

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 372 319**

51 Int. Cl.:
C07D 207/38 (2006.01)
A01N 43/36 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- 96 Número de solicitud europea: **07818979 .2**
- 96 Fecha de presentación: **13.10.2007**
- 97 Número de publicación de la solicitud: **2121597**
- 97 Fecha de publicación de la solicitud: **25.11.2009**

54 Título: **DERIVADOS DE ÁCIDO TETRAMICO SUSTITUIDOS CON TRIFLUOROMETOXI-FENILO COMO PESTICIDAS Y/O HERBICIDAS.**

30 Prioridad:
25.10.2006 DE 102006050148

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:
18.01.2012

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:
18.01.2012

73 Titular/es:
**BAYER CROPSCIENCE AG
ALFRED-NOBEL-STRASSE 50
40789 MONHEIM, DE**

72 Inventor/es:
**FISCHER, Rainer;
LEHR, Stefan;
ARNOLD, Christian;
AULER, Thomas;
DITTMER, Jan;
FEUCHT, Dieter;
FRANKEN, Eva-Maria;
HEMPEL, Waltraud;
HILLS, Martin Jeffrey;
KEHNE, Heinz;
LÖSEL, Peter;
MALSAM, Olga;
ROSINGER, Christopher Hugh;
SANWALD, Erich;
GÖRGENS, Ulrich;
ANTONS, Stefan;
EBENBECK, Wolfgang;
PLESCHKE, Axel;
SCHNEIDER, Marielouise y
WISCHNAT, Ralf**

74 Agente: **Carpintero López, Mario**

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 2 372 319 T3

DESCRIPCIÓN

Derivados de ácido tetrámico sustituidos con trifluorometoxi-fenilo como pesticidas y/o herbicidas

5 La presente invención se refiere a nuevos derivados de ácido tetrámico sustituidos con trifluorometoxi-fenilo, a varios procedimientos para su preparación y a su uso como agentes plaguicidas y/o herbicidas. Son también objeto de la invención agentes herbicidas selectivos que contienen por una parte derivados de ácido tetrámico sustituidos con trifluorometoxi-fenilo y por otra parte un compuesto de mejora de la tolerancia por plantas de cultivo.

10 La presente invención se refiere además al aumento del efecto de agentes plaguicidas que contienen especialmente derivados de ácido tetrámico sustituidos con trifluorometoxi-fenilo, mediante la adición de sales de amonio o fosfonio y dado el caso promotores de la penetración, a los agentes correspondientes, a procedimientos para su preparación y a su uso en la protección de plantas como insecticidas y/o acaricidas y/o para evitar el crecimiento de plantas no deseado.

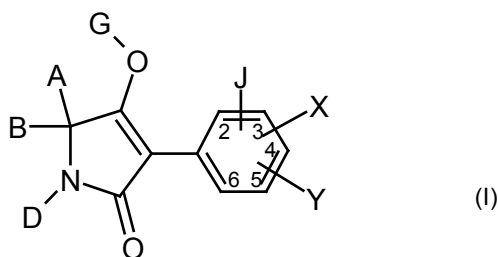
De las 3-acil-pirrolidin-2,4-dionas se indican propiedades farmacéuticas (S. Suzuki y col. Chem. Pharm. Bull. 15 1120 (1967)). Además se sintetizaron N-fenilpirrolidin-2,4-dionas por parte de R. Schmierer y H. Mildenberger (Liebigs Ann. Chem. 1985, 1095). No se describió una actividad biológica de estos compuestos.

15 En los documentos EP-A-0 262 399 y GB-A-2 266 888 se dan a conocer compuestos de estructura similar (3-aril-pirrolidin-2,4-dionas), de los que sin embargo no se conoce efecto herbicida, insecticida o acaricida alguno. Se conocen derivados de 3-aril-pirrolidin-2,4-dionas bicíclicos no sustituidas con efecto herbicida, insecticida o acaricida (documentos EP-A-355 599, EP-A-415 211 y JP-A-12-053 670) así como derivados de 3-aril-pirrolidin-2,4-dionas sustituidas monocíclicas (documentos EP-A-377 893 y EP-A-442 077).

20 Además se conocen derivados de 3-arilpirrolidin-2,4-dionas policíclicos (documento EP-A-442 073) así como derivados de 1H-arilpirrolidin-dionas (documentos EP-A-456 063, EP-A-521 334, EP-A-596 298, EP-A-613 884, EP-A-613 885, WO 94/01997, WO 95/26954, WO 95/20572, EP-A-0 668 267, WO 96/25395, WO 96/35664, WO 97/01535, WO 97/02243, WO 97/36868, WO 97/43275, WO 98/05638, WO 98/06721, WO 98/25928, WO 99/16748, WO 99/24437, WO 99/43649, WO 99/48869, WO 99/55673, WO 01/17972, WO 01/23354, WO 01/74770, WO 03/013249, WO 04/007448, WO 04/024688, WO 04/065366, WO 04/080962, WO 04/111042, WO 05/044791, WO 05/044796, WO 05/048710, WO 05/049596, WO 05/066125, WO 05/092897, WO 06/000355 WO 06/029799, WO 06/056281, WO 06/056282, WO 06/089633, WO 07/048545, WO 07/073856, DE-A-05/059892, DE-A-06/007882, DE-A-06/018828, DE-A-06/025874.

30 Sin embargo la actividad y amplitud de efecto de estos compuestos no siempre es completamente satisfactoria, especialmente en bajas cantidades de aplicación y concentraciones. Además la tolerancia por plantas de estos compuestos no siempre es suficiente frente a algunas plantas de cultivo.

Se han encontrado ahora nuevos compuestos de fórmula (I)



en la que

- 35 J representa trifluorometoxi,
 X representa hidrógeno, alquilo, halógeno, haloalquilo, alcoxi o haloalcoxi,
 Y representa hidrógeno, alquilo, alcoxi o halógeno,

con la condición de que al menos uno de los restos J, X ó Y se encuentre en la posición 2 del resto de fenilo y sea a este respecto distinto de hidrógeno,

- 40 A representa hidrógeno, alquilo, alqueno, alcoxialquilo, alquiloalquilo respectivamente dado el caso sustituidos con halógeno, cicloalquilo dado el caso sustituido, saturado o insaturado, en el que dado el caso al menos un átomo del anillo está reemplazado por un heteroátomo, o representa arilo, arilalquilo o hetarilo respectivamente dado el caso sustituido con halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, ciano o nitro,

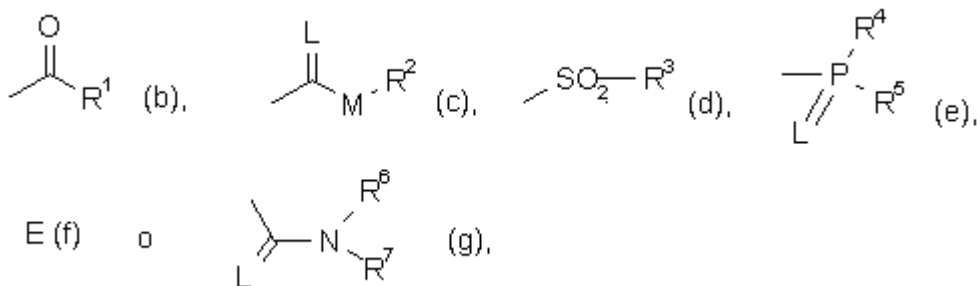
- B representa hidrógeno, alquilo o alcoxialquilo, o

A y B junto con el átomo de carbono al que están unidos representan un ciclo no sustituido o sustituido, saturado o insaturado, que contiene dado el caso al menos un heteroátomo,

5 D representa hidrógeno o un resto dado el caso sustituido del grupo de alquilo, alquenilo, alquinilo, alcoxialquilo, cicloalquilo saturado o insaturado, en el que dado el caso uno o varios miembros del anillo están reemplazados por heteroátomos, representa arilalquilo, arilo, hetarilalquilo o hetarilo o

A y D junto con los átomos a los que están unidos representan un ciclo no sustituido o sustituido en la parte A, D, saturado o insaturado y que contiene dado el caso al menos un heteroátomo.

G representa hidrógeno (a) o uno de los grupos



10 en los que

E representa un equivalente de ión metálico o un ión de amonio,

L representa oxígeno o azufre,

M representa oxígeno o azufre,

15 R¹ representa alquilo, alquenilo, alcoxialquilo, alquiltioalquilo, polialcoxialquilo respectivamente dado el caso sustituidos con halógeno o cicloalquilo dado el caso sustituido con halógeno, alquilo o alcoxi, que puede estar interrumpido por al menos un heteroátomo, fenilo, fenilalquilo, hetarilo, fenoxialquilo o hetariloxialquilo respectivamente dado el caso sustituidos,

R² representa alquilo, alquenilo, alcoxialquilo, polialcoxialquilo respectivamente dado el caso sustituidos con halógeno o representa cicloalquilo, fenilo o bencilo respectivamente dado el caso sustituidos,

20 R³, R⁴ y R⁵ representan independientemente uno de otro alquilo, alcoxi, alquilamino, dialquilamino, alquiltio, alqueniltio, cicloalquiltio respectivamente dado el caso sustituidos con halógeno, o representan fenilo, bencilo, fenoxi o feniltio respectivamente dado el caso sustituido,

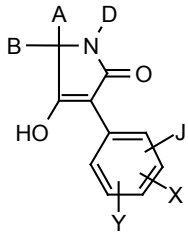
25 R⁶ y R⁷ representan independientemente uno de otro hidrógeno, alquilo, cicloalquilo, alquenilo, alcoxi, alcoxialquilo respectivamente dado el caso sustituidos con halógeno, fenilo dado el caso sustituido, bencilo dado el caso sustituido, o junto con el átomo de N al que están unidos representan un ciclo interrumpido dado el caso por oxígeno o azufre.

30 Los compuestos de fórmula (I) pueden presentarse también en función del tipo de sustituyentes como isómeros o mezclas de isómeros geométricos y/o ópticos, en distintas composiciones, que se pueden separar dado el caso de forma y manera habitual. Son objeto de la presente invención tanto los isómeros puros como también las mezclas isoméricas, su preparación y uso así como los agentes que los contienen. A continuación, sin embargo, se habla siempre para simplificar de compuestos de fórmula (I), aunque se entienden tanto los compuestos puros como dado el caso también mezclas con distintas proporciones de compuestos isoméricos.

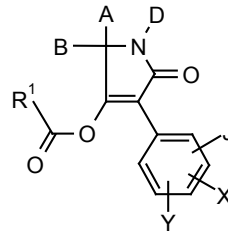
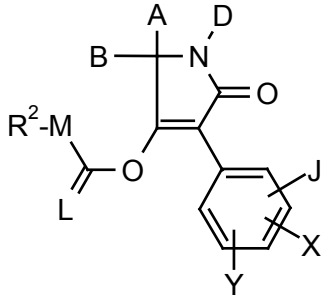
Incluyendo los distintos significados de (a), (b), (c), (d), (e), (f) y (g) del grupo G resultan las siguientes estructuras principales (I-a) a (I-g),

(I-a):

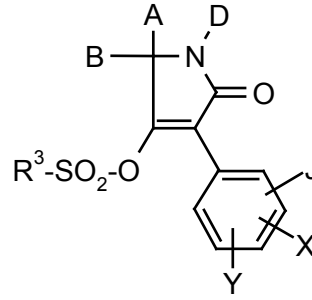
(I-b):



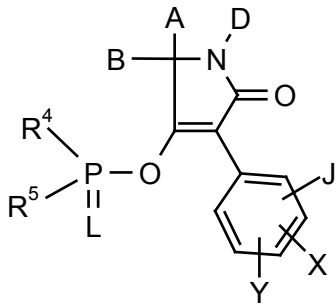
(I-c):



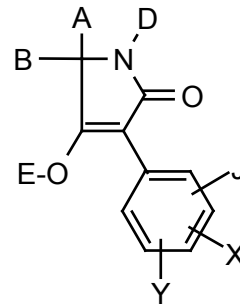
(I-d):



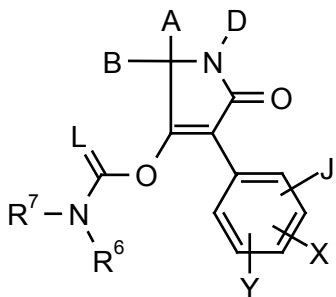
(I-e):



(I-f):



(I-g):

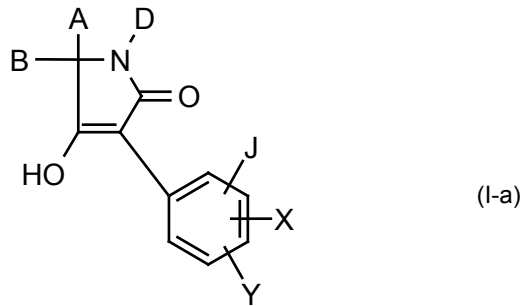


en las que

A, B, D, E, J, L, M, X, Y, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ y R⁷ poseen los significados dados anteriormente.

5 Además se encontró que los nuevos compuestos de fórmula (I) se obtienen según uno de los procedimientos descritos a continuación:

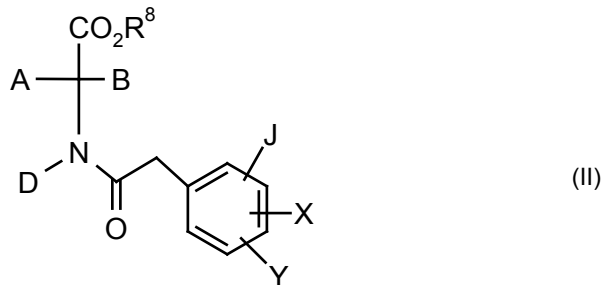
(A) se obtienen compuestos de fórmula (I-a)



en la que

A, B, D, J, X e Y tienen los significados dados anteriormente,

si se condensan intramolecularmente ésteres de N-acilamínico de fórmula (II)



5

en la que

A, B, D, J, X e Y tienen los significados dados anteriormente,

y

R⁸ representa alquilo (preferentemente alquilo C₁-C₆),

10 en presencia de un diluyente y en presencia de una base.

Además se encontró,

(B) que se obtienen los compuestos de fórmula (I-b) mostrada anteriormente, en la que A, B, D, J, R¹, X e Y tienen los significados dados anteriormente, si se hacen reaccionar compuestos de fórmula (I-a) mostrada anteriormente, en la que A, B, D, J, X e Y tienen los significados dados anteriormente, respectivamente

15 (α) con halogenuros de ácido de fórmula (III)



en la que

R¹ tiene el significado dado anteriormente y

Hal representa halógeno (especialmente cloro o bromo)

20 o

(β) con anhídridos de ácido carboxílico de fórmula (IV)



en la que

R¹ tiene el significado dado anteriormente,

dado el caso en presencia de un diluyente y dado el caso en presencia de un ligante de ácido;

(C) que se obtienen los compuestos de fórmula (I-c) mostrada anteriormente, en la que A, B, D, J, R², M, X e Y tienen los significados dados anteriormente y L representa oxígeno, si se hacen reaccionar compuestos de fórmula (I-a) mostrada anteriormente, en la que A, B, D, J, X e Y tienen los significados dados anteriormente, respectivamente

5

con ésteres de ácido clorofórmico o tioésteres de ácido clorofórmico de fórmula (V)



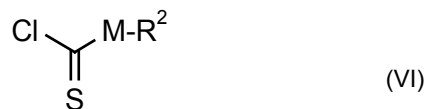
en la que

R² y M tienen los significados dados anteriormente,

10 dado el caso en presencia de un diluyente y dado el caso en presencia de un ligante de ácido;

(D) que se obtienen compuestos de fórmula (I-c) mostrada anteriormente, en la que A, B, D, J, R², M, X e Y tienen los significados dados anteriormente y L representa azufre, si se hacen reaccionar compuestos de fórmula (I-a) mostrada anteriormente, en la que A, B, D, J, X e Y tienen los significados dados anteriormente, respectivamente

con ésteres de ácido cloromonotiofórmico o ésteres de ácido cloroditiofórmico de fórmula (VI)



15

en la que

M y R² tienen los significados dados anteriormente,

dado el caso en presencia de un diluyente y dado el caso en presencia de un ligante de ácido

y

20 (E) que se obtienen compuestos de fórmula (I-d) mostrada anteriormente, en la que A, B, D, J, R³, X e Y tienen los significados dados anteriormente, si se hacen reaccionar compuestos de fórmula (I-a) mostrada anteriormente, en la que A, B, D, J, X e Y tienen los significados dados anteriormente, respectivamente

con cloruros de ácido sulfónico de fórmula (VII)



25 en la que

R³ tiene el significado dado anteriormente,

dado el caso en presencia de un diluyente y dado el caso en presencia de un ligante de ácido,

(F) que se obtienen compuestos de fórmula (I-e) mostrada anteriormente, en la que A, B, D, J, L, R⁴, R⁵, X e Y tienen los significados dados anteriormente, si se hacen reaccionar compuestos de fórmula (I-a) mostrada anteriormente, en la que A, B, D, J, X e Y tienen los significados dados anteriormente, respectivamente

30

con compuestos de fósforo de fórmula (VIII)



en la que

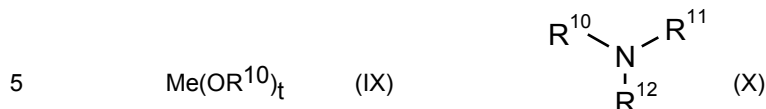
L, R⁴ y R⁵ tienen los significados dados anteriormente y

35 Hal representa halógeno (especialmente cloro o bromo),

dado el caso en presencia de un diluyente y dado el caso en presencia de un ligante de ácido,

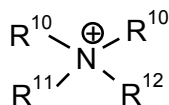
(G) que se obtienen compuestos de fórmula (I-f) mostrada anteriormente, en la que A, B, D, E, J, X e Y tienen los significados dados anteriormente, si se hacen reaccionar compuestos de fórmula (I-a), en la que A, B, D, J, X e Y tienen los significados dados anteriormente, respectivamente

con compuestos metálicos o aminas de fórmulas (IX) o (X)



en la que

Me representa un metal mono o divalente (preferentemente un metal alcalino o alcalinotérreo como litio, sodio, potasio, magnesio o calcio), o un ión de amonio



10 t representa el número 1 ó 2 y

R^{10} , R^{11} , R^{12} representan independientemente unos de otros hidrógeno o alquilo (preferentemente alquilo C_1 - C_8), dado el caso en presencia de un diluyente,

15 (H) que se obtienen compuestos de fórmula (I-g) mostrada anteriormente, en la que A, B, D, J, L, R^6 , R^7 , X e Y tienen los significados dados anteriormente, si se hacen reaccionar compuestos de fórmula (I-a) mostrada anteriormente, en la que A, B, D, J, X e Y tienen los significados dados anteriormente, respectivamente

(α) con isocianatos o isotiocianatos de fórmula (XI)

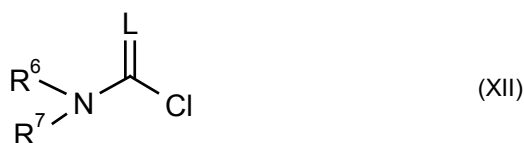


en la que

R^6 y L tienen los significados dados anteriormente,

20 dado el caso en presencia de un diluyente y dado el caso en presencia de un catalizador o

(β) con cloruros de ácido carbámico o cloruros de ácido triocarbámico de fórmula (XII)

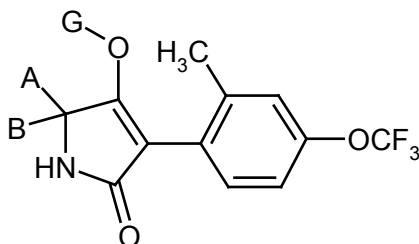


en la que

L, R^6 y R^7 tienen los significados dados anteriormente,

25 dado el caso en presencia de un diluyente y dado el caso en presencia de un ligante de ácido.

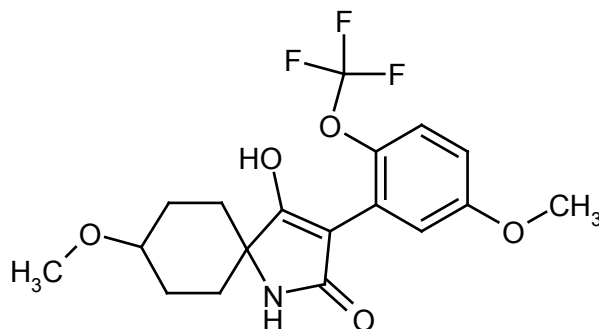
Los siguientes compuestos de fórmula (I) se han dado a conocer en el marco de los procedimientos de prueba de las patentes europeas EP-A-809629 y EP-A-915846:



del documento EP-A-809629

Ej. nº	A	B	G	Isómero
I-1-a-13	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		H	β
I-1-a-14	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂		H	β
I-1-b-14	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂		CO-i-C ₃ H ₇	β
I-1-b-15	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CO-CH ₂ -t-C ₄ H ₉	β
I-1-b-16	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CO-i-C ₃ H ₇	β
I-1-b-17	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂		CO-CH ₂ -t-C ₄ H ₉	β
I-1-c-9	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CO ₂ C ₂ H ₅	β
I-1-c-10	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂		CO ₂ C ₂ H ₅	β

del documento EP-A-915846

Ejemplo I-1-a-29

5 Además se encontró que los nuevos compuestos de fórmula (I) presentan una muy buena actividad como plaguicidas, preferentemente como insecticidas, acaricidas y/o herbicidas.

De forma sorprendente se ha encontrado ahora también que determinados cetoenoles cíclicos sustituidos, en aplicación conjunta con los compuestos descritos más adelante de mejora de la tolerancia por las plantas de cultivo (protectores/antídotos), reducen notablemente bien el daño de las plantas de cultivo y pueden usarse de forma
10 especialmente ventajosa como preparados de combinación ampliamente eficaces para controlar selectivamente plantas indeseadas en cultivos de plantas útiles como, por ejemplo, en cereales, pero también maíz, soja y arroz.

Son también objeto de la invención agentes herbicidas selectivos que contienen un contenido eficaz de una combinación de principios activos que comprende como componentes

15 (a') al menos un derivado de ácido tetrámico sustituido con trifluorometoxi-fenilo de fórmula (I), en la que A, B, D, G, J, X e Y tienen el significado dado anteriormente,

y

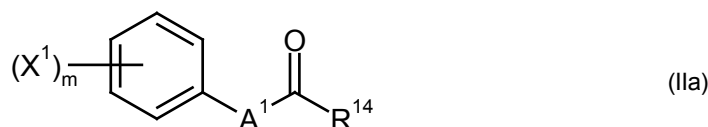
(b') al menos un compuesto de mejora de la tolerancia por las plantas de cultivo del siguiente grupo de compuestos:

20 4-dicloroacetil-1-oxa-4-azaespiro[4.5]-decano (AD-67, MON-4660), 1-dicloroacetilhexahidro-3,3,8a-trimetilpirrolo[1,2-a]pirimidin-6(2H)-ona (diciclonona, BAS-145138), 4-dicloroacetil-3,4-dihidro-3-metil-2H-1,4-benzoxazina (benoxacor), éster 1-metilhexílico del ácido 5-cloroquinolin-8-oxiacético (cloquintocet-mexil – véanse también compuestos relacionados en los documentos EP-A-86750, EP-A-94349, EP-A-191736, EP-A-492366), 3-(2-clorobencil)-1-(1-metil-1-feniletil)urea (cumilurón), α-(cianometoxiimino)fenilacetónitrilo (ciometrinil), ácido 2,4-diclorofenoxiacético (2,4-D), ácido 4-(2,4-diclorofenoxi)butírico (2,4-DB), 1-(1-metil-1-feniletil)-3-(4-metilfenil)urea (daimurón, dimrón), ácido
25 3,6-dicloro-2-metoxibenzoico (dicamba), éster S-1-metil-1-feniletílico del ácido piperidin-1-tiocarboxílico (dimepiperato), 2,2-dicloro-N-(2-oxo-2-(2-propenilamino)etil)-N-(2-propenil)acetamida (DKA-24), 2,2-dicloro-N,N-di-2-propenilacetamida (diclormida), 4,6-dicloro-2-fenil-pirimidina (fenclorim), éster etílico del ácido 1-(2,4-diclorofenil)-5-triclorometil-1H-1,2,4-triazol-3-carboxílico (fenclorazol-etil – véanse también compuestos relacionados en los documentos EP-A-174562 y EP-A-346620), éster fenilmetílico del ácido 2-cloro-4-trifluorometiltiazol-5-carboxílico

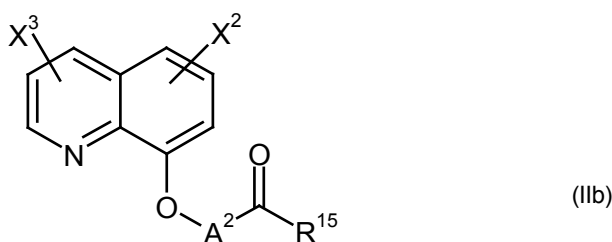
(flurazol), 4-cloro-N-(1,3-dioxolan-2-ilmetoxi)- α -trifluoro-acetofenonoxima (fluxofenim), 3-dicloroacetil-5-(2-furanil)-2,2-dimetiloxazolidina (furilazol, MON-13900), 4,5-dihidro-5,5-difenil-3-isoxazolcarboxilato de etilo (isoxadifén-etilo – véanse también compuestos relacionados en el documento WO-A-95/07897), 3,6-dicloro-2-metoxibenzoato de 1-(etoxicarbonil)etilo (lactidiclor), ácido (4-cloro-o-toliloxi)acético (MCPA), ácido 2-(4-cloro-o-toliloxi)propiónico (mecoprop), 1-(2,4-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-metil-1H-pirazol-3,5-dicarboxilato de dietilo (mefenpir-dietil – véanse también compuestos relacionados en el documento WO-A-91/07874), 2-diclorometil-2-metil-1,3-dioxolano (MG-191), 1-oxa-4-azaespiro[4.5]decano-4-carbodioato de 2-propenilo (MG-838), anhídrido del ácido 1,8-naftálico, α -(1,3-dioxolan-2-ilmetoximino)fenilacetónitrilo (oxabetrinilo), 2,2-dicloro-N-(1,3-dioxolan-2-ilmetil)-N-(2-propenil)acetamida (PPG-1292), 3-dicloroacetil-2,2-dimetiloxazolidina (R-28725), 3-dicloroacetil-2,2,5-trimetiloxazolidina (R-29148), ácido 4-(4-cloro-o-tolil)butírico, ácido 4-(4-clorofenoxi)butírico, ácido difenilmetoxiacético, éster metílico del ácido difenilmetoxiacético, éster etílico del ácido difenilmetoxiacético, éster metílico del ácido 1-(2-clorofenil)-5-fenil-1H-pirazol-3-carboxílico, éster etílico del ácido 1-(2,4-diclorofenil)-5-metil-1H-pirazol-3-carboxílico, éster etílico del ácido 1-(2,4-diclorofenil)-5-isopropil-1H-pirazol-3-carboxílico, éster etílico del ácido 1-(2,4-diclorofenil)-5-(1,1-dimetiletil)-1H-pirazol-3-carboxílico, éster etílico del ácido 1-(2,4-diclorofenil)-5-fenil-1H-pirazol-3-carboxílico (véanse también compuestos relacionados en los documentos EP-A-269806 y EP-A-333131), éster etílico del ácido 5-(2,4-diclorobencil)-2-isoxazolin-3-carboxílico, éster etílico del ácido 5-fenil-2-isoxazolin-3-carboxílico, éster etílico del ácido 5-(4-fluorofenil)-5-fenil-2-isoxazolin-3-carboxílico (véanse también compuestos relacionados en el documento WO-A-91/08202), éster (1,3-dimetilbut-1-ílico) del ácido 5-cloro-quinolin-8-oxi-acético, éster 4-aliloxi-butílico del ácido 5-cloro-quinolin-8-oxi-acético, éster 1-aliloxi-prop-2-ílico del ácido 5-cloro-quinolin-8-oxi-acético, éster metílico del ácido 5-cloro-quinoxalin-8-oxi-acético, éster etílico del ácido 5-cloro-quinolin-8-oxi-acético, éster alílico del ácido 5-cloro-quinoxalin-8-oxi-acético, éster 2-oxoprop-1-ílico del ácido 5-cloro-quinolin-8-oxiacético, éster dietílico del ácido 5-cloro-quinolin-8-oxi-malónico, éster dialílico del ácido 5-cloro-quinoxalin-8-oxi-malónico, éster dietílico del ácido 5-cloro-quinolin-8-oxi-malónico (véanse también compuestos relacionados en el documento EP-A-582198), ácido 4-carboxicroman-4-ilacético (AC-304415, véase el documento EP-A-613618), ácido 4-clorofenoxi-acético, 3,3'-dimetil-4-metoxibenzofenona, 1-bromo-4-clorometilsulfonilbenceno, 1-[4-(N-2-metoxibenzoilsulfamoil)fenil]-3-metilurea (alias N-(2-metoxibenzoil)-4-[(metilaminocarbonil)amino]bencenosulfonamida), 1-[4-(N-2-metoxibenzoilsulfamoil)fenil]-3,3-dimetil-urea, 1-[4-(N-4,5-dimetilbenzoilsulfamoil)fenil]-3-metil-urea, 1-[4-(N-naftilsulfamoil)fenil]-3,3-dimetil-urea, N-(2-metoxi-5-metilbenzoil)-4-(ciclopropilaminocarbonil)-bencenosulfonamida,

y/o uno de los siguientes compuestos definidos con las fórmulas generales

de fórmula general (IIa)



o de fórmula general (IIb)



o de fórmula (IIc)

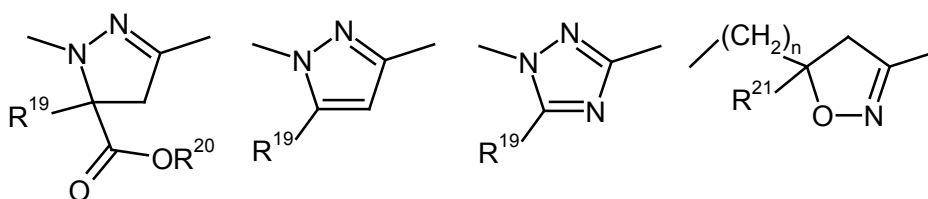


35

en las que

m representa el número 0, 1, 2, 3, 4 ó 5,

A¹ representa una de las agrupaciones heterocíclicas divalentes esquematizadas a continuación,



n representa el número 0, 1, 2, 3, 4 ó 5,

A² representa alcanodiilo de 1 ó 2 átomos de carbono dado el caso sustituido con alquilo C₁-C₄ y/o alcoxi C₁-C₄-carbonilo y/o alquenil C₁-C₄-oxicarbonilo,

5 R¹⁴ representa hidroxilo, mercapto, amino, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-tio, alquil C₁-C₆-amino o di(alquil C₁-C₄)-amino,

R¹⁵ representa hidroxilo, mercapto, amino, alcoxi C₁-C₇, alquenil C₁-C₆-oxi, alquenil C₁-C₆-oxialcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-tio, alquil C₁-C₆-amino o di(alquil C₁-C₄)-amino,

R¹⁶ representa alquilo C₁-C₄ dado el caso sustituido con flúor, cloro y/o bromo,

10 R¹⁷ representa hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆ o alquinilo C₂-C₆ respectivamente dado el caso sustituidos con flúor, cloro y/o bromo, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, dioxolanilalquilo C₁-C₄, furilo, furilalquilo C₁-C₄, tienilo, tiazolilo, piperidinilo o fenilo dado el caso sustituido con flúor, cloro y/o bromo o alquilo C₁-C₄,

R¹⁸ representa hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆ o alquinilo C₂-C₆ respectivamente dado el caso sustituidos con flúor, cloro y/o bromo, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, dioxolanilalquilo C₁-C₄, furilo, furilalquilo C₁-C₄, tienilo, tiazolilo, piperidinilo o fenilo dado el caso sustituido con flúor, cloro y/o bromo o alquilo C₁-C₄,

15 R¹⁷ y R¹⁸ representan también conjuntamente alcano C₃-C₆-diilo u oxaalcano C₂-C₅-diilo respectivamente dado el caso sustituidos con alquilo C₁-C₄, fenilo, furilo, un anillo bencénico asociado, o con dos sustituyentes que forman conjuntamente con el átomo de C al que están unidos un carbociclo de 5 ó 6 miembros,

R¹⁹ representa hidrógeno, ciano, halógeno o alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ o fenilo respectivamente dado el caso sustituidos con flúor, cloro y/o bromo,

20 R²⁰ representa hidrógeno, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ o tri(alquil C₁-C₄)-sililo respectivamente dado el caso sustituidos con hidroxilo, ciano, halógeno o alcoxi C₁-C₄,

R²¹ representa hidrógeno, ciano, halógeno o alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ o fenilo respectivamente dado el caso sustituidos con flúor, cloro y/o bromo,

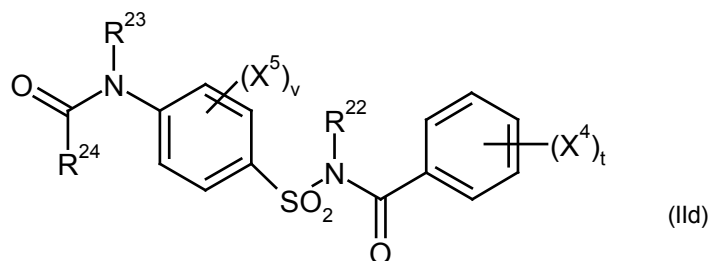
X¹ representa nitro, ciano, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄,

25 X² representa hidrógeno, ciano, nitro, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄,

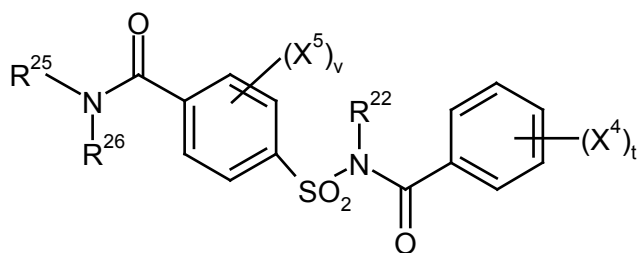
X³ representa hidrógeno, ciano, nitro, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄,

y/o los compuestos siguientes definidos mediante las fórmulas generales

de fórmula general (IId)



30 o de fórmula general (IIe)



en las que

t representa el número 0, 1, 2, 3, 4 ó 5,

v representa el número 0, 1, 2, 3, 4 ó 5,

5 R^{22} representa hidrógeno o alquilo C_1-C_4 ,

R^{23} representa hidrógeno o alquilo C_1-C_4 ,

10 R^{24} representa hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , alquil C_1-C_6 -tio, alquil C_1-C_6 -amino o di(alquil C_1-C_4)-amino respectivamente dado el caso sustituidos con ciano, halógeno o alcoxi C_1-C_4 , o cicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquil C_3-C_6 -oxi, cicloalquil C_3-C_6 -tio o cicloalquil C_3-C_6 -amino respectivamente dado el caso sustituidos con ciano, halógeno o alquilo C_1-C_4 ,

R^{25} representa hidrógeno, alquilo C_1-C_6 dado el caso sustituido con ciano, hidroxilo, halógeno o alcoxi C_1-C_4 , alqueno C_3-C_6 o alquino C_3-C_6 respectivamente dado el caso sustituidos con ciano o halógeno, o cicloalquilo C_3-C_6 dado el caso sustituido con ciano, halógeno o alquilo C_1-C_4 ,

15 R^{26} representa hidrógeno, alquilo C_1-C_6 dado el caso sustituido con ciano, hidroxilo, halógeno o alcoxi C_1-C_4 , alqueno C_3-C_6 o alquino C_3-C_6 respectivamente dado el caso sustituidos con ciano o halógeno, cicloalquilo C_3-C_6 dado el caso sustituido con ciano, halógeno o alquilo C_1-C_4 , o fenilo dado el caso sustituido con nitro, ciano, halógeno, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o haloalcoxi C_1-C_4 , o junto con R^{25} representa alcano C_2-C_6 -diilo u oxalcano C_2-C_5 -diilo respectivamente dado el caso sustituidos con alquilo C_1-C_4 ,

20 X^4 representa nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, formilo, sulfamoilo, hidroxilo, amino, halógeno, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o haloalcoxi C_1-C_4 , y

X^5 representa nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, formilo, sulfamoilo, hidroxilo, amino, halógeno, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o haloalcoxi C_1-C_4 .

