

19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 371 356**

51 Int. Cl.:  
**C07D 401/04** (2006.01)  
**A01N 43/56** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- 96 Número de solicitud europea: **06764009 .4**  
96 Fecha de presentación: **30.06.2006**  
97 Número de publicación de la solicitud: **1904475**  
97 Fecha de publicación de la solicitud: **02.04.2008**

54 Título: **COMPUESTOS DE N-TIO-ANTRANILAMIDA Y SU USO COMO PLAGUICIDAS.**

30 Prioridad:  
**07.07.2005 US 697166 P**

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:  
**30.12.2011**

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:  
**30.12.2011**

73 Titular/es:  
**BASF SE**  
**67056 Ludwigshafen , DE**

72 Inventor/es:  
**SCHMIDT, Thomas;**  
**PUHL, Michael;**  
**DICKHAUT, Joachim;**  
**BASTIAANS, Henricus Maria Martinus;**  
**RACK, Michael;**  
**CULBERTSON, Deborah L.;**  
**ANSPAUGH, Douglas D.;**  
**BRAUN, Franz-Josef;**  
**BUCCI, Toni;**  
**COTTER, Henry Van Tuyl;**  
**KUHN, David G. y**  
**OLOUMI-SADEGHI, Hassan**

74 Agente: **Carvajal y Urquijo, Isabel**

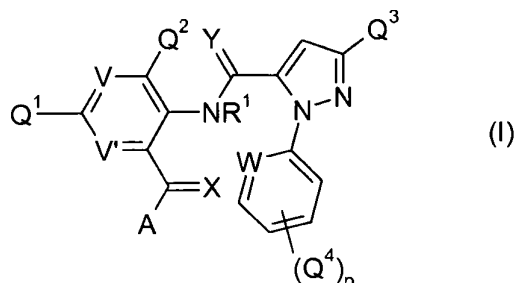
Aviso: En el plazo de nueve meses a contar desde la fecha de publicación en el Boletín europeo de patentes, de la mención de concesión de la patente europea, cualquier persona podrá oponerse ante la Oficina Europea de Patentes a la patente concedida. La oposición deberá formularse por escrito y estar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

ES 2 371 356 T3

DESCRIPCIÓN

Compuestos de N-tio-antranilamida y su uso como plaguicidas

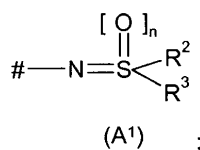
La presente invención se relaciona con compuestos de N-Tio-antranilamida de fórmula (I)



5 en donde

R<sup>1</sup> es hidrógeno; o alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquenilo C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>, alquinilo C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>, o cicloalquilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, cada uno de los cuales está sustituido o no sustituido con 1 a 5 grupos independiente seleccionados de entre halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, alcoxi C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquiltio C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alcoxycarbonilo C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>, alquilamino C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, di(alquil C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>)amino y cicloalquilamino C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>; o alquilcarbonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alcoxycarbonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub> alquilaminocarbonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, di(alquil C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>)aminocarbonilo;

A es A<sup>1</sup>



en donde

# indica el sitio de enlazamiento;

15 R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> cada uno independientemente son R<sup>6</sup>, o

R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> junto con el átomo de azufre al cual están unidos forman un anillo de 3 a 8 miembros saturado, parcialmente insaturado o insaturado que contiene de 1 a 4 heteroátomos seleccionados de entre oxígeno, nitrógeno, azufre, cuyo anillo puede estar fusionado con uno o dos anillos de 5 a 6 miembros saturados, parcialmente insaturado o insaturado que pueden contener de 1 a 4 heteroátomos seleccionados de entre oxígeno, nitrógeno, azufre, en donde todos los anillos anteriores están sustituidos o no sustituidos por cualquier combinación de 1 a 6 grupos R<sup>8</sup>;

G es oxígeno o azufre;

25 R<sup>6</sup> es alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>20</sub>, alquenilo C<sub>2</sub> - C<sub>20</sub>, alquinilo C<sub>2</sub> - C<sub>20</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, cicloalquenilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, cicloalquinilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, fenilo, naftilo, bifenilo, o un sistema de anillo de 3 a 8 miembros saturados, parcialmente insaturado o insaturado que contiene de 1 a 4 heteroátomos seleccionados de entre oxígeno, nitrógeno, azufre, en donde todos estos grupos están sustituidos o no sustituidos por una combinación de 1 a 6 grupos R<sup>8</sup>;

R<sup>8</sup> es R<sup>9</sup>; o dos grupos R<sup>8</sup> junto con los átomos a los cuales están unidos forman un sistema de anillo de 3 a 8 miembros saturado, parcialmente insaturado o insaturado que puede contener de 1 a 4 heteroátomos /heterogrupos seleccionados de entre oxígeno, nitrógeno, azufre, SO y SO<sub>2</sub>, y cuyo sistema de anillo está sustituido o no sustituido con cualquier combinación de 1 a 6 grupos R<sup>9</sup>.

30 R<sup>9</sup> es R<sup>10</sup>, R<sup>11</sup>, -C(=G)R<sup>10</sup>, -C(=NOR<sup>10</sup>)R<sup>10</sup>, -C(=NNR<sup>10</sup>)<sub>2</sub>R<sup>10</sup>, -C(=G)OR<sup>10</sup>, -C(=G)NR<sup>10</sup><sub>2</sub>, -OC(=G)R<sup>10</sup>, -OC(=G)OR<sup>10</sup>, -NR<sup>10</sup>C(=G)R<sup>10</sup>, -N[C(=G)R<sup>10</sup>]<sub>2</sub>, -NR<sup>10</sup>C(=G)OR<sup>10</sup>, -C(=G)NR<sup>10</sup>-NR<sup>10</sup><sub>2</sub>, -C(=G)NR<sup>10</sup>-NR<sup>10</sup>[C(=G)R<sup>10</sup>], -NR<sup>10</sup>-C(=G)NR<sup>10</sup><sub>2</sub>, -NR<sup>10</sup>-NR<sup>10</sup>C(=G)R<sup>10</sup>, -NR<sup>10</sup>-N[C(=G)R<sup>10</sup>]<sub>2</sub>, -N[(C=G)R<sup>10</sup>]-NR<sup>10</sup><sub>2</sub>, -NR<sup>10</sup>-NR<sup>10</sup>[(C=G)GR<sup>10</sup>], -NR<sup>10</sup>[(C=G)NR<sup>10</sup><sub>2</sub>, -NR<sup>10</sup>[C=NR<sup>10</sup>]R<sup>10</sup>, -NR<sup>10</sup>(C=NR<sup>10</sup>)NR<sup>10</sup><sub>2</sub>, -O-NR<sup>10</sup><sub>2</sub>, -O-NR<sup>10</sup>(C=G)R<sup>10</sup>, -SO<sub>2</sub>NR<sup>10</sup><sub>2</sub>, -NR<sup>10</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>10</sup>,



C<sub>10</sub>)aminocarbonilo y tri(C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>)-alquilsililo;

5 Q<sup>3</sup> es halógeno; o alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alqueno C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>, alquino C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquino C<sub>3</sub> - C<sub>10</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, alquil C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub> - cicloalquilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, haloalquil C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub> - cicloalquilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, cada uno no sustituido o independientemente sustituido con 1 a 2 grupos seleccionados de entre ciano, alcoxi C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquiltio C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquiltio C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquilsulfinilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, y alcocarbonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>; o

Q<sup>3</sup> es OR<sup>14</sup>, S(O)<sub>q</sub>R<sup>14</sup>, NR<sup>15</sup>R<sup>16</sup>, OS(O)<sub>2</sub>R<sup>17</sup>, NR<sup>16</sup>S(O)<sub>2</sub>R<sup>17</sup>, C(S)NH<sub>2</sub>, C(R<sup>18</sup>)=NOR<sup>18</sup>, cicloalquil C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, o di(alquil C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>)aminocarbonilo;

10 R<sup>14</sup> es alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alqueno C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>, alquino C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquino C<sub>3</sub> - C<sub>10</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, cicloalquil C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>, alquil C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - cicloalquilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> - alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>, haloalquil C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - cicloalquilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, o haloalquilcarbonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, cada uno sustituido o no sustituido con 1 R<sup>19</sup>;

15 R<sup>15</sup> es alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alqueno C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>, alquino C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquino C<sub>3</sub> - C<sub>10</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, alquil C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - cicloalquilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, haloalquil C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - cicloalquilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, o haloalquilcarbonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, cada uno sustituido o no sustituido con 1 R<sup>19</sup>;

R<sup>16</sup> es hidrógeno; o alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alqueno C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>, alquino C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquino C<sub>3</sub> - C<sub>10</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, alquil C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - cicloalquilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, o haloalquil C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - cicloalquilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, cada uno sustituido o no sustituido con 1 R<sup>19</sup>;

20 R<sup>17</sup> es alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alqueno C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>, alquino C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquino C<sub>3</sub> - C<sub>10</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, alquil C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - cicloalquilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, o haloalquil C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - cicloalquilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, cada uno sustituido o no sustituido con 1 R<sup>19</sup>;

R<sup>19</sup> es ciano, nitro, alcoxi C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquiltio C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquiltio C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquilsulfinilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alcocarbonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquilamino C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, o di(alquil C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>)amino; o

25 R<sup>19</sup> es fenilo o un anillo heteroaromático de 5 ó 6 miembros que contiene de 1 a 4 heteroátomos seleccionados de entre oxígeno, nitrógeno, azufre, el radical fenilo y estando el anillo heteroaromático sustituido o no sustituido con cualquier combinación de 1 a 3 grupos seleccionados de entre halógeno, ciano, nitro, alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alqueno C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>, alquino C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquino C<sub>3</sub> - C<sub>10</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, alcoxi C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquiltio C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquiltio C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquilsulfinilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquilamino C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, di(alquil C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>)amino, cicloalquilamino C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, alquil C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub> - cicloalquilamino C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, alquilcarbonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alcocarbonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, di(alquil C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>)aminocarbonilo y tri(C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>)-alquilsililo;

R<sup>18</sup> es el mismo o diferente: hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, o haloalquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>; q es 0, 1 ó 2;

35 Q<sup>4</sup> es halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, COOH, C(O)NH<sub>2</sub>, alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alqueno C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>, alquino C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquino C<sub>3</sub> - C<sub>10</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, alcoxi C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquiltio C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquiltio C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquilsulfinilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquilamino C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, di(alquil C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>)amino, cicloalquilamino C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, alquilcarbonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alcocarbonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub> - alquilaminocarbonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, di(alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>)aminocarbonilo o tri(C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>)-alquilsililo; o

40 Q<sup>4</sup> es fenilo, bencilo, benciloxi, fenoxi, un anillo heteroaromático de 5 ó 6 miembros que contiene de 1 a 4 heteroátomos seleccionados de entre oxígeno, nitrógeno, azufre o un sistema de anillo heterobíciclico fusionado aromático de 8, 9 ó 10 miembros que contiene de 1 a 4 heteroátomos seleccionados de entre oxígeno, nitrógeno, azufre, en donde cada uno de los sistemas de anillo anteriores está sustituido o no sustituido con cualquier combinación de 1 a 3 grupos seleccionados de entre halógeno, ciano, nitro, alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alqueno C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>, alquino C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquino C<sub>3</sub> - C<sub>10</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, alcoxi C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquiltio C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquilamino C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, di(alquil C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>)amino, cicloalquilamino C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, alquil C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub> - cicloalquilamino C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, alquilcarbonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alcocarbonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, di(alquil C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>)aminocarbonilo y tri(C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>)-alquilsililo;

X y Y son independientemente cada uno oxígeno o azufre;

50 V y V' son independientemente cada uno N o CQ<sup>2</sup>;

W es N, CH o CQ<sup>4</sup>;

n es 0 ó 1 ;

p es 0, 1, 2, 3, ó 4;

o los enantiómeros o sales o N-óxidos de los mismos.

- 5 Además, la presente invención se relaciona con procesos para preparación de los compuestos I, composiciones plaguicidas que contienen los compuestos I y métodos para el control de insectos, ácaros o nemátodos por medio del contacto del insecto, ácaro o nemátodo o su suministro alimenticio, hábitat o sitios de reproducción con una cantidad efectiva como plaguicida de compuestos o composiciones de fórmula I, excluyendo un método de tratamiento de humanos o animales. Además, la presente invención también se relaciona con un método de protección de plantas en crecimiento del ataque o infestación por parte de insectos o ácaros por medio de la aplicación al follaje de las plantas, o al suelo o al agua en los cuales ellos crecen, con una cantidad efectiva como plaguicida de composiciones o compuestos de fórmula I.

- 15 Esta invención también provee composiciones o compuestos para el tratamiento, control, prevención o protección de animales contra infestación o infección por parásitos que incluye administración o aplicación oral, tópica o parenteral a los animales de una cantidad efectiva como parasiticida de composiciones o compuestos de fórmula I.

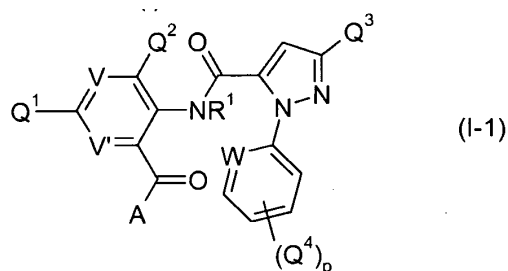
A pesar de los insecticidas, acaricidas y nematocidas comercialmente disponibles hoy en día, sigue presentándose daño a los cultivos, tanto en crecimiento como cosechados, provocado por insectos y nemátodos. Por lo tanto, existe la necesidad permanente de desarrollar nuevos y más efectivos agentes insecticidas, acaricidas y nematocidas.

- 20 Por lo tanto un objetivo de la presente invención fue el de proporcionar nuevas composiciones plaguicidas, nuevos compuestos y nuevos métodos para el control de insectos, ácaros o nemátodos y de protección de plantas en crecimiento del ataque o la infestación por parte de insectos, arácnidos o nemátodos.

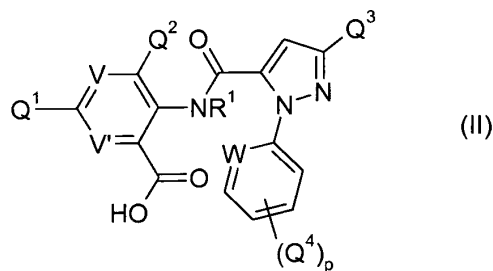
Hemos encontrado que estos objetivos se logran por medio de las composiciones y los compuestos de fórmula I. Además, hemos encontrado procesos para la preparación de los compuestos de fórmula I.

- 25 Los compuestos de antranilamida han sido descritos en una cantidad de solicitudes de patente (WO 01/70671, WO 03/015518, WO 03/015519, WO 04/046129). WO 03/016284 describe ciertos compuestos de N-Tio-antranilamida.

Los compuestos de la fórmula (I-1) en donde X y Y son oxígeno y otros sustituyentes son como se definió anteriormente para la fórmula (I)

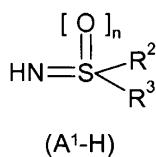


pueden ser preparados por reacción de un ácido carboxílico de la fórmula (II)



- 30 en donde las variables son como se definió para la fórmula (I) en la forma de un derivado activado de este ácido en

presencia de una base con un compuesto de la fórmula A1-H o A2-H, respectivamente, en donde las variables son como se definió para la fórmula (I).



5 Los derivados activados adecuados del ácido que pueden ser utilizados son, por ejemplo, anhídridos, azólidos, o haluros de ácido.

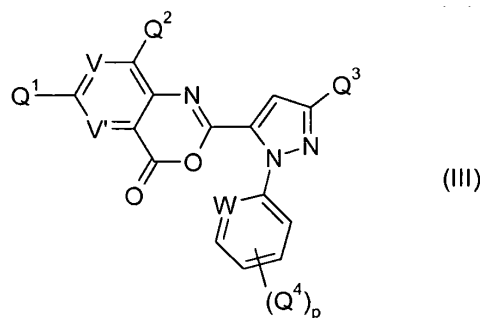
Los derivados activados del ácido pueden ser obtenidos de acuerdo a procedimientos conocidos en el arte, por ejemplo como se enlista en "Comprehensive Organic Reactions" VCH Publishers 1989, para el anhídrido: páginas 965 - 66, para los haluros de ácido: página 978.

10 Las bases adecuadas son, por ejemplo, aminas tales como trietilamina, diisopropiltilamina, piridina o lutidina o además hidruros alcalinos, hidróxidos, carbonatos, o hidróxidos de metal alcalinotérreo, carbonatos o bicarbonatos.

La cantidad de la base que puede ser utilizada en la reacción es usualmente de 1 a 5 moles con relación a 1 mol del compuesto (II).

15 La reacción se lleva a cabo convenientemente en un solvente inerte tal como diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, benceno, tolueno, éter dietílico o tetrahidrofurano, o mezclas de estos solventes, en un rango de temperatura entre 0°C y 100°C, preferiblemente entre 20°C y 50°C.

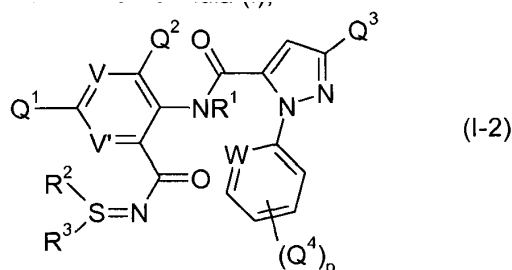
Un procedimiento preferido para la preparación de compuestos específicos de fórmula (I-1) involucra la reacción de A1-H con una benzoxazinona de fórmula (III)



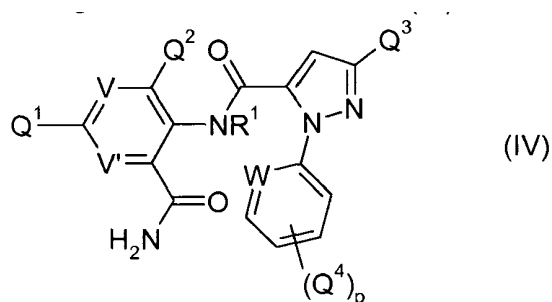
20 en donde las variables son como se definió para la fórmula (I). Los procedimientos típicos involucran la combinación de los compuestos A1-H con la benzoxazinona de fórmula (III) en un solvente inerte tal como diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, benceno, tolueno, éter dietílico o tetrahidrofurano, o mezclas de estos solventes, en un rango de temperatura entre 0°C y 100°C, preferiblemente entre 20°C y 50°C. La adición de una base puede ser benéfica. Las bases adecuadas son, por ejemplo, aminas terciarias tales como trietilamina, diisopropiltilamina, piridina o lutidina o además hidruros de alquilo, hidróxidos, carbonatos, o hidróxidos de metal alcalinotérreo, carbonatos o bicarbonatos. La cantidad de la base que puede ser utilizada en la reacción es usualmente de 1 a 5 moles con relación a 1 mol de compuesto (III).

30 Las benzoxazinonas están bien documentadas en la literatura química y se encuentran disponibles a través de métodos conocidos que involucran el acoplamiento ya sea de un ácido antranílico o un anhídrido isatoico con un cloruro de ácido. Para referencias para la síntesis y química de benzoxazinonas ver Jakobsen et al, Bioorganic and Medicinal Chemistry, 2000, 8, 2095 - 2103 y las referencias citadas allí. Ver también Coppola, J. Heterocyclic Chemistry, 1999, 36, 563 - 588. Las benzoxazinonas de fórmula III pueden ser preparadas también de acuerdo con los procedimientos descritos en WO 04/046129 o WO 04/011447 así como de acuerdo con las referencias citadas allí y las modificaciones adecuadas de los mismos.

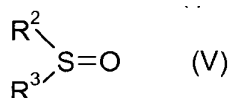
35 Los compuestos de la fórmula (I-2) en los cuales A es A<sup>1</sup>, n es 0, X y Y son oxígeno y las otras variables son como se definió para la fórmula (I).



pueden ser preparados por reacción de una amida de la fórmula (IV)



en donde las variables son como se definieron para la fórmula (I), con un sulfóxido de la fórmula (V),



5

en presencia de un agente de condensación, produciendo los compuestos de fórmula (I-2) con eliminación de agua. Los agentes de condensación adecuados son, por ejemplo, oxiclorigeno de fósforo, óxido de fósforo (V), cloruro de metanosulfonilo, cloruro de sulfurilo, tricloruro de azufre, trifluoruro de boro, dicitclohexilcarbodiimida, aril cianatos o anhídridos ácidos, preferiblemente anhídrido trifluoroacético o anhídrido trifluorometanosulfónico.

10 En los compuestos de la fórmula (I) preparados como se describió anteriormente en los cuales A es A<sup>1</sup>, n es 0, X y Y son oxígeno y las otras variables son como se definió para la fórmula (I), el átomo de azufre puede ser oxidado para producir los respectivos compuestos de la fórmula (I) en los cuales n es 1. Los agentes de oxidación adecuados son, por ejemplo, peryodato de sodio o perácidos orgánicos, tales como el ácido 3-cloroperbenzoico, ver por ejemplo Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, Bd. E11, p. 1299 ff., G. Thieme Verlag, Stuttgart 1985.

