



19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

11 Número de publicación: **2 359 009**

51 Int. Cl.:

**C07D 409/04** (2006.01) **C07D 231/38** (2006.01)  
**C07D 411/04** (2006.01) **C07D 409/14** (2006.01)  
**A01N 43/56** (2006.01) **A61K 31/415** (2006.01)  
**A61K 31/4155** (2006.01) **A61K 31/4439** (2006.01)  
**A61P 33/00** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **05825929 .2**

96 Fecha de presentación : **03.12.2005**

97 Número de publicación de la solicitud: **1824845**

97 Fecha de publicación de la solicitud: **29.08.2007**

54

Título: **Arilpirazoles y su uso como plaguicidas.**

30

Prioridad: **18.12.2004 EP 04030064**

45

Fecha de publicación de la mención BOPI:  
**17.05.2011**

45

Fecha de la publicación del folleto de la patente:  
**17.05.2011**

73

Titular/es: **MERIAL Ltd.**  
**3239 Satellite Blvd**  
**Duluth, Georgia 30096-4640, US**

72

Inventor/es: **Chou, David, T.;**  
**Maier, Michael;**  
**Petry, Friederike y**  
**Knauf, Werner**

74

Agente: **Ponti Sales, Adelaida**

ES 2 359 009 T3

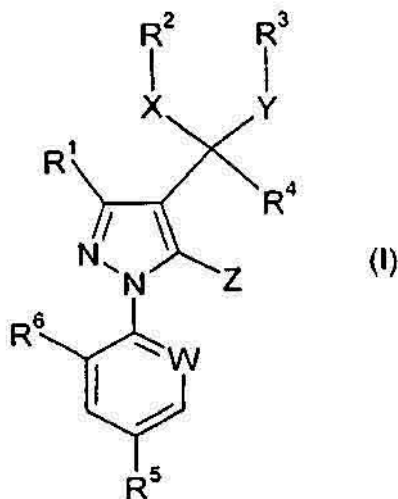
Aviso: En el plazo de nueve meses a contar desde la fecha de publicación en el Boletín europeo de patentes, de la mención de concesión de la patente europea, cualquier persona podrá oponerse ante la Oficina Europea de Patentes a la patente concedida. La oposición deberá formularse por escrito y estar 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

Arilpirazoles y su uso como plaguicidas

- 5 **[0001]** La invención se refiere a derivados novedosos de 1-aril-pirazol, a los procedimientos para su preparación, a sus composiciones, y a su uso para el control de plagas (que incluyen artrópodos y helmintos).
- [0002]** Se ha descrito el control de insectos, arácnidos y helmintos con compuestos de 1-arilpirazol en diversos documentos, por ejemplo, en los documentos WO-A-87/03781, EP-A-295,117, US-A-6.069.157 y US-A-10 4.695.308.
- [0003]** Además, el documento EPA-846.686 da a conocer derivados de 1-fenil-pirazol y su uso como agentes parasitocidas.
- 15 **[0004]** En el documento JP-A-08/311.036 se dan a conocer derivados de pirazol para el control de plagas de insectos que poseen en la posición 4 del anillo de pirazol un sustituyente de carbono que transporta heteroátomos.
- [0005]** El documento WO-A-01/64.651 da a conocer 4-tiometilpirazoles como plaguicidas.
- 20 **[0006]** El documento DE-A-34 23 101 da a conocer derivados de 5-amino-4-heterocicli-1-fenilpirazol que poseen actividad herbicida o reguladora del crecimiento de la planta.
- [0007]** El documento WO 98/40359 da a conocer 1-aril pirazoles que son útiles como plaguicidas, especialmente para controlar artrópodos.
- 25 **[0008]** El documento DE 19518054 da a conocer derivados de N-aril pirazol que muestran una buena eficacia frente a plagas de animales, particularmente insectos tetranychidae, ectoparásitos y helmintos.
- [0009]** Finalmente, el documento JP-A-11/171.702 da a conocer el control de plagas de angiospermas diferentes del arroz mediante tratamiento con un compuesto agroquímico seleccionado. Además de otros compuestos, se pueden usar derivados de pirazol.
- 30 **[0010]** Sin embargo, debido a que los modernos plaguicidas deben cumplir una amplia variedad de demandas, por ejemplo, con respecto al nivel, a la duración y al espectro de acción, el espectro de uso, la toxicidad, la combinación con otras sustancias activas, la combinación con auxiliares de la formulación o de la síntesis, y debido a que es posible la aparición de resistencias, el desarrollo de dichas sustancias nunca se puede considerar como concluido, y existe constantemente una elevada demanda de compuestos novedosos que sean ventajosos sobre los compuestos conocidos, al menos siempre que se contemplen ciertos aspectos.
- 35 **[0011]** Es un objeto de la presente invención proporcionar nuevos compuestos químicos que se puedan usar en la formulación de plaguicidas para el tratamiento de mamíferos y plantas, preferiblemente para el tratamiento de animales.
- [0012]** Es otro objeto de la presente invención proporcionar nuevas formulaciones plaguicidas que se puedan aplicar a animales ventajosamente en forma oral con el fin de evitar la posible contaminación de seres humanos o del entorno que los rodea.
- 45 **[0013]** Otro objeto de la invención es proporcionar nuevos plaguicidas que se puedan usar que dosis menores que los plaguicidas existentes.
- 50 **[0014]** Otro objeto de la invención es proporcionar nuevos plaguicidas que sean sustancialmente no eméticos.
- [0015]** Otro objeto de la invención es proporcionar nuevos plaguicidas que sean más seguros para el usuario y el medio ambiente
- 55 **[0016]** Otro objeto más de la invención es proporcionar nuevos plaguicidas que proporcionen un eficaz control de las plagas durante un periodo alargado con una única aplicación oral.
- [0017]** Estos objetos se cumplen en todo o en parte por la presente invención

[0018] La presente invención proporciona un compuesto de fórmula I o una de sus sales plaguicidamente aceptables, en la que



5  $W$   
 $R^7$   
 $R^8$  y  $R^9$   
 es =N-, =CH-, =CR<sup>7</sup>- o =C(NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>)-,  
 es halógeno, alquilo o haloalquilo,  
 son independientemente entre sí hidrógeno, alquilo, alqueno, alquino, cicloalquilo,  
 arilo, heterociclilo, aralquilo, o heterocicloalquilo, o uno de R<sup>8</sup> o R<sup>9</sup> son -CO-R<sup>8a</sup>, -CO-O-  
 R<sup>93</sup>, -SO-R<sup>8a</sup> o -SO<sub>2</sub>R<sup>83</sup>, o R<sup>8</sup> y R<sup>9</sup> conjuntamente con el átomo N unido forman un anillo  
 heterocíclico de cinco a ocho miembros que contiene opcionalmente un átomo de  
 10 oxígeno, azufre o nitrógeno adicional en el anillo o R<sup>8</sup> y R<sup>9</sup> conjuntamente con el átomo N  
 unido forman un grupo imina -N=CR<sup>8b</sup>R<sup>9b</sup> o un grupo iminoéter -N=CR<sup>8b</sup>(OR<sup>9b</sup>),  
 $R^{8a}$  y  $R^{9a}$   
 $R^{8b}$   
 $R^{9b}$   
 son alquilo, cicloalquilo, arilo, heterociclilo, aralquilo o heterocicloalquilo,  
 es hidrógeno, alquilo, cicloalquilo, arilo, heterociclilo, aralquilo o heterociclilalquilo  
 15 es alquilo, cicloalquilo, arilo, heterociclilo, aralquilo o heterociclilalquilo,  
 donde los grupos R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup>, R<sup>8a</sup>, R<sup>9a</sup>, R<sup>8b</sup>, R<sup>9b</sup> y el anillo heterocíclico que forma los grupos  
 R<sup>8</sup> y R<sup>9</sup> independientemente entre sí están opcionalmente sustituidos por uno o más  
 grupos halógeno, hidroxilo, oxo, ciano, nitro, alquilo, haloalquilo, alcoxilo, haloalcoxilo,  
 alquiltio, cicloalquilo, arilo, heterociclilo, aralquilo o heterociclilalquilo o por amino, que  
 está opcionalmente sustituido por grupos alquilo, alqueno, alquino, arilo o heteroarilo;  
 20  $R^1$   
 $R^{10}$   
 es ciano, halógeno, haloalquilo, -CS-NH<sub>2</sub> o C(=NR<sup>10</sup>)S(O)<sub>n</sub>R<sup>11</sup>,  
 es hidrógeno, alquilo, alqueno, alquino, cicloalquilo, arilo, heterociclilo, aralquilo,  
 heterociclilalquilo, -CO-O-R<sup>12</sup>, -CO-R<sup>13</sup>, -SO-R<sup>14</sup>, -SO<sub>2</sub>-R<sup>15</sup>,  
 $R^{11}$   
 es alquilo, alqueno, alquino, cicloalquilo, arilo, heterociclilo, aralquilo o  
 heterociclilalquilo,  
 25  $R^{12}$ ,  $R^{13}$   
 $R^{14}$  y  $R^{15}$   
 son alquilo, haloalquilo, alqueno, alquino, cicloalquilo, arilo, heterociclilo, aralquilo o  
 heterociclilalquilo, donde los grupos R<sup>10</sup>, R<sup>12</sup>, R<sup>13</sup>, R<sup>14</sup> y R<sup>15</sup> están opcionalmente  
 sustituidos por uno o más grupos halógeno, hidroxilo, oxo, nitro, ciano, amino, alquilo,  
 haloalquilo, alcoxilo, haloalcoxilo, alquiltio, cicloalquilo, arilo, heterociclilo o aralquilo,  
 30  $R^2$   
 es alquilo, alqueno, alquino, cicloalquilo, arilo, heterociclilo, aralquilo o  
 heterociclilalquilo, dicho grupo R<sup>2</sup> está opcionalmente sustituido por uno o más grupos  
 halógeno, hidroxilo, oxo, alquilo, haloalquilo, alcoxilo, haloalcoxilo, alquiltio, cicloalquilo,  
 arilo, heterociclilo, aralquilo o heterociclilalquilo,  
 35  $R^3$   
 es hidrógeno, alquilo, alqueno, alquino, cicloalquilo, arilo, heterociclilo, aralquilo o  
 heterociclilalquilo, dicho R<sup>3</sup> está opcionalmente sustituido por uno o más grupos  
 halógeno, hidroxilo, oxo, alquilo, haloalquilo, alcoxilo, haloalcoxilo, alquiltio, cicloalquilo,  
 arilo, heterociclilo, aralquilo o heterociclilalquilo, o  
 $R^2$  y  $R^3$   
 se pueden unir entre sí para formar un sistema de anillo heterocíclico, saturado o  
 40 insaturado, de cinco a nueve miembros, con hasta un total de tres heteroátomos de  
 anillo seleccionados entre N, O y/o S, en el que al menos un heteroátomo de anillo es S

5	$R^4$	en estado oxidado o no oxidado, y cuyo sistema de anillo heterocíclico contiene opcionalmente condensados en dos átomos de C adyacentes sistemas de anillos carbocíclicos y/o heterocíclicos, saturados o insaturados.
10	$R^5$ $R^6$ $R^{16}$ y $R^{17}$	es hidrógeno, alquilo, alqueno, alquino o cicloalquilo, dicho grupo $R^4$ está opcionalmente sustituido por uno o más grupos halógeno, hidroxilo, oxo, alquilo, haloalquilo, alcoxilo, haloalcoxilo, alquiltio, cicloalquilo, arilo, heterociclilo, aralquilo o heterociclilalquilo, es haloalquilo, haloalcoxilo, halógeno o $-SF_5$ , y es hidrógeno, halógeno, haloalquilo, nitro o $-NR^{16}R^{17}$ , son independientemente entre sí hidrógeno, alquilo, alqueno, alquino, cicloalquilo, arilo, heterociclilo, aralquilo, heterociclilalquilo, $-CO-O-R^{12}$ , $-CO-R^{13}$ , $-SO-R^{14}$ , $-SO_2-R^{15}$ , o $R^{16}$ y $R^{17}$ junto con el átomo N unido forman un anillo heterocíclico de cinco a siete miembros que contiene opcionalmente un átomo de oxígeno, azufre o nitrógeno adicional en el anillo, donde los grupos $R^{16}$ y/o $R^{17}$ o el anillo heterocíclico que forman los grupos $R^{16}$ y $R^{17}$ están opcionalmente sustituidos por uno o más grupos halógeno, hidroxilo, oxo, alquilo, haloalquilo, alcoxilo, haloalcoxilo, alquiltio, cicloalquilo, arilo, heterociclilo, aralquilo, o heterociclilalquilo,
20	X Y $R^{18}$	es $-S-$ , $-SO-$ , o $-SO_2-$ es $-O-$ , $-S-$ , $-SO-$ , o $-SO_2-$ , Z es $NR^{18}R^{19}$ , es hidrógeno, alquilo, alqueno, alquino, arilo, heterociclilo, aralquilo, heterociclilalquilo dicho grupo $R^{18}$ está opcionalmente sustituido por uno o más grupos halógeno, hidroxilo, oxo, nitro, ciano, amino, alquilo, haloalquilo, alcoxilo, haloalcoxilo, alquiltio, cicloalquilo, arilo, heterociclilo, aralquilo y/o por uno o más grupos $-CO-O-R^{20}$ , $-CO-R^{21}$ , $-SO-R^{22}$ y/o $-SO_2-R^{23}$ ,
25	$R^{20}$ , $R^{21}$ , $R^{22}$ y $R^{23}$	son alquilo, haloalquilo, alqueno, alquino, cicloalquilo, arilo, heterociclilo, aralquilo o heterociclilalquilo, donde los grupos $R^{20}$ , $R^{21}$ , $R^{22}$ y $R^{23}$ están opcionalmente sustituidos por uno o más grupos halógeno, hidroxilo, oxo, nitro, ciano, amino, alquilo, haloalquilo, alcoxilo, haloalcoxilo, alquiltio, cicloalquilo, arilo, heterociclilo o aralquilo,
30	$R^{19}$	es hidrógeno, $-CO-O-R^{24}$ , $-CO-R^{25}$ , $-CO-CO-R^{25}$ , $-CO-CH_2-O-R^{25}$ , $-SO-R^{26}$ , $-SO_2-R^{17}$ , alquilo, alqueno, alquino, cicloalquilo, arilo, heterociclilo, aralquilo, heterociclilalquilo dicho grupo $R^{19}$ está opcionalmente sustituido por uno o más de halógeno, hidroxilo, oxo, nitro, ciano, amino, alquilo, haloalquilo, alcoxilo, haloalcoxilo, alquiltio, cicloalquilo, arilo, heterociclilo, aralquilo, heterociclilalquilo, $-NH-CO-R^{28}$ , $-NHR^{29}$ , $-NR^{30}-CO-R^{31}$ , $-O-CO-R^{32}$ , $-O-R^{33}$ , $-SOp-R^{34}$ , $=N-R^{35}$ , $=N-NH-R^{36}$ , $=N-OR^{37}$ , $=N-OH$ , $=N-NH-C(=O)-NH_2$ , $=N-NH-C(=O)-NHR^{31}$ , $=N-NR^{38}-C(=O)-NH_2$ , $=N-NH-C(=S)-NH_2$ , $=N-NH-C(=S)-NHR^{31}$ , $=N-NR^{38}-C(=S)-NH_2$ y/o $=N-NH-C(O)-O-R^{19}$ ,
40	$R^{24}$ , $R^{25}$ , $R^{26}$ , $R^{27}$ $R^{28}$ , $R^{29}$ , $R^{30}$ , $R^{31}$ $R^{32}$ , $R^{33}$ , $R^{34}$ , $R^{35}$ , $R^{36}$ , $R^{37}$ , $R^{38}$ y $R^{39}$	independientemente entre sí son alquilo, haloalquilo, alqueno, alquino, cicloalquilo, arilo, heterociclilo, aralquilo o heterociclilalquilo, donde los grupos $R^{24}$ , $R^{25}$ , $R^{26}$ , $R^{27}$ , $R^{28}$ , $R^{29}$ , $R^{30}$ , $R^{31}$ , $R^{32}$ , $R^{33}$ , $R^{34}$ , $R^{35}$ , $R^{36}$ , $R^{37}$ , $R^{38}$ y/o $R^{39}$ están opcionalmente sustituidos por uno o más grupos halógeno, hidroxilo, oxo, nitro, ciano, amino, alquilo, haloalquilo, alcoxilo, haloalcoxilo, alquiltio, cicloalquilo, arilo, heterociclilo o aralquilo, o
45	$R^{18}$ y $R^{19}$	juntos con el átomo de N unido forman un anillo heterocíclico de cinco a siete miembros que contiene opcionalmente un átomo de oxígeno, azufre o nitrógeno adicional en el anillo y que está opcionalmente sustituido por uno o más grupos halógeno, hidroxilo, oxo, alquilo, haloalquilo, alcoxilo, haloalcoxilo, alquiltio, cicloalquilo, arilo, heterociclilo, aralquilo o heterociclilalquilo, o
50	$R^{18}$ y $R^{19}$	junto con el átomo de N unido forman un grupo imina $-N=CR^{18a}R^{19a}$ o un grupo iminoéter $-N=CR^{18a}(OR^{19a})$ ,
55	$R^{18a}$ $R^{19a}$	es hidrógeno, alquilo, cicloalquilo, arilo, heterociclilo, aralquilo o heterociclilalquilo, es alquilo, cicloalquilo, arilo, heterociclilo, aralquilo o heterociclilalquilo, donde los grupos $R^{18a}$ y $R^{19a}$ independientemente entre sí están opcionalmente sustituidos por uno o más grupos halógeno, hidroxilo, oxo, ciano, nitro, alquilo, haloalquilo, alcoxilo, haloalcoxilo, alquiltio, cicloalquilo, arilo, heterociclilo, aralquilo o heterociclilalquilo o por amino, que está opcionalmente sustituido por grupos alquilo, alqueno, alquino, arilo o heteroarilo, y

n y p son independientemente entre sí 0, 1, o 2.

**[0019]** En la presente memoria descriptiva, que incluye las reivindicaciones adjuntas, los grupos anteriormente mencionados tienen los siguientes significados:

5 El término "halógeno" debe significar flúor, cloro, bromo o yodo.

**[0020]** El término "halo" antes del nombre de un radical significará que este radical está parcial o completamente halogenado, esto quiere decir, sustituido por F, Cl, Br, o I, en cualquier combinación, preferiblemente por F o Cl. El término alquilo significará un grupo hidrocarburo alifático saturado de cadena lineal o de cadena ramificada. En general, los grupos alquilo poseen de uno a diez átomos de carbono, preferiblemente de uno a ocho átomos de carbono. Los ejemplos de grupos alquilo son metilo, etilo, propilo, isopropilo, 2-metilpropilo, 1-butilo, 2-butilo, isobutilo, terc-butilo, 2-metilbutilo, 1,1-dimetilpropilo, n-pentilo, n-hexilo, n-heptilo, 2-etil-hexilo u octilo.

**[0021]** El término "alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)" se entiende que significa un radical hidrocarburo no ramificado o ramificado que tiene de uno a seis átomos de carbono.

**[0022]** Los radicales alquilo tienen preferiblemente de 1 a 4 átomos de carbono.

**[0023]** El término "haloalquilo" significará un grupo alquilo en el que se sustituyen uno o más átomos de hidrógeno por átomos de halógeno idénticos o diferentes, preferiblemente por flúor y/o cloro.

**[0024]** Los ejemplos de grupos haloalquilo son trifluorometilo, difluorometilo, monofluorometilo, 1 o 2-fluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, pentafluoroetilo, 1,1,2,2-tetrafluoroetilo, mono, di, o triclorometilo, 1-fluoro-2-cloro-etilo, 1-cloro-2-fluoro-etil o 1 o 2-cloroetilo.

**[0025]** Los radicales haloalquilo tienen preferiblemente 1 a 2 átomos de carbono.

**[0026]** El término "alcoxilo" significará un grupo hidrocarburo alifático saturado de cadena lineal o de cadena ramificada que está conectado mediante un átomo de oxígeno a otro grupo. En general, los grupos alcoxilo poseen de uno a diez átomos de carbono, preferiblemente de uno a ocho átomos de carbono. Los ejemplos de grupos alcoxilo, son metoxilo, etoxilo, propiloxilo, isopropiloxilo, 1-butiloxilo, 2-butiloxilo, isobutiloxilo, terc-butiloxilo, 2-metilbutiloxilo, 1,1-dimetoxipropiloxilo, n-pentiloxilo, n-hexiloxilo, n-heptiloxilo, 2-etilhexiloxilo u octiloxilo.

**[0027]** El término "alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)" significará un grupo alcoxilo cuya cadena de carbono tiene el significado dado bajo la expresión "alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)".

**[0028]** El término "haloalcoxilo" significará un grupo alcoxilo en el que se sustituyen uno o más átomos de hidrógeno por átomos de halógeno, preferiblemente por flúor y/o cloro. Los ejemplos de grupos haloalcoxilo son trifluorometoxilo, difluorometoxilo, monofluorometoxilo, pentafluoroetoxilo, 1 o 2-fluoroetoxilo, 2,2,2-trifluoroetoxilo, clorometoxilo, 2-cloroetoxilo o 1,1,2,2-tetrafluoroetoxilo.

**[0029]** El término "alquiltio" significará un grupo hidrocarburo alifático saturado de cadena lineal o de cadena ramificada que está conectado mediante un átomo de azufre a otro grupo. En general, los grupos alquiltio poseen de uno a diez átomos de carbono, preferiblemente de uno a ocho átomos de carbono. Los ejemplos de grupos alquiltio son metiltio, etiltio, propiltio, isopropiltio, 1-butiltio, 2-butiltio, isobutiltio, terc-butiltio, 2-metilbutiltio, 1,1-dimetilpropiltio, n-pentiltio, n-hexiltio, n-heptiltio, 3-etil-hexiltio u octiltio.

**[0030]** El término "alquenilo" significará un grupo hidrocarburo alifático insaturado de cadena lineal o de cadena ramificada que posee uno o más dobles enlaces no conjugados. En general los grupos alquenilo poseen de uno a diez átomos de carbono, preferiblemente de uno a ocho átomos de carbono. Los ejemplos de grupos alquenilo son vinilo, alilo, 2-metil-2-propenilo, 1 o 2-butenilo, pentenilo, 2-metilpentenilo, hexenilo, heptenilo u octenilo.

**[0031]** El término "alquenilo (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)" significará una cadena de carbono no cíclico no ramificado o ramificado que tiene un número de átomos de carbono que corresponde a este intervalo establecido y que contiene al menos un doble enlace que puede estar localizado en cualquier posición del radical insaturado respectivo.

**[0032]** El término "alquinilo" significará un grupo hidrocarburo alifático insaturado de cadena lineal o de cadena ramificada que posee uno o más triples enlaces no conjugados. En general, los grupos alquinilo poseen de uno a diez átomos de carbono, preferiblemente de uno a ocho átomos de carbono. Los ejemplos de grupos alquinilo son

etinilo, propargilo, 2-metil-2-propinilo, 1-metil-2-propinilo, 2-butinilo, 3-butinilo, pentinilo, 2-metilpentinilo, hexinilo, heptinilo y octinilo.

5 **[0033]** El término “cicloalquilo” significará un grupo alquilo monocíclico y saturado que tiene preferiblemente un anillo de tres a siete átomos de carbono, tal como ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo, ciclooctilo o ciclodecilo; o un grupo alquilo bicíclico y saturado, tal como norbornilo o biciclo[2.2.2]octilo; o un sistema condensado y saturado, tal como decahidronaftaleno. Se prefieren los grupos cicloalquilo monocíclicos con anillos de cinco o seis miembros.

10 **[0034]** Los grupos cicloalquilo preferiblemente están sustituidos opcionalmente por halógeno o alquilo

**[0035]** En los compuestos de fórmula I se proporcionan los siguientes ejemplos de radicales alquilo o cicloalquilo sustituidos preferidos:

15 Un ejemplo de alquilo sustituido por cicloalquilo es ciclopropilmetilo; un ejemplo de alquilo sustituido por alcoxilo es metoximetilo  $-\text{CH}_2\text{OCH}_3$ ; y un ejemplo de alquilo sustituido por alquiltio es metiltiometilo  $-\text{CH}_2\text{SCH}_3$ .

20 **[0036]** El término “arilo” significará un grupo aromático carbocíclico formado por un anillo de átomos de carbono, preferiblemente 6 a catorce, especialmente un anillo de seis a doce átomos de carbono. Los ejemplos de grupos arilo son fenilo, naftilo o bifenililo, preferiblemente fenilo.

25 **[0037]** El término “heterociclilo” significará un grupo cíclico que está completamente saturado, parcialmente insaturado o completamente insaturado que posee además al menos uno o más átomos de carbono o heteroátomos en el anillo seleccionados entre el grupo de oxígeno, azufre y nitrógeno. Son posibles diferentes heteroátomos en el anillo con la excepción de dos átomos de oxígeno adyacentes en el anillo. Los grupos heterociclilo contienen preferiblemente uno, dos o tres heteroátomos en el anillo heterocíclico, seleccionados preferiblemente entre el grupo constituido por N, O y S (que incluye las formas oxidadas de S). Los grupos heterociclilo son preferiblemente radicales heterociclilo alifáticos que tienen de tres a siete átomos en el anillo o radicales heteroaromáticos que tienen de cinco a siete átomos en el anillo. Los grupos heterocíclicos pueden ser sistemas heterocíclicos mono, bi o policíclicos, preferiblemente sistemas heteroaromáticos en los que al menos un anillo contiene uno o más heteroátomos.

30 **[0038]** Los ejemplos de grupos heterociclilo son tiofenilo, furilo, pirrolilo, tiazolilo, oxazolilo, imidazolilo, isotiazolilo, isoxazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,3,4-triazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,2,4-triazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,3,4-tetrazolilo, benzo[b]tiofenilo, benzo[b]furanilo, indolilo, benzo[c]tiofenilo, benzo[c]furanilo, isoindolilo, benzoxazolilo, benzotiazolilo, bencimidazolilo, bencisoxazolilo, bencisotiazolilo, benzopirazolilo, benzotiadiazolilo, benzotriazolilo, dibenzofuranilo, dibenzotiofenilo, carbazolilo, piridilo, pirazinilo, pirimidinilo, piridazinilo, 1,3,5-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,2,4,5-tetrazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, quinoxalinilo, quinazolinilo, cinnolinilo, 1,8-naftiridinilo, 1,5-naftiridinilo, 1,6-naftiridinilo, 1,7-naftiridinilo, ftalazinilo, piridopirimidinilo, purinilo, pteridinilo, 4H-quinolizinilo, piperidinilo, pirrolidinilo, oxazolinilo, tetrahidrofuranilo, tetrahidropiranilo, isoxazolidinilo, tiazolidinilo, tienilo, oxiranilo, oxetanilo, oxolanilo (= tetrahidrofurilo), oxanilo, pirrolidilo, piperidilo, piperazinilo, dioxolanilo, oxazolinilo, isoxazolinilo, oxazolidinilo, isoxazolidinilo y morfolinilo.

45 **[0039]** El término “grupo heteroaromático” es un subgrupo del término “grupo heterociclilo” y abarca los compuestos heterocíclicos aromáticos completamente insaturados mencionados en la anterior lista.

