la señal más intensa en el espectro. [656] Para calibración del desplazamiento químico de los espectros de RMN de ¹H, se han usado tetrametilsilano y/o el desplazamiento químico del disolvente, en particular en el caso de espectros medidos en DMSO. En consecuencia, el pico de tetrametilsilano se puede producir, pero no necesariamente, en listas de picos de RMN.

- 30 Las listas de picos de RMN de ¹H son similares a impresiones convencionales de RMN de ¹H y, por ende, contienen usualmente todos los picos que se enumeran en la interpretación clásica de RMN.

Adicionalmente, pueden mostrar como señales de disolventes de impresiones clásicas de RMN de ¹H, estereoisómeros de los compuestos objeto que también son objeto de la invención, y/o picos de impurezas.

- 35 Para mostrar las señales de compuestos en el intervalo delta de disolventes y/o agua, los picos usuales de disolventes, por ejemplo, nuestras listas de picos de RMN de ¹H muestran los picos de disolventes usuales, por ejemplo, picos de DMSO en DMSO-D₆ y el pico de agua que usualmente tienen en promedio una elevada intensidad.

Los picos de estereoisómeros de los compuestos objeto y/o picos de impurezas tienen usualmente en promedio una

menor intensidad que los picos de compuestos objeto (por ejemplo, con una pureza > 90%).

Tales estereoisómeros y/o impurezas pueden ser típicos del proceso de preparación específico. Por ende, sus picos pueden ayudar a reconocer la reproducción de nuestro proceso de preparación por medio de "huellas de subproductos".

- 5 Un experto, quien calcula los picos de los compuestos objeto con métodos conocidos (MestreC, ACD-simulation, pero también con valores esperados evaluados empíricamente) puede aislar los picos de los compuestos objeto de ser necesario dado el caso usando filtros adicionales de intensidad. Este aislamiento será similar a la recolección relevante de picos en la interpretación convencional de RMN de ^1H .

- 10 Otros detalles de las listas de picos de RMN de ^1H pueden hallarse en la Base de Datos de la Descripción de Búsqueda Número 564025.

Ej.	LOGP_ NEUTRAL	LOGP_ HCOOH	