15 Los ácidos carboxílicos de fórmula (II) y las amidas de fórmula (IV) pueden ser preparados, por ejemplo, de acuerdo con los procedimientos descritos en WO 04/046129 o WO 04/011447 así como de acuerdo con las referencias citadas allí y las modificaciones adecuadas de los mismos.

20 Después de completarse la reacción, los compuestos de fórmula I pueden ser aislados por medio del empleo de métodos convencionales tales como la adición de la mezcla de reacción al agua, extracción con un solvente orgánico, concentración del extracto y similares. El compuesto (I) aislado puede ser purificado por medio de una técnica tal como cromatografía, recristalización y similares, si es necesario.

Los compuestos de fórmula A1-H pueden ser preparados de acuerdo con procedimientos conocidos en el arte, por ejemplo como se describe en US 6 136 983 y las referencias citadas allí.

25 Los sulfóxidos de fórmula V pueden ser obtenidos de acuerdo con procedimientos conocidos en el arte, por ejemplo como se describe en J. March, Advanced Organic Chemistry, 4th Edition, Wiley, 1992, p. 1297.

Los compuestos de fórmula I, II, III, IV, V, y los compuestos A1-H que no pueden ser preparados de acuerdo con los procedimientos anteriores, pueden ser preparados de acuerdo con modificaciones adecuadas de los procedimientos anteriores.

La preparación de los compuestos de fórmula I anteriores puede conducir a que ellos sean obtenidos como mezclas

de isómeros. Si se desea, estos pueden ser resueltos por medio de los métodos habituales para este propósito, tales como cristalización o cromatografía, también sobre adsorbato ópticamente activo, para producir los isómeros puros.

Las sales agronómicamente aceptables de los compuestos I pueden ser formadas en una forma habitual, por ejemplo por reacción con un ácido del anión en cuestión.

- 5 En esta especificación y en las reivindicaciones, se hará referencia a una cantidad de términos que deben ser definidos para que tengan el siguiente significado:

10 "Sal" como se lo utiliza aquí incluye aductos de compuestos I con ácido maléico, ácido dimaléico, ácido fumárico, ácido difumárico, ácido metano sulfénico, ácido metano sulfónico, y ácido succínico. Además, incluidas como "sales" están aquellas que pueden formar, por ejemplo, con aminas, metales, bases de metal alcalinotérreo o bases de amonio cuaternario, incluidos zwitteriones. Los hidróxidos metálicos y de metal alcalinotérreo adecuados como formadores de sales incluyen las sales de bario, aluminio, níquel, cobre, manganeso, cobalto, zinc, hierro, plata, litio, sodio, potasio, magnesio o calcio. Los formadores de sales adicionales incluyen cloruros, sulfatos, acetatos, carbonatos, hidruros, e hidróxido. Las sales deseables incluyen aductos de compuestos I con ácido maleico, ácido dimaleico, ácido fumárico, ácido difumárico, y ácido metano sulfónico.

- 15 "Halógeno" se entiende que significa flúor, cloro, bromo y yodo.

20 El término "alquilo" como se lo utiliza aquí se refiere a un grupo hidrocarbonado saturado ramificado o no ramificado que tiene de 1 a 10 átomos de carbono, tales como, y preferiblemente, alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>, por ejemplo metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, butilo, 1-metilpropilo, 2-metilpropilo, 1,1-dimetiletilo, pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-dimetilpropilo, 1-etilpropilo, hexilo, 1,1-dimetilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, 1-metilpentilo, 2-metilpentilo, 3-metilpentilo, 4-metilpentilo, 1,1-dimetilbutilo, 1,2-dimetilbutilo, 1,3-dimetilbutilo, 2,2-dimetilbutilo, 2,3-dimetilbutilo, 3,3-dimetilbutilo, 1-etilbutilo, 2-etilbutilo, 1,1,2-trimetilpropilo, 1,2,2-trimetilpropilo, 1-etil-1-metilpropilo y 1-etil-2-metilpropilo.

25 El término "haloalquilo" como se lo utiliza aquí se refiere a un grupo alquilo de cadena recta o ramificada que tiene de 1 a 10 átomos de carbono (como se mencionó anteriormente), donde algunos o todos los átomos de hidrógeno en estos grupos pueden ser reemplazados por átomos de halógeno como se mencionó anteriormente, por ejemplo haloalquilo C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>, tal como clorometilo, bromometilo, diclorometilo, triclorometilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorofluorometilo, diclorofluorometilo, clorodifluorometilo, 1-cloroetilo, 1-bromoetilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2-cloro-2-fluoroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 2,2-dicloro-2-fluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo y pentafluoroetilo;

30 En forma similar, "alcoxi" y "alquiltio" se refieren a grupos alquilo de cadena recta o ramificados que tienen de 1 a 10 átomos de carbono (como se mencionó anteriormente) enlazados a través de enlaces de oxígeno o azufre, respectivamente, a cualquier enlace en el grupo alquilo. Los ejemplos incluyen metoxi, etoxi, propoxi, isopropoxi, metiltio, etiltio, propiltio, isopropiltio, y n-butiltio.

35 En forma similar, "alquilamino" se refiere a un átomo de nitrógeno que transporta 1 o 2 grupos alquilo de cadena recta o ramificada que tienen de 1 a 10 átomos de carbono (como se mencionó anteriormente) que pueden ser iguales o diferentes. Los ejemplos incluyen metilamino, dimetilamino, etilamino, dietilamino, metiletilamino, isopropilamino, o metilisopropilamino.

40 En forma similar, "alquilsulfínico" y "alquilsulfónico" se refieren a grupos alquilo de cadena recta o ramificada que tienen de 1 a 10 átomos de carbono (como se mencionó anteriormente) enlazados a través de enlace -S(=O)- o -S(=O)<sub>2</sub>, respectivamente, con cualquier enlace en el grupo alquilo. Los ejemplos incluyen metilsulfínico y metilsulfónico.

El término "alquilcarbonilo" se refiere a grupos alquilo de cadena recta o ramificada que tienen de 1 a 10 átomos de carbono (como se mencionó anteriormente) enlazados a través de un enlace -C(=O)-, respectivamente, con cualquier enlace en el grupo alquilo. Los ejemplos incluyen acetilo, propionilo, butirilo, o 2-metilbutirilo.

45 El término "alqueno" como se lo utiliza aquí se refiere a un grupo hidrocarburo insaturado ramificado o no ramificado que tiene de 2 a 6 átomos de carbono y un doble enlace en cualquier posición, tal como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-metil-etenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-1-propenilo, 2-metil-1-propenilo, 1-metil-2-propenilo, 2-metil-2-propenilo; 1-pentenilo, 2-pentenilo, 3-pentenilo, 4-pentenilo, 1-metil-1-butenilo, 2-metil-1-butenilo, 3-metil-1-butenilo, 1-metil-2-butenilo, 2-metil-2-butenilo, 3-metil-2-butenilo, 1-metil-3-butenilo, 2-metil-3-butenilo, 3-metil-3-butenilo, 1,1-dimetil-2-propenilo, 1,2-dimetil-1-propenilo, 1,2-dimetil-2-propenilo, 1-etil-1-propenilo, 1-etil-2-propenilo, 1-hexenilo, 2-hexenilo, 3-hexenilo, 4-hexenilo, 5-hexenilo, 1-metil-1-pentenilo, 2-metil-1-pentenilo, 3-metil-1-pentenilo, 4-metil-1-pentenilo, 1-metil-2-pentenilo, 2-metil-2-pentenilo, 3-metil-2-pentenilo, 4-metil-2-



5 pentenilo, 1-metil-3-pentenilo, 2-metil-3-pentenilo, 3-metil-3-pentenilo, 4-metil-3-pentenilo, 1-metil-4-pentenilo, 2-metil-4-pentenilo, 3-metil-4-pentenilo, 4-metil-4-pentenilo, 1,1-dimetil-2-butenilo, 1,1-dimetil-3-butenilo, 1,2-dimetil-1-butenilo, 1,2-dimetil-2-butenilo, 1,2-dimetil-3-butenilo, 1,3-dimetil-1-butenilo, 1,3-dimetil-2-butenilo, 1,3-dimetil-3-butenilo, 2,2-dimetil-3-butenilo, 2,3-dimetil-1-butenilo, 2,3-dimetil-2-butenilo, 2,3-dimetil-3-butenilo, 3,3-dimetil-1-butenilo, 3,3-dimetil-2-butenilo, 1-etil-1-butenilo, 1-etil-2-butenilo, 1-etil-3-butenilo, 2-etil-1-butenilo, 2-etil-2-butenilo, 2-etil-3-butenilo, 1,1,2-trimetil-2-propenilo, 1-etil-1-metil-2-propenilo, 1-etil-2-metil-1-propenil y 1-etil-2-metil-2-propenilo;

El término "alquínilo" como se lo utiliza aquí se refiere a un grupo hidrocarburo insaturado ramificado o no ramificado que contiene al menos un triple enlace, tal como etínilo, propínilo, 1-butinilo, 2-butinilo, y similares.

10 Un sistema de anillo de 3 a 8 miembros saturado, parcialmente insaturado o insaturado que contiene de 1 a 4 heteroátomos seleccionados de entre oxígeno, nitrógeno, azufre, es un sistema de anillos en donde dos átomos de oxígeno no deben estar en posiciones adyacentes y en donde al menos 1 átomo de carbono debe estar en el sistema de anillo por ejemplo tiofeno, furano, pirrol, tiazol, oxazol, imidazol, isotiazol, isoxazol, pirazol, 1,3,4-oxadiazol, 1,3,4-tiadiazol, 1,3,4-triazol, 1,2,4-oxadiazol, 1,2,4-tiadiazol, 1,2,4-triazol, 1,2,3-triazol, 1,2,3,4-tetrazol, benzo[b]tiofeno, 15 benzo[b]furano, indol, benzo[c]tiofeno, benzo[c]furano, isoindol, benzoxazol, benzotiazol, benzimidazol, benzisoxazol, benzisotiazol, benzopirazol, benzotiadiazol, benzotriazol, dibenzofurano, dibenzotiofeno, carbazol, piridina, pirazina, pirimidina, piridazina, 1,3,5-triazina, 1,2,4-triazina, 1,2,4,5-tetrazina, quinolina, isoquinolina, quinoxalina, quinazolina, cinolina, 1,8-naftiridina, 1,5-naftiridina, 1,6-naftiridina, 1,7-naftiridina, ftalazina, 20 piridopirimidina, purina, pteridina, 4H-quinolizina, piperidina, pirrolidina, oxazolina, tetrahidrofurano, tetrahidropirano, isoxazolidina o tiazolidina.

25 Un sistema de anillo de 3 a 8 miembros saturado, parcialmente insaturado o insaturado que contiene de 1 a 4 heteroátomos seleccionados de entre oxígeno, nitrógeno, azufre también es por ejemplo un heterociclo de 5 ó 6 miembros saturado, parcialmente insaturado o insaturado que contiene de 1 a 4 heteroátomos seleccionados de entre oxígeno, nitrógeno y azufre, tal como piridina, pirimidina, (1,2,4)-oxadiazol, (1,3,4)-oxadiazol, pirrol, furano, tiofeno, oxazol, tiazol, imidazol, pirazol, isoxazol, 1,2,4-triazol, tetrazol, pirazina, piridazina, oxazolina, tiazolina, tetrahidrofurano, tetrahidropirano, morfolina, piperidina, piperazina, pirrolina, pirrolidina, oxazolidina, tiazolidina, oxirano u oxetano ; o

30 un heterociclo de 5 ó 6 miembros saturado, parcialmente insaturado o insaturado que contiene 1 átomo de nitrógeno y de 0 a 2 heteroátomos adicionales seleccionados de entre oxígeno, nitrógeno y azufre, preferiblemente de entre oxígeno y nitrógeno, tal como piperidina, piperazina y morfolina.

Preferiblemente, este sistema de anillo es un sistema de anillo de 3 a 6 miembros saturado, parcialmente insaturado o insaturado que contiene de 1 a 4 heteroátomos seleccionados de entre oxígeno, nitrógeno, azufre, en donde dos átomos de oxígeno no deben estar en posiciones adyacentes y en donde al menos 1 átomo de carbono debe estar en el sistema de anillo.

35 Más preferiblemente, este sistema de anillo es un radical de piridina, pirimidina, (1,2,4)-oxadiazol, 1,3,4-oxadiazol, pirrol, furano, tiofeno, oxazol, tiazol, imidazol, pirazol, isoxazol, 1,2,4-triazol, tetrazol, pirazina, piridazina, oxazolina, tiazolina, tetrahidrofurano, tetrahidropirano, morfolina, piperidina, piperazina, pirrolina, pirrolidina, oxazolidina, tiazolidina, oxirano o oxetano.

40 Tri(C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>)alquilsililo se refiere a un átomo de silicio que tiene 3 grupos alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub> de cadena recta o ramificada como se definió anteriormente que pueden ser iguales o diferentes. Los ejemplos incluyen trimetilsililo, trietilsililo, trifenilsililo o triisopropilsililo.

Cicloalquilo: anillos monocíclicos de átomos de carbono saturados de 3 a 6 u 8, por ejemplo cicloalquilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> tales como ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo, o ciclooctilo.

45 Con respecto al uso pretendido de los compuestos de fórmula I, se da preferencia particular a los siguientes significados de los sustituyentes, en cada caso por si mismos o en combinación:

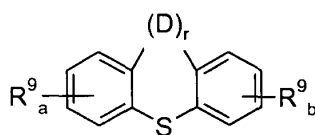
Un compuesto de fórmula I en donde R<sup>1</sup> es hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>, ciano, alquilsulfonilo C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>, o alcoxicarbonilo C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>, preferiblemente hidrógeno o alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>, más preferiblemente hidrógeno.

Un compuesto de fórmula I en donde A es A<sup>1</sup>.

50 Un compuesto de fórmula I en donde R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> son cada uno independientemente R<sup>6</sup>, o R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> junto con el átomo de azufre al cual están unidos forman un anillo de 3 a 8 miembros saturado, parcialmente insaturado o insaturado que contiene de 1 a 4 heteroátomos seleccionados de entre oxígeno, nitrógeno, azufre, cuyo anillo puede estar

fusionado con uno o dos anillos de 5 a 6 miembros saturados, parcialmente insaturados o insaturados que pueden contener de 1 a 4 heteroátomos seleccionados de entre oxígeno, nitrógeno, azufre, en donde todos los anillos anteriores están sustituidos o no sustituidos por una combinación de 1 a 6 grupos  $R^8$ .

- 5 More preferiblemente,  $R^2$  and  $R^3$  each independently are  $R^6$  o  $R^2$  and  $R^3$  junto con the azufre atom to which they are attached form un anillo de 3 a 8 miembros saturado, parcialmente insaturado o insaturado which contains 1 to 4 heteroátomos seleccionados de entre oxígeno, nitrógeno, azufre, which ring can be fused con one o dos saturated, parcialmente insaturado o insaturado 5- to 6-membered rings which may contain 1 to 4 heteroátomos seleccionados de entre oxígeno, nitrógeno, azufre, en donde all de the above rings están sustituidos o no sustituidos por una combinación de 1 to 6 grupos  $R^8$ .
- 10 Incluso más preferidos son los compuestos de fórmula I en donde  $R^2$  y  $R^3$  son independientemente cada uno  $R^6$ , preferiblemente hidrógeno, alquilo  $C_1 - C_{20}$ , alqueno  $C_2 - C_{20}$ , alquino  $C_2 - C_{20}$ , cicloalquilo  $C_3 - C_8$ , cicloalqueno  $C_3 - C_8$ , cicloalquino  $C_3 - C_8$ , fenilo, naftilo, bifenilo, o un anillo de 3 a 8 miembros saturado, parcialmente insaturado o insaturado que contiene de 1 a 4 heteroátomos seleccionados de entre oxígeno, nitrógeno, azufre, en donde todos estos grupos están sustituidos o no sustituidos por una combinación de 1 a 6 grupos  $R^9$ .
- 15 Especialmente preferidos son los compuestos de fórmula I en donde  $R^2$  y  $R^3$  son independientemente cada uno alquilo  $C_1 - C_{10}$ , alqueno  $C_2 - C_{10}$ , alquino  $C_2 - C_{10}$ , cicloalquilo  $C_3 - C_8$ , o fenilo, en donde estos grupos están sustituidos o no sustituidos por una combinación de 1 a 6 grupos seleccionados de entre  $R^{10}$  o  $R^{11}$ , y  $R^{10}$  es alquilo  $C_1 - C_{10}$ , cicloalquilo  $C_3 - C_8$ , alquilo  $C_1 - C_{10}$  - cicloalquilo  $C_3 - C_8$  o un anillo de 3 a 8 miembros saturado, parcialmente insaturado o insaturado que contiene 1 a 4 heteroátomos seleccionados de entre oxígeno, nitrógeno, azufre, en donde estos grupos están sustituidos o no sustituidos con cualquier combinación de 1 a 6 grupos  $R^{11}$ , y
- 20  $R^{11}$  es halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, mercapto, amino, formilo, alquilcarbonilo  $C_1 - C_{10}$ , alcoxi  $C_1 - C_{10}$ , alquenoilo  $C_2 - C_{10}$ , alquenoilo  $C_2 - C_{10}$ , haloalcoxi  $C_1 - C_{10}$ , cicloalcoxi  $C_3 - C_8$ , halocicloalcoxi  $C_3 - C_8$ , alcocarbonilo  $C_1 - C_{10}$ , cicloalcoxycarbonilo  $C_3 - C_8$ , alquilcarbonilo  $C_1 - C_{10}$ , cicloalquilcarbonilo  $C_3 - C_8$ , haloalcoxycarbonilo  $C_1 - C_{10}$ , haloalquilcarbonilo  $C_1 - C_{10}$ , alcanamido  $C_1 - C_{10}$ , cicloalcanamido  $C_3 - C_8$ , alquiltio  $C_1 - C_{10}$ , alquenoiltio  $C_2 - C_{10}$ , alquinoiltio  $C_2 - C_{10}$ , haloalquiltio  $C_1 - C_{10}$ , cicloalquiltio  $C_3 - C_8$ , halocicloalquiltio  $C_3 - C_8$ , cicloalquil  $C_3 - C_8$  - alquiltio  $C_1 - C_4$ , alquilsulfino  $C_1 - C_{10}$ , alquenoilsulfino  $C_2 - C_{10}$ , alquinoilsulfino  $C_2 - C_{10}$ , haloalquilsulfino  $C_1 - C_{10}$ , cicloalquilsulfino  $C_3 - C_8$ , halocicloalquenoilsulfino  $C_3 - C_8$ , cicloalquil  $C_3 - C_8$  - alquilsulfino  $C_1 - C_4$ , alquilsulfono  $C_1 - C_{10}$ , alquenoilsulfono  $C_2 - C_{10}$ , alquinoilsulfono  $C_2 - C_{10}$ , haloalquilsulfono  $C_1 - C_{10}$ , cicloalquilsulfono  $C_3 - C_8$ , halocicloalquilsulfono  $C_3 - C_8$ , cicloalquil  $C_3 - C_8$  - alquilsulfono  $C_1 - C_4$ , di(alquil  $C_1 - C_{10}$ )amino, alquilamino  $C_1 - C_{10}$ , alquenoilamino  $C_2 - C_{10}$ , alquinoilamino  $C_2 - C_{10}$ , alquil  $C_1 - C_{10}$  - alquenoilamino  $C_2 - C_{10}$ , alquil  $C_1 - C_{10}$  - alquinoilamino  $C_2 - C_{10}$ , haloalquilamino  $C_1 - C_{10}$ , haloalquenoilamino  $C_2 - C_{10}$ , cicloalquilamino  $C_3 - C_8$ , tri(alquil  $C_1 - C_{10}$ )silo, arilo, ariloxi, ariltio, arilamino, en donde arilo es fenilo, naftilo o bifenilo, o un sistema de anillo de 3 a 8 miembros saturado, parcialmente insaturado o insaturado que contiene de 1 a 4 heteroátomos seleccionados de entre oxígeno, nitrógeno, azufre,
- 25 en donde estos arilo y estos sistemas de anillo heterocíclico están sustituidos o no sustituidos con cualquier combinación de 1 a 6 grupos seleccionados de entre halógeno, ciano, nitro, amino, hidroxilo, mercapto, alquilo  $C_1 - C_4$ , haloalquilo  $C_1 - C_4$ , alcoxi  $C_1 - C_4$ , haloalcoxi  $C_1 - C_4$ , alquiltio  $C_1 - C_4$ , haloalquiltio  $C_1 - C_4$ , di(alquil  $C_1 - C_4$ )amino y alquilamino  $C_1 - C_4$ .
- 30 Los más preferidos son los compuestos de fórmula I en donde  $R^2$  y  $R^3$  son independientemente cada uno alquilo  $C_1 - C_{10}$ , alqueno  $C_2 - C_{10}$ , alquino  $C_2 - C_{10}$ , cicloalquilo  $C_3 - C_8$ , o fenilo, en donde estos grupos están sustituidos o no sustituidos por una combinación de 1 a 6 grupos seleccionados de entre  $R^{11}$ , y
- 35  $R^{11}$  es halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, mercapto, amino, alcoxi  $C_1 - C_{10}$ , haloalcoxi  $C_1 - C_{10}$ , cicloalcoxi  $C_3 - C_8$ , alcocarbonilo  $C_1 - C_{10}$ , alquilcarbonilo  $C_1 - C_{10}$ , alcanamido  $C_1 - C_{10}$ , alquiltio  $C_1 - C_{10}$ , alquilsulfino  $C_1 - C_{10}$ , alquilsulfono  $C_1 - C_{10}$ , di(alquil  $C_1 - C_{10}$ )amino o alquilamino  $C_1 - C_{10}$ .
- 40 También se prefieren los compuestos de fórmula I en donde  $R^2$  y  $R^3$  junto con el átomo de azufre al cual están unidos forman un heterociclo de 5 ó 6 miembros que además del átomo de azufre contiene 1 átomo de nitrógeno o 1 átomo de oxígeno, en donde estos grupos están sustituidos o no sustituidos por una combinación de 1 a 6 grupos seleccionados de entre cualquier combinación de 1 a 6 grupos seleccionados de entre halógeno, ciano, nitro, amino, hidroxilo, mercapto, alquilo  $C_1 - C_4$ , haloalquilo  $C_1 - C_4$ , alcoxi  $C_1 - C_4$ , haloalcoxi  $C_1 - C_4$ , alquiltio  $C_1 - C_4$ , haloalquiltio  $C_1 - C_4$ , di(alquil  $C_1 - C_4$ ) amino y alquilamino  $C_1 - C_4$ .
- 50 También se prefieren los compuestos de fórmula I en donde  $R^2$  y  $R^3$  junto con el átomo de azufre al cual están unidos forman una unidad  $SR^2R^3$  de la siguiente fórmula:



en donde

r es 0 ó 1;

D es un enlace directo, alquileo C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> recto o ramificado, O, S(O)<sub>0,1,2</sub> o NR<sup>j</sup>, preferiblemente CH<sub>2</sub>, O, o NR<sup>j</sup>;

5 R<sup>9</sup> es como se definió anteriormente para compuestos de fórmula I;

R<sup>j</sup> es hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>, alquilcarbonilo C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>, alcoxicarbonilo C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>, di(alquil C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)aminocarbonilo, o alquilsulfonilo C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>;

a, b son iguales o diferentes 0, 1, 2, 3 ó 4, preferiblemente 0, 1, ó 2.

