



19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

11 Número de publicación: **2 287 321**

51 Int. Cl.:

A01N 43/40 (2006.01)

A01N 43/50 (2006.01)

A61K 31/455 (2006.01)

A61K 31/506 (2006.01)

C07D 405/12 (2006.01)

C07D 409/12 (2006.01)

C07D 401/12 (2006.01)

C07D 409/14 (2006.01)

C07D 451/02 (2006.01)

C07F 7/08 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Número de solicitud europea: **02777107 .0**

86 Fecha de presentación : **14.09.2002**

87 Número de publicación de la solicitud: **1434485**

87 Fecha de publicación de la solicitud: **07.07.2004**

54 Título: **Amidas heterocíclicas para controlar las plagas de animales.**

30 Prioridad: **29.09.2001 DE 101 48 290**

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:
16.12.2007

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:
16.12.2007

73 Titular/es: **Merial Limited**
3239 Satellite Blvd.
Duluth, Georgia 30096, US

72 Inventor/es: **Schaper, Wolfgang;**
Beckmann, Marion;
Döller, Uwe;
Krautstrunk, Gerhard;
Jans, Daniela;
Waibel, Jutta, M. y
Hempel, Waltraut

74 Agente: **Ponti Sales, Adelaida**

ES 2 287 321 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

Amidas heterocíclicas para controlar las plagas de animales.

5 La presente invención se refiere a amidas heterocíclicas, a los procesos para su preparación, a los agentes que las contienen así como a su utilización para controlar plagas de animales, en particular de artrópodos tales como insectos y la acarina, y de helmintos.

10 Debido al gran daño que los insectos causan, por ejemplo, por comerse los cultivos agrícolas, los suministros de alimentos, la madera y los materiales textiles, o también por la transmisión de enfermedades a los humanos, a los animales domésticos y a los cultivos agrícolas, la utilización de insecticidas o repelentes es todavía esencial. Los insecticidas son un componente importante del control integrado de plagas y realizan una contribución decisiva en la producción de los cultivos y en la continuidad de las cosechas en todo el mundo.

15 Las amidas de la trifluorometil piridina son conocidas como pesticidas a partir de la Patente EP-A 0 580 374.

20 La Patente JP-A 10 195072 describe piridina-3-carboxamidas pesticidas, en las que se sustituye la amida por dos heteroaromáticos. Sin embargo, sólo se describen dos compuestos heteroaromáticos específicos. No se describe ni se sugiere una transferencia a otros compuestos aromáticos ni incluso a sustituyentes heterocíclicos alifáticos.

El documento WO 01 70692 describe sulfimidias pesticidas. Sin embargo, no se describe ni se sugiere la utilización de amidas de piridina o pirimidina sustituidas heterocíclicamente.

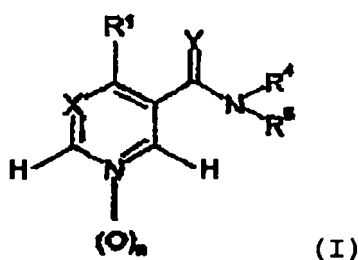
25 La Patente EP-A 0799825 describe amidas del ácido piridin-2,2-dicarboxílico, en las que se sustituye la amida por un radical fenilo. No se describe ni se sugiere una sustitución de la amida por un heterociclo alifático.

El documento WO 96 11690 describe inhibidores PDE-IV basados en los diazepino-indoles, en el que un ejemplo muestra una similitud estructural con los compuestos según la presente invención. No se describe ni se sugiere la utilización de los compuestos descritos como agentes de protección de plantas.

30 Sin embargo, debido a las siempre crecientes exigencias ecológicas y económicas en los insecticidas modernos, por ejemplo, en lo que se refiere a la toxicidad, la selectividad, la cantidad de aplicación, la formación de residuos y la facilidad de producción, y además, por ejemplo, la aparición de problemas con la resistencia, existe una constante necesidad de desarrollar nuevos insecticidas que al menos en parte tengan ventajas en comparación con los insecticidas conocidos.

35 Se ha observado que los componentes de la Fórmula general (I), opcionalmente también como sales, tienen un buen espectro de actividad con respecto a las plagas de animales y al mismo tiempo una buena tolerancia de las plantas y unas buenas propiedades toxicológicas favorables con respecto a los animales mamíferos y acuáticos.

40 Un aspecto de la presente invención es, por lo tanto, las amidas de la Fórmula (I) y sus sales,



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

X es CH o N;

Y es O o S;

60 n es 0 ó 1;

R¹ es haloalquilo (C₁ a C₄);

65 R⁴ es hidrógeno, alquilo (C₁ a C₁₀), cicloalquilo (C₃ a C₁₀), alqueniilo (C₃ a C₁₀) o alquinilo (C₃ a C₁₀), en el que los llamados grupos alquilo, cicloalquilo, alqueniilo o alquinilo hasta tres átomos de hidrógeno se pueden reemplazar por un halógeno, preferentemente flúor o cloro, en el caso del flúor también hasta el número máximo;

ES 2 287 321 T3

a C₄), alquilo (C₁ a C₄) - cicloalquilamino (C₃ a C₈), alqueno (C₂ a C₄) - cicloalquilamino (C₃ a C₈), alquino (C₂ a C₄) - cicloalquilamino (C₃ a C₈), alquilo (C₁ a C₄) - cicloalquencilamino (C₄ a C₈), alqueno (C₂ a C₄) - cicloalquencilamino (C₄ a C₈), los análogos al N-alquilamino (C₁ a C₄) de los catorce últimos radicales nombrados, trialquilsililo (C₁ a C₁₀), arilo, aroilo, heterociclicarbonilo, ariloxi, ariltio, arilamino, N-alquilarilamino (C₁ a C₄), los análogos al N-aquilamino (C₁ a C₄) de los dos últimos radicales nombrados, arilalcoxi (C₁ a C₄), arilalquenciloxi (C₃ a C₄), arilalquiltio (C₁ a C₄), arilalquenciltio (C₃ a C₄), arilalquilamino (C₁ a C₄), arilalquencilamino (C₃ a C₄), los análogos al N-alquilamino (C₁ a C₄) del último radical nombrado, arildialquilsililo (C₁ a C₈), diarilalquilsililo (C₁ a C₈), triarilsililo, heterociclilo, heterociclixo, heterociclitio, o heterociclilamino, en el que la parte cíclica de los radicales nombrados como arilo o heterociclilo se sustituye opcionalmente por uno o más radicales del grupo halógeno, ciano, nitro, amino, hidroxilo, tio, alquilo (C₁ a C₄), haloalquilo (C₁ a C₄), cicloalquilo (C₃ a C₈), alcoxi (C₁ a C₄), haloalcoxi (C₁ a C₄), alquiltio (C₁ a C₄), haloalquiltio (C₁ a C₄), alquilamino (C₁ a C₄), dialquilamino (C₁ a C₄), trimetilsililo o alcanofilo (C₁ a C₄);

en el que opcionalmente dos radicales alquilo R⁶, si se enlazan al mismo átomo de carbono, pueden formar junto con este átomo de carbono un sistema anular espirocíclico, u opcionalmente dos radicales alquilo R⁶, que se enlazan a los diferentes átomos de carbono, pueden formar junto con el heterociclo alifático de la Fórmula (II) un sistema anular condensado o bicíclico o además el sistema anular heteroalifático de la Fórmula (II) y un sistema arilo o heteroarilo adicional juntos forman un sistema anular condensado;

y, si R⁶ indica alquilo (C₁ a C₁₀), alqueno (C₂ a C₁₀), alquino (C₂ a C₁₀), cicloalquilo (C₃ a C₁₀), cicloalqueno (C₄ a C₁₀) o cicloalquino (C₈ a C₁₀), los radicales nombrados se pueden sustituir opcionalmente una o más veces, preferiblemente por radicales R¹¹, y

R¹¹ tiene los significados dados anteriormente para R⁷;

R⁸ indica hidrógeno, alquilo (C₁ a C₁₀), alqueno (C₃ a C₁₀), alquino (C₃ a C₁₀), cicloalquilo (C₃ a C₁₀), cicloalqueno (C₄ a C₁₀), arilo, heterociclilo, alcanofilo (C₁ a C₁₀), alquenoilo (C₃ a C₁₀), alquinoilo (C₃ a C₁₀), cicloalcanofilo (C₄ a C₈), aroilo, heterociclicarbonilo, carbamoilo, mono o dialquilcarbamoilo (C₁ a C₆), mono o dicicloalquilcarbamoilo (C₃ a C₁₀), alcoxycarbonilo (C₁ a C₁₀), cicloalcoxycarbonilo (C₃ a C₁₀), alquilsulfonilo (C₁ a C₁₀), alquencilsulfonilo (C₃ a C₁₀), alquencilsulfonilo (C₁ a C₆), cicloalquilsulfonilo (C₃ a C₁₀), cicloalquencilsulfonilo (C₄ a C₁₀), cicloalquilo (C₃ a C₁₀) - alquilsulfonilo (C₁ a C₁₀), cicloalqueno (C₄ a C₈) - alquilsulfonilo (C₁ a C₄), cicloalquilo (C₃ a C₈) - alquencilsulfonilo (C₃ a C₄), cicloalqueno (C₄ a C₈) - alquencilsulfonilo (C₃ a C₄), alquilo (C₁ a C₄) - cicloalquilsulfonilo (C₃ a C₈), alqueno (C₂ a C₄) - cicloalquilsulfonilo (C₃ a C₈), alquino (C₂ a C₄) - cicloalquencilsulfonilo (C₄ a C₈), alqueno (C₂ a C₄) - cicloalquencilsulfonilo (C₄ a C₈), hidroxilo, alcoxi (C₁ a C₁₀), alquenciloxi (C₃ a C₁₀), cicloalcoxi (C₃ a C₁₀), cicloalquenciloxi (C₄ a C₁₀), cicloalquilo (C₃ a C₈) - alcoxi (C₁ a C₄), cicloalqueno (C₄ a C₈) - alcoxi (C₁ a C₄), cicloalquilo (C₃ a C₈) - alquenciloxi (C₃ a C₄), cicloalqueno (C₄ a C₈) - alquenciloxi (C₃ a C₄), alquilo (C₁ a C₄) - cicloalcoxi (C₃ a C₈), alqueno (C₂ a C₄) - cicloalcoxi (C₃ a C₈), alquino (C₂ a C₄) - cicloalcoxi (C₃ a C₈), alquilo (C₁ a C₄) - cicloalquenciloxi (C₄ a C₈), alqueno (C₂ a C₄) - cicloalquenciloxi (C₄ a C₈), alcoxi (C₁ a C₄) - alcoxi (C₁ a C₄), alcoxi (C₁ a C₄) - alquenciloxi (C₃ a C₄), ariloxi, arilalcoxi (C₁ a C₁₀), arilalquenciloxi (C₃ a C₁₀) o arilalquenciloxi (C₃ a C₁₀),

y los radicales nombrados anteriormente para R⁵ se pueden opcionalmente sustituir por uno o más radicales del grupo ciano, nitro, amino, hidroxilo, tio, alquilo (C₁ a C₄), cicloalquilo (C₃ a C₁₀), alcoxi (C₁ a C₄), alquiltio (C₁ a C₄), alquilamino (C₁ a C₄) o alcanofilo (C₁ a C₄);

R⁹ y R¹⁰ indican alquilo (C₁ a C₁₀), alqueno (C₂ a C₁₀), alquino (C₂ a C₁₀), cicloalquilo (C₃ a C₁₀), cicloalqueno (C₄ a C₁₀), cicloalquino (C₈ a C₁₀), arilo, arilalquilo (C₁ a C₄) o heterociclilo, preferentemente metilo,

y opcionalmente en todos los grupos nombrados para R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰ y R¹¹ el hidrógeno enlazado con carbono se puede reemplazar por de uno a tres átomos de halógeno, en el caso del flúor también hasta el número máximo.

Los símbolos y los índices de la Fórmula (I) tienen preferentemente el siguiente significado:

X es preferentemente -CH-.

Y es preferentemente -O-.

n es preferentemente 0.

R¹ es preferentemente alquilo (C₁ a C₄) sustituido una o más veces por F y/o Cl, particularmente preferible CF₃, CHF₂ o CF₂Cl, de manera muy particularmente preferible CF₃.

R⁴ es preferentemente hidrógeno y metilo, particularmente preferible hidrógeno.

ES 2 287 321 T3

Los compuestos preferidos adicionales son los compuestos de la Fórmula (I), para la que

5 R⁶ indican alquilo (C₁ a C₁₀), alquenilo (C₂ a C₁₀), alquinilo (C₂ a C₁₀), cicloalquilo (C₃ a C₁₀), cicloalquenilo (C₄ a C₁₀) o cicloalquinilo (C₈ a C₁₀) y los radicales nombrados se sustituyen opcionalmente una o más veces por radicales R¹¹, en los que R¹¹ tiene uno de los significados dado anteriormente; R⁶ en particular indica preferentemente hidrógeno o alquilo (C₁ a C₄).

10 Los compuestos preferidos adicionales son los compuestos de la Fórmula (I), para la que

10 R⁵ es preferiblemente un heterociclo alifático de cinco a siete miembros con una o dos unidades de heteroátomos A y/o B, de manera muy particularmente preferible un heterociclo alifático de cinco a siete miembros con una o dos unidades de heteroátomos y opcionalmente también un grupo carbonilo en el anillo, que forma junto con una unidad hetero una unidad lactona o lactama.

15 Los compuestos preferidos adicionales son los compuestos de la Fórmula (I), en la que

20 R⁷ indica arilo, aroilo, heterociclicarbonilo, ariloxi, ariltio, arilamino, N-alquilarilamino (C₁ a C₄), los análogos al N-alquilamino (C₁ a C₄) de los dos últimos radicales nombrados, arilalcoxi (C₁ a C₄), arilalqueniloxi (C₃ a C₄), arilalquiltio (C₁ a C₄), arilalqueniltio (C₃ a C₄), arilalquilamino (C₁ a C₄), arilalquenilamino (C₃ a C₄), los análogos al N-alquilamino (C₁ a C₄) del último radical nombrado, arildialquilsililo (C₁ a C₈), diarilalquilsililo (C₁ a C₈), triarilsililo, heterociclicilo, heterocicliciloxi, heterocicliciltio o heterociclicilamino, en el que la parte cíclica de los radicales nombrados arilo o heterociclicilo se substituye opcionalmente por uno o más radicales del grupo halógeno, ciano, nitro, amino, hidroxilo, tio, alquilo (C₁ a C₄), haloalquilo (C₁ a C₄), cicloalquilo (C₃ a C₈), alcoxi (C₁ a C₄), alquiltio (C₁ a C₄), alquilamino (C₁ a C₄) o alcanofilo (C₁ a C₄).

30 Los compuestos preferidos adicionales son los compuestos de la Fórmula (I), para la que

30 R⁸ indica alquilo (C₁ a C₄), alcanofilo (C₁ a C₄), alcoxicarbonilo (C₁ a C₄), alquilsulfonilo (C₁ a C₄) o dialquilarbamoilo (C₁ a C₄).

35 Los compuestos preferidos adicionales son los compuestos de la Fórmula (I), para la que

A o B indica oxígeno, azufre, SO, SO₂ o NR⁸, en particular oxígeno, azufre, SO o SO₂.

40 Preferidos particularmente adicionales son los compuestos de la Fórmula (I), para la que

40 R⁵ es un heterociclo alifático de cinco a siete miembros con una unidad de heteroátomos A y/o B y esta unidad de heteroátomos indica preferentemente oxígeno; azufre, S(O) o S(O)₂, si A o B indica oxígeno, opcionalmente con un grupo carbonilo adicional en el anillo, que forma junto con el átomo de oxígeno un grupo lactona.

El término “halógeno” incluye flúor, cloro, bromo y yodo.

50 Por el término “alquilo (C₁ a C₄)” se refiere a un radical hidrocarburo alifático y saturado ramificado o no ramificado con 1, 2, 3 o 4 átomos de carbono, tales como, por ejemplo, el radical metilo, etilo, propilo, isopropilo, 1-butilo, 2-butilo, isobutilo o ter-butilo.

55 Por lo tanto, por radicales alquilo con una amplia gama de átomos de carbono se supone un radical hidrocarburo alifático y saturado ramificado o no ramificado que contiene un número de átomos de carbono que se corresponde con esta gama específica. Por lo tanto, el término “alquilo (C₁ a C₄)” incluye el radical alquilo mencionados anteriormente, así como, por ejemplo, el radical pentilo, 3-metilbutilo, 1,1-dimetilpropilo, hexilo, heptilo, octilo, ter-octilo, nonilo o decilo.

60 Por “haloalquilo (C₁ a C₄)” se refiere a un grupo alquilo nombrado bajo el término “alquilo (C₁ a C₄)” en el que uno o más átomos de hidrógeno se sustituyen por el mismo número del mismo o de diferentes átomos de halógeno, preferentemente cloro o flúor, tales como el grupo trifluorometilo, 1- ó 2-fluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, clorometilo, fluorometilo, difluorometilo o 1,1,2,2-tetrafluoroetilo.

65 Los términos “alquenilo” y “alquinilo” precedidos por una gama específica de átomos de carbono indican un radical hidrocarburo de cadena normal o ramificada con un número de átomos de carbono que se corresponde con esta gama específica, que contiene al menos un enlace múltiple, en el que el último se puede localizar en cualquier posición del radical insaturado pertinente. Por lo tanto, “alquenilo (C₃ a C₁₀)” representa, por ejemplo, el grupo alilo, 2-metilpropenilo, 1- ó 2-butenilo, pentenilo, 2-metilpentenilo, hexenilo, heptenilo, octenilo, nonenilo o decenilo. “al-

ES 2 287 321 T3

quinilo (C₂ a C₁₀)” representa, por ejemplo, los grupos nombrados anteriormente así como adicionalmente el grupo vinilo.

5 El “alquinilo (C₃ a C₁₀)” representa, por ejemplo, el grupo propargilo, 2-metilpropinilo, 2-butinilo, pentinilo, 2-metilpentinilo, hexinilo, heptinilo, octinilo, noninilo o decinilo. Por “alquinilo (C₂ a C₁₀)” se refiere a los radicales nombrados anteriormente y también el grupo etinilo.

10 El “cicloalquilo (C₃ a C₁₀)” representa el radical alquilo monocíclicos y saturados, tales como el radical ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo, ciclooctilo o ciclodecilo; para el radical alquilo bicíclicos y saturados, tales como el radical norbomilo o biciclo[2,2,2]octilo, o también para sistemas condensados y saturados, tales como, por ejemplo, el radical decahidronaftilo.

15 El “cicloalquenilo (C₃ a C₁₀)” representa el radical alquilo monocíclicos que contienen al menos un enlace múltiple, tales como el radical ciclobutenilo, ciclopentenilo, ciclohexenilo, cicloheptenilo, ciclooctenilo o ciclodecenilo; para el radical alquilo bicíclicos que contiene al menos un enlace múltiple, tales como el radical norbomenilo o biciclo[2,2,2]octenilo o también para sistemas condensados que contienen al menos un enlace múltiple, tales como, por ejemplo, el radical tetrahidronaftilo, hexahidronaftilo u octahidronaftilo.

20 El “cicloalquinilo (C₈ a C₁₀)” representa el radical ciclooctinilo, ciclounoninilo o ciclodecinilo.

El “alcanoílo (C₁ a C₁₀)” representa, por ejemplo, el grupo formilo, acetilo, propionilo, butirilo, 2-metilbutirilo, pivaloilo, octanoílo o decanoílo.

25 El “alquenoílo (C₃ a C₁₀)” representa, por ejemplo, el grupo acrílo, metacrilo, crotonoílo, dimetilacrilo u octenoílo.

El “alquenoílo (C₃ a C₁₀)” representa, por ejemplo, el grupo propinoílo, butinoílo, hexinoílo u octinoílo.

30 El “cicloalcanoílo (C₃ a C₁₀)” representa, por ejemplo, el ciclopropilcarbonilo, ciclobutilcarbonilo, ciclopentilcarbonilo, ciclohexilcarbonilo o ciclooctilcarbonilo.

Por “alcoxi (C₁ a C₄)” y “alcoxi (C₁ a C₁₀)” se refieren a los grupos alcoxi cuyos radicales hidrocarburo tienen los significados dados bajo los términos “alquilo (C₁ a C₄)” y “alquilo (C₁ a C₁₀)”.