I-1	3,77	3,86	<p>Ejemplo 1: ^1H-RMN (400,0 MHz, d_6-DMSO):</p> <p>δ= 9,544 (6,4); 8,335 (3,9); 8,314 (4,1); 7,568 (2,9); 7,563 (3,5); 7,534 (2,5); 7,529 (1,9); 7,513 (2,3); 7,508 (1,9); 3,323 (17,6); 2,671 (0,3); 2,631 (16,0); 2,524 (1,1); 2,511 (19,3); 2,507 (38,0); 2,502 (49,6); 2,498 (35,5); 2,493 (16,9); 2,075 (0,5); 0,008 (0,9); 0,000 (21,7); - 0,008 (0,7)</p>
I-4	2,65	2,70	<p>Ejemplo 4: ^1H-RMN (400,0 MHz, d_6-DMSO):</p> <p>δ= 9,833 (0,3); 9,210 (3,9); 8,226 (4,1); 8,082 (0,6); 7,993 (0,5); 7,608 (1,3); 7,593 (1,5); 7,587 (1,6); 7,572 (1,4); 7,411 (1,3); 7,405 (1,4); 7,386 (1,4); 7,380 (1,4); 7,244 (1,0); 7,238 (0,9); 7,222 (1,6); 7,216 (1,5); 7,201 (0,8); 7,195 (0,7); 3,785 (16,0); 3,325 (80,3); 2,875 (1,0); 2,863 (1,0); 2,671 (0,7); 2,667 (0,6); 2,506 (76,1); 2,502 (99,5); 2,498 (78,2); 2,464 (2,7); 2,329 (0,6); 2,075 (0,3); 0,000 (2,6)</p>
I-6	2,74	2,75	<p>Ejemplo 6: ^1H-RMN (601,6 MHz, CD_3CN):</p> <p>δ= 9,182 (3,5); 7,526 (1,9); 7,523 (2,0); 7,459 (1,7); 7,445 (2,7); 7,403 (1,7); 7,400 (1,6); 7,390 (1,1); 7,386 (1,0); 3,927 (0,3); 3,770 (16,0); 2,978 (0,3); 2,494 (14,5); 2,222 (0,5); 2,152 (1,6); 1,966 (0,6); 1,958 (1,5); 1,954 (1,8); 1,950 (9,9); 1,946 (17,5); 1,942 (25,9); 1,938 (17,6); 1,934 (8,7); 1,387 (5,1); 1,269 (0,3); 1,212 (0,4); 0,005 (0,3); 0,000 (11,9); - 0,006 (0,4)</p>
I-7	2,67	2,72	<p>Ejemplo 7: ^1H-RMN (400,0 MHz, d_6-DMSO):</p> <p>δ= 9,411 (2,3); 9,408 (2,3); 9,379 (3,9); 9,333 (0,4); 8,751 (2,4); 8,746 (2,5); 8,460 (4,1); 8,316 (0,5); 7,903 (0,3); 4,391 (16,0); 4,199 (1,2); 4,147 (0,5); 4,138 (0,4); 4,121 (0,8); 4,114 (0,6); 4,107 (0,7); 4,100 (0,7); 4,088 (0,7); 4,068 (0,4); 3,976 (0,7); 3,854 (0,6); 3,843 (0,6); 3,833 (0,7); 3,829 (0,7); 3,819 (0,8); 3,803 (0,5); 3,795 (0,6); 3,556 (0,6); 3,543 (0,8); 3,531 (0,5); 3,523 (0,6); 3,518 (0,8); 3,510 (0,9); 3,494 (1,8); 3,477 (0,8); 3,468 (0,8); 3,464 (0,6); 3,455 (0,5); 3,443 (0,6); 3,429 (0,4); 3,325 (63,6); 3,260 (0,8); 3,257 (0,8); 3,241 (2,2); 3,238 (2,3); 3,223 (2,3); 3,219 (2,3); 3,201 (0,9); 2,676 (0,5); 2,671 (0,7); 2,667 (0,6); 2,524 (1,8); 2,511 (41,0); 2,506 (84,3); 2,502 (113,7); 2,498 (86,8); 2,493 (45,8); 2,333 (0,5); 2,329 (0,7); 2,324 (0,6); 1,252 (4,4); 1,233 (9,5); 1,214 (4,3); 0,146 (0,4); 0,008 (2,7); 0,000 (79,8); - 0,008 (4,6); -0,150 (0,4)</p>