50 **[0040]** Los grupos heterociclilo pueden estar sustituidos o no sustituidos, preferiblemente por uno o más radicales, muy preferiblemente por uno a tres radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alcoxilo, haloalcoxilo, alquiltio, hidroxilo, amino, nitro, carboxilo, ciano, alcocarbonilo, alquilcarbonilo, formilo, carbamoilo, mono y dialquilaminocarbonilo, amino sustituido tal como acilamino, mono y dialquilamino, y alquilsulfínilo, haloalquilsulfínilo, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, alquilo y haloalquilo, y adicionalmente también oxo. El grupo oxo puede estar también presente en aquellos heteroátomos del anillo en los que son posibles diversos números de oxidación, por ejemplo en el caso de N y S.

55 **[0041]** Heterociclilo comprenderá preferiblemente un sistema de anillo insaturado, parcialmente saturado o aromático con tres a seis átomos de carbono en el anillo y uno a cuatro heteroátomos en el anillo seleccionados entre el grupo del oxígeno, azufre y nitrógeno o sus combinaciones.

**[0042]** Dos grupos juntos con un átomo de N unido pueden formar un anillo heterocíclico de cinco a siete miembros que contiene opcionalmente un átomo de oxígeno, azufre o nitrógeno adicional en el anillo. Se

proporcionan ejemplos de anillos formados que contienen nitrógeno en la lista de grupos heterociclilo.

- 5 **[0043]** Además, dos grupos  $R^2$  y  $R^3$  juntos con los átomos de S y opcionalmente O unidos pueden formar un anillo heterocíclico de cinco a nueve miembros, preferiblemente de cinco a ocho miembros que contiene opcionalmente heteroátomos adicionales, preferiblemente, átomos de oxígeno, azufre o nitrógeno, en el anillo. El anillo heterocíclico de cinco a ocho miembros puede formar parte de un sistema de anillo más condensado, el sistema de anillo heterocíclico en dicho caso contiene condensado a dos átomos de C adyacentes del sistema del anillo heterocíclico sistemas de anillos carbocíclicos y/o heterocíclicos saturados y/o insaturados adicionales. Se proporcionan ejemplo de estos grupos heterocíclicos en la lista de grupos heterocíclicos.
- 10 **[0044]** El término "aralquilo" significará un grupo arilo que está conectado mediante un grupo alquileo a otro grupo. La porción alquileo es una porción de hidrocarburo saturado de cadena lineal o de cadena ramificada que posee en general uno a seis átomos de carbono. El grupo aralquilo preferido es bencilo.
- 15 **[0045]** El término "heterociclilalquilo" significará un grupo heterociclilo que está conectado mediante un grupo alquileo a otro grupo, La porción alquileo es una porción de hidrocarburo saturado de cadena lineal o de cadena ramificada que posee en general de uno a seis átomos de carbono.
- 20 **[0046]** Se prefieren los compuestos de fórmula I en los que W es =N-, =CR<sup>7</sup>- o =C(NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>)-
- [0047]** Un W muy preferido es =C (halógeno)-, =C(NH<sub>2</sub>)- o =N-, más preferido =N- y =C (halógeno)- y lo más preferido W es =C (halógeno).
- 25 **[0048]** Se prefieren los compuestos de fórmula I, en los que R<sup>7</sup> es cloro o flúor.
- [0049]** Se prefieren los compuestos de fórmula I, en los que R<sup>1</sup> es ciano, halógeno, haloalquilo o -CS-NH<sub>2</sub>.
- [0050]** Se prefieren los compuestos de fórmula I, en los que R<sup>2</sup> es alquilo o haloalquilo.
- 30 **[0051]** Se prefieren los compuestos de fórmula I, en los que R<sup>3</sup> es alquilo o haloalquilo.
- [0052]** Se prefieren los compuestos de fórmula I, en los que R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> se unen entre sí para formar un sistema de anillo heterocíclico saturado o insaturado de cinco a ocho miembros con dos átomos de azufre en el anillo o con un átomo de azufre y un átomo de oxígeno en el anillo o en el que R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> se unen entre sí para formar un sistema de anillo condensado que posee un sistema de anillo heterocíclico saturado o insaturado de cinco a ocho miembros con dos átomos de azufre en el anillo o con un átomo de azufre y un átomo de oxígeno en el anillo al cual se fusiona al menos un sistema de anillo carbocíclico y/o heterocíclico a dos átomos de C adyacentes del sistema de anillo heterocíclico saturado o insaturado de cinco a ocho miembros.
- 35 **[0053]** El(Los) átomo(s) de azufre en el anillo se pueden oxidar y pueden transportar uno o dos átomos de oxígeno.
- [0054]** Se prefieren los compuestos de fórmula I, en los que R<sup>4</sup> es hidrógeno, alquilo o haloalquilo.
- 40 **[0055]** R<sup>4</sup> es muy preferiblemente hidrógeno, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>) o haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>).
- [0056]** Se prefieren los compuestos de fórmula I, en los que R<sup>5</sup> es halógeno, haloalquilo, haloalcoxilo o -SF<sub>5</sub>.
- [0057]** R<sup>5</sup> es muy preferiblemente halógeno, haloalcoxilo (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>) o -SF<sub>5</sub>.
- 50 **[0058]** Se prefieren los compuestos de fórmula I, en los que R<sup>6</sup> es hidrógeno, halógeno, nitro o -NR<sup>16</sup>R<sup>17</sup>.
- [0059]** Se prefieren los compuestos de fórmula I, en los que X e Y son cada uno -S- o -SO- o -SO<sub>2</sub>- o en los que Y es -O- y X es -S-, -SO- o -SO<sub>2</sub>-.
- 55 **[0060]** Se prefieren los compuestos de fórmula I, en los que Y es -S-.
- [0061]** Son muy preferidos los compuestos en los que R<sup>1</sup> es haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), halógeno, ciano, -CS-NH<sub>2</sub> o C(=NR<sup>10</sup>)S(O)<sub>n</sub>R<sup>11</sup>;

R <sup>2</sup> y R <sup>3</sup>	independientemente entre sí son alquilo (C <sub>1</sub> -C <sub>3</sub> ), haloalquilo (C <sub>1</sub> -C <sub>3</sub> ), o R <sup>2</sup> y R <sup>3</sup> se unen entre sí para formar un sistema de anillo heterocíclico saturado o insaturado de cinco a ocho miembros siendo al menos un heteroátomo del anillo azufre, siendo al menos otro heteroátomo del anillo azufre u oxígeno y opcionalmente, seleccionándose un tercer heteroátomo del anillo entre oxígeno, nitrógeno o azufre, o en el que R <sup>2</sup> y R <sup>3</sup> se unen entre sí para formar un sistema de anillo condensado que posee un sistema de anillo heterocíclico saturado o insaturado de cinco a ocho miembros siendo al menos un heteroátomo del anillo azufre, siendo al menos otro heteroátomo del anillo azufre u oxígeno y opcionalmente, seleccionándose un tercer heteroátomo del anillo entre oxígeno, nitrógeno o azufre, cuyo sistema de anillo de al menos uno de otro sistema de anillo carbocíclico y/o heterocíclico se fusiona a dos átomos de C adyacentes del sistema de anillo heterocíclico saturado o insaturado de cinco a ocho miembros.
5	
10	
R <sup>4</sup>	es hidrógeno, alquilo (C <sub>1</sub> -C <sub>3</sub> ) o haloalquilo (C <sub>1</sub> -C <sub>3</sub> ),
R <sup>5</sup>	es -CF <sub>3</sub> , -OCF <sub>3</sub> , -SF <sub>5</sub> o halógeno,
15 R <sup>6</sup>	es hidrógeno, halógeno, -NO <sub>2</sub> , o -NR <sup>16</sup> R <sup>17</sup> ,
W	es =C (halógeno), =C(NR <sup>8</sup> R <sup>9</sup> )- o =N-,
X	es -S-, -SO- o -SO <sub>2</sub> -,
Y	es -O-, -S-, -SO- o -SO <sub>2</sub> -,
Z	es NR <sup>18</sup> R <sup>19</sup> ,
20 R <sup>10</sup>	es hidrógeno, alquilo (C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> ), haloalquilo (C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> ), alqueno (C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> ), alquino (C <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> ), -(CH <sub>2</sub> ) <sub>q</sub> -R <sup>40</sup> , -CO-R <sup>43</sup> , -CO <sub>2</sub> -alquilo(C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> ), -S(O) <sub>p</sub> -R <sup>41</sup> o -S(O) <sub>p</sub> -R <sup>40</sup> ,
R <sup>11</sup>	es alquilo (C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> ) o CH <sub>2</sub> -R <sup>40</sup> ,
R <sup>18</sup>	es hidrógeno, alqueno (C <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> ), alquino (C <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> ), R <sup>40</sup> R <sup>41</sup> , cicloalquilo (C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> ) o alquilo (C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> ) en donde el último grupo mencionado está sustituido o no sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno alcoxi-(C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> ), -S(O) <sub>m</sub> -R <sup>42</sup> , R <sup>40</sup> , cicloalquilo (C <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> ), -CO <sub>2</sub> -(CH) <sub>q</sub> -R <sup>40</sup> , -CO <sub>2</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>q</sub> -R <sup>41</sup> y -CO <sub>2</sub> -R <sup>42</sup> ,
25 R <sup>19</sup>	es hidrógeno, -CO <sub>2</sub> R <sup>44</sup> , -COCOR <sup>45</sup> , -SO <sub>2</sub> R <sup>43</sup> , -COR <sup>43</sup> o -COCH <sub>2</sub> OR <sup>43</sup> , alquilo (C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> )-o haloalquilo (C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> ) donde los grupos alquilo o haloalquilo están sustituidos o no sustituidos por un radical seleccionado entre el grupo constituido por -NHCOR <sup>43</sup> , -NHR <sup>43</sup> , NR <sup>43</sup> COR <sup>43</sup> , -OCOR <sup>43</sup> , -OR <sup>40</sup> , -OR <sup>41</sup> , -S(O) <sub>p</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>q</sub> R <sup>40</sup> , -S(O) <sub>p</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>q</sub> R <sup>41</sup> , =N-R <sup>43</sup> , =NNHR <sup>43</sup> , =NOR <sup>43</sup> , =NOH, =NNHG(=O)R <sup>43</sup> , =NNHC(=O)NH <sub>2</sub> , =MNHC(=O)NHR <sup>31</sup> , =NNR <sup>43</sup> C(=O) NH <sub>2</sub> , =NNHC(=S)R <sup>43</sup> , =NNHC(=S)NH <sub>2</sub> , =NNHC(=S)NHR <sup>31</sup> , =NNR <sup>43</sup> C(=S)NH <sub>2</sub> , =NNHC(=O)O(CH <sub>2</sub> ) <sub>q</sub> R <sup>44</sup> , alcoxi (C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> ) y -S(O) <sub>m</sub> R <sup>42</sup> , en el que dos radicales alcoxi (C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> ) o -S(O) <sub>m</sub> R <sup>42</sup> se pueden unir al mismo átomo de carbono para formar un grupo acetal, tioacetal o hemitioacetal o un acetal cíclico, tioacetal o hemitioacetal que contiene 5 o 6 átomos en el anillo; o
30	
35	
R <sup>18</sup> y R <sup>19</sup>	junto con el nitrógeno-5 pueden formar también un grupo alquil C <sub>1</sub> -C <sub>3</sub> iminoéter,
R <sup>40</sup>	es fenilo sustituido o no sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> ), haloalquilo (C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> ), alcoxi (C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> ), haloalcoxi (C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> ), -CN, -NO <sub>2</sub> , -S(O) <sub>p</sub> -R <sup>42</sup> y -NR <sup>46</sup> R <sup>47</sup> ,
40 R <sup>41</sup>	es heteroarilo sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno alquilo (C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> ), haloalquilo (C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> ), alcoxi (C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> ), haloalcoxi (C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> ); -CN, -NO <sub>2</sub> , -S(O) <sub>p</sub> -R <sup>42</sup> , -NR <sup>46</sup> R <sup>47</sup> , -OH y oxo,
R <sup>42</sup>	es alquilo (C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> ) o haloalquilo (C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> )
45 R <sup>43</sup>	es alquilo (C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> ), haloalquilo (C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> ), cicloalquil (C <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> )-alquilo (C <sub>1</sub> -C <sub>3</sub> ) o -(CH <sub>2</sub> ) <sub>q</sub> -R <sup>40</sup> ,
R <sup>44</sup>	es R <sup>40</sup> , alqueno (C <sub>3</sub> -C <sub>4</sub> ), alquino (C <sub>3</sub> -C <sub>4</sub> ) o alquilo (C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> ) en donde el último grupo mencionado está sustituido o no sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alcoxi (C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> ), haloalcoxi (C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> ), R <sup>40</sup> , -S(O) <sub>m</sub> -R <sup>40</sup> y cicloalquilo (C <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> ),
50 R <sup>45</sup>	es -OR <sup>44</sup> o NR <sup>46</sup> R <sup>46</sup> R <sup>47</sup> ,
R <sup>16</sup> , R <sup>17</sup> , R <sup>46</sup> y R <sup>47</sup>	independientemente entre sí son hidrógeno, alquilo (C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> ), haloalquilo (C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> ), alqueno (C <sub>2</sub> -C <sub>4</sub> ), haloalqueno (C <sub>2</sub> -C <sub>4</sub> ), alquino (C <sub>2</sub> -C <sub>4</sub> ), cicloalquilo (C <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> ), cicloalquil (C <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> )-alquilo (C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> ), R <sup>44</sup> , (CH <sub>2</sub> ) <sub>q</sub> -R <sup>40</sup> ; o
55 R <sup>16</sup> y R <sup>17</sup> o R <sup>46</sup> y R <sup>47</sup>	junto con el átomo de N unido forman un anillo saturado o insaturado de cinco a seis miembros que contiene opcionalmente un heteroátomo adicional en el anillo que se selecciona entre O, S y N, estando el anillo sustituido o no sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> ), haloalquilo (C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> ) y oxo,
m, n y p	son cada uno independientemente 0, 1, o 2,



q es 0 o 1, y

cada heteroarilo en los radicales anteriormente mencionados es independientemente un radical heteroaromático que tiene de 3 a 7 átomos en el anillo y 1, 2 o 3 heteroátomos en el anillo seleccionados entre el grupo constituido por N, O y S (incluyendo las formas oxidadas);

5 o una de sus sales plaguicidamente aceptables.

**[0062]** En las siguientes definiciones preferidas se entiende generalmente que cuando los símbolos no están específicamente definidos serán como se ha definido anteriormente en la descripción.

10 **[0063]** Una clase preferida de compuestos de fórmula I son aquellos en los que:

$R^1$  es CN o haloalquilo ( $C_1-C_3$ ),

$R^2, R^3, X$  e  $Y$  se unen entre sí para formar sistemas de anillos de 1,2-ditiolano o 1,3-ditiano,

$R^4$  es hidrógeno,

$W$  es =C (halógeno)- o =N-, y

15 el resto de radicales son según se ha definido anteriormente

**[0064]** Otra clase preferida de compuestos de fórmula I son aquellos en los que:

$R^1$  es CN

$R^4$  es alquilo ( $C_1-C_3$ ) o haloalquilo ( $C_1-C_3$ ),

20  $W$  es =C (halógeno)- o =C( $NR^8R^9$ )-, y

el resto de radicales son según se ha definido anteriormente.

**[0065]** Otra clase preferida de compuestos de fórmula I son aquellos en los que:

$R^1$  es CN.

25  $R^2, R^3, X$  e  $Y$  se unen entre sí para formar sistemas de anillos de 1,3-ditiolano o 1,3-ditiano,

$R^4$  es hidrógeno,

$Z$  es  $-NR^{18}R^{19}$ ,

$W$  es =C (halógeno)- o =N-, y

el resto de radicales son según se ha definido anteriormente.

30

**[0066]** Otra clase preferida de compuestos de fórmula I son aquellos en los que:

$R^1$  es CN.

$R^2, R^3, X$  e  $Y$  se unen entre sí para formar sistemas de anillos de 1,3-ditiolano o 1,3-ditiano,

$R^4$  es hidrógeno,

35  $Z$  es  $-NR^{18}R^{19}$ ,

$W$  es =C (halógeno)- o =N-,

$R^5$  es  $-CF_3$ ,  $-OCF_3$  o  $-SF_5$ ,

$R^6$  es halógeno o  $NR^{16}R^{17}$ , y

el resto de radicales son según se ha definido anteriormente.

40

**[0067]** Una clase preferida adicional de compuestos de fórmula I son aquellos en los que:

$R^1$  es CN.

$R^2, R^3, X$  e  $Y$  se unen entre sí para formar sistemas de anillos de 1,3-ditiolano o 1,3-ditiano,

$R^4$  es hidrógeno,

45  $Z$  es  $-NR^{18}R^{19}$ ,

$R^{18}$  es hidrógeno, alqueno ( $C_2-C_6$ ), alquilo ( $C_1-C_4$ ) en donde el último grupo mencionado está sustituido o no sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alcoxi ( $C_1-C_4$ ),  $-S(O)_mR^{42}$ ,  $R^{40}$ ,  $-CO_2-(CH_2)_qR^{40}$ ,  $-CO_2(CH_2)_qR^{41}$  y  $-CO_2R^{42}$ ,

50  $R^{19}$  es hidrógeno,  $-CO_2R^{44}$ ,  $-COCOR^{45}$ ,  $-SO_2R^{43}$ ,  $-COR^{43}$ , o  $-COCH_2OR^{43}$ , alquilo ( $C_1-C_4$ ) o haloalquilo ( $C_1-C_4$ ) donde los grupos alquilo o haloalquilo están sustituidos o no sustituidos por un radical seleccionado entre el grupo constituido por  $-NHCOR^{43}$ ,  $-NHR^{43}$ ,  $-NR^{43}COR^{43}$ ,  $-OCOR^{43}$ ,  $-OR^{40}$ ,  $-OR^{41}$ ,  $-S(O)_p(CH_2)_qR^{40}$ ,  $-S(O)_p(CH_2)_qR^{41}$ ,  $=NR^{43}$ ,  $=NNHR^{43}$ ,  $=NOR^{43}$ ,  $=NOH$ ,  $=NNHC(=O)R^{43}$ ,  $=NNHC(=O)NH_2$ ,  $=NNHC(=O)NHR^{31}$ ,  $=NNR^{43}C(=O)NH_2$ ,  $=NNHC(=S)R^{43}$ ,  $=NNHC(=S)NH_2$ ,  $=NNHC(=S)NHR^{31}$ ,

55  $=NNR^{43}C(=S)NH_2$ ,  $=NNHC(=O)O(CH_2)_qR^{44}$ , alcoxi ( $C_1-C_4$ ) y  $-S(O)_mR^{42}$ , en el que dos radicales alcoxi ( $C_1-C_4$ ) o  $-S(O)_mR^{42}$  pueden estar unidos al mismo átomo de carbono para formar un grupo acetal, tioacetal o hemitioacetal o un acetal, tioacetal o hemitioacetal cíclico que contiene 5 o 6 átomos en el anillo,

W es =C (halógeno)- o =N-,  
 R<sup>5</sup> es -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, o -SF<sub>5</sub>,  
 R<sup>6</sup> es halógeno o NR<sup>16</sup>R<sup>17</sup>, y  
 el resto de radicales son según se han definido anteriormente

5

**[0068]** Una clase preferida adicional de compuestos de fórmula I son aquellos en los que:

R<sup>1</sup> es CN.

R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, X e Y se unen entre sí para formar sistemas de anillos de 1,3-ditiano o 1,3-ditiano,

R<sup>4</sup> es hidrógeno,

10 Z es -NR<sup>18</sup>R<sup>19</sup>,

R<sup>18</sup> es hidrógeno, alqueno (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) en donde el último grupo mencionado está sustituido o no sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), -S(O)<sub>m</sub>R<sup>42</sup>, R<sup>40</sup>, -CO<sub>2</sub>-(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>-R<sup>40</sup>, -CO<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>R<sup>41</sup> y -CO<sub>2</sub>R<sup>42</sup>,

15 R<sup>19</sup>

es hidrógeno, -CO<sub>2</sub>R<sup>44</sup>, -COCOR<sup>45</sup>, -SO<sub>2</sub>R<sup>43</sup>, -COR<sup>43</sup>, o -COCH<sub>2</sub>OR<sup>43</sup>, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) o haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) donde los grupos alquilo o haloalquilo están sustituidos o no sustituidos por un radical seleccionado entre el grupo constituido por -S(O)<sub>m</sub>R<sup>42</sup> en el que dos radicales alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) o -S(O)<sub>m</sub>R<sup>42</sup> pueden estar unidos al mismo átomo de carbono para formar un grupo acetal, tioacetal o hemitioacetal o un acetal, tioacetal o hemitioacetal cíclico que contiene 5 o 6 átomos en el anillo,

20

W es =C (halógeno)-,

R<sup>5</sup> es -CF<sub>3</sub>,

R<sup>6</sup> es halógeno, y

el resto de radicales son según se han definido anteriormente

25

**[0069]** Los compuestos de fórmula I poseen valiosas propiedades plaguicidas.

**[0070]** La invención abarca también cualquier estereoisómero, enantiómero o isómero geométrico, y sus mezclas.

30 **[0071]** Por el término "sales plaguicidamente aceptables" se entiende las sales cuyos aniones se conocen y se aceptan en la técnica para la formación de sales de uso plaguicida.

**[0072]** Las sales de adición de ácido adecuadas, por ejemplo, las formadas mediante compuestos de fórmula I que contienen un grupo amino, incluyen sales con ácidos inorgánicos, por ejemplo, clorhidratos, sulfatos, fosfatos y nitratos y sales con ácidos orgánicos, por ejemplo, ácido acético.

35

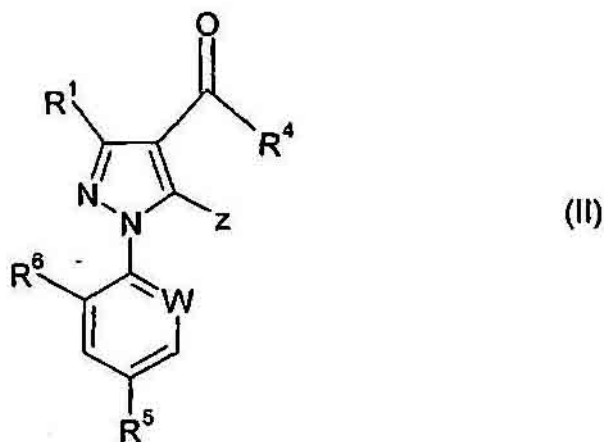
**[0073]** El término plagas significa plagas de artrópodos (que incluye insectos y arácnidos), y helmintos (que incluye nematodos).

40 **[0074]** Los compuestos de fórmula general I se pueden preparar mediante la aplicación o la adaptación de procedimientos conocidos (es decir, procedimientos usados o descritos con anterioridad en la bibliografía química).

**[0075]** En la siguiente descripción de los procedimientos, cuando los símbolos que aparecen en las fórmulas no están específicamente definidos, se entiende que son "como se ha definido anteriormente" según la primera definición de cada símbolo en la memoria descriptiva.

45

**[0076]** Según una característica adicional de la invención, los compuestos de fórmula I en los que R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, Z y W son como se ha definido anteriormente, se pueden preparar mediante la reacción de un compuesto correspondiente de fórmula II descrito en el documento WO-A-98/04530:



en el que los diferentes valores son según se ha definido anteriormente, con un compuesto de fórmula III



5

en presencia de N-bromosuccinimida en un disolvente orgánico, por ejemplo en diclorometano. Alternativamente, el uso de trifluoruro de boro-ácido acético como catalizador durante la reacción de II y III en 1,2-dicloroetano a temperatura ambiente o a temperatura elevada proporciona también la conversión.

- 10 **[0077]** Según una característica de la invención, los compuestos de fórmula I, en los que  $R^{19}$  es alquilo o haloalquilo, donde los grupos se sustituyen por un radical seleccionado entre el grupo constituido por  $=N\text{-R}^{43}$ ,  $=NNHR^{43}$ ,  $=NOR^{43}$ ,  $=NOH$ ,  $=NNHC(=O)R^{43}$ ,  $=NNHC(=O)NH_2$ ,  $=NNHC(=O)NHR^{31}$ ,  $=NNR^{43}C(=O)NH_2$ ,  $=NNHC(=S)R^{43}$ ,  $=NNHC(=S)NH_2$ ,  $=NNHC(=S)NHR^{31}$ ,  $=NNR^{43}C(=S)NH_2$ ,  $=NNHC(=O)O(CH_2)_qR^{44}$ ,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$ ,  $W$ ,  $n$ ,  $q$  y  $p$  son como se han definido anteriormente, se pueden preparar mediante la reacción de un compuesto correspondiente de fórmula I en el que el átomo de carbono del alquilo que soporta el radical relevante está sustituido por un átomo de carbono sustituido por un grupo carbonilo o por un derivado de acetal del mismo, preferiblemente un derivado de acetal de alquilo ( $C_1\text{-}C_4$ ), con un compuesto de fórmula (IV), (V), (VI), (VII), (VIII), (IX), (X), (XI), (XII), (XIII), (XIV), (XV) o (XVI)

- |    |                              |        |
|----|------------------------------|--------|
|    | $NH_2\text{-R}^{43}$         | (IV)   |
| 20 | $NH_2NHR^{43}$               | (V)    |
|    | $NH_2OR^{43}$                | (VI)   |
|    | $NH_2OH$                     | (VII)  |
|    | $NH_2NHC(=O)R^{43}$          | (VIII) |
|    | $NH_2NHC(=O)NH_2$            | (IX)   |
| 25 | $NH_2NR^{43}C(=O)NH_2$       | (X)    |
|    | $NH_2NHC(=S)R^{43}$          | (XI)   |
|    | $NH_2NHC(=S)NH_2$            | (XII)  |
|    | $NH_2NR^{43}C(=S)NH_2$       | (XIII) |
|    | $NH_2NHC(=O)O(CH_2)_qR^{44}$ | (XIV)  |
| 30 | $NH_2NHC(=O)NHR^{31}$        | (XV)   |
|    | $NH_2NHC(=S)NHR^{31}$        | (XVI)  |

en las que los diversos valores son según se ha definido anteriormente, o una sal de ácido de los mismos, tal como la sal de clorhidrato.

- 35 **[0078]** Cuando el compuesto de fórmula I usado en la reacción contiene un átomo de carbono sustituido por un grupo carbonilo, la reacción se lleva a cabo generalmente en presencia de una base, en un disolvente tal como un alcohol o un éter, por ejemplo metanol, o dioxano, a una temperatura de entre  $0^\circ\text{C}$  a la temperatura de reflujo del disolvente. La base es generalmente un carbonato de metal alcalino tal como carbonato de sodio o carbonato de potasio, o una base orgánica tal como una amina terciaria, por ejemplo, trietilamina o etil-diisopropilamina, o piridina,
- 40 o 1,8 diazabicyclo[5.4.0]undec-7 eno (DBU).

**[0079]** Cuando el compuesto de fórmula I usado en la reacción contiene un átomo de carbono sustituido por un

resto acetal, la reacción se lleva a cabo generalmente en presencia de un ácido fuerte tal como un ácido mineral, por ejemplo ácido clorhídrico, en un disolvente tal como un alcohol o un éter, por ejemplo, metanol o dioxano, a una temperatura de entre 0°C a la temperatura de reflujo del disolvente.