35 Por “alqueniilo (C₃ a C₁₀)”, “alquiniilo (C₃ a C₁₀)”, “cicloalcoxi (C₃ a C₁₀)” y “cicloalqueniilo (C₄ a C₁₀)” se refieren a los grupos alcoxi cuyos radicales hidrocarburos tienen los significados dados bajo los términos “alqueniilo (C₃ a C₁₀)”, “alquiniilo (C₃ a C₁₀)”, “cicloalquilo (C₃ a C₁₀)” y “cicloalqueniilo (C₄ a C₁₀)”.

40 El “cicloalquilo (C₃ a C₈) - alcoxi (C₁ a C₄)” representa, por ejemplo, el grupo ciclopropilmetoxi, ciclopropiletoxi, ciclobutilmetoxi, ciclopentilmetoxi, ciclohexilmetoxi o ciclohexiletoxi.

El “cicloalqueniilo (C₄ a C₈) - alcoxi (C₁ a C₄)” representa, por ejemplo, el grupo ciclobutenilmetoxi, ciclopentenilmetoxi, ciclohexenilmetoxi o ciclohexeniletoxi.

45 El “cicloalquilo (C₃ a C₈) - alqueniilo (C₃ a C₄)” representa, por ejemplo, el grupo ciclopropilalilo, ciclobutilalilo o ciclopentilalilo.

El “cicloalqueniilo (C₄ a C₈) - alqueniilo (C₃ a C₄)” representa, por ejemplo, el grupo ciclobutenilalilo o ciclopentenilalilo.

50 El “alquilo (C₁ a C₄) - cicloalcoxi (C₃ a C₈)” representa, por ejemplo, el grupo metilciclopentilo, etilciclopentilo, metilciclohexilo o etilciclohexilo.

El “alqueniilo (C₂ a C₄) - cicloalcoxi (C₃ a C₈)” representa, por ejemplo, el grupo vinilciclopentilo, alilciclopentilo, vinilciclohexilo o alilciclohexilo.

55 El “alquiniilo (C₂ a C₄) - cicloalcoxi (C₃ a C₈)” representa, por ejemplo, el grupo etilciclopentilo, propinilciclopentilo, etilciclohexilo o propinilciclohexilo.

60 El “alquilo (C₁ a C₄) - cicloalqueniilo (C₄ a C₈)” representa, por ejemplo, el grupo metilciclopentenilo, etilciclopentenilo, metilciclohexenilo o etilciclohexenilo.

El “alqueniilo (C₂ a C₄) - cicloalcoxi (C₃ a C₈)” representa, por ejemplo, el grupo vinilciclopentilo, alilciclopentilo, vinilciclohexilo o alilciclohexilo.

65 El “alqueniilo (C₂ a C₄) - cicloalqueniilo (C₃ a C₈)” representa, por ejemplo, el grupo vinilciclopentenilo, alilciclopentenilo, vinilciclohexenilo o alilciclohexenilo.

ES 2 287 321 T3

El “alcoxi (C₁ a C₄) - alcoxi (C₁ a C₄)” indica un grupo alcoxi tal y como se definió anteriormente que se sustituye por un grupo alcoxi adicional tal como, por ejemplo, el grupo etoximetoxi, 1-metoxietoxi, 1-etoxietoxi o 1-metoxipropoxi.

5 El “alcoxi (C₁ a C₄) - alqueniilo (C₃ a C₄)” significa, por ejemplo, el grupo metoxialilo o etoxialilo.

El “mono o dialquilcarbamoilo (C₁ a C₈)” significa, por ejemplo, el grupo metilcarbamoilo, etilcarbamoilo, propilcarbamoilo, isopropilcarbamoilo, butilcarbamoilo o terbutilcarbamoilo o el grupo dimetilcarbamoilo, dietilcarbamoilo, metiletilcarbamoilo o diisopropilcarbamoilo, pero también los derivados cíclicos tales como, por ejemplo, el grupo
10 pirrolidinocarbamoilo o piperidinocarbamoilo.

El “mono o dicicloalquilcarbamoilo (C₃ a C₈)” significa, por ejemplo, el grupo ciclopropilcarbamoilo, ciclobutilcarbamoilo, ciclopentilcarbamoilo o ciclohexilcarbamoilo, o el grupo diciclopropilcarbamoilo, diciclobutilcarbamoilo, diciclopentilcarbamoilo o diciclohexilcarbamoilo.
15

El “alcoxicarbonilo (C₁ a C₈)” significa, por ejemplo, el grupo metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, propoxicarbonilo, isopropoxicarbonilo, butoxicarbonilo, isobutoxicarbonilo, secbutoxicarbonilo o terbutoxicarbonilo.

El “cicloalcoxicarbonilo (C₃ a C₈)” significa, por ejemplo, el grupo ciclopropoxicarbonilo, ciclobutoxicarbonilo, ciclopentiloxicarbonilo o ciclohexiloxicarbonilo.
20

El “alcanoilo (C₁ a C₈)” significa, por ejemplo, el grupo acetilo, propionilo, butanoilo o pivaloilo.

El “cicloalcanoilo (C₃ a C₈)” significa, por ejemplo, el grupo ciclopropilcarbonilo, ciclobutilcarbonilo, ciclopentilcarbonilo o ciclohexilcarbonilo.
25

El “alcanoilamino (C₁ a C₈)” significa, por ejemplo, el grupo formilamino, acetilamino, propionilamino, isopropionilamino, butanoilamino o pivaloilamino.

El “alquenoilamino (C₃ a C₈)” significa, por ejemplo, el grupo acrilamino, metacrilamino, simetilacrilamino o crotonilamino.
30

El “cicloalcanoilamino (C₃ a C₈)” significa, por ejemplo, el grupo ciclopropanoilamino, ciclobutanoilamino, ciclo-pentanoilamino o ciclohexanoilamino.
35

El “cicloalquilo (C₃ a C₈) - alcanoilamino (C₁ a C₄)” significa, por ejemplo, el grupo ciclopropilacetilamino o ciclopentilacetilamino.

El “alquiltio (C₁ a C₁₀)” representa un grupo alquiltio cuyo radical hidrocarburo tiene el significado dado bajo el término “alquilo (C₁ a C₁₀)”.
40

El “alqueniiltio (C₃ a C₁₀)” representa un grupo alqueniiltio cuyo radical hidrocarburo tiene el significado dado bajo el término “alqueniilo (C₃ a C₁₀)”.
45

El “alquiniltio (C₃ a C₁₀)” representa un grupo alquiniltio cuyo radical hidrocarburo tiene el significado dado bajo el término “alquinilo (C₃ a C₁₀)”.
50

El “cicloalquiltio (C₃ a C₁₀)” representa un grupo cicloalquiltio cuyo radical hidrocarburo tiene el significado dado bajo el término “cicloalquilo (C₃ a C₁₀)”.
55

El “cicloalqueniiltio (C₄ a C₁₀)” representa un grupo cicloalqueniiltio cuyo radical hidrocarburo tiene el significado dado bajo el término “cicloalqueniilo (C₄ a C₁₀)”.
60

El “cicloalquilo (C₃ a C₈) - alquiltio (C₁ a C₄)” representa, por ejemplo, el grupo ciclopropilmetiltio, ciclopropilmetiltio, ciclopentilmetiltio o ciclohexilmetiltio.
65

El “cicloalqueniilo (C₄ a C₈) - alquiltio (C₁ a C₄)” representa, por ejemplo, el grupo ciclopentilmetiltio o ciclohexilmetiltio.

El “cicloalquilo (C₃ a C₈) - alqueniiltio (C₃ a C₄)” representa, por ejemplo, el grupo ciclopropilaliltio, ciclopentilaliltio o ciclohexilaliltio.

El “cicloalqueniilo (C₄ a C₈) - alqueniiltio (C₃ a C₄)” representa, por ejemplo, el grupo ciclopentilaliltio o ciclohexilaliltio.
70

El “alquilo (C₁ a C₄) - cicloalquiltio (C₃ a C₈)” representa, por ejemplo, el grupo metilciclopentiltio o metilciclohexiltio.
75

ES 2 287 321 T3

El “alquilo (C_1 a C_4) - cicloalqueniltio (C_4 a C_8)” representa, por ejemplo, el grupo metilciclopenteniltio o metilciclohexeniltio.

5 El “alquenilo (C_2 a C_4) - cicloalquiltio (C_3 a C_8)” representa, por ejemplo, el grupo vinilciclopentiltio, alilciclopentiltio o alilciclohexiltio.

El “alquinilo (C_2 a C_6) - cicloalquiltio (C_3 a C_8)” representa, por ejemplo, el grupo etinilciclopentiltio, propargilciclopentiltio, etinilciclohexiltio o propargilciclohexiltio.

10 El “alquenilo (C_2 a C_4) - cicloalqueniltio (C_4 a C_8)” representa, por ejemplo, el grupo alilciclopenteniltio o alilciclohexeniltio.

El “alquilsulfínico (C_1 a C_8)” representa, por ejemplo, el grupo metilsulfínico, etilsulfínico, propilsulfínico, isopropilsulfínico, butilsulfínico, isobutilsulfínico, secbutilsulfínico, terbutilsulfínico u octilsulfínico.

15 El “alquenilsulfínico (C_3 a C_8)” representa, por ejemplo, el grupo alilsulfínico, metilalilsulfínico, butenilsulfínico u octenilsulfínico.

20 El “alquínilsulfínico (C_3 a C_8)” representa, por ejemplo, el grupo propargilsulfínico, butínilsulfínico u octínilsulfínico.

El “cicloalquilsulfínico (C_3 a C_{10})” representa un grupo cicloalquilsulfínico cuyo radical hidrocarburo tiene el significado dado bajo el término “cicloalquilo (C_3 a C_{10})”.

25 El “cicloalquenilsulfínico (C_4 a C_{10})” representa un grupo cicloalquenilsulfínico cuyo radical hidrocarburo tiene el significado dado bajo el término “cicloalquenilo (C_4 a C_{10})”.

El “cicloalquilo (C_3 a C_8) - alquilsulfínico (C_1 a C_4)” representa, por ejemplo, el grupo ciclopropilmetilsulfínico, ciclopropiletilsulfínico, ciclopentilmetilsulfínico o ciclohexilmetilsulfínico.

30 El “cicloalquenilo (C_4 a C_8) - alquilsulfínico (C_1 a C_4)” representa, por ejemplo, el grupo ciclopentenilmetilsulfínico o ciclohexenilmetilsulfínico.

35 El “cicloalquilo (C_3 a C_8) - alquenilsulfínico (C_3 a C_4)” representa, por ejemplo, el grupo ciclopropilalilsulfínico, ciclopentilalilsulfínico o ciclohexilalilsulfínico.

El “cicloalquenilo (C_4 a C_8) - alquenilsulfínico (C_3 a C_4)” representa, por ejemplo, el grupo ciclopentenilalilsulfínico o ciclohexenilalilsulfínico.

40 El “alquilo (C_1 a C_4) - cicloalquilsulfínico (C_3 a C_8)” representa, por ejemplo, el grupo metilciclopentilsulfínico o metilciclohexilsulfínico.

El “alquilo (C_1 a C_8) - cicloalquenilsulfínico (C_4 a C_8)” representa, por ejemplo, el grupo metilciclopentenilsulfínico o metilciclohexenilsulfínico.

45 El “alquenilo (C_2 a C_4) - cicloalquilsulfínico (C_3 a C_8)” representa, por ejemplo, el grupo vinilciclopentilsulfínico, alilciclopentilsulfínico, vinilciclohexilsulfínico o alilciclohexilsulfínico.

50 El “alquinilo (C_2 a C_4) - cicloalquilsulfínico (C_3 a C_8)” representa, por ejemplo, el grupo etinilciclopentilsulfínico, propargilciclopentilsulfínico, etinilciclohexilsulfínico o propargilciclohexilsulfínico.

El “alquenilo (C_2 a C_4) - cicloalquenilsulfínico (C_4 a C_8)” representa, por ejemplo, el grupo vinilciclopentenilsulfínico, alilciclopentenilsulfínico, vinilciclohexenilsulfínico o alilciclohexenilsulfínico.

55 El “alquilsulfónico (C_1 a C_{10})” representa, por ejemplo, el grupo metilsulfónico, etilsulfónico, propilsulfónico, isopropilsulfónico, butilsulfónico, isobutilsulfónico, secbutilsulfónico, terbutilsulfónico u octilsulfónico.

El “alquenilsulfónico (C_3 a C_{10})” representa, por ejemplo, el grupo alilsulfónico, metilalilsulfónico, butenilsulfónico u octenilsulfónico.

60 El “alquínilsulfónico (C_3 a C_{10})” representa, por ejemplo, el grupo propargilsulfónico, butínilsulfónico u octínilsulfónico.

65 El “cicloalquilsulfónico (C_3 a C_{10})” representa un grupo cicloalquilsulfónico cuyo radical hidrocarburo tiene el significado dado bajo el término “cicloalquilo (C_3 a C_{10})”.

El “cicloalquenilsulfónico (C_4 a C_{10})” representa un grupo cicloalquenilsulfónico cuyo radical hidrocarburo tiene el significado dado bajo el término “cicloalquenilo (C_4 a C_{10})”.

ES 2 287 321 T3

El “cicloalquilo (C₃ a C₈) - alquilsulfonilo (C₁ a C₄)” representa, por ejemplo, el grupo ciclopropilmetilsulfonilo, ciclopropiletilsulfonilo, ciclopentilmetilsulfonilo o ciclohexilmetilsulfonilo.

5 El “cicloalqueno (C₄ a C₈) - alquilsulfonilo (C₁ a C₄)” representa, por ejemplo, el grupo ciclopentenilmetilsulfonilo o ciclohexenilmetilsulfonilo.

El “cicloalquilo (C₃ a C₈) - alquensulfonilo (C₃ a C₄)” representa, por ejemplo, el grupo ciclopropilalilsulfonilo, ciclopentilalilsulfonilo o ciclohexilalilsulfonilo.

10 El “cicloalqueno (C₄ a C₈) - alquensulfonilo (C₃ a C₄)” representa, por ejemplo, el grupo ciclopentenilalilsulfonilo o ciclohexenilalilsulfonilo.

El “alquilo (C₁ a C₄) - cicloalquilsulfonilo (C₃ a C₈)” representa, por ejemplo, el grupo metilciclopentilsulfonilo o metilciclohexilsulfonilo.

15 El “alquilo (C₁ a C₄) - cicloalquensulfonilo (C₄ a C₈)” representa, por ejemplo, el grupo metilciclopentenilsulfonilo o metilciclohexenilsulfonilo.

20 El “alqueno (C₂ a C₄) - cicloalquilsulfonilo (C₃ a C₈)” representa, por ejemplo, el grupo vinilciclopentilsulfonilo, alilciclopentilsulfonilo, vinilciclohexilsulfonilo o alilciclohexilsulfonilo.

El “alquino (C₂ a C₄) - cicloalquilsulfonilo (C₃ a C₈)” representa, por ejemplo, el grupo etnilciclopentilsulfonilo, propargilciclopentilsulfonilo, etnilciclohexilsulfonilo o propargilciclohexilsulfonilo.

25 El “alqueno (C₂ a C₄) - cicloalquensulfonilo (C₄ a C₈)” representa, por ejemplo, el grupo vinilciclopentenilsulfonilo, alilciclopentenilsulfonilo, vinilciclohexenilsulfonilo o alilciclohexenilsulfonilo.

El “alquilamino (C₁ a C₁₀)” representa un átomo de nitrógeno que se substituye por uno o más radicales alquilo idénticos o diferentes tal y como se definieron anteriormente.

30 El “alquencilamino (C₃ a C₁₀)” representa un átomo de nitrógeno que se substituye por uno o más radicales alqueno idénticos o diferentes tal y como se definieron anteriormente.

35 El “alquencilamino (C₃ a C₁₀)” representa un átomo de nitrógeno que se substituye por uno o más radicales alquino idénticos o diferentes tal y como se definieron anteriormente.

El “cicloalquilamino (C₃ a C₈)” representa un átomo de nitrógeno que se substituye por uno o más radicales cicloalquilo idénticos o diferentes tal y como se definieron anteriormente.

40 El “cicloalquilo (C₃ a C₈) - alquilamino (C₁ a C₄)” representa, por ejemplo, el grupo ciclopropilmetilamino, ciclopropiletilamino, ciclopentilmetilamino o ciclohexilmetilamino.

El “cicloalqueno (C₄ a C₈) - alquilamino (C₁ a C₄)” representa, por ejemplo, el grupo ciclopentenilmetilamino o ciclohexenilmetilamino.

45 El “cicloalquilo (C₃ a C₈) - alquencilamino (C₃ a C₄)” representa, por ejemplo, el grupo ciclopropilalilamino, ciclopentilalilamino o ciclohexilalilamino.

50 El “cicloalqueno (C₄ a C₈) - alquencilamino (C₃ a C₄)” representa, por ejemplo, el grupo ciclopentenilalilamino o ciclohexenilalilamino.

El “alquilo (C₁ a C₄) - cicloalquilamino (C₃ a C₈)” representa, por ejemplo, el grupo metilciclopentilamino o metilciclohexilamino.

55 El “alquilo (C₁ a C₈) - cicloalquencilamino (C₄ a C₈)” representa, por ejemplo, el grupo metilciclopentenilamino o metilciclohexenilamino.

El “alqueno (C₂ a C₄) - cicloalquilamino (C₃ a C₈)” representa, por ejemplo, el grupo vinilciclopentilamino, alilciclopentilamino, vinilciclohexilamino o alilciclohexilamino.

60 El “alquino (C₂ a C₄) - cicloalquilamino (C₃ a C₈)” representa, por ejemplo, el grupo etnilciclopentilamino, propargilciclopentilamino, etnilciclohexilamino o propargilciclohexilamino.

65 El “alqueno (C₂ a C₄) - cicloalquencilamino (C₄ a C₈)” representa, por ejemplo, el grupo vinilciclopentenilamino, alilciclopentenilamino, vinilciclohexenilamino o alilciclohexenilamino.

Además de grupos amino N-sustituidos sencillos, se incluyen también los derivados N,N-disustituidos, en particular los derivados cuyo hidrógeno se reemplaza por un grupo alquilo (C₁ a C₄).

ES 2 287 321 T3

El término “trialquilsililo (C_1 a C_{10})” significa un átomo de silicio que tiene tres radicales alquilo idénticos o diferentes tal y como se definieron anteriormente. Análogamente, “arildialquilsililo (C_1 a C_6)” representa un átomo de silicio que tiene un radical arilo y dos radicales alquilo idénticos o diferentes tal y como se definieron anteriormente, “diarilalquilsililo (C_1 a C_6)” representa un átomo de silicio que tiene un radical alquilo y dos radicales arilo idénticos o diferentes tal y como se definieron anteriormente, y “triarilsililo” representa un átomo de silicio que tiene tres radicales arilo idénticos o diferentes tal y como se definieron anteriormente.

Por el término “arilo” se refiere a un carbocíclico, es decir, formado a partir de átomos de carbono, radical aromático con preferentemente de 6 a 14, en particular de 6 a 12 átomos de C, tales como, por ejemplo, fenilo, naftilo o bifenililo, preferentemente fenilo.

Por lo tanto, “aroilo” significa un radical arilo tal y como se definió anteriormente que se enlaza a través de un grupo carbonilo, tal como, por ejemplo, el grupo benzoilo.

El término “heterociclo no aromático de cuatro a ocho miembros que tiene un átomo de oxígeno, azufre, nitrógeno y/o silicio en el anillo” representa un radical cíclico que puede estar completamente saturado o parcialmente insaturado, pero no aromático y que está interrumpido por uno o más átomos idénticos o diferentes, preferiblemente uno o dos, del grupo nitrógeno, azufre, oxígeno y silicio, en el que además no pueden estar directamente adyacentes dos átomos de oxígeno. El heterociclo tiene de cuatro a ocho átomos en el anillo que son átomos de carbono además de los heteroátomos nombrados anteriormente.