ES 2 987 367 T3

Ej.	LOGP NEUTRAL	LOGP HCOOH	
I-8	3,46	3,54	<p>Ejemplo 8: ^1H-RMN (400,0 MHz, d_6-DMSO):</p> <p>$\delta = 9,390$ (2,1); $9,387$ (2,1); $9,377$ (3,6); $8,577$ (2,1); $8,572$ (2,2); $8,379$ (3,7); $8,316$ (0,6); $4,384$ (16,0); $4,362$ (0,4); $3,802$ (0,3); $3,785$ (0,9); $3,767$ (1,3); $3,750$ (0,9); $3,733$ (0,4); $3,322$ (86,4); $2,675$ (1,0); $2,671$ (1,4); $2,666$ (1,0); $2,524$ (3,7); $2,511$ (79,1); $2,506$ (160,9); $2,502$ (213,1); $2,497$ (155,9); $2,493$ (76,9); $2,333$ (1,0); $2,329$ (1,4); $2,324$ (1,0); $1,569$ (6,3); $1,551$ (6,2); $0,906$ (6,4); $0,889$ (6,3); $0,146$ (1,3); $0,008$ (10,0); $0,000$ (280,2); $-0,008$ (11,2); $-0,150$ (1,3)</p>
I-9	3,64	3,66	<p>Ejemplo 9: ^1H-RMN (400,0 MHz, d_6-DMSO):</p> <p>$\delta = 9,544$ (9,2); $8,314$ (2,7); $8,311$ (2,8); $8,294$ (2,9); $8,291$ (2,8); $7,739$ (1,1); $7,735$ (1,2); $7,719$ (2,5); $7,715$ (2,1); $7,701$ (2,2); $7,697$ (2,1); $7,646$ (3,6); $7,627$ (2,2); $7,464$ (1,9); $7,462$ (1,8); $7,444$ (3,0); $7,426$ (1,6); $7,424$ (1,5); $3,322$ (31,6); $3,155$ (1,9); $3,136$ (6,3); $3,118$ (6,4); $3,100$ (2,0); $2,676$ (0,6); $2,671$ (0,8); $2,666$ (0,6); $2,541$ (0,6); $2,524$ (2,7); $2,511$ (49,3); $2,507$ (97,6); $2,502$ (126,8); $2,497$ (89,7); $2,493$ (42,1); $2,333$ (0,6); $2,329$ (0,8); $2,324$ (0,6); $2,075$ (0,3); $1,360$ (7,3); $1,341$ (16,0); $1,323$ (7,0); $0,146$ (0,3); $0,008$ (3,4); $0,000$ (84,9); $-0,009$ (2,9); $-0,150$ (0,3)</p>
I-12	1,83	1,88	<p>Ejemplo 12: ^1H-RMN (400,0 MHz, d_6-DMSO):</p> <p>$\delta = 9,272$ (4,2); $8,266$ (4,5); $8,036$ (1,3); $8,023$ (1,4); $8,015$ (1,6); $8,002$ (1,5); $7,966$ (1,4); $7,959$ (1,6); $7,944$ (1,5); $7,937$ (1,5); $7,706$ (0,8); $7,699$ (0,8); $7,685$ (1,5); $7,678$ (1,5); $7,664$ (0,8); $7,657$ (0,7); $3,973$ (16,0); $3,336$ (80,5); $2,958$ (16,0); $2,678$ (0,4); $2,549$ (0,3); $2,509$ (67,3); $2,337$ (0,4)</p>
I-13	2,34	2,44	<p>Ejemplo 13: ^1H-RMN (400,0 MHz, d_6-DMSO):</p> <p>$\delta = 9,285$ (3,9); $8,280$ (4,2); $8,088$ (2,3); $8,066$ (4,9); $8,060$ (3,8); $8,009$ (2,3); $8,004$ (2,0); $7,988$ (1,4); $7,983$ (1,3); $3,973$ (16,0); $3,327$ (56,5); $3,313$ (1,6); $3,294$ (1,2); $3,279$ (1,2); $3,261$ (1,1); $3,242$ (0,3); $2,905$ (1,1); $2,886$ (1,2); $2,871$ (1,0); $2,853$ (1,0); $2,671$ (0,4); $2,507$ (41,3); $2,502$ (56,0); $2,498$ (43,9); $2,329$ (0,4); $1,150$ (3,8); $1,132$ (8,2); $1,113$ (3,7); $0,000$ (2,5)</p>
I-16	3,21	3,26	<p>Ejemplo 16: ^1H-RMN (400,0 MHz, d_6-DMSO):</p> <p>$\delta = 9,588$ (2,0); $9,585$ (2,1); $9,314$ (3,5); $8,780$ (2,2); $8,776$ (2,2); $8,331$ (3,7); $8,316$ (0,4); $4,409$ (0,3); $4,392$ (1,0); $4,375$ (1,4); $4,357$ (1,0); $4,340$ (0,3); $3,914$ (16,0); $3,322$ (36,9); $2,676$ (0,6); $2,671$ (0,8); $2,667$ (0,6); $2,524$ (2,0); $2,520$ (3,2); $2,511$ (42,6); $2,507$ (88,2); $2,502$ (118,2); $2,497$ (86,9); $2,493$ (42,9); $2,333$ (0,5); $2,329$ (0,7); $2,324$ (0,6); $1,260$ (13,3); $1,243$ (13,2); $0,146$ (0,8); $0,008$ (6,7); $0,000$ (191,2); $-0,009$ (7,6); $-0,150$ (0,8)</p>
I-19	3,38	3,43	<p>Ejemplo 19: ^1H-RMN (400,0 MHz, d_6-DMSO):</p> <p>$\delta = 9,226$ (3,9); $8,243$ (4,1); $7,705$ (0,9); $7,699$ (1,3); $7,684$ (1,6); $7,678$ (2,9); $7,667$ (3,6); $7,662$ (2,3); $7,640$ (3,4); $7,619$ (1,8); $3,788$ (16,0); $3,323$ (25,4); $2,999$ (1,2); $2,981$ (4,0); $2,963$ (4,1); $2,944$ (1,3); $2,671$ (0,4); $2,626$ (0,3); $2,507$ (47,1); $2,502$ (61,4); $2,498$ (45,8); $2,329$ (0,4); $2,300$ (0,5); $1,177$ (4,3); $1,159$ (8,9); $1,140$ (4,1); $0,008$ (1,9); $0,000$ (45,5)</p>