Los compuestos de acuerdo con la invención se definen con la fórmula (I) general. Los sustituyentes o intervalos preferentes de los restos citados en las fórmulas mencionadas anterior y posteriormente se ilustran a continuación:

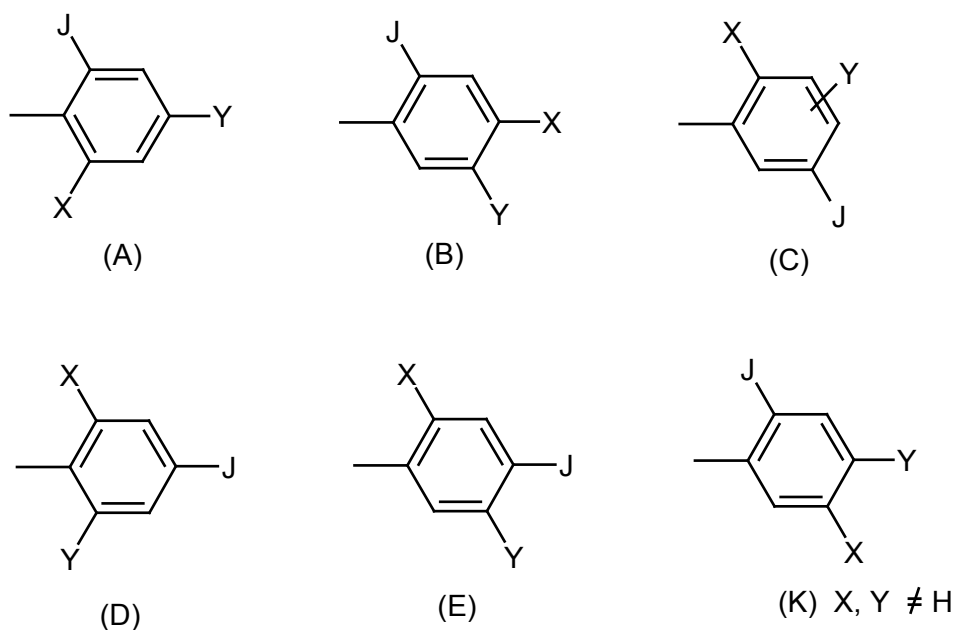
25 J representa preferentemente trifluorometoxi,

X representa preferentemente hidrógeno, halógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_6 o haloalcoxi C_1-C_4 ,

Y representa preferentemente hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 o halógeno,

30 con la condición de que al menos uno de los restos J, X ó Y se encuentre en la posición 2 del resto fenilo y a este respecto sea distinto de hidrógeno.

A este respecto los restos J, X e Y se encuentran preferentemente con sus significados preferentes en los siguientes modelos de sustitución de fenilo

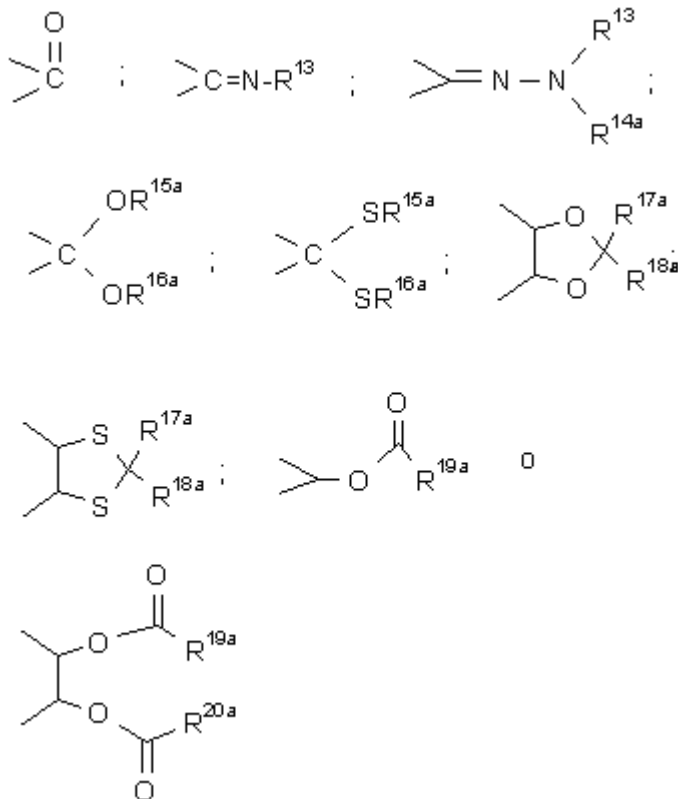


en donde en el modelo de sustitución de fenilo (C), (D) y (E), X e Y son al mismo tiempo distintos de hidrógeno,

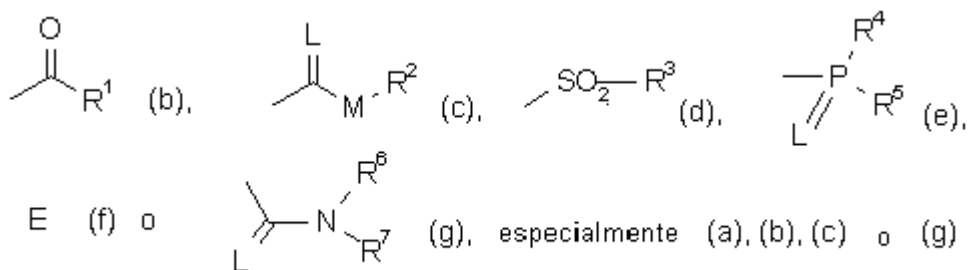
- 5 A representa preferentemente hidrógeno o alquilo C₁-C₁₂, alqueno C₃-C₈, alcoxi C₁-C₁₀-alquilo C₁-C₈, alquil C₁-C₁₀-tio-alquilo C₁-C₆, respectivamente dado el caso sustituidos con halógeno, cicloalquilo C₃-C₈ dado el caso sustituido con halógeno, alquilo C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆, en el que están reemplazados dado el caso uno o dos miembros del anillo no directamente adyacentes por oxígeno y/o azufre, o representa fenilo, naftilo, hetarilo con 5 a 6 átomos de anillo (por ejemplo furanilo, piridilo, imidazolilo, triazolilo, pirazolilo, pirimidilo, tiazolilo o tienilo), fenil-alquilo C₁-C₆ o naftil-alquilo C₁-C₆, respectivamente dado el caso sustituidos con halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, ciano o nitro,
- 10 B representa preferentemente hidrógeno, alquilo C₁-C₁₂ o alcoxi C₁-C₈-alquilo C₁-C₆ o
- A, B y el átomo de carbono al que están unidos representan preferentemente cicloalquilo C₃-C₁₀ saturado o cicloalquilo C₅-C₁₀ insaturado, en los que está reemplazado dado el caso un miembro del anillo por oxígeno o azufre y que están dado el caso sustituidos una o dos veces con alquilo C₁-C₈, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₆-alcoxi C₁-C₄, cicloalquil C₃-C₆-alcoxi C₁-C₂, cicloalquilo C₃-C₁₀, haloalquilo C₁-C₈, alcoxi C₁-C₈, alquil C₁-C₈-tio, halógeno o fenilo o
- 15 A, B y el átomo de carbono al que están unidos representan preferentemente cicloalquilo C₃-C₆, que está sustituido con un grupo alquilenodiilo dado el caso sustituido con alquilo C₁-C₄ que contiene dado el caso uno o dos átomos de oxígeno o azufre no directamente adyacentes, o con un grupo alquilendioxilo o con un grupo alquilenditiilo, que con el átomo de carbono al que está unido forma un anillo adicional de cinco a ocho miembros o
- 20 A, B y el átomo de carbono al que están unidos representan preferentemente cicloalquilo C₃-C₈ o cicloalqueno C₅-C₈, en los que dos sustituyentes junto con los átomos de carbono a los que están unidos representan alcano C₂-C₆-diilo, alqueno C₂-C₆-diilo o alcanodieno C₄-C₆-diilo respectivamente dado el caso sustituidos con alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ o halógeno, en los que está reemplazado dado el caso un grupo metileno por oxígeno o azufre,
- 25 D representa preferentemente hidrógeno, alquilo C₁-C₁₂, alqueno C₃-C₈, alquinilo C₃-C₈, alcoxi C₁-C₁₀-alquilo C₂-C₈ respectivamente dado el caso sustituidos con halógeno, cicloalquilo C₃-C₈ dado el caso sustituido con halógeno, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄, en los que está reemplazado dado el caso un miembro del anillo por oxígeno o azufre o representa fenilo, hetarilo con 5 a 6 átomos de anillo (por ejemplo furanilo, imidazolilo, piridilo, tiazolilo, pirazolilo, pirimidilo, pirrolilo o triazolilo), fenil-alquilo C₁-C₆ o hetaril-alquilo C₁-C₆ con 5 ó 6 átomos de anillo (por ejemplo, furanilo, imidazolilo, piridilo, tiazolilo, pirazolilo, pirimidilo, pirrolilo, tienilo o triazolilo) respectivamente dado el caso sustituidos con halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, ciano o nitro, o
- 30 A y D representan juntos preferentemente alcano C₃-C₆-diilo o alqueno C₃-C₆-diilo respectivamente dado el caso sustituidos, en los que está reemplazado dado el caso un grupo metileno por un grupo carbonilo, oxígeno o azufre y
- en los que como sustituyentes se tienen en cuenta respectivamente:
- 35 halógeno, hidroxilo, mercapto o alquilo C₁-C₁₀, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-tio, cicloalquilo C₃-C₇, fenilo o benciloxi, respectivamente dado el caso sustituido con halógeno, o una agrupación alcano C₃-C₆-diilo, agrupación alqueno

C₃-C₆-diílo o una agrupación butadienilo adicionales, que está sustituida dado el caso con alquilo C₁-C₆ o en la que dado el caso dos sustituyentes adyacentes con los átomos de carbono a los que están unidos, forman un ciclo saturado o insaturado adicional con 5 ó 6 átomos de anillo (y representan entonces, por ejemplo, los grupos AD-1 a AD-10 citados más adelante), que puede contener oxígeno o azufre, o en el que dado el caso está contenido uno de los siguientes grupos

5



G representa preferentemente hidrógeno (a) o uno de los grupos



en los que

10 E representa un equivalente de ión metálico o un ión amonio,

L representa oxígeno o azufre y

M representa oxígeno o azufre,

R¹ representa preferentemente alquilo C₁-C₂₀, alqueno C₂-C₂₀, alcoxi C₁-C₈-alquilo C₁-C₈, alquil C₁-C₈-tioalquilo C₁-C₈, poli-alcoxi C₁-C₈-alquilo C₁-C₈ respectivamente dado el caso sustituidos con halógeno, o cicloalquilo C₃-C₈ dado el caso sustituido con halógeno, alquilo C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆, en el que dado el caso uno o más (preferentemente no más de dos) miembros del anillo no directamente adyacentes están reemplazados por oxígeno y/o azufre,

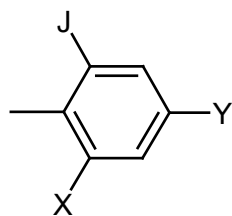
fenilo dado el caso sustituido con halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-tio o alquil C₁-C₆-sulfonilo,

- fenil-alquilo C₁-C₆ dado el caso sustituido con halógeno, nitro, ciano, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ o haloalcoxi C₁-C₆,
- hetarilo de 5 ó 6 miembros dado el caso sustituido con halógeno o alquilo C₁-C₆ (por ejemplo pirazolilo, tiazolilo, piridilo, pirimidilo, furanilo o tienilo),
- 5 fenoxi-alquilo C₁-C₆ dado el caso sustituido con halógeno o alquilo C₁-C₆ o hetariloxi-alquilo C₁-C₆ de 5 ó 6 miembros dado el caso sustituido con halógeno, amino o alquilo C₁-C₆ (por ejemplo, piridiloxi-alquilo C₁-C₆, pirimidiloxi-alquilo C₁-C₆ o tiazoliloxi-alquilo C₁-C₆),
- R² representa preferentemente alquilo C₁-C₂₀, alquenilo C₂-C₂₀, alcoxi C₁-C₈-alquilo C₂-C₈, poli-alcoxi C₁-C₈-alquilo C₂-C₈ respectivamente dado el caso sustituidos con halógeno ,
- 10 cicloalquilo C₃-C₈ dado el caso sustituido con halógeno, alquilo C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆ o
- fenilo o bencilo respectivamente dado el caso sustituidos con halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ o haloalcoxi C₁-C₆,
- R³ representa preferentemente alquilo C₁-C₈ dado el caso sustituido con halógeno o fenilo o bencilo respectivamente dado el caso sustituidos con halógeno, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, ciano o nitro,
- 15 R⁴ y R⁵ representan preferentemente independientemente uno de otro alquilo C₁-C₈, alcoxi C₁-C₈, alquil C₁-C₈-amino, di-(alquil C₁-C₈)amino, alquil C₁-C₈-tio, alquenil C₂-C₈-tio, cicloalquil C₃-C₇-tio respectivamente dado el caso sustituidos con halógeno, o fenilo, fenoxi o feniltio respectivamente dado el caso sustituidos con halógeno, nitro, ciano, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄-tio, haloalquil C₁-C₄-tio, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄,
- 20 R⁶ y R⁷ representan independientemente uno de otro preferentemente hidrógeno, alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, alcoxi C₁-C₈, alquenilo C₃-C₈, alcoxi C₁-C₈-alquilo C₁-C₈ respectivamente dado el caso sustituidos con halógeno, fenilo dado el caso sustituido con halógeno, haloalquilo C₁-C₈, alquilo C₁-C₈ o alcoxi C₁-C₈, bencilo dado el caso sustituido con halógeno, alquilo C₁-C₈, haloalquilo C₁-C₈ o alcoxi C₁-C₈ o juntos representan un resto alquilenilo C₃-C₆ dado el caso sustituido con alquilo C₁-C₄, en el que está reemplazado dado el caso un átomo de carbono por oxígeno o azufre,
- 25 R¹³ representa preferentemente hidrógeno, alquilo C₁-C₈ o alcoxi C₁-C₈ respectivamente dado el caso sustituidos con halógeno, cicloalquilo C₃-C₈ dado el caso sustituido con halógeno, alquilo C₁-C₄ o alcoxi C₁-C₄, en el que está reemplazado dado el caso un grupo metileno por oxígeno o azufre, o fenilo, fenil-alquilo C₁-C₄ o fenil-alcoxi C₁-C₄ respectivamente dado el caso sustituidos con halógeno, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, nitro o ciano,
- 30 R^{14a} representa preferentemente hidrógeno o alquilo C₁-C₈ o
- R¹³ y R^{14a} representan juntos preferentemente alcano C₄-C₆-dílo,
- R^{15a} y R^{16a} son iguales o distintos y representan preferentemente alquilo C₁-C₆ o
- R^{15a} y R^{16a} representan juntos preferentemente un resto alcano C₂-C₄-dílo, que está dado el caso sustituido con alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ o con fenilo dado el caso sustituido con halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₄, nitro o ciano,
- 35 R^{17a} y R^{18a} representan independientemente uno de otro preferentemente hidrógeno, alquilo C₁-C₈ dado el caso sustituido con halógeno o fenilo dado el caso sustituido con halógeno, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, nitro o ciano o
- 40 R^{17a} y R^{18a} representan junto con el átomo de carbono al que están unidos preferentemente un grupo carbonilo o cicloalquilo C₅-C₇ dado el caso sustituido con halógeno, alquilo C₁-C₄ o alcoxi C₁-C₄, en el que está reemplazado dado el caso un grupo metileno por oxígeno o azufre,
- R^{19a} y R^{20a} representan independientemente uno de otro preferentemente alquilo C₁-C₁₀, alquenilo C₂-C₁₀, alcoxi C₁-C₁₀, alquil C₁-C₁₀-amino, alquenil C₃-C₁₀-amino, di-(alquil C₁-C₁₀)amino o di-(alquenil C₃-C₁₀)amino.
- 45 En las definiciones de restos citadas como preferentes halógeno representa flúor, cloro, bromo y yodo, especialmente flúor, cloro y bromo.
- J representa con especial preferencia trifluorometoxi,
- X representa con especial preferencia hidrógeno, flúor, cloro, bromo, alquilo C₁-C₄, trifluorometilo o alcoxi C₁-C₄,

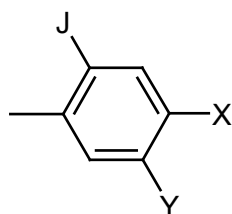
Y representa con especial preferencia hidrógeno, flúor, cloro, bromo, alcoxi C₁-C₄ o alquilo C₁-C₄

con la condición de que al menos uno de los restos J, X o Y se encuentre en la posición 2 del resto fenilo y sea distinto de hidrógeno.

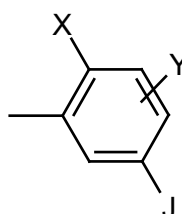
5 Con especial preferencia los restos J, X e Y se encuentran a este respecto con sus significados especialmente preferentes en los siguientes modelos de sustitución de fenilo



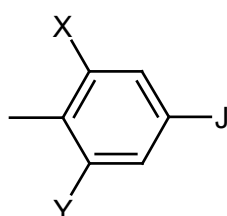
(A)



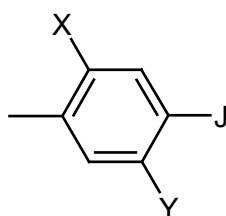
(B)



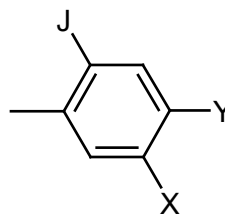
(C)



(D)



(E)



(K) X, Y ≠ H

en donde en el modelo de sustitución de fenilo (C), (D) y (E), X e Y son al mismo tiempo distintos de hidrógeno,

10 A representa con especial preferencia hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₂ respectivamente dado el caso sustituidos de una a tres veces con flúor o cloro, cicloalquilo C₃-C₆ dado el caso sustituido de una a dos veces con alquilo C₁-C₂ o alcoxi C₁-C₂, que puede estar interrumpido dado el caso con un átomo de oxígeno, representa fenilo o bencilo respectivamente dado el caso sustituidos de una de vez a dos veces con flúor, cloro, bromo, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₂, ciano o nitro,

B representa con especial preferencia hidrógeno, alquilo C₁-C₄ o alcoxi C₁-C₂-alquilo C₁-C₂ o

15 A, B y el átomo de carbono al que están unidos representan con especial preferencia cicloalquilo C₅-C₇ saturado o insaturado, en el que dado el caso un miembro del anillo está reemplazado por oxígeno o azufre y que está dado el caso sustituido de una a dos veces con alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₄-alcoxi C₁-C₂, cicloalquil C₃-C₆-metoxi, trifluorometilo o alcoxi C₁-C₆, o

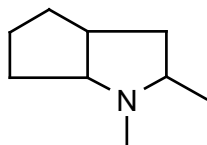
20 A, B y el átomo de carbono al que están unidos representan con especial preferencia cicloalquilo C₅-C₆, que está sustituido con un grupo alquilenodifilo dado el caso sustituido con metilo o etilo o con un grupo alquilenodioxilo o con un grupo alquilenoditiol que contienen dado el caso uno o dos átomos de oxígeno o azufre no directamente adyacentes, que con el átomo de carbono al que está unido forma un anillo adicional de cinco o seis miembros, o

25 A, B y el átomo de carbono al que están unidos representan con especial preferencia cicloalquilo C₃-C₆ o cicloalqueno C₅-C₆, en los que dos sustituyentes junto con los átomos de carbono a los que están unidos representan alcano C₂-C₄-diilo, alqueno C₂-C₄-diilo o butadienodifilo respectivamente dado el caso sustituidos con alquilo C₁-C₂ o alcoxi C₁-C₂,

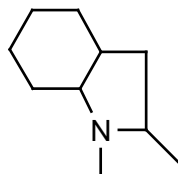
D representa con especial preferencia hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alqueno C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₂-C₃ respectivamente dado el caso sustituidos de una a tres veces con flúor, cicloalquilo C₃-C₆ dado el caso sustituido de una a dos veces con alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₂, en el que está reemplazado dado el caso un grupo metileno por oxígeno, o

30 A y D representan juntos con especial preferencia alcano C₃-C₅-diilo dado el caso sustituido de una a dos veces, en el que puede estar reemplazado un grupo metileno por un grupo carbonilo, oxígeno o azufre, en donde como sustituyentes se tienen en cuenta alquilo C₁-C₂ o alcoxi C₁-C₂ o

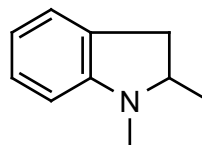
A y D representan junto con los átomos a los que están unidos, uno de los grupos AD-1 a AD-10:



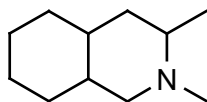
AD-1



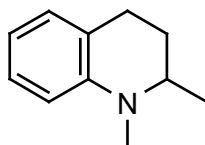
AD-2



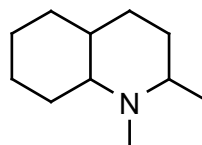
AD-3



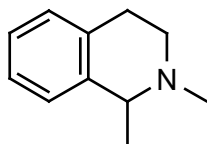
AD-4



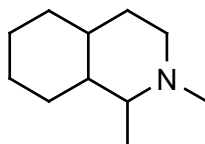
AD-5



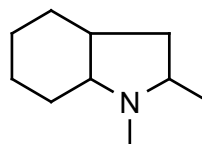
AD-6



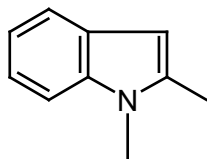
AD-7



AD-8



AD-9



AD-10

G representa con especial preferencia hidrógeno (a) o uno de los grupos

5 en los que

E representa un equivalente de ión metálico o un ión de amonio,

L representa oxígeno o azufre y

M representa oxígeno o azufre,

10 R^1 representa con especial preferencia alquilo C_1-C_8 , alqueno C_2-C_{18} , alcoxi C_1-C_4 -alquilo C_1-C_2 , alquil C_1-C_4 -tio-alquilo C_1-C_2 respectivamente dado el caso sustituidos de una a tres veces con flúor o cloro, o cicloalquilo C_3-C_6 dado el caso sustituido de una a dos veces con flúor, cloro, alquilo C_1-C_2 o alcoxi C_1-C_2 , en el que dado el caso están reemplazados uno o dos miembros del anillo no directamente adyacentes por oxígeno,

fenilo dado el caso sustituido de una a dos veces con flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, alquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_2 o haloalcoxi C_1-C_2 ,

15 R^2 representa con especial preferencia alquilo C_1-C_8 , alqueno C_2-C_8 o alcoxi C_1-C_4 -alquilo C_2-C_4 respectivamente dado el caso sustituidos de una a tres veces con flúor,

cicloalquilo C_3-C_6 dado el caso sustituido una vez con alquilo C_1-C_2 o alcoxi C_1-C_2 o

fenilo o bencilo respectivamente dado el caso sustituido de una a dos veces con flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, alquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_3 , trifluorometilo o trifluorometoxi,

R³ representa con especial preferencia alquilo C₁-C₆ dado el caso sustituido de una a tres veces con flúor, o fenilo respectivamente dado el caso sustituido una vez con flúor, cloro, bromo, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, trifluorometilo, trifluorometoxi, ciano o nitro,

5 R⁴ representa con especial preferencia alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-amino, di-(alquil C₁-C₆)amino, alquil C₁-C₆-tio, alquenil C₃-C₄-tio, cicloalquil C₃-C₆-tio, o fenilo, fenoxi o feniltio respectivamente dado el caso sustituidos una vez con flúor, cloro, bromo, nitro, ciano, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquil C₁-C₃-tio, haloalquil C₁-C₃-tio, alquilo C₁-C₃ o trifluorometilo,

R⁵ representa con especial preferencia alcoxi C₁-C₆ o alquil C₁-C₆-tio,

10 R⁶ representa con especial preferencia hidrógeno, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquenilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₄, fenilo dado el caso sustituido una vez con flúor, cloro, bromo, trifluorometilo, alquilo C₁-C₄ o alcoxi C₁-C₄, bencilo dado el caso sustituido una vez con flúor, cloro, bromo, alquilo C₁-C₄, trifluorometilo o alcoxi C₁-C₄,

R⁷ representa con especial preferencia alquilo C₁-C₆, alquenilo C₃-C₆ o alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₄,

15 R⁶ y R⁷ representan con especial preferencia juntos un resto alquilenos C₄-C₅ dado el caso sustituido con metilo o etilo, en el que dado el caso está reemplazado un grupo metileno por oxígeno o azufre.

En las definiciones de restos citadas con especial preferencia halógeno representa flúor, cloro y bromo, especialmente flúor y cloro.

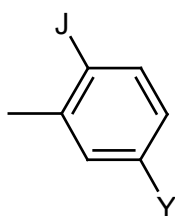
J representa con muy especial preferencia trifluorometoxi,

X representa con muy especial preferencia hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, propilo, metoxi o etoxi,

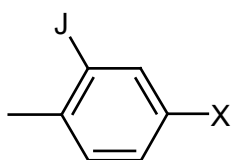
20 Y representa con muy especial preferencia hidrógeno, cloro, bromo, metilo, etilo o metoxi,

con la condición de que al menos uno de los restos J, X o Y se encuentre en la posición 2 del resto fenilo y sea distinto de hidrógeno.

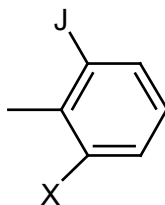
Con muy especial preferencia los restos J, X e Y se encuentran a este respecto con sus significados muy especialmente preferentes en los siguientes modelos de sustitución de fenilo



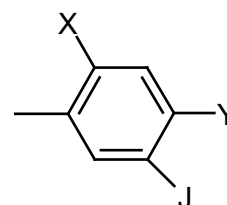
(F)



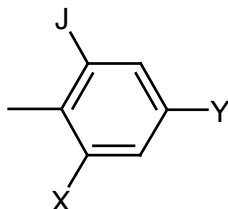
(G) X ≠ H



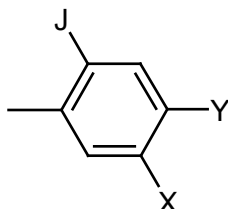
(H) X ≠ H



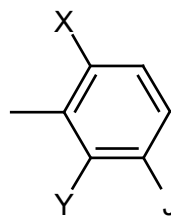
(I)



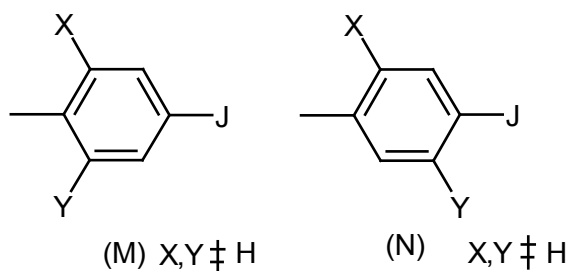
(J) X, Y ≠ H



(K) X, Y ≠ H



(L) X, Y ≠ H



5 A representa con muy especial preferencia hidrógeno, alquilo C₁-C₄ o alcoxi C₁-C₂-alquilo C₁-C₂ respectivamente dado el caso sustituidos de una a tres veces con flúor, representa ciclopropilo, ciclopentilo o ciclohexilo, representa fenilo o bencilo sustituidos respectivamente dado el caso con flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, metoxi, etoxi, trifluorometilo, trifluorometoxi, ciano o nitro,

B representa con muy especial preferencia hidrógeno, metilo o etilo o

10 A, B y el átomo de carbono al que están unidos representan con muy especial preferencia cicloalquilo C₅-C₆ saturado, en el que dado el caso está reemplazado un miembro del anillo por oxígeno o azufre y que está dado el caso sustituido una vez con metilo, etilo, propilo, isopropilo, metoximetilo, etoximetilo, propoximetilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi, propoxi, butoxi, metoxietilo, etoxietilo, metoxietoxi, etoxietoxi, ciclopropilmetoxi, ciclopentilmetoxi o ciclohexilmetoxi, o

A, B y el átomo de carbono al que están unidos representan con muy especial preferencia cicloalquilo C₆, que dado el caso está sustituido con un grupo alquilendioxi que contiene dos átomos de oxígeno no directamente adyacentes, o

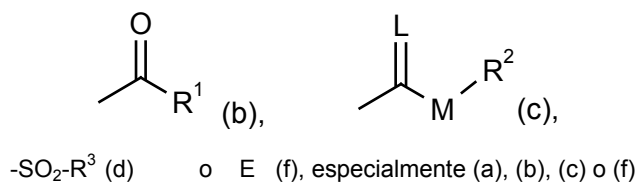
15 A, B y el átomo de carbono al que están unidos representan con muy especial preferencia cicloalquilo C₅-C₆ o cicloalqueno C₅-C₆, en los que dos sustituyentes junto con los átomos de carbono a los que están unidos representan alcano C₂-C₄-diílo o alqueno C₂-C₄-diílo o butadienodílo,

20 D representa con muy especial preferencia hidrógeno, alquilo C₁-C₄, alqueno C₃-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₂-C₃ respectivamente dado el caso sustituidos de una vez a tres veces con flúor, o ciclopropilo, ciclopentilo o ciclohexilo,

o

A y D representan juntos con muy especial preferencia alcano C₃-C₅-diílo dado el caso sustituido una vez con metilo o metoxi, en el que está reemplazado dado el caso un átomo de carbono por oxígeno o azufre o representa el grupo AD-1,

25 G representa con muy especial preferencia hidrógeno (a) o uno de los grupos



en los que

L representa oxígeno o azufre,

30 M representa oxígeno o azufre y

E representa un ión amonio,

R¹ representa con muy especial preferencia alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₁₇, alcoxi C₁-C₂-alquilo C₁, alquil C₁-C₂-tio-alquilo C₁, o ciclopropilo o ciclohexilo respectivamente dado el caso sustituidos una vez con flúor, cloro, metilo o metoxi,

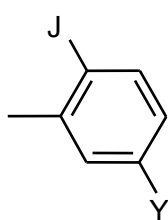
35 fenilo dado el caso sustituido una vez con flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, metoxi, trifluorometilo o trifluorometoxi,

R² representa con muy especial preferencia alquilo C₁-C₈, alqueno C₂-C₆ o alcoxi C₁-C₄-alquilo C₂-C₃, fenilo o bencilo respectivamente dado el caso sustituidos una vez con flúor,

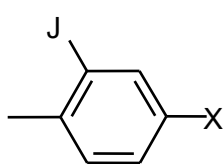
- R³ representa con muy especial preferencia alquilo C₁-C₈.
 J representa destacadamente trifluorometoxi,
 X representa destacadamente hidrógeno, cloro, bromo, metilo, etilo o metoxi,
 Y representa destacadamente hidrógeno, cloro, bromo, metilo o metoxi,

5 con la condición de que al menos uno de los restos J, X o Y se encuentre en la posición 2 del resto fenilo y sea distinto de hidrógeno.