Cuando r = 0 entonces ambos grupos arilo no forman puente.

10 Se prefieren los compuestos de fórmula I en donde R<sup>9</sup> es R<sup>10</sup>, R<sup>11</sup>, o -C(=O)R<sup>10</sup>, -C(=NOR<sup>10</sup>)R<sup>10</sup>, -C(=NNR<sup>10</sup>)R<sup>10</sup>, -C(=O)OR<sup>10</sup>, -C(=O)NR<sup>10</sup>, -C(=O)NR<sup>10</sup>-NR<sup>10</sup>, -C(=O)NR<sup>10</sup>-NR<sup>10</sup>[C(=O)R<sup>10</sup>], -SO<sub>2</sub>NR<sup>10</sup>, -OR<sup>10</sup>, -NR<sup>10</sup>, o -SR<sup>10</sup>.

15 Se prefieren los compuestos de fórmula I en donde Q<sup>1</sup> es hidrógeno, halógeno, ciano, SCN, nitro, hidroxilo, alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, alcoxi C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquiltio C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquiltio C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquilsulfoniloxi C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquilamino C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub> o di(alquil C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>)amino, más preferiblemente hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> o haloalquilo C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>.

Se prefieren los compuestos de fórmula I en donde Q<sup>2</sup> es halógeno, ciano, SCN, nitro, hidroxilo, alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, alcoxi C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquiltio C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquiltio C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquilsulfoniloxi C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquilamino C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub> o di(alquil C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>)amino, más preferiblemente halógeno, ciano, alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> o haloalquilo C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>.

20 Se prefieren los compuestos de fórmula I en donde Q<sup>3</sup> es halógeno, alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquino C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, cada uno no sustituido o independientemente sustituido con 1 a 2 grupos seleccionados de entre ciano, alcoxi C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub> o alquiltio C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, o

Q<sup>3</sup> es OR<sup>14</sup>, S(O)<sub>q</sub>R<sup>14</sup>, NR<sup>15</sup>R<sup>16</sup>, OS(O)<sub>2</sub>R<sup>17</sup>, C(S)NH<sub>2</sub>, C(R<sup>18</sup>)=NOR<sup>18</sup>; y

R<sup>14</sup> es alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub> o cicloalquilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> sustituido o no sustituido con 1 R<sup>19</sup>; y

25 R<sup>15</sup> es alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alqueno C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>, alquino C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>, cada uno sustituido o no sustituido con 1 R<sup>19</sup>; y

R<sup>16</sup> es hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alqueno C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>, alquino C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>, cada uno sustituido o no sustituido con 1 R<sup>19</sup>; y

30 R<sup>17</sup> es alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alqueno C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>, alquino C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, cada uno sustituido o no sustituido con 1 R<sup>19</sup>; y

R<sup>18</sup> es hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, o haloalquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>; y

R<sup>19</sup> es ciano, nitro, alcoxi C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquiltio C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, o haloalquiltio C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>.

Los más preferidos son los compuestos de fórmula I en donde Q<sup>3</sup> es halógeno, haloalquilo C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> o haloalcoxi C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>.

35 Se prefieren los compuestos de fórmula I en donde Q<sup>4</sup> es halógeno, ciano, nitro, alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alcoxi C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquiltio C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquiltio C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, o alcoxicarbonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, preferiblemente halógeno o haloalquilo C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>.

Se prefieren los compuestos de fórmula I en donde X y Y son oxígeno.

Se prefieren los compuestos de fórmula I en donde W es N o CQ<sup>4</sup>, preferiblemente N.

Se prefieren los compuestos de fórmula I en donde n es 0.

- 5 Se prefieren los compuestos de fórmula I en donde V y V' son independientemente cada uno N o CH. Preferiblemente, tanto V como V' son CH.

Especialmente preferidos son los compuestos de N-tio-antranilamida de fórmula I en donde

W es N;

R<sup>1</sup> es hidrógeno;

Q<sup>1</sup> es hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> o haloalquilo C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>;

- 10 Q<sup>2</sup> es halógeno, ciano, alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> o haloalquilo C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>;

Q<sup>3</sup> es halógeno, haloalquilo C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> o haloalcoxi C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>;

Q<sup>4</sup> es halógeno o haloalquilo C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> y está en la posición orto; y

p es 1.

También, se prefieren especialmente los compuestos de N-tio-antranilamida de fórmula I en donde A es A<sup>1</sup>; y

- 15 R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> son independientemente cada uno fenilo, alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>, o alquino C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>, que están sustituidos o no sustituidos con cualquier combinación de 1 a 6 grupos seleccionados de entre halógeno and ciano.

Los más preferidos son los compuestos de fórmula I en donde R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> son independientemente cada uno alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>, fenilmetilo, alilmetilo, propargilmetilo, o junto con el átomo de azufre al cual están unidos forman un anillo saturado de 3 a 6 miembros que contiene 1 a 3 heteroátomos seleccionados de entre azufre y oxígeno.

- 20 Los compuestos de la fórmula I son especialmente adecuados para combatir eficientemente las siguientes plagas:

insectos del orden de los lepidopteros (*Lepidoptera*), por ejemplo *Agrotis ypsilon*, *Agrotis segetum*, *Alabama argillacea*, *Anticarsia gemmatalis*, *Argyresthia conjugella*, *Autographa gamma*, *Bupalus piniarius*, *Cacoecia murinana*, *Capua reticulana*, *Cheimatobia brumata*, *Choristoneura fumiferana*, *Choristoneura occidentalis*, *Cirphis unipuncta*, *Cydia pomonella*, *Dendrolimus pini*, *Diaphania nitidalis*, *Diatraea grandiosella*, *Earias insulana*, *Elasmopalpus lignosellus*, *Eupoecilia ambiguella*, *Evetria bouliana*, *Feltia subterranea*, *Galleria mellonella*, *Grapholitha funebrana*, *Grapholitha molesta*, *Heliothis armigera*, *Heliothis virescens*, *Heliothis zea*, *Hellula undalis*, *Hibemia defoliaria*, *Hyphantria cunea*, *Hyponomeuta malinellus*, *Keiferia lycopersicella*, *Lambdina fiscellaria*, *Laphygma exigua*, *Leucoptera coffeella*, *Leucoptera scitella*, *Lithocolletis blancardella*, *Lobesia botrana*, *Loxostege sticticalis*, *Lymantria dispar*, *Lymantria monacha*, *Lyonetia clerkella*, *Malacosoma neustria*, *Mamestra brassicae*, *Orgyia pseudotsugata*, *Ostrinia nubilalis*, *Panolis flammea*, *Pectinophora gossypiella*, *Peridroma saucia*, *Phalera bucephala*, *Phthorimaea operculella*, *Phyllocnistis citrella*, *Pieris brassicae*, *Plathypena scabra*, *Plutella xylostella*, *Pseudoplusia includens*, *Rhyacionia frustrana*, *Scrobipalpula absoluta*, *Sitotroga cerealella*, *Sparganothis pilleriana*, *Spodoptera frugiperda*, *Spodoptera littoralis*, *Spodoptera litura*, *Thaumtopoea pityocampa*, *Tortrix viridana*, *Trichoplusia ni* y *Zeiraphera canadensis*,

- 35 escarabajos (*Coleoptera*), por ejemplo *Agrilus sinuatus*, *Agriotes lineatus*, *Agriotes obscurus*, *Amphimallus solstitialis*, *Anisandrus dispar*, *Anthonomus grandis*, *Anthonomus pomorum*, *Aphthona euphoridae*, *Athous haemorrhoidalis*, *Atomaria linearis*, *Blastophagus piniperda*, *Blitophaga undata*, *Bruchus rufimanus*, *Bruchus pisorum*, *Bruchus lentis*, *Byctiscus betulae*, *Cassida nebulosa*, *Ceratomyia trifurcata*, *Cetonia aurata*, *Ceuthorrhynchus assimilis*, *Ceuthorrhynchus napi*, *Chaetocnema tibialis*, *Conoderus vespertinus*, *Crioceris asparagi*, *Ctenicera ssp.*, *Diabrotica longicornis*, *Diabrotica semipunctata*, *Diabrotica 12-punctata*, *Diabrotica speciosa*, *Diabrotica virgifera*, *Epilachna varivestis*, *Epitrix hirtipennis*, *Eutinobothrus brasiliensis*, *Hylobius abietis*, *Hypera brunneipennis*, *Hypera postica*, *Ips typographus*, *Lema bilineata*, *Lema melanopus*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Limonius californicus*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Melanotus communis*, *Meligethes aeneus*, *Melolontha hippocastani*, *Melolontha melolontha*, *Oulema oryzae*, *Ortiorrhynchus sulcatus*, *Otiorrhynchus ovatus*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllobius pyri*, *Phyllotreta chrysocephala*, *Phyllorhaga sp.*, *Phyllorhaga horticola*, *Phyllotreta nemorum*, *Phyllotreta striolata*, *Popillia*

*japonica*, *Sitona lineatus* y *Sitophilus granaria*,

moscas, mosquitos (Diptera), por ejemplo *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes vexans*, *Anastrepha ludens*, *Anopheles maculipennis*, *Anopheles crucians*, *Anopheles albimanus*, *Anopheles gambiae*, *Anopheles freeborni*, *Anopheles leucosphyrus*, *Anopheles minimus*, *Anopheles quadrimaculatus*, *Calliphora vicina*, *Ceratitis capitata*,  
 5 *Chrysomya bezziana*, *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macellaria*, *Chrysops discalis*, *Chrysops silacea*, *Chrysops atlanticus*, *Cochliomyia hominivorax*, *Contarinia sorghicola* *Cordylobia anthropophaga*, *Culicoides furens*,  
*Culex pipiens*, *Culex nigripalpus*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex tarsalis*, *Culiseta inornata*, *Culiseta melanura*, *Dacus cucurbitae*, *Dacus oleae*, *Dasineura brassicae*, *Delia antique*, *Delia coarctata*, *Delia platura*, *Delia radicum*,  
 10 *Dermatobia hominis*, *Fannia canicularis*, *Geomyza Tripunctata*, *Gasterophilus intestinalis*, *Glossina morsitans*, *Glossina palpalis*, *Glossina fuscipes*, *Glossina tachinoides*, *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hippelates*  
*spp.*, *Hylemyia platura*, *Hypoderma lineata*, *Leptoconops torrens*, *Liriomyza sativae*, *Liriomyza trifolii*, *Lucilia caprina*,  
*Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*, *Lycoria pectoralis*, *Mansonina titillanus*, *Mayetiola destructor*, *Musca domestica*,  
*Muscina stabulans*, *Oestrus ovis*, *Opomyza florum*, *Oscinella frit*, *Pegomya hysocyami*, *Phorbia antiqua*, *Phorbia brassicae*, *Phorbia coarctata*, *Phlebotomus argentipes*, *Psorophora columbiana*, *Psila rosae*, *Psorophora discolor*,  
 15 *Prosimulium mixtum*, *Rhagoletis cerasi*, *Rhagoletis pomonella*, *Sarcophaga haemorrhoidalis*, *Sarcophaga sp.*,  
*Simulium vittatum*, *Stomoxys calcitrans*, *Tabanus bovinus*, *Tabanus atratus*, *Tabanus lineola*, y *Tabanus similis*,  
*Tipula oleracea*, y *Tipula paludosa*

trips (Thysanoptera), por ejemplo *Dichromothrips corbetti*, *Dichromothrips ssp* , *Frankliniella fusca*, *Frankliniella occidentalis*, *Frankliniella tritici*, *Scirtothrips citri*, *Thrips oryzae*, *Thrips palmi* y *Thrips tabaci*,

20 termitas (Isoptera), por ejemplo *Calotermes flavicollis*, *Leucotermes flavipes*, *Heterotermes aureus*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes virginicus*, *Reticulitermes lucifugus*, *Termes natalensis*, y *Coptotermes formosanus*,

cucarachas (Blattaria - Blattodea), por ejemplo *Blattella germanica*, *Blattella asahinae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta japonica*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Periplaneta australasiae*, y *Blatta orientalis*,

25 chinches (Hemiptera), por ejemplo *Acrostemum hilare*, *Blissus leucopterus*, *Cyrtopeltis notatus*, *Dysdercus cingulatus*, *Dysdercus intermedius*, *Eurygaster integriceps*, *Euschistus impictiventris*, *Leptoglossus phyllopus*, *Lygus lineolaris*, *Lygus pratensis*, *Nezara viridula*, *Piesma quadrata*, *Solubea insularis* , *Thyanta perditor*, *Acyrtosiphon onobrychis*, *Adelges laricis*, *Aphidula nasturtii*, *Aphis fabae*, *Aphis forbesi*, *Aphis pomi*, *Aphis gossypii*, *Aphis grossulariae*, *Aphis schneideri*, *Aphis spiraecola*, *Aphis sambuci*, *Acyrtosiphon pisum*, *Aulacorthum solani*, *Bemisia argentifolii*, *Brachycaudus cardui*, *Brachycaudus helichrysi*, *Brachycaudus persicae*, *Brachycaudus prunicola*,  
 30 *Brevicoryne brassicae*, *Capitophorus horni*, *Cerosiphia gossypii*, *Chaetosiphon fragaefolii*, *Cryptomyzus ribis*,  
*Dreyfusia nordmanniana*, *Dreyfusia piceae*, *Dysaphis radicola*, *Dysaulacorthum pseudosolani*, *Dysaphis plantaginea*, *Dysaphis pyri*, *Empoasca fabae*, *Hyalopterus pruni*, *Hyperomyzus lactucae*, *Macrosiphum avenae*,  
*Macrosiphum euphorbiae*, *Macrosiphon rosae*, *Megoura viciae*, *Melanaphis pyraeae*, *Metopolophium dirhodum*,  
 35 *Myzus persicae*, *Myzus ascalonicus*, *Myzus cerasi*, *Myzus varians*, *Nasonovia ribis-nigri*, *Nilaparvata lugens*,  
*Pemphigus bursarius*, *Perkinsiella saccharicida*, *Phorodon humuli*, *Psylla mali*, *Psylla piri*, *Rhopalomyzus ascalonicus*, *Rhopalosiphum maidis*, *Rhopalosiphum padi*, *Rhopalosiphum insertum*, *Sappaphis mala*, *Sappaphis mali*,  
*Schizaphis graminum*, *Schizoneura lanuginosa*, *Sitobion avenae*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Toxoptera aurantiand*, *Viteus vitifolii*, *Cimex lectularius*, *Cimex hemipterus*, *Reduvius senilis*, *Triatoma spp.*, y *Arilus critatus*.

40 hormigas, abejas, avispas, moscas de sierra (Hymenoptera), por ejemplo *Athalia rosae*, *Atta cephalotes*, *Atta capiguara*, *Atta cephalotes*, *Atta laevigata*, *Atta robusta*, *Atta sexdens*, *Atta texana*, *Crematogaster spp.*, *Hoplocampa minuta*, *Hoplocampa testudinea*, *Monomorium pharaonis*, *Solenopsis geminata*, *Solenopsis invicta*, *Solenopsis richteri*, *Solenopsis xyloni*, *Pogonomyrmex barbatus*, *Pogonomyrmex californicus*, *Pheidole megacephala*, *Dasymutilla occidentalis*, *Bombus spp.* *Vespula squamosa*, *Paravespula vulgaris*, *Paravespula pennsylvanica*,  
 45 *Paravespula germanica*, *Dolichovespula maculata*, *Vespa crabro*, *Polistes rubiginosa*, *Camponotus floridanus*, y  
*Linepithema humile*,

grillos, saltamontes, langostas (Orthoptera), por ejemplo *Acheta domestica*, *Gryllotalpa gryllotalpa*, *Locusta migratoria*, *Melanoplus bivittatus*, *Melanoplus femurrubrum*, *Melanoplus mexicanus*, *Melanoplus sanguinipes*, *Melanoplus spretus*, *Nomadacris septemfasciata*, *Schistocerca americana*, *Schistocerca gregaria*, *Dociostaurus maroccanus*, *Tachycines asynamorus*, *Oedaleus senegalensis*, *Zonozelus variegatus*, *Hieroglyphus daganensis*,  
 50 *Kraussaria angulifera*, *Calliptamus italicus*, *Chortoicetes terminifera*, y *Locustana pardalina*,

Aracnoideos, tal como arácnidos (Acarina), por ejemplo de las familias *Argasidae*, *Ixodidae* y *Sarcoptidae*, tales como *Amblyomma americanum*, *Amblyomma variegatum*, *Amblyomma maculatum*, *Argas persicus*, *Boophilus annulatus*, *Boophilus decoloratus*, *Boophilus microplus*, *Dermacentor silvarum*, *Dermacentor andersoni*, *Dermacentor variabilis*, *Hyalomma truncatum*, *Ixodes ricinus*, *Ixodes rubicundus*, *Ixodes scapularis*, *Ixodes holocyclus*, *Ixodes pacificus*, *Ornithodoros moubata*, *Ornithodoros hermsi*, *Ornithodoros turicata*, *Ornithonyssus bacoti*, *Otobius megnini*,  
 55 *Dermanyssus gallinae*, *Psoroptes ovis*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Rhipicephalus appendiculatus*, *Rhipicephalus*

5 *evertsi*, *Sarcoptes scabiei*, y *Eriophyidae* spp. tal como *Aculus schlechtendali*, *Phyllocoptera oleivora* y *Eriophyes sheldoni*; *Tarsonemidae* spp. tal como *Phytonemus pallidus* y *Polyphagotarsonemus latus*; *Tenuipalpidae* spp. tal como *Brevipalpus phoenicis*; *Tetranychidae* spp. tal como *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus kanzawai*, *Tetranychus pacificus*, *Tetranychus telarius* y *Tetranychus urticae*, *Panonychus ulmi*, *Panonychus citri*, y *Oligonychus pratensis*; Araneida, por ejemplo *Latrodectus mactans*, y *Loxosceles reclusa*,

moscas (*Siphonaptera*), por ejemplo *Ctenocephalides felis*, *Ctenocephalides canis*, *Xenopsylla cheopis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, y *Nosopsyllus fasciatus*,

pecesillos de plata, insectos de fuego (*Thysanura*), por ejemplo *Lepisma saccharina* y *Thermobia domestica*,

ciempies (*Chilopoda*), por ejemplo *Scutigera coleoptrata*,

10 milpies (*Diplopoda*), por ejemplo *Narceus* spp.,

tijeretas (*Dermaptera*), por ejemplo *Forficula auricularia*,

piojos (*Phthiraptera*), por ejemplo *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pthirus pubis*, *Haematopinus eurysternus*, *Haematopinus suis*, *Linognathus vituli*, *Bovicola bovis*, *Menopon gallinae*, *Menacanthus stramineus* y *Solenopotes capillatus*,