ES 2 987 367 T3

Ej.	LOGP NEUTRAL	LOGP HCOOH	
I-20	2,05	2,08	<p>Ejemplo 20: ^1H-RMN (400,0 MHz, d_6-DMSO):</p> <p>δ= 9,258 (4,1); 8,253 (4,3); 7,997 (1,5); 7,990 (2,5); 7,976 (2,4); 7,969 (3,3); 7,956 (1,7); 7,918 (1,1); 7,911 (0,9); 7,897 (1,6); 7,890 (1,4); 7,876 (0,7); 7,869 (0,6); 3,739 (16,0); 3,430 (15,0); 3,326 (81,6); 2,671 (0,7); 2,666 (0,6); 2,506 (84,7); 2,502 (108,3); 2,498 (84,4); 2,328 (0,7); 2,325 (0,5); 0,146 (0,6); 0,000 (128,1); -0,150 (0,6)</p>
I-23	3,96	4,02	<p>Ejemplo 23: ^1H-RMN (400,0 MHz, d_6-DMSO):</p> <p>δ= 9,288 (4,1); 8,977 (2,7); 8,456 (2,7); 8,327 (4,3); 8,317 (0,4); 4,033 (16,0); 3,395 (2,0); 3,377 (2,7); 3,357 (2,4); 3,327 (77,5); 2,720 (2,3); 2,701 (2,8); 2,682 (2,2); 2,672 (0,7); 2,579 (1,5); 2,560 (4,6); 2,542 (4,9); 2,523 (3,2); 2,507 (65,1); 2,502 (87,7); 2,498 (70,2); 2,329 (0,6); 2,075 (0,9); 1,233 (0,6); 1,152 (4,7); 1,133 (9,3); 1,115 (4,4); 0,000 (3,7)</p>
I-27	1,84	1,87	<p>Ejemplo 27: ^1H-RMN (400,0 MHz, d_6-DMSO):</p> <p>δ= 9,253 (3,5); 8,275 (3,8); 8,273 (3,7); 8,257 (1,5); 8,254 (1,4); 8,237 (1,8); 8,234 (1,7); 8,038 (0,5); 8,035 (0,6); 8,020 (1,5); 8,016 (1,6); 8,001 (1,5); 7,998 (1,3); 7,984 (1,2); 7,980 (1,4); 7,965 (1,6); 7,961 (1,7); 7,946 (0,7); 7,942 (0,6); 7,903 (0,9); 7,895 (2,1); 7,892 (2,0); 7,877 (1,4); 7,873 (1,3); 7,567 (0,4); 7,547 (0,6); 5,756 (8,2); 5,231 (0,7); 5,226 (0,6); 5,216 (0,5); 5,211 (1,3); 5,205 (0,5); 5,196 (0,7); 5,190 (0,8); 5,175 (0,4); 4,802 (2,1); 4,783 (4,1); 4,763 (2,6); 4,673 (2,9); 4,657 (3,1); 4,639 (2,0); 3,746 (16,0); 3,732 (0,5); 3,602 (0,5); 3,594 (0,5); 3,325 (51,0); 2,676 (0,3); 2,671 (0,4); 2,524 (1,2); 2,511 (26,7); 2,507 (53,3); 2,502 (69,4); 2,498 (49,5); 2,493 (23,4); 2,333 (0,3); 2,329 (0,5); 1,760 (0,5); 1,236 (0,7); 1,190 (0,3); 0,000 (2,3)</p>
I-28	3,22	3,29	<p>Ejemplo 28: ^1H-RMN (400,0 MHz, d_6-DMSO):</p> <p>δ= 9,561 (4,9); 8,983 (2,2); 8,362 (2,2); 8,359 (2,2); 4,075 (16,0); 4,032 (0,3); 4,022 (0,4); 3,323 (56,4); 3,202 (1,1); 3,184 (3,5); 3,165 (3,5); 3,147 (1,1); 2,676 (0,4); 2,671 (0,6); 2,667 (0,4); 2,511 (33,1); 2,507 (65,1); 2,502 (84,7); 2,498 (61,6); 2,494 (30,1); 2,333 (0,4); 2,329 (0,5); 2,324 (0,4); 1,355 (0,7); 1,252 (4,0); 1,233 (8,3); 1,215 (3,7); 0,008 (2,6); 0,000 (63,4); -0,008 (2,5)</p>
I-29	2,93	3,04	<p>Ejemplo 29: ^1H-RMN (400,0 MHz, d_6-DMSO):</p> <p>δ= 9,302 (3,5); 8,962 (1,6); 8,959 (1,8); 8,951 (1,8); 8,947 (1,8); 8,457 (1,3); 8,437 (1,4); 8,334 (3,7); 7,856 (1,7); 7,845 (1,7); 7,836 (1,6); 7,824 (1,6); 4,092 (16,0); 3,329 (37,7); 2,526 (0,6); 2,512 (14,7); 2,508 (30,1); 2,504 (40,6); 2,499 (31,1); 2,495 (16,5); 0,000 (1,9)</p>
I-31	3,86	3,94	<p>Ejemplo 31: ^1H-RMN (400,0 MHz, d_6-DMSO):</p> <p>δ= 9,283 (3,4); 8,955 (2,1); 8,952 (2,1); 8,347 (2,1); 8,343 (2,2); 8,334 (3,8); 4,021 (16,0); 3,324 (17,5); 3,137 (2,1); 3,119 (3,6); 3,101 (2,2); 2,892 (1,6); 2,732 (1,3); 2,672 (0,4); 2,525 (0,7); 2,512 (20,3); 2,507 (42,4); 2,503 (57,6); 2,498 (43,7); 2,494 (22,9); 2,329 (0,4); 1,607 (1,2); 1,588 (2,4); 1,570 (2,5); 1,552 (1,4); 0,961 (4,2); 0,943 (8,6); 0,924 (3,8); 0,008 (1,3); 0,000 (42,0); -0,009 (2,2)</p>