5 **[0080]** Según una característica de la invención, los compuestos de fórmula I, en la que R<sup>1</sup> es -CSNH<sub>2</sub>, y el resto de valores son como se ha definido anteriormente, se pueden preparar mediante la reacción del correspondiente compuesto de fórmula I, en la que R<sup>1</sup> es CN, con sulfhidratos de metales alcalinos o alcalinotérreos, tales como sulfhidratos preferiblemente de sodio o litio, potasio, calcio, en un disolvente inerte, por ejemplo, N,N-dimetilformamida, piridina, dioxano, tetrahidrofurano, sulfolano, dimetil sulfóxido, metanol o etanol a una temperatura  
10 de entre -35°C a 50°C, preferiblemente de 0°C a 30°C. Opcionalmente, se pueden generar sulfhidratos in situ mediante tratamiento con H<sub>2</sub>S en presencia de una base orgánica, tal como un alcóxido metálico o trialkilamina o una base inorgánica, tal como un hidróxido de metal alcalino o alcalinotérreo o un carbonato, tal como carbonato de sodio o carbonato de potasio o amonio. El uso de un agente complejante metálico, tal como un éter corona, puede ser de beneficio en la aceleración de la reacción.

15 **[0081]** La reacción de la sal de sulfhidrato con el compuesto de fórmula I se puede por tanto llevar a cabo en un sistema de agua/disolvente orgánico bifásico usando un catalizador de transferencia de fase tal como un éter corona o una sal de tetraalkilamonio tal como cloruro de benciltrimetilamonio o como bromuro de tetra-n-butilamonio. Los disolventes orgánicos adecuados para el uso en un sistema bifásico con agua incluye benceno, tolueno,  
20 diclorometano, 1-clorobutano y terc metil butil éter.

**[0082]** Se pueden preparar compuestos alternativos de fórmula I en la que R<sup>1</sup> es -CS-NH<sub>2</sub> a partir del correspondiente compuesto de fórmula I, en la que R<sup>1</sup> es -CN mediante tratamiento con el reactivo Ph<sub>2</sub>PS<sub>2</sub> según se describe en Tet. Lett., 24 (20), 2059 (1983).

25 **[0083]** Según una característica de la invención, se pueden preparar compuestos de la invención de fórmula I, en la que R<sup>1</sup> es -CS-NH<sub>2</sub>, y los otros valores son como se ha definido anteriormente mediante la reacción del correspondiente compuesto de fórmula I, en la que R<sup>1</sup> es -CN, con bis(trialkilsilil)sulfuro, preferiblemente bis(trimetilsilil)-sulfuro, en presencia de una base, generalmente un alcóxido de metal alcalino tal como metóxido de sodio, en un disolvente tal como N,N-dimetilformamida, a una temperatura de entre 0°C a 60°C. El procedimiento se describe generalmente por Lin, Ku of y Shiao en Synthesis 1219 (1992).

30 **[0084]** Según una característica de la invención, se pueden preparar compuestos de fórmula I, en la que n, q o p son 1 o 2 y R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, Z y W son como se ha definido anteriormente, oxidando un correspondiente compuesto en el que n, q o p son 0 o 1. La oxidación se lleva a cabo generalmente usando un perácido, tal como ácido 3-cloroperbenzoico en un disolvente, tal como diclorometano o en 1,2-dicloroetano, a una temperatura de entre 0°C a la temperatura de reflujo del disolvente.

40 **[0085]** Se pueden preparar intermedios de fórmula II según se describe en el documento WO-A-98/04530.

**[0086]** Se pueden preparar de esta manera colecciones de compuestos de fórmula I que se pueden sintetizar mediante los procedimientos anteriormente mencionados de una manera paralela, y se puede efectuar esto de manera manual o semiautomatizada o completamente automatizada. En este caso, es posible, por ejemplo, automatizar el procedimiento de la reacción, elaboración o purificación de los productos o de los intermedios. En  
45 total, debe entenderse que ace significa un procedimiento según se describe, por ejemplo, por S.H. Dewitt en "Annual report in Combinatorial Chemistry of and Molecular Diversity: Automated Synthesis", Volumen 1, publicado por Escom 1997, páginas 69 a 77.

50 **[0087]** Se ofrecen una serie de equipos ace comercialmente disponibles de, por ejemplo, Stem Corporation, Woodrolfe Road, Tollesbury, Essex, CM9 8SE, Inglaterra o de H+P laboratory technology Ltd., Bruckmannring 28, 85764 Oberschleißheim, Alemania o de Radleys, Shirehill, Saffron Walden, Essex, Inglaterra. Se pueden usar para el procedimiento en paralelo de la reacción y la elaboración.

55 **[0088]** Para la purificación en paralelo de los compuestos de fórmula I o de los intermedios obtenidos durante la preparación, se puede hacer el uso, entre otros, de equipos de cromatografía, por ejemplo, los de ISCO, Inc., 4700 superiors Street, Lincoln, NE 68504, EE.UU.

**[0089]** Los equipos mencionados conducen a un procedimiento modular en el que las etapas de procedimiento individuales están automatizadas, pero debe llevarse a cabo un funcionamiento manual entre las etapas de

procedimiento. Se puede evitar esto empleando la automatización del sistema semi integrada o completamente integrada en la que los módulos de automatización en cuestión se hacen funcionar mediante, por ejemplo, robots. Se puede obtener la automatización aparente del sistema, por ejemplo, de Zymark Corporation, Zymark Center, de Hopkinton, MA 01748, para EE.UU.

5

**[0090]** Además de los que se ha descrito aquí, se pueden preparar compuestos de fórmula I en procedimientos soportados en parte o completamente en fase sólida. Para este objetivo, etapas intermedias individuales o todas las etapas intermedias de la síntesis o de la síntesis adaptada a acomodarse al procedimiento en cuestión se unen a una resina sintética. Los procedimientos de síntesis soportada en fase sólida se describen extensamente en la bibliografía especializada, por ejemplo Barry A., Bunin en "The Combinatorial index", Academic Press, 1998.

10

**[0091]** El uso de procedimientos de síntesis soportada en fase sólida permite una serie de protocolos que se conocen de la bibliografía y que, en de forma práctica, se pueden llevar a cabo de manera manual o automatizada. Por ejemplo, se emplea el "procedimiento de los saquitos de té" (Houghten) documento U.S. 4.631.211; Houghten y col., Proc. Natl. Acad. Sci, 1985, 82, 5131-5135, en el que se utilizan productos de IRORI, 11149 North Torrey Pines Road, La Jolla CA 92037 EE.UU. Puede estar semi automatizado. La automatización de la síntesis en paralelo soportada en fase sólida se lleva a cabo satisfactoriamente, por ejemplo, mediante equipos de Argonaut Technologies, Inc., 887 Industrial Road, San Carlos, CA 94070, EE.UU. o de MultiSyn Tech Ltd., Wullener field 4, 58454 Witten Alemania.

15

20

**[0092]** La preparación de los procedimientos descritos en el presente documento da como resultado compuestos de fórmula I en forma de colecciones de sustancias que se denominan bibliotecas. La presente invención se refiere a bibliotecas que comprenden al menos dos compuestos de fórmula I.

25

**[0093]** Se conocen o se pueden preparar compuestos de fórmula III, IV, V, VI, VII, VIII, IX, X, XI, XII, XIII, XIV, XV y XVI mediante procedimientos conocidos.

**[0094]** Los siguientes Ejemplos no limitantes ilustran la preparación de los compuestos de fórmula I.

### 30 Ejemplos químicos

**[0095]** Los espectros de RMN se llevaron a cabo en cloroformo deuterado a no ser que se disponga otra cosa.

35

**[0096]** En los Ejemplos que siguen, las cantidades, y por tanto los porcentajes, están basadas en el peso, a no ser que se disponga otra cosa. Las relaciones de los disolventes están basadas en el volumen.

#### Ejemplo 1

40

5-amino-1-[2,6-dicloro-4-(trifluorometil)fenil]-4-(1,3-ditiolan-2-il)-1H-pirazol-3-carbonitrilo (compuesto 1-1)

45

**[0097]** A la disolución de 5-amino-1-[2,6-dicloro-4-(trifluorometil)fenil]-4-formil-1H-pirazol-3-carbonitrilo (5,00 g, 13,7 mmol) en diclorometano (100 ml) a temperatura ambiente se añadió N-bromosuccinimida (0,74 g, 4,1 mmol) seguido por 1,2-etanoditiol (1,98 g, 20,6 mmol). Se agitó la mezcla resultante a temperatura ambiente durante 3,7 h. A continuación se elaboró añadiendo hidróxido de sodio 2 N. se separaron las capas y se lavó la capa orgánica con salmuera y a continuación se secó (sulfato de sodio). A continuación se concentró para dar como resultado un sólido de color beige claro (7,0 g) RMN <sup>19</sup>F: -63,791.

#### Ejemplo 2

50

5-amino-1-[2,6-dicloro-4-(trifluorometil)fenil]-4-(1,3-ditiolan-2-il)-1H-pirazol-3-carbonitrilo-etoxietileno (1:1) (compuesto 1-5).

55

**[0098]** Al 5-amino-1-[2,6-dicloro-4-(trifluorometil)fenil]-4-(1,3-ditiolan-2-il)-1H-pirazol-3-carbonitrilo (0,30 g, 0,71 mmol) en ortoformiato de trietilo (4,45 g, 29, 70 mmol) se añadió ácido p-toluensulfónico (18 mg). La mezcla resultante se calentó hasta 100°C durante 1,5 h. A continuación se enfrió y a continuación se concentró. El líquido viscoso resultante se diluyó con diclorometano (20 ml). Se lavó la capa orgánica con bicarbonato de sodio saturado, salmuera, y a continuación se secó con sulfato de sodio para proporcionar, tras concentración, un aceite de color amarillo (0,36 g, 0,72 mmol); RMN <sup>19</sup>F: -63,698.

**Ejemplo 3**

1-[2,6-dicloro-4-(trifluorometil)fenil]-4-(1,3-ditiolan-2-il)-5-(metilamino)-1H-pirazol-3-carbonitrilo (compuesto 1-6)

- 5 **[0099]** A la disolución de 5-amino-1-[2,6-dicloro-4-(trifluorometil)fenil]-4-(1,3-ditiolan-2-il)-1H-pirazol-3-carbonitrilo-etoxietileno (1:1) (0,30 g, 0,6 mmol) en etanol (40 ml) a 5° C, se añadió borohidruro de sodio (74 mg, 1,9 mmol). Se agitó la mezcla resultante a temperatura ambiente durante cinco horas y a continuación se diluyó con agua y acetato de etilo. Se separaron las capas y se lavó la capa orgánica con cloruro de sodio saturado, se secó (Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>), se concentró para dar como resultado un aceite de color amarillento (0,27 g, 0,6 mmol); RMN <sup>19</sup>F: -63,704.

10

**Ejemplo 4**

1-[2,6-dicloro-4-(trifluorometil)fenil]-5-(metilamino)-4-[1-óxido-1,3-ditiolan-2-il]-1H-pirazol-3-carbonitrilo (compuesto 1-7 y 1-8)

15

- [0100]** A la disolución de 1-[2,6-dicloro-4-(trifluorometil)fenil]-4-(1,3-ditiolan-2-il)-5-(metil-amino)-1H-pirazol-3-carbonitrilo (0,16 g, 0,4 mmol) en 1,2-dicloroetano a 0-5° C se añadió ácido m-cloroperbenzoico (90 mg, 70%, 0,4 mmol) y se agitó a dicho intervalo de temperatura durante una hora. Se elaboró la reacción mediante la adición de hidróxido de sodio 2 N (10 ml) y acetato de etilo (25 ml). Tras agitar a temperatura ambiente durante 5 minutos, se separaron las capas y se lavó la capa orgánica con agua y disolución acuosa saturada de cloruro de sodio. A continuación se secó (Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>) y se concentró para dar como resultado un semisólido de color amarillo. Tras la purificación cromatográfica en columna de gel de sílice eluyendo con heptano: acetato de etilo (1:1 a 1.3), se aislaron dos productos en forma de sólido blanco como los sulfóxidos (16,1 mg, 70,8 mg, rendimiento combinado 47%): RMN <sup>19</sup>F: 63,693 y el otro -63,682.

20

**Ejemplo 5**

1-[2,6-dicloro-4-(trifluorometil)fenil]-4-(1,3-ditiolan-2-il)-5-(metilamino)-1H-pirazol-3-carbotioamida (compuesto 2-6)

- 30 **[0101]** Al 1,1,1,3,3,3-hexametildisilatio (0,157 g, 0,9 mmol) en dimetilformamida (4 ml) se añadió metóxido de sodio (0,049 g, 0,9 mmol) y la mezcla resultante se sonicó para proporcionar una disolución homogénea coloreada de azul. Esta disolución resultante se añadió a la disolución de 1-[2,6-dicloro-4-(trifluorometil)fenil]-4-(1,3-ditiolan-2-il)-5-(metilamino)-1H-pirazol-3-carbonitrilo (0,08 g, 0,2 mmol) en dimetilformamida (5 mL) a temperatura ambiente en atmósfera de nitrógeno. Se agitó esta mezcla a temperatura ambiente durante una hora y media. A continuación se diluyó con éter (30 ml) y agua 830 ml). Se separaron las capas y se extrajo la capa acuosa con éter. Las capas etéreas se combinaron y se lavaron dos veces con agua (2 X 20 ml), se secaron (Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>), y se concentraron para proporcionar un sólido de color amarillo. Tras la purificación cromatográfica mediante gel de sílice eluyendo con heptano: acetato de etilo (4:1 a 2.1) se obtuvo un sólido de color amarillo (0,048 g, 55%). RMN <sup>19</sup>F: -63,634.

40

**Ejemplo 6**

5-amino-1-[2,6-dicloro-4-(trifluorometil)fenil]-4-(1,3-ditian-2-il)-1H-pirazol-3-carbonitrilo (compuesto 1-93)

- 45 **[0102]** A la disolución de 5-amino-1-[2,6-dicloro-4-(trifluorometil)fenil]-4-formil-1H-pirazol-3-carbonitrilo (0,5 g, 1,4 mmol) en diclorometano (10 ml) se añadió N-bromosuccinimida (0,075 g, 0,2 mmol) seguido por la adición de 1,3-dimercaptopropano (0,19 g, 1,8 mmol). Se agitó la disolución resultante a temperatura ambiente durante ocho horas. A continuación se elaboró mediante la adición de hidróxido de sodio 2 N. Se separaron las capas y se secó la capa orgánica (Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>) y se concentró. El sólido resultante se purificó adicionalmente mediante columna en gel de sílice eluyendo con heptano:acetato de etilo (1:1) para dar como resultado un sólido de color blanco (0,2 g, 33%). RMN <sup>19</sup>F: -64, 231.

50

**Ejemplo 7**

- 55 5-amino-4-[bis(etiltio)metil]-1-[2,6-dicloro-4-(trifluorometil)fenil]-1H-pirazol-3-carbonitrilo (compuesto 1-61)

**[0103]** A la disolución de 5-aminoamino-1-[2,6-dicloro-4-(trifluorometil)fenil]-4-formil-1H-pirazol-3-carbonitrilo (0,5 g, 1,4 mmol) y N-bromosuccinimida (0,075 g, 0,2 mmol) en cloruro de metileno (10m) se añadió etanotiol (0,26 g, 4,2 mmol). Se calentó la disolución resultante a reflujo durante ocho horas. A continuación se enfrió y se añadió

hidróxido de sodio 2 N. Se separaron las capas y se secaron las capas orgánicas (Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>) y se concentraron. Tras la purificación cromatográfica mediante columna en gel de sílice eluyendo con heptano:acetato de etilo (1:1), se obtuvo un sólido de color amarillo (0,35 g, 55%). RMN <sup>19</sup>F: -64,226.

5 [0104] Los siguientes compuestos preferidos que se muestran en las Tablas 1 a 3 forman parte también de la presente invención, y fueron o se pueden preparar según, o de manera análoga a, los Ejemplos 1 a 7 anteriormente mencionados o los procedimientos generales anteriormente descritos.

10 [0105] En las Tablas Me significa metilo, Et significa etilo, Pr significa n-propilo, cPr significa ciclopropilo, OMe significa metoxilo, Oet significa etoxilo, Ph significa fenilo.

[0106] Los valores de desplazamiento de los espectros de RMN <sup>19</sup>F se proporcionan en ppm.

15 [0107] Los números de los compuestos se proporcionan únicamente a efecto de referencia

**Tabla I:** Compuestos de fórmula I en los que los sustituyentes tienen los siguientes significados

Comp. N°	R <sup>1</sup> y R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	X	Y	Z	Pf o RMN <sup>19</sup> F
1-1	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	S	S	NH <sub>2</sub>	-63,791
1-2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	S	SO	NH <sub>2</sub>	-63,806
1-3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H**	S	SO	NH <sub>2</sub>	-63,808
1-4	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	SO	SO	NH <sub>2</sub>	-63,806, -63,833
1-5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	S	S	N=CHOEt	-63,698
1-6	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	S	S	NHMe	-63,704
1-7	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	S	SO	NHMe	-63,693
1-8	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H**	S	SO	NHMe	-63,682
1-9	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	S	S	N=CMe(OEt)	-63,720
1-10	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	S	S	NHEt	-63,682
1-11	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	S	S	NHC(OEt) <sub>2</sub> Me	-63,666
1-12	-CH(Me)CH(Me)-	H	S	S	NH <sub>2</sub>	-63,785
1-13	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	S	S	NHiPr	-63,671
1-14	-CH(Me)CH(Me)-	H	S	SO	NH <sub>2</sub>	-63,796, -63,806
1-15	-CH(Me)CH(Me)-	H**	S	SO	NH <sub>2</sub>	-63,779, -63,796
1-16	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	SO	S	NHiPr	-63,655
1-17	-CH <sub>2</sub> CHMe-	H	S	S	NH <sub>2</sub>	-63,790
1-18	-CH <sub>2</sub> CHMe-	H	S	S	N=CHOEt	-63,698
1-19	-CH <sub>2</sub> CHMe-	H	S	S	NHMe	-63,709
1-20	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CH <sub>3</sub>	S	S	NH <sub>2</sub>	
1-21	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CH <sub>3</sub>	S	SO	NH <sub>2</sub>	
1-22	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CH <sub>3</sub> **	S	SO	NH <sub>2</sub>	
1-23	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CH <sub>3</sub>	SO	SO	NH <sub>2</sub>	
1-24	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CH <sub>3</sub>	S	S	N=CHOEt	
1-25	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CH <sub>3</sub>	S	S	NHMe	
1-26	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CH <sub>3</sub>	S	SO	NHMe	
1-27	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CH <sub>3</sub> **	S	SO	NHMe	
1-28	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CH <sub>3</sub> S		S	N=CMe(OEt)	
1-29	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CH <sub>3</sub>	S	S	NHEt	
1-30	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CH <sub>3</sub>	S	S	NHC(OEt) <sub>2</sub> Me	
1-31	-CH(Me)CH(Me)-	CH <sub>3</sub>	S	S	NH <sub>2</sub>	
1-32	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CH <sub>3</sub>	S	S	NHiPr	
1-33	-CH(Me)CH(Me)-	CH <sub>3</sub>	S	SO	NH <sub>2</sub>	
1-34	-CH(Me)CH(Me)-	CH <sub>3</sub> **	S	SO	NH <sub>2</sub>	
1-35	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CH <sub>3</sub>	SO	S	NHiPr	
1-36	-CH <sub>2</sub> CHMe-	CH <sub>3</sub>	S	S	NH <sub>2</sub>	
1-37	-CH <sub>2</sub> CHMe-	CH <sub>3</sub>	S	S	N=CHOEt	
1-38	-CH <sub>2</sub> CHMe-	CH <sub>3</sub>	S	S	NHMe	
1-39	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub>	S	S	NH <sub>2</sub>	

(continuación)

1-40	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub>	S	SO	NH <sub>2</sub>	
1-41	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub> **	S	SO	NH <sub>2</sub>	
1-42	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub>	SO	SO	NH <sub>2</sub>	
1-43	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub>	S	S	N=CHOEt	
1-44	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub>	S	S	NHMe	
1-45	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub>	S	SO	NHMe	
1-46	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub> **	S	SO	NHMe	
1-47	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub>	S	S	N=CMe(OEt)	
1-48	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub>	S	S	NH <sub>2</sub> Et	
1-49	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub>	S	S	NHC(OEt) <sub>2</sub> Me	
1-50	-CH(Me)CH(Me)-	CF <sub>3</sub>	S	S	NH <sub>2</sub>	
1-51	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub>	S	S	NHiPr	
1-52	-CH(Me)CH(Me)-	CF <sub>3</sub>	S	SO	NH <sub>2</sub>	
1-53	-CH(Me)CH(Me)-	CF <sub>3</sub> **	S	SO	NH <sub>2</sub>	
1-54	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub>	SO	S	NHiPr	
1-55	-CH <sub>2</sub> CHMe	CF <sub>3</sub>	S	S	NH <sub>2</sub>	
1-56	-CH <sub>2</sub> CHMe-	CF <sub>3</sub>	S	S	N=CHOEt	
1-57	-CH <sub>2</sub> CHMe-	CF <sub>3</sub>	S	S	NHMe	
1-61	Et, Et	H	S	S	NH <sub>2</sub>	-64,226
1-62	Et, Et	H	S	SO	NH <sub>2</sub>	
1-63	Et, Et	CH <sub>3</sub>	S	S	NH <sub>2</sub>	
1-64	Et, Et	CH <sub>3</sub>	S	SO	NH <sub>2</sub>	
1-65	Et, Et	CH <sub>3</sub>	SO	SO	NH <sub>2</sub>	
1-66	Et, Et	H	O	S	NH <sub>2</sub>	
1-67	Et, Et	CH <sub>3</sub>	S	S	NH <sub>2</sub>	
1-68	Et, Et	CF <sub>3</sub>	S	S	N <sub>2</sub>	
1-69	Et, Et	CF <sub>3</sub>	SO	S	N <sub>2</sub>	
1-70	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	O	S	NH <sub>2</sub>	
1-71	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CH <sub>3</sub>	O	S	NH <sub>2</sub>	
1-72	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub>	O	S	NH <sub>2</sub>	
1-73	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	S	S	N(Me)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	
1-74	Me, Me	H	S	S	NH <sub>2</sub>	
1-75	Me, Me	H	S	SO	N <sub>2</sub>	
1-76	Me, Me	CH <sub>3</sub>	S	S	NH <sub>2</sub>	
1-77	Me, Me	CH <sub>3</sub>	S	SO	NH <sub>2</sub>	
1-78	Me, Me	CH <sub>3</sub>	SO	SO	NH <sub>2</sub>	
1-79	Me, Me	H	O	S	NH <sub>2</sub>	
1-80	Me, Me	CH <sub>3</sub>	S	S	NH <sub>2</sub>	
1-81	Me, Me	CF <sub>3</sub>	S	S	NH <sub>2</sub>	
1-82	Me, Me	CF <sub>3</sub>	SO	S	NH <sub>2</sub>	
1-83	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	S	S	N(Me)CH=CH <sub>2</sub>	
1-84	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	S	S	NHCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	
1-85	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	S	SO	NHCH <sub>2</sub> CCH	
1-86	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	S	S	N(Me)CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	
1-87	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	S	S	N(Me)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH(SMe) <sub>2</sub>	
1-88	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub>	S	S	NHCCH	
1-89	-CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub>	S	S	N(Me)CCH	
1-90	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	S	S	N(Me)CH <sub>2</sub> CH(SMe) <sub>2</sub>	
1-91	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	S	S	N(Me)CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CH=N Oet	
1-92	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	S	S	N(Me)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH=N NHCO Me	
1-93	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	S	S	NH <sub>2</sub>	-64,231
1-94	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub>	S	S	NHCCH	
1-94	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub>	S	S	N(Me)CCH	
1-96	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	S	S	N(Me)CH <sub>2</sub> CH(SMe) <sub>2</sub>	
1-97	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	S	S	N(Me)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH=N Oet	



(continuación)

1-98	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	S	S	N(Me)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH=N NHCO Me	
1-99	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	S	SO	N(Me)CH <sub>2</sub> CH=N-NH-CO-NH(4-OCF <sub>3</sub> Ph)	
1-100	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	SO	SO	N(Me)CH <sub>2</sub> CH=N-NH-CO-NH(4-OCF <sub>3</sub> Ph)	

\*\* representa el diastereómero del compuesto anteriormente descrito.