15 Nemátodos que parasitan plantas tales como nemátodos del nódulo de la raíz, *Meloidogyne arenaria*, *Meloidogyne chitwoodi*, *Meloidogyne exigua*, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne javanica* y otras especies de *Meloidogyne*; nemátodos de quistes, *Globodera rostochiensis*, *Globodera pallida*, *Globodera tabacum* y otras especies de *Globodera*, *Heterodera avenae*, *Heterodera glycines*, *Heterodera schachtii*, *Heterodera trifolii*, y otras especies de *Heterodera*; nemátodos de la agalla de la semilla, *Anguina funesta*, *Anguina tritici* y otras especies de *Anguina*; nemátodos del tallo y las hojas, *Aphelenchoides besseyi*, *Aphelenchoides fragariae*, *Aphelenchoides ritzemabosi* y otras especies de *Aphelenchoides*; nemátodos de las púas, *Belonolaimus longicaudatus* y otras especies de *Belonolaimus*; nemátodos del pino, *Bursaphelenchus xylophilus* y otras especies de *Bursaphelenchus*; nemátodos de los anillos, especie *Criconema*, especie *Criconemella*, especie *Criconemoides*, y especie *Mesocriconema*; nemátodos del tallo y los bulbos, *Ditylenchus destructor*, *Ditylenchus dipsaci*, *Ditylenchus myceliophagus* y otras especies de *Ditylenchus*; nemátodos de la lezna, especie *Dolichodoros*; nemátodos de espiral, *Helicotylenchus dihystra*, *Helicotylenchus multicinctus* y otras especies de *Helicotylenchus*, *Rotylenchus robustus* y otras especies de *Rotylenchus*; nemátodos de la vaina, especie *Hemicycliophora* y especie *Hemicriconemoides*; especie *Hirshmanniella*; nemátodos de lanza, *Hoplolaimus columbus*, *Hoplolaimus galeatus* y otras especies de *Hoplolaimus*; falsos nemátodos, de los nódulos de la raíz, *Nacobbus aberrans* y otras especies de *Nacobbus*; nemátodos de aguja, *Longidorus elongates* y otras especies de *Longidorus*; nemátodos de horquilla, especie *Pratylenchus*; nemátodos de las lesiones, *Pratylenchus brachyurus*, *Pratylenchus coffeae*, *Pratylenchus curvatus*, *Pratylenchus goodeyi*, *Pratylenchus neglectus*, *Pratylenchus penetrans*, *Pratylenchus scribneri*, *Pratylenchus vulnus*, *Pratylenchus zaeae* y otras especies de *Pratylenchus*; *Radinaphelenchus cocophilus* y otras especies de *Radinaphelenchus*; nemátodos excavadores, *Radopholus similis* y otras especies de *Radopholus*; nemátodos reniformes, *Rotylenchulus reniformis* y otras especies de *Rotylenchulus*; especie *Scutellonema*; nemátodos de las raíces achaparradas, *Trichodorus primitivus* y otras especies de *Trichodorus*; *Paratrichodorus minor* y otras especies de *Paratrichodorus*; nemátodos acrobatas, *Tylenchorhynchus claytoni*, *Tylenchorhynchus dubius* y otras especies de *Tylenchorhynchus* y especie *Merlinius*; nemátodos de los cítricos, *Tylenchulus semipenetrans* y otras especies de *Tylenchulus*; nemátodos daga, *Xiphinema americanum*, *Xiphinema index*, *Xiphinema diversicaudatum* y otras especies de *Xiphinema*; y otras especies de nemátodos que parasitan las plantas.

45 Las formulaciones se preparan en una forma conocida (ver por ejemplo para revisión US 3,060,084, EP-A 707 445 (para concentrados líquidos), Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, Dec. 4, 1967, 147 - 48, Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, páginas 8 - 57 y siguientes, WO 91/13546, US 4.172.714, US 4.144.050, US 3.920.442, US 5.180.587, US 5.232.701, US 5.208.030, GB 2.095.558, US 3.299.566, Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, Hance et al., Weed Control Handbook, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989 and Mollet, H., Grubemann, A., Formulation technology, Wiley VCH Verlag GmbH, Weinheim (Alemania), 2001, 2. D. A. Knowles, Chemistry and Technology de Agrochemical Formulations, Kluwer Academic Publishers, Dordrecht, 1998 (ISBN 0-7514-0443-8), por ejemplo extendiendo el compuesto activo con auxiliares adecuados para la formulación de agroquímicos, tales como solventes y/o portadores, si se desea, agentes emulsificantes, surfactantes y dispersantes, preservantes, antiespumantes, agentes anticongelantes, para formulaciones de tratamiento de semillas también opcionalmente colorantes y aglomerantes.

55 Los ejemplos de solventes adecuados son agua, solventes aromáticos (por ejemplo productos Solvesso, xileno), parafinas (por ejemplo fracción de aceite mineral), alcoholes (por ejemplo metanol, butanol, pentanol, alcohol

bencílico), cetonas (por ejemplo ciclohexanona, gamma-butirolactona), pirrolidonas (NMP, NOP), acetatos (glicol diacetato), glicoles, dimetilamidas de ácido graso, ácidos grasos y ésters de ácido graso. En principio, se pueden utilizar también mezclas disolventes.

5 Los ejemplos de portadores adecuados son minerales naturales molidos (por ejemplo caolines, arcillas, talco, tiza) y minerales sintéticos molidos (por ejemplo sílice altamente disperso, silicatos).

Los emulsionantes adecuados son emusificantes aniónicos y no iónicos (por ejemplo éteres de alcohol graso de polioxietileno, alquilsulfonatos y arilsulfonatos).

Los ejemplos de dispersantes son licores residuales del sulfitado de lignina y metilcelulosa.

10 Los surfactantes adecuados utilizados son sales de metal alcalino, de metal alcalinotérreo y de amonio de ácido lignosulfónico, ácido naftalenosulfónico, ácido fenolsulfónico, ácido dibutilnaftalenosulfónico, alquilarilsulfonatos, alquil sulfatos, alquilsulfonatos, sulfatos de alcohol graso, ácidos grasos y éteres de glicol de alcohol graso sulfatado, además condensados de naftaleno sulfonatado y derivados de naftaleno con formaldehído, condensados de naftaleno o de ácido naftalenosulfónico con fenol y formaldehído, polioxietilén octilfenol éter, isoocetilfenol etoxilado, octilfenol, nonilfenol, alquilfenol poliglicol éteres, tributilfenil poliglicol éter, triestearilfenil poliglicol éter, alquilaril poliéter alcoholes, condensados de óxido de etileno de alcohol graso y alcohol, aceite de ricino etoxilado, polioxietilén alquil éteres, polioxipropileno etoxilado, lauril alcohol poliglicol éter acetal, sorbitol ésteres, licores residuales de lignosulfito y metilcelulosa.

15

20 Las sustancias que son adecuadas para la preparación de soluciones directamente atomizables, emulsiones, pastas o dispersiones en aceite son fracciones de aceite mineral de punto de ebullición entre medio y alto, tales como queroseno o gasóleo, además aceites e alquitrán de hulla y aceites de origen vegetal o animal, hidrocarburos alifáticos, cíclicos y aromáticos, por ejemplo tolueno, xileno, parafina, tetrahidronaftaleno, naftalenos alquilados o sus derivados, metanol, etanol, propanol, butanol, ciclohexanol, ciclohexanona, isoforona, solventes muy polares, por ejemplo dimetil sulfóxido, N-metilpirrolidona o agua.

25 También agentes anticongelantes tales como glicerina, etilén glicol, propilén glicol y bactericidas tales como los que pueden ser agregados a la formulación.

Los agentes antispumantes adecuados son por ejemplo agentes antiespumantes con base en estearato de silicio o de magnesio.

Se pueden preparar polvos, materiales para atomización y productos espolvoreables mezclando o moliendo simultáneamente las sustancias activas con un portador sólido.

30 Se pueden preparar gránulos, por ejemplo gránulos recubiertos, gránulos impregnados y gránulos homogéneos, aglomerando los compuestos activos con portadores sólidos. Los ejemplos de portadores sólidos son tierras minerales tales como geles de sílice, silicatos, talco, caolín, arcilla acicular, piedra caliza, cal, yeso, bole, loess, arcilla, dolomita, tierra de diatomeas, sulfato de calcio, sulfato de magnesio, óxido de magnesio, materiales sintéticos molidos, fertilizantes, tales como, por ejemplo, sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, ureas, y

35 productos de origen vegetal, tales como harina de cereal, harina de corteza de árbol, harina de madera y harina de cáscara de nuez, polvos de celulosa y otros portadores sólidos.

En general, las formulaciones contienen de 0,01 a 95% en peso, preferiblemente de 0,1 a 90% en peso, del(de los) compuesto(s) activo(s). En este caso, el(los) compuesto(s) activo(s) se emplean con una pureza del 90% al 100% en peso, preferiblemente del 95% al 100% en peso (de acuerdo con el espectro de RMN).

40 Los compuestos de fórmula I pueden ser utilizados como tales, en la forma de sus formulaciones o las formas de uso preparadas a partir de los mismos, por ejemplo en la forma de soluciones directamente atomizables, polvos, suspensiones o dispersiones, emulsiones, dispersiones en aceite, pastas, productos espolvoreables, materiales para atomización, o gránulos, por medio de rocío, atomización, espolvoreo, esparcimiento o vertido. Las formas de uso dependen enteramente de los fines previstos; tienen por objeto garantizar en cada caso la distribución más fina

45 posible del(de los) compuesto(s) activo(s) de acuerdo con la invención.

Las formas de uso acuosas pueden ser preparadas a partir de concentrados en emulsión, pastas o polvos rehidratables (povos atomizables, dispersiones en aceite) por medio de la adición de agua. Para preparar emulsiones, pastas o dispersiones en aceite, las sustancias, como tales o disueltas en un aceite o solvente, pueden ser homogenizadas en agua por medio de un humectante, adherente, dispersante o emulsionante. Sin embargo,

50 también es posible preparar concentrados compuestos de sustancia activa, humectante, adherente, dispersante o emulsionante y, según el caso, solvente o aceite, y tales concentrados son adecuados para dilución con agua.

Las concentraciones del compuesto activo en las preparaciones listas para ser usadas pueden variar dentro de rangos relativamente amplios. En general, van desde 0,0001 hasta 10%, preferiblemente desde 0,01 hasta 1% en peso.

- 5 El(los) compuesto(s) activo(s) también pueden ser utilizados exitosamente en los procesos de volumen ultra bajo (ULV), siendo posible aplicar formulaciones que contienen más del 95% en peso de compuesto activo, o incluso aplicar el compuesto activo sin aditivos.

Los siguientes son ejemplos de formulaciones: 1. Productos para dilución con agua para aplicaciones foliares. Para propósitos de tratamiento de la semilla, tales productos pueden ser aplicados a la semilla en forma diluida o no diluida.

- 10 A) Concentrados solubles en agua (SL, LS)

10 partes en peso del(de los) compuesto(s) activo(s) se disuelven en 90 partes en peso de agua o de un solvente soluble en agua. Como alternativa, se añaden humectantes u otros auxiliares. El(los) compuesto(s) activo(s) se disuelve(n) por dilución con agua, mediante lo cual se obtiene una formulación con 10% (p/p) del(de los) compuesto(s) activo(s).

- 15 B) Concentrados dispersables (DC)

20 partes en peso del(de los) compuesto(s) activo(s) se disuelven en 75 partes en peso de ciclohexanona con adición de 10 partes en peso de un dispersante, por ejemplo polivinilpirrolidona. La dilución con agua produce una dispersión, mediante lo cual se obtiene una formulación con 20% (p/p) del(de los) compuesto(s) activo(s).

C) Concentrados emulsionables (EC)

- 20 15 partes en peso del(de los) compuesto(s) activo(s) se disuelven en 75 partes en peso de xileno con adición de dodecilsulfonato de calcio y etoxilato de aceite de ricino (en cada caso 5 partes en peso). La dilución con agua produce una emulsión, mediante lo cual se obtiene una formulación con 15% (p/p) del(de los) compuesto(s) activo(s).

D) Emulsiones (EW, EO, ES)

- 25 40 partes en peso del(de los) compuesto(s) activo(s) se disuelven en 35 partes en peso de xileno con adición de dodecilsulfonato de calcio y etoxilato de aceite de ricino (en cada caso 5 partes en peso). Se introduce esta mezcla en 30 partes en peso de agua por medio de una máquina emulsionadora (por ejemplo Ultraturax) y se la convierte en una emulsión homogénea. La dilución con agua produce una emulsión, mediante lo cual se obtiene una formulación con 25% (p/p) del(de los) compuesto(s) activo(s).

- 30 E) Suspensiones (SC, OD, FS)

- 35 En un molino de bolas con agitación, se trituran 20 partes en peso del(de los) compuesto(s) activo(s) con adición de 10 partes en peso de dispersantes, humectantes y 70 partes en peso de agua o de un solvente orgánico para producir una suspensión fina de compuesto(s) activo(s). La dilución con agua produce una suspensión estable del(de los) compuesto(s) activo(s), mediante lo cual se obtiene una formulación con 20% (p/p) del(de los) compuesto(s) activo(s).

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

- 40 50 partes en peso del(de los) compuesto(s) activo(s) se muelen finamente con la adición de 50 partes en peso de dispersantes y humectantes y se convierten en gránulos dispersables en agua o solubles en agua por medio de dispositivos técnicos (por ejemplo extrusión, torre de pulverización, lecho fluidizado). La dilución con agua produce una dispersión estable o solución del(de los) compuesto(s) activo(s), mediante lo cual se obtiene una formulación con 50% (p/p) del(de los) compuesto(s) activo(s).

G) Polvos dispersables en agua y polvos solubles en agua (WP, SP, SS, WS)

- 45 75 partes en peso del(de los) compuesto(s) activo(s) se muelen en un molino de rotor-estator con adición de 25 partes en peso de dispersantes, humectantes y gel de sílice. La dilución con agua produce una dispersión estable o solución del(de los) compuesto(s) activo(s), mediante lo cual se obtiene una formulación con 75% (p/p) del(de los) compuesto(s) activo(s) es obtained.



2. Productos que se aplican en forma no diluida para aplicaciones foliares. Para los propósitos de tratamiento de la semilla, tales productos pueden ser aplicados a la semilla en forma diluida o no diluida.

H) Polvos espolvoreables (DP, DS)

5 5 partes en peso del(de los) compuesto(s) activo(s) se muelen finamente y se mezclan perfectamente con 95 partes en peso de caolín finamente dividido. Esto produce un producto espolvoreable que tiene 5% (p/p) del(de los) compuesto(s) activo(s).

I) Gránulos (GR, FG, GG, MG)

10 0,5 partes en peso del(de los) compuesto(s) activo(s) se muelen finamente y se asocian con 95,5 partes en peso de portadores, mediante lo cual se obtiene una formulación con 0,5% (p/p) del(de los) compuesto(s) activo(s). Los métodos actuales son extrusión, secado por aspersión o lecho fluidizado. Esto produce gránulos que son aplicados no diluidos para uso foliar.

J) Soluciones ULV (UL, LS)

15 10 partes en peso del(de los) compuesto(s) activo(s) se disuelven en 90 partes en peso de un solvente orgánico, por ejemplo xileno. Esto produce un producto que tiene 10% (p/p) del(de los) compuesto(s) activo(s), el cual se aplica no diluido para uso foliar.

Se pueden añadir diferentes tipos de aceites, humectantes, adyuvantes, herbicidas, fungicidas, otros pesticidas, o bactericidas a los ingredientes activos, según el caso, justo inmediatamente antes de su utilización (mezcla en el tanque). Estos agentes usualmente se mezclan con los agentes de acuerdo con la invención en una proporción en peso de 1:10 a 10:1.

20 Los compuestos de fórmula I son efectivos tanto por contacto como por ingestión.

Los compuestos de fórmula I son también adecuados para la protección de la semilla, los propágulos de la planta y las raíces y brotes de las plántulas, preferiblemente de las semillas, contra las plagas del suelo y también para el tratamiento de las semillas de la planta que tolera la acción de herbicidas o fungicidas o insecticidas debido al fitomejoramiento, incluidos los métodos de ingeniería genética.

25 Las formulaciones convencionales para el tratamiento de la semilla incluyen por ejemplo FS de concentrados fluidos, soluciones LS, polvos para tratamiento en seco con DS, polvos dispersables en agua WS o gránulos para tratamiento de suspensiones, polvos solubles en agua SS y emulsión ES. La aplicación a las semillas se lleva a cabo antes de la siembra, ya sea directamente sobre las semillas.

30 La aplicación del tratamiento a la semilla de los compuestos de fórmula I o de las formulaciones que los contienen es llevada a cabo rociando o espolvoreando las semillas antes de la siembra de las plantas y antes de la aparición de las plantas.

35 La invención también se relaciona con el producto de la propagación de las plantas, y especialmente de la semilla tratada que comprende, es decir, recubierta con y/o que contiene, un compuesto de fórmula I o una composición que lo contiene. El término "recubierta con y/o que contiene" generalmente significa que el ingrediente activo está en su mayor parte sobre la superficie del producto de la propagación al momento de la aplicación, aunque una parte mayor o menor del ingrediente puede penetrar en el producto de la propagación, dependiendo del método de aplicación. Cuando dicho producto de la propagación es plantado nuevamente, puede absorber al ingrediente activo. La semilla incluye a los compuestos o composiciones de la invención que los contienen en una cantidad de 0,1 g a 10 kg por 100 kg de semilla.

40 Las composiciones de esta invención pueden contener también otros ingredientes activos, por ejemplo otros pesticidas, insecticidas, herbicidas, fertilizantes tales como nitrato de amonio, urea, potasa, y superfosfato, fitotóxicos y reguladores del crecimiento de la planta, protectores y nematicidas. Estos ingredientes adicionales pueden ser utilizados en forma secuencial o en combinación con las composiciones anteriormente descritas, según el caso, añadidas también únicamente inmediatamente antes del uso (mezcla en el tanque). Por ejemplo, la(s)

45 planta(s) pueden ser rociadas con una composición de esta invención ya sea antes o después de ser tratadas con otros ingredientes activos.