El término “heterociclilo” representa preferentemente un radical cíclico que puede estar completamente saturado, parcialmente insaturado o completamente insaturado y que puede estar interrumpido por al menos uno o más átomos idénticos o diferentes, preferentemente de uno a tres, del grupo nitrógeno, azufre u oxígeno, en el que además no pueden estar directamente adyacentes dos átomos de oxígeno y al menos un átomo de carbono debe estar presente en el anillo, tales como, por ejemplo, un radical del tiofeno, furano, pirrol, tiazol, oxazol, imidazol, isotiazol, isoxazol, pirazol, 1,3,4-oxadiazol, 1,3,4-tiadiazol, 1,3,4-triazol, 1,2,4-oxadiazol, 1,2,4-tiadiazol, 1,2,4-triazol, 1,2,3-triazol, 1,2,3,4-tetrazol, benzo[b]tiofeno, benzo[b]furano, indol, benzo[c]tiopheno, benzo[c]furano, isoindol, benzoxazol, benzotiazol, bencimidazol, bencisoxazol, bencisotiazol, benzopirazol, benzotiadiazol, benzotriazol, dibenzofurano, dibenzotiofeno, carbazol, piridina, piracina, pirimidina, piridazina, 1,3,5-triacina, 1,2,4-triacina, 1,2,4,5-tetracina, quinolina, isoquinolina, quinoxalina, quinazolina, cinnolina, 1,8-naftiridina, 1,5-naftiridina, 1,6-naftiridina, 1,7-naftiridina, ftalacina, piridopirimidina, purina, pteridina, 4H-quinolicina, piperidina, pirrolidina, oxazolina, tetrahydrofurano, tetrahidropirano, isoxazolidina o tiazolidina. De los significados nombrados anteriormente como “heterociclilo”, el término “heteroaromático” incluye por lo tanto en cada caso los compuestos heterocíclicos aromáticos completamente insaturados.

Heterociclilo significa particularmente preferible un sistema anular saturado, parcialmente saturado o aromático, con de 3 a 6 miembros de anillo y de 1 a 4 heteroátomos del grupo O, S y N, en el que al menos un átomo de carbono debe estar presente en el anillo.

Heterociclilo significa de manera muy particularmente preferible un radical de la piridina, pirimidina, (1,2,4)-oxadiazol, (1,3,4)-oxadiazol, pirrol, furano, tiofeno, oxazol, tiazol, imidazol, pirazol, isoxazol, 1,2,4-triazol, tetrazol, piracina, piridacina, oxazolina, tiazolina, tetrahydrofurano, tetrahidropirano, morfolina, piperidina, piperazina, pirrolidina, pirrolidina, oxazolidina, tiazolidina, oxirano y oxetano.

Por lo tanto, “ariloxi” significa un radical arilo tal y como se definió anteriormente que se enlaza a través de un átomo de oxígeno, tal como, por ejemplo, el grupo fenoxi o naftiloxi.

El “ariltio” significa un radical arilo enlazado a través de un átomo de azufre, por ejemplo, el radical feniltio o 1- o 2-naftiltio.

El “arilamino” significa un radical arilo enlazado a través de un átomo de nitrógeno, por ejemplo, el radical anilino o 1- ó 2-naftamino.

El “N-alquilarilamino (C_1 a C_4)” significa, por ejemplo, el radical N-metil-anilino o N-etil-anilino.

El “arilalcoxi (C_1 a C_4)” representa un radical arilo enlazado a través de un grupo alcoxi (C_1 a C_4), por ejemplo, el radical benciloxi, feniletioxi, fenilbutoxi o naftilmetoxi.

El “arilalquenioloxi (C_3 a C_4)” representa un radical arilo enlazado a través de un grupo alquenioloxi (C_3 a C_4), por ejemplo, el radical 1-, 2- ó 3-fenilaliloxi.

El “arilalquiltio (C_1 a C_4)” representa un radical arilo que está enlazado a través de un radical alquiltio, por ejemplo, el radical benciltío, naftilmetiltío o 1- ó 2-feniletiltío.

El “arilalquenioltio (C_3 a C_4)” representa un radical arilo enlazado a través de un grupo alquenioltio (C_3 a C_4), por ejemplo, el radical 1-, 2- ó 3-fenilaliltío.

ES 2 287 321 T3

El "arilalquenilamino (C_3 a C_4)" representa un radical arilo enlazado a través de un grupo alquenilamino (C_3 a C_4), por ejemplo, el radical 1-, 2- ó 3-fenilalilamino.

5 El "arildialquilsililo (C_1 a C_8)" representa, por ejemplo, un grupo fenil-dimetilsililo o naftil-dimetilsililo.

El "diarilalquilsililo (C_3 a C_4)" representa, por ejemplo, un grupo difenil-metilsililo, fenil-naftil-metilsililo, o dinaftil-metilsililo.

10 El "triarilsililo" representa, por ejemplo, un grupo trifenilo, difenil-naftilo o trinaftilo.

Además, la expresión de que "opcionalmente en todos los grupos nombrados como R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} y R^{11} cuyo hidrógeno enlazado al carbono se puede reemplazar por hasta tres átomos de halógeno, en el caso de flúor también hasta el número máximo" incluye, por ejemplo, los siguientes radicales:

15 Haloalquilo, tal como, por ejemplo, el grupo 1- ó 2-fluoroetilo, el trifluorometilo, el 2,2,2-trifluoroetilo, el clorometilo, el fluorometilo, el difluorometilo o el 1,1,2,2-tetrafluoroetilo;

Haloalquenilo, tal como, por ejemplo, el grupo 1-, 2- ó 3-fluoroalilo o el grupo 1,1-difluoropropeno-3-ilo;

20 Haloalcoxi, tal como, por ejemplo, trifluorometoxi o 2,2,2-trifluoroetoxi;

Haloalquiltio, tal como, por ejemplo, trifluorometiltio;

25 Haloalquilsulfinil, tal como, por ejemplo, trifluorometilsulfinilo;

Haloalquilsulfonil, tal como, por ejemplo, trifluorometilsulfonilo;

Halociclopropilo, tal como, por ejemplo, 1,1-difluorocicloprop-2-ilo.

30 Dependiendo del tipo de sustituyentes definidos anteriormente, los compuestos de la Fórmula general (I) tienen propiedades ácidas o básicas, que pueden formar sales. Si por ejemplo los compuestos de la Fórmula general (I) tienen grupos tales como hidroxil, carboxil u otros grupos que inducen propiedades ácidas, estos compuestos pueden reaccionar con bases para formar sales. Las bases apropiadas son, por ejemplo, los hidróxidos, los carbonatos, los hidrogenocarbonatos de metales alcalinos y alcalinotérreos, en particular los de sodio, potasio, magnesio y calcio, además del amonio, las aminas primarias, secundarias o terciarias con radicales alquilo (C_1 a C_4) así como las aminas monoalcohol, dialcohol y trialcohol de los alcoholes (C_1 a C_4). Si por ejemplo los compuestos de la Fórmula general (I) tienen grupos tales como amino, alquilamino u otros grupos que inducen propiedades básicas, estos compuestos pueden reaccionar con ácidos para formar sales. Los ácidos apropiados son, por ejemplo, los ácidos minerales tales como el ácido clorhídrico, el ácido sulfúrico y el ácido fosfórico, los ácidos orgánicos tales como el ácido acético o el ácido oxálico, y las sales ácidas tales como $NaHSO_4$ y $KHSO_4$. Las sales obtenidas de este modo tienen asimismo propiedades insecticidas, acaricidas y miticidas.

45 Los compuestos de la Fórmula general (I) pueden tener uno o más átomos de carbono asimétricos o estereoisómeros con dobles enlaces. Por lo tanto pueden tener lugar enantiómeros o diastereómeros. La presente invención comprende tanto a los isómeros puros como a sus mezclas. Las mezclas de los diastereómeros se pueden separar en los isómeros según procedimientos habituales, por ejemplo, por cristalización selectiva a partir de disolventes apropiados o por cromatografía. Los racematos se pueden separar en los enantiómeros según procedimientos habituales.

50 La preparación de los compuestos según la presente invención se lleva a cabo según los procedimientos conocidos en sí en la literatura, tal y como se describen en trabajos sobre síntesis orgánica, como por ejemplo, Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, Georg-Thieme-Verlag, Stuttgart.

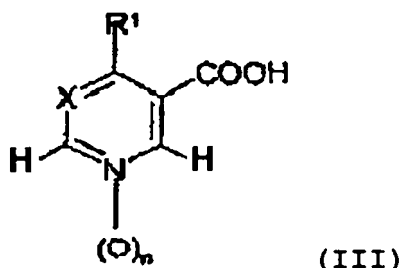
55 La preparación se lleva a cabo bajo condiciones de reacción que son conocidas y apropiadas para las reacciones nombradas. También se pueden utilizar variantes conocidas en sí, no mencionadas aquí con más detalle.

Las sustancias de partida se pueden también, si se desea, formar *in situ* de manera que no están aisladas de la mezcla de reacción pero de inmediato reaccionaron además para formar los compuestos de la Fórmula (I).

60 La presente invención se refiere también a los procesos para la preparación de los compuestos de la Fórmula general (I).

ES 2 287 321 T3

Para preparar los compuestos de la Fórmula general (I), en la que R^1 , R^4 , R^5 , A, Y y n tienen los significados dados para la Fórmula (I), el procedimiento es, por ejemplo, de manera que un ácido carboxílico de la Fórmula (III),



20 en el que X, R^1 y n tienen los significados dados anteriormente para la Fórmula (I), que se reacciona en forma de un derivado activado de este ácido, por ejemplo, un haluro ácido, éster o anhidro, en presencia de una base, por ejemplo, al menos una amina tal como la trietilamina, la diisopropiletilamina, la piridina o la lutidina, carbonato de metal alcalino, hidrogenocarbonato de metal alcalino o hidróxido de metal alcalino o las combinaciones de estos compuestos, con un compuesto de la Fórmula (IV), en la que R^4 y R^5 tienen los significados dados anteriormente para la Fórmula (I),



y el radical R^5 entonces opcionalmente el derivado adicional.

30 Las recopilaciones de los compuestos de la Fórmula (I) que se pueden sintetizar según los procedimientos nombrados anteriormente se pueden preparar también en paralelo, en las que esto puede tener lugar de manera manual, parcialmente automatizada o completamente automatizada. Ello es posible, por ejemplo, para automatizar la implementación de la reacción, el proceso de elaboración o la purificación de los productos o de las etapas intermedias. En términos generales, mediante esto se pretende un procedimiento como el descrito, por ejemplo, por S. H. DeWitt en el "Annual Reports in Combinatorial Chemistry and Molecular Diversity: Automated Synthesis", Volumen 1, Escmo 1997, páginas 69 a 77.

35 Para implementar la reacción y el proceso de elaboración en paralelo, se pueden utilizar una gama de equipamientos disponibles comercialmente, como el que está en venta, por ejemplo, por Stem Corporation, Woodrolfe Road, Tollesbury, Essex, CM9 8SE, Inglaterra o por H+P Labortechnik GmbH, Bruckmannring 28, 85764 Oberschleissheim, Alemania o por Radleys, Shirehill, Saffron Walden, Essex, Inglaterra. Se dispone del instrumento cromatográfico para purificar en paralelo los compuestos de la Fórmula general (I) o los productos intermedios formados durante la preparación, por ejemplo, de ISCO, Inc., 4700 Superior Street, Lincoln, NE 68504, Estados Unidos.

40 El instrumento enumerado da lugar a un procedimiento modular en el que las etapas de trabajo individual están automatizadas, pero con operaciones manuales que se tienen que llevar a cabo entre las etapas de trabajo. Esto se puede evitar utilizando sistemas de automatización parcialmente o completamente integrados en los que los respectivos módulos de automatización operan, por ejemplo, mediante robots. Se pueden obtener dichos sistemas de automatización, por ejemplo, de Zymark Corporation, Zymark Center, Hopkinton, MA 01748, Estados Unidos.

45 Además de los compuestos descritos en la presente invención, se puede llevar a cabo la preparación de los compuestos de la Fórmula general (I) de forma total o parcial, utilizando procedimientos basados en fase sólida. Para este propósito, las etapas intermedias individuales o todas las etapas intermedias de la síntesis o de una síntesis adaptada al procedimiento correspondiente se unen a una resina de síntesis. Los procedimientos de síntesis basados en fase sólida son bien conocidos en la literatura especializada, por ejemplo, de Barry A. Bunin en "The Combinatorial Index", Academic Press, 1998.

50 La utilización de los procedimientos de síntesis basados en fase sólida permite una gama de protocolos conocidos en la literatura que se pueden a su vez llevar a cabo manualmente o automáticamente. Por ejemplo, el "método teabag" (Houghten, US 4.631.211; Houghten *et. al.*, Proc. Natl. Acad. Sci, 1985, 82, 5131-5135) se puede automatizar parcialmente con los productos de IRORI, 11 149 North Torrey Pines Road, La Jolla, CA 92037, Estados Unidos. La automatización de la síntesis en paralelo en fase sólida se consigue, por ejemplo, utilizando instrumentos de Argonaut Technologies, Inc., 887 Industrial Road, San Carlos, CA 94070, Estados Unidos o de MultiSynTech GmbH, Wullener Feld 4, 58454 Witten, Alemania.

55 La preparación según los procesos descritos en la presente invención produce los compuestos de la Fórmula (I) en forma de recopilaciones de sustancias que se denominan quimiotecas.

60 Un tema de la presente invención son también las quimiotecas que contienen al menos dos compuestos de la Fórmula (I).

ES 2 287 321 T3

Los compuestos de la Fórmula (I) son apropiados, con buena tolerancia de las plantas y toxicidad favorable en animales de sangre caliente, para controlar a las plagas de animales, en particular de insectos, de arácnidos, de helmintos y de moluscos, de manera muy particularmente preferible para controlar a los insectos y los arácnidos que tienen lugar en la agricultura, en la cría de animales, en los bosques, en la protección y el almacenamiento de alimentos y materiales y también en el sector de la higiene. Son efectivos normalmente contra los tipos sensibles y resistentes así como a todas o a algunas etapas del desarrollo. Las plagas mencionadas anteriormente incluyen:

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

Del orden de las Isopodas, por ejemplo, *Oniscus aselus*, *Armadium vulgare* y *Porcellio scaber*.

Del orden de las Diplopodas, por ejemplo, *Blaniulus guttulatus*.

Del orden de las Chilopodas, por ejemplo, *Geophilus carpophagus* y *Scutigera spp.*

Del orden de las Symphylas, por ejemplo, *Scutigera immaculata*.

Del orden de las Tisanuras, por ejemplo, *Lepisma saccharina*.

Del orden de las Collembolas, por ejemplo, *Onychiurus armatus*.

Del orden de las Ortopteras, por ejemplo, *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Leucophaea maderae*, *Blattella germanica*, *Acheta domesticus*, *Gryllotalpa spp.*, *Locusta migratoria migratorioides*, *Melanoplus differentialis* y *Schistocerca gregaria*.

Del orden de las Isopteras, por ejemplo, *Reticulitermes spp.*

Del orden de las Anopluras, por ejemplo, *Phylloera vastatrix*, *Pemphigus spp.*, *Pediculus humanus corporis*, *Haematopinus spp.* y *Linognathus spp.*

Del orden de las Mallofagas, por ejemplo, *Trichodectes spp.* y *Darnalinae spp.*

Del orden de la Tisanoptera, por ejemplo, *Hercinothrips femoralis* y *Thrips tabaci*.

Del orden de las Heteropteras, por ejemplo, *Eurygaster spp.*, *Dysdercus intermedius*, *Piesma quadrata*, *Cimex lectularius*, *Rhodnius prolixus* y *Triatoma spp.*

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

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

Del orden de las Coleopteras, por ejemplo, *Anobium punctatum*, *Rhizopertha dominica*, *Bruchidius obtectus*, *Acanthoscelides obtectus*, *Hylotrupes bajulus*, *Agelastica alni*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Phaedon cochleariae*, *Diabrotica spp.*, *Psyllodes chrysocephala*, *Epilachna varivestis*, *Atomaria spp.*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Anthonomus spp.*, *Sitophilus spp.*, *Otiorrhynchus sulcatus*, *Cosmopolites sordidus*, *Ceuthorrhynchus assimilis*, *Hypera postica*, *Dermestes spp.*, *Trogoderma*, *Anthrenus spp.*, *Attagenus spp.*, *Lycius spp.*, *Meligethes aeneus*, *Ptinus spp.*, *Niptus hololeucus*, *Gibbium psyllodes*, *Tribolium spp.*, *Tenebrio molitor*, *Agriotes spp.*, *Conoderus spp.*, *Melolontha melolontha*, *Amphimallon solstitialis* y *Costelytra zealandica*.

Del orden de las Himenopteras, por ejemplo, *Diprion spp.*, *Hoplocampa spp.*, *Lasius spp.*, *Monomorium pharaonis* y *Vespa spp.*

Del orden de las Dipteras, por ejemplo, *Aedes spp.*, *Anopheles spp.*, *Culex spp.*, *Drosophila melanogaster*, *Musca spp.*, *Fannia spp.*, *Calliphora erythrocephala*, *Lucilia spp.*, *Chrysomyia spp.*, *Cuterebra spp.*, *Gastrophilus spp.*, *Hy-*

ES 2 287 321 T3

pobosca spp., *Stomoxys spp.*, *Oestrus spp.*, *Hypoderma spp.*, *Tabanus spp.*, *Tannia spp.*, *Bibio hortulanus*, *Oscinella frit*, *Phorbia spp.*, *Pegomyia hyoscyami*, *Ceratitits capitata*, *Dacus oleae* y *Tipula paludosa*.

Del orden de las Siphonapteras, por ejemplo, *Xenopsylla cheopsis* y *Ceratophyllus spp.*.

Del orden de las Aracnidas, por ejemplo, *Scorpio maurus* y *Latrodectus mactans*.

De la clase de los helmintos, por ejemplo, *Haemonchus*, *Trichostrongylus*, *Ostertagia*, *Cooperia*, *Chabertia*, *Strongyloides*, *Oesophagostomum*, *Hyostrongylus*, *Ancylostoma*, *Ascaris* y *Heterakis* y también *Fasciola*.

De la clase de las Gastropodas, por ejemplo, *Deroceras spp.*, *Arion spp.*, *Lymnaea spp.*, *Galba spp.*, *Succinea spp.*, *Biomphalaria spp.*, *Bulinus spp.*, *Oncomelania spp.*.

De la clase de las Bivalvas, por ejemplo, *Dreissena spp.*.

También se pueden controlar a los protozoos, tales como las Eimerias.

Los nematodos fitoparásitos que se pueden controlar según la presente invención incluyen, por ejemplo, los nematodos de suelo parásitos de las raíces tales como, por ejemplo, los de los géneros *Meloidogyne* (nematodos de los nudos de la raíz tales como la *Meloidogyne incognita*, la *Meloidogyne hapla* y la *Meloidogyne javanica*), la *Heterodera* y la *Globodera* (nematodos formadores de quistes tales como la *Globodera rostochiensis*, la *Globodera pallida* y la *Heterodera trifolii*) y también de los géneros *Radopholus* tal como la *Radopholus similis*, la *Pratylenchus* tal como la *Pratylenchus neglectus*, la *Pratylenchus penetrans* y la *Pratylenchus curvatus*; la *Tylenchulus* tal como la *Tylenchulus semipenetrans*, la *Tylenchorhynchus*, tal como la *Tylenchorhynchus dubius* y la *Tylenchorhynchus claytoni*, la *Rotylenchus* tal como la *Rotylenchus robustus*, la *Helicotylenchus* tal como la *Helicotylenchus multicinctus*, la *Belonoaimus* tal como la *Belonoaimus longicaudatus*, la *Longidorus* tal como la *Longidorus elongatus*, la *Trichodorus* tal como la *Trichodorus primitivus* y la *Xiphinema* tal como la *Xiphinema index*.

Además, el nematodo de los generos *Ditylenchus* (parásitos severos tales como el *Ditylenchus dipsaci* y el *Ditylenchus destructor*), *Aphelenchoides* (nematodos de las hojas tales como el *Aphelenchoides ritzemabosi*) y *Anguina* (nematodos galígenos tales como el *Anguina tritici*) se pueden controlar con los compuestos según la presente invención.

La presente invención se refiere también a los agentes, por ejemplo, los agentes para la protección de las plantas, preferentemente insecticidas, acaricidas, ixodicidas, nematocidas, moluscicidas o fungicidas, en particular agentes insecticidas y acaricidas que contienen uno o más compuestos de la Fórmula (I) además de formulaciones auxiliares apropiadas.