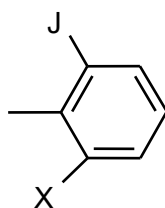
Destacadamente los restos J, X e Y se encuentran a este respecto con sus significados muy especialmente preferentes en los siguientes modelos de sustitución de fenilo.



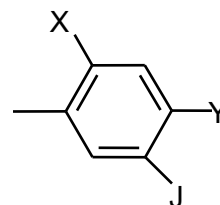
(F)



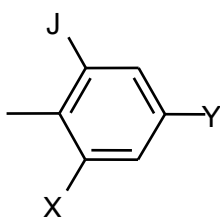
(G) X ≠ H



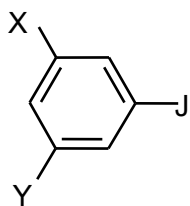
(H) X ≠ H



(I)



(J) X, Y ≠ H

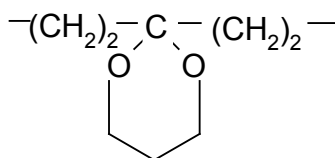
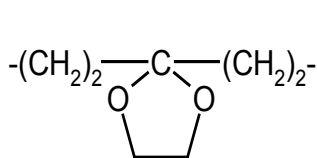


(M) X, Y ≠ H

- 10 A representa destacadamente alquilo C₁-C₄ o cicloalquilo,
 B representa destacadamente hidrógeno o metilo,

A, B y el átomo de carbono al que están unidos representan destacadamente cicloalquilo C₅-C₆ saturado, en el que está reemplazado dado el caso un miembro del anillo por oxígeno y que está dado el caso sustituido una vez con metoximetilo, metoxi, etoxi, propoxi o butoxi,

15 o

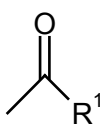


D representa destacadamente hidrógeno o ciclopropilo,

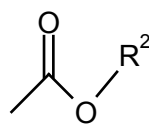
o

A y D representan juntos destacadamente alcano C₃-C₅-diilo,

- 20 G representa destacadamente hidrógeno (a) o uno de los grupos



(b)



(c)

R¹ representa destacadamente alquilo C₁-C₆.

R² representa destacadamente alquilo C₁-C₈ o bencilo.

5 Las definiciones o ilustraciones de restos generales o de intervalos preferentes anteriormente citados pueden combinarse discrecionalmente entre sí, también pues entre los intervalos e intervalos preferentes respectivos. Son válidas para los productos finales así como para los productos de partida e intermedios correspondientes.

Son preferentes de acuerdo con la invención los compuestos de fórmula (I) en los que se presenta una combinación de los significados citados anteriormente como preferentes (preferentemente).

Son especialmente preferentes de acuerdo con la invención los compuestos de fórmula (I) en los que se presenta una combinación de los significados citados anteriormente como especialmente preferentes.

10 Son preferentes muy especialmente de acuerdo con la invención los compuestos de fórmula (I) en los que se presenta una combinación de los significados citados anteriormente como muy especialmente preferentes.

Son preferentes destacadamente de acuerdo con la invención los compuestos de fórmula (I) en los que se presenta una combinación de los significados citados anteriormente como destacados.

15 Los restos hidrocarburo saturados o insaturados como alquilo, alcanodiilo o alqueniilo pueden ser, también en compuestos con heteroátomos como, por ejemplo, en alcoxi, en tanto sea posible, respectivamente de cadena lineal o ramificada.

Los restos dado el caso sustituidos pueden estar sustituidos una o varias veces, a menos que se indique otra cosa, pudiendo ser iguales o distintos los sustituyentes en las sustituciones múltiples.

20 De forma particular se citan además de los compuestos citados en los ejemplos de preparación los siguientes compuestos de fórmula (I-1-a):

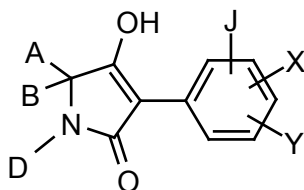

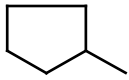
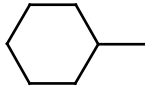



Tabla 1: 2-OCF₃; X = H; Y = H.

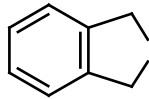
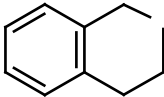
A	B	D
CH ₃	H	H
C ₂ H ₅	H	H
C ₃ H ₇	H	H
i-C ₃ H ₇	H	H
C ₄ H ₉	H	H
i-C ₄ H ₉	H	H
s-C ₄ H ₉	H	H
t-C ₄ H ₉	H	H
CH ₃	CH ₃	H
C ₂ H ₅	CH ₃	H
C ₃ H ₇	CH ₃	H
i-C ₃ H ₇	CH ₃	H
C ₄ H ₉	CH ₃	H
i-C ₄ H ₉	CH ₃	H
s-C ₄ H ₉	CH ₃	H
t-C ₄ H ₉	CH ₃	H

ES 2 372 319 T3

(continuación)

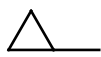
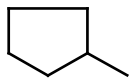
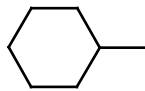

A	B	D
C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
C ₃ H ₇	C ₃ H ₇	H
	CH ₃	H
	CH ₃	H
	CH ₃	H
	-(CH ₂) ₂ -	H
	-(CH ₂) ₄ -	H
	-(CH ₂) ₅ -	H
	-(CH ₂) ₆ -	H
	-(CH ₂) ₇ -	H
	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -	H
	-CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -	H
	-(CH ₂) ₂ -S-(CH ₂) ₂ -	H
	-CH ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₃ -	H
	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	H
	-(CH ₂) ₂ -CHC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -	H
	-(CH ₂) ₂ -CHC ₃ H ₇ -(CH ₂) ₂ -	H
	-(CH ₂) ₂ -CHi-C ₃ H ₇ -(CH ₂) ₂ -	H
	-CH ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₃ -	H
	-CH ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₃ -	H
	CH ₂ -CHOC ₃ H ₇ -(CH ₂) ₃ -	H
	-CH ₂ -CHOC ₄ H ₉ -(CH ₂) ₃ -	H
	-CH ₂ -CHO-(CH ₂) ₂ -OCH ₃ -(CH ₂) ₃ -	H
	-CH ₂ -CH(O-CH ₂)-(CH ₂) ₃ -	H
		

(continuación)

A	B	D
	$-(\text{CH}_2)_2\text{-CHOCH}_3\text{-(CH}_2)_2\text{-}$	H
	$-(\text{CH}_2)_2\text{-CHOC}_2\text{H}_5\text{-(CH}_2)_2\text{-}$	H
	$-(\text{CH}_2)_2\text{-CHOC}_3\text{H}_7\text{-(CH}_2)_2\text{-}$	H
	$-(\text{CH}_2)_2\text{-CHO-i-C}_3\text{H}_7\text{-(CH}_2)_2\text{-}$	H
	$-\text{CH}_2\text{-CH(CH}_2\text{-OCH}_3\text{)-(CH}_2)_3\text{-}$	H
	$-\text{CH}_2\text{-CH(CH}_2\text{-CH}_2\text{-OCH}_3\text{)-(CH}_2)_3\text{-}$	H
	$-(\text{CH}_2)_2\text{-CH(CH}_2\text{-OCH}_3\text{)-(CH}_2)_2\text{-}$	H
	$-(\text{CH}_2)_2\text{-CH(CH}_2\text{-CH}_2\text{-OCH}_3\text{)-(CH}_2)_2\text{-}$	H
	$-(\text{CH}_2)_2\text{-C(CH}_3)_2\text{-(CH}_2)_2\text{-}$	H
	$-\text{CH}_2\text{-(CHCH}_3)_2\text{-(CH}_2)_2\text{-}$	H
	$\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---CH---(CH}_2)_2\text{---CH---} \\ \quad \quad \quad \diagdown \quad \diagup \\ \quad \quad \quad \text{CH}_2 \end{array}$	H
	$\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---CH---CH---CH}_2\text{---} \\ \quad \quad \quad \diagdown \quad \diagup \\ \quad \quad \quad \text{(CH}_2)_4 \end{array}$	H
	$\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---CH---CH---(CH}_2)_2\text{---} \\ \quad \quad \quad \diagdown \quad \diagup \\ \quad \quad \quad \text{(CH}_2)_3 \end{array}$	H
		H
		H
A	D	B
	$-(\text{CH}_2)_3\text{-}$	H
	$-(\text{CH}_2)_4\text{-}$	H
	$-\text{CH}_2\text{-CHCH}_3\text{-CH}_2\text{-}$	H
	$-\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-CHCH}_3\text{-}$	H
	$-\text{CH}_2\text{-CHCH}_3\text{-CHCH}_3\text{-}$	H
	$-\text{CH}_2\text{-CH(OCH}_3\text{)-CH}_2\text{-}$	H

(continuación)

A	D	B
	$-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-$	H
	$-\text{CH}_2-\overset{\text{O}}{\underset{\text{ }}{\text{C}}}-\text{CH}-\text{CH}_2-$	H
	$-\text{CH}_2-\text{S}-\text{CH}_2-$	H
	$-\text{CH}_2-\text{S}-(\text{CH}_2)_2-$	H

A	B	D
	$-(\text{CH}_2)_2-\text{S}-\text{CH}_2-$	H
	$-\text{CH}_2-\text{CH}-\text{CH}-$ $\quad \quad \quad \diagdown \quad \diagup$ $\quad \quad \quad (\text{CH}_2)_3$	H
H	CH_3	H
H	C_2H_5	H
H	C_3H_7	H
H	$i\text{-C}_3\text{H}_7$	H
H		H
H		H
H		H
CH_3	CH_3	H
CH_3	C_2H_5	H
CH_3	C_3H_7	H
CH_3	$i\text{-C}_3\text{H}_7$	H
CH_3		H

(continuación)

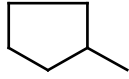
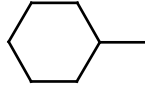
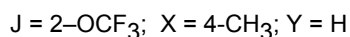
A	B	D
CH ₃		H
CH ₃		H
	$\begin{array}{c} \text{---CH}_2\text{---CH---CH---} \\ \qquad \\ \text{CH}_2\text{---O---CH}_2 \end{array}$	H
C ₂ H ₅	CH ₃	H
C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H

Tabla 2: A, B y D son como se indican en la tabla 1



5 **Tabla 3:** A, B y D son como se indican en la tabla 1

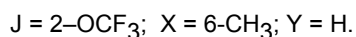


Tabla 4: A, B y D son como se indican en la tabla 1

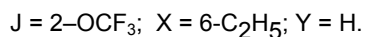


Tabla 5: A, B y D son como se indican en la tabla 1

10 $X = 2\text{-CH}_3; Y = \text{H}; J = 5\text{-OCF}_3.$

Tabla 6: A, B y D son como se indican en la tabla 1

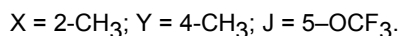
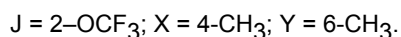


Tabla 7: A, B y D son como se indican en la tabla 1



15 **Tabla 8:** A, B y D son como se indican en la tabla 1

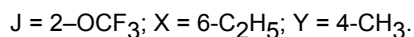


Tabla 9: A, B y D son como se indican en la tabla 1

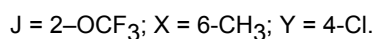


Tabla 10: A, B y D son como se indican en la tabla 1

20 $J = 2\text{-OCF}_3; X = 6\text{-C}_2\text{H}_5; Y = 4\text{-Cl}.$

Tabla 11: A, B y D son como se indican en la tabla 1

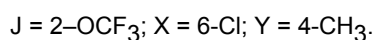
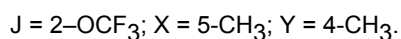
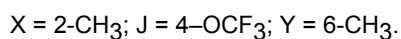


Tabla 12: A, B y D son como se indican en la tabla 1

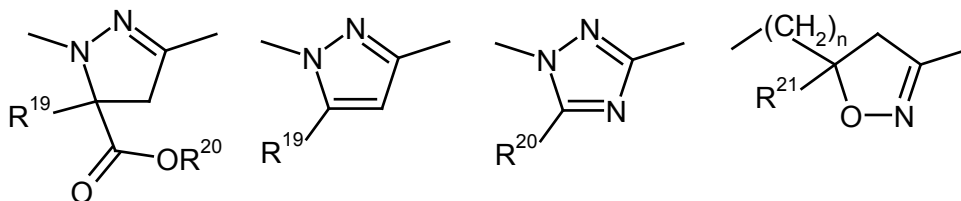


25 **Tabla 13:** A, B y D son como se indican en la tabla 1



- Tabla 14:** A, B y D son como se indican en la tabla 1
X = 2-C₂H₅; J = 4-OCF₃; Y = 6-CH₃.
- Tabla 15:** A, B y D son como se indican en la tabla 1
X = 2-C₂H₅; J = 4-OCF₃; Y = 6-C₂H₅.
- 5 **Tabla 16:** A, B y D son como se indican en la tabla 1
X = 2-Cl; J = 4-OCF₃; Y = 6-CH₃.
- Tabla 17:** A, B y D son como se indican en la tabla 1
X = 2-Cl; J = 4-OCF₃; Y = 6-C₂H₅.
- Tabla 18:** A, B y D son como se indican en la tabla 1
10 X = 2-Cl; J = 4-OCF₃; Y = H.
- Tabla 19:** A, B y D son como se indican en la tabla 1
X = 2-Br; J = 4-OCF₃; Y = H.
- Tabla 20:** A, B y D son como se indican en la tabla 1
X = 2-OCH₃; J = 4-OCF₃; Y = 6-Cl.
- 15 **Tabla 21:** A, B y D son como se indican en la tabla 1
X = 2-OCH₃; J = 6-OCF₃; Y = 4-Cl.
- Tabla 22:** A, B y D son como se indican en la tabla 1
J = 2-OCF₃; X = 6-Cl; Y = 4-Cl.
- Tabla 23:** A, B y D son como se indican en la tabla 1
20 J = 2-OCF₃; X = 6-Cl; Y = 4-Br.
- Tabla 24:** A, B y D son como se indican en la tabla 1
J = 2-OCF₃; X = 6-Br; Y = 4-Br.
- Tabla 25:** A, B y D son como se indican en la tabla 1
J = 4-OCF₃; X = 2-Cl; Y = 6-Cl.
- 25 **Tabla 26:** A, B y D son como se indican en la tabla 1
J = 4-OCF₃; X = 2-Br; Y = 6-Cl.
- Tabla 27:** A, B y D son como se indican en la tabla 1
X = 2-Br; J = 4-OCF₃; Y = 6-Br.
- Tabla 28:** A, B y D son como se indican en la tabla 1
30 X = 2-Cl; J = 5-OCF₃; Y = H.
- Tabla 29:** A, B y D son como se indican en la tabla 1
X = 2-Br; J = 5-OCF₃; Y = H.
- Tabla 30:** A, B y D son como se indican en la tabla 1
X = H; J = 2-OCF₃; Y = 5-CH₃.
- 35 Se definen a continuación los significados preferentes de los grupos citados con respecto a los compuestos de mejora de la tolerancia por las plantas de cultivo ("protectores de herbicida") de fórmulas (IIa), (IIb), (IIc), (IIe) y (IIe).
- m representa preferentemente los números 0, 1, 2, 3 ó 4.

A¹ representa preferentemente una de las agrupaciones heterocíclicas divalentes esquematizadas a continuación



n representa preferentemente los números 0, 1, 2, 3 ó 4.

5 A² representa preferentemente metileno o etileno respectivamente dado el caso sustituidos con metilo, etilo, metoxicarbonilo o etoxicarbonilo.

R¹⁴ representa preferentemente hidroxilo, mercapto, amino, metoxi, etoxi, n- o isopropoxi, n-, iso-, *sec*- o *terc*-butoxi, metiltio, etiltio, n- o isopropiltio, n-, iso-, *sec*- o *terc*-butiltio, metilamino, etilamino, n- o isopropilamino, n-, iso-, *sec*- o *terc*-butilamino, dimetilamino o dietilamino.

10 R¹⁵ representa preferentemente hidroxilo, mercapto, amino, metoxi, etoxi, n- o isopropoxi, n-, iso-, *sec*- o *terc*-butoxi, 1-metilhexiloxi, aliloxi, 1-aliloximetiletoxi, metiltio, etiltio, n- o isopropiltio, n-, iso-, *sec*- o *terc*-butiltio, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, n-, iso-, *sec*- o *terc*-butilamino, dimetilamino o dietilamino.

R¹⁶ representa preferentemente metilo, etilo, n- o isopropilo respectivamente dado el caso sustituidos con flúor, cloro y/o bromo.

15 R¹⁷ representa preferentemente hidrógeno, metilo, etilo, n- o isopropilo, n- iso-, *sec*- o *terc*-butilo, propenilo, butenilo, propinilo o butinilo, metoximetilo, etoximetilo, metoxietilo, etoxietilo, dioxolanilmetilo, furilo, furilmetilo, tienilo, tiazolilo, piperidinilo respectivamente dado el caso sustituidos con flúor y/o cloro, o fenilo dado el caso sustituido con flúor, cloro, metilo, etilo, n- o isopropilo, n-, iso-, *sec*- o *terc*-butilo.

20 R¹⁸ representa preferentemente hidrógeno, metilo, etilo n- o isopropilo, n-, iso-, *sec*- o *terc*-butilo, propenilo, butenilo, propinilo o butinilo, metoximetilo, etoximetilo, metoxietilo, etoxietilo, dioxolanilmetilo, furilo, furilmetilo, tienilo, tiazolilo, piperidinilo respectivamente dado el caso sustituidos con flúor y/o cloro, o fenilo dado el caso sustituido con flúor, cloro, metilo, etilo, n- o isopropilo, n-, iso-, *sec*- o *terc*-butilo, o junto con R¹⁷ representa uno de los restos -CH₂-O-CH₂-CH₂- y -CH₂-CH₂-O-CH₂-CH₂-, que están dado el caso sustituidos con metilo, etilo, furilo, fenilo, un anillo bencénico asociado o forman mediante dos sustituyentes, junto con el átomo de carbono al que están unidos, un carbociclo de 5 ó 6 miembros.

25 R¹⁹ representa preferentemente hidrógeno, ciano, flúor, cloro, bromo o metilo, etilo, n- o isopropilo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo o fenilo respectivamente dado el caso sustituidos con flúor, cloro y/o bromo.

R²⁰ representa preferentemente hidrógeno, metilo, etilo, n- o isopropilo, n-, iso- *sec*- o *terc*-butilo dado el caso sustituidos con hidroxilo, ciano, flúor, metoxi, etoxi, n- o isopropoxi.

30 R²¹ representa preferentemente hidrógeno, ciano, flúor, cloro, bromo o metilo, etilo, n- o isopropilo, n-, iso-, *sec*- o *terc*-butilo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo o fenilo respectivamente dado el caso sustituidos con flúor, cloro y/o bromo.

X¹ representa preferentemente nitro, ciano, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n- o isopropilo, n-, iso-, *sec*- o *terc*-butilo, difluorometilo, diclorometilo, trifluorometilo, triclorometilo, clorodifluorometilo, fluorodiclorometilo, metoxi, etoxi, n- o isopropoxi, difluorometoxi o trifluorometoxi.

35 X² representa preferentemente hidrógeno, nitro, ciano, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n- o isopropilo, n-, iso-, *sec*- o *terc*-butilo, difluorometilo, diclorometilo, trifluorometilo, triclorometilo, clorodifluorometilo, fluorodiclorometilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, difluorometoxi o trifluorometoxi.

40 X³ representa preferentemente hidrógeno, nitro, ciano, flúor, cloro, bromo metilo, etilo, n- o isopropilo, n-, iso-, *sec*- o *terc*-butilo, difluorometilo, diclorometilo, trifluorometilo, triclorometilo, clorodifluorometilo, fluorodiclorometilo, metoxi, etoxi, n- o isopropoxi, difluorometoxi o trifluorometoxi.

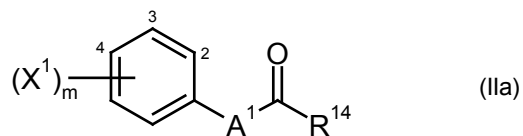
t representa preferentemente los números 0, 1, 2, 3 ó 4.

v representa preferentemente los números 0, 1, 2 ó 3.

R²² representa preferentemente hidrógeno, metilo, etilo, n- o isopropilo.

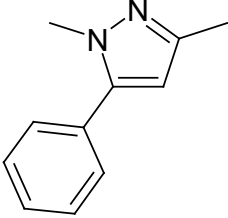
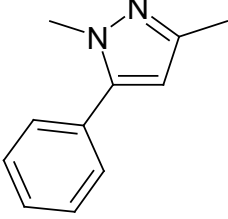
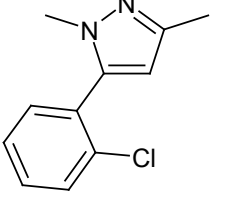
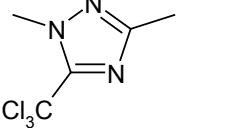
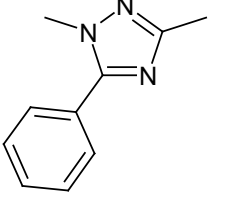
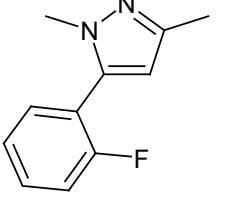
R²³ representa preferentemente hidrógeno, metilo, etilo, n- o isopropilo.

- 5 R²⁴ representa preferentemente hidrógeno, metilo, etilo, n- o isopropilo, n-, iso-, *sec*- o *terc*-butilo, metoxi, etoxi, n- o isopropoxi, n-, iso-, *sec*- o *terc*-butoxi, metiltio, etiltio, n- o isopropiltio, n-, iso-, *sec*- o *terc*-butiltio, metilamino, etilamino, n- o i-propilamino, n-, iso-, *sec*- o *terc*-butilamino, dimetilamino o dietilamino respectivamente dado el caso sustituidos con ciano, flúor, cloro, metoxi, etoxi, n- o isopropoxi, o ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclopropiloxi, ciclobutiloxi, ciclopentiloxi, ciclohexiloxi, ciclopropiltio, ciclobutiltio, ciclopentiltio, ciclohexiltio, ciclopropilamino, ciclobutilamino, ciclopentilamino o ciclohexilamino respectivamente dado el caso sustituidos con ciano, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo n- o isopropilo.
- 10 R²⁵ representa preferentemente hidrógeno, metilo, etilo, n- o isopropilo, n-, iso- o *sec*-butilo respectivamente dado el caso sustituidos con ciano, hidroxilo, flúor, cloro, metoxi, etoxi, n- o isopropoxi, propenilo, butenilo, propinilo o butinilo respectivamente dado el caso sustituidos con ciano, flúor, cloro o bromo, o ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo o ciclohexilo respectivamente dado el caso sustituidos con ciano, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n- o isopropilo.
- 15 R²⁶ representa preferentemente hidrógeno, metilo, etilo, n- o isopropilo, n-, iso- o *sec*-butilo respectivamente dado el caso sustituidos con ciano, hidroxilo, flúor, cloro, metoxi, etoxi, n- o isopropoxi, propenilo, butenilo, propinilo o butinilo respectivamente dado el caso sustituidos con ciano, flúor, cloro o bromo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo o ciclohexilo respectivamente dado el caso sustituidos con ciano, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n- o isopropilo, o fenilo dado el caso sustituido con nitro, ciano, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n- o isopropilo, n-, iso-, *sec*- o *terc*-butilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi, n- o isopropoxi, difluorometoxi o trifluorometoxi, o junto con R²⁵ representa butano-1,4-diilo (trimetileno), pentano-1,5-diilo, 1-oxa-butano-1,4-diilo o 3-oxapentano-1,5-diilo respectivamente dado el caso sustituidos con metilo o etilo.
- 20 X⁴ representa preferentemente nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, formilo, sulfamoilo, hidroxilo, amino, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n- o isopropilo, n-, iso-, *sec*- o *terc*-butilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi, n- o isopropoxi, difluorometoxi o trifluorometoxi.
- X⁵ representa preferentemente nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, formilo, sulfamoilo, hidroxilo, amino, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n- o isopropilo, n-, iso-, *sec*- o *terc*-butilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi, n- o isopropoxi, difluorometoxi o trifluorometoxi.
- 25 Se citan en la siguiente tabla ejemplos de compuestos muy especialmente preferentes como protectores de herbicidas de acuerdo con la invención de fórmula (IIa).

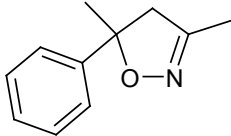
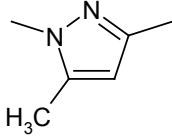
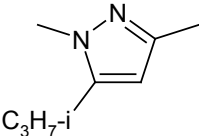
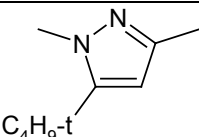
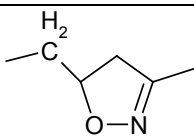
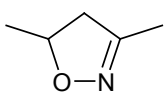
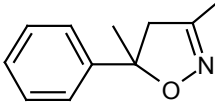
Tabla Ejemplos de los compuestos de fórmula (IIa)

Ej. nº	(Posiciones) (X ¹) _m	A ¹	R ¹⁴
IIa-1	(2) Cl, (4) Cl		OCH ₃
IIa-2	(2) Cl, (4) Cl		OCH ₃
IIa-3	(2) Cl, (4) Cl		OC ₂ H ₅
IIa-4	(2) Cl, (4) Cl		OC ₂ H ₅
IIa-5	(2) Cl		OCH ₃

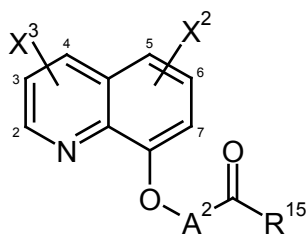
(continuación)

Ej. nº	(Posiciones) (X ¹) _m	A ¹	R ¹⁴
IIa-6	(2) Cl, (4) Cl		OCH ₃
IIa-7	(2) F		OCH ₃
IIa-8	(2) F		OCH ₃
IIa-9	(2) Cl, (4) Cl		OC ₂ H ₅
IIa-10	(2) Cl, (4) CF ₃		OCH ₃
IIa-11	(2) Cl		OCH ₃

(continuación)

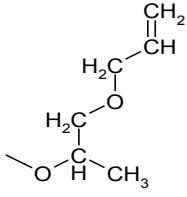
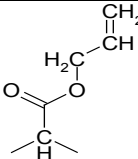
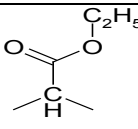
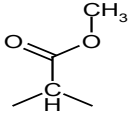
Ej. nº	(Posiciones) (X ¹) _m	A ¹	R ¹⁴
Ila-12	-		OC ₂ H ₅
Ila-13	(2) Cl, (4) Cl		OC ₂ H ₅
Ila-14	(2) Cl, (4) Cl		OC ₂ H ₅
Ila-15	(2) Cl, (4) Cl		OC ₂ H ₅
Ila-16	(2) Cl, (4) Cl		OC ₂ H ₅
Ila-17	(2) Cl, (4) Cl		OC ₂ H ₅
Ila-18	-		OH

Se citan en la siguiente tabla ejemplos de compuestos muy especialmente preferentes como protectores de herbicidas de acuerdo con la invención de fórmula (IIb).



(IIb)

Tabla Ejemplos de los compuestos de fórmula (IIb)

Ej. nº	(Posición) X ²	(Posición) X ³	A ²	R ¹⁵
IIb-1	(5) Cl	-	CH ₂	OH
IIb-2	(5) Cl	-	CH ₂	OCH ₃
IIb-3	(5) Cl	-	CH ₂	OC ₂ H ₅
IIb-4	(5) Cl	-	CH ₂	OC ₃ H _{7-n}
IIb-5	(5) Cl	-	CH ₂	OC ₃ H _{7-i}
IIb-6	(5) Cl	-	CH ₂	OC ₄ H _{9-n}
IIb-7	(5) Cl	-	CH ₂	OCH(CH ₃)C ₅ H _{11-n}
IIb-8	(5) Cl	(2) F	CH ₂	OH
IIb-9	(5) Cl	(2) Cl	CH ₂	OH
IIb-10	(5) Cl	-	CH ₂	OCH ₂ CH=CH ₂
IIb-11	(5) Cl	-	CH ₂	OC ₄ H _{9-i}
IIb-12	(5) Cl	-	CH ₂	
IIb-13	(5) Cl	-		OCH ₂ CH=CH ₂
IIb-14	(5) Cl	-		OC ₂ H ₅
IIb-15	(5) Cl	-		OCH ₃

Se citan en la siguiente tabla ejemplos de compuestos muy especialmente preferentes como protectores de herbicidas de acuerdo con la invención de fórmula (IIc).

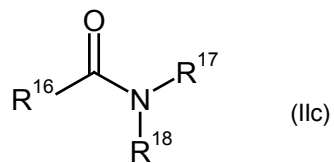
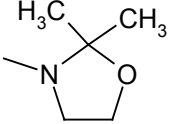
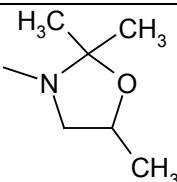
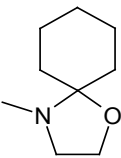
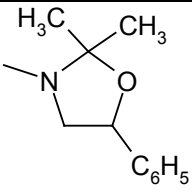
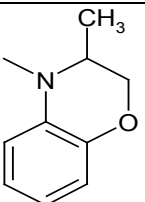
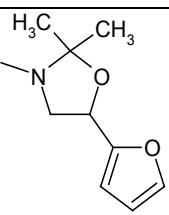


Tabla Ejemplos de los compuestos de fórmula (IIc)

Ej. nº	R ¹⁶	N(R ¹⁷ ,R ¹⁸)
IIc-1	CHCl ₂	N(CH ₂ CH=CH ₂) ₂
IIc-2	CHCl ₂	
IIc-3	CHCl ₂	
IIc-4	CHCl ₂	
IIc-5	CHCl ₂	
IIc-6	CHCl ₂	
IIc-7	CHCl ₂	

Se citan en la siguiente tabla ejemplos de compuestos muy especialmente preferentes como protectores de herbicidas de acuerdo con la invención de fórmula (IId).

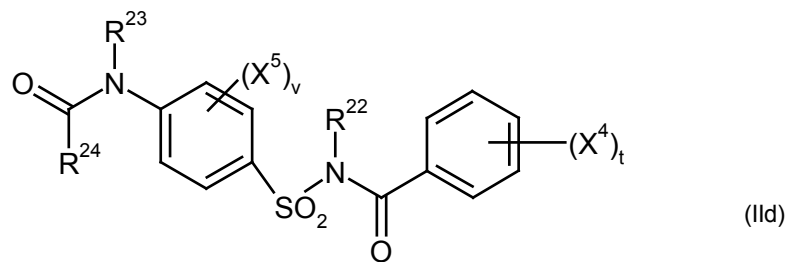


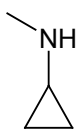


Tabla Ejemplos de los compuestos de fórmula (IId)

Ej. nº	R ²²	R ²³	R ²⁴	(Posiciones) (X ⁴) _t	(Posiciones) (X ⁵) _v
IId-1	H	H	CH ₃	(2) OCH ₃	-
IId-2	H	H	C ₂ H ₅	(2) OCH ₃	-
IId-3	H	H	C ₃ H _{7-n}	(2) OCH ₃	-
IId-4	H	H	C ₃ H _{7-i}	(2) OCH ₃	-
IId-5	H	H		(2) OCH ₃	-
IId-6	H	H	CH ₃	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
IId-7	H	H	C ₂ H ₅	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
IId-8	H	H	C ₃ H _{7-n}	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
IId-9	H	H	C ₃ H _{7-i}	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
IId-10	H	H		(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
IId-11	H	H	OCH ₃	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
IId-12	H	H	OC ₂ H ₅	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-

(continuación)

Ej. nº	R ²²	R ²³	R ²⁴	(Posiciones) (X ⁴) _t	(Posiciones) (X ⁵) _v
IId-13	H	H	OC ₃ H _{7-i}	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
IId-14	H	H	SCH ₃	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
IId-15	H	H	SC ₂ H ₅	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
IId-16	H	H	SC ₃ H _{7-i}	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
IId-17	H	H	NHCH ₃	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
IId-18	H	H	NHC ₂ H ₅	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
IId-19	H	H	NHC ₃ H _{7-i}	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
IId-20	H	H		(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
IId-21	H	H	NHCH ₃	(2) OCH ₃	-
IId-22	H	H	NHC ₃ H _{7-i}	(2) OCH ₃	-
IId-23	H	H	N(CH ₃) ₂	(2) OCH ₃	-
IId-24	H	H	N(CH ₃) ₂	(3) CH ₃ (4) CH ₃	-
IId-25	H	H	CH ₂ -O-CH ₃	(2) OCH ₃	-

Se citan en la siguiente tabla ejemplos de compuestos muy especialmente preferentes como protectores de herbicidas de acuerdo con la invención de fórmula (Ile).