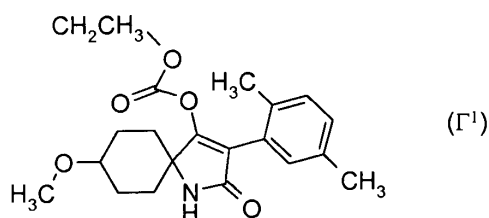
Se puede utilizar la siguiente lista de pesticidas junto con los compuestos de acuerdo con la invención, la cual pretende ilustrar las posibles combinaciones, pero sin imponer ninguna limitación:

A.1. Organo(tio)fosfatos: acefato, azametifos, metil azinfos, clorpirifos, metil clorpirifos, clorfenvinfos, diazinona, diclorvos, dicrotofos, dimetoato, disulfotón, etión, fenitrotión, fentiión, isoxatiión, malatiión, metamidofos, metidatiión, metil paratiión, mevinfos, monocrotofos, metil oxidemetón, paraoxón, paratiión, fentoato, fosalona, fosmet, fosfamidón, forato, foxim, metil pirimifos, profenofos, protiofos, sulprofos, tetraclorvinfos, terbufos, triazofos, triclorfón;

5 A.2. Carbamatos: alanicarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, carbarilo, carbofurán, carbosulfán, fenoxicarb, furatiocarb, metiocarb, metomilo, oxamilo, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, triazamato;

10 A.3. Piretroides: aletrina, bifentrina, ciflutrina, cihalotrina, cifenotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, beta-cipermetrina, zeta-cipermetrina, deltametrina, esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, imiprotrina, lambda-cihalotrina, permetrina, praletrina, piretrina I y II, resmetrina, silafluofeno, tau-fluvalinato, teflutrina, tetrametrina, tralometrina, transflutrina;

15 A.4. Reguladores de crecimiento: a) inhibidores de la síntesis de quitina: benzoilureas: clorfluazuron, ciromazina, diflubenzurón, flucicloxurón, flufenoxurón, hexaflumurón, lufenurón, novalurón, teflubenzurón, triflumurón; buprofezina, diofenolano, hexitiazox, etoxazol, clofentazina; b) antagonistas de ecdisona: halofenozida, metoxifenozida, tebufenozida, azadiractina; c) juvenoides: piriproxifeno, metopreno, fenoxicarb; d) inhibidores de la biosíntesis de lípidos: espirodiclofeno, espiromesifeno, un derivado de ácido tetrónico de fórmula  $\Gamma^1$ ,



A.5. Compuestos agonistas/antagonistas del receptor nicotínico: clotianidina, dinotefurano, imidacloprida, tiametoxam, nitenpiram, acetamiprida, tiacloprida;

A.6. Compuestos antagonistas de GABA: acetoprol, endosulfan, etiprol, fipronil, vaniliprol;

20 A.7. Insecticidas de lactona macrocíclica: abamectina, emamectina, milbemectina, lepimectina, espinosad;

A.8. Acaricidas METI I: fenazaquin, piridaben, tebufenpirad, tolfenpirad;

A.9. Compuestos METI II y III: acequinocil, fluaciprim, hidrametilnon;

A.10. Compuestos desacopladores: clorfenapir;

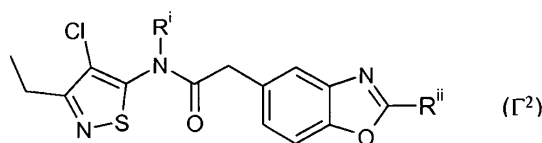
25 A.11. Compuestos inhibidores de la fosforilización oxidativa: cihexatina, diafentiurona, óxido de fenbutatina, propargita;

A.12. Compuestos que interrumpen la muda: criomazina;

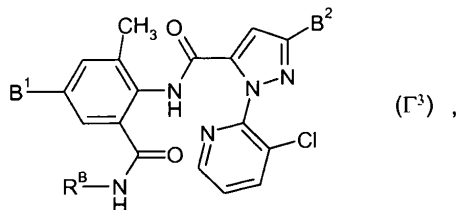
A.13. Compuestos inhibidores de la Función Oxidasa Mixta: piperonil butóxido;

A.14. Compuestos bloqueadores del canal de sodio: indoxacarb, metaflumizona;

30 A.15. Otros: benclotiaz, bifenazato, cartap, flonicamida, piridalilo, pimetozina, azufre, tiociclam, N-R'-2,2-dihalo-1-R" ciclo-propanocarboxamida-2-(2,6-dicloro- $\alpha,\alpha,\alpha$ -trifluoro-p-tolil)hidrazona o N-R'-2,2-di(R''')propionamida-2-(2,6-dicloro- $\alpha,\alpha,\alpha$ -trifluoro-p-tolil)-hidrazona, en donde R' es metilo o etilo, halo es cloro o bromo, R" es hidrógeno o metilo y R''' es metilo o etilo, y los compuestos aminoisotiazol de fórmula  $\Gamma^2$ ,



en donde  $R^i$  es  $-\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3$  o H y  $R^{ii}$  es  $\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$  o  $\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_3$ , compuestos antranilamida de fórmula  $\Gamma^3$



5 en donde  $B^1$  es hidrógeno o un átomo de cloro,  $B^2$  es un átomo de bromo o  $\text{CF}_3$ , y  $R^B$  es  $\text{CH}_3$  o  $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ , y compuestos malononitrilo como se describe en JP 2002 284608, WO 02/89579, WO 02/90320, WO 02/90321, WO 04/06677, WO 04/20399, o JP 2004 99597.

Los insectos pueden ser controlados poniendo en contacto al parásito/plaga objetivo, a su fuente de alimentación, su hábitat, sitios de reproducción o su locus con una cantidad efectiva como plaguicida de compuestos de o composiciones de fórmula I.

10 "Locus" significa un hábitat, sitio de reproducción, planta, semilla, suelo, área, material o medio ambiente en el cual una plaga o parásito se desarrolla o puede desarrollarse.

15 En general, "cantidad efectiva como pesticida" significa la cantidad de ingrediente activo necesario para lograr un efecto observable sobre el crecimiento, incluidos los efectos de necrosis, muerte, retardo, prevención, y remoción, destrucción, o bien disminución de la ocurrencia y actividad del organismo objetivo. La cantidad efectiva como pesticida puede variar para los diferentes compuestos/composiciones utilizados en la invención. Una cantidad efectiva como pesticida de las composiciones variará también de acuerdo con las condiciones prevalecientes tales como el efecto pesticida deseado y la duración, el clima, la especie objetivo, el locus, el modo de aplicación, y similares.

Los compuestos o composiciones de la invención también pueden ser aplicados en forma preventiva a lugares en los cuales se espera la aparición de las plagas.

20 Los compuestos de fórmula I pueden ser utilizados también para proteger el crecimiento de las plantas del ataque o infestación por parte de plagas poniendo en contacto a la planta con una cantidad efectiva como plaguicida de compuestos de fórmula I. Como tal, "poner en contacto" incluye tanto contacto directo (aplicación de los compuestos/composiciones directamente sobre la plaga y/o la planta - típicamente al follaje, tallo o raíces de la planta) como contacto indirecto (aplicación de los compuestos/composiciones al locus de la plaga y/o la planta).

25 En el caso de tratamiento del suelo o de aplicación al lugar de habitación o nido de las plagas, la cantidad de ingrediente activo está en el rango de 0,0001 a 500 g por 100 m<sup>2</sup>, preferiblemente de 0,001 a 20 g por 100 m<sup>2</sup>.

Para uso en el tratamiento de plantas de cultivo, la tasa de aplicación de los ingredientes activos de esta invención puede estar en el rango de 0,1 g a 4000 g por hectárea, en forma deseable de 25 g a 600 g por hectárea, en forma más deseable de 50 g a 500 g por hectárea.

30 Los compuestos de fórmula I y las composiciones que los contienen también pueden ser utilizados para controlar y prevenir infestaciones e infecciones en animales incluidos animales de sangre caliente (incluidos los humanos) y peces. Ellos son por ejemplo adecuados para controlar y prevenir infestaciones e infecciones en mamíferos tales como ganado, ovejas, porcinos, camellos, ciervos, caballos, cerdos, aves de corral, conejos, cabras, perros y gatos, búfalo de agua, burros, gamos y renos, y también en animales de piel tales como visón, chinchilla y mapaches, aves  
35 tales como gallinas, gansos, pavos y patos y peces tales como peces de agua dulce y de mar tales como trucha, carpa y anguilas.

Las infestaciones en animales de sangre caliente y peces incluyen, pero no se limitan a, piojos, piojos mordedores, garrapatas, larvas de moscardones nasales, keds, moscas mordedoras, moscas muscoides, moscas, larvas de la mosca miasítica, chinches, piojos, mosquitos y pulgas.

40 Los compuestos de fórmula I y las composiciones que los contienen son adecuados para control sistémico y/o no sistémico de ecto y/o endoparásitos. Son activos contra todas o algunas de las etapas del desarrollo.

Se puede llevar a cabo la administración tanto en forma profiláctica como terapéutica. La administración de los compuestos activos se lleva a cabo directamente o en la forma de preparaciones adecuadas, en forma oral,

tópica/dérmica o parenteral.

5 Para administración oral a animales de sangre caliente, se pueden formular los compuestos de fórmula I como alimentos para animales, premezclas de alimentos para animales, concentrados de alimentos para animales, píldoras, soluciones, pastas, suspensiones, pociones, geles, tabletas, bolos y cápsulas. Además, los compuestos de fórmula I pueden ser administrados a los animales en el agua para beber. Para administración oral, la forma de dosificación escogida debe proveer al animal con 0,01 mg/kg a 100 mg/kg de peso corporal animal por día del compuesto de fórmula I, preferiblemente con 0,5 mg/kg a 100 mg/kg de peso corporal del animal por día.

10 Alternativamente, los compuestos de fórmula I pueden ser administrados a los animales en forma parenteral, por ejemplo, por medio de una inyección intrarruminal, intramuscular, intravenosa o subcutánea. Los compuestos de fórmula I pueden dispersarse o disolverse en un portador fisiológicamente aceptable para inyección subcutánea. Alternativamente, los compuestos de fórmula I pueden ser formulados en un implante para administración subcutánea. Además el compuesto de fórmula I puede ser administrado en forma transdérmica a los animales. Para administración parenteral, la forma de dosificación escogida debe proveer al animal con 0,01 mg/kg a 100 mg/kg de peso corporal del animal por día del compuesto de fórmula I.

15 Los compuestos de fórmula I pueden ser aplicados también en forma tópica a los animales en la forma de baños por inmersión, polvos, collares, medallones, atomizadores, champús, formulaciones colocadas en un sitio determinado y vertidas y en forma de ungüentos o de emulsiones de agua en aceite o de aceite en agua. Para aplicación tópica, los baños por inmersión y los atomizadores usualmente contienen de 0,5 ppm a 5.000 ppm y preferiblemente de 1 ppm a 3.000 ppm del compuesto de fórmula I. Además, los compuestos de fórmula I pueden ser formulados como  
20 etiquetas para las orejas para animales, particularmente para cuadrúpedos tales como ganado y ovejas.

Las preparaciones adecuadas son:

- Soluciones tales como soluciones orales, concentrados para administración oral después de dilución, soluciones para uso sobre la piel o en cavidades corporales, formulaciones para ser vertidas, geles;
- Emulsiones y suspensiones para administración oral o dérmica; preparaciones semisólidas;
- 25 - Formulaciones en las cuales el compuesto activo es procesado en una base tipo ungüento o en una base tipo emulsión de aceite en agua o agua en aceite;
- Preparaciones sólidas tales como polvos, premezclas o concentrados, gránulos, píldoras, tabletas, bolos, cápsulas; aerosoles e inhaladores, y artículos conformados que contienen al compuesto activo.

30 Generalmente es favorable aplicar formulaciones sólidas que liberan los compuestos de fórmula I en cantidades totales de 10 mg/kg a 300 mg/kg, preferiblemente de 20 mg/kg a 200 mg/kg. Los compuestos activos pueden también ser utilizados como una mezcla con sinergistas o con otros compuestos activos que actúan contra endo y ectoparásitos patógenos.

35 En general, los compuestos de fórmula I se aplican en una cantidad efectiva como parasiticida, lo que significa la cantidad de ingrediente activo necesaria para lograr un efecto observable sobre el crecimiento, incluidos los efectos de necrosis, muerte, retardo, prevención, y remoción, destrucción, o bien la disminución de la aparición y actividad del organismo objetivo. La cantidad efectiva como parasiticida puede variar para los diferentes compuestos/composiciones utilizados en la invención. Una cantidad efectiva como parasiticida de las composiciones variará también de acuerdo con las condiciones prevalecientes tales como el efecto parasiticida deseado y la duración, especie objetivo, modo de aplicación, y similares.

#### 40 Ejemplos de síntesis

Con la debida modificación de los compuestos de partida, se utilizaron los protocolos mostrados en los ejemplos de síntesis más adelante para obtener compuestos I adicionales. Los compuestos resultantes, junto con los datos físicos, están enlistados en las Tablas 1 a 3 que vienen a continuación.

45 La 2-[5-Bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-il]-8-metil-benzo[d] [1,3]oxazin-4-ona es conocida a partir de WO 04/011447.

#### Ejemplo 1

(2-carbamoil-6-metil-fenil)-amida del ácido metil-fenil-sulfamoil-N-(5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico [no de acuerdo con la invención]

- 5 Se disolvieron 0,089 g de metil-fenil-sulfamoil-amina en 5 ml de cloruro de metileno. Se añadieron 0,017 g hidruro de sodio a 20 - 25°C y se agitó la solución durante 1 hora. Se añadieron 0,20 g de 2-[5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-il]-8-metil-benzo[d][1,3]oxazin-4-ona y se sometió a reflujo la mezcla resultante durante 24 h. Se removió el solvente y se purificó el residuo por medio de cromatografía en columna (ciclohexano/ acetato de etilo 1:2) para producir 0,18 g de (2-carbamoil-6-metil-fenil)-amida del ácido metil-fenilsulfamoil-N-(5-bromo-2-(3-cloropiridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico).

### Ejemplo 2

Etapa A: Preparación de (2-carbamoil-6-metil-fenil)-amida del ácido 5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico.

- 10 Se recogió 1,00 g de 2-[5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-il]-8-metil-benzo[d][1,3]oxazin-4-ona en 10 ml de a una solución de amoníaco al 25% en agua y se agitó durante 72 h. Se filtraron los sólidos y se lavó con agua fría para producir 0,80 g de la amida.

Etapa B: (2-carbamoil-6-metil-fenil)-sulfimida del ácido S,S-dimetil-N-(5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico, compuesto 1.3-2.

- 15 Se disolvieron 0,071 ml de DMSO bajo una atmósfera de nitrógeno en 0,5 ml de cloruro de metileno y se enfrió hasta -60°C. Se añadieron lentamente 0,14 ml de anhídrido de ácido trifluoroacético a esta temperatura seguido por la adición de 0,20 g de (2-carbamoil-6-metil-fenil)-amida del ácido 5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico. Se agitó la solución resultante a -35°C durante 1 h. Después de diluir con 5 ml de cloruro de metileno, se extrajo la mezcla de reacción con hidróxido de sodio acuoso una vez y dos veces con agua. Se secó el solvente orgánico y se removió el solvente. Se diluyó el residuo con éter dietílico y se retiró por filtración el residuo sólido y se lo secó para producir 0,08 g de la sulfamida deseada.
- 20

### Ejemplo 3

Se preparó S,S-dimetil-S-aminosulfonio mesitilenosulfonato de acuerdo con Y. Tamura et al, Tetrahedron, 1975, 31, 3035 - 3040.

- 25 (2-carbamoil-6-metil-fenil)-sulfimida del ácido S,S-dimetil-N-(5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico, compuesto 1.3-2.

- 30 Se disolvieron 0,2 g de S,S-dimetil-S-aminosulfonio mesitilenosulfonato en 20 ml de cloruro de metileno. Se añadieron 0,26 g de t-butilato de potasio, 0,54 g de 2-[5-bromo-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-il]-8-metil-benzo[d][1,3]oxazin-4-ona y se agitó la mezcla resultante a 20 - 25°C durante 3,5 h adicionales. Se extrajo la mezcla de reacción con hidróxido de sodio acuoso una vez y dos veces con agua. Se secó el solvente orgánico y se removió el solvente. La cromatografía en columna produjo 0,3 g del producto deseado.

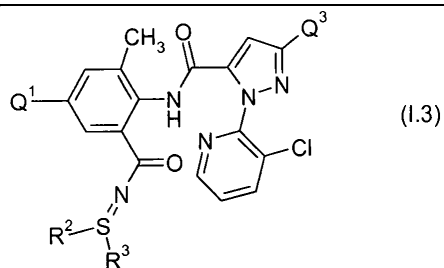
### Ejemplo 4

2-{2-[5-Bromo-2-(2-cloro-fenil)-2H-pirazol-3-il]-2-oxo-etil}-5-cloro-3-metil-N-(1-oxo-hexahidro-1-lambda\*6\*-tiopiran-1-ilideno)-benzamida

- 35 Se disolvieron 0,2 g de 2-{2-[5-bromo-2-(2-cloro-fenil)-2H-pirazol-3-il]-2-oxo-etil}-5-cloro-3-metil-N-(tetrahidro-1-lambda\*4\*-tiopiran-1-ilideno)-benzamida (0,35 mmol) en 10 ml de ácido acético. Se añadieron 4 mg de wolframato de sodio dihidratado. Se añadieron gota a gota 45 mg de una solución al 30 % de peróxido de hidrógeno y se agió la solución resutante durante 18 h. Se vertió la mezcla de reacción en una solución acuosa saturada de carbonato de sodio, se añadió cloruro de metileno y se lavó posteriormente la fase orgánica con agua y carbonato de sodio acuoso saturado. Se secó el solvente orgánico y se removió el solvente. La cromatografía en columna produjo 0,07 g del producto deseado, compuesto 1.4-22.
- 40

Se caracterizaron los productos por medio de Cromatografía Líquida de Alto Rendimiento acoplada / espectrometría de masas (HPLC/MS), por RMN o por medio de sus puntos de fusión.

Tabla III



No.	Q <sup>1</sup>	Q <sup>3</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	Punto de Fusión [°C]
13.1 - 1	Cl	CF <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	163
13.1 - 2	H	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	165
13.1 - 3	Cl	Br	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	aceite
13.1 - 4	Cl	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	185
13.1 - 5	Cl	Br	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	165 con descomposición
13.1 - 6	Cl	CF <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	142
13.1 - 7	H	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	200
13.1 - 8	Cl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	182
13.1 - 9	H	Br	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	150
13.1 - 10	H	CF <sub>3</sub>	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	143
13.1 - 11	Cl	Br	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	179
13.1 - 12	Cl	Br	n-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	160
13.1 - 13	H	Br	n-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	70 con descomposición
13.1 - 14	Cl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	60 con descomposición
13.1 - 15	I	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	85
13.1 - 16	I	Br	CH <sub>3</sub>	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	180 con descomposición
13.1 - 17	H	CF <sub>3</sub>	n-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	106
13.1 - 18	I	Br	n-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	150 con descomposición
13.1 - 19	I	Br	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	75
13.1 - 20	I	CF <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	75
13.1 - 21	H	Br	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	180

ES 2 371 356 T3

(continuación)

No.	Q <sup>1</sup>	Q <sup>3</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	Punto de Fusión [°C]
13.1 - 22	I	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	115
13.1 - 23	I	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	165
13.1 - 24	H	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	206
13.1 - 25	Cl	Br	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	192
13.1 - 26	H	Br	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	161
13.1 - 27	I	Br	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	124
13.1 - 28	Cl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	181
13.1 - 29	H	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	181
13.1 - 30	I	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	181
13.1 - 31	H	CF <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	192
13.1 - 32	Cl	CF <sub>3</sub>	n-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	133
13.1 - 33	I	CF <sub>3</sub>	n-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	135
13.1 - 34	Cl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	p-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	185
13.1 - 35	Cl	Br	CH <sub>3</sub>	p-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	195
13.1 - 36	H	Br	CH <sub>3</sub>	p-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	120
13.1 - 37	H	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	p-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	180
13.1 - 38	I	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	p-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	182
13.1 - 39	I	Br	CH <sub>3</sub>	p-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	201
13.1 - 40	Cl	Br	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	158
13.1 - 41	Cl	Br	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CHCH <sub>2</sub>	75
13.1 - 42	H	Br	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CHCH <sub>2</sub>	60
13.1 - 43	I	Br	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CHCH <sub>2</sub>	80
13.1 - 44	I	Br	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	80
13.1 - 45	Cl	OCH <sub>2</sub> CCH	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	aceite
13.1 - 46	I	OCH <sub>2</sub> CCH	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	aceite
13.1 - 47	Cl	OCH <sub>2</sub> CCH	CH <sub>3</sub>	p-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	aceite

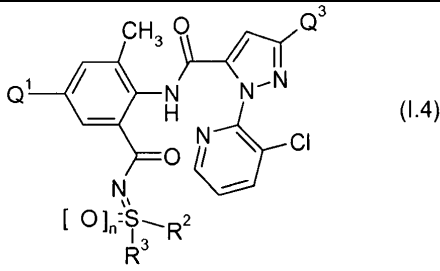









ES 2 371 356 T3

(continuación)

No.	Q <sup>1</sup>	Q <sup>3</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	Punto de Fusión [°C]
13.1 - 48	I	OCH <sub>2</sub> CCH	CH <sub>3</sub>	p-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	Aceite
13.1 - 49	Cl	OCH <sub>2</sub> CCH	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	n-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	aceite
13.1 - 50	I	OCH <sub>2</sub> CCH	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	n-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	aceite
13.1 - 51	H	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	171
13.1 - 52	I	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	164
13.1 - 53	CN	CF <sub>3</sub>	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	70
13.1 - 54	CN	CF <sub>3</sub>	p-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	72
13.1 - 55	CN	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	225
13.1 - 56	CN	Br	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	70
13.1 - 57	CN	Br	p-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	180
13.1 - 58	CN	Br	n-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	50
13.1 - 59	CN	Br	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	185
13.1 - 60	CN	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	205
13.1 - 61	CN	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	80
13.1 - 62	CN	Br	CH <sub>3</sub>	CHCH <sub>2</sub>	60
13.1 - 63	CN	Br	CH <sub>3</sub>	s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	71
13.1 - 64	CN	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CHCH <sub>2</sub>	60
13.1 - 65	CN	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	65
13.1 - 66	CN	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	n-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	47
13.1 - 67	CN	CF <sub>3</sub>	s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	66
13.1 - 68	CN	CF <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	131
"con descomposición" indica la temperatura de inicio de la descomposición					















Tabla IV

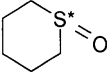
 <p>(I.4)</p>				
No.	Q <sup>1</sup>	Q <sup>3</sup>	[ O ] <sub>n</sub> -S <sup>*</sup> (R <sup>3</sup> )-R <sup>2</sup>	Datos Físicos: Punto de fusión [°C]
1.4 - 1	Cl	Br		203
1.4 - 2	I	Br		195
1.4 - 3	I	CF <sub>3</sub>		185
1.4 - 4	H	CF <sub>3</sub>		208
1.4 - 5	Cl	CF <sub>3</sub>		182
1.4 - 6	Cl	Br		165
1.4 - 7	I	Br		120
1.4 - 8	H	CF <sub>3</sub>		188
1.4 - 9	H	Br		169

ES 2 371 356 T3

(continuación)

No.	Q <sup>1</sup>	Q <sup>3</sup>	$[O]_n = \begin{matrix} S^* \\   \\ R^3 \\   \\ R^2 \end{matrix}$	Datos Físicos: Punto de fusión [°C]
1.4 - 10	I	CF <sub>3</sub>		148
1.4 - 11	I	CF <sub>3</sub>		215
1.4 - 12	Cl	Br		223
1.4 - 13	I	Br		213
1.4 - 14	Cl	OCH <sub>2</sub> CCH		aceite
1.4 - 15	Cl	OCH <sub>2</sub> CCH		aceite
1.4 - 16	CN	CF <sub>3</sub>		85
1.4 - 17	CN	Br		92
1.4 - 18	CN	Br		85
1.4 - 19	CN	Br		85
1.4 - 20	CN	CF <sub>3</sub>		88
1.4 - 21	CN	CF <sub>3</sub>		134

(continuación)

No.	Q <sup>1</sup>	Q <sup>3</sup>	$[O]_n = \overset{*}{S} \begin{matrix} R^2 \\   \\ R^3 \end{matrix}$	Datos Físicos: Punto de fusión [°C]
1.4 - 22	Cl	Br		Aceite
1.4 - 23	Cl	CF <sub>3</sub>	[CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH][(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> CH <sub>3</sub> ]S(=O)-	aceite

### Ejemplos para la acción contra plagas nocivas

#### 5 1. Actividad contra el Picudo del algodónero (*Anthonomus grandis*)

Se formularon los compuestos activos en DMSO:agua en una relación de 1:3. Se colocaron de 10 a 15 huevos en placas de microtitulación llenas con agar-agar al 2% en agua y 300 ppm de formalina. Se rociaron los huevos con 20  $\mu$ l de la solución de prueba, se sellaron las placas con láminas perforadas y se las mantuvo a 24 - 26°C y 75 - 85% de humedad con un ciclo día/noche durante 3 a 5 días. Se evaluó la mortalidad con base en el resto de huevos no eclosionados o larvas sobre la superficie de agar y/o la cantidad y profundidad de los canales de excavación provocados por las larvas eclosionadas. Los análisis fueron repetidos 2 veces.