Para producir los agentes según la presente invención, se mezclan juntos el ingrediente activo y los aditivos adicionales y se transforman en una forma apropiada de utilización.

La presente invención se refiere también a los agentes, en particular a los agentes insecticidas y acaricidas, que contienen los compuestos de la fórmula (I) además de formulaciones auxiliares apropiadas.

Los agentes según la presente invención contienen en general del 1 al 95% en peso de los ingredientes activos de la Fórmula (I). Se pueden formular de varias formas, según que se especifique parámetros biológicos y/o fisicoquímicos. Se puede considerar por lo tanto como posibilidades para la formulación:

Los polvos humectantes (PH), los concentrados emulsionantes (CE), los líquidos solubles (LS), las emulsiones, las soluciones pulverizables, las concentraciones de suspensiones basadas en aceites o en agua (CS), las suspoemulsiones (SE), los polvos para espolvorización (PE), los corrosivos, los gránulos en forma de microgránulos, gránulos en aerosol, gránulos cubiertos y gránulos de adsorción, los gránulos que se dispersan en agua (GA), las formulaciones ULV, las microcápsulas, las ceras o los cebos.

Se conocen en principio estos tipos de formulaciones individuales y se describen, por ejemplo, en: Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Volumen 7, C. Hanser Verlag, Munich, 4ª Edición 1986; van Falkenberg, "Pesticidas Formulations", Marcel Dekker, Nueva York, 2ª Edición 1972-1973; K. Martens, "Spray Drying Handbook", 3ª Edición 1979, G. Goodwin Ltd., Londres.

Las formulaciones auxiliares necesarias, es decir, las sustancias portadoras y/o tensoactivas tales como los materiales inertes, los agentes de superficie, los disolventes y los aditivos adicionales asimismo se conocen y se describen, por ejemplo, en: Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers", 2ª Edición, Darland Books, Caldwell, Nueva Jersey; H. v. Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry", 2ª Edición, J. Wiley & Sons, Nueva York; Marsden, "Solvents Guide", 2ª Edición, Interscience, Nueva Cork, 1950; McCutcheon's, "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood, Nueva Jersey; Sisley and Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., Nueva York, 1964; Schonfeldt, "Grenzflächenaktive Athylenoxidaddukte", Wiss. Verlagsgesell, Stuttgart, 1967; Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Volumen 7, C. Hanser Verlag Munich, 4ª Edición, 1986.

ES 2 287 321 T3

Partiendo de la base de estas formulaciones, se pueden preparar también combinaciones con otras sustancias pesticidas, fertilizantes y/o reguladores del crecimiento, por ejemplo, en forma de una mezcla ya preparada o como una mezcla en tanque. Los polvos humectantes son preparaciones que se pueden dispersar uniformemente en agua que, además del ingrediente activo, aparte de una sustancia diluyente o inerte, también contiene humectantes, por ejemplo, alquilfenoles polioxietilados, alcoholes grasos polioxietilados, sulfonatos de alquil o de alquilfenol y dispersantes, por ejemplo, ácido lignosulfónico sódico y ácido 2,2'-dinaftilmetano-6,6'-disulfónico sódico.

Los concentrados emulsionantes se preparan disolviendo el ingrediente activo en un disolvente orgánico, por ejemplo, butanol, ciclohexanona, dimetilformamida, xileno o también aromáticos o hidrocarburos de elevado punto de ebullición con la adición de uno o más emulsionantes. Se pueden utilizar, por ejemplo, como emulsionantes: las sales de ácido sulfónico de alquilarilo cálcico tal como el sulfonato de dodecibenceno cálcico o los emulsionantes no iónicas tales como los ésteres de poliglicol de ácidos grasos, los éteres de poliglicol alquilarilo, los éteres de poliglicol de alcoholes grasos, los productos de condensación de óxido de propileno - óxido de etileno, los poliéteres de alquilo, los ésteres de ácidos grasos del sorbitano, los ésteres de ácidos grasos del sorbitano polioxietileno o los ésteres del sorbitol polioxietileno.

Los agentes para espolvorización se obtienen moliendo el ingrediente activo con sustancias sólidas distribuidas finamente, por ejemplo, el talco, las arcillas naturales tales como el caolín, la bentonita, la pirofilita o las tierras de diatomeas. Los gránulos se pueden preparar tanto por atomización del ingrediente activo en el material inerte adsorbente y granulado como por aplicación de los concentrados de ingrediente activo mediante adhesivos, por ejemplo, alcohol de polivinilo, ácido poliacrílico sódico o también aceites minerales, hacia la superficie de los portadores tales como arena, caolinita o de material inerte granulado. Si se desean mezclar con fertilizantes, los ingredientes activos apropiados se pueden granular también de forma habitual para la preparación de gránulos de fertilizantes.

En los polvos humectantes, la concentración de ingrediente activo es por lo general aproximadamente del 10 al 90% en peso, el resto hasta el 100% en peso consiste en constitutivos de formulaciones habituales. En concentrados de emulsionantes, la concentración del ingrediente activo puede ser aproximadamente del 5 al 80% en peso. Las formulaciones en forma de polvos para espolvorización contienen por lo general del 5 al 20% en peso del ingrediente activo, aproximadamente del 2 al 20% en peso de soluciones pulverizables. En el caso de gránulos, el contenido de ingrediente activo depende en parte en si el compuesto activo se presenta en forma líquida o sólida y que excipientes de granulación, rellenos, etc., se utilizan.

Además, las formulaciones de ingrediente activo nombradas contienen opcionalmente los adhesivos, los humectantes, los dispersantes, los emulsionantes, los fluidos penetrantes, los disolventes, los rellenos o los portadores habituales en cada caso.

Para que se puedan utilizar, las concentraciones presentes comercialmente en forma habitual se diluyen opcionalmente de forma habitual, por ejemplo, utilizando agua con polvos humectantes, concentrados emulsionantes, dispersiones y en parte también con microgránulos. Las preparaciones en forma de polvos para espolvorización y gránulos y también soluciones pulverizables por lo general se diluyen además con sustancias inertes adicionales antes de su utilización.

La cantidad requerida de solicitudes varía dependiendo de las condiciones externas tales como la temperatura y la humedad, entre otras. Puede variar dentro de límites amplios, por ejemplo, entre 0,0005 y 10,0 kg/ha o más de sustancia activa, pero preferentemente está entre 0,001 y 5 kg/ha de ingrediente activo.

Los ingredientes activos según la presente invención se pueden presentar comercialmente en sus formulaciones habituales y también en formas de utilización preparadas a partir de estas formulaciones mezcladas con otros ingredientes activos tales como los insecticidas, los cebos atrayentes, los esterilizantes, los acaricidas, los nematocidas, los fungicidas, las sustancias reguladoras del crecimiento o los herbicidas.

Los pesticidas incluyen, por ejemplo, los ésteres del ácido fosfórico, los carbamatos, los ésteres del ácido carboxílico, las formamidinas, los compuestos de estaño y las sustancias preparadas utilizando microorganismos.

Las parejas de mezclas preferidas son:

1. Del grupo de los compuestos de fósforo.

Acefato, azametifos, azinfos-etilo, azinfos-metilo, bromofos, bromofos-etilo, cadusafos (F-67825), cloretoxifos, clorienvinfos, clormefos, clorpirifos, metil-clorpirifos, demeton, demeton-S-metilo, demeton-S-metilsulfón, dialifos, diazinón, diclorvós, dicrotofos, dimetoato, disulfotón, EPN, etión, etoprofos, etrimfos, famfur, fenamifos, fenitrotión, fensulfotión, fentió, fonofos, formotión, fostiazato (ASC-66824), heptenofos, isazofos, isotioato, isoxatió, malatió, metacrifos, metamidofos, metidatió, salitió, mevinfos, monocrotofos, naled, ometoato, oxidemeton-metilo, paratió, paratió-metilo, fentoato, forato, fosalono, fosfolán, fosfocarb (BAS-301), fosmeto, fosfamidón, foxim, pirimifos, pirimifos-etilo, pirimifos-metilo, profenofos, proprafos, proetamfos, protiofos, piraclafos, piridapentió, quinalfos, sulprofos, temefos, terbufos, tebupirimfos, tetraclorvinfos, tiometon, triazofos, triclorfon y vamidotió;

ES 2 287 321 T3

2. Del grupo de los carbamatos.

Alanicarb (OK-135), aldicarb, 2-sec-butilfenil metilcarbamato (BPMC), carbarilo, carbofurano, carbosulfano, cloetocarb, benfuracarb, etiofencarb, furatiocarb, HCN-801, isoprocarb, metomil, 5-metil-m-cumenilbutiril(metil)carbamato, oxamilo, pirimicarb, proprocur, tiodicarb, tiofanox, 1-metiltio(etilidenoamino)-N-metil-N-(morfolinotio)carbamato (UC 51717) y triazamato;

3. Del grupo de los ésteres del ácido carboxílico.

Acrinatrina, aletrina, alfame-trina, 5-bencil-3-furilmetil-(E)-(1R)-cis-2,2-dimetil-3-(2-oxotiolan-3-ilidenometil) ciclopropanocarbolato, beta-ciflutrina, beta-cipermetrina, bioaletrina, bioaletrina-(isómero (S)-ciclopentilo), bioresmetrina, bifentrina, (RS)-1-ciano-1-(6-feno-xi-2-piridil)metil-(1RS)-trans-3-(4-terbutilfenil)-2,2-dimetilciclopropanocarboylato (NCI 85193), cicloprotrina, ciflutrina, cihalotrina, cititrina, cipermetrina, cifenotrina, deltametrina, empentrina, esfenvalerato, fenflutrina, fenpropatrina, fenvalerato, flubrocitrinato, flucitrinato, flumetrina, fluvalinato (isómero D), imiprotrina (S-41311), lambda-cihalotrina, permetrina, fenotrina (isómero (R)), praletrina, piretrina (productos naturales), resmetrina, teflutrina, tetrametrina, theta-cipermetrina (TD-2344), tralometrina, transflutrina y zeta-cipermetrina (F-56701);

4. Del grupo de las amidinas.

Amitraz y clordimeform;

5. Del grupo de los compuestos de estaño.

Cihexatina y óxido de fenbutatina;

6. Otros.

Abamectina, ABG-9008, acequinocilo, azadiractina, acetamiprido, *anagrapha falcitera*, AKD-1022, AKD-3059, AKD-3088, AL-9811, ANS-118, *bacillus thuringiensis*, *beauveria bassiana*, bensultap, bifenazato (D-2341), bina-pacril, BJL-932, bromopropilato, BAJ-2740 (espiroclorofeno), BTG-504, BTG-505, buprofezina, camfeclor, cartap, clorobencilato, clorfenapir, clorfluzaron, 2-(4-clorofenil)-4,5-difeniltiofeno (UBI-T 930), clofentezina, cloproxife-no, clotianidina, cromafeno-zida (ANS-118), A-184699, - éster de (2-naftilmetil) - ácido ciclopropanocarboxílico (Ro12-0470), ciromazina, CM-002X, DBI-3204, diaclo-den (tiametoxam), diafentiuron, éster etilo del ácido N-(3,5-dicloro-4-(1,1,2,3,3,3-hexafluoro-1-propiloxi)fenil)-carbamoil)-2-clorobenzocarboximido, DDT, dicofol, diflubenzu-ron, N-(2,3-diidro-3-metil-1,3-tiazol-2-ilideno)-2,4-xilidino, dinobuton, dinocap, diofenolan, DPX-062, benzoato de emamectina (MK-244), endosulfan, etiprole (sulfetiprole), etofenprox, etoxazole (YI-5301), fenazaquin, fenoxicarb, fipronil, fluazuron, flumite (flufenzine, SZI-121), 2-fluoro-5-(4-(4-ethoxyphenyl)-4-methyl-1-penty1)diphenylether (MTI 800), virus de poliedro granuloso y nuclear, fenpiroximato, fentiocarb, fluacripirim, flufenzina, flubenzimina, fluciclo-xuron, flufenoxuron, flufenprox (ICI-A5683), fluproxifeno, FMC-F6028, gamma-HCH, halofeno-zida (RH-0345), halofenprox (MTI-732), hexaflumuron (DE-473), hexitiazox, HOI-9004, hidrametilnon (AC 217300), lufenu-ron, imidacloprid, indoxacarb (DPX-MP062), kanemita (AKD-2023), M-020, MTI-446, ivermectina, M-020, IKA-2000, IKI-220, MKI-245, metoxifeno-zida (intrepid, RH-2485), milbemectin, NC-196, neemgard, nitenpiram (TI-304), 2-nitrometil-4,5-dihidro-6H-tiazina (DS 52618), 2-nitrometil-3,4-dihidrotiazola (SD 35651), 2-nitrometilen-1,2-tiazinan-3-ilcarbomaldehido (WL 108477), NC-196, NNI-0001, nidintefuran, piriproxifen (S-71639), piridaril, protrifenbute, piriproxifen, NC-196, NC-1111, NNI-9768, novaluron (MCW-275), OK-9701, OK-9601, OK-9602, proprargita, pimetrozina, piridaben, pirimidifen (SU-8801), RH-0345, RH-2485, RYI-210, S-1283, S-1833, SB7242, SI-8601, silafluofen, silomadina (CG-177), spinosad, SU-9118, tebufeno-zide, tebufenpirad (MK-239), teflubenzuron, tetradifon, tetrasul, tiacloprid, tiociclam, tiametoxam, TI-435, tolfenpirad (OMI-88), triazamato (RH-7988), triflum-u-ron, verbutin, vertalec (micotal), YI-5301 y YI-6101.

Las parejas de combinación mencionadas anteriormente representan los ingredientes activos conocidos, la mayoría de los cuales se describen en Ch. R Worthing, S. B. Walker, The Pesticide Manual, 12ª Edición, British Crop Protection Council Famham, 2000.

Los siguientes productos se pueden nombrar, por ejemplo, como fungicidas que se pueden combinar con los com-puestos según la presente invención de la Fórmula (I):

Aldimorf, andoprim, anilazina, BAS 480F, BAS 450F, benalaxil, benodanil, benomil, binapacril, bitertanol, bro-muconazol, butiobate, captafol, captán, carben-dazim, carboxín, CGA 173506, ciprofuram, dicloflu-anid, diclomezin, diclobutrazol, dietofencarb, difenconazol (CGA 169374), difluconazole, dimetirimol, dimetomorf, diniconazole, di-nocap, ditianon, dodemorf, dodina, edifenfos, etirimol, etridiazot, fenarimol, fenfuram, fenciclonil, fenpropidin, fen-propimorf, fentinacetato, fentinhidróxido, ferimzone (TF164), fluazinam, fluobenzimina, fluquinconazole, fluorimi-da, flusilazole, flutolanil, fluta-fol, folpet, fosetilaluminio, fuberidazole, fulsulfamida (MT-F 651), furalaxil, furco-

ES 2 287 321 T3

nazol, furmeciclo, guazatina, hexaconazole, ICI A5504, imazalil, imibenconazole, iprobenfos, iprodiona, isoprotiolane, KNF 317, compuestos de cobre tales como oxiclورو de cobre, oxina de cobre, óxido de cobre, mancozeb, maneb, mepanipirim (KIF 3535), metconazol, mepronil, metalaxil, metasulfocarb, metfuroxam, MON 24000, miclobutanil, nabam, nitrotalidopropil, nuarimol, ofurace, oxadixil, oxicarboxin, penconazol, pencicuron, PP 969, 5 probenazole, proprineb, procloraz, procimidon, propamocarb, propiconazol, protiocarb, piracarbolid, pirazofos, pirifenox, piroquilon, rabenzazole, RH 7592, azufre, tebuconazole, TF 167, tiabendazole, ticiofen, tiofanato-metilo, tiram, tolclofos-metilo, tolilfluanid, triadimefon, triadimenol, triciclazole, tridemorf, triflumizol, triforina, validamicín, vinclozólín, XRD 563, zineb, sulfonato de dodecilo sódico, sulfato de dodecilo sódico, sodium alcohol ether sulfonato de éter de alcohol C13/C15 sódico, éster de fosfato de cetostearilo sódico, sulfosuccinato de dioctilo sódico, sulfonato de naftaleno isopropilo sódico, sulfonato de bisnaftaleno metileno sódico, cloruro amónico de trimetil cetilo, sales de aminas primarias, secundarias y terciarias de cadena larga, alquilpropilenoamina, bromuro de lauril-pirimidinio, aminas grasas cuaternizadas etoxiladas, cloruro amónico de alquildimetilbencilo y 1-hidroxitil-2-alquilimidazolina.

15 El contenido de ingrediente activo de las formas de utilización preparadas a partir de formulaciones comercialmente habituales puede ser desde el 0,00000001 hasta el 95% en peso de ingrediente activo, preferentemente entre el 0,00001 y el 1% en peso.

20 La utilización tiene lugar de forma habitual adaptada a la forma de utilización.

Un tema de la presente invención es por lo tanto la utilización de los compuestos de la Fórmula (I) y de sus sales para controlar a los organismos de las plagas.

25 Un tema adicional de la presente invención es un procedimiento para controlar a los insectos, los arácnidos y/o los nematodos nocivos, en el que se aplica una cantidad efectiva de un compuesto de la Fórmula (I) o de sus sales a las plagas o al lugar del efecto deseado.

30 Los ingredientes activos según la presente invención son también apropiados para controlar a los endoparásitos y los ectoparásitos en los campos de la medicina humana y veterinaria y en el campo de la cría de animales. Los ingredientes activos según la presente invención se utilizan en la presente invención de forma conocida, como para uso oral en forma, por ejemplo, de pastillas, cápsulas, pócimas, gránulos, para uso dérmico en forma, por ejemplo, de inmersión, pulverización, unción dorsal continua y unción dorsal puntual y espolvoreado, así como para uso parenteral en forma, por ejemplo, de inyección.

35 Un tema de la presente invención es por lo tanto también la utilización de un compuesto de la Fórmula (I) o de una de sus sales para la preparación de un producto medicinal humano o animal, preferentemente un producto medicinal animal, en particular para controlar a los endoparásitos y/o los ectoparásitos

40 Los compuestos según la presente invención de la Fórmula (I) se pueden en consecuencia utilizar también en particular de forma ventajosa para tratar a los animales de sangre caliente, en particular en la cría de ganado (por ejemplo, reses, ovejas, cerdos y aves de granja tales como pollos, gansos, etc.). En una realización preferida de la presente invención, los compuestos se administran oralmente a los animales, opcionalmente en formulaciones apropiadas y opcionalmente con sus aguas potables o con su comida. Dado que una excreción efectiva tiene lugar a través de las heces, el desarrollo de los insectos en las heces de los animales se puede prevenir muy fácilmente. Las dosis y las 45 formulaciones adecuadas en cada caso dependen en particular en el tipo y en la etapa de desarrollo de los animales de granja y también en el nivel de infestación y se pueden fácilmente establecer y especificar según los procedimientos habituales. Se pueden utilizar los compuestos en reses, por ejemplo, en dosis de 0,01 a 1 mg/kg de peso de animal.

50 Además de un efecto letal en las plagas, los compuestos de la Fórmula (I) o de sus sales se caracterizan también por un efecto repelente pronunciado.

55 El repelente dentro del significado de la descripción es una sustancia o una mezcla de sustancias que tiene un efecto defensivo o expulsivo en otros animales, en particular las plagas y los insectos nocivos. El término también incluye efectos tales como el efecto antialimentario, en el que se perturba o se impide la ingestión (efecto disuasivo alimentario), la supresión de la puesta de huevos o la influencia del desarrollo de la población.

60 Un tema de la presente invención es por lo tanto también la utilización de los compuestos de la Fórmula (I) o de sus sales para conseguir los efectos nombrados, en particular en las plagas nombradas en los ejemplos biológicos.

Un tema de la presente invención es también un procedimiento para defender de o para expeler a los organismos de las plagas, en el que uno o más compuestos de la Fórmula (I) o de sus sales se utilizan en el lugar en el que están los organismos de las plagas para que no se acerquen o se expelan.

65 El despliegue en el caso de que una planta puede ser, por ejemplo, un tratamiento de la planta o también de las semillas.