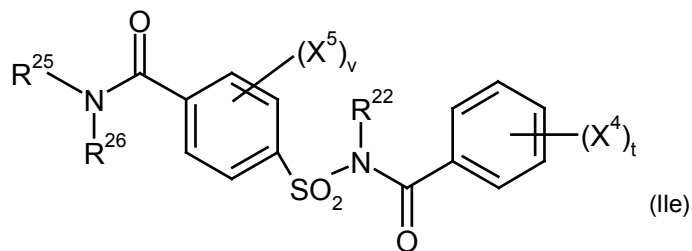




Tabla Ejemplos de los compuestos de fórmula (Ile)

Ej. nº	R ²²	R ²⁵	R ²⁶	(Posiciones) (X ⁴) _t	(Posiciones) (X ⁵) _v
Ile-1	H	H	CH ₃	(2) OCH ₃	-
Ile-2	H	H	C ₂ H ₅	(2) OCH ₃	-
Ile-3	H	H	C ₃ H _{7-n}	(2) OCH ₃	-
Ile-4	H	H	C ₃ H _{7-i}	(2) OCH ₃	-
Ile-5	H	H		(2) OCH ₃	-
Ile-6	H	CH ₃	CH ₃	(2) OCH ₃	-
Ile-7	H	H	CH ₃	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
Ile-8	H	H	C ₂ H ₅	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
Ile-9	H	H	C ₃ H _{7-n}	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
Ile-10	H	H	C ₃ H _{7-i}	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
Ile-11	H	H		(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
Ile-12	H	CH ₃	CH ₃	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-

Como el compuesto que mejora la tolerancia por las plantas de cultivo [componente (b')], son preferentes en la mayoría de los casos cloquintocet-mexilo, fenclorazol-etilo, isoxadifén-etilo, mefenpir-dietilo, furilazol, fenclorim, cumilurón, dimrón, dimepiperato y los compuestos Ile-5 y Ile-11, siendo especialmente destacados cloquintocet-mexilo y mefenpir-dietilo.

- 5 Los compuestos para usar como protectores de acuerdo con la invención de fórmula general (IIa) son conocidos y/o pueden prepararse según procedimientos en sí conocidos (véanse los documentos WO-A-91/07874, WO-A-95/07897).

Los compuestos para usar como protectores de acuerdo con la invención de fórmula general (IIb) son conocidos y/o pueden prepararse según procedimientos en sí conocidos (véase el documento EP-A-191736).

- 10 Los compuestos para usar como protectores de acuerdo con la invención de fórmula general (IIc) son conocidos y/o pueden prepararse según procedimientos en sí conocidos (véanse los documentos DE-A-2218097, DE-A-2350547).

Los compuestos para usar como protectores de acuerdo con la invención de fórmula general (IId) son conocidos y/o pueden prepararse según procedimientos en sí conocidos (véanse los documentos DE-A-19621522 / US-A-6235680).

Los compuestos para usar como protectores de acuerdo con la invención de fórmula general (Ile) son conocidos y se pueden preparar según procedimientos en sí conocidos (véanse los documentos WO-A-99/66795 / US-A-6251827).

- 15 Se enumeran en la siguiente tabla ejemplos de combinaciones herbicidas selectivas de acuerdo con la invención respectivamente a partir de un principio activo de fórmula (I) y respectivamente uno de los protectores anteriormente definidos.

Tabla Ejemplos de las combinaciones de acuerdo con la invención

Principios activos de fórmula (I)	Protector
I-a	Cloquintocet-mexilo
I-a	Fenclorazol-etilo
I-a	Isoxadifén-etilo
I-a	Mefenpir-dietilo
I-a	Furilazol
I-a	Fenclorim
I-a	Cumilurón
I-a	Daimurón /dimrón
I-a	Dimepiperato
I-a	Ile-11
I-a	Ile-5
I-b	Cloquintocet-mexilo
I-b	Fenclorazol-etilo
I-b	Isoxadifén-etilp
I-b	Mefenpir-dietilo
I-b	Furilazol
I-b	Fenclorim
I-b	Cumilurón
I-b	Daimurón /dimrón
I-b	Dimepiperato
I-b	Ile-11
I-b	Ile-5
I-c	Cloquintocet-mexilo
I-c	Fenclorazol-etilo
I-c	Isoxadifén-etilo
I-c	Mefenpir-dietilo
I-c	Furilazol
I-c	Fenclorim
I-c	Cumilurón

(continuación)

Principios activos de fórmula (I)	Protector
I-c	Daimurón /dimrón
I-c	Dimepiperato
I-c	Ile-5
I-c	Ile-11
I-d	Cloquintocet-mexilo
I-d	Fenclorazol-etilo
I-d	Isoxadifén-etilo
I-d	Mefenpir-dietilo
I-d	Furilazol
I-d	Fenclorim
I-d	Cumilurón
I-d	Daimurón /dimrón
I-d	Dimepiperato
I-d	Ile-11
I-d	Ile-5
I-e	Cloquintocet-mexilo
I-e	Fenclorazol-etilo
I-e	Isoxadifén-etilo
I-e	Mefenpir-dietilo
I-e	Furilazol
I-e	Fenclorim
I-e	Cumilurón
I-e	Daimurón /dimrón
I-e	Dimepiperato
I-e	Ile-5
I-e	Ile-11
I-f	Cloquintocet-mexilo
I-f	Fenclorazol-etilo
I-f	Isoxadifén-etilo
I-f	Mefenpir-dietilo
I-f	Furilazol

(continuación)

Principios activos de fórmula (I)	Protector
I-f	Fenclorim
I-f	Cumilurón
I-f	Daimurón /dimrón
I-f	Dimepiperato
I-f	Ile-5
I-f	Ile-11
I-g	Cloquintocet-mexilo
I-g	Fenclorazol-etilo
I-g	Isoxadifén-etilo
I-g	Mefenpir-dietilo
I-g	Furilazol
I-g	Fenclorim
I-g	Cumilurón
I-g	Daimurón /dimrón
I-g	Dimepiperato
I-g	Ile-5
I-g	Ile-11
I-h	Cloquintocet-mexilo
I-h	Fenclorazol-etilo
I-h	Isoxadifén-etilo
I-h	Mefenpir-dietilo
I-h	Furilazol
I-h	Fenclorim
I-h	Cumilurón
I-h	Daimurón /dimrón
I-h	Dimepiperato
I-h	Ile-5
I-h	Ile-11

5 Se ha encontrado ahora de forma sorprendente que las combinaciones de principios activos anteriormente definidas de derivados de ácido tetrámico sustituido con trifluorometoxi-fenilo de fórmula general (I) y protectores (antídotos) del grupo (b') anteriormente citados presentan una actividad herbicida especialmente alta con muy buena tolerancia por las plantas útiles y pueden usarse en distintos cultivos, especialmente en cereales (ante todo trigo), pero también en soja, patatas, maíz y arroz para combatir malas hierbas de forma selectiva.

10 A este respecto, ha de considerarse sorprendente que a partir de una multitud de protectores o antídotos conocidos que son capaces de antagonizar el efecto dañino de un herbicida sobre las plantas de cultivo, sólo los compuestos anteriormente citados del grupo (b') sean adecuados para anular casi completamente el efecto dañino de cetoenoles

cíclicos sustituidos sobre las plantas de cultivo sin perjudicar así relevantemente la actividad herbicida frente a malas hierbas.

5 Se destaca a este respecto el efecto especialmente ventajoso del asociado de combinación especialmente y principalmente preferente del grupo (b'), especialmente respecto a la protección de plantas de cereales como, por ejemplo, trigo, cebada y centeno, pero también maíz y arroz, como plantas de cultivo.

10 En la bibliografía ya se describió que el efecto de distintos principios activos se puede aumentar mediante adición de sales de amonio. A este respecto se trata sin embargo de sales que actúan como detergentes (por ejemplo, documento WO 95/017817) o de sales con sustituyentes alquilo y/o arilo largos, que actúan permeabilizando o aumentan la solubilidad del principio activo (por ejemplo, documentos EP-A 0 453 086, EP-A 0 664 081, FR-A 2 600 494, US 4 844 734, US 5 462 912, US 5 538 937, US-A 03/0224939, US-A 05/0009880, US-A 05/0096386). Además el estado de la técnica describe el efecto sólo para determinados principios activos y/o determinadas aplicaciones de los agentes correspondientes. En muchos otros casos se trata de sales de ácidos sulfónicos, en los que los ácidos actúan propiamente paralizando los insectos (documento US 2 842 476). Se describe un aumento del efecto, por ejemplo, mediante sulfato de amonio por ejemplo para los herbicidas glifosato, fosfinotricina y determinados cetoenoles cíclicos (documentos US 6 645 914, EP-A2 0 036 106, WO 07/068427). Se ha descrito en el documento WO 07/068428 un efecto correspondiente en insecticidas para los cetoenoles cíclicos determinados.

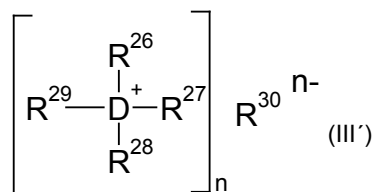
También se describe el uso de sulfato de amonio como coadyuvante para formulación para determinados principios activos y aplicaciones (documento WO 92/16108), pero este sirve para la estabilización de la formulación no para el aumento del efecto.

20 Se ha encontrado ahora de forma completamente sorprendente que se puede aumentar claramente el efecto de insecticidas y/o acaricidas y/o herbicidas de la clase de derivados de ácido tetrámico sustituidos con trifluorometoxi-fenilo de fórmula (I) mediante la adición de sales de amonio o de fosfonio a la solución de aplicación o mediante la incorporación de estas sales a una formulación que contiene derivados de ácido tetrámico sustituidos con trifluorometoxi-fenilo de fórmula (I). Por tanto, es objeto de la presente invención el uso de sales de amonio o de fosfonio para el aumento del efecto de agentes plaguicidas, que contienen derivados de ácido tetrámico sustituidos con trifluorometoxi-fenilo de fórmula (I) de efecto herbicida y/o insecticida y/o acaricida como principio activo. Son igualmente objeto de la invención agentes que contienen derivados de ácido tetrámico sustituidos con trifluorometoxi-fenilo de fórmula (I) de efecto herbicida y/o acaricida y/o insecticida y las sales de amonio o de fosfonio que aumentan el efecto y en concreto tanto principios activos formulados como también agentes listos para uso (caldos de pulverización). Es objeto de la invención finalmente además el uso de estos agentes para combatir insectos parasitarios y/o tetraníquidos y/o vegetación no deseada.

Los compuestos de fórmula (I) poseen un amplio efecto insecticida y/o acaricida y/o herbicida, que particularmente no deja nada que desear en cuanto a efecto y/o tolerancia por las plantas. No obstante, estas propiedades se pueden mejorar con la adición de sales de amonio o de fosfonio completa o parcialmente.

35 Los principios activos se pueden usar en las composiciones de acuerdo con la invención en un amplio intervalo de concentración. A este respecto la concentración de los principios activos en la formulación es normalmente de 0,1 a 50 % en peso.

40 Las sales de amonio y de fosfonio que de acuerdo con la invención aumentan el efecto de productos fitosanitarios que contienen principio activo de la clase de derivados de ácido tetrámico sustituidos con trifluorometoxi-fenilo de fórmula (I), se definen con la fórmula (III')



en la que

D representa nitrógeno o fósforo,

D representa preferentemente nitrógeno,

45 R^{26} , R^{27} , R^{28} y R^{29} representan independientemente unos de otros hidrógeno o alquilo C_1-C_8 respectivamente dado el caso sustituido o alquileno C_1-C_8 una o más veces insaturado, dado el caso sustituido, en donde los sustituyentes se pueden seleccionar de halógeno, nitro y ciano,

R²⁶, R²⁷, R²⁸ y R²⁹ representan preferentemente independientemente unos de otros hidrógeno o alquilo C₁-C₄ respectivamente dado el caso sustituido, en donde los sustituyentes se pueden seleccionar de halógeno, nitro y ciano,

5 R²⁶, R²⁷, R²⁸ y R²⁹ representan con especial preferencia independientemente unos de otros hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, n-butilo, iso-butilo, sec-butilo o *terc*-butilo,

R²⁶, R²⁷, R²⁸ y R²⁹ representan con muy especial preferencia hidrógeno,

n representa 1, 2, 3 ó 4,

n representa preferentemente 1 ó 2,

R³⁰ representa un anión inorgánico u orgánico,

10 R³⁰ representa preferentemente hidrogenocarbonato, tetraborato, fluoruro, bromuro, yoduro, cloruro, monohidrogenofosfato, dihidrogenofosfato, hidrogenosulfato, tartrato, sulfato, nitrato, tiosulfato, tiocianato, formiato, lactato, acetato, propionato, butirato, pentanoato u oxalato,

R³⁰ representa con especial preferencia lactato, sulfato, nitrato, tiosulfato, oxalato o formiato,

R³⁰ representa con muy especial preferencia sulfato.

15 Se enumeran en la siguiente tabla combinaciones destacables de acuerdo con la invención de principio activo, sal y promotor de la penetración. A este respecto "según ensayo" significa que cada compuesto es adecuado cuando en el ensayo de la penetración en cutícula (Baur y col., 1997, *Pesticide Science* 51, 131 a 152) actúa como promotor de la penetración.

20 Las sales de amonio y de fosfonio de fórmula (III') se pueden usar en un amplio intervalo de concentración para el aumento del efecto de productos fitosanitarios que contienen derivados de ácido tetrámico sustituido con trifluorometoxi-fenilo de fórmula (I). En general se usan las sales de amonio o de fosfonio en productos fitosanitarios listos para uso en una concentración de 0,5 a 80 mmol/l, preferentemente de 0,75 a 37,5 mmol/l, con especial preferencia de 1,5 a 25 mmol/l. En el caso de un producto formulado se selecciona la concentración de sal de amonio y/o de fosfonio en la formulación de modo que se encuentre tras dilución de la formulación en la
25 concentración de principio activo deseada en estos intervalos generales dados, preferentes o especialmente preferentes. La concentración de la sal en la formulación se encuentra normalmente a este respecto en 1 a 50 % en peso.

30 En una forma de realización preferente de la invención se añade a los productos fitosanitarios para el aumento del efecto no sólo una sal de amonio y/o de fosfonio, sino adicionalmente un promotor de la penetración. Se señala como completamente sorprendente que se observa propiamente en estos casos un aumento del efecto aún más profundo. Por tanto, es igualmente objeto de la presente invención el uso de una combinación de promotores de la penetración y sales de amonio y/o de fosfonio para el aumento del efecto de productos fitosanitarios, que contienen derivados de ácido tetrámico sustituido con trifluorometoxi-fenilo de fórmula (I) de efecto insecticida como principio
35 activo. Son igualmente objeto de la invención agentes que contienen derivados de ácido tetrámico sustituido con trifluorometoxi-fenilo de fórmula (I) de efecto herbicida y/o acaricida y/o insecticida, promotores de la penetración y sales de amonio y/o de fosfonio y en concreto tanto principios activos formulados como también agentes listos para uso (caldos de pulverización). Finalmente es además objeto de la invención el uso de estos agentes para el control de insectos dañinos y/o ácaros araña.

40 Como promotores de la penetración se tienen en cuenta en relación a la presente todas aquellas sustancias que se usan normalmente para mejorar la penetración de principios activos agroquímicos en plantas. A este respecto se definen promotores de la penetración porque penetran desde los caldos de pulverización acuosos y/o desde la capa de pulverización en la cutícula de las plantas y con ello pueden aumentar la migración de sustancias (movilidad) de principios activos en la cutícula. Se pueden usar los procedimientos descritos en la bibliografía (Baur y col., 1997, *Pesticide Science* 51, 131 a 152) para la determinación de estas propiedades.

45 Como promotores de la penetración se tienen en cuenta, por ejemplo, alcoxilatos de alcohol. De acuerdo con la invención son promotores de la penetración alcoxilatos de alcohol de fórmula (IV')



en la que

R representa alquilo de cadena lineal o ramificada con 4 a 20 átomos de carbono,

50 R' representa hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, n-butilo, i-butilo, t-butilo, n-pentilo o n-hexilo,

AO representa un resto de óxido de etileno, un resto de óxido de propileno, un resto de óxido de butileno, o mezclas de restos de óxido de etileno y óxido de propileno o restos de óxido de butileno y

v representa números de 2 a 30.

Un grupo preferente de promotores de la penetración son alcoxilatos de alcohol de fórmula



en la que

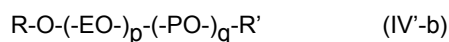
R tiene el significado dado anteriormente,

R' tiene el significado dado anteriormente,

EO representa $-CH_2-CH_2-O-$ y

10 n representa números de 2 a 20.

Un grupo adicional preferente de promotores de la penetración son alcoxilatos de alcohol de fórmula

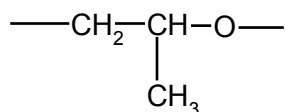


en la que

R tiene el significado dado anteriormente,

15 R' tiene el significado dado anteriormente,

EO representa $-CH_2-CH_2-O-$,

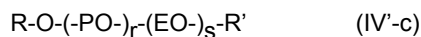


PO representa ,

p representa números de 1 a 10 y

q representa números de 1 a 10.

20 Un grupo preferente adicional de promotores de la penetración son alcoxilatos de alcohol de fórmula

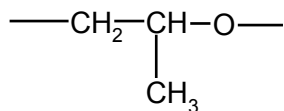


en la que

R tiene el significado dado anteriormente,

R' tiene el significado dado anteriormente,

25 EO representa $-CH_2-CH_2-O-$,



PO representa ,

r representa números de 1 a 10 y

s representa números de 1 a 10.

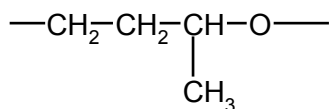
Un grupo preferente adicional de promotores de la penetración son alcoxilatos de alcohol de fórmula



en la que

R y R' tienen los significados dados anteriormente,

EO representa $-CH_2-CH_2-O-$,



BO representa ,

p representa números de 1 a 10 y

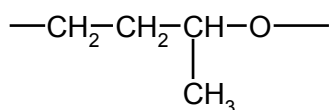
q representa números de 1 a 10.

Un grupo preferente adicional de promotores de la penetración son alcoxilatos de alcohol de fórmula



en la que

R y R' tienen los significados dados anteriormente,



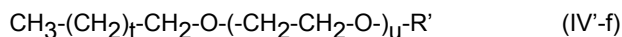
BO representa ,

EO representa $\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-O-}$,

10 r representa números de 1 a 10 y

s representa números de 1 a 10.

Un grupo preferente adicional de promotores de la penetración son alcoxilatos de alcohol de fórmula



en la que

15 R' tiene el significado dado anteriormente,

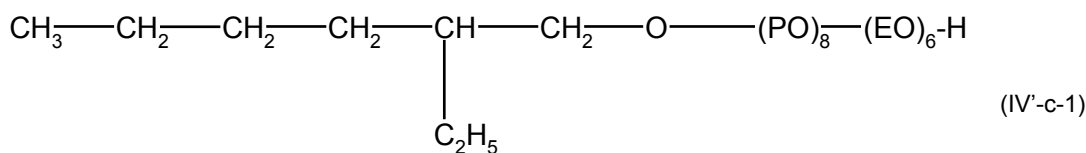
t representa números de 8 a 13

u representa números de 6 a 17.

En las fórmulas dadas previamente representan

20 R preferentemente butilo, i-butilo, n-pentilo, i-pentilo, neopentilo, n-hexilo, i-hexilo, n-octilo, i-octilo, 2-etil-hexilo, nonilo, i-nonilo, decilo, n-dodecilo, i-dodecilo, laurilo, miristilo, i-tridecilo, trimetil-nonilo, palmitilo, estearilo o eicosilo.

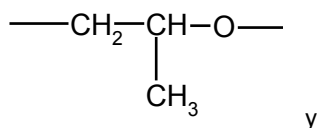
Como ejemplo para un alcoxilato de alcohol de fórmula (IV'-c) se menciona alcoxilato de 2-etil-hexilo de fórmula



en la que

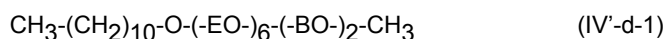
EO representa $\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-O-}$,

25 PO representa



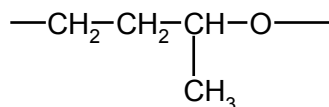
los números 8 y 6 representan valores promedio.

Como ejemplo de un alcoxilato de alcohol de fórmula (IV-d) se menciona la fórmula



en la que

EO representa $\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-O-}$,



BO representa y

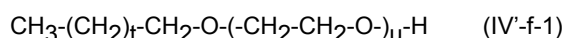
los números 10, 6 y 2 representan valores promedio.

5 Alcoxilatos de alcohol de fórmula (IV'-f) especialmente preferentes son compuestos de esta fórmula, en la que

t representa números de 9 a 12 y

u representa números de 7 a 9.

Es de mencionar con muy especial preferencia alcoxilato de alcohol de fórmula (IV'-f-1)



10 en la que

t representa el valor promedio 10,5 y

u representa el valor promedio 8,4.

Los alcoxilatos de alcohol se definen en general mediante las fórmulas anteriores. En cuanto a estas sustancias se trata de mezclas de sustancias del tipo dado con distintas longitudes de cadena. Para los índices se calculan por tanto valores promedio que se puede fluctuar también de números enteros.

15 Los alcoxilatos de alcohol de fórmulas dadas son conocidos y se pueden obtener en parte comercialmente o se pueden preparar según procedimientos conocidos (véanse los documentos WO 98-35 553, WO 00-35 278 y EP-A 0 681 865).

20 Como promotores de la penetración también se tienen en cuenta, por ejemplo, sustancias que favorecen la solubilidad de los compuestos de fórmula (I) en el capa de pulverización. A estos pertenecen, por ejemplo, aceites minerales o vegetales. Como aceites se consideran todos los aceites minerales o vegetales –dado el caso modificados- que se pueden usar normalmente en agentes agroquímicos. Se pueden mencionar a título de ejemplo aceite de girasol, aceite de colza, aceite de oliva, aceite de ricino, aceite de nabina, aceite de semilla de maíz, aceite de semilla de algodón y aceite de haba de soja o los ésteres de los aceites mencionados. Son preferentes aceite de colza, aceite de girasol y sus ésteres metílicos o etílicos.

25 La concentración de promotor de la penetración puede variar en los agentes de acuerdo con la invención en un amplio intervalo. En un producto fitosanitario formulado se encuentra este en general de 1 a 95 % en peso, preferentemente de 1 a 55 % en peso, con especial preferencia de 15 a 40 % en peso. En los agentes listos para usar (caldos de pulverización) se encuentra la concentración en general entre 0,1 y 10 g/l, preferentemente entre 0,5 y 5 g/l.

Agentes plaguicidas de acuerdo con la invención pueden contener también otros componentes, por ejemplo, tensioactivos o coadyuvantes de dispersión o emulsionantes.

35 Como tensioactivos no iónicos o coadyuvantes de dispersión se tienen en cuenta todas las sustancias de este tipo que se pueden usar normalmente en agentes agroquímicos. Preferentemente son de mencionar copolímeros de bloque de poli(óxido de etileno)-poli(óxido de propileno), polietilenglicoléteres de alcoholes lineales, productos de reacción de ácidos grasos con óxido de etileno y/o óxido de propileno, además de poli(alcohol vinílico), polivinilpirrolidona, polimerizados mixtos de poli(alcohol vinílico) y polivinilpirrolidona así como copolimerizados de ácido (met)acrílico y ésteres de ácido (met)acrílico, además de etoxilatos de alquilo y etoxilatos de alquilarilo, que dado el caso se pueden fosfatar y dado el caso neutralizar con bases, en donde son de mencionar a título de ejemplo etoxilatos de sorbitol, así como derivados de polioxialquilenamina.

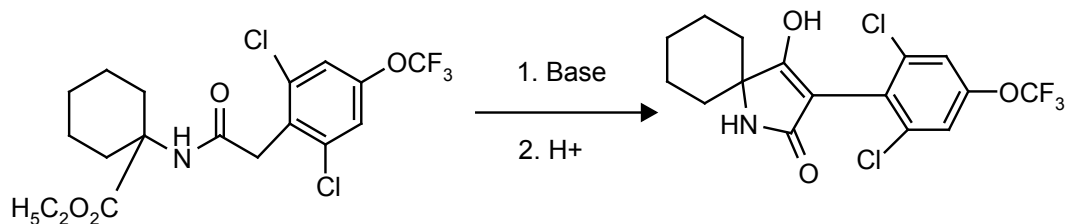
40 Como tensioactivos aniónicos se consideran normalmente todas las sustancias de este tipo que se pueden usar normalmente en agentes agroquímicos. Son preferentes sales de metal alcalino y alcalinotérreo de ácidos alquilsulfónicos o ácidos alquilarilsulfónicos.

45 Otro grupo preferente de tensioactivos aniónicos o coadyuvantes de dispersión son sales poco solubles en aceite vegetal de poli(ácidos estirensulfónicos), sales de poli(ácidos vinilsulfónicos), sales de productos de condensación de ácido naftalinsulfónico-formaldehído, sales de productos de condensación de ácido naftalinsulfónico, ácido fenolsulfónico y formaldehído así como sales de ácido ligninsulfónico.

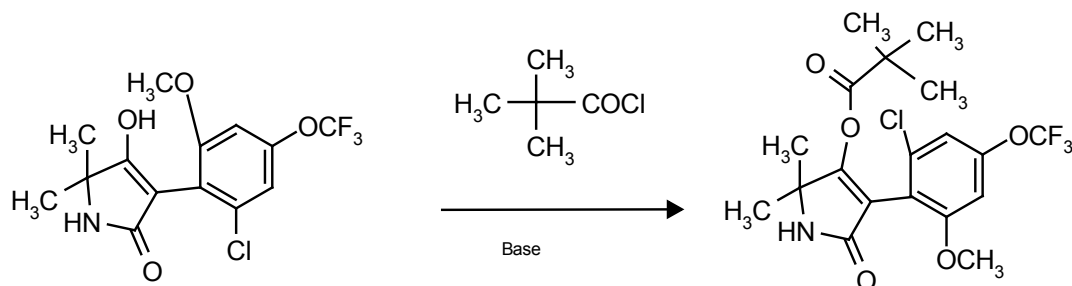
Como aditivos, que pueden estar contenidos en las formulaciones de acuerdo con la invención, se tienen en cuenta emulsionantes, agentes antiespumantes, agentes conservantes, antioxidantes, colorantes y materiales para carga inertes.

5 Los emulsionantes preferentes son nonilfenoles etoxilados, productos de reacción de alquilfenoles con óxido de etileno y/o óxido de propileno, arilalquilfenoles etoxilados, además de arilalquilfenoles etoxilados y propoxilados, así como etoxilatos o etoxipropoxilatos de alquilarilo sulfatados o fosfatados, en donde son de mencionar a título de ejemplo derivados de sorbitán, como poli(óxido de etileno) - éster de sorbitán y ácido graso y éster de sorbitán y ácido graso.

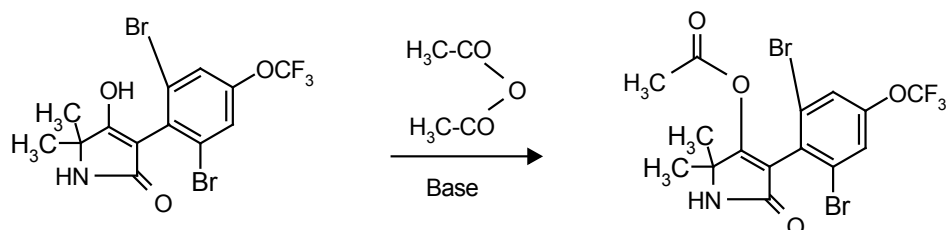
10 Si se usa por ejemplo según el procedimiento (A) éster etílico de ácido N-(2,6-dicloro-4-trifluorometoxi-fenilacetil)-1-amino-ciclohexan-carboxílico como sustancia de partida, entonces el desarrollo del procedimiento de acuerdo con la invención puede reproducirse mediante el siguiente esquema de reacción:



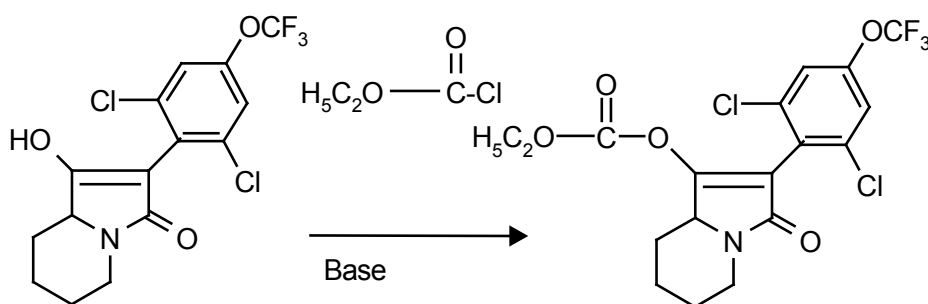
15 Si se usa por ejemplo según el procedimiento (B α) 3-(2-cloro-4-trifluorometoxi-6-metoxi-fenil)-5,5-dimetilpirrolidin-2,4-diona y cloruro de pivalóilo como sustancias de partida, entonces el desarrollo del procedimiento de acuerdo con la invención puede reproducirse mediante el siguiente esquema de reacción:



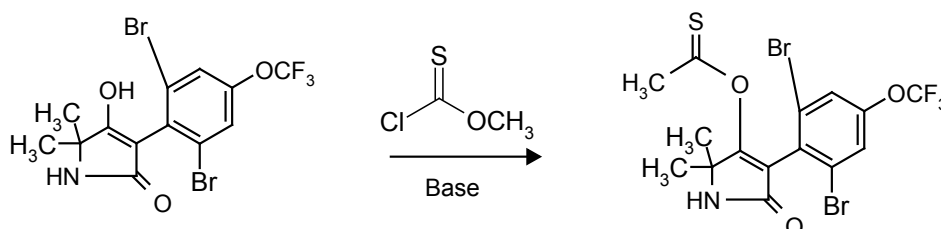
Si se usa por ejemplo según el procedimiento (B β) 3-(2,6-dibromo-4-trifluorometoxi-fenil)-5,5-dimetilpirrolidin-2,4-diona y acetanhidruro como compuestos de partida, entonces el desarrollo del procedimiento de acuerdo con la invención puede reproducirse mediante el siguiente esquema de reacción:



20 Si se usa por ejemplo según el procedimiento (C) 8-[(2,6-dicloro-4-trifluorometoxi-fenil)-1-aza-biciclo-(4,3,0^{1,6})-nonan-7,9-diona y éster etílico de ácido clorofórmico como compuestos de partida, entonces el desarrollo del procedimiento de acuerdo con la invención puede reproducirse mediante el siguiente esquema de reacción:

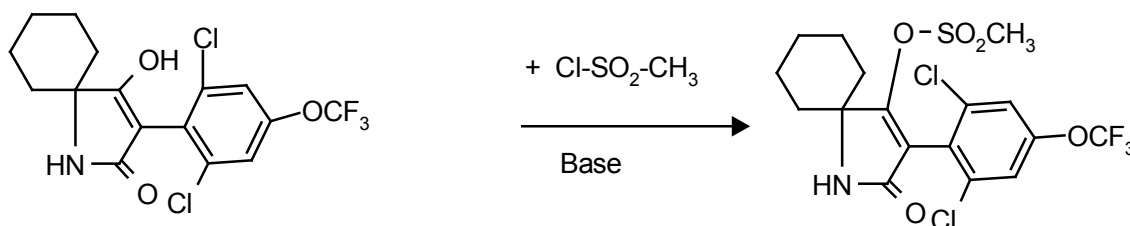


Si se usa por ejemplo según el procedimiento (D), 3-(2,6-dibromo-4-trifluorometoxi-fenil)-5,5-dimetil-6-pirrolidin-2,4-diona y éster metílico del ácido cloromonotiofórmico como productos de partida, entonces el desarrollo del procedimiento de acuerdo con la invención puede reproducirse mediante el siguiente esquema de reacción:

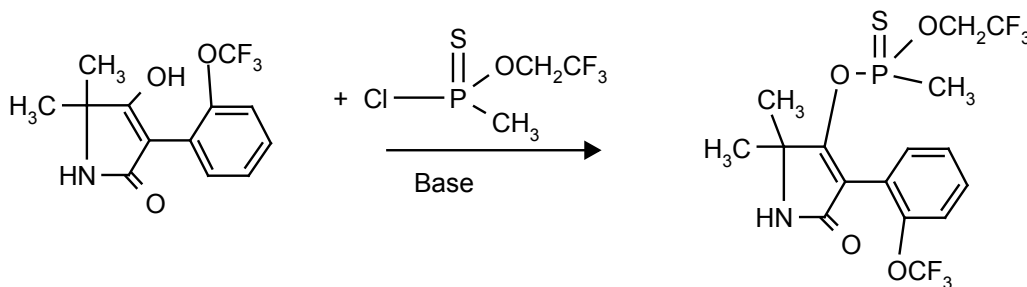


5

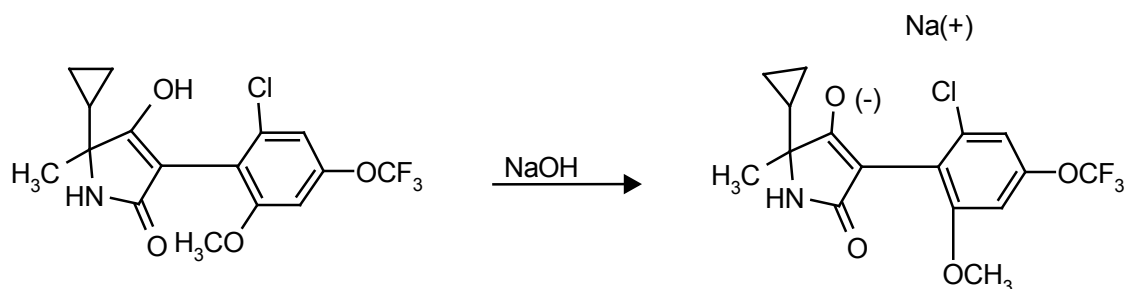
Si se usa por ejemplo según el procedimiento (E) 3-(2,6-dicloro-4-trifluorometoxi-fenil)-5,5-pentametil-6-pirrolidin-2,4-diona y cloruro de ácido metanosulfónico como producto de partida, entonces el desarrollo del procedimiento de acuerdo con la invención puede reproducirse mediante el siguiente esquema de reacción:



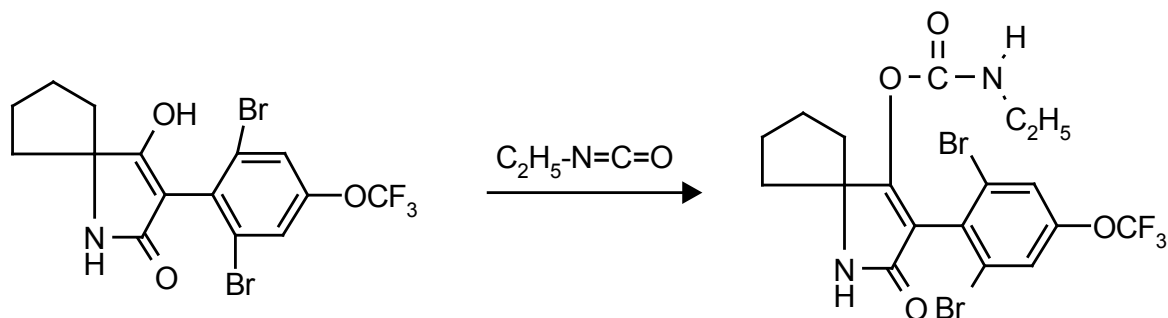
10 Si se usa por ejemplo según el procedimiento (F) 3-(2-trifluorometoxi-fenil)-5,5-dimetil-pirrolidin-2,4-diona y éster 2,2,2-trifluoroetílico del ácido metanotio-fosfónico como productos de partida, entonces el desarrollo del procedimiento de acuerdo con la invención puede reproducirse mediante el siguiente esquema de reacción:



15 Si se usa por ejemplo según el procedimiento (G) 3-(2-cloro-4-trifluorometoxi-6-metoxi-fenil)-5-ciclopropil-5-metil-pirrolidin-2,4-diona y NaOH como componentes, entonces el desarrollo del procedimiento de acuerdo con la invención puede reproducirse mediante el siguiente esquema de reacción:

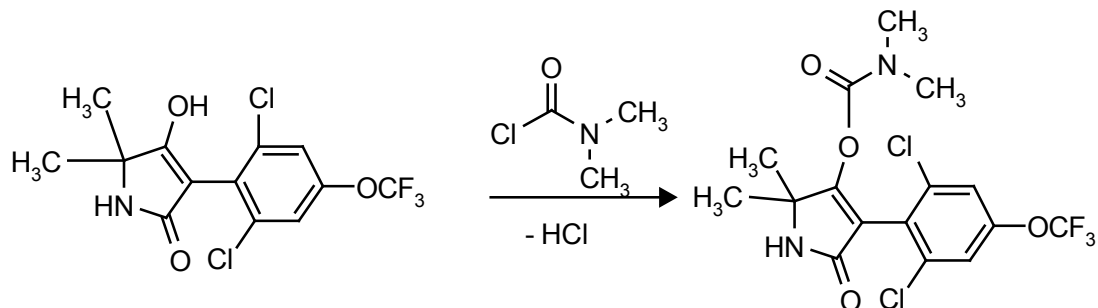


Si se usa por ejemplo según el procedimiento (H) 3-(2,6-dibromo-4-trifluorometoxi-fenil)-5,5-tetrametilen-pirrolidin-2,4-diona variante α e isocianato de etilo como productos de partida, entonces el desarrollo de la reacción puede reproducirse mediante el siguiente esquema de reacción:

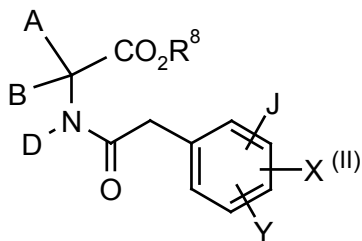


5

Si se usa por ejemplo según el procedimiento (H) 3-(2,6-dicloro-4-trifluorometoxi-fenil)-5,5-dimetil-pirrolidin-2,4-diona variante β y cloruro de ácido dimetilcarbámico como productos de partida, entonces el desarrollo de la reacción puede reproducirse mediante el siguiente esquema:



- 10 Los compuestos de fórmula (II) necesarios como sustancias de partida en el procedimiento (a) de acuerdo con la invención

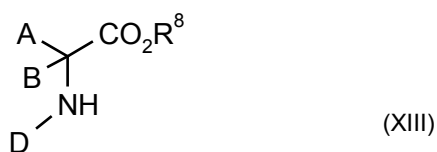


en la que

A, B, D, J, X, Y y R^8 tienen los significados dados anteriormente,

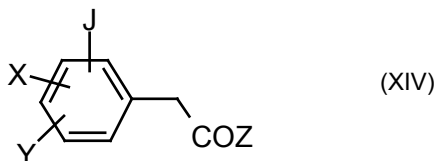
- 15 son nuevos.

Se obtienen los ésteres de acilaminoácido de fórmula (II), por ejemplo, si se acilan derivados de aminoácido de fórmula (XIII)



en la que

A, B, R⁸ y D tienen los significados dados anteriormente,
con derivados de ácido fenilacético sustituidos de fórmula (XIV)



5

en la que

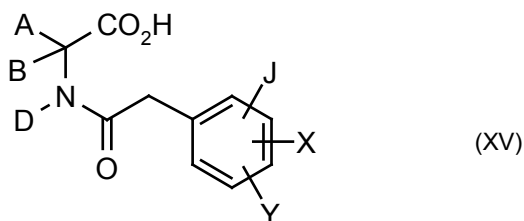
J, X e Y tienen los significados dados anteriormente y

Z representa un grupo saliente introducido mediante reactivos de activación de ácido carboxílico como carbonildiimidazol, carbonildiimidaz (como, por ejemplo, dicitohexilcarbodiimida), reactivos de fosforilación (como, por ejemplo, POCl₃, BOP-Cl), agentes de halogenación, por ejemplo, cloruro de tionilo, cloruro de oxalilo, fosgeno o ésteres de ácido clorofórmico,

10

(Chem. Reviews 52, 237-416 (1953); Bhattacharya, Indian J. Chem. 6, 341-5, 1968)

o si se esterifican ácidos acilamínicos de fórmula (XV)

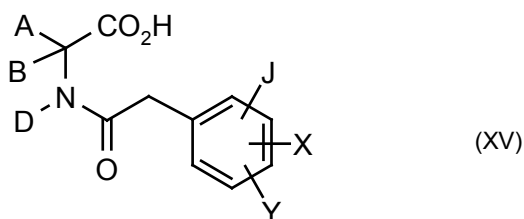


15 en la que

A, B, D, J, X e Y tienen los significados dados anteriormente,

(Chem. Ind. (Londres) 1568 (1968)).

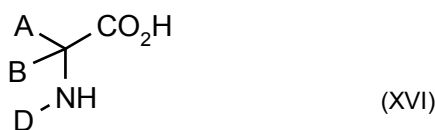
Los compuestos de fórmula (XV)



20 en la que

A, B, D, J, X e Y tienen los significados dados anteriormente,
son nuevos.

Se obtienen los compuestos de fórmula (XV) si se acilan aminoácidos de fórmula (XVI)



en la que

A, B y D tienen los significados dados anteriormente,

con derivados de ácido fenilacético sustituidos de fórmula (XIV)



5

en la que

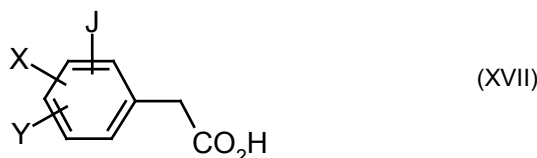
J, X e Y tienen los significados dados anteriormente y

Z tiene el significado dado anteriormente,

10 por ejemplo según Schotten-Baumann (Organikum, VEB Deutscher Verlag der Wissenschaften, Berlín 1977, página 505).

Los compuestos de fórmula (XIV) son nuevos. Estos se pueden sintetizar según procedimientos en principio conocidos y cómo se representa en los ejemplos (véase, por ejemplo, H. Henecka, Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, tomo 8, página 467 a 469 (1952)).

15 Se obtienen los compuestos de fórmula (XIV), por ejemplo, si se hacen reaccionar ácidos fenilacéticos de fórmula (XVII)



en la que

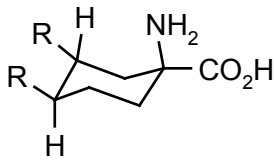
J, X e Y tienen los significados dados anteriormente,

20 con agentes halogenantes (por ejemplo, cloruro de tionilo, bromuro de tionilo, cloruro de oxalilo, fosgeno, tricloruro de fósforo, tribromuro de fósforo o pentacloruro de fósforo), reactivos de fosforilación como (por ejemplo, POCl₃, BOP-Cl), carbonildiimidazol, carbonildiimidas (por ejemplo, dicitohexilcarbonildiimida) dado el caso en presencia de un diluyente (por ejemplo, hidrocarburos alifáticos o aromáticos dado el caso clorados como tolueno o cloruro de metileno o éteres, por ejemplo, tetrahidrofurano, dioxano, metil-terc-butiléter) a temperaturas de -20 °C a 150 °C, preferentemente de -10 °C a 100 °C.

25 Los compuestos de fórmula (XVII) se pueden adquirir en parte comercialmente. Los nuevos compuestos de fórmula (XVII) se describen en la parte experimental o se pueden preparar según procedimientos conocidos de las solicitudes citadas al comienzo.

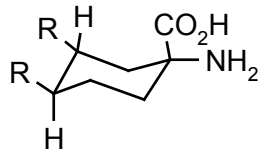
30 Los compuestos de fórmulas (XIII) y (XVI) son parcialmente conocidos y/o se pueden sintetizar según procedimientos conocidos (véase, por ejemplo, Compagnon, Miocque Ann. Chim. (París) [14] 5, páginas 11-22, 23-27 (1970)).

35 Los ácidos aminocarboxílicos cíclicos sustituidos de fórmula (XVI) en la que A y B forman un anillo se obtienen en general según la síntesis de Bucherer-Bergs o según la síntesis de Strecker y se generan a este respecto en distintas formas isoméricas. De este modo se obtiene en las condiciones de la síntesis de Bucherer-Bergs sobre todo los isómeros (en lo sucesivo por motivos de simplicidad designados como β), en los que los restos R y el grupo carboxilo son ecuatoriales, mientras que en las condiciones de la síntesis de Strecker se generan sobre todo los isómeros (en lo sucesivo por motivos de simplicidad designados como α), en los que el grupo amino y el resto R son ecuatoriales.



Síntesis de Bucherer-Bergs

(Isómero β)

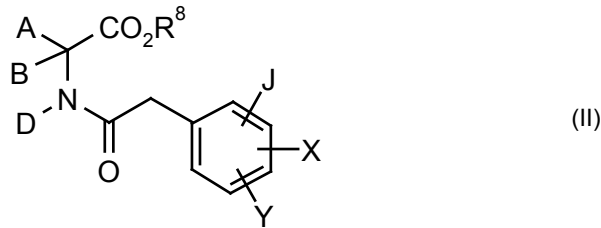


Síntesis de Strecker

(Isómero α)

(L. Munday, J. Chem. Soc. 4372 (1961); J.T. Eward, C. Jitrangeri, Can. J. Chem. 53, 3339 (1975).

5 Además se pueden preparar las sustancias de partida de fórmula (II) usadas en el procedimiento (A) anterior



en la que

A, B, D, J, X, Y y R^8 tienen los significados dados anteriormente,

si se hacen reaccionar aminonitrilos de fórmula (XVIII)



10

en la que

A, B y D tienen los significados dados anteriormente,

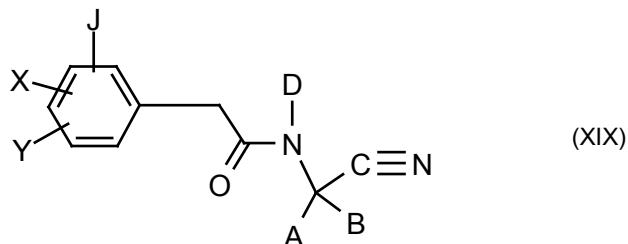
con derivados de ácido fenilacético sustituido de fórmula (XIV)



15 en la que

J, X, Y y Z tienen los significados dados anteriormente,

dando compuestos de fórmula (XIX)



en la que

A, B, D, J, X e Y tienen los significados dados anteriormente,

y estos se someten a continuación a una alcoholólisis ácida.

Los compuestos de fórmula (XIX) son igualmente nuevos.

5 Los halogenuros de ácido de fórmula (III), anhídridos de ácido carboxílico de fórmula (IV), ésteres de ácido clorofórmico o tioésteres de ácido clorofórmico de fórmula (V), ésteres de ácido cloromonotiofórmico o ésteres de ácido cloroditiofórmico de fórmula (VI), cloruros de ácido sulfónico de fórmula (VII), compuestos de fósforo de fórmula (VIII) e hidróxidos de metal, alcóxidos de metal o aminas de fórmula (IX) y (X) e isocianatos de fórmula (XI) y cloruros de ácido carbámico de fórmula (XII) necesarios además como sustancias de partida para la realización de los procedimientos (B), (C), (D), (E), (F), (G) y (H) de acuerdo con la invención son compuestos por lo general conocidos de la química orgánica o inorgánica.

Los compuestos de fórmulas (XIII), (XVI) y (XVIII) son además conocidos de las solicitudes de patentes citadas al comienzo y/o se pueden preparar según procedimientos ahí indicados.

El procedimiento (A) se caracteriza porque se somete a una condensación intramolecular compuestos de fórmula (II), en la que A, B, D, J, X, Y y R⁸ tienen los significados dados anteriormente, en presencia de una base.

15 Como diluyentes se pueden usar en el procedimiento (A) de acuerdo con la invención todos los disolventes orgánicos inertes. Se puede usar preferentemente hidrocarburos como tolueno y xileno, además éteres como dibutiléter, tetrahidrofurano, dioxano, glicoldimetiléter y diglicoldimetiléter, además disolventes polares como dimetilsulfóxido, sulfolano, dimetilformamida y N-metilpirrolidona, así como alcoholes como metanol, etanol, propanol, isopropanol, butanol, isobutanol, *terc*-butanol.

20 Como base (agente de desprotonación) se pueden usar en la realización del procedimiento (A) de acuerdo con la invención todos los aceptores de protones habituales. Se usan preferentemente óxidos, hidróxidos y carbonatos de metales alcalinos y metales alcalinotérreos como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, óxido de magnesio, óxido de calcio, carbonato de sodio, carbonato de potasio y carbonato de calcio, que también se pueden usar en presencia de catalizadores de transferencia de fase como, por ejemplo, cloruro de trietilbencilamonio, bromuro de tetrabutilamonio, Adogen 464 (= cloruro de metiltrialquil (C₈-C₁₀)amonio) o TDA 1 (= tris-(metoxietoxietil)-amina). Además se pueden usar metales alcalinos como sodio o potasio. Además se usan amidas e hidruros de metales alcalinos y alcalinotérreos, como amida sódica, hidruro de sodio e hidruro de calcio, y además también alcoholatos de metales alcalinos, como metilato de sodio, etilato de sodio y *terc*-butilato de potasio.

30 Las temperaturas de reacción pueden variar en la realización del procedimiento (A) de acuerdo con la invención dentro de un amplio intervalo. En general se trabaja a temperaturas entre 0 °C y 250 °C, preferentemente entre 50 °C y 150 °C.

El procedimiento (A) de acuerdo con la invención se lleva a cabo en general a presión normal.

35 En la realización del procedimiento (A) de acuerdo con la invención se usa los componentes de reacción de fórmula (II) y las bases desprotonantes en general en cantidades aproximadamente doblemente equimolares. Sin embargo, también es posible usar uno u otro componente en un gran exceso (hasta 3 mol).

El procedimiento (B-□) se caracteriza porque se hacen reaccionar compuestos de fórmula (I-a) con halogenuros de ácido carboxílico de fórmula (III), dado el caso en presencia de un diluyente y dado el caso en presencia de un ligante de ácido.

40 Como diluyentes se pueden usar en el procedimiento (B-α) de acuerdo con la invención todos los disolventes inertes frente a los halogenuros de ácido. Preferentemente se usan hidrocarburos como bencina, benceno, tolueno, xileno y tetralina, además de hidrocarburos halogenados, como cloruro de metileno, cloroformo, tetracloruro de carbono, clorobenceno y *o*-diclorobenceno, además de cetonas, como acetona y metilisopropilcetona, además de éteres como dietiléter, tetrahidrofurano y dioxano, además de ésteres de ácido carboxílico, como acetato de etilo y también disolventes fuertemente polares, como dimetilsulfóxido y sulfolano. Si la estabilidad frente a la hidrólisis del halogenuro de ácido lo permite se puede llevar a cabo la reacción también en presencia de agua.

45 Como ligantes de ácidos se tienen en cuenta en la reacción según el procedimiento (B-α) de acuerdo con la invención todos los aceptores de ácido habituales. Preferentemente se usan aminas terciarias, como trietilamina, piridina, diazabicciclooctano (DABCO), diazabiccicoundeceno (DBU), diazabicciclononas (DBN), base de Hünig y N,N-dimetilanilina, además de óxidos de metales alcalinotérreos, como óxido de magnesio y de calcio, además de carbonatos de metal alcalino y alcalinotérreo, como carbonato de sodio, carbonato de potasio y carbonato de calcio así como hidróxidos alcalinos como hidróxido de sodio e hidróxido de potasio.

50 Las temperaturas de reacción pueden variar en el procedimiento (B-α) de acuerdo con la invención dentro de un amplio intervalo. En general se trabaja a temperaturas entre -20 °C y +150 °C, preferentemente entre 0 °C y 100 °C.

En la realización del procedimiento (B- α) de acuerdo con la invención se usan las sustancias de partida de fórmula (I-a) y el halogenuro de ácido carboxílico de fórmula (III) en general en cantidades aproximadamente equivalentes. Sin embargo también es posible usar el halogenuro de ácido carboxílico en un gran exceso (hasta 5 mol). El procesamiento se realiza según procedimientos habituales.

- 5 El procedimiento (B- β) se caracteriza porque se hacen reaccionar compuestos de fórmula (I- α) con anhídridos de ácido carboxílico de fórmula (IV) dado el caso en presencia de un diluyente y dado el caso en presencia de un ligante de ácido.

10 Como diluyentes se pueden usar en el procedimiento (B- β) de acuerdo con la invención preferentemente aquellos diluyentes que se tienen en cuenta en el uso de halogenuros de ácido. Adicionalmente puede servir también un anhídrido de ácido carboxílico usado en exceso al mismo tiempo como diluyente.

Como ligantes de ácidos dado el caso añadidos se tienen en cuenta en el procedimiento (B- β) preferentemente aquellos ligantes de ácidos que también se tienen en cuenta preferentemente en el uso de halogenuros de ácido.

15 Las temperaturas de reacción pueden variar en la realización del procedimiento (B- β) de acuerdo con la invención dentro de un amplio intervalo. En general se trabaja a temperaturas entre -20 °C y +150 °C, preferentemente entre 0 °C y 100 °C.

En la realización del procedimiento (B- β) de acuerdo con la invención se usan las sustancias de partida de fórmula (I-a) y el anhídrido de ácido carboxílico de fórmula (IV) en general en cantidades aproximadamente equivalentes. Sin embargo también es posible usar el anhídrido de ácido carboxílico en un gran exceso (hasta 5 mol). El procesamiento se realiza según procedimientos habituales.

- 20 En general se procede de modo que el diluyente y anhídrido de ácido carboxílico presente en exceso así como el ácido carboxílico generado se separan por destilación o mediante lavado con un disolvente orgánico o con agua.

El procedimiento (C) se caracteriza porque se hacen reaccionar compuestos de fórmula (I-a) con ésteres de ácido clorofórmico o tioletéres de ácido clorofórmico de fórmula (V) dado el caso en presencia de un diluyente y dado el caso en presencia de un ligante de ácido.

- 25 Como ligantes de ácidos se tienen en cuenta en la reacción según el procedimiento (C) de acuerdo con la invención todos los aceptores de ácido habituales. Preferentemente se usan aminas terciarias como trietilamina, piridina, DABCO, DBU, DBA, base de Hünig y N,N-dimetil-anilina, además de óxidos de metal alcalinotérreo como óxido de magnesio y de calcio, además de carbonatos de metal alcalino y alcalinotérreo, como carbonato de sodio, carbonato de potasio y carbonato de calcio así como hidróxidos alcalinos, como hidróxido de sodio e hidróxido de potasio.

- 30 Como diluyentes se pueden usar en el procedimiento (C) de acuerdo con la invención todos los disolventes inertes frente a ésteres de ácido clorofórmico o tioletéres de ácido clorofórmico. Preferentemente se usan hidrocarburos como bencina, benceno, tolueno, xileno y tetralina, además de hidrocarburos halogenados, como cloruro de metileno, cloroformo, tetracloruro de carbono, clorobenceno y o-diclorobenceno, además de cetonas, como acetona y metilisopropilcetona, además de éteres como dietiléter, tetrahidrofurano y dioxano, además de ésteres de ácido carboxílico, como acetato de etilo y también disolventes fuertemente polares, como dimetilsulfóxido y sulfolano.

35 Las temperaturas de reacción pueden variar en la realización del procedimiento (C) de acuerdo con la invención dentro de un amplio intervalo. Se trabaja en presencia de un diluyente y de un ligante de ácido, de modo que la temperaturas de reacción se encuentran en general entre -20 °C y +100 °C, preferentemente entre 0 °C y 50 °C.

El procedimiento (C) de acuerdo con la invención se lleva a cabo en general a presión normal.

- 40 En la realización del procedimiento (C) de acuerdo con la invención se usan las sustancias de partida de fórmula (I-a) y los ésteres de ácido clorofórmico o tioletéres de ácido clorofórmico de fórmula (V) correspondientes en general en cantidades aproximadamente equivalentes. Sin embargo también es posible usar uno u otro componente en un gran exceso (hasta 2 mol). El procesamiento se realiza según procedimientos habituales. En general se procede de modo que se separan las sales precipitadas y se concentra la mezcla de reacción que queda mediante eliminación del disolvente.

45 El procedimiento (D) de acuerdo con la invención se caracteriza porque se hacen reaccionar compuestos de fórmula (I-a) con compuestos de fórmula (VI) en presencia de un diluyente y dado el caso en presencia de un ligante de ácido.

- 50 En el procedimiento de preparación (D) se hace reaccionar por mol de compuesto de partida de fórmula (I-a) aproximadamente 1 mol de éster de ácido cloromonotiofórmico o éster de ácido cloroditiofórmico de fórmula (VI) de 0 a 120 °C, preferentemente de 20 a 60 °C.

Como diluyentes dado el caso añadidos se tienen en cuenta todos los disolventes orgánicos polares inertes, como éteres, amidas, sulfonas, sulfóxidos, pero también haloalcanos.

Preferentemente se usan dimetilsulfóxido, tetrahidrofurano, dimetilformamida o cloruro de metileno.

Si se sintetiza en una forma de realización preferente mediante adición de agentes desprotonantes fuertes como, por ejemplo, hidruro de sodio o terc-butilato de potasio la sal enolato de los compuestos (I-a), se puede prescindir de la adición de ligantes de ácidos.

- 5 Si se usan ligantes de ácidos se tienen en cuenta bases inorgánicas u orgánicas habituales, son de citar a modo de ejemplo hidróxido de sodio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, piridina, trietilamina.

La reacción se puede realizar a presión normal o a presión elevada, preferentemente se trabaja a presión normal. El procesamiento se lleva a cabo según procedimientos habituales.

- 10 El procedimiento (E) de acuerdo con la invención se caracteriza porque se hacen reaccionar compuestos de fórmula (I-a) con cloruros de ácido sulfónico de fórmula (VII), dado el caso en presencia de un diluyente y dado el caso en presencia de un ligante de ácido.

En el procedimiento de preparación (E) se hace reaccionar por mol de compuesto de partida de fórmula (I-a) aproximadamente 1 mol de cloruro de ácido sulfónico de fórmula (VII) de -20 a 150 °C, preferentemente de 20 a 70 °C.

- 15 Como diluyentes dado el caso añadidos se tienen en cuenta todos los disolventes orgánicos polares inertes, como éteres, amidas, nitrilos, sulfonas, sulfóxidos o hidrocarburos halogenados como cloruro de metileno.

Preferentemente se usan dimetilsulfóxido, tetrahidrofurano, dimetilformamida, cloruro de metileno.

- 20 Si se sintetiza en una forma de realización preferente mediante adición de agentes desprotonantes fuertes (como, por ejemplo, hidruro de sodio o terc-butilato de potasio) la sal enolato de los compuestos (I-a), se puede prescindir de la adición de ligantes de ácidos.

Si se usan ligantes de ácidos se tienen en cuenta bases inorgánicas u orgánicas habituales, son de citar a modo de ejemplo hidróxido de sodio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, piridina, trietilamina.

La reacción se puede realizar a presión normal o a presión elevada, preferentemente se trabaja a presión normal. El procesamiento se lleva a cabo según procedimientos habituales.

- 25 El procedimiento (F) de acuerdo con la invención se caracteriza porque se hacen reaccionar compuestos de fórmula (I-a) con compuestos de fósforo de fórmula (VIII), dado el caso en presencia de un diluyente y dado el caso en presencia de un ligante de ácido.

- 30 En el procedimiento de preparación (F) se hace reaccionar para la obtención de compuestos de fórmula (I-e) por mol de los compuestos (I-a), de 1 a 2, preferentemente de 1 a 1,3 mol del compuesto de fósforo de fórmula (VIII) a temperaturas entre -40 y 150 °C, preferentemente entre -10 y 110 °C.

Como diluyentes dado el caso añadidos se tienen en cuenta todos los disolventes orgánicos polares inertes como éteres, amidas, nitrilos, alcoholes, sulfuros, sulfonas, sulfóxidos, etc.

Preferentemente se usan acetonitrilo, dimetilsulfóxido, tetrahidrofurano, dimetilformamida, cloruro de metileno.

- 35 Como ligantes de ácidos dado el caso añadidos se tienen en cuenta bases inorgánicas u orgánicas habituales, como hidróxidos, carbonatos o aminas. Son de citar a modo de ejemplo hidróxido de sodio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, piridina, trietilamina.

- 40 La reacción se puede llevar a cabo a presión normal o a presión elevada, preferentemente se trabaja a presión normal. El procesamiento se realiza según procedimientos habituales de la química orgánica. La purificación de los productos finales obtenidos se realiza preferentemente mediante cristalización, purificación cromatográfica o por la denominada "destilación incipiente", es decir separación de los componentes volátiles a vacío.

El procedimiento (G) se caracteriza porque se hacen reaccionar compuestos de fórmula (I-a) con hidróxidos metálicos o alcóxidos metálicos (IX) o aminas de fórmula (X), dado el caso en presencia de un diluyente.

Como diluyentes se pueden usar en el procedimiento (G) de acuerdo con la invención preferentemente éteres como tetrahidrofurano, dioxano, dietiléter, o bien alcoholes como metanol, etanol, isopropanol, pero también agua.

- 45 El procedimiento (G) de acuerdo con la invención se lleva a cabo en general a presión normal.

Las temperaturas de reacción se encuentran en general entre -20 °C y 100 °C, preferentemente entre 0 °C y 50 °C.

El procedimiento (H) de acuerdo con la invención se caracteriza porque se hacen reaccionar compuestos de fórmula (I-a) con (H- α) compuestos de fórmula (XI), dado el caso en presencia de un diluyente y dado el caso en presencia

de un catalizador o (H-β) con compuestos de fórmula (XII), dado el caso en presencia de un diluyente y dado el caso en presencia de un ligante de ácido.

En el procedimiento de preparación (H-α) se hace reaccionar por mol de compuesto de partida de fórmula (I-a) aproximadamente 1 mol de isocianato de fórmula (IX) de 0 a 100 °C, preferentemente de 20 a 50 °C.

- 5 Como diluyentes dado el caso añadidos se tienen en cuenta todos los disolventes orgánicos inertes como éteres, amidas, nitrilos, sulfonas, sulfóxidos.

Dado el caso se pueden añadir catalizadores para acelerar la reacción. Como catalizadores se pueden usar de forma muy ventajosa compuestos orgánicos de estaño como, por ejemplo, dilaurato de dibutilestaño. Se trabaja preferentemente a presión normal.

- 10 En el procedimiento de preparación (H-β) se hace reaccionar por mol de compuesto de partida de fórmula (I-a) aproximadamente 1 mol de cloruro de ácido carbamídico de fórmula (XII) de -20 a 150 °C, preferentemente de 0 a 70 °C.

Como diluyentes dado el caso añadidos se tienen en cuenta disolventes orgánicos polares inertes, como éteres, amidas, sulfonas, sulfóxidos o hidrocarburos halogenados.

- 15 Preferentemente se usan dimetilsulfóxido, tetrahidrofurano, dimetilformamida o cloruro de metileno.

Si se sintetiza en una forma de realización preferente mediante adición de agentes desprotonantes fuertes (como, por ejemplo, hidruro de sodio o terc-butolato de potasio) la sal enolato del compuesto (I-a), se puede prescindir de la adición de ligantes de ácidos.

- 20 Si se usan ligantes de ácidos se tienen en cuenta bases inorgánicas u orgánicas habituales, son de citar a modo de ejemplo hidróxido de sodio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, trietilamina o piridina.

La reacción se puede llevar a cabo a presión normal o a presión elevada, preferentemente se trabaja a presión normal. El procesamiento se realiza según procedimiento habituales. Los principios activos de acuerdo con la invención son adecuados por su buena tolerancia por las plantas, toxicidad favorable en mamíferos y buena tolerancia ambiental para la protección de plantas y órganos de plantas, para aumentar los rendimientos de cosecha, mejorar la calidad de los productos de cosecha y para combatir plagas animales, especialmente insectos, arácnidos, helmintos, nematodos y moluscos, que aparecen en agricultura, en horticultura, en cría de animales, en bosques, en jardines e instalaciones de tiempo libre, en la protección de productos y materiales, así como en el sector de la higiene. Se pueden usar preferentemente como agentes plaguicidas. Son eficaces contra los tipos de sensibilidad normal y resistentes, así como contra todos o algunos de los estados de desarrollo. Pertenecen a las plagas anteriormente citadas:

- 30 Del orden de los anopluros (*Phthiraptera*), por ejemplo, *Damalinea spp.*, *Haematopinus spp.*, *Linognathus spp.*, *Pediculus spp.*, *Trichodectes spp.*

- 35 De la clase de los arácnidos, por ejemplo, *Acarus siro*, *Aceria sheldoni*, *Aculops spp.*, *Aculus spp.*, *Amblyomma spp.*, *Argas spp.*, *Boophilus spp.*, *Brevipalpus spp.*, *Bryobia praetiosa*, *Chorioptes spp.*, *Dermanyssus gallinae*, *Eotetranychus spp.*, *Epitimerus pyri*, *Eutetranychus spp.*, *Eriophyes spp.*, *Hemitarsonemus spp.*, *Hyalomma spp.*, *Ixodes spp.*, *Latrodectus mactans*, *Metatetranychus spp.*, *Oligonychus spp.*, *Ornithodoros spp.*, *Panonychus spp.*, *Phyllocoptura oleivora*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Psoroptes spp.*, *Rhipicephalus spp.*, *Rhizoglyphus spp.*, *Sarcoptes spp.*, *Scorpio maurus*, *Stenotarsonemus spp.*, *Tarsonemus spp.*, *Tetranychus spp.*, *Vasates lycopersici*.

De la clase de los bivalvos, por ejemplo, *Dreissena spp.*

Del orden de los quilópodos, por ejemplo, *Geophilus spp.*, *Scutigera spp.*

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

Del orden de los colémbolos, por ejemplo, *Onychiurus armatus*.

Del orden de los dermápteros, por ejemplo, *Forficula auricularia*.

Del orden de los diplópodos, por ejemplo, *Blaniulus guttulatus*.

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

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

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

Además se pueden combatir protozoos como *Eimeria*.