**Tabla 2:** Compuestos de fórmula I en los que los sustituyentes tienen los siguientes significados:

Comp. N°	R <sup>1</sup> y R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	X	Y	Z	Pf o RMN <sup>19</sup> F
2-1	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	S	S	NH <sub>2</sub>	-63,725
2-2	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	S	SO	NH <sub>2</sub>	-63,758
2-3	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H**	S	SO	NH <sub>2</sub>	
2-4	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	SO	SO	NH <sub>2</sub>	
2-5	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	S	S	N=CHOEt	
2-6	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	S	S	NHMe	-63,634
2-7	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	S	SO	NHMe	-63,650
2-8	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H**	S	SO	NHMe	
2-9	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	S	S	N=CMe(OEt)	
2-10	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	S	S	NHEt	
2-11	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	S	S	NHC(OEt) <sub>2</sub> Me	
2-12	-CH(Me)CH(Me)-	H	S	S	NH <sub>2</sub>	-63,725
2-13	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	S	S	NHiPr	
2-14	-CH(Me)CH(Me)-	H	S	SO	NH <sub>2</sub>	-63,742
2-15	-CH(Me)CH(Me)-	H**	S	SO	NH <sub>2</sub>	
2-16	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	SO	S	NHiPr	
2-17	-CH <sub>2</sub> CHMe-	H	S	S	NH <sub>2</sub>	
2-18	-CH <sub>2</sub> CHMe-	H	S	S	N=CHOEt	
2-19	-CH <sub>2</sub> CHMe-	H	S	S	NHMe	
2-20	-CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -	CH <sub>3</sub>	S	S	NH <sub>2</sub>	
2-21	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CH <sub>3</sub>	S	SO	NH <sub>2</sub>	
2-22	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CH <sub>3</sub> **	S	SO	NH <sub>2</sub>	
2-23	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CH <sub>3</sub>	SO	SO	NH <sub>2</sub>	
2-24	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CH <sub>3</sub>	S	S	N=CHOEt	
2-25	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CH <sub>3</sub>	S	S	NHMe	
2-26	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CH <sub>3</sub>	S	SO	NHMe	
2-27	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CH <sub>3</sub> **	S	SO	NHMe	
2-28	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CH <sub>3</sub>	S	S	N=CMe(OEt)	
2-29	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CH <sub>3</sub>	S	S	NHEt	
2-30	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CH <sub>3</sub>	S	S	NH(OEt) <sub>2</sub> Me	
2-31	-CH(Me)CH(Me)-	CH <sub>3</sub>	S	S	NH <sub>2</sub>	
2-32	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CH <sub>3</sub>	S	S	NHiPr	
2-33	-CH(Me)CH(Me)-	CH <sub>3</sub>	S	SO	NH <sub>2</sub>	
2-34	-CH(Me)CH(Me)-	CH <sub>3</sub> **	S	SO	NH <sub>2</sub>	
2-35	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CH <sub>3</sub>	SO	S	NHiPr	
2-36	-CH <sub>2</sub> CHMe	CH <sub>3</sub>	S	S	NH <sub>2</sub>	
2-37	-CH <sub>2</sub> CHMe-	CH <sub>3</sub>	S	S	N=CHOEt	
2-38	-CH <sub>2</sub> CHMe-	CH <sub>3</sub>	S	S	NHMe	
2-39	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub>	S	S	NH <sub>2</sub>	
2-40	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub>	S	SO	NH <sub>2</sub>	
2-41	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub> **	S	SO	NH <sub>2</sub>	
2-42	-CH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> -	CF <sub>3</sub>	SO	SO	NH	
2-43	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub>	S	S	N=CHOEt	
2-44	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub>	S	S	NHMe	
2-45	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub>	S	SO	NHMe	

(continuación)

2-46	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub> **	S	SO	NHMe
2-47	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub>	S	S	N=CMe(OEt)
2-48	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub>	S	S	NHEt
2-49	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub>	S	S	NHC(OEt) <sub>2</sub> Me
2-50	-CH(Me)CH(Me)-	CF <sub>3</sub>	S	S	NH <sub>2</sub>
2-51	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub>	S	S	NHiPr
2-52	-CH(Me)CH(Me)-	CF <sub>3</sub>	S	SO	NH <sub>2</sub>
2-53	-CH(Me)CH(Me)-	CF <sub>3</sub> **	S	SO	NH <sub>2</sub>
2-54	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub>	SO	S	NHiPr
2-55	-CH <sub>2</sub> CHMe-	CF <sub>3</sub>	S	S	NH <sub>2</sub>
2-56	-CH <sub>2</sub> CHMe-	CF <sub>3</sub>	S	S	NHMe
2-57	-CH <sub>2</sub> CHMe-	CF <sub>3</sub>	S	S	NHMe
2-61	Et, Et	H	S	S	NH <sub>2</sub>
2-62	Et, Et	H	S	SO	NH <sub>2</sub>
2-63	Et, Et	CH <sub>3</sub>	S	S	NH <sub>2</sub>
2-64	Et, Et	CH <sub>3</sub>	S	SO	NH <sub>2</sub>
2-65	Et, Et	CH <sub>3</sub>	SO	SO	NH <sub>2</sub>
2-66	Et, Et	H	O	S	NH <sub>2</sub>
2-67	Et, Et	CH <sub>3</sub>	S	S	NH <sub>2</sub>
2-68	Et, Et	CF <sub>3</sub>	S	S	NH <sub>2</sub>
2-69	Et, Et	CF <sub>3</sub>	SO	S	NH <sub>2</sub>
2-70	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	O	S	NH <sub>2</sub>
2-71	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CH <sub>3</sub>	O	S	N <sub>2</sub>
2-72	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub>	O	S	NH <sub>2</sub>
2-73	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	S	S	N(Me)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>
2-74	Me, Me	H	S	S	NH <sub>2</sub>
2-75	Me, Me	H	S	SO	NH <sub>2</sub>
2-76	Me, Me	CH <sub>3</sub>	S	S	NH <sub>2</sub>
2-77	Me, Me	CH <sub>3</sub>	S	SO	NH <sub>2</sub>
2-78	Me, Me	CH <sub>3</sub>	SO	SO	NH <sub>2</sub>
2-79	Me, Me	H	O	S	NH <sub>2</sub>
2-80	Me, Me	CH <sub>3</sub>	S	S	NH <sub>2</sub>
2-81	Me, Me	CF <sub>3</sub>	S	S	NH <sub>2</sub>
2-82	Me, Me	CF <sub>3</sub>	SO	S	NH <sub>2</sub>
2-83	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	S	S	N(Me)CH=CH <sub>2</sub>
2-84	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	S	S	NHCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>
2-85	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	S	SO	NHCH <sub>2</sub> CCH
2-86	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	S	S	N(Me)CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>
2-87	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	S	S	N(Me)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH(SMe) <sub>2</sub>
2-88	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub>	S	S	NHCCH
2-89	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub>	S	S	N(Me)CCH
2-90	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	S	S	N(Me)CH <sub>2</sub> CH(SMe) <sub>2</sub>
2-91	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	S	S	N(Me)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH=NOEt
2-92	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	S	S	N(Me)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH=NNHCO Me
2-93	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	S	S	N(Me)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH(SMe) <sub>2</sub>
2-94	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub>	S	S	NHCCH
2-94	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	CF <sub>3</sub>	S	S	N(Me)CCH
2-96	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	S	S	N(Me)CH <sub>2</sub> CH(SMe) <sub>2</sub>
2-97	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	S	S	N(Me)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH=NOEt
2-98	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	S	S	N(Me)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH=NNHCO Me
2-99	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	S	SO	N(Me)CH <sub>2</sub> CH=N-NH-Co-NH(4-OCF <sub>3</sub> Ph)
2-100	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	H	SO	SO	N(Me)CH <sub>2</sub> CH=N-NH-CO-NH(4-OCF <sub>3</sub> Ph)

\*\* representa el diastereómero del compuesto anteriormente descrito

**Tabla 3:** Compuestos de fórmula I en los que los sustituyentes tienen los siguientes significados

R <sup>1</sup> es -CN, R <sup>2</sup> y R <sup>3</sup> son -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> , R <sup>6</sup> es -Cl, R <sup>5</sup> es -CF <sub>3</sub>						
Comp. Nº	W	R <sup>4</sup>	X	Y	Z	Pf o RMN <sup>19</sup> F
3-1	C-NHEt	H	S	S	NH <sub>2</sub>	-64,098
3-2	C-NHEt	H	S	SO	NH <sub>2</sub>	-64,109
3-3	C-N(Et) <sub>2</sub>	H	S	S	NH <sub>2</sub>	-63,915
3-4	C-N(Me) <sub>2</sub>	H	SO	SO	NH <sub>2</sub>	
3-5	C-N(Me) <sub>2</sub>	H	S	S	N=CHOEt	
3-6	C-NHMe	H	S	S	NHMe	
3-7	C-NHMe	H	S	SO	NHMe	
3-8	C-NHEt	CF <sub>3</sub>	S	SO	NHMe	
3-9	C-NH <sub>2</sub>	H	S	S	N=CMe(OEt)	
3-10	C-N(Me)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	H	S	S	NHEt	
3-11	C-N(Me) <sub>2</sub>	H	S	S	NHC(OEt) <sub>2</sub> Me	
3-12	N	H	S	S	NH <sub>2</sub>	
3-13	C-NHEt	H	S	S	NHiPr	
3-14	N	H	S	SO	NH <sub>2</sub>	
3-15	N	CH <sub>3</sub>	S	S	NH <sub>2</sub>	
3-16	C-NHEt	H	SO	S	NHiPr	
3-17	N	CH <sub>3</sub>	S	SO	NHMe	
3-18	N	CF <sub>3</sub>	S	S	NH <sub>2</sub>	
3-19	N	CF <sub>3</sub>	SO	S	NH <sub>2</sub>	
3-20	C-NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	S	S	NH <sub>2</sub>	
3-21	C-N(Me)CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	S	SO	NH <sub>2</sub>	
3-22	C-NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	S	SO	NH <sub>2</sub>	
3-23	C-NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	SO	SO	NH <sub>2</sub>	
3-24	C-N(Me)CH=CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	S	S	N=CHOEt	
3-25	C-N(Me)CH=CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	S	S	NHMe	
3-26	C-N(Me)CH=CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	S	SO	NHMe	
3-27	C-N(Me)CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	S	SO	NHMe	
3-28	C-NHEt	CH <sub>3</sub>	S	S	N=CMe(OEt)	
3-29	C-N(Et) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	S	S	NHEt	
3-30	C-NHMe	CH <sub>3</sub>	S	S	NH <sub>2</sub>	

- 5 **[0108]** Según una característica adicional de la presente invención, se proporciona un procedimiento para el control de plagas en un emplazamiento que comprende aplicar al anterior una cantidad eficaz de un compuesto de fórmula I o una de sus sales. Para este objetivo, se usa normalmente, por ejemplo, el mencionado compuesto en la forma de una composición plaguicida (es decir, en asociación con diluyentes o vehículos y/o agentes tensioactivos compatibles adecuados para el uso en las composiciones plaguicidas), según se describe a partir de ahora en el presente documento.
- 10 **[0109]** El término "compuesto de la invención" según se usa a partir de ahora en el presente documento abarca un compuesto de fórmula I según se ha definido anteriormente y una de sus sales plaguicidamente aceptable.
- 15 **[0110]** Un aspecto de la presente invención según se ha definido anteriormente es un procedimiento para el control de plagas en un emplazamiento. El emplazamiento incluye, por ejemplo, la propia plaga, el lugar (la planta, el campo, el bosque, el huerto, la vía fluvial, el suelo, el producto vegetal, o similares) en el que reside o se alimenta la plaga, o un lugar susceptible de futura infestación por la plaga. Se puede aplicar por tanto el compuesto de la invención directamente a la plaga, al lugar en el que la plaga reside o se alimenta, o al lugar susceptible de futura infestación por la plaga.
- 20 **[0111]** Como es evidente de los usos plaguicidas anteriores, la presente invención proporciona compuestos plaguicidamente activos y los procedimientos de uso de dichos compuestos para el control de numerosas especies de plagas que incluyen: artrópodos, especialmente insectos o ácaros, o nematodos de plantas. El compuesto de la invención puede de esta manera emplearse ventajosamente en usos prácticos, por ejemplo, en cultivos agrícolas u hortícolas, en usos forestales, en medicina veterinaria o cría de ganado, o en salud pública.
- 25

**[0112]** Se pueden usar los compuestos de la invención por ejemplo en las siguientes aplicaciones y en las siguientes plagas:

Para el control de los insectos del suelo, tales como el gusano de la raíz del maíz, las termitas (especialmente para la protección de estructuras), gusanos de las raíces, gusanos de elatéridos, gorgojos de la raíz, barrenadores del tallo, larvas de mariposas nocturnas, áfidos de la raíz, larvas. Pueden usarse también para proporcionar actividad contra nematodos patógenos de las plantas tales como, nematodos formadores de agallas, de quistes, excavadores, formadores de lesiones, o nematodos del tallo o del bulbo, o contra ácaros. Para el control de las plagas del suelo, por ejemplo, del gusano de la raíz del maíz, los compuestos se aplican ventajosamente a o se incorporan a una tasa eficaz en el suelo en cuyos cultivos se plantan o se van a plantar o a las semillas o a las raíces de las plantas en crecimiento.

**[0113]** En el área de la salud pública, los compuestos son especialmente útiles en el control de muchos insectos, especialmente moscas de la suciedad u otros plagas de Dípteros, tales como moscas domésticas, moscas de las cuadras, moscas soldado, moscas del cuerno, tábanos, tábanos del caballo, mosquitos pequeños, mosquitos de la arena, moscas negras, o mosquitos.

**[0114]** En la protección de los productos almacenados, por ejemplo, de los cereales, que incluyen el grano o la harina, cacahuetes, piensos para animales, maderas o enseres domésticos, por ejemplo, alfombras y telas, los compuestos de la invención son útiles contra el ataque por artrópodos, más especialmente, escarabajos, que incluyen gorgojos, polillas o ácaros, por ejemplo *Ephestia* spp (polillas de la harina), *Anthrenus* spp. (escarabajos de las alfombras), *Tribolium* spp. (escarabajos de la harina), *Sitophilus* spp. (gorgojos del grano) o *Acarus* spp (ácaros).

**[0115]** En el control de cucarachas, hormigas o termitas o plagas de artrópodos similares en establecimientos domésticos o industriales infestados o en el control de larvas de mosquitos en vías fluviales, pozos, depósitos u otras aguas corrientes o estancadas.

**[0116]** Para el tratamiento de cimientos, estructuras o suelo en la prevención del ataque de edificios por termitas, por ejemplo, *Reticulitermes* spp., *Heterotermes* spp., *Coptotermes* spp.

**[0117]** Además, se ha encontrado que los compuestos de la invención presentan una elevada acción insecticida contra insectos que destruyen materiales técnicos.

**[0118]** Como ejemplo y, preferiblemente – pero sin limitarse – se nombran los siguientes insectos  
Escarabajos tales como *Hylotrupes bajulus*, *Chlorophorus pilosis*, *Anobium punctatum*, *Xestobium rufovillosum*, *Ptilinus pecticornis*, *Dendrobium pertinex*, *Ernobius mollis*, *Priobium carpini*, *Lyctus brunneus*, *Lyctus africanus*, *Lyctus planicollis*, *Lyctus linearis*, *Lyctus pubescens*, *Trogoxylon aequale*, *Minthes rugicollis*, *Xyleborus spec.* *Tryptodendron spec.* *Apate monachus*, *Bostrychus capucins*, *Heterobostrychus brunneus*, *Sinoxylon spec.* *Dinoderus minutus*;

Himenópteros tales como *Sirex juvenicus*, *Urocerus gigas*, *Urocerus gigas taignus*, *Urocerus augur*;

Termitas tales como *Kaloterms flavicollis*, *Cryptotermes brevis*, *Heterotermes indicola*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes santonensis*, *Reticulitermes lucifugus*, *Mastotermes darwiniensis*, *Zootermopsis nevadensis*, *Coptotermes formosanus*;

Pez plateado tal como *Lepisma saccharina*.

Dentro del presente contexto se entiende que los materiales técnicos significan materiales no vivos tales como preferiblemente plásticos, adhesivos, colas, papel, cartón, cuero, madera, productos de fabricación de la madera y pinturas

**[0119]** Los compuestos de la invención se pueden usar al mismo tiempo para la protección contra la suciedad de los objetos, especialmente, los cascos de los buques, pantallas, redes, edificios, instalaciones de muelles y señales que entran en contacto con el mar o agua salobre.

**[0120]** Además, se pueden usar los compuestos de la invención en combinación con los otros compuestos activos como agentes antiensuciamiento.

**[0121]** Los compuestos activos son adecuados para el control de las zooplagas en la protección doméstica, de la higiene y del almacenamiento, especialmente los insectos, arácnidos y ácaros que aparecen en espacios cerrados tales como apartamentos, naves industriales, oficinas, cabinas de vehículos, etc. Se pueden usar solos o en combinación con otros compuestos activos y auxiliares en productos insecticidas domésticos para el control de

estas plagas. Son activos contra especies sensibles y resistentes así como contra todas las etapas de desarrollo. Estas plagas incluyen:

El orden Scorpionidea, por ejemplo, *Buthus occitanus*.

- 5 **[0122]** El orden Acarina, por ejemplo, *Argas persicus*, *Argas reflexus*, *Bryobia* ssp., *Dermanyssus gallinae*, *Glyciphagus domesticus*, *Ornithodoros moubat*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Trombicula alfreddugesi*, *Neutrombicula autumnalis*, *Dermatophagoides pteronissimus*, *Dermatophagoides farinae*.
- 10 **[0123]** El orden Araneae, por ejemplo, Aviculariidae, Araneidae.
- [0124]** El orden Opiliones, por ejemplo, *Pseudoscorpiones chelifer*, *Pseudoscorpiones cheiridium*, *Opiliones phalangium*.
- 15 **[0125]** El orden Isopoda, por ejemplo, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*.
- [0126]** El orden Diploda, por ejemplo, *Blaniulus guttulatus*, *Polydesmus* spp.
- [0127]** El orden Chilopoda, por ejemplo, *Geophilus* spp..
- 20 **[0128]** El orden Zygentoma, por ejemplo, *Ctenolepisma* spp., *Lepisma saccharina*, *Lepismodes inquilinus*.
- [0129]** El orden Blattaria, por ejemplo, *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Blattella asahinai*, *Leucophaea maderae*, *Panchlora* spp., *Parcoblatta* spp., *Periplaneta australasiae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Supella longipalpa*.
- 25 **[0130]** El orden Saltatoria, por ejemplo, *Acheta domesticus*.
- [0131]** El orden Dermaptera, por ejemplo, *Forficula auricularia*.
- 30 **[0132]** El orden Isoptera, por ejemplo, *Kaloterms* spp., *Reticulitermes* spp.
- [0133]** El orden Psocoptera, por ejemplo, *Lepinatus* spp., *Liposcelis* spp.
- 35 **[0134]** El orden Coleoptera, por ejemplo, *Anthrenus* spp., *Attagenus* spp., *Dermestes* spp., *Latheticus oryzae*, *Necrobia* spp., *Ptinus* spp. *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus granarius*, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Stegobium paniceum*
- 40 **[0135]** El orden Diptera, por ejemplo, *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes taeniorhynchus*, *Anopheles* spp., *Calliphora erythrocephala*, *Chrysozona pluvialis*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex pipiens*, *Culex tarsalis*, *Drosophila* spp., *Fannia canicularis*, *Musca domestica*, *Phlebotomus* spp., *Sarcophaga carnaria*, *Simulium* spp., *Stomoxys calcitrans*; *Tipula paludosa*.
- 45 **[0136]** El orden Lepidoptera, por ejemplo, *Achroia grisella*, *Galleria mellonella*, *Plodia interpunctella*, *Tinea cloacella*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*.
- [0137]** El orden Siphonaptera, por ejemplo, *Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, *Xenopsylla cheopis*.
- 50 **[0138]** El orden Hymenoptera, por ejemplo, *Camponotus herculeanus*, *Lasius fuliginosus*, *Lasius niger*, *Lasius umbratus*, *Monomorium pharaonis*, *Paravespula* spp., *Tetramorium caespitum*.
- [0139]** El orden Anoplura, por ejemplo, *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pemphigus* spp., *Phylloera vastatrix*, *Phthirus pubis*.
- 55 **[0140]** El orden Heteroptera, por ejemplo, *Cimex hemipterus*, *Cimex lectularius*, *Rhodinus prolixus*, *Triatoma infestans*.
- [0141]** El uso en el sector insecticida doméstico se lleva a cabo solo o en combinación con otros compuestos activos adecuados tales como fosfatos, carbamatos, piretroides, neonicotinoides, reguladores del crecimiento o

compuestos activos de otras clases conocidas de insecticidas.

- 5 **[0142]** El uso se lleva a cabo con aerosoles, agentes no presurizados, por ejemplo, pulverizadores de bomba y polvo, nebulizadores, productores de niebla, espumantes, geles, productos para la evaporación con plaquetas de evaporación de celulosa o plástico, evaporadores líquidos, evaporadores de gel y membrana, evaporadores impulsados por propelentes, sistemas de evaporación sin energía o pasivos, papeles atrapamoscas, trampas para moscas, geles para moscas, como granulados o polvos, en cebos de dispersión o estaciones de cebos.
- 10 **[0143]** En agricultura, contra adultos, larvas y huevos de Lepidoptera (mariposas y polillas), por ejemplo *Heliothis* spp. Tal como *Heliothis virescens* (gusano de las yemas del tabaco), *Heliothis armigera* y *Heliothis zea*. Contra adultos y larvas de Coleoptera (escarabajos), por ejemplo *Anthonomus* spp., por ejemplo, *grandis* (gorgojo del algodonero), *Leptinotarsa decemlineata* (escarabajo de la patata de Colorado), *Diabrotica* spp., (gusanos de la raíz del maíz). Contra Heteroptera (Hemiptera y Homoptera) por ejemplo, *Psylla* spp., *Bemisia* spp., *Trialeurodes* spp., *Aphis* spp., *Myzus* spp., *Megoura viciae*, *Phylloxera* spp., *Nephotettix* spp., (saltamontes de la hoja de arroz), *Nilaparvata* spp.
- 15 **[0144]** Contra Diptera, por ejemplo, *Musca* spp. Contra Thysanoptera tal como *Thrips tabaci*. Contra Orthoptera tal como *Locusta* y *Schistocerca* spp., (langostas y grillos), por ejemplo, *Gryllus* spp., y *Acheta* spp. por ejemplo, *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Blatella germanica*, *Locusta migratoria migratorioides*, y *Schistocerca gregaria*. Contra Collembola, por ejemplo, *Periplaneta* spp. y *Blatella* spp. (cucarachas).
- 20 **[0145]** Contra artrópodos de significación agrícola tales como Acari (ácaros), por ejemplo *Tetranychus* spp., y *Panonychus* spp.
- 25 **[0146]** Contra nematodos que atacan plantas o árboles de importancia para la agricultura, el uso forestal o la horticultura tanto de manera directa como diseminando enfermedades bacterianas, víricas, por micoplasmas o fúngicas de las plantas. Por ejemplo, los nematodos formadores de agallas tales como *Meloidogyne* spp. (por ejemplo, *M. incognita*).
- 30 **[0147]** En el campo de la medicina veterinaria o de la cría de ganado o en el mantenimiento de la salud pública contra los artrópodos, que son parásitos tanto internos como externos de los vertebrados, particularmente de vertebrados de sangre caliente, por ejemplo, de animales domésticos, por ejemplo, ganado, cabras, equinos, porcinos, aves de corral, perros o gatos, por ejemplo Acarina, incluyendo garrapatas (por ejemplo, garrapatas de cuerpo blando que incluyen *Argasidae* spp., por ejemplo, *Argas* spp. y *Ornithodoros* spp. (por ejemplo, *Ornithodoros moubata*); garrapatas de cuerpo duro que incluyen *Ixodidae* spp., por ejemplo, *Boophilus* spp., por ejemplo, *Boophilus microplus*, *Rhipicephalus* spp., por ejemplo, *Rhipicephalus appendiculatus* y *Rhipicephalus sanguineus*; ácaros (por ejemplo, *Damalinea* spp.); pulgas (por ejemplo, *Ctenocephalides* spp., por ejemplo, *Ctenocephalides felis* (pulga del gato) y *Ctenocephalides canis* (pulga del perro)); piojos, por ejemplo, *Menopon* spp.; Diptera (por ejemplo, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Musca* spp., *Hypoderma* spp.); Hemiptera.; Dictyoptera (por ejemplo, *Periplaneta* spp., *Blatella* spp.); Hymenoptera; por ejemplo, contra infecciones del tracto gastrointestinal producidas por gusanos nematodos parásitos, por ejemplo, los miembros de la familia *Trichostrongylidae*.
- 35 **[0148]** Un aspecto preferido de la invención se refiere al uso de compuestos de fórmula I en la preparación de un medicamento para el control de parásitos de animales. Preferiblemente, el animal es un animal doméstico de compañía tal como un perro o un gato.
- 40 **[0149]** Los parásitos que se van a controlar incluyen, por ejemplo:  
El orden Anoplurida, por ejemplo, *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phtirus* spp., *Solenopotes* spp.
- 45 **[0150]** El orden Mallophagida y los subórdenes Amblycerina e Ischnocerina, por ejemplo, *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Damalinea* spp., *Trichodectes* spp., *Felicola* spp.
- 50 **[0151]** El orden Diptera y los subórdenes Nematocerina y Brachyicerina por ejemplo *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Simulium* spp., *Eusimulium* spp., *Phlebotomus* spp., *Lutzomyia* spp., *Culicoides* spp., *Chrysops* spp., *Hybomitra* spp., *Atylotus* spp., *Tabanus* spp., *Haematopota* spp., *Philipomyia* spp., *Braula* spp., *Musca* spp., *Hydrotaea* spp., *Stomoxys* spp., *Haematobia* spp., *Morellia* spp., *Fannia* spp., *Glossina* spp., *Calliphora* spp.,

Lucilia spp., Chrysomyia spp., Wohlfahrtia spp., Sarcophaga spp., Oestrus spp., Hypoderma spp., Gasterophilus spp., Hippobosca spp., Lipoptena spp., Melophagus spp.

5 [0152] El orden Siphonapterida, por ejemplo, Pulex spp., Ctenocephalides spp., Xenopsylla spp., Ceratophyllus spp.

[0153] El orden Heteropterida, por ejemplo, Cimex spp., Triatoma spp., Rhodnius spp., Panstrongylus spp.

10 [0154] El orden Blattarida, por ejemplo, Blatta orientalis, Periplaneta americana, Blattella germanica, Supella spp.

[0155] La subclase Acari (Acarina) y el orden Meta y Mesostigmata por ejemplo Argas spp., Ornithodoros spp., Otobius spp., Ixodes spp., Amblyomma spp., Boophilus spp., Dermacentor spp., Haemophysalis spp., Hyalomma spp., Rhipicephalus spp., Dermanyssus spp., Raillietia spp., Pneumonyssus spp., Sternostoma spp., Varroa spp.

15 [0156] El orden Actiniedida (Prostigmata) y Acaridida (Astigmata), por ejemplo, Acarapis spp., Cheyletiella spp., Ornithocheyletia spp., Myobia spp., Psorergates spp., Demodex spp., Trombicula spp., Listrophorus spp., Acarus spp., Tyrophagus spp., Caloglyphus spp., Hypodectes spp., Pterolichus spp., Psoroptes spp., Chorioptes spp., Otodectes spp., Sarcoptes spp., Notoedres spp., Knemidocoptes spp., Cytodites spp., Laminosioptes spp.

20 [0157] Los compuestos de la invención de estructura (1) son también adecuados para el uso en la preparación de un medicamento para el control de artrópodos que afectan a los animales agrícolas tales como ganado, cabras, caballos, cerdos, burros, camellos, búfalos, conejos, pollos, pavos, patos, gansos, abejas, otros animales domésticos tales como perros, gatos, pájaros de jaula, peces de acuario así como los así denominados animales experimentales tales como hámsters, cobayas, ratas y ratones. Mediante el control de estos artrópodos se  
25 reducirán las tasas de mortandad y la pérdida de rendimiento (en carne, leche, lana, cueros, huevos, miel, etc) de tal manera que será posible una cría animal más económica y sencilla mediante el uso de los compuestos de la invención.

30 [0158] Los compuestos activos en el sector veterinario y la cría animal son adecuados para la administración mediante administración entérica en forma de, por ejemplo, comprimidos, cápsulas, bebidas, pócimas, granulados, pastas, bolos, procedimientos a través de alimentos, supositorios, por administración parenteral mediante, por ejemplo, inyección (intramuscular, subcutánea, intravenosa, intraperitoneal, entre otras), implantes, mediante  
35 aplicación nasal, mediante administración dérmica en forma de, por ejemplo, baño de desinfección, pulverización, fríega dorsal continua y fríega dorsal puntual, lavado, espolvoreado, y con la ayuda de accesorios que contienen los compuestos activos tales como collares, crótalos, marcadores de la cola, bandas de las extremidades, cabestros, dispositivos de marcado, etc.

40 [0159] En ganado, aves de corral, animales domésticos, etc., los compuestos activos de estructura (1) son adecuados para el uso como formulaciones (por ejemplo, en polvo, emulsiones, agentes fluidos) que contienen los compuestos activos en una cantidad de 1 a 80% en peso, directamente o tras una dilución de 100 a 10.000 veces o como un baño químico.

45 [0160] En un aspecto adicional de la invención, los compuestos de fórmula I o sus sales o composiciones se usan para la preparación de un medicamento veterinario.

[0161] Una característica adicional de la invención se refiere por tanto al uso de un compuesto de fórmula I o una de sus sales, o una de sus combinaciones, en la preparación de un medicamento para el control de las plagas como ya se ha mencionado anteriormente:

50 Las plagas nombradas anteriores incluyen por ejemplo:  
el orden Anoplura (Phthiraptera), por ejemplo, Damalinia spp., Haematopinus spp., Linognathus spp., Pediculus spp., Trichodectes spp.