10

En este ensayo, los compuestos 1.3 - 1, 1.3 - 3, 1.3 - 4, 1.3 - 5, 1.3 - 6, 1.3 - 7, 1.3 - 8, 1.3 - 9, 1.3 - 10, 1.3 - 11, 1.3 - 12, 1.3 - 13, 1.3 - 14, 1.3 - 19, 1.3 - 20, 1.3 - 21, 1.3 - 22, 1.3 - 23, 1.3 - 24, 1.3 - 25, 1.3 - 26, 1.3 - 27, 1.3 - 28, 1.3 - 29, 1.3 - 30, 1.3 - 31, 1.3 - 32, 1.3 - 33, 1.3 - 34, 1.3 - 35, 1.3 - 36, 1.3 - 37, 1.3 - 38, 1.3 - 39, 1.3 - 40, 1.3 - 41, 1.3 - 42, 1.3 - 43, 1.3 - 44, 1.3 - 45, 1.3 - 46, 1.3 - 47, 1.3 - 48, 1.3 - 49, 1.3 - 51, 1.3 - 52, 1.3 - 53, 1.3 - 54, 1.3 - 55, 1.3 - 56, 1.3 - 57, 1.3 - 58, 1.4 - 1, 1.4 - 2, 1.4 - 3, 1.4 - 4, 1.4 - 5, 1.4 - 6, 1.4 - 7, 1.4 - 8, 1.4 - 9, 1.4 - 10, 1.4 - 11, 1.4 - 12, 1.4 - 13, 1.4 - 14, 1.4 - 15, 1.4 - 16, 1.4 - 17, 1.4 - 22, y 1.4 - 23 con 2500 ppm mostraron una mortalidad por encima del 75 %.

15

#### 2. Actividad contra la Mosca de la fruta del Mediterraneo (*Ceratitis capitata*)

Se formularon los compuestos activos en DMSO:agua en una relación de 1:3. Se colocaron de 50 a 80 huevos en placas de microtitulación llenas con agar-agar al 0,5% y una dieta al 14 % en agua. Se rociaron los huevos con 5  $\mu$ l de la solución de prueba, se sellaron las placas con láminas perforadas y se las mantuvo a 27 - 29°C y 75 - 85% de humedad bajo luz fluorescente durante 6 días. Se evaluó la mortalidad con base en la agilidad de la larva eclosionada. Los análisis fueron repetidos 2 veces.

20

En este ensayo, los compuestos 1.3 - 1, 1.3 - 8, 1.3 - 9, 1.3 - 10, 1.3 - 11, 1.3 - 12, 1.3 - 13, 1.3 - 14, 1.3 - 19, 1.3 - 20, 1.3 - 22, 1.3 - 23, 1.3 - 24, 1.3 - 25, 1.3 - 26, 1.3 - 27, 1.3 - 28, 1.3 - 29, 1.3 - 30, 1.3 - 32, 1.3 - 33, 1.3 - 34, 1.3 - 35, 1.3 - 37, 1.3 - 38, 1.3 - 39, 1.3 - 40, 1.3 - 41, 1.3 - 42, 1.3 - 43, 1.3 - 44, 1.3 - 45, 1.3 - 46, 1.3 - 47, 1.3 - 48, 1.3 - 49, 1.3 - 51, 1.3 - 52, 1.3 - 53, 1.3 - 54, 1.3 - 55, 1.3 - 56, 1.3 - 57, 1.3 - 58, 1.4 - 1, 1.4 - 2, 1.4 - 3, 1.4 - 4, 1.4 - 5, 1.4 - 6, 1.4 - 7, 1.4 - 8, 1.4 - 9, 1.4 - 10, 1.4 - 11, 1.4 - 12, 1.4 - 13, 1.4 - 15, 1.4 - 16, 1.4 - 17, 1.4 - 22 y 1.4 - 23 con 2500 ppm mostraron una mortalidad por encima del 75 %.

25

#### 30 3. Actividad contra el gusano de las yemas del Tabaco (*Heliothis virescens*)

Se formularon los compuestos activos en DMSO:agua en una relación de 1:3. Se colocaron de 15 a 25 huevos en placas de microtitulación llenos con dieta. Se rociaron los huevos con 10  $\mu$ l de la solución de prueba, se sellaron las placas con láminas perforadas y se las mantuvo a 27 - 29°C y 75 - 85% de humedad bajo luz fluorescente durante 6 días. Se evaluó la mortalidad con base en la agilidad y la alimentación comparativa de la larva eclosionada. Los análisis fueron repetidos 2 veces.

35

En este ensayo, los compuestos 1.3 - 1, 1.3 - 3, 1.3 - 4, 1.3 - 5, 1.3 - 6, 1.3 - 7, 1.3 - 8, 1.3 - 9, 1.3 - 10, 1.3 - 11, 1.3 - 12, 1.3 - 13, 1.3 - 14, 1.3 - 19, 1.3 - 20, 1.3 - 21, 1.3 - 22, 1.3 - 23, 1.3 - 24, 1.3 - 25, 1.3 - 26, 1.3 - 27, 1.3 - 28, 1.3 - 29, 1.3 - 30, 1.3 - 31, 1.3 - 32, 1.3 - 33, 1.3 - 34, 1.3 - 35, 1.3 - 36, 1.3 - 37, 1.3 - 38, 1.3 - 39, 1.3 - 40, 1.3 - 41, 1.3 - 42, 1.3 - 43, 1.3 - 44, 1.3 - 45, 1.3 - 46, 1.3 - 47, 1.3 - 48, 1.3 - 49, 1.3 - 51, 1.3 - 52, 1.3 - 53, 1.3 - 54, 1.3 - 55, 1.3 - 56, 1.3 - 57, 1.3 - 58, 1.4 - 1, 1.4 - 2, 1.4 - 3, 1.4 - 4, 1.4 - 5, 1.4 - 6, 1.4 - 7, 1.4 - 8, 1.4 - 9, 1.4 - 10, 1.4 - 11, 1.4 - 12, 1.4 - 13, 1.4 - 14, 1.4 - 15, 1.4 - 16, 1.4 - 17,

40

1.4 - 22 y 1.4 - 23 con 2500 ppm mostraron una mortalidad por encima del 75 %.

4. Actividad contra el Pulgón de la arveja (*Megoura viciae*)

5 Se formularon los compuestos activos en DMSO:agua en una relación de 1:3. Se colocaron discos de hoja de alubias en placas de microtitulación con agar-agar al 0,8% y 2,5 ppm de OPUS™. Se rociaron los discos de hoja con 2.5 µl de la solución de prueba y se colocaron de 5 a 8 áfidos adultos en las placas de microtitulación que fueron luego cerradas y mantenidas a 22 - 24°C y 35 - 45% bajo luz fluorescente durante 6 días. Se evaluó la mortalidad con base en los áfidos vitales reproducidos. Los análisis fueron repetidos 2 veces.

10 En este ensayo, los compuestos I.3 - 1, I.3 - 3, I.3 - 4, I.3 - 5, I.3 - 6, I.3 - 7, I.3 - 8, I.3 - 9, I.3 - 10, I.3 - 11, I.3 - 12, I.3 - 13, I.3 - 14, I.3 - 19, I.3 - 20, I.3 - 21, I.3 - 22, I.3 - 23, I.3 - 24, I.3 - 25, I.3 - 26, I.3 - 27, I.3 - 28, I.3 - 29, I.3 - 30, I.3 - 32, I.3 - 33, I.3 - 34, I.3 - 35, I.3 - 36, I.3 - 37, I.3 - 38, I.3 - 39, I.3 - 40, I.3 - 41, I.3 - 42, I.3 - 43, I.3 - 44, I.3 - 45, I.3 - 47, I.3 - 49, I.3 - 51, I.3 - 52, I.3 - 53, I.3 - 54, I.3 - 55, I.3 - 56, I.3 - 57, I.3 - 58, I.4 - 1, I.4 - 2, I.4 - 3, I.4 - 4, I.4 - 5, I.4 - 6, I.4 - 7, I.4 - 8, I.4 - 9, I.4 - 10, I.4 - 11, I.4 - 12, I.4 - 13, I.4 - 14, I.4 - 15, I.4 - 16, I.4 - 17, I.4 - 22 y I.4 - 23 con 2500 ppm mostraron una mortalidad por encima del 75 % comparado con una mortalidad del 0% de los controles no tratados.

15 5. Actividad contra el Pulgón de la avena (*Rhopalosiphum padi*)

20 Se formularon los compuestos activos en DMSO:agua en una relación de 1:3. Se colocaron discos de hoja de cabada en placas de microtitulación con agar-agar al 0,8% y 2,5 ppm de OPUS™. Se rociaron los discos de hoja con 2.5 µl de la solución de prueba y se colocaron de 3 a 8 áfidos adultos en las placas de microtitulación que fueron luego cerradas y mantenidas a 22 - 24°C y 35 - 45% bajo luz fluorescente durante 5 días. Se evaluó la mortalidad con base en los áfidos vitales. Los análisis fueron repetidos 2 veces.

En este ensayo, el compuesto I.3-1 con 2500 ppm mostró una mortalidad por encima del 75 % comparado con una mortalidad del 0% de los controles no tratados.

6. Actividad contra el Pulgón del algodón (*Aphis gossypii*)

25 Se formularon los compuestos activos en acetona:agua en proporción 50:50 y 100 ppm de Kinetic™ como surfactante.

30 Se infestaron plantas de algodón en etapa de cotiledón (una planta por maceta) colocando una hoja fuertemente infestada de la colonia principal en la parte superior de cada cotiledón. Se permitió la transferencia de los áfidos a la planta huésped durante la noche, y se removió la hoja utilizada para transferir los áfidos. Se sumergieron los cotiledones en la solución del ensayo y se permitió que se secaran. Después de 5 días, se hizo el recuento de la mortalidad.

35 En este ensayo, los compuestos I.3 - 1, I.3 - 3, I.3 - 4, I.3 - 5, I.3 - 6, I.3 - 7, I.3 - 8, I.3 - 9, I.3 - 10, I.3 - 11, I.3 - 12, I.3 - 13, I.3 - 14, I.3 - 15, I.3 - 16, I.3 - 17, I.3 - 18, I.3 - 19, I.3 - 20, I.3 - 21, I.3 - 22, I.3 - 23, I.3 - 24, I.3 - 25, I.3 - 26, I.3 - 27, I.3 - 28, I.3 - 29, I.3 - 30, I.3 - 32, I.3 - 33, I.3 - 34, I.3 - 35, I.3 - 36, I.3 - 38, I.3 - 39, I.3 - 40, I.3 - 41, I.3 - 42, I.3 - 43, I.3 - 44, I.3 - 51, I.3 - 52, I.3 - 53, I.3 - 54, I.4 - 1, I.4 - 2, I.4 - 3, I.4 - 4, I.4 - 5, I.4 - 6, I.4 - 7, I.4 - 8, I.4 - 9, I.4 - 10, I.4 - 11, I.4 - 12, I.4 - 13 y I.4 - 16 con 300 ppm mostraron una mortalidad por encima del 50 %.

7. Actividad contra la oruga del sur (*Spodoptera eridania*), segundo estadio larvario

Se formularon los compuestos activos para analizar la actividad contra insectos y arácnidos como una solución de 10.000 ppm en una mezcla de acetona al 35% y agua, que se diluyó con agua, si fuera necesario.

40 Se sumergió una hoja de alubias en la solución del ensayo y se permitió que se secase. Se colocó luego la hoja en una caja de Petri que contenía un papel de filtro en el fondo y diez orugas en segundo estadio larvario. A los 5 días, se hicieron las observaciones de mortalidad y alimentación reducida.

45 En este ensayo, los compuestos I.3 - 3, I.3 - 4, I.3 - 5, I.3 - 6, I.3 - 7, I.3 - 8, I.3 - 9, I.3 - 10, I.3 - 11, I.3 - 12, I.3 - 13, I.3 - 14, I.3 - 15, I.3 - 16, I.3 - 17, I.3 - 18, I.3 - 19, I.3 - 20, I.3 - 21, I.3 - 22, I.3 - 23, I.3 - 24, I.3 - 25, I.3 - 26, I.3 - 27, I.3 - 28, I.3 - 29, I.3 - 30, I.3 - 32, I.3 - 33, I.3 - 34, I.3 - 35, I.3 - 37, I.3 - 38, I.3 - 39, I.3 - 40, I.3 - 41, I.3 - 42, I.3 - 43, I.3 - 44, I.3 - 51, I.3 - 52, I.3 - 53, I.3 - 54, I.4 - 1, I.4 - 2, I.4 - 3, I.4 - 4, I.4 - 5, I.4 - 6, I.4 - 7, I.4 - 8, I.4 - 9, I.4 - 11, I.4 - 12, I.4 - 13, I.4 - 16, I.4 - 22 y I.4 - 23 con 300 ppm mostraron una mortalidad por encima del 75%.

8. Actividad contra la mosca blanca de la hoja plateada (*bemisia argentifolii*)

Se formularon los compuestos activos en acetona:agua en una proporción 50:50 y 100 ppm de Kinetic™ como surfactante.

5 Se cultivaron las plantas de algodón seleccionadas hasta el estado e cotiledón (una planta por maceta). Se sumergieron los cotiledones en la solución del ensayo para proporcionar recubrimiento completo al follaje y se los colocó en un área bien ventilada hasta sequedad. Se colocó cada maceta con plántulas tratadas en una taza de plástico y se introdujeron de 10 a 12 moscas blancas adultas (aproximadamente 3 - 5 días de edad). Se recolectaron los insectos utilizando un aspirador y un tubo de 0,6 cm, no tóxico de Tygon™ (R-3603) conectado a una punta de una pipeta de barrera. La punta, que contenía los insectos recolectados, fue luego insertada suavemente en el suelo que contenía la planta tratada, permitiendo que los insectos se arrastren desde la punta hasta alcanzar el follaje para alimentarse. Se cubrieron las tazas con una tapa enmallada reutilizable (malla de poliéster con tamaño de orificio de 150 micras PeCap de Tetko Inc). Se mantuvieron las plantas del ensayo en la sala de espera aproximadamente a 25°C y 20 - 40% de humedad relativa durante 3 días evitando exposición directa a la luz fluorescente (período de luz de 24 horas) para evitar el atrapamiento de calor dentro de la taza. Se evaluó la mortalidad 3 días después del tratamiento de las plantas.

15 En este ensayo, los compuestos 1.3 - 1, 1.3 - 3, 1.3 - 4, 1.3 - 5, 1.3 - 6, 1.3 - 8, 1.3 - 9, 1.3 - 10, 1.3 - 11, 1.3 - 12, 1.3 - 13, 1.3 - 14, 1.3 - 15, 1.3 - 16, 1.3 - 17, 1.3 - 19, 1.3 - 20, 1.3 - 22, 1.3 - 23, 1.3 - 25, 1.3 - 26, 1.3 - 27, 1.3 - 28, 1.3 - 30, 1.4 - 1, 1.4 - 2 y 1.4 - 3 con 300 ppm mostraron una mortalidad por encima del 90%.

#### 9. Actividad contra la polilla Dorso de diamante (*plutella xylostella*)

20 Se formularon los compuestos activos en acetona:agua en una proporción de 50:50 y 0,1% (vol/vol) de Alkamuls EL 620 como surfactante. Se sumergió un disco de hoja de 6 cm de hojas de col en la solución del ensayo durante 3 segundos y se permitió que se secase al aire en una caja de Petri forrada con papel filtro húmedo. Se inoculó el disco de hoja con 10 larvas en tercer estadio larvario y se lo mantuvo a 25 - 27°C y 50 - 60% de humedad durante 3 días. Se evaluó la mortalidad después de 72 h de tratamiento.

25 En este ensayo, los compuestos 1.3 - 5, 1.3 - 6, 1.3 - 7, 1.3 - 8, 1.3 - 9, 1.3 - 10, 1.3 - 11, 1.3 - 12, 1.3 - 13, 1.3 - 14, 1.3 - 15, 1.3 - 16, 1.3 - 17, 1.3 - 18, 1.3 - 19, 1.3 - 20, 1.3 - 21, 1.3 - 22, 1.3 - 23, 1.3 - 24, 1.3 - 25, 1.3 - 26, 1.3 - 27, 1.3 - 28, 1.3 - 29, 1.3 - 30, 1.3 - 31, 1.3 - 32, 1.3 - 33, 1.3 - 34, 1.3 - 35, 1.3 - 36, 1.3 - 37, 1.3 - 38, 1.3 - 39, 1.3 - 40, 1.3 - 41, 1.3 - 42, 1.3 - 43, 1.3 - 44, 1.3 - 45, 1.3 - 46, 1.3 - 47, 1.3 - 48, 1.3 - 49, 1.3 - 51, 1.3 - 52, 1.3 - 53, 1.3 - 54, 1.3 - 55, 1.3 - 56, 1.3 - 57, 1.3 - 58, 1.3 - 59, 1.3 - 60, 1.3 - 61, 1.3 - 62, 1.3 - 63, 1.4 - 1, 1.4 - 2, 1.4 - 3, 1.4 - 4, 1.4 - 5, 1.4 - 6, 1.4 - 7, 1.4 - 8, 1.4 - 9, 1.4 - 10, 1.4 - 11, 1.4 - 12, 1.4 - 13, 1.4 - 16, 1.4 - 17, 1.4 - 18, 1.4 - 19, y 1.4 - 22 con 300 ppm mostraron una mortalidad por encima del 75%.

35 10. Actividad contra la hormiga Argentina (*Linepithema humile*), hormiga cosechadora (*Pogonomyrmex californicus*), hormiga acróbata (*Crematogaster spp.*), hormiga carpintera (*Camponotus floridanus*), hormiga de fuego (*Solenopsis invicta*), mosca casera (*Musca domestica*), mosca de establo (*Stomoxys calcitrans*), mosca de la carne (*Sarcophaga sp.*), mosquito de la fiebre amarilla (*Aedes aegyptii*), mosquito casero (*Culex quinquefasciatus*), mosquito de la malaria (*Anopheles albimanus*), cucaracha alemana (*Blattella Germanica*), pulga del gato (*Ctenocephalides felis*), y garrapata marrón del perro (*Rhipicephalus sanguineus*) a través de contacto con el vidrio.

Se trataron viales de vidrio con 0,5 ml de una solución de ingrediente activo en acetona y se permitió que se secaran. Se colocaron los insectos o garrapatas en cada vial junto con algo de alimento y suministro de humedad. Se mantuvieron los viles a 22°C y se observaron los efectos del tratamiento en diferentes intervalos de tiempo.

40 En este ensayo, los compuestos 1.3 - 4, 1.3 - 5 y 1.3 - 6 con 10 ppm mostraron una mortalidad por encima del 70% del mosquito de la fiebre amarilla.

11. Actividad contra las larvas del mosquito de la fiebre amarilla (*Aedes aegyptii*), el mosquito casero (*Culex quinquefasciatus*) y el mosquito de la malaria (*Anopheles albimanus*) a través del tratamiento con agua.