ES 2 987 367 T3

Ej.	LOGP NEUTRAL	LOGP HCOOH	
I-32	3,32	3,37	<p>Ejemplo 32: ^1H-RMN (400,0 MHz, d_6-DMSO):</p> <p>δ= 9,580 (2,3); 9,577 (2,3); 9,316 (3,9); 8,796 (2,4); 8,792 (2,4); 8,350 (4,1); 7,903 (0,5); 7,898 (0,5); 7,547 (0,5); 5,756 (2,2); 3,923 (16,0); 3,898 (2,3); 3,883 (1,8); 3,878 (2,4); 3,873 (1,8); 3,859 (2,3); 3,775 (0,8); 3,323 (27,3); 2,676 (0,3); 2,671 (0,5); 2,667 (0,3); 2,524 (1,0); 2,511 (25,7); 2,507 (52,2); 2,502 (69,6); 2,498 (51,6); 2,493 (26,0); 2,329 (0,4); 2,324 (0,3); 1,737 (1,1); 1,718 (1,9); 1,699 (2,0); 1,680 (1,2); 1,013 (4,1); 1,002 (0,9); 0,995 (8,4); 0,976 (3,8); 0,000 (9,4); -0,008 (0,4)</p>
I-34	4,41	4,38	<p>Ejemplo 34: ^1H-RMN (400,0 MHz, d_6-DMSO):</p> <p>δ= 9,332 (3,7); 8,517 (4,3); 8,515 (4,4); 8,272 (3,7); 8,251 (3,9); 7,627 (0,5); 7,623 (0,6); 7,614 (0,4); 7,597 (0,5); 7,575 (0,4); 7,566 (0,4); 7,556 (0,4); 7,542 (2,9); 7,538 (3,4); 7,509 (2,4); 7,504 (1,7); 7,488 (2,1); 7,483 (1,8); 3,321 (35,3); 2,680 (0,4); 2,675 (0,9); 2,671 (1,2); 2,666 (0,8); 2,662 (0,4); 2,610 (16,0); 2,524 (3,5); 2,511 (65,6); 2,506 (129,9); 2,502 (168,9); 2,497 (120,0); 2,493 (56,5); 2,337 (0,4); 2,333 (0,8); 2,329 (1,1); 2,324 (0,8); 2,320 (0,4); 1,355 (1,2); 1,328 (0,4); 1,207 (0,3); 1,189 (0,7); 1,168 (2,5); 1,160 (2,3); 1,145 (0,4); 1,058 (0,5); 0,146 (0,4); 0,008 (3,6); 0,000 (97,2); -0,009 (3,2); -0,150 (0,4)</p>
I-35	4,07	4,03	<p>Ejemplo 35: ^1H-RMN (400,0 MHz, d_6-DMSO):</p> <p>δ= 9,334 (5,6); 8,540 (6,8); 8,538 (6,7); 8,234 (2,7); 8,231 (2,8); 8,214 (3,0); 8,211 (2,8); 7,693 (1,0); 7,690 (1,0); 7,673 (2,6); 7,669 (2,1); 7,655 (2,3); 7,651 (2,2); 7,621 (3,9); 7,602 (2,0); 7,440 (1,8); 7,437 (1,8); 7,420 (3,0); 7,402 (1,5); 7,399 (1,4); 3,323 (126,5); 3,130 (2,0); 3,112 (6,6); 3,093 (6,7); 3,075 (2,1); 2,680 (0,5); 2,675 (1,1); 2,671 (1,5); 2,666 (1,1); 2,662 (0,5); 2,524 (4,8); 2,511 (84,8); 2,506 (166,1); 2,502 (215,2); 2,497 (153,7); 2,493 (72,9); 2,333 (1,0); 2,329 (1,4); 2,324 (1,0); 1,333 (7,5); 1,315 (16,0); 1,297 (7,2); 0,008 (1,0); 0,000 (28,0); -0,009 (0,9)</p>
I-38	2,63	2,68	<p>Ejemplo 38: ^1H-RMN (400,0 MHz, d_6-DMSO):</p> <p>δ= 9,273 (3,9); 8,266 (4,2); 8,141 (2,4); 8,120 (3,8); 8,105 (2,9); 8,100 (3,4); 8,055 (2,4); 8,049 (2,0); 8,033 (1,5); 8,028 (1,3); 7,904 (0,8); 7,899 (0,7); 7,894 (0,5); 7,887 (0,5); 7,697 (0,3); 7,568 (0,5); 7,548 (0,8); 7,528 (0,3); 3,763 (16,0); 3,530 (0,6); 3,513 (1,3); 3,495 (1,4); 3,476 (0,6); 3,357 (0,5); 3,328 (61,7); 2,676 (0,4); 2,671 (0,5); 2,667 (0,4); 2,525 (1,3); 2,507 (57,0); 2,502 (75,7); 2,498 (56,3); 2,333 (0,3); 2,329 (0,5); 2,325 (0,3); 1,125 (3,8); 1,107 (8,1); 1,088 (3,6); 0,000 (0,6)</p>
I-39	3,45	3,52	<p>Ejemplo 39: ^1H-RMN (400,0 MHz, d_6-DMSO):</p> <p>δ= 9,386 (2,2); 9,383 (2,3); 9,374 (3,8); 8,774 (2,3); 8,769 (2,3); 8,316 (0,4); 8,302 (3,8); 5,756 (0,4); 4,362 (16,0); 3,637 (0,5); 3,616 (0,9); 3,605 (0,6); 3,596 (0,6); 3,585 (1,0); 3,564 (0,6); 3,322 (68,3); 2,993 (0,6); 2,981 (0,7); 2,973 (0,7); 2,961 (1,1); 2,949 (0,7); 2,941 (0,7); 2,928 (0,6); 2,676 (0,6); 2,671 (0,8); 2,666 (0,6); 2,511 (49,6); 2,506 (97,4); 2,502 (127,7); 2,497 (95,5); 2,493 (49,9); 2,333 (0,6); 2,329 (0,8); 2,324 (0,6); 2,029 (0,5); 2,010 (0,7); 1,994 (0,8); 1,975 (0,7); 1,956 (0,4); 1,804 (0,4); 1,789 (0,6); 1,783 (0,5); 1,770 (0,6); 1,757 (0,4); 1,754 (0,4); 1,146 (3,8); 1,128 (8,0); 1,109 (3,6); 0,146 (0,8); 0,008 (8,1); 0,000 (174,8); -0,008 (10,0); -0,150 (0,8)</p>