55 [0162] La clase de los Arácnidos, por ejemplo, Acarus siro, Aceria sheldoni, Aculops spp., Aculus spp., Amblyomma spp., Argas spp., Boophilus spp., Brevipalpus spp., Bryobia praetiosa, Chorioptes spp., Dermanyssus gallinae, Eotetranychus spp., Epirimerus pyri, Eutetranychus spp., Eriophyes spp., Hemitarsonemus spp., Hyalomma spp., Ixodes spp., Latrodectus mactans, Metatetranychus spp., Oligonychus spp., Ornithodoros spp., Panonychus spp., Phyllocoptura oleivora, Polyphagotarsonemus latus, Psoroptes spp., Rhipicephalus spp., Rhizoglyphus spp., Sarcoptes spp., Scorpio maurus, Stenotarsonemus spp., Tarsonemus spp., Tetranychus spp., Vasates lycopersici.

[0163] La clase de los Bivalvos, por ejemplo, *Dreissena* spp.

[0164] El orden Chilopoda, por ejemplo, *Geophilus* spp., *Scutigera* spp.

[0165] El orden Coleoptera, por ejemplo, *Acanthoscelides obtectus*, *Adoretus* spp., *Agelastica alni*, *Agriotes* spp., *Amphimallon solstitialis*, *Anobium punctatum*, *Anoplophora* spp., *Anthonomus* spp., *Anthrenus* spp., *Apogonia* spp., *Atomaria* spp., *Attagenus* spp., *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp., *Ceuthorhynchus* spp., *Cleonus mendicus*, *Conoderus* spp., *Cosmopolites* spp., *Costelytra zealandica*, *Curculio* spp., *Cryptorhynchus lapathi*, *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp., *Epilachna* spp., *Faustinus cubae*, *Gibbium psyllioides*, *Heteronychus arator*, *Hylamorpha elegans*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera postica*, *Hypothenemus* spp., *Lachnosterna consanguinea*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lixus* spp., *Lyctus* spp., *Meligethes aeneus*, *Melolontha melolontha*, *Migdolus* spp., *Monochamus* spp., *Naupactus xanthographus*, *Niptus hololeucus*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Otiorrhynchus sulcatus*, *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllophaga* spp., *Popillia japonica*, *Premnotrypes* spp., *Psylliodes chrysocephala*, *Ptinus* spp., *Rhizobius ventralis*, *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus* spp., *Sphenophorus* spp., *Sternechus* spp., *Symphyletes* spp., *Tenebrio molitor*, *Tribolium* spp., *Trogoderma* spp., *Tychius* spp., *Xylotrechus* spp., *Zabrus* spp.

[0166] El orden Collembola, por ejemplo, *Onychiurus armatus*.

[0167] El orden Dermaptera, por ejemplo, *Forficula auricularia*.

[0168] El orden Diplopoda, por ejemplo, *Blaniulus guttulatus*.

[0169] El orden Diptera, por ejemplo, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Bibio hortulanus*, *Calliphora erythrocephala*, *Ceratitis capitata*, *Chrysomyia* spp., *Cochliomyia* spp., *Cordylobia anthropophaga*, *Culex* spp., *Cuterebra* spp., *Dacus oleae*, *Dermatobia hominis*, *Drosophila* spp., *Fannia* spp., *Gastrophilus* spp., *Hylemyia* spp., *Hyppobosca* spp., *Hypoderma* spp., *Liriomyza* spp., *Lucilia* spp., *Musca* spp., *Nezara* spp., *Oestrus* spp., *Oscinella frit*, *Pegomyia hyoscyami*, *Phorbia* spp., *Stomoxys* spp., *Tabanus* spp., *Tannia* spp., *Tipula paludosa*, *Wohlfahrtia* spp.

[0170] La clase Gastropoda, por ejemplo, *Arion* spp., *Biomphalaria* spp., *Bulinus* spp., *Deroceras* spp., *Galba* spp., *Lymnaea* spp., *Oncomelania* spp., *Succinea* spp.

[0171] La clase de los Helmintos, por ejemplo, *Ancylostoma duodenale*, *Ancylostoma ceylanicum*, *Acylostoma braziliensis*, *Ancylostoma* spp., *Ascaris lubricoides*, *Ascaris* spp., *Brugia malayi*, *Brugia timori*, *Bunostomum* spp., *Chabertia* spp., *Clonorchis* spp., *Cooperia* spp., *Dicrocoelium* spp., *Dictyocaulus filaria*, *Diphyllobothrium latum*, *Dracunculus medinensis*, *Echinococcus granulosus*, *Echinococcus multilocularis*, *Enterobius vermicularis*, *Faciola* spp., *Haemonchus* spp., *Heterakis* spp., *Hymenolepis nana*, *Hyostrogylus* spp., *Loa Loa*, *Nematodirus* spp., *Oesophagostomum* spp., *Opisthorchis* spp., *Onchocerca volvulus*, *Ostertagia* spp., *Paragonimus* spp., *Schistosoma* spp., *Strongyloides fuelleborni*, *Strongyloides stercoralis*, *Strongyloides* spp., *Taenia saginata*, *Taenia solium*, *Trichinella spiralis*, *Trichinella nativa*, *Trichinella britovi*, *Trichinella nelsoni*, *Trichinella pseudopsiralis*, *Trichostrongylus* spp., *Trichuris trichuria*, *Wuchereria bancrofti*.

[0172] Adicionalmente se pueden controlar protozoos tales como *Eimeria*.

[0173] El orden Heteroptera, por ejemplo, *Anasa tristis*, *Antestiopsis* spp., *Blissus* spp., *Calocoris* spp., *Campylomma livida*, *Cavelerius* spp., *Cimex* spp., *Creontiades dilutus*, *Dasynus piperis*, *Dichelops furcatus*, *Diconocoris hewetti*, *Dysdercus* spp., *Euschistus* spp., *Eurygaster* spp., *Heliopeltis* spp., *Horcias nobilellus*, *Leptocoris* spp., *Leptoglossus phyllopus*, *Lygus* spp., *Macropes excavatus*, *Miridae*, *Nezara* spp., *Oebalus* spp., *Pentomidae*, *Piesma quadrata*, *Piezodorus* spp., *Psallus seriatus*, *Pseudacysta perseae*, *Rhodnius* spp., *Sahlbergella singularis*, *Scotinophora* spp., *Stephanitis nashi*, *Tibraca* spp., *Triatoma* spp.

[0174] El orden Homoptera, por ejemplo, *Acyrtosiphon* spp., *Aeneolamia* spp., *Agonoscena* spp., *Aleurodes* spp., *Aleurolobus barodensis*, *Aleurothrix* spp., *Amrasca* spp., *Anuraphis cardui*, *Aonidiella* spp., *Aphanostigma piri*, *Aphis* spp., *Arboridia apicalis*, *Aspidiotus* spp., *Aspidiotus* spp., *Atanus* spp., *Aulacorthum solani*, *Bemisia* spp., *Brachycaudus helichrysi*, *Brachycolus* spp., *Brevicoryne brassicae*, *Calligypona maiginata*, *Carneiocephala fulgida*, *Ceratovacuna lanigera*, *Cercopidae*, *Ceroplastes* spp., *Chaetosiphon fragaefolii*, *Chionaspis tegalensis*, *Chlorita onukii*, *Chromaphis juglandicola*, *Chrysomphalus ficus*, *Cicadulina mbila*, *Coccoxystus halli*, *Coccus* spp., *Cryptomyzus ribis*, *Dalbulus* spp., *Dialeurodes* spp., *Diaphorina* spp., *Diaspis* spp., *Doralis* spp., *Drosicha* spp.,



- Dysaphis spp., Dysmicoccus spp., Empoasca spp., Eriosoma spp., Erythroneura spp., Euscelis bilobatus, Geococcus coffeae, Homalodisca coagulata, Hyalopterus arundinis, Icerya spp., Idiocerus spp., Idioscopus spp., Laodelphax striatellus, Lecanium spp., Lepidosaphes spp., Lipaphis erysimi, Macrosiphum spp., Mahanarva fimbriolata, Melanaphis sacchari, Metcalfiella spp., Metopolophium dirhodum, Monellia costalis, Monelliopsis pecanis, Myzus spp., Nasonovia ribisnigri, Nephrotettix spp., Nilaparvata lugens, Oncometopia spp., Orthezia praelonga, Parabemisia myricae, Paratrioza spp., Parlatoria spp., Pemphigus spp., Peregrinus maidis, Phenacoccus spp., Phloeomyzus passerinii, Phorodon humuli, Phylloxera spp., Pinnaspis aspidistrae, Planococcus spp., Protospulvinaria pyriformis, Pseudaulacaspis pentagona, Pseudococcus spp., Psylla spp., Pteromalus spp., Pyrrilla spp., Quadraspidotus spp., Quesada gigas, Rastrococcus spp., Rhopalosiphum spp., Saissetia spp., Scaphoides titanus, Schizaphis graminum, Selenaspis articulatus, Sogatata spp., Sogatella furcifera, Sogatodes spp., Stictocephala festina, Tenalaphara malayensis, Tinocallis caryaefoliae, Tomaspis spp., Toxoptera spp., Trialeurodes vaporariorum, Trioza spp., Typhlocyba spp., Unaspis spp., Viteus vitifolii.
- 5 [0175] El orden Hymenoptera, por ejemplo, Diprion spp., Hoplocampa spp., Lasius spp., Monomorium pharaonis, Vespa spp.
- [0176] El orden Isopoda, por ejemplo, Armadillidium vulgare, Oniscus asellus, Porcellio scaber.
- 20 [0177] El orden Isoptera, por ejemplo, Reticulitermes spp., Odontotermes spp.
- [0178] El orden Lepidoptera, por ejemplo, Acronicta major, Aedia leucomelas, Agrotis spp., Alabama argillacea, Anticarsia spp., Barathra brassicae, Bucculatrix thurberiella, Bupalus piniarius, Cacoecia podana, Capua reticulana, Carpocapsa pomonella, Cheimatoxia brumata, Chilo spp., Choristoneura fumiferana, Clysia ambiguella, Cnaphalocerus spp., Earias insulana, Ephestia kuehniella, Euproctis chrysothorax, Euxoa spp., Feltia spp., Galleria mellonella, Helicoverpa spp., Heliothis spp., Hofmannophila pseudospretella, Homona magnanima, Hyponomeuta padella, Laphygma spp., Lithocolletis blancardella, Lithophane antennata, Loxagrotis albicosta, Lymantria spp., Malacosoma neustria, Mamestra brassicae, Mocis repanda, Mythimna separata, Oria spp., Oulema oryzae, Panolis flammea, Pectinophora gossypiella, Phyllocnistis citrella, Pieris spp., Plutella xylostella, Prodenia spp., Pseudaletia spp., Pseudoplusia includens, Pyrausta nubilalis, Spodoptera spp., Thermesia gemmatilis, Tinea pellionella, Tineola bisselliella, Tortrix viridana, Trichoplusia spp.
- 25 [0179] El orden Orthoptera, por ejemplo, Acheta domesticus, Blatta orientalis, Blattella germanica, Gryllotalpa spp., Leucophaea maderae, Locusta spp., Melanoplus spp., Periplaneta americana, Schistocerca gregaria.
- 30 [0180] El orden Siphonaptera, por ejemplo, Ceratophyllus spp., Xenopsylla cheopis.
- [0181] El orden Symphyla, por ejemplo, Scutigera immaculata.
- [0182] El orden Thysanoptera, por ejemplo, Baliothrips biformis, Enneothrips flavens, Frankliniella spp., Heliothrips spp., Hercinothrips femoralis, Kakothrips spp., Rhipiphorothrips cruentatus, Scirtothrips spp., Taeniothrips cardamoni, Thrips spp.
- 40 [0183] El orden Thysanura, por ejemplo Lepisma saccharina.
- 45 [0184] Los nematodos parásitos de plantas incluyen, por ejemplo, Anguina spp., Aphelenchoides spp., Belonoaimus spp., Bursaphelenchus spp., Ditylenchus dipsaci, Globodera spp., Heliocotylenchus spp., Heterodera spp., Longidorus spp., Meloidogyne spp., Pratylenchus spp., Radopholus similis, Rotylenchus spp., Trichodorus spp., Tylenchorhynchus spp., Tylenchulus spp., Tylenchulus semipenetrans, Xiphinema spp.
- 50 [0185] Los compuestos de estructura (I) de la invención se caracterizan particularmente por una fuerte acción contra áfidos (por ejemplo, Aphis gossypii and Myzus persicae), larvas de escarabajos (por ejemplo, Phaedon cochleariae), orugas de mariposas (por ejemplo, Plutella xylostella, Spodoptera exigua y Spodoptera frugiperda).
- 55 [0186] Se pueden usar también opcionalmente los compuestos de la invención en determinadas concentraciones o cantidades de aplicación como herbicidas, protectores, reguladores del crecimiento, o como agentes para mejorar las propiedades de las plantas o como microbiocidas, por ejemplo, como fungicidas, antimicóticos, bactericidas, viricidas (que incluyen agentes contra viroides) o como agentes contra MLO (organismo de tipo Micoplasma) y RLO (organismo de tipo Rickettsia). Se pueden usar también opcionalmente como intermedios o precursores para la síntesis de compuestos activos adicionales.

5 **[0187]** Se pueden tratar todas las plantas y partes de las plantas según la invención. Se entiende por tanto que plantas significa todas las plantas y poblaciones de plantas tales como las plantas silvestres deseables e indeseables o cultígenos (que incluyen cultígenos que se producen naturalmente). Los cultígenos pueden ser procedimientos de biotecnología o de genomanipulación o combinaciones de estos procedimientos, que incluyen plantas transgénicas y que incluyen variedades que son protegibles o no protegibles por las leyes de protección de variedades de plantas. Se entiende que partes de las plantas son todas las partes por encima del terreno y por debajo del terreno y los órganos de las plantas tales como injertos, la hoja, la flor y la raíz, incluyendo, por ejemplo, 10 las hojas, las agujas, los pedículos, los tallos, las flores, los cuerpos frutales, los frutos y las semillas así como las raíces, los bulbos, los rizomas. Los cultivos cosechados, así como, el material de reproducción vegetativo y generativo, por ejemplo, los esquejes, los bulbos, los rizomas, los brotes y las semillas forman parte también de las partes de las plantas.

15 **[0188]** En el uso práctico para el control de artrópodos especialmente de insectos y ácaros, o de helmintos, especialmente de plagas de nematodos de las plantas, un procedimiento, por ejemplo, comprende aplicar a las plantas o al medio en el que crecen una cantidad eficaz de un compuesto de la invención. Para dicho procedimiento, el compuesto de la invención se aplica generalmente al emplazamiento en el que se va a controlar la infestación de artrópodos y nematodos a una tasa eficaz en el intervalo de aproximadamente 2 g a 20 aproximadamente 1 kg del compuesto activo por hectárea de emplazamiento tratado. En condiciones ideales, dependiendo de la plaga que se va a controlar una tasa más baja puede ofrecer protección adecuada. Por otra parte, las condiciones atmosféricas adversas, la resistencia de la plaga u otros factores pueden requerir que el ingrediente activo se use a tasas más elevadas. La tasa óptima depende normalmente de numerosos factores, por ejemplo, del tipo de plaga que se está controlando, del tipo o de la etapa de crecimiento de la planta infestada, de 25 la separación de las hileras o también del procedimiento de aplicación. Preferiblemente, un intervalo de tasa eficaz del compuesto activo está entre aproximadamente 10 g/ha a aproximadamente 400 g/ha, más preferiblemente entre aproximadamente 50 g/ha y aproximadamente 200 g/ha.

30 **[0189]** Cuando una plaga se transmite a través del suelo, el compuesto activo generalmente en una composición formulada, se distribuye suavemente sobre el área que se va a tratar (es decir, por ejemplo, tratamiento por difusión o en bandas) de cualquier manera conveniente y se aplica a tasas de aproximadamente 10 g ia/ha a aproximadamente 400 g ia/ha, preferiblemente de aproximadamente 50 g ia/h a aproximadamente 200 g ia/ha ("ia" significa "ingrediente activo"). Cuando se aplica como inmersión de la raíz de plántulas o riego por goteo a plantas, la disolución o la suspensión líquida contiene de aproximadamente 0,075 a aproximadamente 1000 mg ia/l, 35 preferiblemente de aproximadamente 25 a aproximadamente 200 mg ia/l. se puede realizar la aplicación, si se desea, al campo o al área de crecimiento del cultivo generalmente o en estrecha proximidad a las semillas o a las plantas que se van a proteger del ataque. Se puede lavar el compuesto de la invención en el suelo mediante pulverización con agua sobre el área o se puede dejar a la acción natural de la precipitación. Durante o después de la aplicación, el compuesto formulado puede, si se desea, distribuirse mecánicamente en el suelo, por ejemplo, mediante arado, arado de disco, o uso de cadenas de arrastre. La aplicación puede ser antes de la plantación, en la plantación, después de la plantación pero antes de que tenga lugar la brotación, o después de la brotación. 40

45 **[0190]** El compuesto de la invención y los procedimientos de control de plagas de la misma son de particular valor en la protección del campo, del forraje, de la plantación, del invernadero, del huerto o de los cultivos de viñas, de los cultivos ornamentales, o de la plantación de árboles forestales, por ejemplo: de cereales (tales como trigo o arroz), algodón, vegetales (tales como de pimientas), campos de cultivos (tales como de remolacha azucarera, soja o aceite de colza), cultivos de pastizales o forraje (tales como maíz o sorgo), huertos o arboledas (tales como de piedra o pepitas de fruta o cítricos), plantas ornamentales, flores o vegetales o arbustos bajo vidrio o en jardines o parques, o árboles forestales (de hoja caduca y perenne), en bosques, plantaciones o arboretos. 50

**[0191]** Son también valiosos en la protección de la madera (en pie, talada, procesada, almacenada o estructural) del ataque, por ejemplo, por moscas de sierra o escarabajos o termitas.

55 **[0192]** Tienen aplicaciones en la protección de productos almacenados tales como granos, frutos, nueces, espigas o tabaco, tanto completos, molidos o compuestos en productos, del ataque de polillas, escarabajos, ácaros o gorgojos del grano. Están protegidos también los productos animales almacenados tales como pieles, pelos, lana o plumas en forma natural o procesada (por ejemplo, como alfombras o telas) del ataque de polillas o escarabajos así como la carne, pescado o granos almacenados del ataque de escarabajos, ácaros o moscas.

**[0193]** Adicionalmente, el compuesto de la invención y sus procedimientos de uso son de particular valor en el control de artrópodos o helmintos que son perjudiciales para, o se diseminan o actúan como vectores de enfermedades de animales domésticos, por ejemplo, de aquellas mencionadas anteriormente en el presente documento, y más especialmente en el control de garrapatas, ácaros, piojos, pulgas, mosquitos, o mordeduras, perjuicios o moscas que producen miasis.

**[0194]** Los compuestos de la invención son particularmente útiles en la preparación de un medicamento para controlar los artrópodos o helmintos que están presentes en el interior de animales hospedadores domésticos o que se alimentan en o sobre la piel o chupan la sangre del animal, para cuyo objetivo son adecuados para la administración oral, parenteral, percutánea o tópica.

**[0195]** Las composiciones descritas a partir de ahora en el presente documento para aplicación a cultivos en crecimiento o a emplazamientos en los que crecen cultivos o como impregnación de semillas pueden, en general, emplearse alternativamente en la protección de productos almacenados, enseres domésticos, propiedad o áreas del entorno general. Los medios adecuados de aplicación de los compuestos de la invención incluyen:

Hacer crecer cultivos como con pulverizaciones foliares (por ejemplo como con pulverizaciones en surco), polvos, gránulos, nieblas o espumas o también como con suspensiones o con composiciones finamente divididas o encapsuladas como tratamiento para el suelo o las raíces, mediante empapamiento de líquido, polvos, gránulos, humos o espumas; a siembras de cultivos mediante aplicación como impregnaciones de semillas, por ejemplo, mediante suspensiones líquidas o polvos;

A animales infestados por o expuestos a infestación por artrópodos o helmintos, mediante aplicación parenteral, oral o tópica de composiciones en las que el ingrediente activo presenta una acción inmediata y/o prolongada durante un periodo de tiempo contra los artrópodos o helmintos, por ejemplo, mediante incorporación en la alimentación o en formulaciones farmacéuticas ingeribles oralmente adecuadas, cebos comestibles, sal para lamer, suplementos dietarios, formulaciones para friega dorsal continua, pulverizadores, baños, baños de inmersión, duchas, chorros, polvos, gases, champús, cremas, frotis céreos o sistemas de autotratamiento para ganado;

Al entorno en general o a localizaciones específicas en las que las plagas pueden estar al acecho, que incluyen productos almacenados, madera, enseres domésticos, o establecimientos domésticos o industriales, como pulverizadores, neblinas, polvos, humos, frotis céreos, lacas, gránulos, o cebos, o en alimentaciones por goteo para vías fluviales, pozos, depósitos u otras aguas corrientes o estancadas.

**[0196]** Los compuestos de fórmula I son particularmente adecuados para la administración oral, y en un aspecto preferido adicional de la invención, se usan los compuestos de fórmula Ia o Ib en la preparación de un medicamento para el control de los parásitos de animales que es administrable oralmente. Los compuestos de fórmula I o sus sales son adecuados para la administración, antes, durante o después de las comidas, los compuestos de fórmula I o sus sales se pueden mezclar con un vehículo y/o comestible.

**[0197]** El compuesto de fórmula I o su sal es adecuado para la administración oral al animal en un intervalo de dosis generalmente entre 0,1 y 500 mg/kg del compuesto de fórmula Ia o Ib o su sal por kilogramo de peso corporal del animal (mg/kg).

**[0198]** En el animal, preferiblemente el animal doméstico, el compuesto de fórmula I o su sal es adecuado para la administración generalmente entre aproximadamente una vez por semana a aproximadamente una vez por año, preferiblemente entre aproximadamente una vez cada dos semanas a una vez cada tres meses.

**[0199]** Los compuestos de la invención son adecuados para la administración con otro material parasiticidamente eficaz, tal como un endoparasiticida, y/o un ectoparasiticida, y/o un endectoparasiticida. Por ejemplo, dichos compuestos incluyen lactonas macrocíclicas tales como avermectinas o milbemicinas, por ejemplo, ivermectina, piratel o un regulador del crecimiento de los insectos tal como lufenuron o metopreno.

**[0200]** Se pueden emplear también los compuestos de fórmula I para controlar organismos perjudiciales en cultivos de plantas genomanipuladas conocidas o de plantas genomanipuladas aún por desarrollar. Como regla, las plantas transgénicas se distinguen por propiedades específicamente ventajosas, por ejemplo, por resistencias a agentes particulares de protección de cultivos, resistencias a enfermedades de plantas o patógenos de enfermedades de plantas, tales como insectos o microorganismos particulares tales como hongos, bacterias o virus. Otras propiedades particulares se refieren, por ejemplo, al material cosechado con respecto a la cantidad, calidad, propiedades de almacenamiento, composición y constituyentes específicos. De esta manera, se conocen plantas transgénicas en las que está aumentado el contenido de almidón, o está alterada la calidad del almidón, o

en las que el material cosechado tiene una diferente composición de ácidos grasos.

**[0201]** Todas las plantas que han recibido mediante genomanipulación, material genético modificado que imparte propiedades valiosas particularmente ventajosas ("rasgos") a estas plantas pertenecen a las plantas transgénicas (obtenidas mediante genomanipulación) o variedades de plantas que se van a tratar preferiblemente según la invención. Ejemplos de dichas propiedades son crecimiento de la planta mejorado, aumento de la tolerancia hacia temperaturas altas o bajas, aumento de la tolerancia hacia la sequía o hacia el contenido salino del agua o el suelo, rendimiento mejorado de la floración, cosecha simplificada, maduración acelerada, aumentos del rendimiento de la cosecha, mejora de la calidad y/o valor nutricional del cultivo, mejor vida en almacenamiento y/o procesamiento del cultivo. Ejemplos adicionales y con particular énfasis de dichas propiedades son el aumento de la resistencia de las plantas hacia las zooplagas y las plagas microbianas, tales como hacia insectos, ácaros, hongos patógenos de las plantas, bacterias y/o virus así como aumento de la tolerancia de las plantas hacia algunos herbicidas. Ejemplos de dichas plantas transgénicas son los importantes cultígenos tales como cereales (trigo, arroz), maíz, soja, patata, remolacha azucarera, tomate, guisantes, y otras variedades vegetales, algodón, tabaco, colza, así como plantas con frutos (con los frutos de la manzana, pera, frutos de los cítricos, y uvas), se enfatizan por tanto especialmente el maíz, la soja, la patata, el algodón, el tabaco y la colza. Las propiedades ("rasgos") que se resaltan especialmente son el aumento de la tolerancia de las plantas hacia insectos, arácnidos, nematodos y gastrópodos a través de las toxinas formadas en las plantas, especialmente las que se producen en las plantas (conocidas a partir de ahora en el presente documento como "plantas Bt") por el material genético de *Bacillus thuringiensis* (por ejemplo, de los genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb y CryIF así como de sus combinaciones). Particularmente enfatizadas como propiedades ("rasgos") están el aumento de resistencia de las plantas hacia los hongos, bacterias y virus a través de la resistencia sistémicamente adquirida (SAR), sistemina, fitoalexina, genes estimuladores y de resistencia y proteínas y toxinas correspondientemente expresadas. Propiedades ("rasgos") particularmente resaltadas de manera adicional son un aumento de la tolerancia de las plantas a algunos compuestos herbicidas activos, por ejemplo imidazolinonas, sulfonilureas, glifosato o fosfotrocina (por ejemplo, gen "PAT"). Se pueden producir también los respectivos genes que imparten las propiedades deseadas ("rasgos") en las plantas transgénicas en combinación entre sí. Ejemplos de dichas "plantas Bt" son variedades de maíz, variedades de algodón, variedades de soja y variedades de patata que se comercializan con las marcas comerciales YIELD GARD® (por ejemplo, maíz, algodón, soja) KnockOut® (por ejemplo, maíz), StarLink® (por ejemplo, maíz), Bollgard® (algodón), Nucoat® (algodón) y NewLeaf® (patata). Ejemplos de plantas tolerantes a herbicidas son variedades de maíz, variedades de algodón y variedades de soja que se comercializan con las marcas comerciales Roundup Ready (tolerancia hacia glifosato, por ejemplo, maíz, algodón, soja), Liberty Link® (tolerancia hacia fosfotrocina, por ejemplo, colza), IMI® (tolerancia hacia imidazolinonas) y STS® (tolerancia hacia sulfonilureas, por ejemplo, maíz). Se mencionan también como plantas resistentes a herbicidas (cultivadas convencionalmente por la tolerancia a herbicidas) aquellas variedades comercializadas con el nombre Clearfield® (por ejemplo, maíz). Naturalmente, estas declaraciones se aplican también a las variedades de plantas desarrolladas o comercializadas en el futuro con estas propiedades genéticas ("rasgos") o las desarrolladas en el futuro

**[0202]** Se prefiere el uso en cultivos transgénicos económicamente importantes de plantas útiles y ornamentales, por ejemplo, de cereales tales como trigo, cebada, centeno, avenas, mijo, arroz, yuca y maíz u otros cultivos de remolacha azucarera, algodón, soja, aceite de semillas de colza, patatas, tomates, guisantes y otros tipos de vegetales.