ES 2 287 321 T3

Con respecto a la influencia de las poblaciones, es también útil seguir la pista a los efectos sucesivos en el desarrollo de la población, para poder tenerlo en cuenta. Aunque el efecto individual puede por sí mismo tener solo un grado de eficiencia bastante por debajo del 100%, un efecto del 100% se puede finalmente conseguir en términos generales.

Por otra parte - para aprovecharse de los efectos enumerados anteriormente - los compuestos de la Fórmula (I) o de sus sales se diferencian por el hecho de que el agente se aplica de una vez más pronto de lo que es habitual con un control directo. El efecto continúa a menudo durante mucho tiempo con el resultado de que se consigue un periodo de acción de más de 2 meses.

Los efectos tienen lugar en los insectos, los arácnidos y las otras plagas nombradas anteriormente.

Además de los procedimientos de aplicación nombrados antes, los ingredientes activos según la presente invención de la Fórmula (I) tienen un efecto sistémico excelente. Los ingredientes activos se pueden por lo tanto introducir también en las plantas a través de tanto las partes subterráneas de la planta como en las de superficie (raíz, tallo, hoja) si los ingredientes activos se aplican en forma líquida o sólida en el área de forma directa alrededor de la planta (por ejemplo, gránulos aplicados en la tierra, aplicación en los campos inundados de arroz).

Además, los ingredientes activos según la presente invención se pueden utilizar en particular para tratar el material de multiplicación vegetativo y generativo, tal como, por ejemplo, las semillas de por ejemplo los cereales, las verduras, el algodón, el arroz, la remolacha azucarera y otras plantas cultivadas u ornamentales, la cebolla, los esquejes y las raíces de tubérculos de otras plantas cultivadas u ornamentales multiplicadas vegetativamente. El tratamiento para ello puede tener lugar antes de la siembra o el plantado (por ejemplo, mediante técnicas específicas de revestimiento de semillas, mediante abono en forma líquida o sólida o tratamiento de la caja de semillas), durante la siembra o el plantado o después de la siembra o el plantado mediante técnicas de aplicación específicas (por ejemplo, por tratamiento para la preparación del lecho de siembra). La cantidad utilizada de ingrediente activo puede variar en gran parte dependiendo de la aplicación. En general, las cantidades utilizadas están entre 1 g y 10 kg de ingrediente activo por hectárea de terreno.

Los compuestos de la Fórmula (I) se pueden utilizar también para controlar a las plagas de animales en los cultivos de plantas modificadas genéticamente que se conocen o que aún se están desarrollando. Por lo general, las plantas transgénicas se diferencian por las propiedades en particular favorables, por ejemplo, por las resistencias a los agentes de protección de plantas específicos, las resistencias a las enfermedades de las plantas o a las enfermedades patógenas de las plantas tales como insectos específicos o microorganismos tales como hongos, bacterias o virus. Otras propiedades especiales conciernen, por ejemplo, al producto de cosecha con respecto a la cantidad, la calidad, la almacenabilidad, la composición y los contenidos específicos. De este modo, se conocen plantas transgénicas con un elevado contenido de almidón o con la calidad del almidón modificada o de aquellos con otra composición de ácidos grasos del producto de cosecha.

Se prefiere la utilización en cultivos transgénicos significativos comercialmente de plantas agrícolas y ornamentales, por ejemplo, de cereales tales como el trigo, la cebada, el centeno, la avena, el mijo, el arroz, la mandioca y el maíz, o también cultivos de remolacha azucarera, algodón, soja, semilla de colza, patatas, tomates, guisantes y otros tipos de verduras.

Con la utilización en los cultivos transgénicos, en particular con resistencias a los insectos, a menudo tienen lugar los efectos, además de los efectos en los organismos de las plagas observables en otros cultivos, que son específicos a la aplicación en el respectivo cultivo transgénico, por ejemplo, un espectro de plaga modificado o expandido explícitamente que se puede controlar, o cantidades modificadas de aplicación que se pueden utilizar para la aplicación.

Un tema de la presente invención es también por lo tanto la utilización de compuestos de la Fórmula (I) para controlar a los organismos de las plagas en las plantas cultivadas transgénicamente.

La utilización de los compuestos según la presente invención comprende, además de la aplicación directa a las plagas, todas las demás aplicaciones por las que los compuestos de la Fórmula (I) actúan en las plagas. Dichas aplicaciones indirectas pueden ser, por ejemplo, la utilización de compuestos que se descomponen o se transforman, por ejemplo, en la tierra, la planta o la plaga, en los compuestos de la Fórmula (I).

Se hace referencia expresa al contenido de la solicitud de la patente alemana 10148290.6 cuya prioridad se reivindica mediante la presente solicitud, y el resumen que le acompaña; se incorpora en la presente descripción mediante referencia.

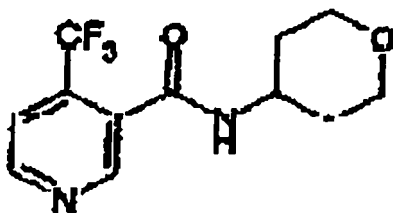
Los siguientes ejemplos sirven para explicar la presente invención sin limitarla.

A. Ejemplos químicos

Ejemplo A

5

10

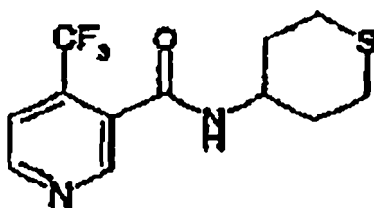
15 *Ácido 4-trifluorometil nicotínico-(amida tetrahidropiran-4-ilo)*

Una solución de 0,63 g (3,0 mmol) de cloruro de ácido 4-trifluoronicotínico en un poco de diclorometano se añade gota a gota a 0°C a una solución de 0,30 g (3,0 mmol) de 4-amino-tetrahidropurano (preparada mediante aminación reductiva de tetrahidropirano-4-ona; NH₃/H₂/Ni, 100 bar, 50°C) y 0,35 g (3,5 mmol) de trietilamina en 25 ml de diclorometano. Se agitó la mezcla durante otras dos horas a temperatura ambiente, reaccionó con solución salina saturada y se separaron las fases. Se extrajo la fase acuosa mediante agitación dos veces más con diclorometano. Se secaron y se concentraron las fases orgánicas combinadas. Se obtuvieron 0,46 g (el 67,8% del valor teórico) de producto como un sólido incoloro con un punto de fusión de 149-150°C.

25

Ejemplo B

30



35

Ácido 4-trifluorometil nicotínico-(amida tetrahidropiran-4-ilo)

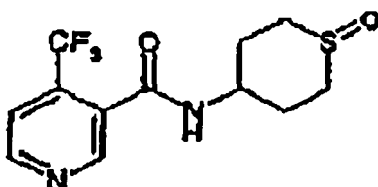
40

Como en el Ejemplo A, cantidades equimolares de 4-amino-tetrahidro-tiopirano (preparado partiendo de tetrahidro-tiopirano-4-ona a través de la correspondiente oxima y posterior reducción con alanato de litio en tetrahidrofurano) y de cloruro de ácido 4-trifluorometil nicotínico reaccionaron en presencia de trietilamina. Se obtuvo la amida después de aplicar cromatografía en gel de sílice (acetato de etilo) como un sólido incoloro con un punto de fusión de 161-163°C (Rendimiento del 51,3% del valor teórico).

45

Ejemplo C

50



55

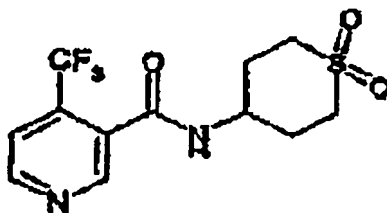
Ácido 4-trifluorometil nicotínico-(amida tetrahidrotiopiran-4-ilo)-S-óxido

60

Una solución de 1,23 g (5 mmol) de 70% de ácido 3-cloroperbenzoico en 25 ml de diclorometano se añadió a 0°C a una solución de 1,45 g (5 mmol) de ácido 4-trifluorometil nicotínico-(amida tetrahidrotiopiran-4-ilo) (Ejemplo B) en 50 ml de diclorometano. Se agitó la mezcla durante 6 horas a temperatura ambiente, se extrajo por agitación con solución de sosa y se dejó secar la fase orgánica. Después la concentración permaneció un aceite incoloro que cristalizó después de la trituración con acetato de etilo. Después de la filtración mediante succión se obtuvo 1,0 g de producto (el 65,3% del valor teórico) con un punto de fusión de 243-244°C.

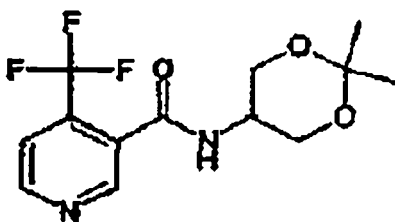
65

Ejemplo D

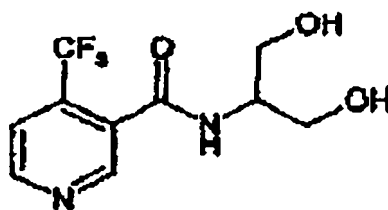
*Ácido 4-trifluorometil nicotínico-(amida tetrahidropirán-4-ilo)-S,S-dióxido*

Una solución de 2,46 g (10 mmol) de 70% de ácido 3-cloroperbenzoico en 50 ml de diclorometano se añadieron a 0°C a una solución de 1,45 g (5 mmol) de ácido 4-trifluorometil nicotínico-(amida tetrahidropirán-4-ilo) (Ejemplo B) en 50 ml de diclorometano. Se agitó la mezcla durante 6 horas a temperatura ambiente, se extrajo por agitación con solución de sosa y se dejó secar la fase orgánica. Después la concentración permaneció un aceite incoloro que cristalizó después de la trituración con acetato de etilo. Después de la filtración mediante succión se obtuvo 1,3 g de producto (el 80,7% del valor teórico) con un punto de fusión de 248°C (descomposición).

Ejemplo E

*Ácido 4-trifluorometil nicotínico-(amida 2,2-dimetil-1,3-dioxa-ciclohexilo)*

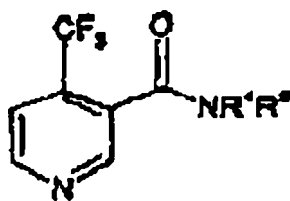
2,64 g (10 mmol) de N-(4-trifluorometilnicotinoil)-serinol y 4,20 g (40 mmol) de acetona dimetil acetal se agitaron en 50 ml de tolueno en presencia de 0,50 g de hidrato de ácido p-toluen sulfónico durante 12 horas a 80°C, en el que el metanol resultante se destiló aparte. Después de refrigerar, se extrajo la mezcla por agitación con sosa cáustica diluida y agua y se dejó secar y concentrar la fase orgánica. Se obtuvo 1,5 g de producto (el 49,3% del valor teórico) como un sólido incoloro con un punto de fusión de 155-156°C.

Preparación del producto de partida N-(4-trifluorometilnicotinoil)-serinol.

3,9 g (20 mmol) de ácido 4-trifluorometil nicotínico y 3,2 g (20 mmol) de carbonildiimidazola se agitaron en 100 ml de tetrahidrofurano seco a 40-50°C durante 6 horas. Después de refrigerar, se añadieron 1,8 g (20 mmol) de serinol y se continuó con la agitación durante 4 horas más a 50-60°C. El producto puro obtenido después de retirar el disolvente se purificó mediante cromatografía en gel de sílice. Se obtuvieron 2,9 g de producto (el 55,3% del valor teórico) con un punto de fusión de 155-156°C.

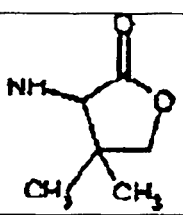
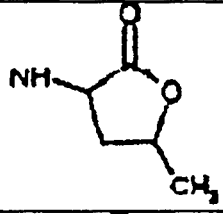
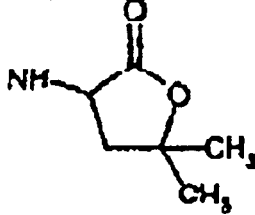
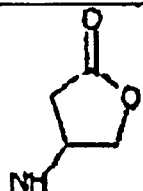
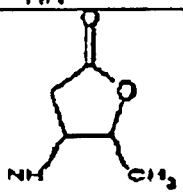
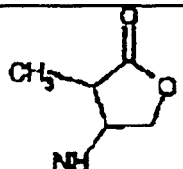
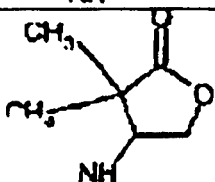
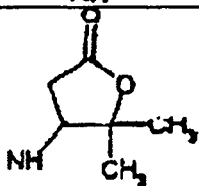
Los compuestos mostrados en las siguientes tablas se pueden producir de forma similar.

TABLA 1

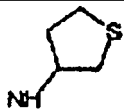

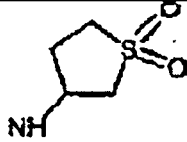
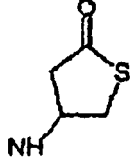
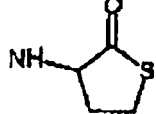
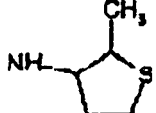
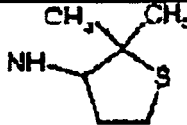
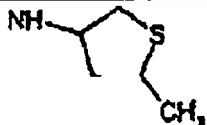
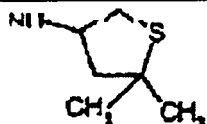
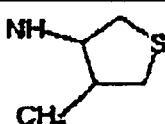
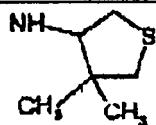
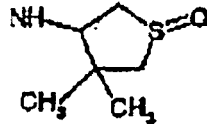


Número de Ejemplo	NR^4R^5	Punto de Fusión [$^{\circ}\text{C}$]
1		
2		
3		aceite
4		
4		
5		
6		
7		
8		121 - 122
9		

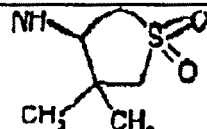
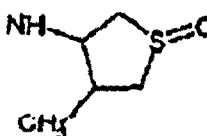
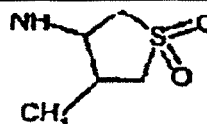
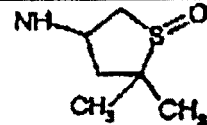
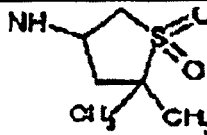
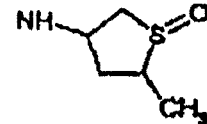
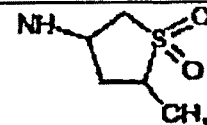
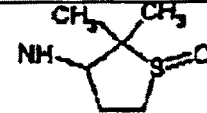
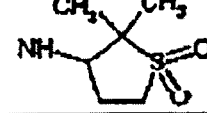
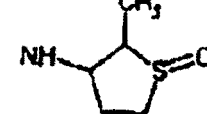
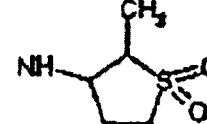

ES 2 287 321 T3










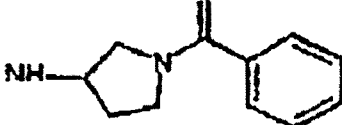
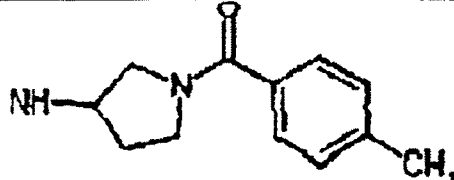
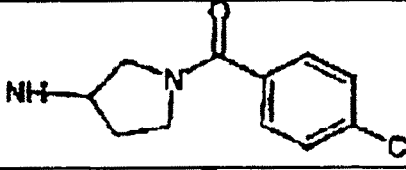
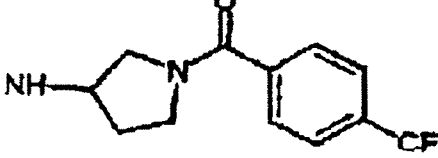
<p>9</p>		<p>168 - 171</p>
<p>10</p>		<p>119 - 121</p>
<p>11</p>		<p>140 - 142</p>
<p>12</p>		<p>83 - 84</p>
<p>13</p>		
<p>14</p>		
<p>15</p>		
<p>16</p>		

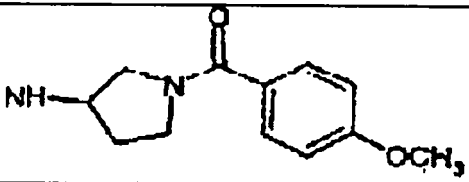
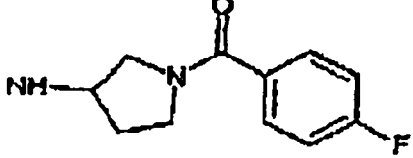
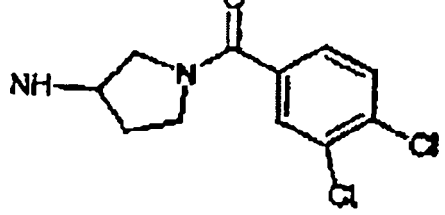
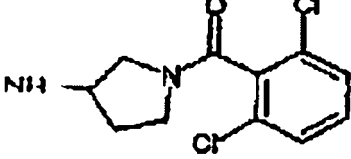
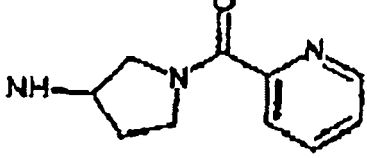
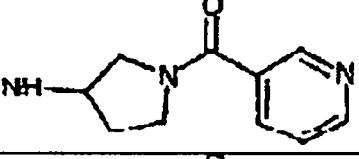
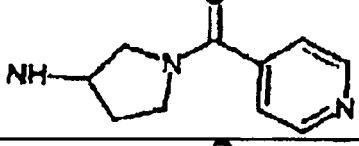
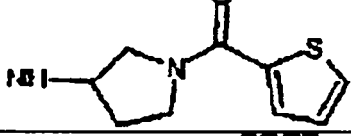


ES 2 287 321 T3

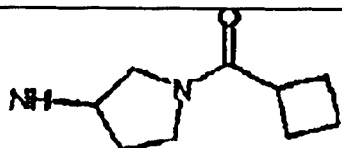
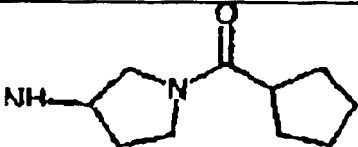
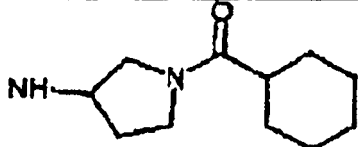
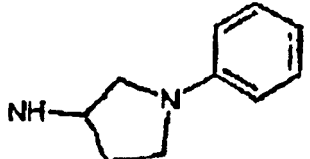
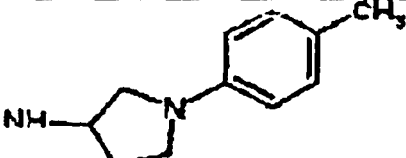
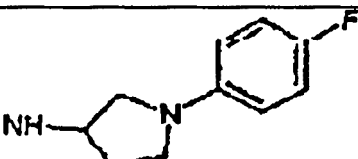
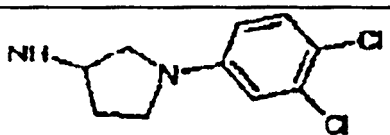
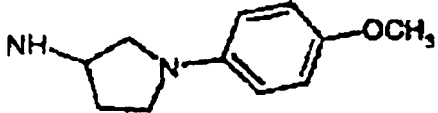

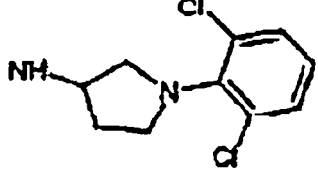
17		78 - 80
18		153 - 154
19		168 - 169
20		
21		151 - 153
22		112 - 118 mezcla isómera
23		aceite
24		118 - 121
25		aceite
26		cis-isómero: aceite trans-isómero: aceite
27		
28		

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

29		
30		cis-amino- metilo: aceite trans-amino- metilo: 105 - 108
31		
32		
33		
34		
35		150 - 152
36		
37		
38		mezcla isómera, aceite
39		mezcla isómera, aceite
40		