Ej.	LOGP NEUTRAL	LOGP HCOOH	
I-40	3,10	3,15	<p>Ejemplo 40: ^1H-RMN (400,0 MHz, d_6-DMSO):</p> <p>δ= 9,347 (4,8); 8,561 (5,7); 8,293 (2,2); 8,291 (2,3); 8,274 (2,4); 8,271 (2,3); 7,668 (1,0); 7,665 (1,1); 7,647 (2,2); 7,630 (1,4); 7,627 (1,3); 7,480 (1,7); 7,460 (2,8); 7,442 (1,3); 7,179 (2,9); 7,159 (2,6); 6,870 (1,5); 6,647 (0,8); 5,165 (3,3); 5,147 (6,3); 5,130 (3,6); 4,804 (0,5); 4,788 (1,2); 4,771 (1,9); 4,755 (1,2); 4,738 (0,4); 4,512 (3,8); 4,496 (6,3); 4,480 (3,3); 3,328 (53,8); 2,672 (0,6); 2,507 (73,4); 2,503 (93,5); 2,499 (70,8); 2,330 (0,6); 2,183 (2,4); 1,355 (16,0); 1,233 (0,9); 1,182 (0,6); 0,008 (3,2); 0,000 (57,9)</p>
I-41	3,73	3,80	<p>Ejemplo 41: ^1H-RMN (400,0 MHz, d_6-DMSO):</p> <p>δ= 9,277 (3,9); 8,989 (2,5); 8,456 (2,5); 8,453 (2,5); 8,345 (0,3); 8,333 (4,2); 7,954 (0,5); 4,021 (0,4); 4,003 (1,1); 3,988 (16,0); 3,949 (0,4); 3,932 (1,0); 3,916 (1,4); 3,899 (1,1); 3,883 (0,4); 3,325 (35,1); 2,892 (3,7); 2,732 (3,3); 2,672 (0,3); 2,507 (40,5); 2,503 (53,7); 2,499 (41,6); 2,330 (0,4); 1,235 (14,8); 1,219 (14,7); 0,008 (1,4); 0,000 (30,8)</p>

Ejemplos de aplicación

Myzus persicae – ensayo de rociado (MYZUPE)

Solvente: 78 partes en peso de acetona

5 1.5 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: alquilarilpoliglicoléter

10 Para producir una formulación de principio activo apropiada, 1 parte en peso de principio activo se disuelve usando las partes en peso de solvente especificadas y se completa con agua que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm hasta que se alcanza la concentración deseada. Para producir otras concentraciones de prueba, la preparación se diluye con agua que contiene emulsionante.

Discos de hojas de col china (*Brassica pekinensis*) infestadas con todas las etapas del áfido verde del durazno (*Myzus persicae*) son rociadas con una formulación de principio activo de la concentración deseada.

Después de 6 días, se determinó la eficacia en %. 100% significa que todos los áfidos murieron; 0% significa que ninguno de los áfidos murió.

15 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 100% a una tasa de aplicación de 500 g/ha: 1-13.1-23

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 90% a una tasa de aplicación de 500 g/ha: 1-4,1-12,1-19,1-38

20 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 90% a una tasa de aplicación de: I-39

Phaedon cochleariae – ensayo de rociado (PHAECO)

Solvente: 78,0 partes en peso de acetona

1,5 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: alquilarilpoliglicoléter

25 Para producir una formulación de principio activo apropiada, 1 parte en peso de principio activo se disuelve usando las partes en peso de solvente especificadas y se completa con agua que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm hasta que se alcanza la concentración deseada. Para producir otras concentraciones de ensayo, la preparación se diluye con agua que contiene emulsionante.

Discos de col china (*Brassica pekinensis*) son rociados con una formulación de principio activo de la concentración

deseada y, después de secar, son poblados con larvas de escarabajo de la mostaza (*Phaedon cochleariae*).

Después de 7 días, se determinó la eficacia en %. 100% significa que todas las larvas de escarabajo murieron; 0% significa que ninguna larva de escarabajo murió.

- 5 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 100% a una tasa de aplicación de 500 g/ha: 1-4, 1-12, 1-13, 1-19, 1-28, 1-29, 1-31, 1-38, 1-39, 1-41

Spodoptera frugiperda – ensayo de rociado (SPODFR)

Solvente: 78,0 partes en peso de acetona

1,5 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: alquilarilpoliglicoléter

- 10 Para producir una formulación de principio activo apropiada, 1 parte en peso de principio activo se disuelve usando las partes en peso de solvente especificadas y se completa con agua que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm hasta que se alcanza la concentración deseada. Para producir otras concentraciones de prueba, la preparación se diluye con agua que contiene emulsionante.

- 15 Discos de hojas de maíz (*Zea mays*) son rociados con una formulación de principio activo de la concentración deseada y, después de secar, son poblados con oruga militar tardía (*Spodoptera frugiperda*).

Después de 7 días, se determina la eficacia en %. 100% significa que todas las orugas murieron; 0% significa que ninguna oruga murió.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 100% a una tasa de aplicación de 500 g/ha: I-39

- 20 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 83% a una tasa de aplicación de 500 g/ha: I-19

Tetranychus urticae – ensayo de rociado, resistente a OP (TETRUR)

Solvente: 78,0 partes en peso de acetona

1,5 partes en peso de dimetilformamida

- 25 Emulsionante: alquilarilpoliglicoléter

Para producir una formulación de principio activo apropiada, 1 parte en peso de principio activo se disuelve usando las partes en peso de solvente especificadas y se completa con agua que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm hasta que se alcanza la concentración deseada. Para producir otras concentraciones de prueba, la preparación se diluye con agua que contiene emulsionante.