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

Del orden de los homópteros, por ejemplo, *Acyrtosipon spp.*, *Aeneolamia spp.*, *Agonosцена spp.*, *Aleurodes spp.*, *Aleurolobus barodensis*, *Aleurothrixus spp.*, *Amrasca spp.*, *Anuraphis cardui*, *Aonidiella spp.*, *Aphanostigma piri*, *Aphis spp.*, *Arboridia apicalis*, *Aspidiella spp.*, *Aspidiotus spp.*, *Atanus spp.*, *Aulacorthum solani*, *Bemisia spp.*, *Brachycaudus helichrysi*, *Brachycolus spp.*, *Brevicoryne brassicae*, *Calligypona marginata*, *Carneocephala fulgida*, *Ceratovacuna lanigera*, *Cercopidae*, *Ceroplastes spp.*, *Chaetosiphon fragaefolii*, *Chionaspis tegalensis*, *Chlorita onukii*, *Chromaphis juglandicola*, *Chrysomphalus ficus*, *Cicadulina mbila*, *Coccomytilus halli*, *Coccus spp.*, *Cryptomyzus ribis*, *Dalbulus spp.*, *Dialeurodes spp.*, *Diaphorina spp.*, *Diaspis spp.*, *Doralis spp.*, *Drosicha spp.*, *Dysaphis spp.*, *Dysmicoccus spp.*, *Empoasca spp.*, *Eriosoma spp.*, *Erythroneura spp.*, *Euscelis bilobatus*, *Geococcus coffeae*, *Homalodisca coagulata*, *Hyalopterus arundinis*, *Icerya spp.*, *Idiocerus spp.*, *Idioscopus spp.*, *Laodelphax striatellus*, *Lecanium spp.*, *Lepidosaphes spp.*, *Lipaphis erysimi*, *Macrosiphum spp.*, *Mahanarva fimbriolata*, *Melanaphis sacchari*, *Metcalfiella spp.*, *Metopolophium dirhodum*, *Monellia costalis*, *Monelliopsis pecanis*, *Myzus spp.*, *Nasonovia ribisnigri*, *Nephotettix spp.*, *Nilaparvata lugens*, *Oncometopia spp.*, *Orthezia praelonga*, *Parabemisia myricae*, *Paratrioza spp.*, *Parlatoria spp.*, *Pemphigus spp.*, *Peregrinus maidis*, *Phenacoccus spp.*, *Phloeomyzus passerinii*, *Phorodon humuli*, *Phylloxera spp.*, *Pinnaspis aspidistrae*, *Planococcus spp.*, *Protopulvinaria pyriformis*, *Pseudaulacaspis pentagona*, *Pseudococcus spp.*, *Psylla spp.*, *Pteromalus spp.*, *Pyrilla spp.*, *Quadraspidotus spp.*, *Quesada gigas*, *Rastrococcus spp.*, *Rhopalosiphum spp.*, *Saissetia spp.*, *Scaphoides titanus*, *Schizaphis graminum*, *Selenaspis articulatus*, *Sogata spp.*, *Sogatella furcifera*, *Sogatodes spp.*, *Stictocephala festina*, *Tenalaphara malayensis*, *Tinocallis caryaefoliae*, *Tomaspis spp.*, *Toxoptera spp.*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Trioxa spp.*, *Typhlocyba spp.*, *Unaspis spp.*, *Viteus vitifolii*.

Del orden de los himenópteros, por ejemplo, *Diprion spp.*, *Hoplocampa spp.*, *Lasius spp.*, *Monomorium pharaonis*, *Vespa spp.*

Del orden de los isópodos, por ejemplo, *Armadillidium vulgare*, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*.

Del orden de los isópteros, por ejemplo, *Reticulitermes spp.*, *Odontotermes spp.*

Del orden de los lepidópteros, por ejemplo, *Acronicta major*, *Aedia leucomelas*, *Agrotis spp.*, *Alabama argillacea*, *Anticarsia spp.*, *Barathra brassicae*, *Bucculatrix thurberiella*, *Bupalus piniarius*, *Cacoecia podana*, *Capua reticulana*, *Carpocapsa pomonella*, *Cheimatobia brumata*, *Chilo spp.*, *Choristoneura fumiferana*, *Clysia ambiguella*, *Cnaphalocerus spp.*, *Earias insulana*, *Ephestia kuehniella*, *Euproctis chrysothoea*, *Euxoa spp.*, *Feltia spp.*, *Galleria mellonella*, *Helicoverpa spp.*, *Heliopsis spp.*, *Hofmannophila pseudospretella*, *Homona magnanima*, *Hyponomeuta padella*, *Laphygma spp.*, *Lithocolletis blancardella*, *Lithophane antennata*, *Loxagrotis albicosta*, *Lymantria spp.*, *Malacosoma neustria*, *Mamestra brassicae*, *Mocis repanda*, *Mythimna separata*, *Oria spp.*, *Oulema oryzae*, *Panolis flammea*, *Pectinophora gossypiella*, *Phyllocnistis citrella*, *Pieris spp.*, *Plutella xylostella*, *Prodenia spp.*, *Pseudaletia spp.*, *Pseudoplusia includens*, *Pyrausta nubilalis*, *Spodoptera spp.*, *Thermesia gemmatilis*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*, *Tortrix viridana*, *Trichoplusia spp.*

Del orden de los ortópteros, por ejemplo, *Acheta domesticus*, *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Gryllotalpa* spp., *Leucophaea maderae*, *Locusta* spp., *Melanoplus* spp., *Periplaneta americana*, *Schistocerca gregaria*.

Del orden de los sifonápteros, por ejemplo, *Ceratophyllus* spp., *Xenopsylla cheopis*.

Del orden de los sínfilos, por ejemplo, *Scutigera* spp.

- 5 Del orden de los tisanópteros, por ejemplo, *Baliothrips biformis*, *Enneothrips flavens*, *Frankliniella* spp., *Heliethrips* spp., *Hercinothrips femoralis*, *Kakothrips* spp., *Rhipiphorotherips cruentatus*, *Scirtothrips* spp., *Taeniothrips cardamoni*, *Thrips* spp.

Del orden de los tisanuros, por ejemplo, *Lepisma saccharina*.

- 10 A los nematodos parásitos de plantas pertenecen, por ejemplo, *Anguina* spp., *Aphelenchoides* spp., *Belonoaimus* spp., *Bursaphelenchus* spp., *Ditylenchus dipsaci*, *Globodera* spp., *Heliocotylenchus* spp., *Heterodera* spp., *Longidorus* spp., *Meloidogyne* spp., *Pratylenchus* spp., *Radopholus similis*, *Rotylenchus* spp., *Trichodorus* spp., *Tylenchorhynchus* spp., *Tylenchulus* spp., *Tylenchulus semipenetrans*, *Xiphinema* spp.

- 15 Los compuestos de acuerdo con la invención se pueden usar dado el caso en concentraciones o cantidades de aplicación determinadas también como herbicidas, protectores, reguladores del crecimiento o agentes para mejorar las propiedades de las plantas, o como microbicidas, por ejemplo, como fungicidas, antimicóticos, bactericidas, viricidas (incluyendo agentes contra viroides) o como agentes contra MLO (organismo similar a micoplasma) y RLO (organismo similar a Rickettsia). Pueden usarse dado el caso también como productos intermedios o iniciales para la síntesis de otros principios activos.

- 20 De acuerdo con la invención, se pueden tratar todas las plantas y partes de planta. Por plantas se entienden, a este respecto, todas las plantas y poblaciones de plantas, como plantas silvestres deseadas y no deseadas o plantas de cultivo (incluyendo plantas de cultivo de aparición natural). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que pueden obtenerse mediante procedimientos de cultivo y optimización convencionales o mediante procedimientos biotecnológicos y de tecnología genética o combinaciones de estos procedimientos, incluyendo las plantas transgénicas e incluyendo las especies de plantas protegibles por el derecho de protección de especies o las especies de plantas no protegibles. Por partes de planta deben entenderse todas las partes y órganos de la planta aéreos y subterráneos, como brote, hoja, flor y raíz, citándose por ejemplo hojas, agujas, tallos, troncos, flores, cuerpos fructíferos, frutos y semillas, así como raíces, tubérculos y rizomas. Pertenecen a las partes de planta también productos de cosecha así como material de reproducción vegetativa y generativa, por ejemplo esquejes, tubérculos, rizomas, acodos y semillas.

- 30 El tratamiento de acuerdo con la invención de plantas y partes de planta con los principios activos se realiza directamente o mediante exposición a su entorno, espacio vital o espacio de almacenamiento según los procedimientos de tratamiento habituales, por ejemplo, mediante inmersión, pulverización, vaporización, nebulización, dispersión, deposición, inyección y en material reproductivo, especialmente en semillas, además mediante capas de una o varias capas.

- 35 Los principios activos se pueden transformar en formulaciones habituales como soluciones, emulsiones, polvos de pulverización, suspensiones basadas en agua y aceite, polvos, productos en polvo, pastas, polvos solubles, gránulos solubles, gránulos de dispersión, concentrados de suspensión-emulsión, sustancias naturales impregnadas con principio activo, sustancias sintéticas impregnadas con principio activo, fertilizantes, así como microencapsulaciones de sustancias poliméricas.

- 40 Estas formulaciones se preparan de modo conocido, por ejemplo, mediante mezclado de los principios activos con diluyentes, como disolventes líquidos y/o vehículos sólidos, dado el caso usando agentes tensioactivos, como agentes emulsionantes y/o agentes dispersantes y/o agentes espumantes. La preparación de formulaciones se realiza bien en equipos adecuados o también antes o durante el uso.

- 45 Como coadyuvantes pueden ser de uso aquellas sustancias que son adecuadas para conferir al propio agente y/o a preparaciones derivadas de este (por ejemplo, líquidos de pulverización, desinfectantes de semillas) propiedades especiales, como determinadas propiedades técnicas y/o también propiedades biológicas especiales. Como coadyuvantes típicos se tienen en cuenta: diluyentes, disolventes y vehículos.

- 50 Como diluyentes son adecuados, por ejemplo, agua, líquidos químicos orgánicos polares y no polares, por ejemplo, de la clase de los hidrocarburos aromáticos y no aromáticos (como parafinas, alquibencenos, alquilnaftalinas, clorobencenos), los alcoholes y polioles (que eventualmente pueden estar sustituidos, eterificados y/o esterificados), las cetonas (como acetona, ciclohexanona), ésteres (también grasas y aceites) y (poli)éteres, las aminas simples y sustituidas, amidas, lactamas (como N-alquilpirrolidona) y lactonas, las sulfonas y sulfóxidos (como dimetilsulfóxido).

- 55 En caso de uso de agua como diluyente se pueden usar por ejemplo también disolventes orgánicos como disolventes auxiliares. Como disolventes líquidos se tienen en cuenta esencialmente: compuestos aromáticos como xileno, tolueno o alquilnaftalina, compuestos aromáticos clorados e hidrocarburos alifáticos clorados como

clorobenceno, cloroetileno o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos como ciclohexano o parafina, por ejemplo, fracciones de petróleo, aceites minerales y vegetales, alcoholes como butanol o glicol, así como sus éteres y ésteres, cetonas como acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona o ciclohexanona, disolventes polares fuertes como dimetilsulfóxido, así como agua.

5 Se tienen en cuenta como vehículos sólidos:

por ejemplo, sales de amonio y polvos de rocas naturales como caolín, arcilla, talco, creta, cuarzo, atapulgita, montmorillonita o tierra de diatomeas y polvos de rocas sintéticos como sílice de alta dispersión, óxido y silicatos de aluminio; como vehículos sólidos para gránulos se tienen en cuenta: por ejemplo, rocas naturales rotas y fraccionadas como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita, así como gránulos sintéticos de polvos inorgánicos y orgánicos, así como gránulos de material orgánico como papel, serrín, cáscaras de coco, mazorcas de maíz y tallos de tabaco; como agentes emulsionantes y/o espumantes se tienen en cuenta: por ejemplo, agentes emulsionantes no ionogénicos y aniónicos como éster de ácido graso y polioxietileno, éteres de alcohol graso y polioxietileno, por ejemplo, alquilaril-polglicoléteres, alquilsulfonatos, alquilsulfatos, arilsulfonatos, así como hidrolizados de albúmina; como agentes de dispersión se tienen en cuenta sustancias no iónicas y/o iónicas, por ejemplo, de las clases de alcohol-POE- y/o POP-éteres, ésteres de ácido y/o de POP- POE, alquil-aril- y/o POP-POE-éteres, aductos grasos y/o de POP- POE, derivados de POE- y/o POP-poliol, aductos de POE- y/o POP-sorbitán o azúcar, sulfatos, sulfonatos y fosfatos de alquilo o arilo o los aductos de PO-éter correspondientes. Además de oligo- o polímeros adecuados, por ejemplo partiendo de monómeros vinílicos, de ácido acrílico, de EO y/o PO sólo o en combinación con, por ejemplo, (poli)-alcoholes o (poli)-aminas. Además pueden ser de uso lignina y sus derivados de ácido sulfónico, celulosas simples y modificadas, ácidos sulfónicos aromáticos y/o alifáticos así como sus aductos con formaldehído.

Se pueden usar en las formulaciones adhesivos como carboximetilcelulosa, polímeros naturales y sintéticos en forma de polvo, grano o látex, como goma arábiga, poli(alcohol vinílico), poli(acetato de vinilo), así como fosfolípidos naturales como cefalina y lecitina y fosfolípidos sintéticos.

25 Se pueden usar colorantes como pigmentos inorgánicos, por ejemplo, óxido de hierro, óxido de titanio, azul de ferrocianuro y colorantes orgánicos como colorantes de alizarina, azoicos y de ftalocianina metálica y oligonutrientes como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc.

Otros aditivos pueden ser sustancias aromáticas, aceites minerales o vegetales dado el caso modificados, ceras y sustancias nutritivas (también oligonutrientes), como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc.

Además pueden estar contenidos estabilizadores como estabilizadores de frío, conservantes, antioxidantes, agentes fotoprotectores u otros agentes que mejoran la estabilidad química y/o física.

Las formulaciones contienen en general entre el 0,01 y el 98 % en peso de principio activo, preferentemente entre el 0,5 y el 90 %.

35 El principio activo de acuerdo con la invención puede presentarse en sus formulaciones comerciales, así como en las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones, mezclado con otros principios activos como insecticidas, atrayentes, esterilizantes, bactericidas, acaricidas, nematocidas, fungicidas, sustancias reguladoras del crecimiento, herbicidas, protectores, fertilizantes o semioquímicos.

Son asociados de mezcla especialmente convenientes, por ejemplo, los siguientes:

40 **Fungicidas:**

Inhibidores de la síntesis de ácido nucleico

benalaxilo, benalaxilo-m, bupirimat, quiralaxilo, clozilación, dimetirimol, etirimol, furalaxilo, himexazol, metalaxilo, metalaxilo-m, ofurace, oxadixilo, ácido oxolínico

Inhibidores de la mitosis y división celular

45 benomilo, carbendazim, dietofencarb, fuberidazol, pencicurona, tiabendazol, tiofanat-metilo, zoxamid

Inhibidores de complejo I de la cadena respiratoria

diflumentorim

Inhibidores de complejo II de la cadena respiratoria

boscalid, carboxina, fenfuram, flutolanilo, furametpir, mepronilo, oxicarboxina, pentiopirad, tifluzamid

50 Inhibidores de complejo III de la cadena respiratoria

azoxistrobina, ciazofamid, dimoxistrobina, enestrobina, famoxadon, fenamidon, fluoxastrobina, cresoximmetilo, metominostrobrina, orisastrobina, piraclostrobina, picoxistrobina, trifloxistrobina

Desacopladores

dinocap, fluazinam

5 Inhibidores de la producción de ATP

fentinacetato, cloruro de fentina, hidróxido de fentina, siltiofam

Inhibidores de la biosíntesis de aminoácidos y proteínas

andoprim, blastidicidín-s, ciprodinilo, casugamicina, clorhidrato de casugamicina hidratado, mepanipirim, pirimetanilo

10 Inhibidores de transducción de señal

fenciclonilo, fludioxonilio, quinoxifeno

Inhibidores de la síntesis de grasa y membrana

clozolinat, iprodiona, procimidona, vinclozolina

ampropilfós, potasio-ampropilfós, edifenfós, iprobenfós (IBP), isoprotiolano, pirazofós

15 tolclofós-metilo, bifenilo

yodocarb, propamocarb, clorhidrato de propamocarb

Inhibidores de la biosíntesis de ergosterol

fenhexamida,

20 azaconazol, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, diclobutrazol, difenoconazol, diniconazol, diniconazol-m, epoxiconazol, etaconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, furconazol, furconazol-cis, hexaconazol, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanilo, paclobutrazol, penconazol, propiconazol, protioconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefona, triadimenol, triticonazol, uniconazol, voriconazol, imizalilo, sulfato de imazalilo, oxpoconazol, fenarimol, flurprimidol, nuarimol, pirifenox, triforina, pefurazoato, procloraz, triflumizol, viniconazol,

25 aldimorf, dodemorf, acetato de dodemorf, fenpropimorf, tridemorf, fenpropidina, espiroxamina,

naftifina, piributicarb, terbinafina

Inhibidores de la síntesis de pared celular

bentiavalicarb, bialafós, dimethomorf, flumorf, iprovalicarb, polioxinas, polioxorim, validamicina A

Inhibidores de la biosíntesis de la melanina

30 capropamida, diclocimet, fenoxanilo, ftalida, piroquilona, triciclazol

Inducción de resistencia

acibenzolar-S-metilo, probenazol, tiadinilo

Multisitios

35 captafol, captano, clorotalonil, sales de cobre como: hidróxido de cobre, naffenato de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato de cobre, óxido de cobre, oxina-cobre y mezcla burdeos, diclofluanid, ditanona, dodina, base libre de dodina, ferbam, folpet, fluorofolpet, guazatina, acetato de guazatina, iminoctadina, albesilato de iminoctadina, triacetato de iminoctadina, manganeso-cobre, mancozeb, maneb, metiram, metiram cin, propineb, azufre y preparados de azufre que contienen polisulfuro de calcio, tiram, toliifluanida, zineb, ziram

Mecanismos desconocidos

40 amibromdol, bentiazol, betoxazina, capsimicina, carvona, quinometionato, cloropicrina, cufraneb, ciflufenamida, cimoxanilo, dazomet, debacarb, diclomezina, diclorofeno, diclorano, difenzoquat, sulfato de difenzoquat metilo, difenilamina, etaboxam, ferimzona, flumetover, flusulfamida, fluopicolid, fluoroimida, hexaclorobenceno, sulfato de 8-hidroxiquinolina, irumamicina, metasulfocarb, metrafenona, isotiocianato de metilo, mildiomicina, natamicina,

5 dimetilditiocarbamato de níquel, nitrotal-isopropilo, octilina, oxamocarb, oxifentina, pentaclorofenol y sales, 2-fenilfenol y sales, piperalina, propanosin-sodio, proquinazid, pirrolnitrina, quintozeno, tecloftalam, tecnazeno, triazoxid, triclamida, zarilamida, y 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)-piridina, N-(4-cloro-2-nitrofenil)-N-etil-4-metil-bencenosulfonamida, 2-amino-4-metil-N-fenil-5-tiazolcarboxamida, 2-cloro-N-(2,3-dihidro-1,1,3-trimetil-1H-inden-4-il)-3-piridincarboxamida, 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetilisoxazolidin-3-il]piridina, cis-1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-cicloheptanol, 2,4-dihidro-5-metoxi-2-metil-4-[[[1-[3-(trifluorometil)-fenil]-etiliden]-amino]-oxi]-metil]-fenil]-3H-1,2,3-triazol-3-ona (185336-79-2), 1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-inden-1-il)-1H-imidazol-5-carboxilato de metilo, 3,4,5-tricloro-2,6-piridindicarbonitrilo, 2-[[[ciclopropil[(4-metoxifenil)imino]metil]tio]metil]-alfa-(metoximetil)-benzacetato de metilo, 4-cloro-alfa-propinilo-N-[2-[3-metoxi-4-(2-propinilo)fenil]etil]-benzacetamida, (2S)-N-[2-[4-[3-(4-clorofenil)-propinilo]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(metilsulfonil)amino]-butanamida, 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina, 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-N-[(1R)-1,2,2-trimetilpropil][1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-amina, 5-cloro-N-[(1R)-1,2-dimetilpropil]-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-amina, N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2,4-dicloroonicotinamida, N-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)metil-2,4-dicloroonicotinamida, 2-butoxi-6-yodo-3-propilbenzopiranon-4-ona, N-{(Z)-[(ciclopropilmetoxi)imino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil}-2-benzacetamida, N-(3-etil-3,5,5-trimetil-ciclohexil)-3-formilamino-2-hidroxi-benzamida, 2-[[[1-[3-(1-fluoro-2-feniletil)oxi]fenil]etiliden]amino]oxi]metil]-alfa-(metoxiimino)-N-metil-alfaE-benzacetamida, N-[2-[3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il]etil]-2-(trifluorometil)benzamida, N-(3',4'-dicloro-5-fluorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, N-(6-metoxi-3-piridinil)-ciclopropanocarboxamida, ácido 1-[(4-metoxifenoxi)metil]-2,2-dimetilpropil-1H-imidazol-1-carboxílico, ácido O-[1-[(4-metoxifenoxi)metil]-2,2-dimetilpropil]-1H-imidazol-1-carboxílico, 2-(2-[[6-(3-cloro-2-metilfenoxi)-5-fluoropirimidin-4-il]oxi]fenil)-2-(metoxiimino)-N-metilacetamida.

Bactericidas:

25 bronopol, diclorofeno, nitrapirina, dimetilditiocarbamato de níquel, kasugamicina, octilina, ácido furancarboxílico, oxitetraciclina, probenazol, estreptomina, tecloftalam, sulfato de cobre y otras preparaciones de cobre.

Insecticidas / acaricidas / nematocidas:

Inhibidores de acetilcolinesterasa (AChE)

30 Carbamatos,

por ejemplo alanicarb, aldicarb, aldoxicarb, alixicarb, aminocarb, bendiocarb, benfuracarb, bufencarb, butacarb, butocarboxim, butoxicarboxim, carbarilo, carbofurano, carbosulfano, cloetocarb, dimetilano, etiofencarb, fenobucarb, fenotiocarb, formetanato, furatiocarb, isoprocarb, metam-sodio, metiocarb, metomilo, metolcarb, oxamilo, pirimicarb, promecarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, trimetacarb, XMC, xilicarb, triazamatos

35

Organofosfatos,

por ejemplo acefato, azametifós; azinfós (metilo, -etilo), bromofós-etilo, bromo-fenvinfós (-metilo), butatofós, cadusafós, carbofenotona, cloretixifós, clorofenvinfós, cloromefós, cloropirifós (-metilo/etilo), coumafós, cianofenfós, cianofós, clorofenvinfós, demetón-S-metilo, demeton-S-metilsulfona, dialifós, diazinona, diclofenotona, diclorovós/DDVP, dicrotofós, dimetoato, dimetilvinfós, dioxabenzofós, disulfotona, EPN, etiona, etopofós, etrimfós, famfur, fenamifós, fenitrotiona, fensulfotona, fentiona, flupirazofós, fonofós, formotiona, fosmetilano, fostiazato, heptenofós, yodofenfós, iprobenfós, isazofós, isofenfós, o-aalilato de isopropilo, isoxationa, malationa, mecarb, metacrifós, metamidofós, metidationa, mevinfós, monocrotofós, naled, ometoato, oxidemeton-metilo, parationa, (-metilo/etilo), fentoato, forato, fosalona, fosmet, fosfamidona, fosfocarb, foxim, pirimifós (-metilo/etilo), fosfenofós, propafós, propetamfós, protiofós, protoato, piraclófós, piridafentona, piridationa, quinalfós, sebufós, sulfotep, sulprofós, tebupirimfós, temefós, terbufós, tetraclorvinfós, tiometona, triazofós, triclorofona, vamidotona

45

Moduladores del canal de sodio / bloqueadores del canal de sodio dependientes de la tensión

Piretroides,

50 por ejemplo acrintrina, aletrina, (d-cis-trans, d-trans), beta-ciflutrina, bifentrina, bioaletrina, isómero de bioaletrina-S-ciclopentilo, bioetanometrina, biopermetrina, bioresmetrina, clovaportrina, cis-cipermetrina, cis-resmetrina, cis-permetrina, clocitrina, cicloprotrina, ciflutrina, cihalotrina, cipermetrina (alfa-beta-, teta-, zeta-), cifenotrina, deltametrina, empentrina (isómero 1R), esfen-valerato, etofenprox, fenflutrina, fenpropatrina, fenpiritrina, fenvalerato, flubrocitrinato, flucitrinato, flufenprox, flumetrina, fluvalinato, fubfenprox, gamma-cihalotrina, imiprotrina, cadertrina, lambda-cihalotrina, metoflutrina, permetrina (cis-, trans-), fenotrina (isómero 1R-trans), praletrina, proflutrina, protrifenbuta, piresmetrina, resmetrina, RU 15525, silafluofeno,

55

tau-fluvalinato, teflutrina, teraletrina, tetrametrina (isómero 1R), tralometrina, transflutrina, ZXI 8901, piretrinas (piretro)

DDT

Oxadiazinas,

5 por ejemplo, indoxacarb

Semicarbazonas

por ejemplo, metaflumizona (BAS 3201)

Agonistas/antagonistas del receptor de acetilcolina

Cloronicotínicos,

10 por ejemplo, acetamiprid, clotianidina, dinotefurano, imidacloprid, nitenpiram, nitiazina, tiacloprid, tiametoxam,

nicotina, bensultap, cartap

Moduladores del receptor de acetilcolina

espinosinas,

15 por ejemplo, espinosad

Antagonistas del canal de cloruro controlado por GABA

organoclorados,

por ejemplo, canfeclor, clordano, endosulfano, gamma-HCH, HCH, heptaclor, lindano, metoxiclor

fiproles,

20 por ejemplo, acetoprol, etiprol, fipronilo, pirafluprol, piriprol, vaniliprol

Activadores del canal de cloruro

mectinas,

por ejemplo, abamectina, emamectina, benzoato de emamectina, ivermectina, lepimectina, milbemicina,

Miméticos de hormonas juveniles,

25 por ejemplo, diofenolán, epofenonano, fenoxicarb, hidropreno, kinopreno, metopreno, piriproxifeno, tripreno

Agonistas/disruptores de ecdisona

diacilhidrazinas,

por ejemplo, cromafenozida, halofenozida, metoxifenozida, tebufenozida

Inhibidores de biosíntesis de quitina

30 benzoilureas,

por ejemplo, bistriflurón, clofluazurón, diflubenzurón, fluazurón, flucicloxurón, flufenoxurón, hexaflumurón, lufenurón, novalurón, noviflumurón, penflurón, teflubenzurón, triflumurón,

buprofezina

ciromazina

35 Inhibidores de la fosforilación oxidativa, disruptores de ATP

diafentiurón

compuestos de organoestaño

por ejemplo, azociclotina, cihexatina, óxidos de fenbutatina

Desacopladores de la fosforilación oxidativa mediante interrupción del gradiente de protón H

pirroles,

por ejemplo, clorofenapir

dinitrofenoles,

5 por ejemplo, binapacirl, dinobutón, dinocap, DNOC, meptildinocap

Inhibidores del transporte de electrones parte I

METI,

por ejemplo, fenazaquina, fenpiroximato, pirimidifén, piridabén, tebufenpirad, tolfenpirad

hidrametilnón

10 dicofol

Inhibidores del transporte de electrones parte II

rotenonas

Inhibidores del transporte de electrones parte III

acequinocilo, fluacirpirim

15 Disruptores microbianos de la membrana intestinal de insectos

cepas de *Bacillus thuringiensis*

Inhibidores de la síntesis de las grasa

ácidos tetrónicos,

por ejemplo, espiroclifeno, espiromesifeno

20 ácidos tetrámicos,

por ejemplo, espirotetramato, cis-3-(2,5-dimetilfenil)-4-hidroxi-8-metoxi-1-azaespiro[4.5]dec-3-en-2-ona

carboxamidas,

por ejemplo, flonicamida

agonistas octopaminérgicos,

25 por ejemplo, amitraz

Inhibidores de ATPasa estimulada por magnesio,

propargita

Análogos de nereistoxina,

por ejemplo, hidrogenoxalato de tiociclám, triosultap-sodio

30 Agonistas del receptor de rianodina,

dicarboxamida del ácido benzoico,

por ejemplo, flubendiamida

antranilamida,

35 por ejemplo, rinaxipir (3-bromo-N-{4-cloro-2-metil-6-[(metilamino)carbonil]fenil}-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazole-5-carboxamida)

productos biológicos, hormonas o feromonas,

azadiractina, *Bacillus spec*, *Beauveria spec.*, *codlemona*, *Metarrhizium spec.*, *Paecilomyces spec.*, *turingiensina*, *Verticillium spec.*

Principios activos con mecanismos de acción desconocidos o no específicos

agentes fumigantes,

5 por ejemplo, fosfuros de aluminio, bromuros de metilo, fluoruros de sulfuro

antinutritivos,

por ejemplo, criolita, flonicamid, pimetrozina

inhibidores del crecimiento de ácaros,

por ejemplo, clofetezina, etoxazol, hexitiazox

10 amidoflumet, benclotiaz, benzoximato, bifenazato, bromopropilato, buprofezina, quinometionato, clordimeform, clorobenzilato, cloropicrina, clotiazobeno, ciclopreno, ciflumetofeno, diciclanil, fenoxacrim, fentripanil, flubenzimina, flufenerim, flutenzina, Gossyplure, hidrametilnona, japoniluro, metoxadiazona, vaselina, butóxido de piperonilo, oleato de potasio, piridalilo, sulfluramida, tetradifón, tetrasul, triarateno, verbutín.

15 Es también posible una mezcla con otros principios activos conocidos como herbicidas, fertilizantes, reguladores del crecimiento, protectores, productos semioquímicos o también con agentes para mejorar las propiedades de las plantas.

Los principios activos de acuerdo con la invención se pueden presentar además en el uso como insecticidas en sus formulaciones comerciales, así como en las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones, mezclados con sinergistas. Los sinergistas son compuestos mediante los que se controla el efecto de los principios activos, sin que el sinergista mismo añadido deba ser activo eficaz.

20 Los principios activos de acuerdo con la invención se pueden presentar además en el uso como insecticidas en sus formulaciones comerciales, así como en las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones, en mezclas con sustancias inhibitoras que reducen la degradación del principio activo después de la aplicación en el entorno de las plantas, sobre la superficie de las partes de la planta o en los tejidos de la planta.

25 El contenido de principio activo de las formas de aplicación preparadas a partir de las formulaciones comerciales puede variar en amplios intervalos. La concentración de principio activo de las formas de aplicación puede encontrarse de 0,00000001 hasta 95 % en peso de principio activo, preferentemente entre 0,00001 y 1 % en peso.

La aplicación tiene lugar en uno de los modos habituales adaptados a las formas de aplicación.

30 Como ya se ha citado anteriormente, pueden tratarse de acuerdo con la invención todas las plantas y sus partes. En una forma de realización preferente, se tratan tipos de plantas y variedades de plantas de origen silvestre u obtenidas mediante procedimientos de cultivo biológico convencional, como cruzamiento o fusión de protoplastos, así como sus partes. En una forma de realización preferente adicional, se tratan plantas transgénicas y variedades de plantas que se han obtenido mediante procedimientos de tecnología genética eventualmente en combinación con procedimientos convencionales (organismos modificados genéticamente) y sus partes. Los términos "partes" o "partes de plantas" se aclararon anteriormente.

35 De forma especialmente preferente, se tratan plantas de acuerdo con la invención de las variedades de plantas respectivamente comerciales o que se encuentran en uso. Por variedades de plantas, se entienden plantas con nuevas propiedades ("rasgos"), que se cultivan tanto mediante cultivo convencional, mediante mutagénesis o mediante técnicas de ADN recombinante. Éstas pueden ser variedades, biotipos y genotipos.

40 Según la especie de planta o variedad de planta, su hábitat y condiciones de crecimiento (suelo, clima, periodo vegetativo, alimentación), pueden aparecer también efectos superaditivos ("sinérgicos") mediante el tratamiento de acuerdo con la invención. Así, son posibles, por ejemplo, cantidades de aplicación reducidas y/o ampliaciones del espectro de acción y/o un reforzamiento del efecto de las sustancias y agentes de acuerdo con la invención, mejor crecimiento de plantas, mayor tolerancia frente a altas o bajas temperaturas, mayor tolerancia a sequía o frente al contenido de agua o sales del suelo, mayor rendimiento de floración, recolección facilitada, aceleramiento de la maduración, mayores rendimientos de cosecha, mayor calidad y/o mayor valor nutritivo de los productos de cosecha, mayor capacidad de almacenamiento y/o procesabilidad de los productos de cosecha, que superan los efectos que realmente se esperan.