45 Se utilizaron placas con pozos como lugares de prueba. Se disolvió el ingrediente activo en acetona y se diluyó con agua hasta obtener la concentración requerida. Las soluciones finales que contenían aproximadamente 1% de acetona fueron colocadas en cada pozo. Se añadieron aproximadamente 10 larvas de mosquito (cuarto estadio larvario) en 1 ml de agua a cada pozo. Las larvas fueron alimentadas una gota de hígado en polvo cada día. Se cubrieron las cajas y mantuvieron a 22°C. Se registró la mortalidad cada día y diariamente se retiraron las pupas muertas o vivas y las larvas muertas. Al final del ensayo se registraron las larvas vivas restantes y se calculó el porcentaje de mortalidad.

50 En este ensayo, los compuestos 1.3 - 4, 1.3 - 5, 1.3 - 6 y 1.3 - 7 con 10 ppm mostraron una mortalidad por encima del 70% del mosquito de la fiebre amarilla.

12. Actividad contra los nematodos del nódulo de la raíz (*Meloidogyne incognita*):

5 Se preparan y formulan los compuestos del ensayo en formulaciones acuosas utilizando acetona. Se cultivan plantas de tomate (variedad Bonny Best) en el invernadero en tubos de plástico (4 a 6 plantas por tubo). Se infestan las plantas y el suelo (una mezcla 50:50 de arena y marga arenosa "New Egypt") con *M. incognita* J2 (para establecer la colonia "interna, *M. Incognita* J2 fueron inicialmente adquiridas a la Auburn University). Se mantienen las plantas podadas y se utilizan a medida que se van necesitando. Se mantienen las plantas de tomate en el cilindro que contiene la solución hidropónica y se las airea hasta que los nemátodos ya no están presentes en la solución (usualmente aproximadamente 60 días). Se revisan los cultivos diariamente eluyendo un pequeño volumen (aproximadamente 20  $\mu\text{l}$ ) del fondo de un embudo unido al cilindro dentro de una caja pequeña de cristalización y y

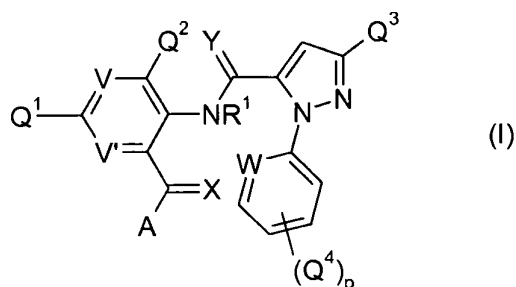
10 se observa utilizando un alcance de disección binocular. Si se requiere para el análisis, se limpian y concentran los nemátodos vertiendo la solución del cultivo a través de un tamiz para limpieza y un tamiz para concentración. Se resuspenden luego los nemátodos en agua hasta una concentración aproximadamente de 20 a 50 nemátodos por 50  $\mu\text{l}$ . Se hace un recuento de éstos colocando 25  $\mu\text{l}$  de la solución de nemátodos en un pozo no utilizado de una placa de ensayo. Se multiplica luego el total por 2 para un total final de nemátodos por 50  $\mu\text{l}$  de solución. A las

15 placas de microtitulación que contienen aproximadamente 1,0 mg del compuesto, se añade a cada pozo acetona en una proporción de 80:20 y se mezcla la solución para obtener la concentración deseada del compuesto. Se añade la solución de nemátodos a cada placa. Se sellan luego las placas y se colocan en una incubadora a 27°C y 50% (+/- 2%) de humedad relativa. Después de 72 horas, se lee la mortalidad de la población, en donde la inmovilidad de nemátodos es considerada como mortalidad.

20

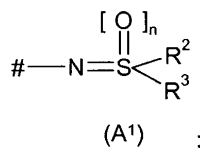
## REIVINDICACIONES

1. Compuestos de N-Tio-antranilamida de fórmula I



en donde

- 5 R<sup>1</sup> es hidrógeno; o alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alqueno C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>, alquino C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>, o cicloalquilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, cada uno de los cuales está sustituido o no sustituido con 1 a 5 grupos independiente seleccionados de entre halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, alcoxi C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquiltio C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alcocarbonilo C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>, alquilamino C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, di(alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>)amino y cicloalquilamino C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>; o alquilcarbonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alcocarbonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, di(alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>)aminocarbonilo;
- 10 A es A<sup>1</sup>



en donde

# indica el sitio de enlazamiento;

R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> cada uno independientemente son R<sup>6</sup>, o

- 15 R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> junto con el átomo de azufre al cual están unidos forman un anillo de 3 a 8 miembros saturado, parcialmente insaturado o insaturado que contiene de 1 a 4 heteroátomos seleccionados de entre oxígeno, nitrógeno, azufre, cuyo anillo puede estar fusionado con uno o dos anillos de 5 a 6 miembros saturados, parcialmente insaturado o insaturado que pueden contener de 1 a 4 heteroátomos seleccionados de entre oxígeno, nitrógeno, azufre, en donde todos los anillos anteriores están sustituidos o no sustituidos por cualquier combinación de 1 a 6 grupos R<sup>8</sup>;
- 20 G es oxígeno o azufre;
- R<sup>6</sup> es alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>20</sub>, alqueno C<sub>2</sub> - C<sub>20</sub>, alquino C<sub>2</sub> - C<sub>20</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, cicloalqueno C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, cicloalquino C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, fenilo, naftilo, bifenilo, o un sistema de anillo de 3 a 8 miembros saturados, parcialmente insaturado o insaturado que contiene de 1 a 4 heteroátomos seleccionados de entre oxígeno, nitrógeno, azufre, en donde todos estos grupos están sustituidos o no sustituidos por una combinación de 1 a 6 grupos R<sup>8</sup>;
- 25 R<sup>8</sup> es R<sup>9</sup>; o dos grupos R<sup>8</sup> junto con los átomos a los cuales están unidos forman un sistema de anillo de 3 a 8 miembros saturado, parcialmente insaturado o insaturado que puede contener de 1 a 4 heteroátomos /heterogrupos seleccionados de entre oxígeno, nitrógeno, azufre, SO y SO<sub>2</sub>, y cuyo sistema de anillo está sustituido o no sustituido con cualquier combinación de 1 a 6 grupos R<sup>9</sup>.

- 30 R<sup>9</sup> es R<sup>10</sup>, R<sup>11</sup>, -C(=G)R<sup>10</sup>, -C(=NOR<sup>10</sup>)R<sup>10</sup>, -C(=NNR<sup>10</sup>)R<sup>10</sup>, -C(=G)OR<sup>10</sup>, -C(=G)NR<sup>10</sup>, -OC(=G)R<sup>10</sup>, -OC(=G)OR<sup>10</sup>, -NR<sup>10</sup>C(=G)R<sup>10</sup>, -N[C(=G)R<sup>10</sup>]<sub>2</sub>, -NR<sup>10</sup>C(=G)OR<sup>10</sup>, -C(=G)NR<sup>10</sup>-NR<sup>10</sup>, -C(=G)NR<sup>10</sup>-NR<sup>10</sup>[C(=G)R<sup>10</sup>], -NR<sup>10</sup>-C(=G)NR<sup>10</sup>, -NR<sup>10</sup>-NR<sup>10</sup>C(=G)R<sup>10</sup>, -NR<sup>10</sup>-N[C(=G)R<sup>10</sup>]<sub>2</sub>, -N[(C=G)R<sup>10</sup>]-NR<sup>10</sup>, -NR<sup>10</sup>-NR<sup>10</sup>[(C=G)R<sup>10</sup>], -NR<sup>10</sup>[(C=G)NR<sup>10</sup>], -NR<sup>10</sup>[C(=NR<sup>10</sup>)R<sup>10</sup>], -NR<sup>10</sup>(C=NR<sup>10</sup>)NR<sup>10</sup>, -O-NR<sup>10</sup>, -O-NR<sup>10</sup>(C=G)R<sup>10</sup>, -SO<sub>2</sub>NR<sup>10</sup>, -NR<sup>10</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>10</sup>, -SO<sub>2</sub>OR<sup>10</sup>, -OSO<sub>2</sub>R<sup>10</sup>, -OR<sup>10</sup>, -NR<sup>10</sup>, -SR<sup>10</sup>, -SiR<sup>10</sup><sub>3</sub>, -PR<sup>10</sup><sub>2</sub>, -P(=G)R<sup>10</sup>, -SOR<sup>10</sup>, -SO<sub>2</sub>R<sup>10</sup>, -PG<sub>2</sub>R<sup>10</sup>, -PG<sub>3</sub>R<sup>10</sup>, o dos grupos R<sup>9</sup> juntos son (=G), (=N-R<sup>10</sup>), (=CR<sup>10</sup>), (=CHR<sup>10</sup>), o (=CH<sub>2</sub>);

5  $R^{10}$  es alquilo  $C_1 - C_{10}$ , alqueno  $C_2 - C_{10}$ , alquino  $C_2 - C_{10}$ , cicloalquilo  $C_3 - C_8$ , cicloalqueno  $C_4 - C_8$ , cicloalquil  $C_3 - C_8$  - alquilo  $C_1 - C_4$ , cicloalqueno  $C_4 - C_8$  - alquilo  $C_1 - C_4$ , cicloalquil  $C_3 - C_8$  - alqueno  $C_2 - C_4$ , cicloalqueno  $C_4 - C_8$  - alqueno  $C_2 - C_4$ , alquil  $C_1 - C_{10}$  - cicloalquilo  $C_3 - C_8$ , alqueno  $C_2 - C_{10}$  - cicloalquilo  $C_3 - C_8$ , alquil  $C_1 - C_{10}$  - cicloalqueno  $C_4 - C_8$ , alqueno  $C_2 - C_{10}$  - cicloalqueno  $C_4 - C_8$ , alquil  $C_1 - C_{10}$  - cicloalqueno  $C_4 - C_8$ , un sistema de anillo de 3 a 8 miembros saturado, parcialmente insaturado o insaturado que contiene de 1 a 4 heteroátomos seleccionados de entre oxígeno, nitrógeno, azufre, en donde los grupos anteriores están sustituidos o no sustituidos con cualquier combinación de 1 a 6 grupos  $R^{11}$ ;

10  $R^{11}$  es halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, mercapto, amino, formilo, alquilcarbonilo  $C_1 - C_{10}$ , alcoxi  $C_1 - C_{10}$ , alquinoxilo  $C_2 - C_{10}$ , alquinoxilo  $C_2 - C_{10}$ , haloalcoxi  $C_1 - C_{10}$ , haloalquinoxilo  $C_3 - C_{10}$ , haloalquinoxilo  $C_3 - C_{10}$ , cicloalcoxi  $C_3 - C_8$ , cicloalquinoxilo  $C_4 - C_8$ , halocicloalcoxi  $C_3 - C_8$ , halocicloalquinoxilo  $C_4 - C_8$ , cicloalquil  $C_3 - C_8$  - alcoxi  $C_1 - C_4$ , cicloalqueno  $C_4 - C_8$  - alcoxi  $C_1 - C_4$ , cicloalquil  $C_3 - C_8$  - alquinoxilo  $C_2 - C_4$ , cicloalqueno  $C_4 - C_8$  - alquinoxilo  $C_2 - C_4$ , alquil  $C_1 - C_{10}$  - cicloalcoxi  $C_3 - C_8$ , alqueno  $C_1 - C_{10}$  - cicloalcoxi  $C_3 - C_8$ , alquil  $C_1 - C_{10}$  - cicloalquinoxilo  $C_3 - C_8$ , alqueno  $C_1 - C_{10}$  - cicloalquinoxilo  $C_3 - C_8$ , alcoxi  $C_1 - C_4$  - alcoxi  $C_1 - C_{10}$ , alcoxi  $C_1 - C_4$  - di(cicloalquil  $C_3 - C_8$ )carbamoilo, alcoxycarbonilo  $C_1 - C_{10}$ , cicloalcoxycarbonilo  $C_3 - C_8$ , alquilcarbonilo  $C_1 - C_{10}$ , cicloalquilcarbonilo  $C_3 - C_8$ , haloalcoxycarbonilo  $C_1 - C_{10}$ , haloalquilcarbonilo  $C_1 - C_{10}$ , alcanamido  $C_1 - C_{10}$ , haloalcanamido  $C_1 - C_{10}$ , alquenamido  $C_2 - C_{10}$ , cicloalcanamido  $C_3 - C_8$ , cicloalquil  $C_3 - C_8$  - alcanamido  $C_1 - C_4$ , alquiltio  $C_1 - C_{10}$ , alquenoiltio  $C_2 - C_{10}$ , alquinoiltio  $C_2 - C_{10}$ , haloalquiltio  $C_1 - C_{10}$ , haloalquenoiltio  $C_2 - C_{10}$ , haloalquinoiltio  $C_2 - C_{10}$ , cicloalquiltio  $C_3 - C_8$ , cicloalquenoiltio  $C_3 - C_8$ , halocicloalquiltio  $C_3 - C_8$ , halocicloalquenoiltio  $C_3 - C_8$ , cicloalquil  $C_3 - C_8$  - alquiltio  $C_1 - C_4$ , cicloalqueno  $C_4 - C_8$  - alquiltio  $C_1 - C_4$ , cicloalquil  $C_3 - C_8$  - alquenoiltio  $C_2 - C_4$ , cicloalqueno  $C_4 - C_8$  - alquenoiltio  $C_2 - C_4$ , alquil  $C_1 - C_{10}$  - cicloalquiltio  $C_3 - C_8$ , alqueno  $C_1 - C_{10}$  - cicloalquiltio  $C_3 - C_8$ , alquil  $C_1 - C_{10}$  - cicloalquenoiltio  $C_3 - C_8$ , alqueno  $C_1 - C_{10}$  - cicloalquenoiltio  $C_3 - C_8$ , alquilsulfino  $C_1 - C_{10}$ , alquilsulfino  $C_2 - C_{10}$ , alquilsulfino  $C_2 - C_{10}$ , haloalquilsulfino  $C_1 - C_{10}$ , haloalquilsulfino  $C_2 - C_{10}$ , haloalquilsulfino  $C_2 - C_{10}$ , cicloalquilsulfino  $C_3 - C_8$ , cicloalquenoiltio  $C_3 - C_8$ , halocicloalquilsulfino  $C_3 - C_8$ , halocicloalquenoiltio  $C_3 - C_8$ , cicloalquil  $C_3 - C_8$  - alquilsulfino  $C_1 - C_4$ , cicloalqueno  $C_4 - C_8$  - alquilsulfino  $C_1 - C_4$ , cicloalquil  $C_3 - C_8$  - alquilsulfino  $C_2 - C_4$ , cicloalqueno  $C_4 - C_8$  - alquilsulfino  $C_2 - C_4$ , alquil  $C_1 - C_{10}$  - cicloalquilsulfino  $C_3 - C_8$ , alqueno  $C_1 - C_{10}$  - cicloalquilsulfino  $C_3 - C_8$ , alquil  $C_1 - C_{10}$  - cicloalquilsulfino  $C_3 - C_8$ , alquilsulfonilo  $C_1 - C_{10}$ , alquilsulfonilo  $C_2 - C_{10}$ , alquilsulfonilo  $C_2 - C_{10}$ , haloalquilsulfonilo  $C_1 - C_{10}$ , haloalquilsulfonilo  $C_2 - C_{10}$ , haloalquilsulfonilo  $C_2 - C_{10}$ , cicloalquilsulfonilo  $C_3 - C_8$ , cicloalquenoiltio  $C_3 - C_8$ , halocicloalquilsulfonilo  $C_3 - C_8$ , halocicloalquenoiltio  $C_3 - C_8$ , cicloalquil  $C_3 - C_8$  - alquilsulfonilo  $C_1 - C_4$ , cicloalqueno  $C_4 - C_8$  - alquilsulfonilo  $C_1 - C_4$ , cicloalquil  $C_3 - C_8$  - alquilsulfonilo  $C_2 - C_4$ , cicloalqueno  $C_4 - C_8$  - alquilsulfonilo  $C_2 - C_4$ , alquil  $C_1 - C_{10}$  - cicloalquilsulfonilo  $C_3 - C_8$ , alqueno  $C_1 - C_{10}$  - cicloalquilsulfonilo  $C_3 - C_8$ , alquil  $C_1 - C_{10}$  - cicloalquilsulfonilo  $C_3 - C_8$ , di(alquil  $C_1 - C_{10}$ )amino, alquilamino  $C_1 - C_{10}$ , alquenoilamino  $C_2 - C_{10}$ , alquinoilamino  $C_2 - C_{10}$ , alquil  $C_1 - C_{10}$  - alquenoilamino  $C_2 - C_{10}$ , alquil  $C_1 - C_{10}$  - alquinoilamino  $C_2 - C_{10}$ , haloalquilamino  $C_1 - C_{10}$ , haloalquenoilamino  $C_2 - C_{10}$ , haloalquinoilamino  $C_2 - C_{10}$ , cicloalquilamino  $C_3 - C_8$ , cicloalquenoilamino  $C_3 - C_8$ , halocicloalquilamino  $C_3 - C_8$ , halocicloalquenoilamino  $C_3 - C_8$ , cicloalquil  $C_3 - C_8$  - alquilamino  $C_1 - C_4$ , cicloalqueno  $C_4 - C_8$  - alquilamino  $C_1 - C_4$ , cicloalquil  $C_3 - C_8$  - alquenoilamino  $C_2 - C_4$ , cicloalqueno  $C_4 - C_8$  - alquenoilamino  $C_2 - C_4$ , alquil  $C_1 - C_{10}$  - cicloalquilamino  $C_3 - C_8$ , alqueno  $C_1 - C_{10}$  - cicloalquilamino  $C_3 - C_8$ , alquil  $C_1 - C_{10}$  - cicloalquenoilamino  $C_3 - C_8$ , alqueno  $C_1 - C_{10}$  - cicloalquenoilamino  $C_3 - C_8$ , tri(alquil  $C_1 - C_{10}$ )silo, arilo, ariloxi, ariltio, arilamino, arilalcoxi  $C_1 - C_4$ , arilalquinoxilo  $C_3 - C_4$ , arilalquiltio  $C_1 - C_4$ , arilalquenoiltio  $C_2 - C_4$ , arilalquenoilamino  $C_1 - C_4$ , arilalquenoilamino  $C_3 - C_4$ , aril-di(alquil  $C_1 - C_4$ )silo, triarilsilo, en donde arilo es fenilo, naftilo o bifenilo, o un sistema de anillo de 3 a 8 miembros saturado, parcialmente insaturado o insaturado que contiene de 1 a 4 heteroátomos seleccionados de entre oxígeno, nitrógeno, azufre, en donde estos arilo y estos sistemas de anillo heterocíclico están sustituidos o no sustituidos con cualquier combinación de 1 a 6 grupos seleccionados de entre halógeno, ciano, nitro, amino, hidroxilo, mercapto, alquilo  $C_1 - C_4$ , haloalquilo  $C_1 - C_4$ , cicloalquilo  $C_3 - C_8$ , alcoxi  $C_1 - C_4$ , haloalcoxi  $C_1 - C_4$ , alquiltio  $C_1 - C_4$ , haloalquiltio  $C_1 - C_4$ , di(alquil  $C_1 - C_4$ )amino, alquilamino  $C_1 - C_4$ , haloalquilamino  $C_1 - C_4$ , formilo y alquilcarbonilo  $C_1 - C_4$ ;

50  $Q^1$  y  $Q^2$  son independientemente cada uno hidrógeno, halógeno, ciano, SCN, nitro, hidroxilo, alquilo  $C_1 - C_{10}$ , haloalquilo  $C_1 - C_{10}$ , alqueno  $C_2 - C_{10}$ , haloalqueno  $C_2 - C_{10}$ , alquino  $C_2 - C_{10}$ , haloalquino  $C_3 - C_{10}$ , cicloalquilo  $C_3 - C_8$ , halocicloalquilo  $C_3 - C_8$ , alcoxi  $C_1 - C_{10}$ , haloalcoxi  $C_1 - C_{10}$ , alquiltio  $C_1 - C_{10}$ , haloalquiltio  $C_1 - C_{10}$ , alquilsulfino  $C_1 - C_{10}$ , haloalquilsulfino  $C_1 - C_{10}$ , alquilsulfonilo  $C_1 - C_{10}$ , haloalquilsulfonilo  $C_1 - C_{10}$ , alquilsulfonilo  $C_1 - C_{10}$ , alquilsulfonilo  $C_1 - C_{10}$ , alquilsulfonilo  $C_1 - C_{10}$ , alquilsulfonilo  $C_1 - C_{10}$ , di(alquil  $C_1 - C_{10}$ )amino, cicloalquilamino  $C_3 - C_8$ , alquilcarbonilo, alcoxycarbonilo  $C_1 - C_{10}$ , alquilaminocarbonilo  $C_1 - C_{10}$ , di(alquil  $C_1 - C_{10}$ )aminocarbonilo, o trialquilsilo ( $C_1 - C_{10}$ , o  $Q^1$  y  $Q^2$  son independientemente cada uno fenilo, bencilo o fenoxi, en donde cada anillo está sustituido o no sustituido con cualquier combinación de 1 a 3 sustituyentes independientemente seleccionados de entre el grupo de halógeno, ciano, nitro, alquilo  $C_1 - C_{10}$ , haloalquilo  $C_1 - C_{10}$ , alqueno  $C_2 - C_{10}$ , haloalqueno  $C_2 - C_{10}$ , alquino  $C_2 - C_{10}$ , haloalquino  $C_3 - C_{10}$ , cicloalquilo  $C_3 - C_8$ , halocicloalquilo  $C_3 - C_8$ , alcoxi  $C_1 - C_{10}$ , haloalcoxi  $C_1 - C_{10}$ , alquiltio  $C_1 - C_{10}$ , haloalquiltio  $C_1 - C_{10}$ , alquilsulfino  $C_1 - C_{10}$ , alquilsulfonilo  $C_1 - C_{10}$ , alquilamino  $C_1 - C_{10}$ , di(alquil  $C_1 - C_{10}$ )amino, cicloalquilamino  $C_3 - C_8$ , alquil  $C_1 - C_{10}$  - cicloalquilamino  $C_3 - C_8$ , alquilcarbonilo  $C_1 - C_{10}$ , alcoxycarbonilo  $C_1 - C_{10}$ , alquilaminocarbonilo  $C_1 - C_{10}$ , di(alquil  $C_1 - C_{10}$ )aminocarbonilo y tri( $C_1 - C_{10}$ )-alquilsilo;