**[0203]** Cuando se usan en cultivos transgénicos, en particular aquellos que tienen resistencias a los insectos, se observan efectos frecuentemente, además de los efectos contra organismos perjudiciales que se observan en otros cultivos, que son específicos de la aplicación en el cultivo transgénico en cuestión, por ejemplo, un espectro alterado o específicamente ampliado de plagas que se pueden controlar, o tasas de aplicación alteradas que se pueden emplear para la aplicación

**[0204]** La invención se refiere también por tanto al uso de compuestos de fórmula I para controlar organismos perjudiciales en plantas de cultivos transgénicos.

**[0205]** Según una característica adicional de la presente invención, se proporciona una composición plaguicida que comprende uno o más compuestos de la invención según se ha definido anteriormente, en asociación con, y preferiblemente dispersado homogéneamente en uno o más diluyentes o vehículos y/o agentes tensioactivos plaguicidamente aceptables compatibles (es decir, diluyentes o vehículos y/o agentes tensioactivos del tipo generalmente aceptado en la materia que son adecuados para uso en la composiciones plaguicidas y que son compatibles con los compuestos de la invención).

5 **[0206]** En la práctica, los compuestos de la invención forman más frecuentemente partes de composiciones. Se pueden emplear estas composiciones para controlar artrópodos, especialmente insectos, o nematodos de plantas o ácaros. Las composiciones pueden ser de cualquier tipo conocido en la materia adecuado para la aplicación a la plaga deseada en cualquier establecimiento o área cubierta o al aire libre. Estas composiciones contienen al menos un compuesto de la invención como ingrediente activo en combinación o asociación con uno o más componentes compatibles diferentes que son, por ejemplo, vehículos o diluyentes sólidos o líquidos, potenciadores, agentes tensioactivos, o similares apropiados para el uso pretendido y que son agrónomicamente o medicinalmente aceptables. Esas composiciones, que se pueden preparar mediante cualquier manera conocida en la materia, forman igualmente una parte de esta invención.

15 **[0207]** Los compuestos de la invención, en sus formulaciones comercialmente disponibles y en las formas de uso preparadas a partir de estas formulaciones, pueden estar presentes en mezclas con otras sustancias activas tales como insecticidas, atrayentes, esterilizantes, acaricidas, nematocidas, fungicidas, sustancias reguladoras del crecimiento o herbicidas.

**[0208]** Los plaguicidas incluyen, por ejemplo, ésteres fosfóricos, carbamatos, ésteres carboxílicos, formamidas, compuestos de estaño, y materiales producidos por microorganismos.

20 **Formamidas:**

**[0209]**

25 Inhibidores de la síntesis de ácido nucleico  
benalaxil, benalaxil-M, bupirimato, quiralaxil, clozilacon, dimetirimol, etirimol, furalaxil, himexazol, metalaxil, metalaxil-M, ofurace, oxadixil, ácido oxolínico

Inhibidores de la mitosis y de la división celular  
benomil, carbendazim, dietofencarb, fuberidazol, pencicuron, tiabendazol, tiofanatometilo, zoxamis

30 Inhibidor del complejo respiratorio I  
difluometorim

35 Inhibidores del complejo respiratorio II  
boscalid, carboxin, fenfuram, flutolanil, furametpir, mepronil, oxicarboxin, pentiopirad, tifluzamida

Inhibidor del complejo respiratorio III  
azoxistrobin, ciazofamida, dimoxistrobin, enestrobin, famoxadona, fenamidona, fluoxastrobin, kresoxim metilo, metominostrobin, orisastrobin, piraclostrobin, picoxistrobin

40 Desacopladores  
dinocap, fluazinam

45 Inhibidores de la producción de ATP  
acetato de fentin, cloruro de fentin, hidróxido de fentin, siltiofam

Inhibidores de la biosíntesis de aminoácidos y proteínas  
andoprim; blastacidin-S, ciprodinil, kasugamicina, Clorhidrato hidratado de kasugamicina, mepanipirim, pirimetanilo

50 Inhibidores de la transducción de la señal  
fencpiclonil, fludioxonil, quinoxifen

55 Inhibidores de la síntesis de grasa y de la membrana  
clozolinato, iprodiona, procymidona, vinclozolin  
ampropilfos, potasio ampropilfos, edifenfos, iprobenfos (IBP), isoprotiolano, pirazofos  
tolclofos-metilo, bifenilo  
iodocarb, propamocarb, clorhidrato de propamocarb

Inhibidores de la biosíntesis de ergosterol

- fenhexamida,  
 azaconazol, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, diclobutrazol, difenoconazol, diniconazol, diniconazol-M,  
 epoxiconazol, etaconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, furconazol, furconazol-cis,  
 5 hexaconazol, imibenconazol, ipconazol, metconazol, myclobutanil, paclobutrazol, penconazol, propiconazol,  
 protioconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefon, triadimenol, triticonazol, uniconazol,  
 voriconazol, imazalil, sulfato de imazalil , oxpoconazol, fenarimol, flurprimidol, nuarimol, pirifenox, triforin,  
 pefurazoate, procloraz, triflumizol, viniconazol,  
 aldimorf, dodemorf, acetato de dodemorf , fenpropimorf, tridemorf, fenpropidin, espiroxamine,  
 10 naftifin, piributicarb, terbinafin
- Inhibidores de la síntesis de la pared celular  
 bentiavalicarb, bialafos, dimetomorf, flumorf, iprovalicarb, polioxinas, polioxorim, validamicin A
- Inhibidores de la biosíntesis de melanina  
 15 capropamida, diclocymet, fenoxanil, ftalide, piroquilon, triciclazol
- Inducción a la resistencia  
 acibenzolar-S-metilo, probenazol, tiadinil
- 20 Multisitios  
 captafol, captan, clorothalonil, sales de cobre: hidróxido de cobre, naftenato de cobre, oxiclورو de cobre,  
 sulfato de cobre, óxido de cobre , oxina-cobre y mezcla de Burdeos , diclofluanid, ditianon, dodin, base exenta  
 de dodin , ferbam, fluorofolpet, guazatin, acetato de guazatin , iminoctadina, albesilato de iminoctadina ,  
 triacetato de iminoctadina , mancopper, mancozeb, maneb, metiram, metiram cinc, propineb, azufre and  
 25 preparaciones de azufre que contienen polisulfuro de calcio tiram, tolifluanid, zineb, ziram
- Mecanismo desconocido  
 amibromdol, bentiazol, betoxazin, capsimicina, carvona, metionato de quinolina, cloropicrina, cufraneb,  
 30 ciflufenamida, cimoxanil, dazomet, debacarb, diclomezina, diclorofeno, dicloran, metil sulfato de difenzoquat,  
 difenilamina, etaboxam, ferimzona, flumetover, flusulfamida, fluopicolida, fluoroimida, hexaclorobenceno, sulfato  
 de S-hidroxiquinolina, irumamicina, metasulfocarb, metrafenona, isotiocianato de metilo, mildiomicina,  
 natamicina, níquel dimetilditiocarbamato, nitrotal-isopropilo, octilina, oxamocarb, oxifentiina, pentaclorofenol y  
 las sales, 2-fenilfenol y las sales, piperalina, propanosin-sodio, proquinazid, pirrolnitrina, quintozen, tecloftalam,  
 tecnazen, triazóxido, triclámida, zarilámida y 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)piridina, N-(4-cloro-2-nitrofenil)-N-  
 35 etil-4-metilbenzenosulfonamida, 2-amino-4-metil-N-fenil-5-tiazol carboxamida, 2-cloro-N-(2,3-dihidro-1,1,3-  
 trimetil-1H-inden-4-il)-3-piridina carboxamida, 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetilisoxazolidin-3-il]piridina, cis-1-(4-  
 clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)cicloheptanol, 2,4-dihidro-5-metoxi-2-metil-4-[[[1-(3-(trifluorometil)-  
 fenil]etilideno)amino]oxi]metil]fenil]-3H-1,2,3-triazol-3-ona (185336-79-2), metil 1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-  
 inden-1-il)-1H-imidazol-5-carboxilato, 3,4,5-tricloro-2,6-piridina dicarbonitriol, metil 2-[[[ciclopropil[(4-metoxifenil)  
 40 imino]metil]tio]metil]-.alfa.-(metoximetilen)-benzacetato, 4-cloro-alfa-propinilo-N-[2-[3-metoxi-4-(2-  
 propinilo)fenil]etil]-benzacetamida, (2S)-N-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propinil]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-  
 [(metilsulfonil)amino]-butanamida, 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-  
 a]pirimidina, 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-N-[(1R)-1,2,2-trimetilpropil][1,3,4]triazolo[1,5-a]pirimidina-7-amina, 5-  
 45 cloro-N-[(1R)-1,2-dimetilpropil]-6-(2,4,6-trifluorofenil) [1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina-7-amina, N-[1-(5-bromo-3-  
 cloropiridin-2-il)etil]-2,4-dicloronicotinamida, N-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)metil-2,4-dicloronicotinamida, 2-  
 butoxi-6-yodo-3-propilbenzopirano-4-ona, N-[(Z)-[(ciclopropilmetoxi)imino][6-(difluorometoxi)-2,3-  
 difluorofenil]metil]-2-benzacetamida, N-(3-etil-3,5-trimetilciclohexil)-3-formilamino-2-hidroxibenzamida, 2-[[[1-  
 [3(1fluoro-2-feniletil)oxi]feniletideno]amino]oxi]metil]-alfa-(metoxiimino)-N-metil-alfaE-benzacetamida, N-(2-[3-  
 50 cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il]etil)-2-(trifluorometil)benzamida, N-(3',4'-dicloro-5-fluorobifenil-2-il)-3-  
 (difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, N-(6-Metoxi-3-piridinil)-ciclopropano carboxamida, ácido 1-[(4-  
 metoxifenoxi)metil]-2,2-dimetilpropil-1H-imidazol-1-carboxílico, ácido O-[1-[(4-metoxifenoxi)metil]-2,2-  
 dimetilpropil]-1H-imidazol-1-carboxílico, 2-(2-[[6-(3-clor-2-metilfenoxi)-5-fluoropirimidin-4-il]oxi]fenil)-2-  
 (metoxiimino)-N-metilacetamida
- 55 **Bactericidas:**  
 [0210] bronopol, dichlorofeno, nitrapirin, dimetilditiocarbamato de níquel, kasugamicina, octilina, ácido furan  
 carboxílico , oxitetraciclina, probenazol, estreptomycin, tecloftalam, sulfato de cobre y otras preparaciones de  
 cobre.

**Insecticida / Acaricida / Nematicida:****[0211]**

- 5 Inhibidores de la acetilcolinesterasa (AChE)  
 carbamatos,  
 por ejemplo alanycarb, aldicarb, aldoxycarb, allyxycarb, aminocarb, bendiocarb, benfuracarb, bufencarb,  
 butacarb, butocarboxim, butoxicarboxim, carbaril, carbofuran, carbosulfan, cloethocarb, dimetilan, etiofencarb,  
 fenobucarb, fenotiocarb, formetanato, furatiocarb, isoprocarb, metam-sodio, metiocarb, metomil, metoicarb,  
 10 oxamil, pirimicarb, promecarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, trimetacarb, XMC, xilicarb, triazamato  
 organofosfatos, por ejemplo, acefato, azamethifos, azinfos (-metil, -etil), aromophos-etil, (-metil), autatiofos,  
 cadusafos, carbofenotion, cloretoxifos, clorfenvinfos, clormefos, clorpyrifos (-metil/-etil), coumafos, cianofenos,  
 cianofos, clorfenvinfos, demeton-S-metilo, demeton-S-metilsulfona, dialifos, diazinona, diclofentiona,  
 15 diclorvos/DDVP, dicrotofos, dimetoato, dimetilvinfos, dioxabenzofos, disulfoton, EPN, etion, etoprofos, etrimfos,  
 famfur, fenamifos, fenitroton, fensulfotion, fention, flupirazofos, fonofos, formotion, fosmetilan, fostiazato,  
 heptenofos, iodofenos, iprobenfos, isazofos, isofenos, isopropil O-salicilato, isoxation, malation, mecarbam,  
 metacrifos, metamidofos, metidation, mevinfos, monocrotofos, naled, ometoato, oxidemeton-metilo, paration (-  
 metil/-etil), fentoato, forato, fosalone, fosmet, fosfamidona, fosfocarb, Foxim, pirimifos (-metil/-etil), profenofos,  
 propafos, propetamfos, protiofos, protoato, piraclofos, piridafention, piridation, quinalphos, sebufos, sulfotep,  
 20 sulprofos, tebupirimfos, temefos, terbufos, tetraclorvinfos, tiometon, triazofos, triclofon, vamidotion
- Moduladores del canal de sodio / Bloqueantes del canal de sodio dependientes de voltaje  
 piretroides  
 por ejemplo acrinatrina, alletrina (d-cis-trans, d-trans), beta-ciflutrina, bifentrina, bioalletrina, isómero de  
 25 bioalletrin-S-ciclopentilo, bioetanometrina, biopermetrina, bioresmetrina, clovaportrina, cis-cipermetrina, cis-  
 resmetrina, cis-permetrina, clocitrina, cicloprotrina, ciflutrina, chaloctrina, cipermetrina (alfa-, beta-, teta-, zeta),  
 cifenotrina, deltametrina, empenetrina (isómero -1R-), esfenvalerato, etofenprox, fenflutrina, fenpropatrina,  
 fenpiritrina, fenvalerato, flubrocitrinato, flucitrinato, flufenprox, flumetrina, fluvalinato, fubfenprox, gamma-  
 30 cihalotrina, imiprotrina, kadetrina, lambda-cihalotrina, metoflutrina, permetrina (cis-, trans-), fenotrina (isómero  
 1R-trans ), pralletrina, proflutrina, protrifenbuto, piresmetrins, resmetrina, RU 15525, silafluofeno, tau-fluvalinato,  
 teflutrina, teralletrina, tetrametrina (isómero -1R- ), tralometrina, transflutrina, ZXI 8901, piretrinas (pyrethrum)  
 DDT
- oxadiazinas  
 35 por ejemplo indoxacarb
- Agonistas/antagonistas del receptor de la acetilcolina  
 cloronicotinilos,  
 por ejemplo acetamiprid, clotianidin, dinotefuran, imidacloprid, nitenpram, nitiazina, tiacloprid, tiametoxam  
 40 nicotina, bensultap, cartap
- Moduladores del receptor de la acetilcolina  
 Espinosinas  
 por ejemplo, espinosad  
 45
- Antagonistas del canal de cloruro controlado por GABA  
 Organocloro  
 Por ejemplo camfecloro, clordane, endosulfan, gamma-HCH, HCH, heptacloro, lindano, metoxcloro  
 Fiproles,  
 50 Por ejemplo acetoprol, etiprol, fipronil, pirafloprol, piriproprol, vaniliproprol
- Activadores del canal de cloruro  
 Mectinas  
 por ejemplo avermectina, emamectina, benzoato de emamectina, ivermectina, milbemicina  
 55 Miméticos de la hormona juvenil,  
 por ejemplo diofenolan, epofenonano, fenoxicarb, hidropreno, kinopreno, metopreno, piriproproxifeo, tripreno
- Agonistas/perturbadores de la ecdisona  
 diacilhidrazinas,

por ejemplo cromafezonida, halofenozida, metoxifenozida, tebufenozida

Inhibidores de la biosíntesis de quitina

Benzoilureas

5 por ejemplo bistrifluron, clofluzuron, diflubenzuron, fluazuron, flucicloخورon, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, penfluron, teflubenzuron, triflumuron  
buprofezina  
ciromazina

10 Inhibidores de la fosforilación oxidativa, perturbadores del ATP  
diafentiuron

compuestos de organoestaño,  
por ejemplo azoclotina, cihexatina, fenbutatina-óxido

15 Desacopladores de la fosforilación oxidativa mediante la interrupción de los gradientes de H-protón  
pirrol,

por ejemplo clorfenapir

dinitrofenoles,

20 por ejemplo binapaciril, dinobuton, dinocap, DNOC

Inhibidores del transporte de electrones en el sitio I  
de METI

por ejemplo fenazaquin, fenpiroximato, pirimidifeno, piridabeno, tebufenpirad, tolfenpirad hidrametilnon  
dicofol

25 Inhibidores del transporte de electrones en el sitio II  
rotenones

30 Inhibidores del transporte de electrones en el sitio III  
acequinocilo, fluacirpirim

perturbadores microbianos de la membrana intestinal de insectos  
cepas de *Bacillus thuringiensis*

35 Inhibidores de la síntesis de grasa

ácidos tetrónicos

por ejemplo espirodiclofen, espiromesifen

ácidos tetrámicos,

40 por ejemplo espirotetramat (CAS-Reg.-Nº: 203313-25-1) y 3-(2,5-dimetilfenil)-8-metoxi-2-oxo-1-  
azaspiro[4.5]dec-3-en-4-il carbonato de etilo (alias: ácido carbónico 3-(2,5-dimetilfenil)-8-metoxi-2-oxo-1-  
azaspiro[4.5]dec-3-en-4-il éster de etilo , CAS-Reg.-Nº: 382608-10-8)

carboxamidas,

por ejemplo flonicamid

45 agonistas octopaminérgicos,

por ejemplo amitraz

Inhibidor de la ATPasa estimulada por magnesio

propargita

dicarboxamidas de ácido benzoico ,

50 por ejemplo flubendiamida

Análogos de Nereistoxin,

Por ejemplo tiociclam oxalato de hidrógeno, tiosultap-sodio

55 Agonistas del receptor de rianodina

dicarboxamidas de ácido benzoico

por ejemplo flubendiamida

Hormonas o feromonas biológicas

azadiractina, *Bacillus spec.*, *Beauveria spec.*, codlemone, *Metarrhizium spec.*, *Paecilomyces spec.*,



thuringiensin, Verticillium spec.

Compuestos activos con modo de acción desconocido o no específico fumigantes,

5 por ejemplo fosforo de aluminio, bromuro de metilo, fluoruro de sulfurio inhibidores de la alimentación,

por ejemplo criolita, flonicamid, pimetrozina

inhibidores del crecimiento de ácaros,

10 por ejemplo clofentezina, etoxazol, hexitiazox

amidoflumet, benclotiaz, benzoximato, bifenazato, bromopropilato, buprofezina, quinometionato, clordimeform, clorobenzilato, cloropicrina, clotiazoben, ciclopreno, ciflumetofeno, diciclanilo, fenoxacrim, fentripanil, flubenzimina, flufenimerim, flutenzin, gossiplure, hidrametilnona, japonilure, metoxadiazona, petróleo, butóxido de piperonilo, oleato de potasio, piridalilo, sulfuramid, tetradifon, tetrasul, triaratenol, verbutin

15 **[0212]** Es también posible una mezcla con otros compuestos activos conocidos tales como herbicidas, fertilizantes, reguladores del crecimiento, protectores, semioquímicos o también con agentes para mejorar las propiedades de las plantas.

20 **[0213]** Los compuestos activos de la invención pueden estar también presentes en sus formulaciones comerciales normales cuando se usan como insecticidas así como en las formas de aplicación preparadas de estas formulaciones en premezcla con sinérgicos. Los sinérgicos son compuestos a través de los cuales se puede aumentar la actividad del compuesto activo sin que el propio sinérgico añadido tenga que ser activo.

25 **[0214]** Los compuestos activos de la invención pueden estar también presentes en sus formulaciones comerciales normales cuando se usan como insecticidas así como en las formas de aplicación preparadas de estas formulaciones en premezcla con inhibidores que reducen la degradación del compuesto activo tras el uso en el entorno de las plantas o en los tejidos de las plantas.

30 **[0215]** Los componentes anteriormente mencionados de las combinaciones se conocen como sustancias activas, muchas de las cuales se describen en Ch. R Worthing, S.B. Walker, The Pesticide Manual, 12ª Edición, British Crop Protection Council, Farnham 2000.

35 **[0216]** Las dosis de uso eficaces de los compuestos empleados en la invención pueden variar dentro de amplios límites, dependiendo particularmente de la naturaleza de la plaga que se va a eliminar o del grado de infestación, por ejemplo, de los cultivos con estas plagas. En general, las composiciones según la invención contienen normalmente aproximadamente 0,05 a aproximadamente 95% (en peso) de uno o más principios activos según la invención, aproximadamente a aproximadamente 95% de uno o más vehículos sólidos o líquidos y, opcionalmente, aproximadamente 0,1 a aproximadamente 50% de uno o más de diferentes componentes compatibles, tales como agentes tensioactivos o similares.

40 **[0217]** A este respecto, el término "vehículo" denota un ingrediente orgánico u inorgánico, natural o sintético, con el que se combina el ingrediente activo para facilitar su aplicación, por ejemplo, a la planta, las semillas, o el suelo. Este vehículo por lo general es inerte y debe ser aceptable (por ejemplo, agronómicamente aceptable, especialmente para la planta tratada).

45 **[0218]** El vehículo puede ser un sólido, por ejemplo, arcillas, silicatos naturales o sintéticos, sílice, resinas, ceras, fertilizantes sólidos (por ejemplo sales de amonio), minerales naturales del suelo, tales como caolines, arcillas, talco, cal, cuarzo, atapulgita, montmorillonita, bentonita o tierra de diatomeas, o minerales sintéticos del suelo tales como sílice, alúmina, o silicatos especialmente silicatos de aluminio o magnesio. Como vehículos sólidos para 50 gránulos, son adecuados los siguientes: rocas naturales trituradas o fraccionadas tales como calcita, mármol, pumita, sepiolita y dolomita; gránulos sintéticos de alimentos orgánico u inorgánico; gránulos de material orgánico tales como serrín, cáscara de coco, mazorcas de maíz, cascarilla de maíz o tallos de tabaco; kieselguhr, fosfato tricálcico, corcho pulverizado, negro de humo absorbente; polímeros solubles en agua, resinas, ceras; o fertilizantes sólidos. Dichas composiciones sólidas pueden, si se desea, contener uno o más agentes mojantes, 55 dispersantes, emulsionantes o colorantes compatibles que, si son sólidos, también pueden actuar como diluyente.

**[0219]** Los adecuados como vehículos sólidos son:

por ejemplo, se pueden usar sales de amonio y polvos minerales naturales tal como caolines, arcillas, talco, cal,

5 cuarzo, atapulgita, montmorillonita o tierra de diatomeas, y polvos minerales sintéticos tales como sílice muy disperso, óxidos y silicatos de aluminio, los adecuados como vehículos para granulados son: por ejemplo minerales naturales triturados y fraccionados tales como calcita, mármol, pumita, sepiolita y dolomita así como  
 10 granulados procedentes de materiales orgánicos como papel, serrín, cáscara de coco, espigas de maíz y tallos de tabaco; los adecuados como agentes emulsionantes y espumantes son; por ejemplo emulsionantes no ionógenos y aniónicos tales como ésteres de ácidos grasos con polioxietileno, éteres de ácidos grasos con polioxietileno, por ejemplo éteres de alquilarilpoliglicol, alquilsulfonatos, alquilsulfatos, arilsulfonatos e hidrolizados de proteínas; los adecuados como dispersantes son materiales no iónicos y/o iónico, por ejemplo del tipo alcohol-POE y/o éteres de POP, ácidos y/o ésteres de POP o POE, éteres de alquilo y/o arilo con POP o POE, aductos de grasa y/o POP o POE, derivados de POE y/o POP con poliol, aductos de POE y/o POP con sorbitán o azúcares, alquil o aril sulfatos, sulfonatos y fosfatos o los respectivos aductos de éter PO. Además, oligómeros o polímeros adecuados, por ejemplo partiendo de monómeros vinílicos, o de ácido acrílico, a partir de EO y/o PO solos o combinados con, por ejemplo (poli)alcoholes o (poli)aminas. Además, lignina y sus derivados de ácido sulfónico, celulosas simples y modificadas, ácidos sulfónicos aromáticos y/o alifáticos así como sus aductos con formaldehído.

15 **[0220]** Se pueden usar materiales de depósito tales como carboximetilcelulosa, polvo natural y sintético, polímeros granulares o tipo látex en las formulaciones, tales como goma arábiga, alcohol de polivinilo, acetato de polivinilo, así como fosfolípidos naturales tales como cefalinas y lecitinas y fosfolípidos sintéticos.

20 **[0221]** El vehículo puede ser también líquido, por ejemplo: agua; alcoholes, especialmente butanol o glicol, así como sus éteres o ésteres, particularmente acetato de metilglicol; cetonas, particularmente acetona, ciclohexanona, metiletil cetona, metilisobutilcetona, o isoforona; fracciones del petróleo tales como hidrocarburos parafínicos o aromáticos, particularmente xilenos o alquil naftalenos; aceites minerales o vegetales, hidrocarburos alifáticos clorados, particularmente tricloroetano o cloruro de metileno; hidrocarburos clorados, particularmente clorobencenos; disolventes solubles en agua o fuertemente polares tales como dimetilformamida, dimetilsulfóxido, o N-metilpirrolidona; gases licuados; o similares o una mezcla de los mismos.

25 **[0222]** El agente tensioactivo puede ser un agente emulsionante, un agente dispersante o un agente mojante de tipo iónico o no iónico o una mezcla de ese tipo de agentes tensioactivos. Entre estos se encuentran, por ejemplo, sales de ácidos poliacrílicos, sales de ácidos lignosulfónicos, sales de ácidos fenolsulfónico o naftalenosulfónico, policondensado de óxido de etileno con alcoholes grasos o ácidos grasos o ésteres grasos o aminas grasas, fenoles sustituidos (particularmente alquilfenoles o arilfenoles), sales de ésteres de ácido sulfosuccínico, derivados de taurina (particularmente alquiltauratos), ésteres fosfóricos de alcoholes o de policondensados de óxido de etileno con fenoles, ésteres de ácidos grasos con polioles, o derivados funcionales de sulfato, sulfonato o fosfato de los compuestos anteriores. La presencia de al menos un agente tensioactivo es esencial por regla general cuando el ingrediente activo y/o el vehículo inerte son solo ligeramente solubles en agua o no son solubles en agua y el agente vehículo de la composición para la aplicación es el agua.

30 **[0223]** Las composiciones de la invención pueden contener además otros aditivos tales como adhesivos o colorantes. En las formulaciones se pueden utilizar adhesivos tales como carboximetilcelulosa o polímeros naturales o sintéticos en forma de polvos, gránulos o enrejados, tales como goma arábiga, alcohol de polivinil o acetato de polivinilo, fosfolípido naturales, tales como cefalinas o lecitinas, o fosfolípidos sintéticos. Es posible utilizar colorantes tales como pigmentos colorantes inorgánicos, por ejemplo: óxidos de hierro, óxidos de titanio, o azul de Prusia; tintes orgánicos tales como colorantes de alizarina, colorantes azo o colorantes de ftalocianina metálica; o nutrientes traza tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno o cinc.

35 **[0224]** Para su uso agrícola, los compuestos de la invención están así por lo general en forma de composiciones, que pueden ser diferentes formas sólidas o líquidas.

40 **[0225]** Las formas sólidas de las composiciones que se pueden usar son polvos de empolvado (con un contenido del compuesto de la invención, de hasta el 80%), polvos o gránulos mojables (incluyendo gránulos dispersables en agua), particularmente los obtenidos por extrusión, compactación, impregnación de un vehículo granular, o granulación partiendo de un polvo (el contenido del compuesto de la invención, en estos polvos o gránulos mojables está comprendida entre aproximadamente 0,5 y aproximadamente 80%). Se pueden utilizar composiciones sólidas homogéneas o heterogéneas que contienen uno o más compuestos de la invención, por ejemplo gránulos, aglomerados, briquetas o cápsulas, para tratar agua corriente o estancada durante un periodo de tiempo. Se puede conseguir un efecto similar usando aportes mediante goteo o intermitentes de concentrados dispersables en agua según se describe en el presente documento.