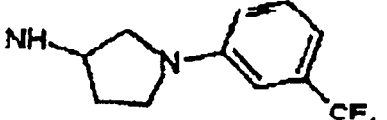

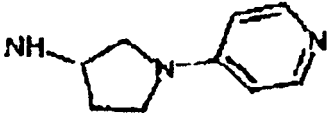

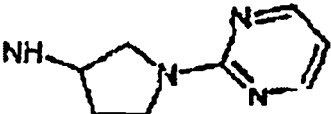
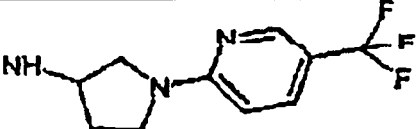
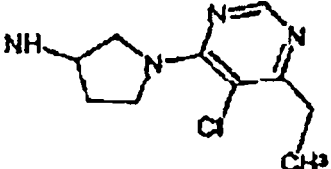


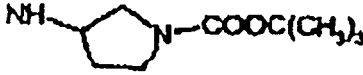
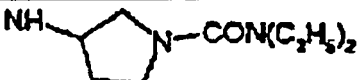
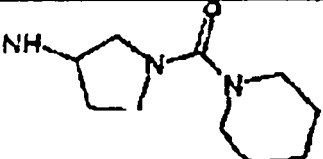
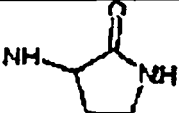
41		
42		
43		
44		
45		
46		
47		
48		
49		
50		
51		
52		
53		

54		
55		
56		
57		
58		
59		
60		
61		
62		
63		

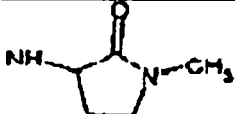
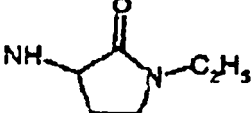
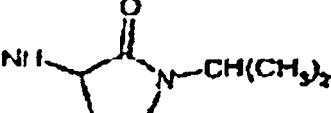
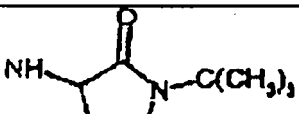
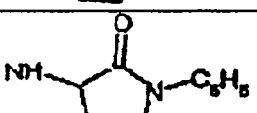






5 64		
10 65		
15 66		
20 67		
25 68		
30 69		
35 70		
40 71		
45 72		
50 73		

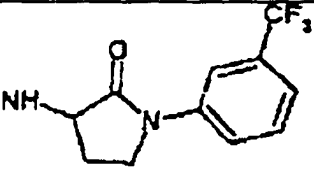
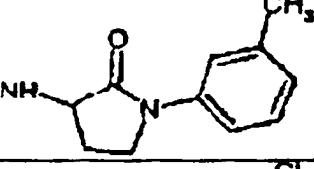
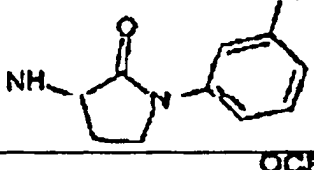
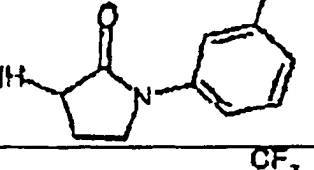
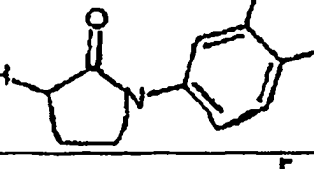
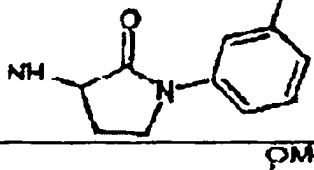
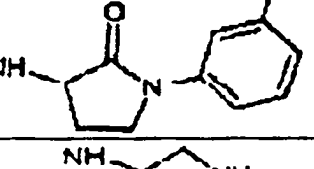
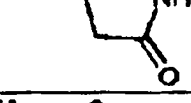
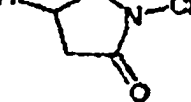

60

65

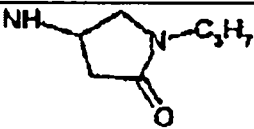
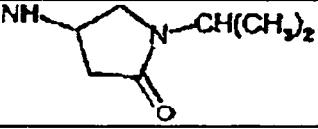
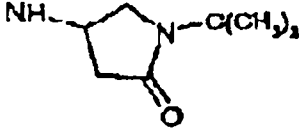

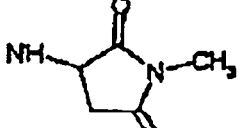
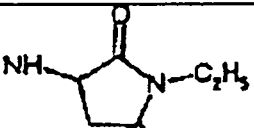
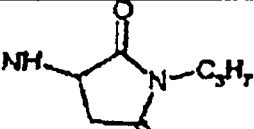
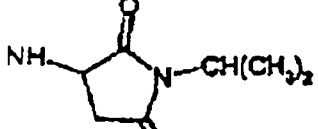
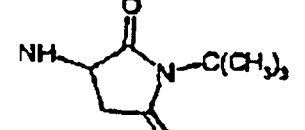
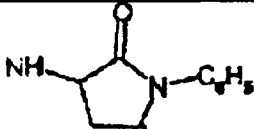
74		
75		
76		
77		
78		
79		
80		
81		
82		
83		107 - 108
84		
85		
86		


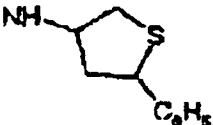
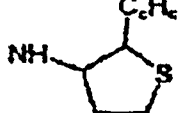
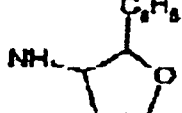
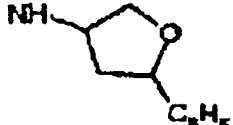
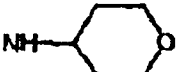
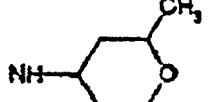
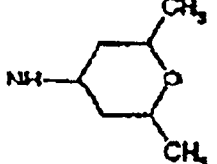
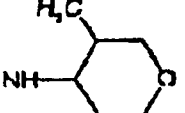
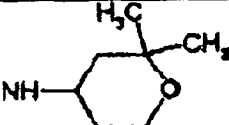
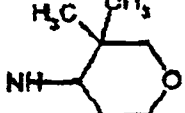

ES 2 287 321 T3

87		
88		
89		
90		
91		170 - 171
92		
93		
94		
95		
96		
97		

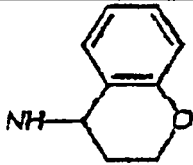
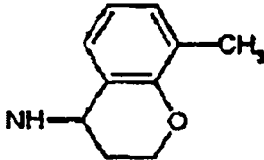
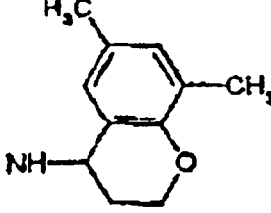
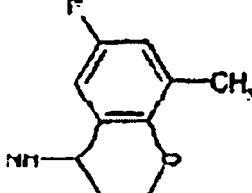
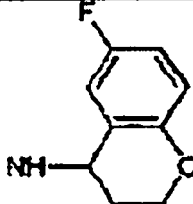
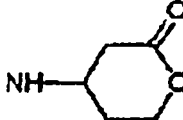
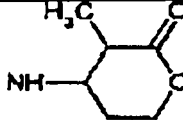
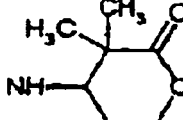
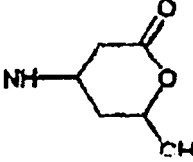
5 98	 <chem>O=C1CCNC1c2ccc(C(F)(F)F)cc2</chem>	197 - 197
10 99	 <chem>O=C1CCNC1c2ccc(C)cc2</chem>	130-132
15 100	 <chem>O=C1CCNC1c2ccc(Cl)cc2</chem>	195 - 198
20 101	 <chem>O=C1CCNC1c2ccc(OC(F)(F)F)cc2</chem>	180 - 181
25 102	 <chem>O=C1CCNC1c2cc(F)c(C(F)(F)F)cc2</chem>	161 - 163
30 103	 <chem>O=C1CCNC1c2ccc(F)cc2</chem>	168 - 171
35 104	 <chem>O=C1CCNC1c2ccc(OC)cc2</chem>	164 - 167
40 105	 <chem>O=C1NCNC1</chem>	
45 107	 <chem>CN1CNC(=O)N1</chem>	
50 108	 <chem>CCN1CNC(=O)N1</chem>	

ES 2 287 321 T3

109		
110		
111		
112		
113		
114		
115		
116		
117		
118		

119	 <chem>CN(C)C1CCN(C)C1</chem>	aceite
120	 <chem>CC1SCCN1</chem>	
121	 <chem>CC1SCCN1</chem>	
122	 <chem>CC1OCCN1</chem>	
123	 <chem>CC1OCCN1</chem>	
124	 <chem>C1OCCNCC1</chem>	149 - 150
125	 <chem>CC1OCCN(C)CC1</chem>	
126	 <chem>CC1OCCN(C)C(C)CC1</chem>	
127	 <chem>CC1OCCNCC1</chem>	
128	 <chem>CC1(C)OCCNCC1</chem>	138
129	 <chem>CC1(C)OCCNCC1</chem>	
130	 <chem>CC1OCCNCC1</chem>	

ES 2 287 321 T3

131		197 - 199
132		216 - 217
133		
134		217 - 219
135		200 - 202
136		
137		
138		
139		

5

10

15

20

25

30

35

40

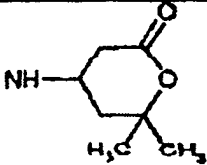
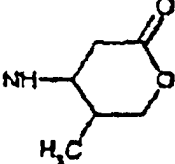
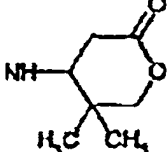
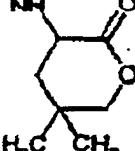
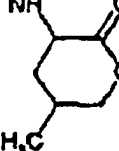
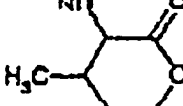
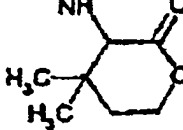
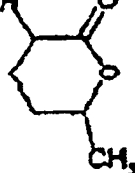
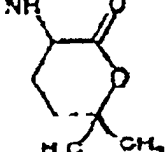
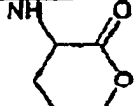
45

50

55

60

65

140		
141		
142		
143		
144		
145		
146		
147		
148		
149		

5

10

15

20

25

30

35

40

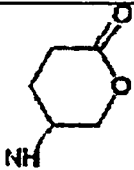
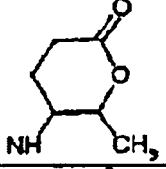
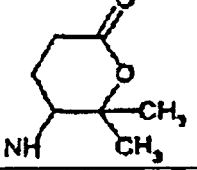
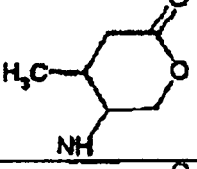
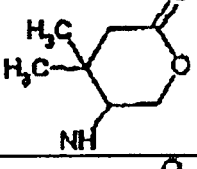
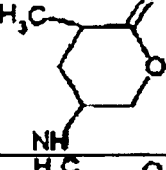
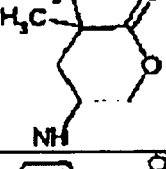
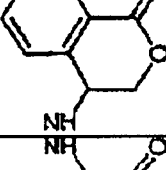
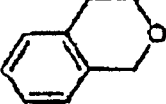
45

50

55

60

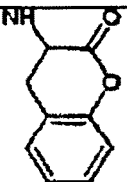
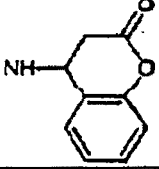
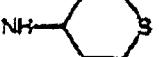



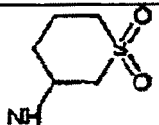
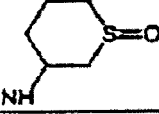
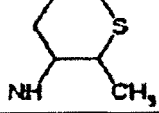
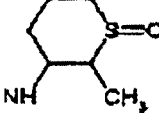
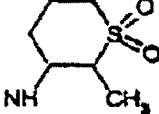
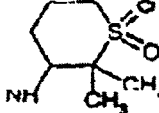
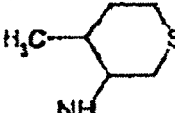
65

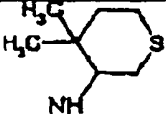
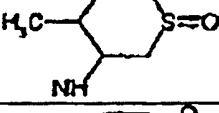
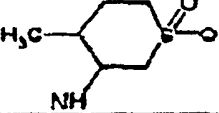
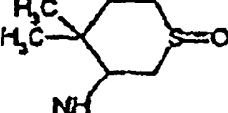
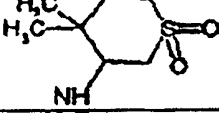
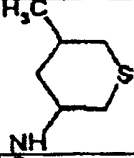
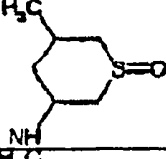
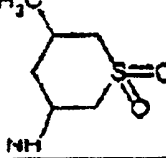
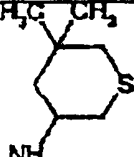
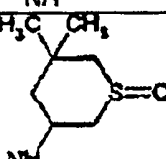
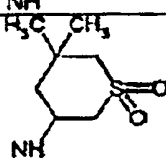
5	150		
10	151		
15	152		
20	153		
25	154		
30	155		
35	156		
40	157		
45	158		

60

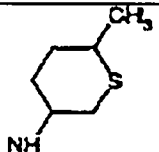
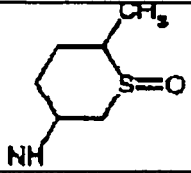
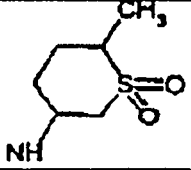
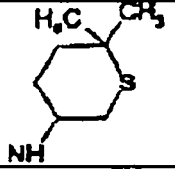
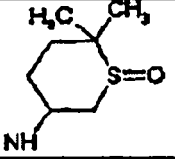
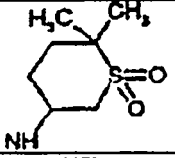
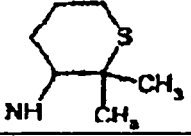
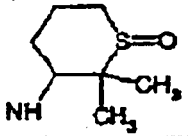
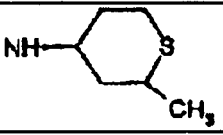
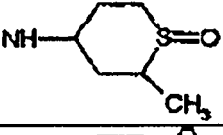
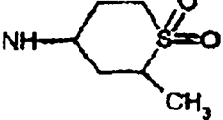
65

ES 2 287 321 T3

5	159		
10	160		
15	161		161 - 162
20	162		168 - 170
25	163		243
30	164		248
35	165		208 - 209
40	166		aceite
45	167		
50	168		
55	169		
60	170		
65	171		

5	172		
10	173		
15	174		
20	175		
25	176		
30	177		
35	178		
40	179		
45	180		
50	181		
55	182		
60			

65

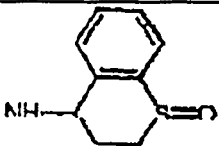
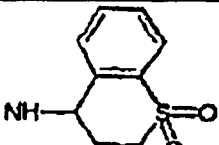
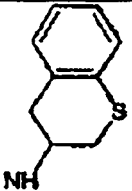
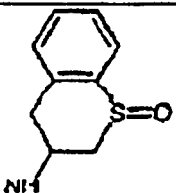
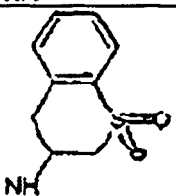
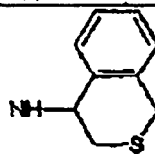
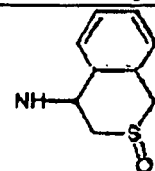
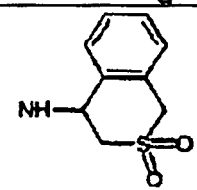


5 183		
10 184		
15 185		
20 186		
25 187		
30 188		
35 189		
40 190		
45 191		
50 192		
55 193		

65



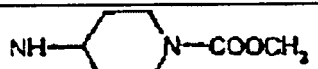






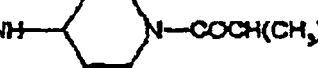

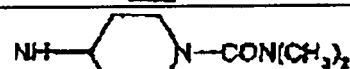
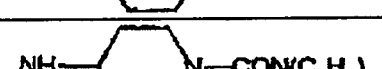




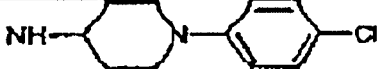
5	194		
10	195		
15	196		
20	197		
25	198		
30	199		
35	200		
40	201		
45	202		
50	203		
55	204		

60

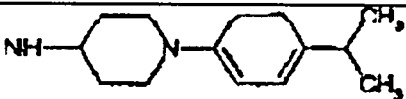
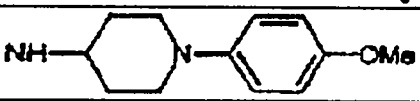
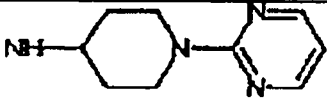
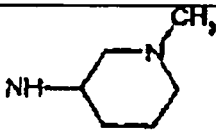
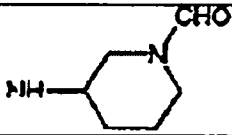
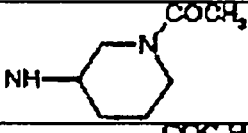
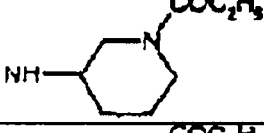
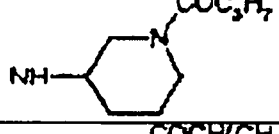
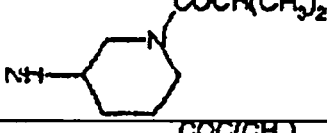
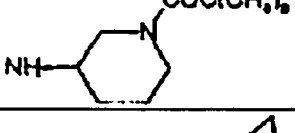
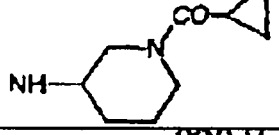
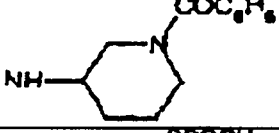
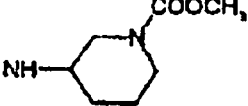
65

205		
206		
207		
208		
209		
210		
211		
212		
213		
214		




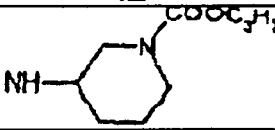

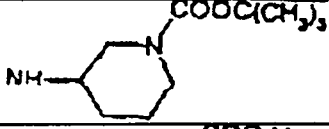

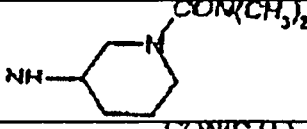

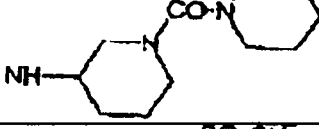
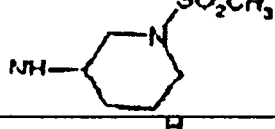

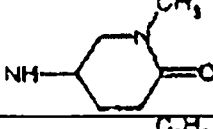
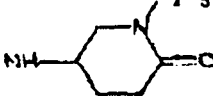
ES 2 287 321 T3

215		207 - 209
216		145 - 146
217		
218		
219		
220		93 - 96
221		
222		
223		
224		
225		
226		
227		
228		
229		
230		
231		193
232		

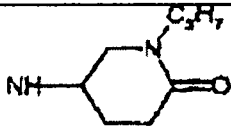
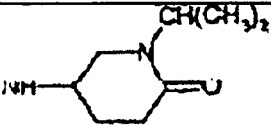
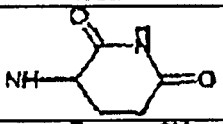
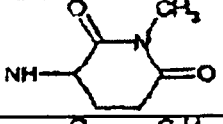
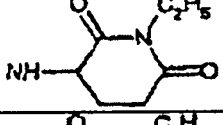
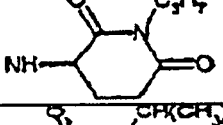
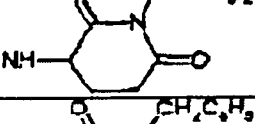
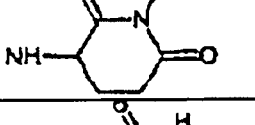
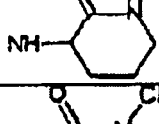
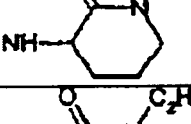
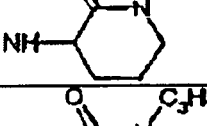
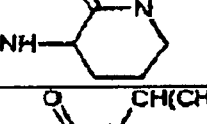