50 Pertenecen a las plantas o variedades de plantas transgénicas preferentes de acuerdo con la invención para tratar (obtenidas por ingeniería genética) todas las plantas que mediante la modificación por ingeniería genética han obtenido material genético que confiere a estas plantas propiedades valiosas especialmente ventajosas ("rasgos"). Son ejemplos de dichas propiedades mejor crecimiento de planta, tolerancia elevada frente a temperaturas altas o bajas, tolerancia aumentada frente a sequedad o frente al contenido de sal de agua o suelo, rendimiento de floración

elevado, recolección facilitada, aceleramiento de la maduración, mayores rendimientos de cosecha, mayor calidad y/o mayor valor nutritivo de los productos de cosecha, mayor capacidad de almacenamiento y/o procesabilidad de los productos de cosecha. Son ejemplos adicionales y especialmente destacados de dichas propiedades una defensa elevada de las plantas frente a parásitos animales y microbianos, como frente a insectos, ácaros, hongos fitopatógenos, bacterias y/o virus, así como una tolerancia elevada de las plantas frente a determinados principios activos herbicidas. Como ejemplos de plantas transgénicas, se citan las plantas de cultivo importantes como cereales (trigo, arroz), maíz, soja, patata, remolacha, tomate, guisante y otras variedades de verduras, algodón, tabaco, colza, así como plantas frutales (con los frutos manzana, pera, frutos cítricos y uvas), siendo especialmente destacadas maíz, soja, patata, algodón, tabaco y colza. Como propiedades ("rasgos"), se destacan especialmente la defensa elevada de las plantas frente a insectos, arácnidos, nemátodos y caracoles, especialmente por aquellas toxinas generadas en las plantas mediante el material genético de *Bacillus thuringiensis* (por ejemplo, mediante los genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb y CryIF, así como sus combinaciones) (en adelante, "plantas Bt"). Como propiedades ("rasgos"), se destacan también especialmente la defensa elevada de las plantas frente a hongos, bacterias y virus mediante resistencia sistémica adquirida (SAR), sistemina, fitoalexinas, desencadenantes, así como genes de resistencia y las correspondientes proteínas y toxinas expresadas. Como propiedades ("rasgos"), se destacan especialmente también la tolerancia elevada de las plantas frente a determinados principios activos herbicidas, por ejemplo, imidazolinonas, sulfonilureas, glifosato o fosfinotricina (por ejemplo, gen "PAT"). Los genes que confieren las propiedades respectivamente deseadas ("rasgos") pueden aparecer también en combinaciones entre sí en las plantas transgénicas. Como ejemplos de "plantas Bt", se citan variedades de maíz, variedades de algodón, variedades de soja y variedades de patata, que se comercializan con las referencias comerciales YIELD GARD® (por ejemplo, maíz, algodón, soja), KnockOut® (por ejemplo, maíz), StarLink® (por ejemplo, maíz), Bollgard® (algodón), Nucotn® (algodón) y NewLeaf® (patata). Como ejemplos de plantas tolerantes a herbicida, se citan variedades de maíz, variedades de algodón y variedades de soja que se comercializan con las referencias comerciales Roundup Ready® (tolerancia frente a glifosato, por ejemplo, maíz, algodón, soja), Liberty Link® (tolerancia frente a fosfinotricina, por ejemplo, colza), IMI® (tolerancia frente a imidazolinonas) y STS® (tolerancia frente a sulfonilureas, por ejemplo, maíz). Como plantas resistentes a herbicida (criadas convencionalmente con tolerancia a herbicida), se citan también las variedades comercializadas con la referencia Clearfield® (por ejemplo, maíz). Por supuesto, estas indicaciones son válidas también para las variedades de plantas desarrolladas en el futuro o presentes en el mercado futuro con estas u otras propiedades genéticas desarrolladas en el futuro ("rasgos").

Las plantas citadas se pueden tratar de forma especialmente ventajosa de acuerdo con la invención con los compuestos de fórmula I general o las mezclas de principios activos de acuerdo con la invención. Los intervalos preferentes dados anteriormente en los principios activos o mezclas son también válidos para el tratamiento de estas plantas. Se destaca especialmente el tratamiento de plantas con las composiciones o mezclas citadas especialmente en el presente texto.

Los principios activos de acuerdo con la invención actúan no sólo contra plagas de plantas, higiene y existencias, sino también en el sector veterinario contra parásitos animales (ecto- y endoparásitos) como garrapatas duras, garrapatas blandas, ácaros de la sarna, ácaros chupadores, moscas (picadoras y chupadoras), larvas de moscas parásitas, piojos, malófagos de pelo, malófagos de pluma y pulgas. Pertenecen a estos parásitos:

40 Del orden de los anoplúridos, por ejemplo, *Haematopinus spp.*, *Linognathus spp.*, *Pediculus spp.*, *Phtirus spp.*, *Solenopotes spp.*

Del orden de los Mallophagida y los subórdenes Amblycerina así como Ischnocerina, por ejemplo, *Trimenopon spp.*, *Menopon spp.*, *Trinoton spp.*, *Bovicola spp.*, *Werneckiella spp.*, *Lepikentron spp.*, *Damalina spp.*, *Trichodectes spp.*, *Felicola spp.*

45 Del orden de los dípteros y los subórdenes nematoceros, así como Brachycerina, por ejemplo, *Aedes spp.*, *Anopheles spp.*, *Culex spp.*, *Simulium spp.*, *Eusimulium spp.*, *Phlebotomus spp.*, *Lutzomyia spp.*, *Culicoides spp.*, *Chrysops spp.*, *Hybomitra spp.*, *Atylotus spp.*, *Tabanus spp.*, *Haematopota spp.*, *Philipomyia spp.*, *Braula spp.*, *Musca spp.*, *Hydrotaea spp.*, *Stomoxys spp.*, *Haematobia spp.*, *Morellia spp.*, *Fannia spp.*, *Glossina spp.*, *Calliphora spp.*, *Lucilia spp.*, *Chrysomyia spp.*, *Wohlfahrtia spp.*, *Sarcophaga spp.*, *Oestrus spp.*, *Hypoderma spp.*, *Gasterophilus spp.*, *Hippobosca spp.*, *Lipoptena spp.*, *Melophagus spp.*

Del orden de los sifonápteros, por ejemplo, *Pulex spp.*, *Ctenocephalides spp.*, *Xenopsylla spp.*, *Ceratophyllus spp.*

Del orden de los heterópteros, por ejemplo, *Cimex spp.*, *Triatoma spp.*, *Rhodnius spp.*, *Panstrongylus spp.*

Del orden de los blatarios, por ejemplo, *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Blattella germanica*, *Supella spp.*

55 De la subclase de los ácaros (Acarina) y los órdenes de los Meta- así como Mesostigmata, por ejemplo, *Argas spp.*, *Ornithodoros spp.*, *Otobius spp.*, *Ixodes spp.*, *Amblyomma spp.*, *Boophilus spp.*, *Dermacentor spp.*, *Haemophysalis spp.*, *Hyalomma spp.*, *Rhipicephalus spp.*, *Dermanyssus spp.*, *Raillietia spp.*, *Pneumonyssus spp.*, *Sternostoma spp.*, *Varroa spp.*

Del orden de los actinédidos (*Prostigmata*) y acarídidos (*Astigmata*), por ejemplo, *Acarapis spp.*, *Cheyletiella spp.*, *Ornithocheyletia spp.*, *Myobia spp.*, *Psorergates spp.*, *Demodex spp.*, *Trombicula spp.*, *Listrophorus spp.*, *Acarus spp.*, *Tyrophagus spp.*, *Caloglyphus spp.*, *Hypodectes spp.*, *Pterolichus spp.*, *Psoroptes spp.*, *Chorioptes spp.*, *Otodectes spp.*, *Sarcoptes spp.*, *Notoedres spp.*, *Knemidocoptes spp.*, *Cytodites spp.*, *Laminosioptes spp.*

- 5 Los principios activos de fórmula I de acuerdo con la invención son adecuados también para combatir artrópodos que atacan a animales útiles agrícolas como, por ejemplo, vacas, ovejas, cabras, caballos, cerdos, asnos, camellos, búfalos, conejos, gallinas, pavos, patos, gansos, abejas, mascotas tales como, por ejemplo, perros, gatos, aves domésticas, peces de acuario, así como los denominados animales de ensayo como, por ejemplo, hámsteres, conejillos de indias, ratas y ratones. Mediante el combate de estos artrópodos, deben reducirse los fallecimientos y reducciones de rendimiento (de carne, leche, lana, pieles, huevos, miel, etc.), de modo que mediante el uso de los principios activos de acuerdo con la invención es posible una cría de animales más económica y sencilla.

- 10 La aplicación de los principios activos de acuerdo con la invención se realiza de modo conocido en el sector veterinario y en la cría de animales mediante administración por vía entérica en forma de, por ejemplo, comprimidos, cápsulas, pociones, brebajes, gránulos, pastas, bolos, procedimiento de alimentación continua, supositorios, mediante administración por vía parenteral como, por ejemplo, mediante inyecciones (intramuscular, subcutánea, intravenosa, intraperitoneal, entre otras), implantes, mediante administración por vía nasal, mediante aplicación dérmica en forma, por ejemplo, de inmersión o baño (remojo), pulverización (pulverizador), vertido (vertido dorsal y en la cruz), lavado, empolvado, así como con ayuda de cuerpos de moldeo que contienen principios activos como collares, marcas en la oreja, marcas en el rabo, brazaletes, ronzales, dispositivos de marcaje, etc.

- 20 En la aplicación para ganado, aves de corral, mascotas, etc., se puede usar los principios activos de fórmula (I) como formulaciones (por ejemplo, polvos, emulsiones, agentes fluidos) que contienen el principio activo en una cantidad de 1 a 80 % en peso, directamente o después de dilución a 100 a 10.000 veces, o se usan como baño químico.

Además se ha encontrado que los compuestos de acuerdo con la invención muestran un elevado efecto insecticida frente a insectos que degradan materiales industriales.

- 25 Por ejemplo y preferentemente, sin embargo sin limitación, se citan los siguientes insectos:

escarabajos como *Hylotrupes bajulus*, *Chlorophorus pilosis*, *Anobium punctatum*, *Xestobium rufovillosum*, *Ptilinus pecticornis*, *Dendrobium pertinex*, *Ernobius mollis*, *Priobium carpini*, *Lyctus brunneus*, *Lyctus africanus*, *Lyctus planicollis*, *Lyctus linearis*, *Lyctus pubescens*, *Trogoxylon aequale*, *Minthes rugicollis*, *Xyleborus spec.* *Tryptodendron spec.* *Apate monachus*, *Bostrychus capucins*, *Heterobostrychus brunneus*, *Sinoxylon spec.* *Dinoderus minutus*;

- 30 himenópteros como *Sirex juvencus*, *Urocerus gigas*, *Urocerus gigas taignus*, *Urocerus augur*;

termitas como *Kaloterms flavicollis*, *Cryptoterms brevis*, *Heteroterms indicola*, *Reticuliterms flavipes*, *Reticuliterms santonensis*, *Reticuliterms lucifugus*, *Mastoterms darwiniensis*, *Zootermopsis nevadensis*, *Coptoterms formosanus*;

lepismas como *Lepisma saccharina*.

- 35 Por materiales industriales se entienden en el presente contexto materiales no vivos como, por ejemplo, plásticos, adhesivos, colas, papeles y cartones, cuero, madera, productos del procesamiento de la madera y agentes de recubrimiento.

Los agentes listos para uso pueden contener eventualmente otros insecticidas y eventualmente uno o varios fungicidas.

- 40 En lo que respecta a asociados de mezcla adicionales posibles se hace referencia a los insecticidas y fungicidas citados anteriormente.

Al mismo tiempo se pueden usar los compuestos de acuerdo con la invención para la protección de objetos contra la incrustación, especialmente cascos de embarcaciones, tamices, redes, edificios, atracaderos y balizas que se encuentren en contacto con agua de mar o salobre.

- 45 Además se pueden usar los compuestos de acuerdo con la invención solos o en combinaciones con otros principios activos como agentes anti-incrustación.

- 50 Los principios activos son adecuados también para el combate de parásitos animales en protección del hogar, higiene y provisiones, especialmente insectos, arácnidos y ácaros que se originan en espacios cerrados como, por ejemplo, viviendas, naves de fábricas, oficinas, cabinas de vehículos, entre otros. Estos se pueden usar para combatir estos parásitos solos o en combinación con otros principios activos y coadyuvantes en productos insecticidas para el hogar. Estos son efectivos contra variedades sensibles y resistentes así como contra todos los estados de desarrollo. A estos parásitos pertenecen:

Del orden de los escorpionideos, por ejemplo, *Buthus occitanus*.

Del orden de los acarinos, por ejemplo, *Argas persicus*, *Argas reflexus*, *Bryobia* ssp., *Dermanyssus gallinae*, *Glyciphagus domesticus*, *Ornithodoros moubat*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Trombicula alfreddugesi*, *Neutrombicula autumnalis*, *Dermatophagoides pteronissimus*, *Dermatophagoides forinae*.

Del orden de los Araneae, por ejemplo, *Aviculariidae*, *Araneidae*.

- 5 Del orden de los opiliones, por ejemplo, *Pseudoscorpiones chelifer*, *Pseudoscorpiones cheiridium*, *Opiliones phalangium*.

Del orden de los isópodos, por ejemplo, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*.

Del orden de los diplópodos, por ejemplo, *Blaniulus guttulatus*, *Polydesmus* spp.

Del orden de los quilópodos, por ejemplo, *Geophilus* spp.

- 10 Del orden de los ciguentomos, por ejemplo, *Ctenolepisma* spp., *Lepisma saccharina*, *Lepismodes inquilinus*.

Del orden de los blatarios, por ejemplo, *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Blattella asahinai*, *Leucophaea maderae*, *Panchlora* spp., *Parcoblatta* spp., *Periplaneta australasiae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Supella longipalpa*.

Del orden de los Saltatoria, por ejemplo, *Acheta domesticus*.

- 15 Del orden de los dermápteros, por ejemplo, *Forficula auricularia*.

Del orden de los isópteros, por ejemplo, *Kaloterms* spp., *Reticuliterms* spp.

Del orden de los psocópteros, por ejemplo, *Lepinatus* spp., *Liposcelis* spp.

- 20 Del orden de los coleópteros, por ejemplo, *Anthrenus* spp., *Attagenus* spp., *Dermestes* spp., *Latheticus oryzae*, *Necrobia* spp., *Ptinus* spp., *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus granarius*, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Stegobium paniceum*.

Del orden de los dípteros, por ejemplo, *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes taeniorhynchus*, *Anopheles* spp., *Calliphora erythrocephala*, *Chrysozona pluvialis*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex pipiens*, *Culex tarsalis*, *Drosophila* spp., *Fannia canicularis*, *Musca domestica*, *Phlebotomus* spp., *Sarcophaga carnaria*, *Simulium* spp., *Stomoxys calcitrans*, *Tipula paludosa*.

- 25 Del orden de los lepidópteros, por ejemplo, *Achroia grisella*, *Galleria mellonella*, *Plodia interpunctella*, *Tinea cloacella*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*.

Del orden de los sifonápteros, por ejemplo, *Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, *Xenopsylla cheopis*.

- 30 Del orden de los himenópteros, por ejemplo, *Camponotus herculeanus*, *Lasius fuliginosus*, *Lasius niger*, *Lasius umbratus*, *Monomorium pharaonis*, *Paravespula* spp., *Tetramorium caespitum*.

Del orden de los anopluros, por ejemplo, *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pemphigus* spp., *Phylloera vastatrix*, *Phthirus pubis*.

Del orden de los heterópteros, por ejemplo, *Cimex hemipterus*, *Cimex lectularius*, *Rhodinus prolixus*, *Triatoma infestans*.

- 35 La aplicación en el campo de los insecticidas domésticos se realiza solo o en combinación con otros principios activos adecuados como ésteres de ácido fosfórico, carbamatos, piretroides, neonicotinoides, reguladores del crecimiento o principios activos de otras clases de insecticidas conocidas.

- 40 La aplicación se realiza en aerosoles, pulverizadores sin presión, por ejemplo, pulverizadores de bombeo y atomización, nebulizadores automáticos, nebulizadores, espumas, geles, productos de vaporización con placas vaporizadoras de celulosa o plástico, vaporizadores de líquido, vaporizadores de gel y membrana, vaporizadores propulsores, sistemas de vaporización sin energía o pasivos, papeles antipolillas, saquitos antipolillas y geles antipolillas, en forma de gránulos o polvos, en cebos dispersados o trampas con cebo.

- 45 Los principios activos de acuerdo con la invención pueden usarse también como defoliantes, desecantes, agentes de destrucción vegetal y especialmente como agentes de destrucción de malas hierbas. Por malas hierbas se entienden en el sentido más amplio todas las plantas que crecen en lugares donde son indeseadas. Que las sustancias de acuerdo con la invención actúen como herbicidas totales o selectivos, depende esencialmente de las cantidades empleadas.

Los principios activos de acuerdo con la invención se pueden usar, por ejemplo, en las siguientes plantas:

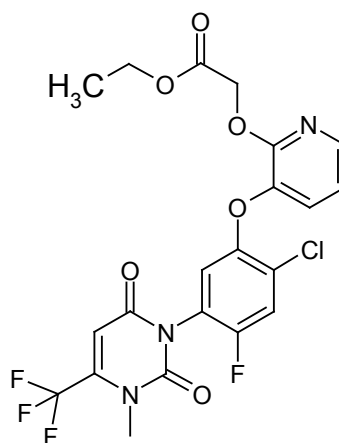
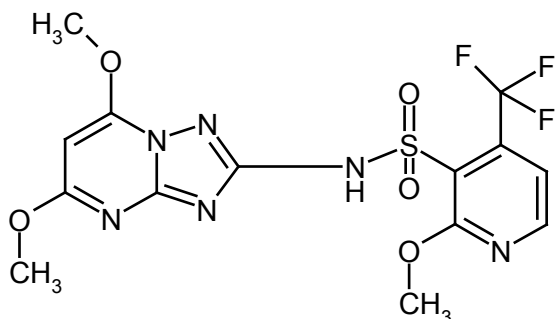
- Malas hierbas dicotiledóneas de los géneros: *Abutilon, Amaranthus, Ambrosia, Anoda, Anthemis, Aphanes, Atriplex, Bellis, Bidens, Capsella, Carduus, Cassia, Centaurea, Chenopodium, Cirsium, Convolvulus, Datura, Desmodium, Emex, Erysimum, Euphorbia, Galeopsis, Galinsoga, Galium, Hibiscus, Ipomoea, Kochia, Lamium, Lepidium, Lindernia, Matricaria, Mentha, Mercurialis, Mullugo, Myosotis, Papaver, Pharbitis, Plantago, Polygonum, Portulaca, Ranunculus, Raphanus, Rorippa, Rotala, Rumex, Salsola, Senecio, Sesbania, Sida, Sinapis, Solanum, Sonchus, Sphenoclea, Stellaria, Taraxacum, Thlaspi, Trifolium, Urtica, Veronica, Viola, Xanthium.*
- 5 Cultivos dicotiledóneos de los géneros: *Arachis, Beta, Brassica, Cucumis, Cucurbita, Helianthus, Daucus, Glycine, Gossypium, Ipomoea, Lactuca, Linum, Lycopersicon, Nicotiana, Phaseolus, Pisum, Solanum, Vicia.*
- Malas hierbas monocotiledóneas de los géneros: *Aegilops, Agropyron, Agrostis, Alopecurus, Apera, Avena, Brachiaria, Bromus, Cenchrus, Commelina, Cynodon, Cyperus, Dactyloctenium, Digitaria, Echinochloa, Eleocharis, Eleusine, Eragrostis, Eriochloa, Festuca, Fimbristylis, Heteranthera, Imperata, Ischaemum, Leptochloa, Lolium, Monochoria, Panicum, Paspalum, Phalaris, Phleum, Poa, Rottboellia, Sagittaria, Scirpus, Setaria, Sorghum.*
- 10 Cultivos monocotiledóneos de los géneros: *Allium, Ananas, Asparagus, Avena, Hordeum, Oryza, Panicum, Saccharum, Secale, Sorghum, Triticale, Triticum, Zea.*
- 15 El uso de los principios activos de acuerdo con la invención no está limitado sin embargo en modo alguno a estos géneros, sino que se extiende igualmente también a otras plantas.
- Los principios activos de acuerdo con la invención son adecuados dependiendo de la concentración para el control total de las malas hierbas, por ejemplo, en instalaciones industriales y ferroviarias, y en pasos y lugares con y sin vegetación arbórea. Igualmente, los principios activos de acuerdo con la invención pueden usarse para combatir
- 20 malas hierbas en cultivos permanentes, por ejemplo, bosques, instalaciones de maderas decorativas, fruta, vino, cítricos, nueces, plátanos, café, té, goma, aceite de palma, cacao, bayas y lúpulo, de hierbas decorativa y deportiva y superficies de pasto, así como para el control selectivo de malas hierbas en cultivos anuales.
- Los principios activos de acuerdo con la invención muestran una fuerte actividad herbicida y un amplio espectro de acción en la aplicación al suelo y a las partes aéreas de las plantas. Son adecuados a escala conocida también para
- 25 combatir selectivamente malas hierbas monocotiledóneas y dicotiledóneas en cultivos monocotiledóneos y dicotiledóneos, tanto en procedimientos de antes como de después del brote.
- Los principios activos de acuerdo con la invención se pueden usar en determinadas concentraciones o cantidades de aplicación también para combatir plagas animales y enfermedades fúngicas o bacterianas de plantas. Pueden usarse eventualmente también como productos intermedios o previos para la síntesis de principios activos adicionales.
- 30 Los principios activos se pueden transformar en las formulaciones habituales como soluciones, emulsiones, polvos de pulverización, suspensiones, polvos, productos en polvo, pastas, polvos solubles, gránulos, concentrados de suspensión-emulsión, sustancias naturales y sintéticas impregnadas con principio activo, así como microencapsulaciones en sustancias poliméricas.
- Estas formulaciones se preparan de modo conocido, por ejemplo, mediante mezclado de los principios activos con
- 35 diluyentes, como disolventes líquidos y/o vehículos sólidos, eventualmente usando agentes tensioactivos como emulsionantes y/o dispersantes y/o agentes productores de espuma.
- En caso de empleo de agua como diluyente, pueden usarse, por ejemplo, también disolventes orgánicos como coadyuvantes. Como disolventes líquidos se tienen en cuenta esencialmente: compuestos aromáticos como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, compuestos aromáticos clorados e hidrocarburos alifáticos clorados como clorobenceno,
- 40 cloroetileno o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos como ciclohexano o parafina, por ejemplo, fracciones de petróleo, aceites minerales y vegetales, alcoholes como butanol o glicol, así como sus éteres y ésteres, cetonas como acetona, metilacetona, metilisobutilcetona o ciclohexanona, disolventes polares fuertes como dimetilformamida y dimetilsulfóxido, así como agua.
- Como vehículos sólidos se tienen en cuenta, por ejemplo: sales de amoníaco y polvos de rocas naturales como caolín, arcilla, talco, creta, cuarzo, atapulgita, montmorillonita o tierra de diatomeas y polvos de rocas sintéticos como sílice de alta dispersión, óxido y silicato de aluminio; como vehículos sólidos para gránulos se tienen en cuenta, por
- 45 ejemplo: rocas naturales rotas y fraccionadas como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita, así como gránulos sintéticos de polvos inorgánicos y orgánicos, así como gránulos de material orgánico como papel, serrín, cáscaras de coco, mazorcas de maíz y tallos de tabaco; como agentes emulsionantes y/o productores de espuma se
- 50 tienen en cuenta, por ejemplo: agentes emulsionantes no ionogénicos y aniónicos como éster de ácido graso de polioxietileno, éter de alcohol graso de polioxietileno, por ejemplo, alquilarilpoliglicoléteres, alquilsulfonatos, alquilsulfatos, arilsulfonatos, así como hidrolizados de albúmina; como agentes de dispersión se tienen en cuenta, por ejemplo: lejías de lignina-sulfito y metilcelulosa.
- Se pueden usar en las formulaciones adhesivos como carboximetilcelulosa, polímeros naturales y sintéticos en forma
- 55 de polvo, grano o látex, como goma arábiga, poli(alcohol vinílico), poli(acetato de vinilo), así como fosfolípidos naturales como cefalinas y lecitinas y fosfolípidos sintéticos. Pueden ser otros aditivos aceites minerales y vegetales.

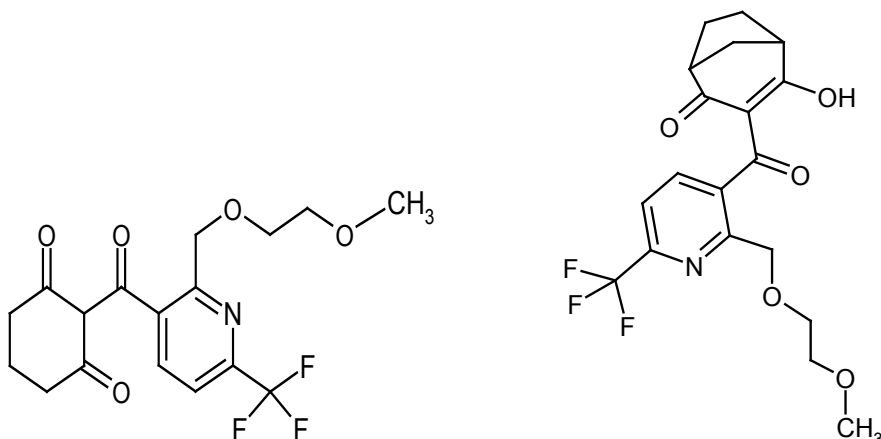
Se pueden usar colorantes como pigmentos inorgánicos, por ejemplo, óxido de hierro, óxido de titanio, azul de ferrocianuro y colorantes orgánicos como colorantes de alizarina, azo y ftalocianina metálica, y oligonutrientes como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc.

5 Las formulaciones contienen en general entre el 0,1 y el 95 % en peso de principio activo, preferentemente entre el 0,5 y el 90 %.

Los principios activos de acuerdo con la invención pueden usarse también, como tales o en sus formulaciones, mezclados con herbicidas conocidos y/o con sustancias que mejoran la tolerancia de las plantas de cultivo ("protectores") para combatir las malas hierbas, siendo posibles formulaciones preparadas o mezclas en tanque. Son posibles también pues mezclas con agentes de control de malas hierbas que contienen uno o varios herbicidas conocidos y un protector.

Para las mezclas se tienen en cuenta herbicidas conocidos, por ejemplo: 2-cloro-5-[2,6-dioxo-4-(trifluorometil)-3,6-dihidropirimidin-1(2H)-il]-4-fluoro-N-[metil(1-metiletil)sulfamoil]benzamida, acetoclor, acifluorfen (de sodio), aclonifeno, alaclor, aloxidim (de sodio, ametrina, amicarbazona, amidoclor, amidosulfurón, aminopiraldia, anilofós, asulam, atrazina, azafenidina, azimsulfurón, beflubutamida, benazolina (etilo), benfuresato, bensulfurón (metilo), bentazón, bencarbazona, benzfendizona, benzobiciclón, benzofenap, benzoilprop (etilo), bialafós, bifenox, bispiribac (de sodio), bromobutida, bromofenoxim, bromoxinil, butaclor, butafenacil (alilo), butroxidim, butilato, cafenestrol, caloxidim, carbetamida, carfentrazona (etilo), clometoxifeno, clorambeno, cloridazón, clorimurón (etilo), clornitrofen, clorsulfurón, clortolurón, cinidón (etilo), cinmetilina, cinosulfurón, clefoxidim, cletodim, clodinafop (propargilo), clomazona, clomeprop, clopiraldia, clopirasulfurón (metilo), cloransulam (metilo), cumilurón, cianazina, ciburtrina, cicloato, ciclosulfamurón, cicloxidim, cihalofop (butilo), 2,4-D, 2,4-DB, desmedifam, dialato, dicamba, diclorprop (-P), diclofop (metilo), diclosulam, dietatil (etilo), difenzoquat, diflufenicán, diflufenzopir, dimefurón, dimepiperato, dimetaclor, dimetametrina, dimetenamida, dimexiflam, dinitramina, difenamida, diquat, ditiopir, diurón, dimrón, epropodán, EPTC, esprocarb, etalfuralina, etametsulfurón (metilo), etofumesato, etoxifén, etoxisulfurón, etobenzanida, fenoxaprop (-P-etilo), fentrazamida, flamprop (-isopropilo, -isopropilo-L, -metilo), flazasulfurón, florasulam, fluazifop (-P-butilo), fluazolato, flucarbazona (de sodio), flufenacet, flumetsulam, flumiclorac (-pentilo), flumioxazina, flumipropina, flumetsulam, fluometurón, fluorocloridona, fluoroglicofén (-etilo), flupoxam, flupropacil, flurpirsulfurón (-metilo, de sodio), flurenol (-butilo), fluridona, fluroxipir (-butoxipropilo, -meptilo), flurprimidol, flurtamona, flutiacet (-metilo), fluti-amida, fomesafén, foramsulfurón, glufosinato (-de amonio), glifosato (-isopropilamonio), halosafén, haloxyfop (-etoxi-etilo, -P-metilo), hexazinona, HOK-201, imazametabenz (-metilo), imazametapir, imazamox, imazapic, imazapir, imazaquin, imazetapir, imazosulfurón, yodosulfurón (-metilo, de sodio), ioxinil, isopropalina, isoproturón, isourón, isoxabén, isoxaclortol, isoxaflutol, isoxapirifop, lactofén, lenacil, linurón, MCPA, mecoprop, mefenacet, mesosulfurona, mesotriona, metamifop, metamitrón, metazaclor, metabenztiázurón, metobenzurón, metobromurón, (alfa-) metolaclor, metosulam, metoxurón, metribuzín, metsulfurón (-metilo), molinato, monolinurón, naproanilida, napropamida, neburón, nicosulfurón, norflurazón, orbencarb, ortosulfamurón, orizalina, oxadiargil, oxadiazón, oxasulfurón, oxaziclo-mefona, oxifluorfen, paraquat, ácido pelargónico, pendimetalina, pendralina, penoxsulam, pentoxazona, fenmedifam, picolinafén, pinoxadén, piperofós, pretilaclor, primisulfurón (-metilo), profluazol, prometrina, propaclor, propanil, propaquizafop, propisoclor, propoxicarbazona (de sodio), propizamida, prosulfocarb, prosulfurón, pirafiflufén (-etilo), pirasulfotol, pirazogil, pirazolato, pirazosulfurón (-etilo), pirazoxifén, piribenzoxim, piributicarb, piridato, piridatol, piri-ftalid, piriminobac (-metilo), pirimisulfán, piritiobac (de sodio), piroxasulfona, quinclorac, quinmerac, quinoclamina, quizalofop (-P-etilo, -P-tefurilo), rimsulfurón, setoxidim, simazina, simetrina, sulcotriona, sulfentrazona, sulfometurón (-metilo), sulfosato, sulfosulfurón, tebutam, tebutiurón, tembotriona, tepraloxidim, terbutilazina, terbutrina, tenilclor, tiafluamida, tiazopir, tidiazimina, tifensulfurón (-metilo), tiobencarb, tiocarbazil, topamezona, tralcoxidim, trialato, tria-sulfurón, tribenurón (-metilo), triclopir, tridifano, trifluralina, trifloxisulfurón, triflusulfurón (-metilo), tritosulfurón y





También es posible una mezcla con otros principios activos conocidos como fungicidas, insecticidas, acaricidas, nematocidas, sustancias protectoras frente a daños por aves, nutrientes de plantas y agentes de mejora de la estructura del suelo.

5 Los principios activos o combinaciones de principios activos se pueden emplear como tales, en forma de sus formulaciones o de las formas de aplicación preparadas a partir de ellas mediante dilución adicional, como soluciones, suspensiones, emulsiones, polvos, pastas y gránulos listos para uso. La aplicación ocurre de modo habitual, por ejemplo, mediante vertido, pulverización, atomización, dispersión.

10 Los principios activos o combinaciones de principios activos de acuerdo con la invención se pueden aplicar tanto antes como después del brote de las plantas. Se pueden incorporar también antes de la siembra en el suelo.

La cantidad de principio activo empleada puede oscilar en un gran intervalo. Depende esencialmente del tipo de efecto deseado. En general, las cantidades de aplicación se encuentran entre 1 g y 10 kg de principio activo por hectárea de superficie de suelo, preferentemente entre 5 g y 5 kg por ha.

15 El efecto ventajoso de la tolerancia por las plantas de cultivo de las combinaciones de principios activos de acuerdo con la invención es especialmente muy pronunciado a determinadas relaciones de concentración. Sin embargo, las relaciones en peso de principio activo en las combinaciones de principios activos pueden variar en intervalos relativamente grandes. En general, corresponden a 1 parte en peso de principio activo de fórmula (I) de 0,001 a 1000 partes en peso, preferentemente 0,01 a 100 partes en peso, de forma especialmente preferente 0,05 a 20 partes en peso de uno de los compuestos de mejora de la tolerancia por las plantas de cultivo (antídotos/protectores) citados anteriormente en (b').

20 Las combinaciones de principios activos de acuerdo con la invención se aplican en general en forma de formulaciones preparadas. Sin embargo, los principios activos contenidos en las combinaciones de principios activos pueden mezclarse también en formulaciones individuales en la aplicación, es decir, aplicarse en forma de mezclas en tanque.

25 Para determinados fines de aplicación, especialmente en el procedimiento post-emergencia, puede ser ventajoso además incorporar a las formulaciones como aditivos adicionales aceites minerales o vegetales tolerables para plantas (por ejemplo, el preparado comercial "Rako Binol") o sales de amonio como, por ejemplo, sulfato de amonio o rodanuro de amonio.

30 Las nuevas combinaciones de principios activos pueden emplearse como tales, en forma de sus formulaciones o de las formas de aplicación preparadas mediante dilución adicional a partir de las mismas, como soluciones, suspensiones, emulsiones, polvos, pastas y gránulos listos para usar. La aplicación ocurre de modo habitual, por ejemplo, mediante vertido, pulverización, atomización, espolvoreo o dispersión.

35 Las cantidades de aplicación de las combinaciones de principios activos de acuerdo con la invención pueden variar en un intervalo conocido; dependen, entre otras cosas, del tiempo y de factores del suelo. En general, las cantidades de aplicación se encuentran entre 0,001 y 5 kg por ha, preferentemente entre 0,005 y 2 kg por ha, de forma especialmente preferente entre 0,01 y 0,5 kg por ha.

Las combinaciones de principios activos de acuerdo con la invención se pueden aplicar antes y después del brote de las plantas, como en procedimientos de antes y de después del brote.