5 [0226] Las composiciones líquidas, por ejemplo, incluyen disoluciones acuosas o no acuosas o suspensiones (tales como concentrados emulsionables, emulsiones, fluidos, dispersiones, o disoluciones) o aerosoles. Las composiciones líquidas incluyen también, en particular, concentrados emulsionables, dispersiones, emulsiones fluidos, aerosoles, polvos mojables (o polvo para pulverizar), sólidos o pastas fluidas como formas de composiciones que son líquidas o previstas para formar composiciones líquidas cuando se aplican, por ejemplo, como pulverizadores acuosos (incluyendo de volumen bajo o ultrabajo) o como nieblas o aerosoles.

10 [0227] Las composiciones líquidas, por ejemplo, en forma de concentrados emulsionables o solubles muy frecuentemente comprenden de aproximadamente 5 a aproximadamente 80% en peso del ingrediente activo, mientras que las emulsiones o disoluciones que están listas para la aplicación contienen, en su caso, de aproximadamente 0,01 a aproximadamente 20% del ingrediente activo. Además del disolvente, los concentrados emulsionables o solubles pueden contener, según necesidad de aproximadamente 2 a aproximadamente 50% de aditivos adecuados, tales como estabilizantes, agentes tensioactivos, agentes penetrantes, inhibidores de la corrosión, colorantes o adhesivos. Las emulsiones de cualquier concentración necesaria, que sea particularmente adecuada para la aplicación, por ejemplo, a las plantas, se puede obtener a partir de estos concentrados por dilución con agua. Estas composiciones están incluidas en el alcance de las composiciones que se pueden emplear en la presente invención. Las emulsiones pueden estar en la forma del tipo de agua-en-aceite o de aceite-en-agua, y pueden tener una consistencia espesa.

20 [0228] Las composiciones líquidas de esta invención pueden, además de en las aplicaciones de uso habitual en agricultura, utilizarse por ejemplo para tratar sustratos o lugares infestados o propensos a la infestación por artrópodos (u otras plagas controladas por los compuestos de esta invención) incluyendo establecimientos, almacenamientos al aire libre o bajo techo, o zonas de procesamiento, contenedores o equipos o agua corriente o estancada.

30 [0229] Todas estas dispersiones o emulsiones o mezclas para pulverización acuosas se pueden aplicar, por ejemplo, a los cultivos por cualquier medio adecuado, especialmente mediante pulverización, a tasas que por lo general son del orden de aproximadamente 100 a aproximadamente 1,200 litros de mezcla de pulverización por hectárea, pero pueden ser superiores o inferiores (por ejemplo volumen bajo o ultra bajo) dependiendo de la necesidad o técnica de aplicación. El compuesto o composiciones según la invención se aplican convencionalmente a la vegetación y en particular a raíces u hojas que tengan plagas a eliminar. Otro procedimiento de aplicación del compuesto o composiciones según la invención es la quimiorrigación, es decir, la adición de una formulación que contiene el ingrediente activo al agua de irrigación. Esta irrigación puede ser irrigación mediante rociadores para los plaguicidas foliares o puede ser irrigación del suelo o irrigación del subsuelo para plaguicidas para suelo o sistémicos.

40 [0230] Las suspensiones concentradas, que se pueden aplicar por pulverización, se preparan de forma que produzcan un producto fluido estable que no sedimente (molienda fina) y habitualmente contienen de aproximadamente 10 a aproximadamente 75% en peso de ingrediente activo, de aproximadamente 0,5 a aproximadamente 30% de agentes tensioactivos, de aproximadamente 0,1 a aproximadamente 10% de agentes tixotrópicos, de aproximadamente 0 a aproximadamente 30% de aditivos adecuados, tales como agentes antiespumantes, inhibidores de la corrosión, estabilizantes, agentes penetrantes, adhesivos y, como vehículo, agua o un líquido orgánico en el que el ingrediente activo es poco soluble o insoluble. Algunos sólidos orgánicos o sales inorgánicas se pueden disolver en el vehículo para ayudar a evitar la sedimentación o como anticongelante para el agua.

50 [0231] Los polvos mojables (o polvos para pulverización) se preparan normalmente de forma que contienen de aproximadamente 10 a aproximadamente 80% en peso de ingrediente activo, de aproximadamente 20 a aproximadamente 90% de un vehículo sólido, de aproximadamente 0 a aproximadamente 5% de un agente mojante, de aproximadamente 3 a aproximadamente 10% de un agente dispersante y, cuando es necesario, de aproximadamente 0 a aproximadamente 80% de uno o más estabilizantes y/o otros aditivos, tales como agentes de penetración, adhesivos, agentes antiapelmazamiento, colorantes, o similares. Para obtener estos polvos mojables, el ingrediente activo se mezcla completamente en un mezclador adecuado con sustancias adicionales que pueden impregnarse sobre la carga porosa y se tritura utilizando un molino u otro triturador adecuado. Esto produce polvos mojables, cuya capacidad de mojado y suspensión son ventajosas. Pueden suspenderse en agua para dar cualquier concentración deseada y esta suspensión se puede emplear de forma muy ventajosa en particular para aplicación al follaje de las plantas.

**[0232]** Los “gránulos dispersables en agua (WG)” (gránulos que se dispersan con facilidad en agua) tienen composiciones que en lo sustancial son muy similares a las de los polvos mojables. Se pueden preparar por granulación de las formulaciones descritas para los polvos mojables, tanto por vía húmeda (poniendo en contacto ingrediente activo finamente dividido con la carga inerte y un poco de agua, por ejemplo de 1 a 20% en peso, o con una disolución acuosa de un agente dispersante o ligante, seguido por secado y tamizado), o por vía seca (compactación seguida por molienda y tamizado).

**[0233]** Las tasas y concentraciones de las composiciones formuladas pueden variar según el procedimiento de aplicación o la naturaleza de las composiciones o el uso de las mismas. En términos generales, las composiciones para aplicación para controlar plagas de artrópodos o de nematodos vegetales contienen habitualmente de aproximadamente 0,00001% a aproximadamente 95%, más particularmente de aproximadamente 0,0005% a aproximadamente 50% en peso de uno o más compuestos de la invención, o de principios activos totales (esto es como decir los compuestos de la invención, junto con otras sustancias tóxicas para los artrópodos o nematodos vegetales, sinérgicos, elementos traza o estabilizantes). Las composiciones reales empleadas a su tasa de aplicación se seleccionarán para conseguir el efecto o efectos deseados por el granjero, ganadero, médico o veterinario, operario de control de plagas u otra persona experta en la técnica.

**[0234]** Las composiciones líquidas o sólidas para aplicación sólida a animales, maderas, productos almacenados o enseres domésticos contienen habitualmente de aproximadamente 0,00005% a aproximadamente 90%, más particularmente de aproximadamente 0,001 % a aproximadamente 10%, en peso de uno o más compuestos de la invención. Para administración a animales oral o parenteralmente, incluyendo percutáneamente las composiciones líquidas o sólidas, estas contienen normalmente de aproximadamente 0,1% a aproximadamente 90% en peso de uno o más compuestos de la invención. Los piensos medicados contienen normalmente de aproximadamente 0,001% a aproximadamente 3% en peso de uno o más compuestos de la invención. Los concentrados o suplementos para mezclar con los piensos medicados contienen normalmente de aproximadamente 5% a aproximadamente 90%, preferiblemente de aproximadamente 5% a aproximadamente 50%, en peso de uno o más compuestos de la invención. Los productos de sales minerales para lamer contienen normalmente de aproximadamente 0,1% a aproximadamente 10% en peso de uno o más compuestos de fórmula I o sales plaguicidamente aceptables de los mismos.

**[0235]** Las composiciones en polvo o líquidas para aplicación al ganado, mercancías, establecimientos o zonas al aire libre pueden contener de aproximadamente 0,0001% a aproximadamente 15%, más especialmente de aproximadamente 0,005% a aproximadamente 2,0%, en peso, de uno o más compuestos de la invención. Las concentraciones adecuadas para agua tratada están entre aproximadamente 0,0001 ppm y aproximadamente 20 ppm, más particularmente aproximadamente de 0,001 ppm a aproximadamente 5,0 ppm de uno o más compuestos de la invención, y se pueden usar terapéuticamente en piscifactoría con los tiempos de exposición adecuados. Los cebos comestibles pueden contener de aproximadamente 0,01% a aproximadamente 5%, preferiblemente de aproximadamente 0,01% a aproximadamente 1,0%, en peso, de uno o más compuestos de la invención.

**[0236]** Cuando es adecuado administrar a los vertebrados por vía parenteral, oral o percutánea o de otra forma, la dosificación de los compuestos de la invención, dependerá de la especie, edad, o estado de salud del vertebrado y de la naturaleza y grado de su infestación real o potencial por plagas de artrópodos o helmintos. Una única dosis de aproximadamente 0,1 a aproximadamente 100 mg, preferiblemente de aproximadamente 2,0 a aproximadamente 20,0 mg, por kg de peso corporal del animal o dosis de aproximadamente 0,01 a aproximadamente 20,0 mg, preferiblemente de aproximadamente 0,1 a aproximadamente 5,0 mg, por kg de peso corporal del animal, para una medicación continua, son por lo general adecuadas para administración oral o parenteral. Mediante el uso de formulaciones o dispositivos de liberación continua, las dosis diarias necesarias en un plazo de meses se pueden combinar y administrar a los animales en una sola ocasión.

**[0237]** La siguiente composición EJEMPLOS 2A 2M ilustran composiciones para uso contra artrópodos, especialmente ácaros o insectos, o nematodos vegetales que comprende, como ingrediente activo, compuestos de la invención, tales como los descritos en los ejemplos preparativos. Cada una de las composiciones descritas en los EJEMPLOS 2A 2M se puede diluir para dar una composición pulverizable a concentraciones adecuadas para uso en el campo. Las descripciones genéricas de los ingredientes (para los que todos los porcentajes indicados son porcentajes en peso), usados en la composiciones de los EJEMPLOS 2A 2M ejemplificados a continuación son de la siguiente forma:

Nombre comercial	Descripción química
Etilan BCP	Condensado de nonilfenol con óxido de etileno
Soprophor BSU	Condensado de tristirilfenol con óxido de etileno
Arilan CA	Disolución al 70% p/v de dodecilbencenosulfonato de calcio
Solvesso 150	Disolvente aromático C <sub>10</sub> ligero
Arilan S	Dodecilbencenosulfonato de sodio
Darvan NO <sub>2</sub>	Lignosulfonato de sodio
Celite PF	Vehículo sintético de silicato de magnesio
Sopropon T36	Sales sódicas de ácidos policarboxílicos
Rhodigel 23	Polisacárido de goma xantana
Bentone 38	Derivado orgánico de montmorillonita de magnesio
Aerosil	Dióxido de silicio microfino

EJEMPLO 2A

5 [0238] Se preparó un concentrado soluble en agua que contenía la siguiente composición:

Ingrediente activo	7%
Etilan BCP	10%
N-metilpirrolidona	83%

10

[0239] Se añadió el ingrediente activo a una disolución de Etilan BCP disuelto en una porción de N-metilpirrolidona con calentamiento y agitación hasta disolución. Se completó el volumen de la disolución resultante con el resto de disolvente.

15 EJEMPLO 2B

[0240] Se preparó un concentrado emulsionable (EC) con la siguiente composición:

Ingrediente activo	25% (máx.)
Soprophor BSU	10%
Arilan CA	5%
N-metilpirrolidona	50%
Solvesso 1	10%

20

25 [0241] Los primeros tres componentes se disolvieron en N-metilpirrolidona y a esto se agregó seguidamente el Solvesso 150 para dar el volumen final.

EJEMPLO 2C

30 [0242] Se preparó un polvo mojable (WP) con la siguiente composición:

Ingrediente activo	40%
Arilan S	2%
Darvan NO <sub>2</sub>	5%
Celite PF	53%

35

[0243] Los ingredientes se mezclaron y trituraron en un molino de martillos hasta conseguir un polvo con un tamaño de partícula inferior a 50 micrómetros

40 EJEMPLO 2D

[0244] Se preparó una formulación de un polvo fluido con la siguiente composición:

Ingrediente activo	40,00%
Etilan BCP	1,00%
Sopropon T360,	0,20%
Etileno glicol	5,00%
Rhodigel 230,	0,15%

45

Agua 53,5%

**[0245]** Los ingredientes se mezclaron completamente y se trituraron en un molino de cuentas hasta obtener un tamaño de partícula promedio inferior a 3 micrómetros.

5

EJEMPLO 2E

**[0246]** Se preparó un concentrado de suspensión emulsionable con la siguiente composición:

10	Ingrediente activo	30,0%
	Ethylan BCP	10,0%
	Bentone 38	0,5%
	Solvesso 150	59,5%

**[0247]** Los ingredientes se mezclaron completamente y se trituraron en un molino de cuentas hasta obtener un tamaño de partícula promedio inferior a 3 micrómetros.

EJEMPLO 2F

**[0248]** Se preparó un gránulo dispersable en agua con la siguiente composición:

20	Ingrediente activo	30%
	Darvan N° 2	15%
	Arilan S	8%
25	Celite PF	47%

**[0249]** Los ingredientes se mezclaron, se micronizaron en un molino de energía fluidizada y seguidamente se granularon en un aglomerador giratorio con pulverización de agua (hasta el 10%). Los gránulos resultantes se secaron en un secador de lecho fluidizado para eliminar el exceso de agua.

30

EJEMPLO 2G

**[0250]** Se preparó un polvo para empolvado con la siguiente composición:

35	Ingrediente activo	1 a 10%
	Polvo superfino de talco	99 a 90%

**[0251]** Los ingredientes se mezclaron completamente y se molieron adicionalmente según necesidad para conseguir un polvo fino. este polvo se puede aplicar a una zona infestada por artrópodos, por ejemplo vertederos, productos almacenados o enseres domésticos o animales infestados o en riesgo de infestación por, artrópodos para controlar los artrópodos por ingestión oral. Los medios adecuados para distribuir el polvo de empolvado en la zona infestada por artrópodos incluyen soplantes mecánicos, batidores manuales o dispositivos para autotratamiento del ganado.

40

45 EJEMPLO 2H

**[0252]** Se preparó un cebo comestible con la siguiente composición:

50	Ingrediente activo	0,1 a 1,0%
	Harina de trigo	80%
	Melaza	19,9 a 19%

**[0253]** Los ingredientes se mezclaron completamente y se conformaron según necesidad en forma de cebo. Este cebo comestible se puede distribuir por la zona, por ejemplo establecimientos domésticos o industriales, por ejemplo cocinas, hospitales o zonas al aire libre infestadas por artrópodos, por ejemplo hormigas, langostas, cucarachas o moscas, para controlar los artrópodos por ingestión oral.

55

EJEMPLO 2I

**[0254]** Se preparó una formulación para disolución con la siguiente composición:

Ingrediente activo	15%
Dimetil sulfóxido	85%

**[0255]** El ingrediente activo se disolvió en dimetil sulfóxido con mezcla y/o calentamiento según necesidad. esta disolución se aplicó percutáneamente como aplicación para friegas a los animales domésticos infestados por artrópodos o, tras esterilización por filtración con una membrana de politetrafluoroetileno (tamaño de poro de 0,22 micrómetros), por inyección parenteral, a una tasa de aplicación de 1,2 a 12 ml de disolución por 100 kg de peso corporal del animal

EJEMPLOS 2J

**[0256]** Se preparó un polvo mojable con la siguiente composición:

Ingrediente activo	50%
Ethylan BCP	5%
Aerosil	5%
Celite PF	40%

**[0257]** El Etilan BCP se absorbió sobre el Aerosil que se mezcló seguidamente con el resto de ingredientes y se trituró en un molino de martillos para dar un polvo mojable, que se puede diluir con agua hasta una concentración de 0,001% a 2% en peso del compuesto activo y aplicarse a una zona de infestación por artrópodos, por ejemplo, larvas de díptero o nematodos vegetales, por pulverización, o a animales domésticos infestados o en riesgo de infestación por artrópodos, por pulverización o inmersión, o por administración oral en el agua de bebida, para controlar los artrópodos.

EJEMPLOS 2K

**[0258]** Se preparó una composición para bolo de liberación lenta formado por gránulos que contenían los siguientes componentes en varios porcentajes (similares a los descritos para las composiciones anteriores) dependiendo de la necesidad

Ingrediente activo
Agente de densidad
Agente de liberación lenta
Ligante

**[0259]** Los ingredientes completamente mezclados se conforman en gránulos que comprimen en un bolo con un peso específico de 2 o más. Este se puede administrar oralmente a los animales domésticos rumiantes para retención en el retículo y rumen para proporcionar una liberación lenta continuada del compuesto activo durante un periodo de tiempo prolongado para controlar la infestación de animales domésticos rumiantes por artrópodos.

EJEMPLO 2L

**[0260]** Se puede preparar una composición de liberación lenta en forma de gránulos, aglomerados, briquetas o similares de la siguiente forma:

Ingrediente activo	0,5 a 25%
Cloruro de polivinilo	75 a 99,5%
Ftalato de dioctilo (plastificante)	

**[0261]** Los componentes se mezclaron y después se conformaron en las formas adecuadas por extrusión en fundido o moldeo. Esta composición es útil, por ejemplo, para añadir a agua estampada o para fabricación de collares o crótalos para colocar a animales domésticos para colocar a los animales domésticos para controlar plagas por liberación lenta.

EJEMPLO 2M

**[0262]** Se preparó un gránulo dispersable en agua con la siguiente composición:

5	Ingrediente activo	85% (máx.)
	Polivinilpirrolidona	5%
	Arcilla de atapulgita	6%
	Lauril sulfato de sodio	2%
	Glicerina	2%

10 **[0263]** Los ingredientes se mezclaron como suspensión al 45% en agua y se molieron en húmedo hasta un tamaño de partícula de 4 micrómetros, y después se secaron por pulverización para eliminar el agua.

PROCEDIMIENTOS PARA USAR EL PLAGUICIDA

15 **[0264]** El siguiente procedimiento de ensayo representativo que usa compuestos de la invención, se llevó a cabo para determinar la actividad parasitocida de los compuestos de la invención.

PROCEDIMIENTO A: Procedimiento de cribado para ensayar la sistemicidad de los compuestos contra *Ctenocephalides felis* (pulga del gato)

20 **[0265]** Se llenó un recipiente de ensayo con 10 adultos de *Ctenocephalides felis*. Un cilindro de vidrio se cerró por un extremo con parafilm y se colocó en la parte superior del recipiente de ensayo. La disolución de compuesto de ensayo se pipeteó a continuación en sangre bobina y se agregó al cilindro de vidrio. Las *Ctenocephalides felis* tratadas se mantuvieron en esta prueba de perro artificial (sangre 37°C, 40-60 % de humedad relativa; *Ctenocephalides felis* 20-22°C, 40-60 % de humedad relativa) y se realizaron las evaluaciones a las 24 y 48 horas tras la aplicación.

25 **[0266]** Los compuestos de números 1-1, 1-2, y 1-3 produjeron un control de al menos el 70% de *Ctenocephalides felis* a una concentración de ensayo de 50 ppm o menos.

30 PROCEDIMIENTO B: Procedimiento de cribado para ensayar la actividad por contacto contra *Rhipicephalus sanguineus* (garrapata marrón del perro).

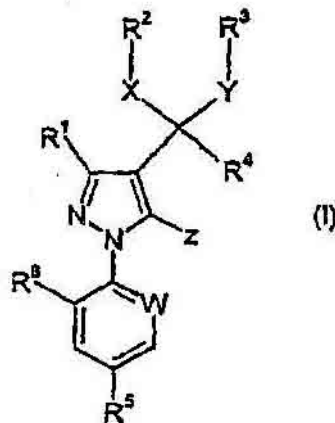
**[0267]** Se aplicaron gotas de disoluciones de los compuestos de ensayo sobre papel de filtro, se secaron, y el papel de filtro se introdujo en tubos de ensayo y se infestaron con 20-30 larvas (L1) de *Rhipicephalus sanguineus* y los tubos se cerraron con un tapón de clip. Las *Rhipicephalus sanguineus* tratadas se mantuvieron en una cámara climática (25°C, 90% HR) y se evaluó el porcentaje de eficacia a las 24 horas de la aplicación en comparación con el control no tratado.

35 **[0268]** Los compuestos 1-61, 1-70, y 1-93 proporcionaron un control de al menos el 50 % a una concentración de ensayo de 1.000 ppm.



## REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de formula I o una de sus sales plaguicidamente aceptable, en el que



- 5 W es =N-, =CH-, =CR<sup>7</sup>- o =C(NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>)-,  
R<sup>7</sup> es halógeno, alquilo o haloalquilo,  
R<sup>8</sup> y R<sup>9</sup> son independientemente entre sí hidrógeno, alquilo, alqueno, alquino, cicloalquilo, arilo, heterociclilo, aralquilo, o heterocicloalquilo, o uno de R<sup>8</sup> o R<sup>9</sup> son -CO-R<sup>8a</sup>, -CO-O-R<sup>9a</sup>, -SO-R<sup>8a</sup> o -SO<sub>2</sub>R<sup>8a</sup>, o R<sup>8</sup> y R<sup>9</sup> conjuntamente con el átomo N unido forman un anillo heterocíclico de cinco a ocho miembros que contiene
- 10 opcionalmente un átomo de oxígeno, azufre o nitrógeno adicional en el anillo o R<sup>8</sup> y R<sup>9</sup> conjuntamente con el átomo N unido forman un grupo imina -N=CR<sup>8b</sup>R<sup>9b</sup> o un grupo iminoéter -N=CR<sup>8b</sup>(OR<sup>9b</sup>),  
R<sup>8a</sup> y R<sup>9a</sup> son alquilo, cicloalquilo, arilo, heterociclilo, aralquilo o heterocicloalquilo,  
R<sup>8b</sup> es hidrógeno, alquilo, cicloalquilo, arilo, heterociclilo, aralquilo o heterociclilalquilo  
R<sup>9b</sup> es alquilo, cicloalquilo, arilo, heterociclilo, aralquilo o heterociclilalquilo,
- 15 donde los grupos R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup>, R<sup>8a</sup>, R<sup>9a</sup>, R<sup>8b</sup>, R<sup>9b</sup> y el anillo heterocíclico que forma los grupos R<sup>8</sup> y R<sup>9</sup> independientemente entre sí están opcionalmente sustituidos por uno o más grupos halógeno, hidroxilo, oxo, ciano, nitro, alquilo, haloalquilo, alcoxilo, haloalcoxilo, alquiltio, cicloalquilo, arilo, heterociclilo, aralquilo o heterociclilalquilo o por amino, que está opcionalmente sustituido por grupos alquilo, alqueno, alquino, arilo o heteroarilo;
- 20 R<sup>1</sup> es ciano, halógeno, haloalquilo, -CS-NH<sub>2</sub> o C(=NR<sup>10</sup>)S(O)<sub>n</sub>R<sup>11</sup>,  
R<sup>10</sup> es hidrógeno, alquilo, alqueno, alquino, cicloalquilo, arilo, heterociclilo, aralquilo, heterociclilalquilo, -CO-O-R<sup>12</sup>, -CO-R<sup>13</sup>, -SO-R<sup>14</sup>, -SO<sub>2</sub>-R<sup>15</sup>,  
R<sup>11</sup> es alquilo, alqueno, alquino, cicloalquilo, arilo, heterociclilo, aralquilo o heterociclilalquilo,  
R<sup>12</sup>, R<sup>13</sup>, R<sup>14</sup> y R<sup>15</sup> son alquilo, haloalquilo, alqueno, alquino, cicloalquilo, arilo, heterociclilo, aralquilo o heterociclilalquilo, donde los grupos R<sup>10</sup>, R<sup>12</sup>, R<sup>13</sup>, R<sup>14</sup> y R<sup>15</sup> están opcionalmente sustituidos por uno o más grupos
- 25 halógeno, hidroxilo, oxo, nitro, ciano, amino, alquilo, haloalquilo, alcoxilo, haloalcoxilo, alquiltio, cicloalquilo, arilo, heterociclilo o aralquilo,  
R<sup>2</sup> es alquilo, alqueno, alquino, cicloalquilo, arilo, heterociclilo, aralquilo o heterociclilalquilo, dicho grupo R<sup>2</sup> está opcionalmente sustituido por uno o más grupos halógeno, hidroxilo, oxo, alquilo, haloalquilo, alcoxilo, haloalcoxilo, alquiltio, cicloalquilo, arilo, heterociclilo, aralquilo o heterociclilalquilo,
- 30 R<sup>3</sup> es hidrógeno, alquilo, alqueno, alquino, cicloalquilo, arilo, heterociclilo, aralquilo o heterociclilalquilo, dicho R<sup>3</sup> está opcionalmente sustituido por uno o más grupos halógeno, hidroxilo, oxo, alquilo, haloalquilo, alcoxilo, haloalcoxilo, alquiltio, cicloalquilo, arilo, heterociclilo, aralquilo o heterociclilalquilo, o  
R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> se pueden unir entre sí para formar un sistema de anillo heterocíclico, saturado o insaturado, de cinco a nueve miembros, con hasta un total de tres heteroátomos de anillo seleccionados entre N, O y/o S, en el que al
- 35 menos un heteroátomo de anillo es S en estado oxidado o no oxidado, y cuyo sistema de anillo heterocíclico contiene opcionalmente condensados en dos átomos de C adyacentes sistemas de anillos carbocíclicos y/o heterocíclicos, saturados o insaturados.  
R<sup>4</sup> es hidrógeno, alquilo, alqueno, alquino o cicloalquilo, dicho grupo R<sup>4</sup> está opcionalmente sustituido por uno o más grupos halógeno, hidroxilo, oxo, alquilo, haloalquilo, alcoxilo, haloalcoxilo, alquiltio, cicloalquilo, arilo,
- 40 heterociclilo, aralquilo o heterociclilalquilo,  
R<sup>5</sup> es haloalquilo, haloalcoxilo, halógeno o -SF<sub>5</sub>, y  
R<sup>6</sup> es hidrógeno, halógeno, haloalquilo, nitro o -NR<sup>16</sup>R<sup>17</sup>,  
R<sup>16</sup> y R<sup>17</sup> son independientemente entre sí hidrógeno, alquilo, alqueno, alquino, cicloalquilo, arilo, heterociclilo,