ES 2 287 321 T3

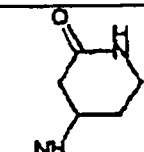
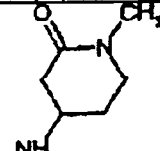
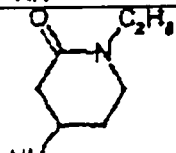
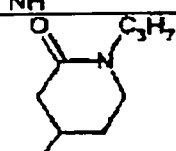
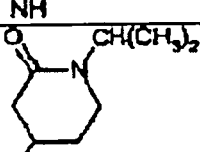
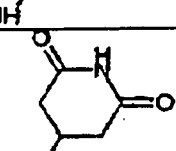
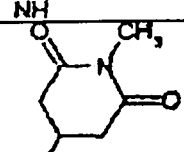
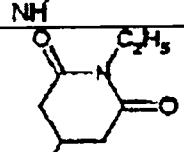
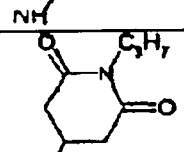
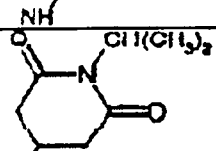
233		152 - 153
234		178
235		
236		
237		
238		172 - 174
239		
240		
241		
242		
243		
244		
245		

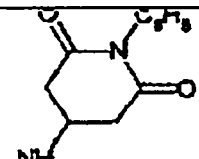
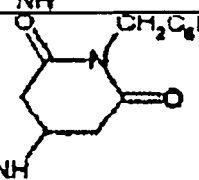
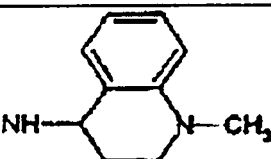
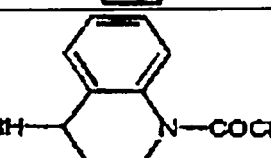


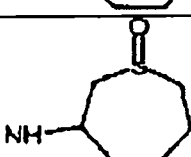
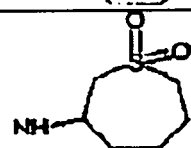




ES 2 287 321 T3

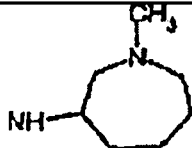
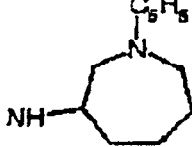
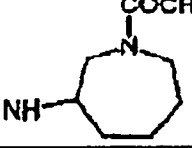
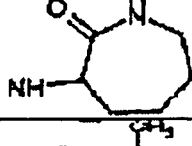
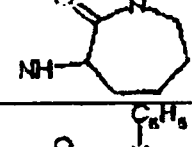
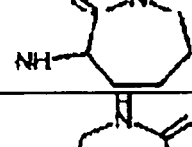
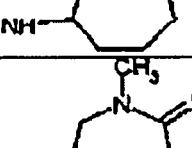

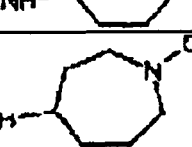
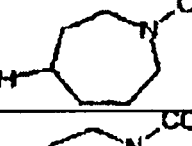
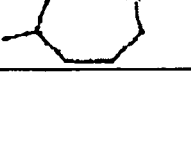

246		
247		
248		
249		
250		
251		153 - 156
252		
253		
254		
255		
256		
257		
258		
259		

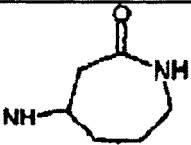
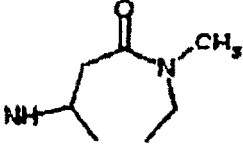
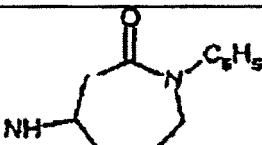
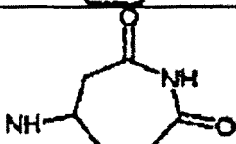
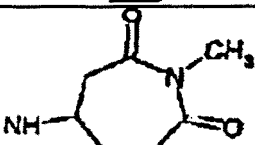
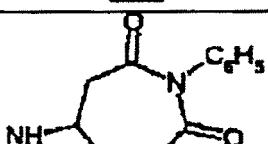
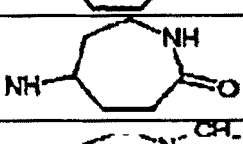
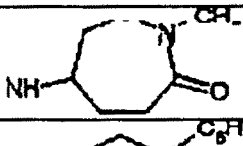
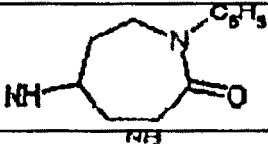
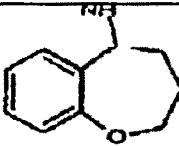
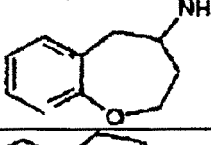
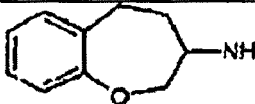
5
10
15
20
25
30
35
40
45
50
55
60
65

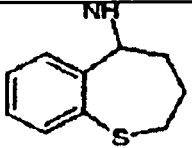
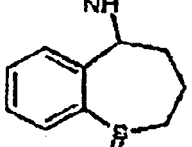
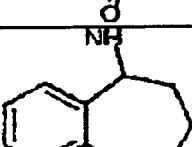
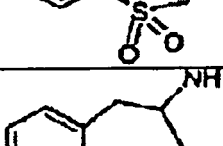
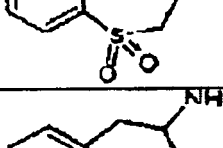
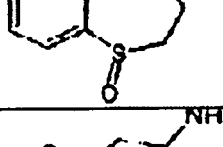
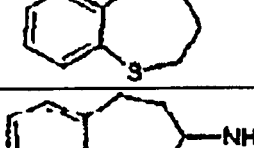
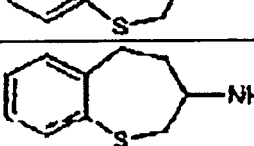
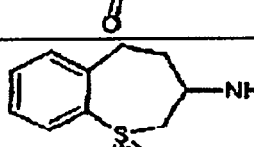
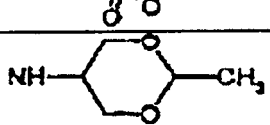

5 260		
10 261		
15 262		
20 263		
25 264		
30 265		
35 266		
40 267		
45 268		
50 269		
55 270		
60 271		
65 272		

5	273		
10	274		
15	275		
20	276		
25	277		
30	278		
35	279		
40	280		
45	281		
50	282		
55			
60			


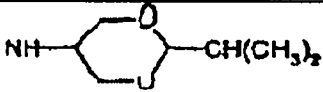
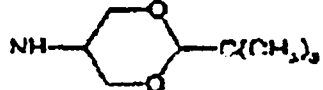



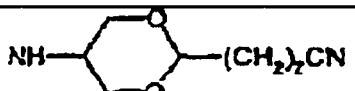
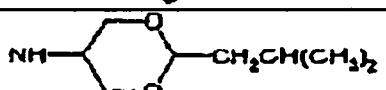

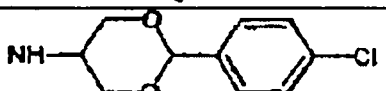
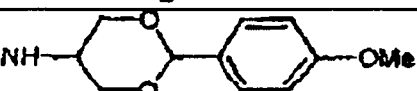



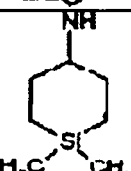
5 283		
10 284		
15 285		
20 286		
25 287		
30 288		
35 289		
40 290		
45 291		
50 292		
55 293		
60 294		

5	295		
10	296		
15	297		
20	298		
25	299		
30	300		
35	301		
40	302		
45	303		
50	304		
55	305		
60	306		

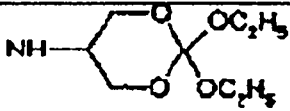


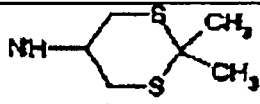
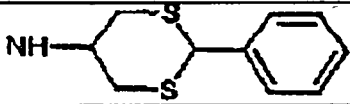
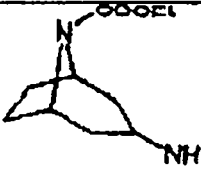
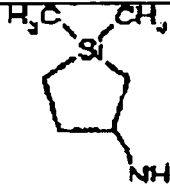
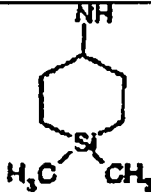
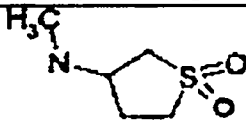

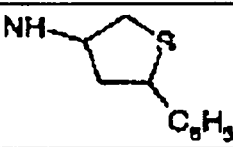
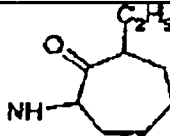
5 307		
10 308		
15 309		
20 310		
25 311		
30 312		
35 313		
40 314		
45 315		
50 316		
55 317		
60 318		

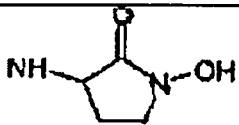
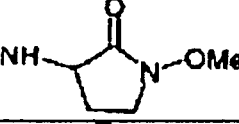
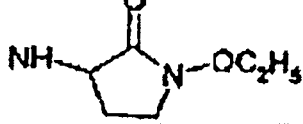
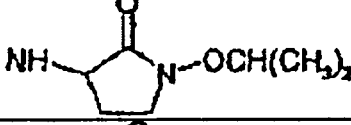
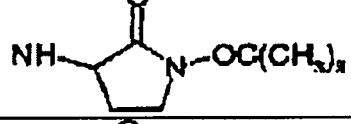
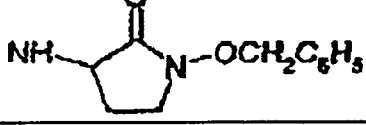
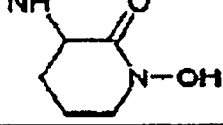
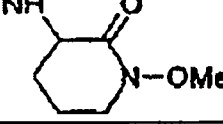
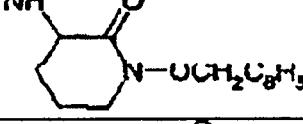
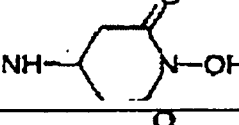
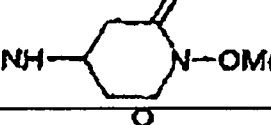
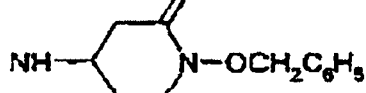
319		
320		
321		
322		
323		
324		
325		
326		
327		
328		191 - 192
329		

ES 2 287 321 T3

5	330		
10	331		aceite
15	332		
20	333		155 - 156
25	334		133 - 134
30	335		aceite
35	336		aceite
40	337		95 - 96
45	338		164 - 165
50	339		
55	340		
60	341		
65	342		
	343		104
	344		aceite

ES 2 287 321 T3

345		122 - 123
346		
347		
348		
349		
350		
351		
352		
353		38 - 41
354		149 - 152
355		152 - 154
356		38 - 41

357		
358		
359		
360		
361		
362		
363		
364		
365		
366		
367		
368		

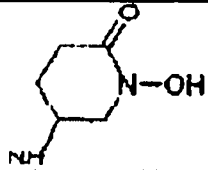
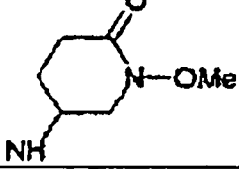
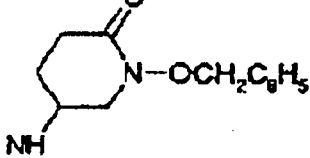
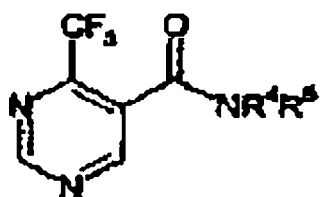

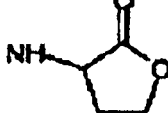
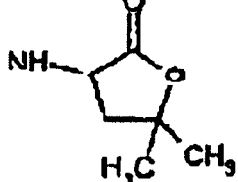
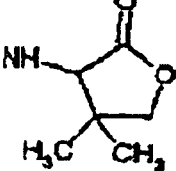








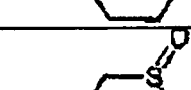


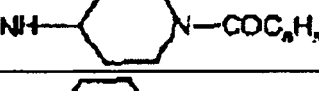
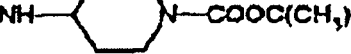
369		
370		
371		

TABLA 2



Número de Ejemplo	NR ⁴ R ⁵	Punto de Fusión [°C]
372		
373		
374		
375		

376		
377		
378		
379		
380		
381		
382		
383		
384		
385		
386		
387		
388		

50 B. Ejemplos de formulación

- a) Un agente para espolvorización se obtiene con 10 partes en peso de ingrediente activo y 90 partes en peso de talco como material inerte que se mezclan y se trituran en un molino batidor.
- 55 b) Un polvo humectante que se dispersa fácilmente en agua se obtiene mediante la mezcla de 25 partes en peso de ingrediente activo, 65 partes en peso de cuarzo que contiene caolín como material inerte, 10 partes en peso de ácido lignosulfónico potásico y 1 parte en peso de ácido oleoilmetiltaurínico sódico como humectante y dispersante, y se molutra en un molino de discos fijos.
- 60 c) Un concentrado de una dispersión fácilmente dispersada en agua se prepara mediante la mezcla de 40 partes en peso de ingrediente activo con 7 partes en peso de un medio éster del ácido sulfosuccínico, 2 partes en peso de una sal sódica del ácido lignosulfónico y 51 partes en peso de agua, y se molutra en un molino de bolas de desgaste hasta un tamaño de grano inferior a 5 micrones.
- 65 d) Un concentrado emulsionante se puede preparar a partir de 15 partes en peso de ingrediente activo, 75 partes en peso de ciclohexanona como disolvente y 10 partes en peso de nonilfenol etoxilado (10 EO) como emulsionante.

ES 2 287 321 T3

e) Los gránulos se pueden producir a partir de 2 a 15 partes de ingrediente activo y un gránulo inerte que soporte el material tal como gránulos de atapulgita, gránulos de piedra pómez y/o arena de cuarzo. Se utiliza convenientemente una suspensión del polvo humectante del Ejemplo b) con un contenido sólido del 30%, y esto se pulveriza en la superficie de los gránulos de atapulgita, secados y mezclados de forma homogénea. La proporción en peso del polvo humectante es de aproximadamente el 5% y la del material de soporte inerte de aproximadamente el 95% de los gránulos acabados.

C. Ejemplos biológicos

En los siguientes Ejemplos 1 a 3 se consideran los compuestos como activos si, a una concentración de 500 ppm (en relación con el nivel de ingrediente activo) o menos, tienen un efecto en los organismos de las plagas del 50% o más.

Ejemplo 1

Las semillas de haba germinada (*Vicia faba*) con radicales se transfirieron a botellas de vidrio marrón llenadas con agua del grifo y cubiertas posteriormente con aproximadamente 100 pulgones negros de las judías (*Aphis fabae*). Las plantas y los pulgones se lavaron entonces durante 5 segundos en una solución acuosa del compuesto para ser analizados y formulados. Después del escurrido, se almacenaron las plantas y los animales en una cámara climática (16 horas de luz al día, a 25°C y 40 - 60% de humedad relativa). Después de 3 y 6 días de almacenamiento, se determinó la mortalidad de los compuestos en los pulgones. Fueron activos según los siguientes ejemplos los compuestos: 3, 8, 9, 11, 17, 18, 19, 21, 22 (cis), 22 (trans), 24, 30 (cis), 30 (trans), 31 (cis), 124, 134, 135, 161, 163, 164, 166, 203, 216, 219, 353 y 356.

Ejemplo 2

Las semillas de haba germinada (*Vicia faba*) con radicales se transfirieron a botellas de vidrio marrón llenadas con agua del grifo. Cuatro mililitros de una solución acuosa del compuesto para ser analizado y formulado se pipetearon en las botellas de vidrio marrón. El haba se cubrió entonces copiosamente con aproximadamente 100 pulgones negros de las judías (*Aphis fabae*). Las plantas y los pulgones se almacenaron entonces en una cámara climática (16 horas de luz al día, a 25°C y 40 - 60% de humedad relativa). Después de 3 y 6 días de almacenamiento, el efecto en las raíces del compuesto se determinó como la mortalidad de los pulgones. Fueron activos según los siguientes ejemplos los compuestos: 3, 8, 9, 10, 11, 12, 17, 18, 19, 21, 22 (cis), 22 (trans), 24, 30 (cis), 30 (trans), 31 (cis), 35, 124, 128, 134, 135, 161, 162, 163, 164, 165, 166, 203, 216, 219, 237, 250, 353 y 356.

Ejemplo 3

Las alubias de matorral (*Phaseolus vulgaris*), cada una con dos hojas bien desarrolladas se pulverizan con una solución acuosa del compuesto para ser analizado y formulado hasta dejarlas chorreando. Después de secarlas, una planta de judías tratada, una planta de judías sin tratar y una planta de judías infestada copiosamente de la mosca blanca (*Trialeurodes vaporariorum*) se colocaron respectivamente juntas. Se colocaron las plantas en un invernadero a 25°C y 60% de humedad relativa. Después de 48 horas se determinó el número de huevos desovados en la planta de judías tratada y en la de sin tratar. El grado del efecto repelente se midió mediante una comparación relativa del número de huevos de la planta sin tratar (que se corresponde con el 100% en cada caso) con el número de huevos en la planta tratada. Fue activo en esta prueba de repelencia según el ejemplo siguiente el compuesto: 19.

Ejemplo 4

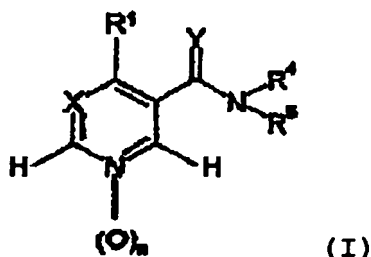
Las plantas de soja, cada una con tres hojas bien desarrolladas se pulverizan con una solución acuosa del compuesto para ser analizado y formulado hasta dejarlas chorreando. Después de secarlas, se colocaron juntas una planta tratada, una planta sin tratar y una planta infestada de trips de la especie *Frankliniella occidentalis*, respectivamente. Se almacenaron las plantas en una cámara climática (a 23°C y a 50 - 60% de humedad relativa). Después de 14 días se determinó el daño en las hojas de las plantas tratada y no tratada. El grado del efecto repelente se midió mediante una comparación relativa del daño en las hojas de la planta sin tratar (que se corresponde con el 100% en cada caso) con el de la planta tratada. Fue activo en esta prueba de repelencia según el ejemplo siguiente el compuesto: 19.

60

65

REIVINDICACIONES

1. Amidas de la Fórmula (I) y de sus sales,



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

X es CH o N;

Y es O o S;

n es 0 ó 1;

R¹ es haloalquilo (C₁ a C₄);

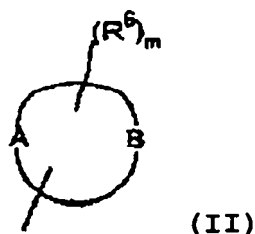
R² es hidrógeno, alquilo (C₁ a C₁₀), cicloalquilo (C₃ a C₁₀), alquenilo (C₃ a C₁₀) o alquinilo (C₃ a C₁₀), en el que los llamados grupos alquilo, cicloalquilo, alquenilo o alquinilo hasta tres átomos de hidrógeno se pueden reemplazar por un halógeno, en el caso del flúor también hasta el número máximo;

R³ es un heterociclo no aromático que contiene al menos un átomo de oxígeno, azufre, nitrógeno y/o silicio en el anillo que se sustituye opcionalmente con un grupo con una valencia de hasta seis, y que opcionalmente puede ser parte de sistema anular espirocíclico, condensado o bicíclico.