$Q^3$  es halógeno; o alquilo  $C_1 - C_{10}$ , haloalquilo  $C_1 - C_{10}$ , alqueno  $C_2 - C_{10}$ , haloalqueno  $C_2 - C_{10}$ , alquino  $C_2 - C_{10}$ ,



haloalquino  $C_3 - C_{10}$ , cicloalquilo  $C_3 - C_8$ , halocicloalquilo  $C_3 - C_8$ , alquil  $C_1 - C_{10}$  - cicloalquilo  $C_3 - C_8$ , haloalquil  $C_1 - C_{10}$  - cicloalquilo  $C_3 - C_8$ , cada uno no sustituido o independientemente sustituido con 1 a 2 grupos seleccionados de entre ciano, alcoxi  $C_1 - C_{10}$ , haloalcoxi  $C_1 - C_{10}$ , alquiltio  $C_1 - C_{10}$ , haloalquiltio  $C_1 - C_{10}$ , alquilsulfino  $C_1 - C_{10}$ , haloalquilsulfino  $C_1 - C_{10}$ , alquilsulfonilo  $C_1 - C_{10}$ , haloalquilsulfonilo  $C_1 - C_{10}$ , y alcocarbonilo  $C_1 - C_{10}$ ; o

5  $Q^3$  es  $OR^{14}$ ,  $S(O)_qR^{14}$ ,  $NR^{15}R^{16}$ ,  $OS(O)_2R^{17}$ ,  $NR^{16}S(O)_2R^{17}$ ,  $C(S)NH_2$ ,  $C(R^{18})=NOR^{18}$ , cicloalquil  $C_3 - C_8$  - alquilo  $C_1 - C_4$ , alquilaminocarbonilo  $C_1 - C_{10}$ , o di(alquil  $C_1 - C_{10}$ )aminocarbonilo;

10  $R^{14}$  es alquilo  $C_1 - C_{10}$ , haloalquilo  $C_1 - C_{10}$ , alqueno  $C_2 - C_{10}$ , haloalqueno  $C_2 - C_{10}$ , alquino  $C_2 - C_{10}$ , haloalquino  $C_3 - C_{10}$ , cicloalquilo  $C_3 - C_8$ , halocicloalquilo  $C_3 - C_8$ , cicloalquil  $C_3 - C_8$  - alquilo  $C_1 - C_4$ , alquil  $C_1 - C_4$  - cicloalquilo  $C_3 - C_8$ , halocicloalquilo  $C_3 - C_8$  - alquilo  $C_1 - C_4$ , haloalquil  $C_1 - C_4$  - cicloalquilo  $C_3 - C_8$ , o haloalquilcarbonilo  $C_1 - C_{10}$ , cada uno sustituido o no sustituido con 1  $R^{19}$ ;

$R^{15}$  es alquilo  $C_1 - C_{10}$ , haloalquilo  $C_1 - C_{10}$ , alqueno  $C_2 - C_{10}$ , haloalqueno  $C_2 - C_{10}$ , alquino  $C_2 - C_{10}$ , haloalquino  $C_3 - C_{10}$ , cicloalquilo  $C_3 - C_8$ , halocicloalquilo  $C_3 - C_8$ , alquil  $C_1 - C_4$  - cicloalquilo  $C_3 - C_8$ , haloalquil  $C_1 - C_4$  - cicloalquilo  $C_3 - C_8$ , o haloalquilcarbonilo  $C_1 - C_{10}$ , cada uno sustituido o no sustituido con 1  $R^{19}$ ;

15  $R^{16}$  es hidrógeno; o alquilo  $C_1 - C_{10}$ , haloalquilo  $C_1 - C_{10}$ , alqueno  $C_2 - C_{10}$ , haloalqueno  $C_2 - C_{10}$ , alquino  $C_2 - C_{10}$ , haloalquino  $C_3 - C_{10}$ , cicloalquilo  $C_3 - C_8$ , halocicloalquilo  $C_3 - C_8$ , alquil  $C_1 - C_4$  - cicloalquilo  $C_3 - C_8$ , o haloalquil  $C_1 - C_4$  - cicloalquilo  $C_3 - C_8$ , cada uno sustituido o no sustituido con 1  $R^{19}$ ;

$R^{17}$  es alquilo  $C_1 - C_{10}$ , haloalquilo  $C_1 - C_{10}$ , alqueno  $C_2 - C_{10}$ , haloalqueno  $C_2 - C_{10}$ , alquino  $C_2 - C_{10}$ , haloalquino  $C_3 - C_{10}$ , cicloalquilo  $C_3 - C_8$ , halocicloalquilo  $C_3 - C_8$ , alquil  $C_1 - C_4$  - cicloalquilo  $C_3 - C_8$ , o haloalquil  $C_1 - C_4$  - cicloalquilo  $C_3 - C_8$ , cada uno sustituido o no sustituido con 1  $R^{19}$ ;

20  $R^{19}$  es ciano, nitro, alcoxi  $C_1 - C_{10}$ , haloalcoxi  $C_1 - C_{10}$ , alquiltio  $C_1 - C_{10}$ , haloalquiltio  $C_1 - C_{10}$ , alquilsulfino  $C_1 - C_{10}$ , haloalquilsulfino  $C_1 - C_{10}$ , alquilsulfonilo  $C_1 - C_{10}$ , haloalquilsulfonilo  $C_1 - C_{10}$ , alcocarbonilo  $C_1 - C_{10}$ , alquilamino  $C_1 - C_{10}$ , o di(alquil  $C_1 - C_{10}$ )amino; o

25  $R^{19}$  es fenilo o un anillo heteroaromático de 5 ó 6 miembros que contiene de 1 a 4 heteroátomos seleccionados de entre oxígeno, nitrógeno, azufre, el radical fenilo y estando el anillo heteroaromático sustituido o no sustituido con cualquier combinación de 1 a 3 grupos seleccionados de entre halógeno, ciano, nitro, alquilo  $C_1 - C_{10}$ , haloalquilo  $C_1 - C_{10}$ , alqueno  $C_2 - C_{10}$ , haloalqueno  $C_2 - C_{10}$ , alquino  $C_2 - C_{10}$ , haloalquino  $C_3 - C_{10}$ , cicloalquilo  $C_3 - C_8$ , halocicloalquilo  $C_3 - C_8$ , alcoxi  $C_1 - C_{10}$ , haloalcoxi  $C_1 - C_{10}$ , alquiltio  $C_1 - C_{10}$ , alquilsulfino  $C_1 - C_{10}$ , alquilsulfonilo  $C_1 - C_{10}$ , alquilamino  $C_1 - C_{10}$ , di(alquil  $C_1 - C_{10}$ )amino, cicloalquilamino  $C_3 - C_8$ , alquil  $C_1 - C_{10}$  - cicloalquilamino  $C_3 - C_8$ , alquilcarbonilo  $C_1 - C_{10}$ , alcocarbonilo  $C_1 - C_{10}$ , alquilaminocarbonilo  $C_1 - C_{10}$ , di(alquil  $C_1 - C_{10}$ )aminocarbonilo y tri( $C_1 - C_{10}$ )-alquilsililo;

$R^{18}$  es el mismo o diferente: hidrógeno, alquilo  $C_1 - C_{10}$ , o haloalquilo  $C_1 - C_{10}$ ; q es 0, 1 ó 2;

35  $Q^4$  es halógeno, ciano, nitro, hidróxido,  $COOH$ ,  $C(O)NH_2$ , alquilo  $C_1 - C_{10}$ , haloalquilo  $C_1 - C_{10}$ , alqueno  $C_2 - C_{10}$ , haloalqueno  $C_2 - C_{10}$ , alquino  $C_2 - C_{10}$ , haloalquino  $C_3 - C_{10}$ , cicloalquilo  $C_3 - C_8$ , halocicloalquilo  $C_3 - C_8$ , alcoxi  $C_1 - C_{10}$ , haloalcoxi  $C_1 - C_{10}$ , alquiltio  $C_1 - C_{10}$ , haloalquiltio  $C_1 - C_{10}$ , alquilsulfino  $C_1 - C_{10}$ , haloalquilsulfino  $C_1 - C_{10}$ , alquilsulfonilo  $C_1 - C_{10}$ , haloalquilsulfonilo  $C_1 - C_{10}$ , alquilamino  $C_1 - C_{10}$ , di(alquil  $C_1 - C_{10}$ )amino, cicloalquilamino  $C_3 - C_8$ , alquilcarbonilo  $C_1 - C_{10}$ , alcocarbonilo  $C_1 - C_{10}$ , alquilaminocarbonilo  $C_1 - C_{10}$ , di(alquilo  $C_1 - C_{10}$ )aminocarbonilo o tri( $C_1 - C_{10}$ )-alquilsililo; o

40  $Q^4$  es fenilo, bencilo, benciloxi, fenoxi, un anillo heteroaromático de 5 ó 6 miembros que contiene de 1 a 4 heteroátomos seleccionados de entre oxígeno, nitrógeno, azufre o un sistema de anillo heterobíciclico fusionado aromático de 8, 9 ó 10 miembros que contiene de 1 a 4 heteroátomos seleccionados de entre oxígeno, nitrógeno, azufre, en donde cada uno de los sistemas de anillo anteriores está sustituido o no sustituido con cualquier combinación de 1 a 3 grupos seleccionados de entre halógeno, ciano, nitro, alquilo  $C_1 - C_{10}$ , haloalquilo  $C_1 - C_{10}$ , alqueno  $C_2 - C_{10}$ , haloalqueno  $C_2 - C_{10}$ , alquino  $C_2 - C_{10}$ , haloalquino  $C_3 - C_{10}$ , cicloalquilo  $C_3 - C_8$ , halocicloalquilo  $C_3 - C_8$ , alcoxi  $C_1 - C_{10}$ , haloalcoxi  $C_1 - C_{10}$ , alquiltio  $C_1 - C_{10}$ , alquilsulfino  $C_1 - C_{10}$ , alquilsulfonilo  $C_1 - C_{10}$ , alquilamino  $C_1 - C_{10}$ , di(alquil  $C_1 - C_{10}$ )amino, cicloalquilamino  $C_3 - C_8$ , alquil  $C_1 - C_{10}$  - cicloalquilamino  $C_3 - C_8$ , alquilcarbonilo  $C_1 - C_{10}$ , alcocarbonilo  $C_1 - C_{10}$ , alquilaminocarbonilo  $C_1 - C_{10}$ , di(alquil  $C_1 - C_{10}$ )aminocarbonilo y tri( $C_1 - C_{10}$ )-alquilsililo;

X e Y son independientemente cada uno oxígeno o azufre;

V y V' son independientemente cada uno N o  $CQ^2$ ;

W es N, CH o  $CQ^4$ ;

n es 0 ó 1 ;

p es 0, 1, 2, 3, ó 4;

o los enantiómeros o sales o N-óxidos de los mismos.

2. Compuestos de N-Tio-antranilamida de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1 en donde X e Y son oxígeno.

5 3. Compuestos de N-Tio-antranilamida de fórmula I de acuerdo con las reivindicaciones 1 ó 2 en donde V y V' son CH.

4. Compuestos de N-Tio-antranilamida de fórmula I de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 3 en donde W es N,

R<sup>1</sup> es hidrógeno o alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>;

10 Q<sup>1</sup> es halógeno, ciano, SCN, nitro, hidroxilo, alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, alcoxi C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquiltio C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquiltio C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquilsulfoniloxi C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquilamino C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub> o di(alquil C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>)amino;

Q<sup>2</sup> es halógeno, ciano, SCN, nitro, hidroxilo, alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, alcoxi C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquiltio C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquiltio C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquilsulfoniloxi C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquilamino C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub> o di(alquil C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>)amino;

15 Q<sup>3</sup> es halógeno, alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquino C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, cada uno no sustituido o independientemente sustituido con 1 a 2 grupos seleccionados de entre ciano, alcoxi C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub> o alquiltio C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, o

Q<sup>3</sup> es OR<sup>14</sup>, S(O)<sub>q</sub>R<sup>14</sup>, NR<sup>15</sup>R<sup>16</sup>, OS(O)<sub>2</sub>R<sup>17</sup>, C(S)NH<sub>2</sub>, C(R<sup>18</sup>)=NOR<sup>18</sup>; en donde

R<sup>14</sup> es alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub> o cicloalquilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> sustituido o no sustituido con 1 R<sup>19</sup>; y

20 R<sup>15</sup> es alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alqueno C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>, alquino C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>, cada uno sustituido o no sustituido con 1 R<sup>19</sup>; y

R<sup>16</sup> es hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alqueno C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>, alquino C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>, cada uno sustituido o no sustituido con 1 R<sup>19</sup>; y

25 R<sup>17</sup> es alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alqueno C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>, alquino C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, cada uno sustituido o no sustituido con 1 R<sup>19</sup>; y

R<sup>18</sup> es hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, o haloalquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>; y

R<sup>19</sup> es ciano, nitro, alcoxi C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquiltio C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquiltio C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>;

30 Q<sup>4</sup> es halógeno, ciano, nitro, alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alcoxi C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquiltio C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquiltio C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, o alcóxicarbonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, y está en la posición orto; y

p es 1.

5. Compuestos de N-Tio-antranilamida de fórmula I de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 4 en donde W es N;

R<sup>1</sup> es hidrógeno;

Q<sup>1</sup> es hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> o haloalquilo C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>;

35 Q<sup>2</sup> es halógeno, ciano, alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> o haloalquilo C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>;

Q<sup>3</sup> es halógeno, haloalquilo C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> o haloalcoxi C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>;

Q<sup>4</sup> es halógeno o haloalquilo C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> y está en la posición orto; y

p es 1.

6. Compuestos de N-Tio-antranilamida de fórmula I de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 5 en donde A es A<sup>1</sup>;

5 R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> son independientemente cada uno alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alqueno C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>, alquino C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, o fenilo, en donde estos grupos están sustituidos o no sustituidos por una combinación de 1 a 6 grupos seleccionados de entre R<sup>11</sup>,

R<sup>11</sup> es halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, mercapto, amino, alcoxi C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, cicloalcoxi C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>, alcoxycarbonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquilcarbonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alcanamido C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquiltio C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>, di(alquil C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>)amino o alquilamino C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub>; o

R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> junto con el átomo de azufre al cual están unidos forman una unidad SR<sup>2</sup>R<sup>3</sup> de la siguiente fórmula:



en donde

r es 0 ó 1;

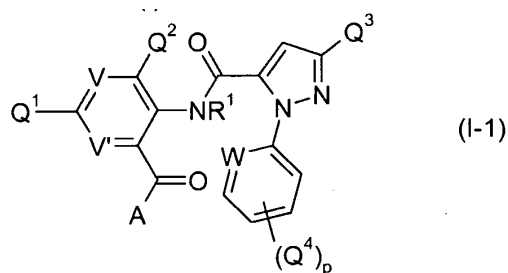
D es un enlace directo, alqueno C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> recto o ramificado, O, S(O)<sub>0,1,2</sub> o NR<sup>i</sup>, preferiblemente CH<sub>2</sub>, O, o NR<sup>i</sup>;

R<sup>9</sup> es como se definió anteriormente para compuestos de fórmula I;

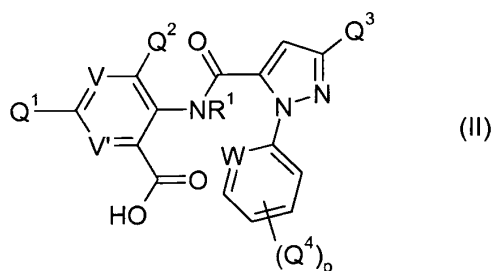
15 R<sup>j</sup> es hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>, alquilcarbonilo C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>, alcoxycarbonilo C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>, di(alquil C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)aminocarbonilo, o alquilsulfonilo C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>;

a, b son iguales o diferentes 0, 1, 2, 3 ó 4, preferiblemente 0, 1, ó 2.

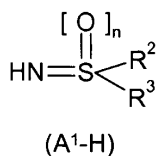
7. Un proceso para la preparación de compuestos de fórmula (I - 1)



20 en donde las variables son como se definió para la fórmula (I) en la reivindicación 1, **caracterizado porque** un derivado activado de un ácido carboxílico de la fórmula (II)

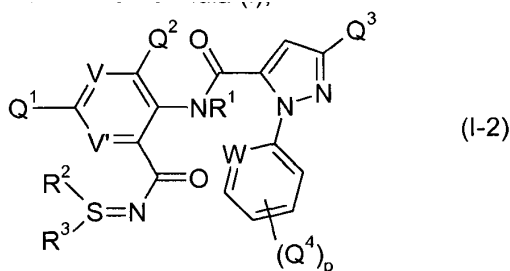


en donde las variables son como se definió para la fórmula (I) reacciona en presencia de una base con un compuesto de la fórmula A<sup>1</sup> - H.



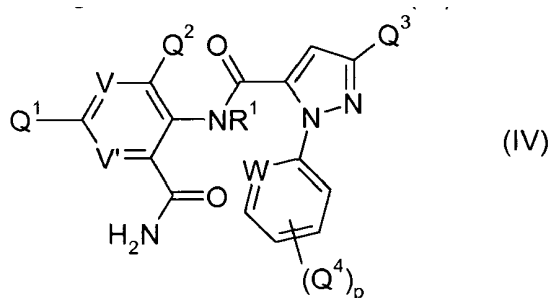
en donde las variables son como se definió para la fórmula (I).

8. Un proceso para la preparación de compuestos de fórmula (I - 2)



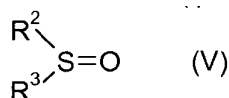
5

en donde las variables son como se definió para la fórmula (I) en la reivindicación 1, **caracterizado porque** una amida de la fórmula (IV)



10

en donde las variables son como se definieron para la fórmula (I) en la reivindicación 1, reacciona con un sulfóxido de la fórmula (V),



en donde R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> son como se definió para a fórmula (I) en la reivindicación 1, en presencia de un agente de condensación.

15

9. El uso de compuestos de fórmula I como se define en las reivindicaciones 1 a 6 para combatir insectos, ácaros, o nematodos, incluido un método de tratamiento para humanos o animales.

10. Un método para el control de insectos, ácaros o nemátodos por contacto del insecto, ácaro o nematodo o su fuente de alimentación, su hábitat, sitios de reproducción o sus locus con una cantidad efectiva como plaguicida de compuestos de fórmula I como se define en las reivindicaciones 1 a 6 excluyendo un método de tratamiento de humanos o de animales.

20

11. Un método para proteger el crecimiento de las plantas del ataque o infestación por parte de insectos, ácaros o nematodos por medio de la aplicación al follaje de las plantas, o al suelo o al agua en los cuales ellos crecen, de una cantidad efectiva como plaguicida de compuestos de fórmula I como se define en las reivindicaciones 1 a 6.

12. Los compuestos de fórmula I como se define en las reivindicaciones 1 a 6 para uso en el tratamiento, control,

prevención o protección de animales contra infestación o infección por parásitos que incluye administración o aplicación oral, tópica o parenteral a los animales de una cantidad efectiva como parasiticida de compuestos de fórmula I como se define en las reivindicaciones 1 a 6 o sus enantiómeros o sales aceptables en veterinaria.

5 13. Un proceso para la preparación de una composición para el tratamiento, control, prevención o protección de animales contra infestación o infección por parásitos que incluye una cantidad efectiva como parasiticida de compuestos de fórmula I como se define en las reivindicaciones 1 a 6 o sus enantiómeros o sales aceptables en veterinaria.

14. Composiciones que comprenden una cantidad activa como pesticida o como parasiticida de compuestos de fórmula I como se define en las reivindicaciones 1 a 6 y un portador agronómica o veterinariamente aceptable.