- aralquilo, heterociclicilalquilo,  $-\text{CO-O-R}^{12}$ ,  $-\text{CO-R}^{13}$ ,  $-\text{SO-R}^{14}$ ,  $-\text{SO}_2\text{-R}^{15}$ , o  $\text{R}^{16}$  y  $\text{R}^{17}$  junto con el átomo N unido forman un anillo heterocíclico de cinco a siete miembros que contiene opcionalmente un átomo de oxígeno, azufre o nitrógeno adicional en el anillo, donde los grupos  $\text{R}^{16}$  y/o  $\text{R}^{17}$  o el anillo heterocíclico que forman los grupos  $\text{R}^{16}$  y  $\text{R}^{17}$  están opcionalmente sustituidos por uno o más grupos halógeno, hidroxilo, oxo, alquilo, haloalquilo, alcoxilo, haloalcoxilo, alquiltio, cicloalquilo, arilo, heterocicliilo, aralquilo, o heterociclicilalquilo,
- 5 X es  $-\text{S}-$ ,  $-\text{SO}-$ , o  $-\text{SO}_2-$   
 Y es  $-\text{O}-$ ,  $-\text{S}-$ ,  $-\text{SO}-$ , o  $-\text{SO}_2-$ ,  
 Z es  $\text{NR}^{18}\text{R}^{19}$ ,  
 $\text{R}^{18}$  es hidrógeno, alquilo, alqueno, alquino, arilo, heterocicliilo, aralquilo, heterociclicilalquilo dicho grupo  $\text{R}^{18}$  está  
 10 opcionalmente sustituido por uno o más grupos halógeno, hidroxilo, oxo, nitro, ciano, amino, alquilo, haloalquilo, alcoxilo, haloalcoxilo, alquiltio, cicloalquilo, arilo, heterocicliilo, aralquilo y/o por uno o más grupos  $-\text{CO-O-R}^{20}$ ,  $-\text{CO-R}^{21}$ ,  $-\text{SO-R}^{22}$  y/o  $-\text{SO}_2\text{-R}^{23}$ ,  
 $\text{R}^{20}$ ,  $\text{R}^{21}$ ,  $\text{R}^{22}$  y  $\text{R}^{23}$  son alquilo, haloalquilo, alqueno, alquino, cicloalquilo, arilo, heterocicliilo, aralquilo o heterociclicilalquilo, donde los grupos  $\text{R}^{20}$ ,  $\text{R}^{21}$ ,  $\text{R}^{22}$  y  $\text{R}^{23}$  están opcionalmente sustituidos por uno o más grupos  
 15 halógeno, hidroxilo, oxo, nitro, ciano, amino, alquilo, haloalquilo, alcoxilo, haloalcoxilo, alquiltio, cicloalquilo, arilo, heterocicliilo o aralquilo,  
 $\text{R}^{19}$  es hidrógeno,  $-\text{CO-O-R}^{24}$ ,  $-\text{CO-R}^{25}$ ,  $-\text{CO-CO-R}^{25}$ ,  $-\text{CO-CH}_2\text{-O-R}^{25}$ ,  $-\text{SO-R}^{26}$ ,  $-\text{SO}_2\text{-R}^{27}$ , alquilo, alqueno, alquino, cicloalquilo, arilo, heterocicliilo, aralquilo, heterociclicilalquilo dicho grupo  $\text{R}^{19}$  está opcionalmente sustituido por uno o más de halógeno, hidroxilo, oxo, nitro, ciano, amino, alquilo, haloalquilo, alcoxilo, haloalcoxilo, alquiltio, cicloalquilo, arilo, heterocicliilo, aralquilo,  $-\text{NH-CO-R}^{28}$ ,  $-\text{NHR}^{29}$ ,  $-\text{NR}^{30}\text{-CO-R}^{31}$ ,  $-\text{O-CO-R}^{32}$ ,  $-\text{O-R}^{33}$ ,  $-\text{SOp-R}^{34}$ ,  $=\text{N-R}^{35}$ ,  $=\text{N-NH-R}^{36}$ ,  $=\text{N-OR}^{37}$ ,  $=\text{N-OH}$ ,  $=\text{N-NH-C(=O)-NH}_2$ ,  $=\text{N-NH-C(=O)-NHR}^{31}$ ,  $=\text{N-NR}^{38}\text{-C(=O)-NH}_2$ ,  $=\text{N-NH-C(=S)-NH}_2$ ,  $=\text{N-NHC(=S)-NHR}^{31}$ ,  $=\text{N-NR}^{38}\text{-C(=S)-NH}_2$  y/o  $=\text{N-NH-C(O)-O-R}^{39}$   
 $\text{R}^{24}$ ,  $\text{R}^{25}$ ,  $\text{R}^{26}$ ,  $\text{R}^{27}$ ,  $\text{R}^{28}$ ,  $\text{R}^{29}$ ,  $\text{R}^{30}$ ,  $\text{R}^{31}$ ,  $\text{R}^{32}$ ,  $\text{R}^{33}$ ,  $\text{R}^{34}$ ,  $\text{R}^{35}$ ,  $\text{R}^{36}$ ,  $\text{R}^{37}$ ,  $\text{R}^{38}$  y  $\text{R}^{39}$  independientemente entre sí son alquilo, haloalquilo, alqueno, alquino, cicloalquilo, arilo, heterocicliilo, aralquilo o heterociclicilalquilo,  
 25 donde los grupos  $\text{R}^{24}$ ,  $\text{R}^{25}$ ,  $\text{R}^{26}$ ,  $\text{R}^{27}$ ,  $\text{R}^{28}$ ,  $\text{R}^{29}$ ,  $\text{R}^{30}$ ,  $\text{R}^{31}$ ,  $\text{R}^{32}$ ,  $\text{R}^{33}$ ,  $\text{R}^{34}$ ,  $\text{R}^{35}$ ,  $\text{R}^{36}$ ,  $\text{R}^{37}$ ,  $\text{R}^{38}$  y/o  $\text{R}^{39}$  están opcionalmente sustituidos por uno o más grupos halógeno, hidroxilo, oxo, nitro, ciano, amino, alquilo, haloalquilo, alcoxilo, haloalcoxilo, alquiltio, cicloalquilo, arilo, heterocicliilo o aralquilo, o  
 $\text{R}^{18}$  y  $\text{R}^{19}$  juntos con el átomo de N unido forman un anillo heterocíclico de cinco a siete miembros que contiene opcionalmente un átomo de oxígeno, azufre o nitrógeno adicional en el anillo y que está opcionalmente sustituido  
 30 por uno o más grupos halógeno, hidroxilo, oxo, alquilo, haloalquilo, alcoxilo, haloalcoxilo, alquiltio, cicloalquilo, arilo, heterocicliilo, aralquilo o heterociclicilalquilo, o  
 $\text{R}^{18}$  y  $\text{R}^{19}$  junto con el átomo de N unido forman un grupo imina  $-\text{N}=\text{CR}^{18a}\text{R}^{19a}$  o un grupo iminoéter  $-\text{N}=\text{CR}^{18a}(\text{OR}^{19a})$ ,  
 $\text{R}^{18a}$  es hidrógeno, alquilo, cicloalquilo, arilo, heterocicliilo, aralquilo o heterociclicilalquilo,  
 35  $\text{R}^{19a}$  es alquilo, cicloalquilo, arilo, heterocicliilo, aralquilo o heterociclicilalquilo, donde los grupos  $\text{R}^{18a}$  y  $\text{R}^{19a}$  independientemente entre sí están opcionalmente sustituidos por uno o más grupos halógeno, hidroxilo, oxo, ciano, nitro, alquilo, haloalquilo, alcoxilo, haloalcoxilo, alquiltio, cicloalquilo, arilo, heterocicliilo, aralquilo o heterociclicilalquilo o por amino, que está opcionalmente sustituido por grupos alquilo, alqueno, alquino, arilo o heteroarilo, y  
 40 n y p son independientemente entre sí 0, 1, o 2.
2. Un compuesto según se reivindica en la reivindicación 1, en el que W es  $=\text{N}$ ,  $=\text{CR}^7$ - o  $=\text{C}(\text{NR}^6\text{R}^9)$ - o una de sus sales plaguicidamente aceptable.
- 45 3. Un compuesto según se reivindica en la reivindicación 2, en el que W es  $=\text{C}$  (halógeno)-,  $=\text{C}(\text{NH}_2)$ -, o  $=\text{N}$ - o una de sus sales plaguicidamente aceptable.
4. Un compuesto según se reivindica en la reivindicación 2, en el que  $\text{R}^7$  es cloro o flúor o una de sus sales plaguicidamente aceptable.
- 50 5. Un compuesto según se reivindica en la reivindicación 1, en el que  $\text{R}^1$  es ciano, halógeno, haloalquilo o  $-\text{CS-NH}_2$  o una de sus sales plaguicidamente aceptable.
6. Un compuesto según se reivindica en la reivindicación 1, en el que  $\text{R}^2$  es alquilo o haloalquilo o una de sus sales plaguicidamente aceptable.
- 55 7. Un compuesto según se reivindica en la reivindicación 6, en el que  $\text{R}^2$  es haloalquilo ( $\text{C}_1\text{-C}_3$ ) o una de sus sales plaguicidamente aceptable.

8. Un compuesto según se reivindica en la reivindicación 1, en el que  $R^3$  es alquilo o haloalquilo o una de sus sales plaguicidamente aceptable.
9. Un compuesto según se reivindica en la reivindicación 8, en el que  $R^3$  es haloalquilo ( $C_1-C_3$ ) o una de sus sales plaguicidamente aceptable.
10. Un compuesto según se reivindica en la reivindicación 1, en el que  $R^2$  y  $R^3$  se unen entre sí para formar un sistema de anillo heterocíclico saturado o insaturado de cinco a ocho miembros con dos átomos de anillo de azufre o con un átomo de anillo de azufre y un átomo de anillo de oxígeno, o en el que  $R^2$  y  $R^3$  se unen entre sí para formar un sistema de anillo condensado que posee un sistema de anillo heterocíclico saturado o insaturado de cinco a ocho miembros con dos átomos de anillo de azufre o con un átomo de anillo de azufre y un átomo de anillo de oxígeno al cual se fusiona al menos un sistema de anillo carbocíclico y/o heterocíclico diferente a dos átomos de C adyacentes del sistema de anillo heterocíclico saturado o insaturado de cinco a ocho miembros o a una de sus sales plaguicidamente aceptable.
11. Un compuesto según se reivindica en la reivindicación 1, en el que  $R^4$  es hidrógeno, alquilo o haloalquilo o una de sus sales plaguicidamente aceptable.
12. Un compuesto según se reivindica en la reivindicación 11, en el que  $R^4$  es hidrógeno, alquilo ( $C_1-C_3$ ) o haloalquilo ( $C_1-C_3$ ) o una de sus sales plaguicidamente aceptable.
13. Un compuesto según se reivindica en la reivindicación 1, en el que  $R^5$  es halógeno, haloalquilo o  $-SF_5$ ; o una de sus sales plaguicidamente aceptable.
14. Un compuesto según se reivindica en la reivindicación 13, en el que  $R^5$  es halógeno, haloalcoxi ( $C_1-C_3$ ), haloalquilo ( $C_1-C_3$ ) o  $-SF_5$  o una de sus sales plaguicidamente aceptable.
15. Un compuesto según se reivindica en la reivindicación 1, en el que  $R^6$  es hidrógeno, halógeno, nitro o  $-NR^{16}R^{17}$  o una de sus sales plaguicidamente aceptable.
16. Un compuesto según se reivindica en la reivindicación 1, en el que X e Y son cada uno  $-S-$  o  $-SO-$  o  $-SO_2-$  o en el que Y es  $-O-$  y X es  $-S-$ ,  $-SO-$  o  $-SO_2-$  o una de sus sales plaguicidamente aceptable.
17. Un compuesto según se reivindica en la reivindicación 1, en el que Y es  $-S-$  o una de sus sales plaguicidamente aceptable.
18. Un compuesto según se reivindica en la reivindicación 1 o una de sus sales plaguicidamente aceptable, en el que:
- $R^1$  es haloalquilo ( $C_1-C_3$ ), halógeno, ciano,  $-CS-NH_2$  o  $C(=NR^{10})S(O)_nR^{11}$ ;  
 $R^2$  y  $R^3$  independientemente entre sí son alquilo ( $C_1-C_3$ ), haloalquilo ( $C_1-C_3$ ), o  $R^2$  y  $R^3$  se unen entre sí para formar un sistema de anillo heterocíclico saturado o insaturado de cinco a ocho miembros siendo al menos un heteroátomo de anillo azufre, siendo al menos otro heteroátomo de anillo azufre u oxígeno y opcionalmente, seleccionándose un tercer heteroátomo de anillo entre oxígeno, nitrógeno o azufre, o en el que  $R^2$  y  $R^3$  se unen entre sí para formar un sistema de anillo condensado que posee un sistema de anillo heterocíclico saturado o insaturado de cinco a ocho miembros siendo al menos un heteroátomo de anillo azufre, siendo al menos otro heteroátomo de anillo azufre u oxígeno y opcionalmente, seleccionándose un tercer heteroátomo de anillo entre oxígeno, nitrógeno o azufre, cuyo sistema de anillo de al menos uno de otro sistema de anillo carbocíclico y/o heterocíclico se fusiona a dos átomos de C adyacentes del sistema de anillo heterocíclico saturado o insaturado de cinco a ocho miembros.
- $R^4$  es hidrógeno, alquilo ( $C_1-C_3$ ) o haloalquilo ( $C_1-C_3$ ),  
 $R^5$  es  $-CF_3$ ,  $-OCF_3$ ,  $-SF_5$  o halógeno,  
 $R^6$  es hidrógeno, halógeno,  $-NO_2$ , o  $-NR^{16}R^{17}$ ,  
W es  $=C$  (halógeno),  $=C(NR^8R^9)-$  o  $=N-$ ,  
X es  $-S-$ ,  $-SO-$  o  $-SO_2-$ ,  
Y es  $-O-$ ,  $-S-$ ,  $-SO-$  o  $-SO_2-$ ,  
Z es  $NR^{18}R^{19}$ ,  
 $R^{10}$  es hidrógeno, alquilo ( $C_1-C_6$ ), haloalquilo ( $C_1-C_6$ ), alqueno ( $C_2-C_6$ ), alquino ( $C_2-C_6$ ),  $-(CH_2)_9-R^{40}$ ,  $-CO-R^{43}$ ,  $-CO_2$ -alquilo ( $C_1-C_6$ ),  $-S(O)_p-R^{41}$  o  $-S(O)_p-R^{40}$ , alquilo ( $C_1-C_6$ )  
 $R^{11}$  es o  $CH_2-R^{40}$ ,

- R<sup>18</sup> es hidrógeno, alqueno (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alquino (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), R<sup>40</sup> R<sup>41</sup>, cicloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) o alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) en donde el último grupo mencionado está sustituido o no sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), -S(O)<sub>m</sub>-R<sup>42</sup>, R<sup>40</sup>, cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), -CO<sub>2</sub>-(CH)<sub>q</sub>-R<sup>40</sup>, -CO<sub>2</sub>-(CH<sub>2</sub>)<sub>9</sub>-R<sup>41</sup> y -CO<sub>2</sub>-R<sup>42</sup>, R<sup>19</sup> es hidrógeno, -CO<sub>2</sub>R<sup>44</sup>, -COCOR<sup>45</sup>, -SO<sub>2</sub>R<sup>43</sup>, -COR<sup>43</sup> o -COCH<sub>2</sub>OR<sup>45</sup>, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-o haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)
- 5 donde los grupos alquilo o haloalquilo están sustituidos o no sustituidos por un radical seleccionado entre el grupo constituido por -NHCOR<sup>43</sup>, -NHR<sup>43</sup>, NR<sup>43</sup>COR<sup>43</sup>, -OCOR<sup>43</sup>, -OR<sup>40</sup>, -OR<sup>41</sup>, -S(O)<sub>p</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>R<sup>40</sup>, -S(O)<sub>p</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>R<sup>41</sup>, =N-R<sup>43</sup>, =NNHR<sup>43</sup>, =NOR<sup>43</sup>, =NOH, =NNHC(=O)R<sup>43</sup>, =NNHC(=O)NH<sub>2</sub>, =MNHC(=O)NHR<sup>31</sup>, =NNR<sup>43</sup>C(=O)NH<sub>2</sub>, =NNHC(=S)R<sup>43</sup>, =NNHC(=S)NH<sub>2</sub>, =NNHC(=S)NHR<sup>31</sup>, =NNR<sup>43</sup>C(=S)NH<sub>2</sub>, =NNHC(=O)O(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>R<sup>44</sup>, alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) y -S(O)<sub>m</sub>R<sup>42</sup>, en el que dos radicales alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) o -S(O)<sub>m</sub>R<sup>42</sup> se pueden unir al mismo átomo de carbono para
- 10 formar un grupo acetal, tioacetal o hemitioacetal o un acetal cíclico, tioacetal o hemitioacetal que contiene 5 o 6 átomos de anillo; o
- R<sup>18</sup> y R<sup>19</sup> junto con el nitrógeno-5 pueden formar también un grupo alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> iminoéter,
- R<sup>40</sup> es fenilo sustituido o no sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), -CN, -NO<sub>2</sub>, -S(O)<sub>p</sub>-R<sup>42</sup> y -NR<sup>46</sup>R<sup>47</sup>,
- 15 R<sup>41</sup> es heteroarilo sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>); -CN, -NO<sub>2</sub>, -S(O)<sub>p</sub>-R<sup>42</sup>, -NR<sup>46</sup>R<sup>47</sup>, -OH y oxo,
- R<sup>42</sup> es alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) o haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)
- R<sup>43</sup> es alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), cicloalquil (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>) o -(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>-R<sup>40</sup>,
- 20 R<sup>44</sup> es R<sup>40</sup>, alqueno (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>), alquino (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>) o alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) en donde el último grupo mencionado está sustituido o no sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), R<sup>40</sup>, -S(O)<sub>m</sub>-R<sup>40</sup> y cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), R<sup>45</sup> es -OR<sup>44</sup> o NR<sup>46</sup>R<sup>46</sup>R<sup>47</sup>,
- R<sup>16</sup>, R<sup>17</sup>, R<sup>46</sup> y R<sup>47</sup> independientemente entre sí son hidrógeno, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alqueno (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>),
- 25 haloalqueno (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), alquino (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>), cicloalquilo (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquil (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), R<sup>44</sup>, (CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>-R<sup>40</sup>; o R<sup>16</sup> y R<sup>17</sup> o R<sup>46</sup> y R<sup>47</sup> junto con el átomo de N unido forman un anillo saturado o insaturado de cinco a seis miembros que contiene opcionalmente un heteroátomo adicional en el anillo que se selecciona entre O, S y N, estando el anillo sustituido o no sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) y oxo,
- 30 m, n y p son cada uno independientemente 0, 1, o 2, q es 0 o 1, y cada heteroarilo en los radicales anteriormente mencionados es independientemente un radical heteroaromático que tiene de 3 a 7 átomos de anillo y 1, 2 o 3 heteroátomos en el anillo seleccionados entre el grupo constituido por N, O y S (incluyendo las formas oxidadas);
- 35 19. Un compuesto según se reivindica en la reivindicación 1, en el que
- R<sup>1</sup> es -CN o haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>),
- R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, X e Y se unen entre sí para formar sistemas de anillos de 1,3-ditiano o 1,3-ditolano,
- R<sup>4</sup> es hidrógeno,
- 40 W es =C (halógeno)- o =N-, y el resto de radicales son según se ha definido en la reivindicación 1 o una de sus sales plaguicidamente aceptable.
20. Un compuesto según se reivindica en la reivindicación 1, en el que
- R<sup>1</sup> es -CN,
- 45 R<sup>4</sup> es alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>) o haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), W es =C (halógeno)- o =C(NR<sup>6</sup>R<sup>9</sup>)-, y el resto de radicales son según se ha definido en la reivindicación 1 o una de sus sales plaguicidamente aceptable.
21. Un compuesto según se reivindica en la reivindicación 1, en el que
- 50 R<sup>1</sup> es -CN,
- R<sup>4</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, X e Y se unen entre sí para formar sistemas de anillos de 1,3-ditiano o 1,3-ditolano, es hidrógeno,
- W es =C (halógeno)- o =N-, y el resto de radicales son según se ha definido en la reivindicación 1 o una de sus sales plaguicidamente aceptable.
- 55 22. Un compuesto según se reivindica en la reivindicación 1, en el que
- R<sup>1</sup> es -CN,
- R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, X e Y se unen entre sí para formar sistemas de anillos de 1,3-ditiano o 1,3-ditolano,
- R<sup>4</sup> es hidrógeno,
- W es =C (halógeno)- o =N-,

$R^5$  es  $-CF_3$ ,  $-OCF_3$  o  $-SF_5$ ,  
 $R^6$  es halógeno o  $-NR^{16}R^{17}$ , y

el resto de radicales son según se ha definido en la reivindicación 1 o una de sus sales plaguicidamente aceptable.

5 23. Un compuesto según se reivindica en la reivindicación 18, en el que

$R^1$  es CN,

$R^2$ ,  $R^3$ , X e Y se unen entre sí para formar sistemas de anillos de 1,3-ditiano o 1,3-ditolano,

$R^4$  es hidrógeno,

10  $R^{18}$  es hidrógeno, alqueno (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) en donde el último grupo mencionado está sustituido o no sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>),  $-S(O)_mR^{42}$ ,  $R^{40}$ ,  $-CO_2-(CH_2)_q-R^{40}$ ,  $-CO_2(CH_2)_qR^{41}$  y  $-CO_2R^{42}$ ,

15  $R^{19}$  es hidrógeno,  $-CO_2R^{44}$ ,  $-COCOR^{45}$ ,  $-SO_2R^{43}$ ,  $-COR^{43}$ , o  $-COCH_2OR^{43}$ , alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) o haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) donde los grupos alquilo o haloalquilo están sustituidos o no sustituidos por un radical seleccionado entre el grupo constituido por  $-NHCOR^{43}$ ,  $-NHR^{43}$ ,  $-NR^{43}COR^{43}$ ,  $-OCOR^{43}$ ,  $-OR^{40}$ ,  $-OR^{41}$ ,  $-S(O)_p(CH_2)_qR^{40}$ ,  $-S(O)_p(CH_2)_qR^{41}$ ,  $=N-R^{43}$ ,  $=NNHR^{43}$ ,  $=NOR^{43}$ ,  $=NOH$ ,

20  $=NNHC(=O)R^{43}$ ,  $=NNHC(=O)NH_2$ ,  $=NNHC(=O)NHR^{31}$ ,  $=NNR^{43}C(=O)NH_2$ ,  $=NNHC(=S)R^{43}$ ,  $=NNHC(=S)NH_2$ ,  $=NNHC(=S)NHR^{31}$ ,  $=NNR^{43}C(=S)NH_2$ ,  $=NNHC(=O)O(CH_2)_qR^{44}$ , alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) y  $-S(O)_mR^{42}$ , en el que dos radicales alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) o  $-S(O)_mR^{42}$  pueden estar unidos al mismo átomo de carbono para formar un grupo acetal, tioacetal o hemitioacetal o un acetal, tioacetal o hemitioacetal cíclico que contiene 5 o 6 átomos de anillo,

W es =C (halógeno)- o =N-,

$R^5$  es  $-CF_3$ ,  $-OCF_3$ , o  $-SF_5$ ,

$R^6$  es halógeno o  $NR^{16}R^{17}$ , y

el resto de radicales son según se ha definido en la reivindicación 18 o una de sus sales plaguicidamente aceptable.

25

24. Un compuesto según se reivindica en la reivindicación 18, en el que

$R^1$  es CN,

$R^2$ ,  $R^3$ , X e Y se unen entre sí para formar sistemas de anillos de 1,3-ditiano o 1,3-ditolano,

30  $R^4$  es hidrógeno,

$R^{18}$  es hidrógeno, alqueno (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) en donde el último grupo mencionado está sustituido o no sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>),  $-S(O)_mR^{42}$ ,  $R^{40}$ ,  $-CO_2-(CH_2)_q-R^{40}$ ,  $-CO_2(CH_2)_qR^{41}$  y  $-CO_2R^{42}$ ,

35  $R^{19}$  es hidrógeno,  $-CO_2R^{44}$ ,  $-COCOR^{45}$ ,  $-SO_2R^{43}$ ,  $-COR^{43}$ , o  $-COCH_2OR^{43}$ , alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) o haloalquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) donde los grupos alquilo o haloalquilo están sustituidos o no sustituidos por un radical seleccionado entre el grupo constituido por  $-S(O)_mR^{42}$  en el que dos radicales alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) o  $-S(O)_mR^{42}$  pueden estar unidos al mismo átomo de carbono para formar un grupo acetal, tioacetal o hemitioacetal o un acetal, tioacetal o hemitioacetal cíclico que contiene 5 o 6 átomos de anillo,

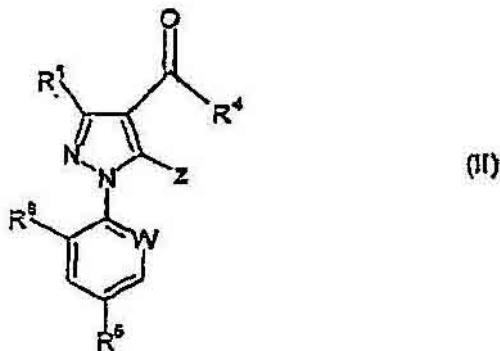
W es =C (halógeno)-,

40  $R^5$  es  $-CF_3$ ,

$R^6$  es halógeno, y

el resto de radicales son según se ha definido en la reivindicación 18 o una de sus sales plaguicidamente aceptable.

25. Un procedimiento para la preparación de compuestos de fórmula 1 según se reivindica en la  
 45 reivindicación 1 que comprende hacer reaccionar un compuesto de fórmula II



en la que  $R^1$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$ ,  $W$  y  $Z$  son según se ha definido en la reivindicación 1, con un compuesto de fórmula III,



- 5 en la que  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $X$  e  $Y$  son según se ha definido en la reivindicación 1, en presencia de un catalizador en un disolvente orgánico.
26. Una composición plaguicida que comprende como ingrediente activo al menos un compuesto de  
10 fórmula I según la reivindicación 1 o una de sus sales plaguicidamente aceptable.
27. Una composición plaguicida según la reivindicación 26 que comprende diluyentes y/o vehículos y/o  
agentes tensioactivos que son compatibles con dicho ingrediente activo.
- 15 28. Una composición plaguicida según la reivindicación 26 que es un medicamento veterinario y que está  
adaptada para la administración oral.
29. Uso de un compuesto de fórmula I según la reivindicación 1 o una de sus sales plaguicidamente  
aceptable en la preparación de un medicamento para el control de los numerosos artrópodos, especialmente  
20 insectos o ácaros o de nematodos de plantas.
30. Uso de un compuesto de fórmula I según cualquiera de las reivindicaciones 1 o 20 a 24 o una de sus  
sales plaguicidas para la preparación de un agente de control de plagas, preferiblemente de un insecticida y/o  
25 acaricida.
31. Uso de un compuesto de fórmula I según la reivindicación 1 o de una de sus sales plaguicidamente  
aceptable para la protección de plantas transgénicas contra las plagas.
32. Uso de un compuesto de fórmula I según la reivindicación 1 o de una de sus sales plaguicidamente  
30 aceptable en la preparación de un medicamento para el tratamiento de vertebrados, preferiblemente de animales  
domésticos, para el control de artrópodos y/o helmintos.
33. Un procedimiento para controlar plagas en un emplazamiento que comprende aplicar al anterior una  
cantidad eficaz de un compuesto de fórmula I o una de sus sales plaguicidamente aceptable según se reivindica en  
35 cualquiera de las reivindicaciones 1 a 24.
34. Un compuesto de fórmula I según la reivindicación 1, o una de sus sales plaguicidamente aceptable,  
para uso en el control de artrópodos y/o helmintos.
- 40 35. Un compuesto de fórmula I según la reivindicación 1, o una de sus sales plaguicidamente aceptable,  
para uso en el control de los numerosos artrópodos, especialmente insectos o ácaros, o de nematodos de plantas.
36. Una composición plaguicida según la reivindicación 26 que comprende además otra sustancia activa.