2. Amidas de la Fórmula (I) y de sus sales según la Reivindicación 1, **caracterizadas** por el hecho de que R³ es un heterociclo no aromático de cuatro a ocho miembros que tiene un átomo de oxígeno en el anillo, un átomo de azufre en el anillo, un átomo de nitrógeno en el anillo, un átomo de silicio en el anillo, dos átomos de oxígeno en el anillo o dos átomos de azufre en el anillo, en el que los átomos de azufre en el anillo están presentes en la forma

-S(O)_p- y p indica 0, 1 ó 2.

3. Amidas de la Fórmula (I) y de sus sales según la Reivindicación 1 ó 2, en las que R³ es un heterociclo no aromático de cuatro a ocho miembros de la Fórmula (II),



en el que A y/o B indica al menos un átomo de oxígeno, azufre, nitrógeno o silicio en el anillo, y el anillo puede contener además uno o dos grupos carbonilo que junto con las unidades hetero pueden formar opcionalmente una unidad lactona, lactama o imida; y, si A indica oxígeno y B indica nitrógeno, estas unidades pueden estar directamente adyacentes y en todos los otros casos, en que A y B indican unidades de heteroátomos, deben estar separados por al menos una unidad de carbono saturado;

m indica 0 o de 1 a 6,

R⁴ dependiendo de si m es idéntico o diferente en cada caso indica alquilo (C₁ a C₁₀), alquenilo (C₂ a C₁₀), alquinilo (C₂ a C₁₀), cicloalquilo (C₃ a C₁₀), cicloalquenilo (C₄ a C₁₀) o cicloalquinilo (C₈ a C₁₀), que se sustituyen opcionalmente con uno o más radicales idénticos o diferentes, o representa un radical R⁴, en el que

R⁵ indica halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, tio, amino, alcanofilo (C₁ a C₁₀), alquenoilo (C₃ a C₁₀), alquinoilo (C₃ a C₁₀), cicloalcanoilo (C₃ a C₁₀), alcoxi (C₁ a C₁₀), alquenoiloxi (C₃ a C₁₀), alquinoiloxi (C₃ a C₁₀), cicloalcoxi (C₃ a C₁₀), cicloalquenoiloxi (C₄ a C₁₀), cicloalquilo (C₃ a C₈) - alcoxi (C₁ a C₄), cicloalquenoilo (C₄ a C₈) - alcoxi

ES 2 287 321 T3

(C₁ a C₄), cicloalquilo (C₃ a C₈) - alqueniloxi (C₃ a C₄), cicloalquenilo (C₄ a C₈) - alqueniloxi (C₃ a C₄), alquilo (C₁ a C₄) - cicloalcoxi (C₃ a C₈), alquenilo (C₂ a C₄) - cicloalcoxi (C₃ a C₈), alquinilo (C₂ a C₄) - cicloalcoxi (C₃ a C₈), alquilo (C₁ a C₄) - cicloalqueniloxi (C₄ a C₈), alquenilo (C₂ a C₄) - cicloalqueniloxi (C₄ a C₈), alcoxi (C₁ a C₄) - alcoxi (C₁ a C₄), alcoxi (C₁ a C₄) - alqueniloxi (C₃ a C₄), carbamoilo, mono o dialquilcarbamoilo (C₁ a C₈), mono o dicicloalquilcarbamoilo (C₃ a C₈), alcocicarbonilo (C₁ a C₈), cicloalcoxicarbonilo (C₃ a C₈), alcanoiloxi (C₁ a C₈), cicloalcanoiloxi (C₃ a C₈), alcanoilamino (C₁ a C₈), alquenoilamino (C₃ a C₈), cicloalcanoilamino (C₃ a C₈), cicloalquilo (C₃ a C₈) - alcanoilamino (C₁ a C₄), los análogos al N-alquilamino (C₁ a C₄) de los cuatro últimos radicales nombrados, alquiltio (C₁ a C₁₀), alqueniltio (C₃ a C₁₀), alquiniltio (C₃ a C₁₀), cicloalquiltio (C₃ a C₈), cicloalqueniltio (C₄ a C₈), cicloalquilo (C₃ a C₈) - alquiltio (C₁ a C₄), cicloalquenilo (C₄ a C₈) - alquiltio (C₁ a C₄), cicloalquilo (C₃ a C₈) - alqueniltio (C₃ a C₄), cicloalquenilo (C₄ a C₈) - alqueniltio (C₃ a C₄), alquilo (C₁ a C₄) - cicloalquiltio (C₃ a C₈), alquenilo (C₂ a C₄) - cicloalquiltio (C₃ a C₈), alquinilo (C₂ a C₄) - cicloalquiltio (C₃ a C₈), alquilo (C₁ a C₄) - cicloalqueniltio (C₄ a C₈), alquenilo (C₂ a C₆) - cicloalqueniltio (C₄ a C₈), alquilsulfínilo (C₁ a C₁₀), alquenilsulfínilo (C₃ a C₄), alquinilsulfínilo (C₃ a C₄), cicloalquilsulfínilo (C₃ a C₁₀), cicloalquilsulfínilo (C₄ a C₁₀), cicloalquilo (C₃ a C₈) - alquilsulfínilo (C₁ a C₄), cicloalquenilo (C₄ a C₈) - alquilsulfínilo (C₁ a C₄), cicloalquilo (C₃ a C₈) - alquenilsulfínilo (C₃ a C₄), cicloalquenilo (C₄ a C₈) - alquenilsulfínilo (C₃ a C₄), alquilo (C₁ a C₄) - cicloalquilsulfínilo (C₃ a C₈), alquenilo (C₂ a C₄) - cicloalquilsulfínilo (C₃ a C₈), alquinilo (C₂ a C₄) - cicloalquilsulfínilo (C₃ a C₈), alquilo (C₁ a C₄) - cicloalquilsulfínilo (C₄ a C₈), alquenilo (C₂ a C₃) - cicloalquilsulfínilo (C₄ a C₈), alquilsulfonilo (C₁ a C₁₀), alquenilsulfonilo (C₃ a C₄), alquinilsulfonilo (C₃ a C₁₀), cicloalquilsulfonilo (C₃ a C₁₀), cicloalquilsulfonilo (C₄ a C₁₀), cicloalquilo (C₃ a C₈) - alquilsulfonilo (C₁ a C₄), cicloalquenilo (C₄ a C₈) - alquilsulfonilo (C₁ a C₄) - alquenilsulfonilo (C₃ a C₄), cicloalquilsulfonilo (C₃ a C₄), alquilo (C₁ a C₄) - cicloalquilsulfonilo (C₃ a C₈), alquenilo (C₂ a C₄) - cicloalquilsulfonilo (C₃ a C₈), alquinilo (C₂ a C₄) - cicloalquilsulfonilo (C₃ a C₈), alquilo (C₁ a C₄) - cicloalquilsulfonilo (C₄ a C₈), alquenilo (C₃ a C₄) - cicloalquilsulfonilo (C₄ a C₈), alquilamino (C₁ a C₁₀), alquenilamino (C₃ a C₁₀), alquinilamino (C₃ a C₁₀), cicloalquilamino (C₃ a C₈), cicloalquenilamino (C₄ a C₈), cicloalquilo (C₃ a C₈) - alquilamino (C₁ a C₄), cicloalquenilo (C₄ a C₈) - alquilamino (C₁ a C₄), cicloalquilo (C₃ a C₈) - alquenilamino (C₃ a C₄), cicloalquenilo (C₄ a C₈) - alquenilamino (C₃ a C₄), alquilo (C₁ a C₄) - cicloalquilamino (C₃ a C₈), alquenilo (C₂ a C₄) - cicloalquilamino (C₃ a C₈), alquinilo (C₂ a C₄) - cicloalquilamino (C₃ a C₈), alquilo (C₁ a C₄) - cicloalquilsulfonilo (C₃ a C₈), alquenilo (C₂ a C₄) - cicloalquilsulfonilo (C₃ a C₈), alquinilo (C₂ a C₄) - cicloalquilsulfonilo (C₃ a C₈), los análogos al N-alquilamino (C₁ a C₄) de los catorce últimos radicales nombrados, triarilsililo (C₁ a C₁₀), arilo, aroilo, heterociclilcarbonilo, ariloxi, ariltio, arilamino, N-alquilarilamino (C₁ a C₄), los análogos al N-alquilamino (C₁ a C₄) de los dos últimos radicales nombrados, arilalcoxi (C₁ a C₄), arilalqueniloxi (C₃ a C₄), arilalquiltio (C₁ a C₄), arilalqueniltio (C₃ a C₄), arilalquilamino (C₁ a C₄), arilalquenilamino (C₃ a C₄), los análogos al N-alquilamino (C₁ a C₄) del último radical nombrado, arildialquilsililo (C₁ a C₈), diarilalquilsililo (C₁ a C₈), triarilsililo, heterociclilo, heterocicliloxi, heterocicliltio, o heterocicilamino, en el que la parte cíclica de los radicales nombrados como arilo o heterociclilo se sustituye opcionalmente por uno o más radicales del grupo halógeno, ciano, nitro, amino, hidroxilo, tio, alquilo (C₁ a C₄), haloalquilo (C₁ a C₄), cicloalquilo (C₃ a C₈), alcoxi (C₁ a C₄), haloalcoxi (C₁ a C₄), alquiltio (C₁ a C₄), haloalquiltio (C₁ a C₄), alquilamino (C₁ a C₄), dialquilamino (C₁ a C₄), trimetilsililo o alcanolilo (C₁ a C₄);

40 en el que opcionalmente dos radicales alquilo R⁶, si se enlazan al mismo átomo de carbono, pueden formar junto con este átomo de carbono un sistema anular espirocíclico, u

opcionalmente dos radicales alquilo R⁶, que se enlazan a diferentes átomos de carbono, pueden formar junto con el heterociclo alifático de la Fórmula (II) un sistema anular condensado o bicíclico o además el sistema anular heteroalifático de la Fórmula (II) y un sistema arilo o heteroarilo adicional juntos forman un sistema anular condensado;

y, si R⁶ indica alquilo (C₁ a C₁₀), alquenilo (C₂ a C₁₀), alquinilo (C₂ a C₁₀), cicloalquilo (C₃ a C₁₀), cicloalquenilo (C₄ a C₁₀) o cicloalquinilo (C₈ a C₁₀), los radicales nombrados se pueden sustituir opcionalmente una o más veces, preferiblemente por radicales R¹¹,

50 R¹¹ tiene los significados dados anteriormente para R⁷, y opcionalmente en todos los grupos nombrados como R⁶, R⁷ y R¹¹ el hidrógeno enlazado al carbono se puede reemplazar por hasta tres átomos de halógeno, en el caso de flúor también hasta el número máximo.

55 4. Amidas de la Fórmula (I) y sus sales según la Reivindicación 3, en las que A y/o B indican una unidad que contiene al menos un átomo en el anillo de -O-, -S(O)_{0,1,2}-, -NR⁸- o -SiR⁹R¹⁰-, en las que

R⁸ indica hidrógeno, alquilo (C₁ a C₁₀), alquenilo (C₃ a C₁₀), alquinilo (C₃ a C₁₀), cicloalquilo (C₃ a C₁₀), cicloalquenilo (C₄ a C₁₀), arilo, heterociclilo, alcanolilo (C₁ a C₁₀), alquenoilo (C₃ a C₁₀), alquinoilo (C₃ a C₁₀), cicloalcanolilo (C₄ a C₈), aroilo, heterociclilcarbonilo, carbamoilo, mono o dialquilcarbamoilo (C₁ a C₆), mono o dicicloalquilcarbamoilo (C₃ a C₁₀), alcocicarbonilo (C₁ a C₁₀), cicloalcoxicarbonilo (C₃ a C₁₀), alquilsulfonilo (C₁ a C₁₀), alquenilsulfonilo (C₃ a C₁₀), alquinilsulfonilo (C₁ a C₆), cicloalquilsulfonilo (C₃ a C₁₀), cicloalquenilsulfonilo (C₄ a C₁₀), cicloalquilo (C₃ a C₁₀) - alquilsulfonilo (C₁ a C₁₀), cicloalquenilo (C₄ a C₈) - alquilsulfonilo (C₁ a C₄), cicloalquilo (C₃ a C₈) - alquenilsulfonilo (C₃ a C₄), cicloalquenilo (C₄ a C₈) - alquenilsulfonilo (C₃ a C₄), alquilo (C₁ a C₄) - cicloalquilsulfonilo (C₃ a C₈), alquenilo (C₂ a C₄) - cicloalquilsulfonilo (C₃ a C₈), alquinilo (C₂ a C₄) - cicloalquilsulfonilo (C₃ a C₈), alquilo (C₁ a C₄) - cicloalquilsulfonilo (C₄ a C₈), alquenilo (C₂ a C₄) - cicloalquilsulfonilo (C₄ a C₈), alquinilo (C₂ a C₄) - cicloalquilsulfonilo (C₄ a C₈), hidroxilo, alcoxi (C₁ a C₁₀), alqueniloxi (C₃ a C₁₀), alquiniloxi (C₃ a

ES 2 287 321 T3

- 5 C_{10}), cicloalcoxi (C_3 a C_{10}), cicloalqueniloxi (C_4 a C_{10}), cicloalquilo (C_3 a C_8) - alcoxi (C_1 a C_4), cicloalquenilo (C_4 a C_8) - alcoxi (C_1 a C_4), cicloalquilo (C_3 a C_8) - alqueniloxi (C_3 a C_4), cicloalquenilo (C_4 a C_8) - alqueniloxi (C_3 a C_4), alquilo (C_1 a C_4) - cicloalcoxi (C_3 a C_8), alquenilo (C_2 a C_4) - cicloalcoxi (C_3 a C_8), alquinilo (C_2 a C_4) - cicloalcoxi (C_3 a C_8), alquilo (C_1 a C_4) - cicloalqueniloxi (C_4 a C_8), alquenilo (C_2 a C_4) - cicloalqueniloxi (C_4 a C_8), alcoxi (C_1 a C_4) - alcoxi (C_1 a C_4), alcoxi (C_1 a C_4) - alqueniloxi (C_3 a C_4), ariloxi, arilalcoxi (C_1 a C_{10}), arilalqueniloxi (C_3 a C_{10}) o arilalquiniloxi (C_3 a C_{10}), y los radicales nombrados anteriormente para R^5 se pueden opcionalmente sustituir por uno o más radicales del grupo ciano, nitro, amino, hidroxilo, tio, alquilo (C_1 a C_4), cicloalquilo (C_3 a C_{10}), alcoxi (C_1 a C_4), alquiltio (C_1 a C_4), alquilamino (C_1 a C_4) o alcanofilo (C_1 a C_4);
- 10 R^9 y R^{10} indican alquilo (C_1 a C_{10}), alquenilo (C_2 a C_{10}), alquinilo (C_2 a C_{10}), cicloalquilo (C_3 a C_{10}), cicloalquenilo (C_4 a C_{10}), cicloalquinilo (C_8 a C_{10}), arilo, arilalquilo (C_1 a C_4) o heterociclilo,

15 y opcionalmente en todos los grupos nombrados para R^8 , R^9 y R^{10} el hidrógeno enlazado con carbono se puede reemplazar por uno a tres átomos de halógeno, en el caso del flúor también hasta el número máximo.

5 5. Amidas de la Fórmula (I) y sus sales según la Reivindicación 3, en las que R^5 es un heterociclo no aromático de cinco a siete miembros con una o dos unidades de heteroátomos A y/o B, y también un grupo carbonilo en el anillo, que forma junto con la unidad hetero o las unidades hetero una unidad lactona o lactama.

20 6. Amidas de la Fórmula (I) y sus sales según la Reivindicación 3, en las que R^6 indica alquilo (C_1 a C_{10}), alquenilo (C_2 a C_{10}), alquinilo (C_2 a C_{10}), cicloalquilo (C_3 a C_{10}), cicloalquenilo (C_4 a C_{10}) o cicloalquinilo (C_8 a C_{10}) y los radicales nombrados se pueden sustituir opcionalmente una o más veces por radicales R^{11} , en los que R^{11} tiene los significados dados en la Reivindicación 3.

25 7. Amidas de la Fórmula (I) y de sus sales según la Reivindicación 3, en las que R^7 indica arilo, aroilo, heterociclil-carbonilo, ariloxi, ariltio, arilamino, N-alquilarilamino (C_1 a C_4), los análogos al N-alquilamino (C_1 a C_4) de los dos últimos radicales nombrados, arilalcoxi (C_1 a C_4), arilalqueniloxi (C_3 a C_4), arilalquiltio (C_1 a C_4), arilalqueniltio (C_3 a C_4), arilalquilamino (C_1 a C_4), arilalquenilamino (C_3 a C_4), los análogos al N-alquilamino (C_1 a C_4) del último radical nombrado, arildialquilsililo (C_1 a C_8), diarilalquilsililo (C_1 a C_8), triarilsililo, heterociclilo, heterocicliloxi, heterocicliltio y heterociclilamino y la parte cíclica de los radicales arilo o heterociclilo nombrados se substituye opcionalmente por uno o más radicales del grupo halógeno, ciano, nitro, amino, hidroxilo, tio, alquilo (C_1 a C_4), haloalquilo (C_1 a C_4), cicloalquilo (C_3 a C_8), alcoxi (C_1 a C_4), alquiltio (C_1 a C_4), alquilamino (C_1 a C_4) o alcanofilo (C_1 a C_4).

35 8. Amidas de la Fórmula (I) y sus sales según una o más de las Reivindicaciones 1 a 7, en las que X es -CH-, Y indica -O- y n es 0.

9. Amidas de la Fórmula (I) y sus sales según una o más de las Reivindicaciones 1 a 8, en las que R^1 es alquilo (C_1 a C_4) sustituido una o más veces por F y/o Cl.

40 10. Amidas de la Fórmula (I) y sus sales según la Reivindicación 9, en las que R^1 es CF_3 , CHF_2 o CF_2Cl .

11. Proceso para la preparación de amidas de la Fórmula (I) y sus sales según una o más de las Reivindicaciones 1 a 10, que comprende la conversión de un ácido carboxílico de la Fórmula (III),



(III)

60 en la que X, R^1 y n tienen los significados dados en la Reivindicación 1, en forma de un derivado activado de este ácido, en presencia de una base, con un compuesto de la Fórmula (IV), en la que R^4 y R^5 tienen los significados dados en la Reivindicación 1.



65 12. Agente con efecto insecticida, acaricida, ixodicida, nematocida, moluscicida o fungicida, **caracterizado** por un contenido de al menos un compuesto de Fórmula (I) o una de sus sales según una o más de las Reivindicaciones 1 a 10.

ES 2 287 321 T3

13. Agente según la Reivindicación 12 mezclado con sustancias portadoras y/o sustancias tensoactivas.

14. Utilización de los compuestos de la Fórmula (I) o sus sales según una o más de las Reivindicaciones 1 a 10 para controlar a organismos de plagas de insectos en grupo y arácnidos, excluyendo las utilizaciones para el tratamiento del cuerpo humano o animal.

15. Utilización según la Reivindicación 14 para controlar organismos de plagas en plantas cultivadas transgénicas.

16. Utilización de los compuestos de la Fórmula (I) o de sus sales según una o más de las Reivindicaciones 1 a 10, para defenderse de o para expulsar plagas y/o insectos nocivos.

17. Utilización de los compuestos de la Fórmula (I) o de sus sales según una o más de las Reivindicaciones 1 a 10, para la preparación de un producto medicinal humano y/o un producto medicinal animal.

18. Utilización de los compuestos de la Fórmula (I) o de sus sales según una o más de las Reivindicaciones 1 a 10, para la preparación de un producto medicinal para controlar los endoparásitos y los ectoparásitos.

19. Procedimiento para controlar insectos nocivos, arácnidos y/o nematodos nocivos, en el que una cantidad efectiva de un compuesto de la Fórmula (I) o de sus sales según una o más de las Reivindicaciones 1 a 10 se aplica a las plagas o al lugar del efecto deseado, excluyendo los métodos de tratamiento del cuerpo humano o animal.

20. Procedimiento para defenderse de o para expulsar organismos de plagas, en el que uno o más compuestos de la Fórmula (I) o sus sales según una o más de las Reivindicaciones 1 a 10 se utilizan en el lugar desde el que los organismos de las plagas se mantienen lejos o expulsados.