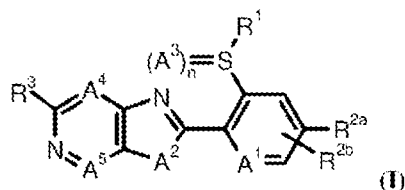
- 30 Discos de hojas de frijol (*Phaseolus vulgaris*) infestados con todas las etapas de la araña roja de los invernaderos (*Tetranychus urticae*) son rociados con una formulación de principio activo de la concentración deseada.

Después de 6 días, se determina la eficacia en %. 100% significa que todas las arañas rojas murieron; 0% significa que ninguna de las arañas rojas murió.

- 35 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 90% a una tasa de aplicación de 500 g/ha: 1-13, I-19, I-28

REIVINDICACIONES

1. Compuestos de fórmula (I)



en la que R¹, R²ᵃ, R²ᵇ, R³, A¹, A², A⁴, A⁵ y n tienen los significados dados en la tabla y A³ es oxígeno:

Ej.	R¹	n	A⁴	A⁵	R³	A²	A¹	R²ᵃ	R²ᵇ
I-1	CH₃	0	N	CH	CF₃	O	CH	Cl	H
I-4	CH₃	0	CH	CH	CF₃	N-metilo	CH	F	H
I-6	CH₃	0	N	CH	CF₃	N-metilo	CH	Cl	H
I-7	-(CH₂)₂-SO₂-C₂H₅	2	CH	CH	CF₃	N-metilo	N	CF₃	H
I-8	i-C₃H₇	1	CH	CH	CF₃	N-metilo	N	CF₃	H
I-9	C₂H₅	0	N	CH	CF₃	O	CH	H	H
I-12	CH₃	1	CH	CH	CF₃	N-metilo	CH	F	H
I-13	C₂H₅	1	CH	CH	CF₃	N-metilo	CH	H	5-Cl
I-16	i-C₃H₇	2	CH	CH	CF₃	N-metilo	N	CF₃	H
I-19	C₂H₅	0	CH	CH	CF₃	N-metilo	CH	H	5-Cl
I-20	CH₃	2	CH	CH	CF₃	N-metilo	CH	F	H
I-23	-(CH₂)₂-S-C₂H₅	0	CH	CH	CF₃	N-metilo	N	CF₃	H
I-27	oxetan-3-ilo	2	CH	CH	CF₃	N-metilo	CH	H	H
I-28	C₂H₅	0	N	CH	CF₃	N-metilo	N	CF₃	H
I-29	CF₃	0	CH	CH	CF₃	N-metilo	N	H	H
I-31	n-C₃H₇	0	CH	CH	CF₃	N-metilo	N	CF₃	H
I-32	n-C₃H₇	2	CH	CH	CF₃	N-metilo	N	CF₃	H
I-34	CH₃	0	CH	CH	CF₃	O	CH	Cl	H
I-35	C₂H₅	1	CH	CH	CF₃	O	CH	H	H
I-38	C₂H₅	2	CH	CH	CF₃	N-metilo	CH	H	5-Cl
I-39	n-C₃H₇	1	CH	CH	CF₃	N-metilo	N	CF₃	H
I-40	oxetan-3-ilo	0	CH	CH	CF₃	O	CH	H	H
I-41	i-C₃H₇	0	CH	CH	CF₃	N-metilo	N	CF₃	H

5

2. Composición, **caracterizada por** un contenido de al menos un compuesto de fórmula (I) según la reivindicación 1 y extensores y/o tensioactivos habituales.

3. Procedimiento para el control de plagas, **caracterizado porque** se permite que un compuesto de fórmula (I) según la reivindicación 1 o una composición según la reivindicación 2 actúe sobre las plagas y/o su hábitat, con exclusión de los métodos de tratamiento terapéutico o quirúrgico del cuerpo humano o animal.

10

4. Uso de compuestos de fórmula (I) según la reivindicación 1 o de composiciones según la reivindicación 2 para el control de plagas, con exclusión del uso en métodos de tratamiento terapéutico o quirúrgico del cuerpo humano o animal.