40 Los protectores que se van a usar de acuerdo con la invención se pueden usar según sus propiedades para el pretratamiento de la semilla de la planta de cultivo (desinfección de semilla) o antes de incorporar la semilla en el surco de semilla, o emplearse separadamente antes del herbicida o emplearse junto con el herbicida antes o

después de la emergencia de las plantas.

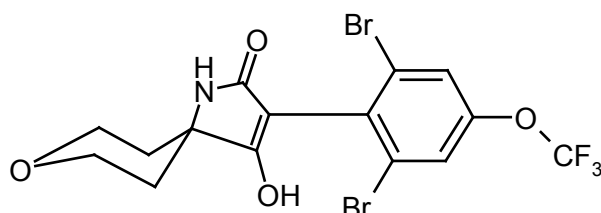
Como ejemplos de plantas, se citan las plantas de cultivo importantes, como cereales (trigo, cebada, arroz), maíz, soja, patata, algodón, colza, nabo, caña de azúcar, así como plantas frutales (con las frutas manzana, peras, frutas cítricas y uvas de vino), destacando especialmente cereales, maíz, soja, patata, algodón y colza.

- 5 El término "principio activo" incluye siempre también las combinaciones de principios activos aquí citadas.

La preparación y el uso de los principios activos de acuerdo con la invención se desprende de los siguientes ejemplos.

Ejemplos de aplicación

Ejemplo I-a-1

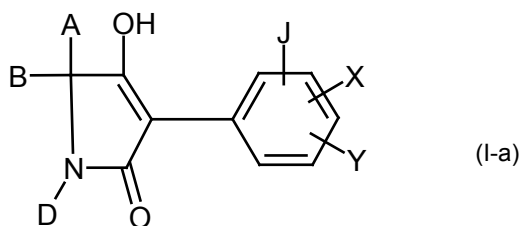


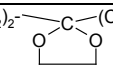
- 10 Se disponen en atmósfera de argón 4,26 g de *tert*-butilato de potasio (36 mmol) en 10 ml de dimetilacetamida. Se añaden gota a gota a de -20 a -30 °C 8,5 g (16,4 mmol) del compuesto según el ejemplo II-1 en 15 ml de dimetilacetamida. Se agita durante 1 hora a 20 °C (control por cromatografía en capa fina). Finalizada la reacción se agita la solución de reacción en 100 ml de agua enfriada con hielo, se ajusta a pH 2 con ácido clorhídrico concentrado y se filtra el precipitado con succión. Se disuelve de nuevo el precipitado en 40 ml de diclorometano y se añaden gota a gota 20 ml de solución de NaOH 0,5 N. Se agita durante 1 hora a 20 °C. Se ajusta la fase acuosa a pH 2 y se filtra el precipitado con succión.
- 15

Se continúa con purificación en cromatografía en columna en gel de sílice (diclorometano:éster etílico de ácido acético = 5:3).


- 20 Rendimiento: 4,2 g (51 % del valor teórico), p.f. 259 °C.

De forma análoga al **ejemplo (I-a-1)** y según las indicaciones generales para la preparación se obtiene los siguientes compuestos de fórmula (I-a)







Ej. nº	J	X	Y	D	A	B	P.f. °C	Isómero
I-a-2	2-OCF ₃	H	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		228	β
I-a-3	5-OCF ₃	2-Br	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		258	β
I-a-4	5-OCF ₃	2-Br	H	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		138	-
I-a-5	5-OCF ₃	2-Br	H	H	-(CH ₂) ₂ -  -(CH ₂) ₂ -		230	-
I-a-6	5-OCF ₃	2-Br	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -		96	β
I-a-7	4-OCF ₃	2-Br	6-Br	H	-CH ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₃ -		372	α
I-a-8	4-OCF ₃	2-Br	6-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		*1,46-1,57 (m,2H,CH ₂); 2,20 (s,3H,Ar-CH ₃);	

ES 2 372 319 T3

Ej. nº	J	X	Y	D	A	B	P.f. °C	Isómero
							3,73-3,79 (m,2H, <u>OCH₂</u>); 3,99-4,03 (m,2H, <u>OCH₂</u>); 7,42-7,43 (d,1H,Ar <u>H</u>)	
I-a-9	4-OCF ₃	2-Br	6-Br	H	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ - (CH ₂) ₂ -		170	β
I-a-10	4-OCF ₃	2-Br	6-Cl	H	CH ₃	CH ₃	108-111	-
I-a-11	4-OCF ₃	2-Br	6-Cl	H	-CH ₂ -CHOC ₄ H ₉ -(CH ₂) ₃ -		110-112	β
I-a-12	4-OCF ₃	2-Br	6-Cl	-(CH ₂) ₃ -		H	220-221	-
I-a-13	4-OCF ₃	2-Br	6-Cl		CH ₃	H	100-102	-
I-a-14	4-OCF ₃	2-Br	6-Br	H	-CH ₂ -CHOC ₄ H ₉ -(CH ₂) ₃ -		106-110	β

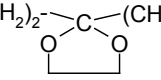
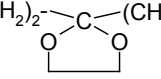
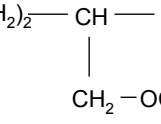
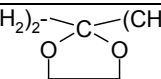
ES 2 372 319 T3

(continuación)

Ej. nº	J	X	Y	D	A	B	P.f. °C	Isómero
I-a-15	4-OCF ₃	2-Br	6-Br	-(CH ₂) ₃ -		H	229-231	-
I-a-16	4-OCF ₃	2-Br	6-Br		CH ₃	H	108-112	-
I-a-17	4-OCF ₃	2-Br	6-Br	H		CH ₃	98-100	-
I-a-18	4-OCF ₃	2-Br	6-Br	H	C ₂ H ₅	CH ₃	85-87	-
I-a-19	4-OCF ₃	2-Br	6-Cl	H		CH ₃	221-225	-
I-a-20	4-OCF ₃	2-Br	6-Cl	H	C ₂ H ₅	CH ₃	209-212	-
I-a-21	4-OCF ₃	2-OCH ₃	6-Br	H	CH ₃	CH ₃		-
I-a-22	4-OCF ₃	2-OCH ₃	6-Br	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		104-106	β
I-a-23	4-OCF ₃	2-OCH ₃	6-Cl	H	CH ₃	CH ₃	133-136	-
I-a-24	4-OCF ₃	2-OCH ₃	6-Cl	H	-CH ₂ -CHOC ₄ H ₉ -(CH ₂) ₃ -		93-96	β
I-a-25	4-OCF ₃	2-OCH ₃	6-Cl	-(CH ₂) ₃ -		H	170-172	-
I-a-26	4-OCF ₃	2-OCH ₃	6-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		170-173	β
I-a-27	4-OCF ₃	2-OCH ₃	6-Cl	H		CH ₃	79-82	-
I-a-28	4-OCF ₃	2-OCH ₃	6-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		121	-
I-a-29	4-OCF ₃	2-Cl	6-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		282	β
I-a-30	4-OCF ₃	2-Cl	6-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		251	-
I-a-31	4-OCF ₃	2-Br	6-Br	H	CH ₃	CH ₃	216	-
I-a-32	4-OCF ₃	2-Br	6-Br	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		280	β
I-a-33	4-OCF ₃	2-Br	6-Br	H	-CH ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₃ -		Cera	β
I-a-34	5-OCF ₃	2-Br	H	H	$-\text{CH}_2-\underset{\text{CH}_2-\text{OCH}_3}{\text{CH}}-(\text{CH}_2)_2-$		125	β
I-a-35	5-OCF ₃	2-Br	H	H	$-(\text{CH}_2)_2-\underset{\text{CH}_2-\text{OCH}_3}{\text{CH}}-(\text{CH}_2)_2-$		189	β
I-a-36	4-OCF ₃	2-OCH ₃	6-OCH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		*** 3.32(m, 1H, <u>CHO</u> CH ₃); 6.40(s, 2H, ArH)	β

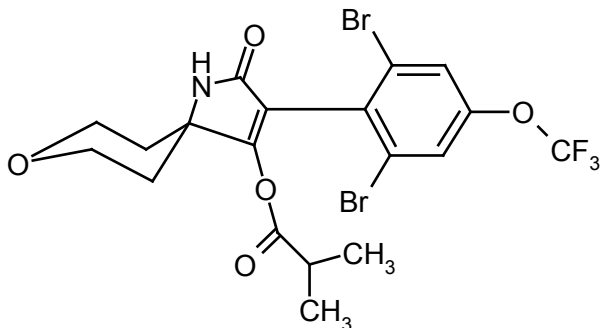
ES 2 372 319 T3

(continuación)

Ej. nº	J	X	Y	D	A	B	P.f. °C	Isómero
I-a-37	4-OCF ₃	2-CH ₃	6-CH ₃	H	-CH ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₃ -		109-112	B
I-a-38	4-OCF ₃	2-CH ₃	6-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		263-265	β
I-a-39	4-OCF ₃	2-Cl	6-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		270	β
I-a-40	4-OCF ₃	2-Cl	6-CH ₃	H	-CH ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		202-206	cis
I-a-41	4-OCF ₃	2-Cl	6-CH ₃	H	-CH ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		75-95	trans
I-a-42	4-OCF ₃	2-OCH ₃	6-Cl	H			Descomposición	-
I-a-43	4-OCF ₃	2-Cl	6-Cl	H			272	-
I-a-44	4-OCF ₃	2-Br	6-Br	H			240	β
I-a-45	4-OCF ₃	2-Br	6-Br	H			291	-
I-a-46	2-OCF ₃	4-Br	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		253	β
I-a-47	2-OCF ₃	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		245	-
I-a-48	2-OCF ₃	6-Cl	4-Br	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		258	-
I-a-49	2-OCF ₃	6-CH ₃	4-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		216-219	β
I-a-50	2-OCF ₃	6-CH ₃	4-CH ₃	H	-CH ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₃ -		189-192	β
I-a-51	2-OCF ₃	6-OCH ₃	4-Br	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		208	-
I-a-52	2-OCF ₃	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		239	β
I-a-53	2-OCF ₃	6-Br	4-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		275	-
I-a-54	2-OCF ₃	6-OCH ₃	4-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		224	-
I-a-55	2-OCF ₃	6-Cl	4-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		** 1.2-1.34 (m,2H, <u>CH</u> ₂) - 2,37 (s,3H- Ar <u>CH</u> ₃ 3,83-3,88 (m,2H, <u>OCH</u> ₂), 7,14, 7,34 (2s,2H, <u>ArH</u>)	-
I-a-56	2-OCF ₃	4-Br	H	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		246	-
I-a-57	2-OCF ₃	6-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		254	β
I-a-58	2-OCF ₃	6-Br	4-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		280	β

(continuación)

Ej. nº	J	X	Y	D	A	B	P.f. °C	Isómero
I-a-59	2-OCF ₃	6-Br	4-Br	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		280	B
I-a-60	2-OCF ₃	6-Cl	4-Br	H	-CH ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₃ -		73	β
I-a-61	2-OCF ₃	6-OCH ₃	4-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		196-198	β
I-a-62	2-OCF ₃	6-Cl	4-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		209-210	β
I-a-63	2-OCF ₃	6-Cl	4-CH ₃	H	-CH ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₃ -		189-192	β
I-a-64	2-OCF ₃	6-Cl	4-CH ₃	H	-CH ₂ -CHOC ₃ H ₇ -(CH ₂) ₃ -		105-108	β
I-a-65	2-OCF ₃	6-OCH ₃	4-Cl	H	-CH ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₃ -		89-91	β
I-a-66	2-OCF ₃	6-C ₂ H ₅	4-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		237-240	β
I-a-67	2-OCF ₃	6-C ₂ H ₅	4-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -CH-(CH ₂) ₂ - CH ₂ -OCH ₃		201-204	β
I-a-68	2-OCF ₃	6-CH ₃	4-Cl	H	-CH ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₃ -		222-223	β
I-a-69	2-OCF ₃	6-CH ₃	4-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		280-282	β
I-a-70	2-OCF ₃	6-Cl	4-Br	H	-(CH ₂) ₂ -C(CH ₂) ₂ - O		209	-
I-a-71	2-OCF ₃	6-Cl	4-Br	H	CH ₃	CH ₃	181	-
I-a-72	2-OCF ₃	6-Cl	4-Br	H	-(CH ₂) ₂ -C(CH ₂) ₂ - O		257	-
I-a-73	2-OCF ₃	6-C ₂ H ₅	4-Cl		-(CH ₂) ₃ -	H	217-220	

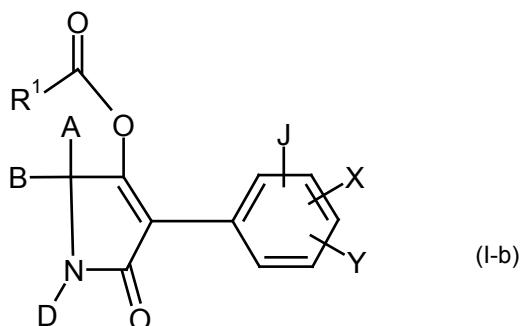
* RMN ¹H (400 MHz, d₄-metanol): desplazamientos δ en ppm** RMN ¹H (400 MHz, d₆-DMSO): desplazamientos δ en ppm*** RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃): desplazamientos δ en ppm5 **Ejemplo I-b-1**





Se disponen 0,5 g (1 mmol) del compuesto según el ejemplo I-a-1 en éster etílico de ácido acético en atmósfera de argón, se añaden 0,14 ml de trietilamina más 10 mg de base de Steglich y se añaden gota a gota a reflujo 0,1 ml de cloruro de 2-metil-propionilo disueltos en 5 ml de éster etílico de ácido acético y después se agita a reflujo.

10 Finalizada la reacción (control por cromatografía en capa fina) se realiza una separación en columna de fase inversa (agua/acetonitrilo: 50/50 → 10/90).

Rendimiento: 0,23 g (40 % del valor teórico), p.f. 219 °C.


De forma análoga al **ejemplo (I-b-1)** y según las indicaciones generales para la preparación se obtiene los siguientes compuestos de fórmula (I-b)



Ej. nº	J	X	Y	D	A	B	R ¹	P.f. °C	Isómero
I-b-2	5-OCF ₃	2-Br	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		i-C ₃ H ₇	165	β
I-b-3	5-OCF ₃	2-Br	H	H	-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₂ -OCH ₃)-(CH ₂) ₂ -		i-C ₃ H ₇	156	β
I-b-4	4-OCF ₃	2-Br	6-Cl		CH ₃	H	i-C ₃ H ₇	aceite, * 1)	-
I-b-5	4-OCF ₃	2-Br	6-Br	H	-CH ₂ -CHOC ₄ H ₉ -(CH ₂) ₃ -		i-C ₃ H ₇	182- 185	β
I-b-6	4-OCF ₃	2-Br	6-Cl	H		CH ₃	i-C ₃ H ₇	156- 159	-
I-b-7	4-OCF ₃	2-Br	6-Br	H		CH ₃	i-C ₃ H ₇	150- 156	-
I-b-8	4-OCF ₃	2-Br	6-Br	H	C ₂ H ₅	CH ₃	i-C ₃ H ₇	129- 132	-
I-b-9	4-OCF ₃	2-Br	6-Cl	H	-CH ₂ -CHOC ₄ H ₉ -(CH ₂) ₃ -		i-C ₃ H ₇	183- 186	β
I-b-10	4-OCF ₃	2-Br	6-Br	-(CH ₂) ₃ -		H	i-C ₃ H ₇	** 2)	-
I-b-11	4-OCF ₃	2-Br	6-Cl		CH ₃	H	i-C ₃ H ₇	** 3)	-
I-b-12	4-OCF ₃	2-Br	6-Cl	H	C ₂ H ₅	CH ₃	i-C ₃ H ₇	135- 141	-
I-b-13	4-OCF ₃	2-OCH ₃	6-Br	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		i-C ₃ H ₇	204	β
I-b-14	4-OCF ₃	2-Br	6-Cl	-(CH ₂) ₃ -		H	i-C ₃ H ₇	** 4)	-
I-b-15	4-OCF ₃	2-OCH ₃	6-Cl	H	-CH ₂ -CHOC ₄ H ₉ -(CH ₂) ₃ -		i-C ₃ H ₇	178- 186	β
I-b-16	4-OCF ₃	2-OCH ₃	6-Cl	-(CH ₂) ₃ -		H	i-C ₃ H ₇	** 5)	-

ES 2 372 319 T3

(continuación)

Ej. nº	J	X	Y	D	A	B	R ¹	P.f. °C	Isómero
I-b-17	4-OCF ₃	2-OCH ₃	6-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		i-C ₃ H ₇	198	β
I-b-18	4-OCF ₃	2-OCH ₃	6-Cl	H		CH ₃	i-C ₃ H ₇	153-174	-
I-b-19	4-OCF ₃	2-OCH ₃	6-Cl	H	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇	110-118	-
I-b-20	4-OCF ₃	2-Cl	6-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		i-C ₃ H ₇	190	β
I-b-21	4-OCF ₃	2-Cl	6-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	212	β
I-b-22	4-OCF ₃	2-Cl	6-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		i-C ₃ H ₇	159-161	β
I-b-23	4-OCF ₃	2-Br	6-Br	H	-(CH ₂) ₂ -CH-(CH ₂) ₂ - CH ₂ -OCH ₃		i-C ₃ H ₇	204	β
I-b-24	2-OCF ₃	6-CH ₃	4-CH ₃	H	-CH ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₃ -		CH ₃	228-230	β
I-b-25	2-OCF ₃	6-CH ₃	4-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	202-205	β
I-b-26	2-OCF ₃	6-CH ₃	4-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		i-C ₃ H ₇	207	β
I-b-27	2-OCF ₃	6-C ₂ H ₅	4-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -CH-(CH ₂) ₂ - CH ₂ -OCH ₃		i-C ₃ H ₇	* 6)	β
I-b-28	2-OCF ₃	6-CH ₃	4-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	* 7)	β

1) 2,61 (m, 1H, CH(C5)); 2,70 (m, 1H (CH(CH₃)₂)); 7,31, 7,44 (cada unos dd, 1H, ArH)

2) 2,70 (m, 1H, CH(CH₃)₂); 4,79 (m, 1H, CH(C5)); 7,47 (dd, 2-H, ArH)

3) 2,62 (m, 1H CH(C5)); 2,70 (m, 1H, CH(CH₃)₂); 7,47 (dd, 1H ArH)

5 4) 2,67 (m, 1H CH(CH₃)₂); 4,75 (m, 1H, CH(C5)); 7,31, 7,43 (cada uno dd, 1H, ArH)

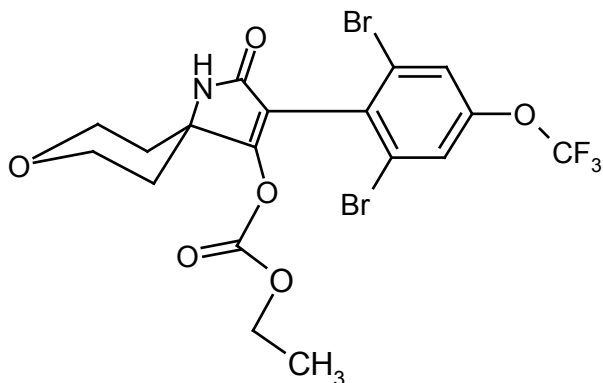
5) 2,66 (m, 1H CH(CH₃)₂); 4,70 (m, 1H, CH(C5)); 6,68, 6,96 (cada uno dd, 1H, ArH)

6) 2,62 (m, 1H, CH(CH₃)₂); 2,71 (m, 2H, ArCH₂(CH₃)); 3,36 (s, 3H, OCH₃)

7) 2,1 (s, 3H, COCH₃); 2,33 (s, 3H, ArCH₃); 3,40 (s, 3H, OCH₃)

* RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃): desplazamientos δ en ppm

10 ** RMN ¹H (300 MHz, CDCl₃): desplazamientos δ en ppm

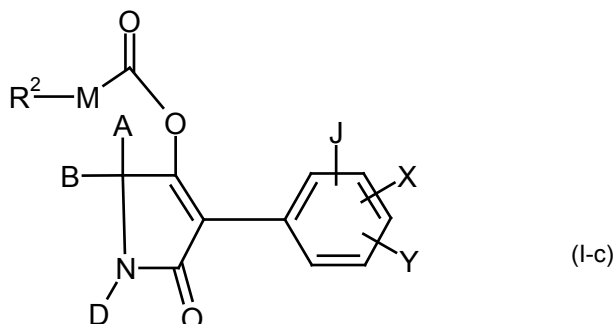
Ejemplo I-c-1

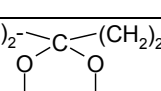
5 Se disponen 0,5 g (1 mmol) del compuesto según el **ejemplo I-a-1** en atmósfera de argón en cloruro de metileno, se añaden 0,14 ml de trietilamina y se añade gota a gota a aproximadamente 20 °C el éster de ácido clorofórmico (0,1 ml) disuelto en 5 ml de diclorometano y se agita a de 20 a 30 °C.

Finalizada la reacción (control por cromatografía en capa fina) se realiza una separación en columna de fase inversa (agua/acetonitrilo: 50/50 → 10/90).

Rendimiento: 0,415 g (74 % del valor teórico), p.f. 194 °C.





10 De forma análoga al **ejemplo (I-c-1)** y según las indicaciones generales para la preparación se obtiene los siguientes compuestos de fórmula (I-c):



Ej. nº	J	X	Y	D	A	B	M	R ²	P.f.°C	Isó-mero
I-c-2	5-OCF ₃	2-Br	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ - (CH ₂) ₂ -		O	C ₂ H ₅	161	β
I-c-3	5-OCF ₃	2-Br	H	H	-(CH ₂) ₂ - 		O	C ₂ H ₅	201	-
I-c-4	5-OCF ₃	2-Br	H	H	-(CH ₂) ₂ -CH-(CH ₂) ₂ - CH ₂ -OCH ₃		O	C ₂ H ₅	182	β
I-c-5	4-OCF ₃	2-Br	6-Br	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ - (CH ₂) ₂ -		O	C ₂ H ₅	166	β
I-c-6	4-OCF ₃	2-Br	6-Cl	H	-CH ₂ -CHOC ₄ H ₉ - (CH ₂) ₃ -		O	C ₂ H ₅	184	β

ES 2 372 319 T3

(continuación)

Ej. nº	J	X	Y	D	A	B	M	R ²	P.f.°C	Isó- mero	
I-c-7	4-OCF ₃	2-Br	6-Cl			-(CH ₂) ₃ -	H	O	C ₂ H ₅	* 1)	-
I-c-8	4-OCF ₃	2-Br	6-Cl		CH ₃		H	O	C ₂ H ₅	Aceite viscoso * 2)	-
I-c-9	4-OCF ₃	2-Br	6-Br	H		-CH ₂ -CHOC ₄ H ₉ - (CH ₂) ₃ -		O	C ₂ H ₅	201	β
I-c-10	4-OCF ₃	2-Br	6-Br			-(CH ₂) ₃ -	H	O	C ₂ H ₅	Aceite viscoso * 3)	-
I-c-11	4-OCF ₃	2-Br	6-Br		CH ₃		H	O	C ₂ H ₅	Aceite viscoso * 4)	-
I-c-12	4-OCF ₃	2-Br	6-Cl	H		CH ₃		O	C ₂ H ₅	143	-
I-c-13	4-OCF ₃	2-Br	6-Br	H		CH ₃		O	C ₂ H ₅	126-130	-
I-c-14	4-OCF ₃	2-Br	6-Br	H	C ₂ H ₅	CH ₃		O	C ₂ H ₅	110-114	-
I-c-15	4-OCF ₃	2-Br	6-Cl	H	C ₂ H ₅	CH ₃		O	C ₂ H ₅	130-131	-
I-c-16	4-OCF ₃	2-OCH ₃	6-Br	H		-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ - (CH ₂) ₂ -		O	C ₂ H ₅	177-179	β
I-c-17	4-OCF ₃	2-OCH ₃	6-Cl	H		-CH ₂ -CHOC ₄ H ₉ - (CH ₂) ₃ -		O	C ₂ H ₅	188-190	β
I-c-18	4-OCF ₃	2-OCH ₃	6-Cl	H		-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ - (CH ₂) ₂ -		O	C ₂ H ₅	147-150	β
I-c-19	4-OCF ₃	2-OCH ₃	6-Cl			-(CH ₂) ₃ -	H	O	C ₂ H ₅	1,30 (m, 3H, O-CH, CH ₃), 4,67 (m, 1H, N-C H), 6,52, 6,92 (2d, cada uno 1H, Ar-H)	-
I-c-20	4-OCF ₃	2-Cl	6-Cl	H		-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ - (CH ₂) ₂ -		O	C ₂ H ₅	164	β
I-c-21	4-OCF ₃	2-Cl	6-Cl	H		-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		O	C ₂ H ₅	212	-

ES 2 372 319 T3

(continuación)

Ej. nº	J	X	Y	D	A	B	M	R ²	P.f.°C	Isó- mero
I-c-22	4-OCF ₃	2-CH ₃	6-CH ₃	H		-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ - (CH ₂) ₂ -	O	C ₂ H ₅	182-183	β
I-c-23	4-OCF ₃	2-CH ₃	6-CH ₃	H		-CH ₂ -CHOC ₂ H ₅ - (CH ₂) ₃ -	O	C ₂ H ₅	205-206	β
I-c-24	4-OCF ₃	2-Cl	6-CH ₃	H		-CH ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	O	C ₂ H ₅	86-89	cis
I-c-25	4-OCF ₃	2-Cl	6-CH ₃	H		-CH ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	O	C ₂ H ₅	146-149	trans
I-c-26	4-OCF ₃	2-Cl	6-CH ₃	H		-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ - (CH ₂) ₂ -	O	C ₂ H ₅	163-165	β
I-c-27	4-OCF ₃	2-Br	6-Br	H		-(CH ₂) ₂ -CH-(CH ₂) ₂ - CH ₂ -OCH ₃	O	C ₂ H ₅	201	β
I-c-28	2-OCF ₃	6-C ₂ H ₅	4-Cl		-(CH ₂) ₃ -	H	O	CH ₂ - C ₆ H ₅	* 5)	-
I-c-29	2-OCF ₃	6-CH ₃	4-CH ₃	H		-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ - (CH ₂) ₂ -	O	C ₂ H ₅	210-212	β
I-c-30	2-OCF ₃	6-CH ₃	4-CH ₃	H		-CH ₂ -CHOC ₂ H ₅ - (CH ₂) ₃ -	O	C ₂ H ₅	203	β
I-c-31	2-OCF ₃	6-OCH ₃	4-Cl	H		-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ - (CH ₂) ₂ -	O	C ₂ H ₅	168-170	β
I-c-32	2-OCF ₃	6-C ₂ H ₅	4-Cl	H		-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ - (CH ₂) ₂ -	O	C ₂ H ₅	139-141	β
I-c-33	2-OCF ₃	6-C ₂ H ₅	4-Cl	H		-(CH ₂) ₂ -CH-(CH ₂) ₂ - CH ₂ -OCH ₃	O	C ₂ H ₅	160-162	β
I-c-34	2-OCF ₃	6-CH ₃	4-Cl	H		-CH ₂ -CHOC ₂ H ₅ - (CH ₂) ₃ -	O	C ₂ H ₅	186-188	β
I-c-35	2-OCF ₃	6-OCH ₃	4-Cl	H		-CH ₂ -CHOC ₂ H ₅ - (CH ₂) ₃ -	O	C ₂ H ₅	186-187	β
I-c-36	2-OCF ₃	6-Cl	4-CH ₃	H		-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ - (CH ₂) ₂ -	O	C ₂ H ₅	227-228	β
I-c-37	2-OCF ₃	6-Cl	4-CH ₃	H		-CH ₂ -CHOC ₂ H ₅ - (CH ₂) ₃ -	O	C ₂ H ₅	144-145	β
I-c-38	2-OCF ₃	6-CH ₃	4-Cl	H		-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ - (CH ₂) ₂ -	O	C ₂ H ₅	* 6	β
I-c-39	2-OCF ₃	6-C ₂ H ₅	4-Cl	H		-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ - (CH ₂) ₂ -	O	CH ₃	* 7	β

1) 4,29 (m, 2H, OCH₂-CH₃); 4,81 (m, 1H, CH (C5)); 7,33, 7,47 (cada uno dd, 1H, ArH)

2) 2,62 (m, 1H, CH (C5)); 4,26 (m, 2H, OCH₂CH₃); 7,32, 7,45 (cada uno dd, 1H, ArH)

3) 4,27 (c, 2H, OCH₂); 4,80 (m, 1H, CH (C5)); 7,47 (dd, 2H, ArH)

4) 2,62 (m, 1H, CH (C5)); 4,26 (m, 2H, OCH₂); 7,47 (d, 2H, ArH)

5) 1,08 (m, 3H, Ar-CH₂-CH₃); 4,76 (m, 1H, CH (C5)); 5,2 (d, 2H, O-CH₂)

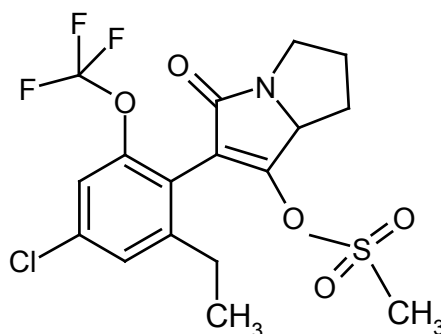
6) 2,33 (s, 3H, Ar CH_3); 3,38 (s, 3H, OCH_3); 4,08 (c, 2 H, OCH_2)

7) 2,67 (m, 2H, Ar- CH_2 - CH_3); 3,37 (s, 3H, OCH_3); 3,69 (s, 3H CO_2CH_3)

* RMN ^1H (400 MHz, CDCl_3): desplazamiento δ en ppm

** RMN ^1H (300 MHz, CDCl_3): desplazamiento δ en ppm

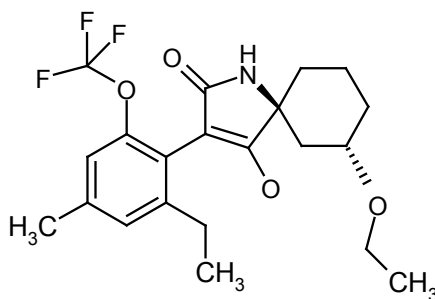
5 Ejemplo I-d-1



Se disponen 0,15 g (0,41 mmol) del compuesto según el ejemplo (I-a-73), 0,05 g de tritilamina y 5 mg de 4-N,N'-dimetilamino-piridina en 5 ml de cloroformo. Después de 10 minutos de agitación se añaden 0,05 g (0,45 mmol) de cloruro de ácido metanosulfónico y se agita durante la noche a temperatura ambiente. Se añade la mezcla de reacción sobre 5 ml de solución de hidrogenocarbonato de sodio al 5 %, se agita durante 10 minutos a temperatura ambiente, se separa la fase orgánica, se seca sobre sulfato de sodio y se evapora en el evaporador giratorio. Se realiza una purificación cromatográfica en gel de sílice en un equipo de separación de Biotage con un gradiente (éster etílico de ácido acético:n-heptano 1:4 hasta 4:1). Rendimiento: 0,052 g (28 % del valor teórico)

RMN ^1H (300 MHz, CDCl_3): δ = 3,04 (s, 3H, SOCH_3), 4,64 (m, 1H, CH (C5), 7,16, 7,22 (cada dd, 1H, Ar-H) ppm.

15 Ejemplo I-f-1

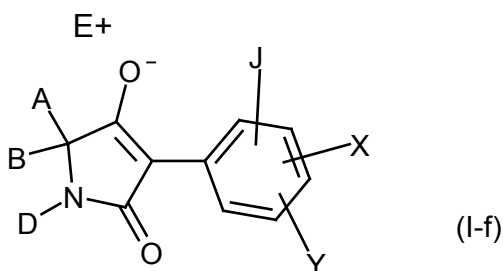


Na^+

Se disponen 0,15 g (0,38 mmol) del compuesto según el ejemplo (I-a-50) en 6 ml de metanol y se incorporan 0,07 ml de una solución de metilato de sodio al 30 %. Se concentra después de 2 horas de agitación a temperatura ambiente y se seca el residuo a alto vacío. Se obtiene 0,155 g (= 97 % del valor teórico) de un sólido.

RMN ^1H (400 MHz, D_2O): δ = 3,67 (m, 3H, O- CH y O- CH_2), 7,05, 7,13 (cada d, 1H, ArH) ppm.

De forma análoga al ejemplo (I-f-1) y según las indicaciones generales para la preparación se obtiene los siguientes compuestos de fórmula (I-f)



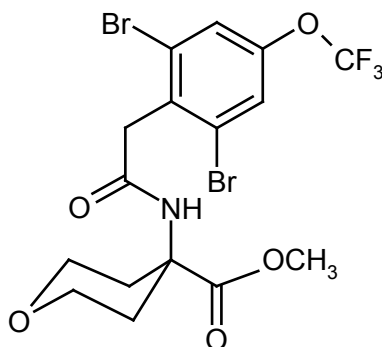
Ej. nº	J	X	Y	D	A	B	E	RMN	Isómero
I-f-2	2-OCF ₃	6-C ₂ H ₅	4-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		Na ⁺	* 1)	β
I-f-3	2-OCF ₃	4-CH ₃	6-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		Na ⁺	* 2)	β

1) 3,23 (s, 3H, OCH₃); 6,98, 7,11 (cada uno d, 1H, ArH)

2) 3,16 (s, 3H, OCH₃); 6,72, 7,85 (cada uno d, 1H, Ar-H)

5 * RMN ¹H (400 MHz, d₆-DMSO): desplazamiento δ en ppm

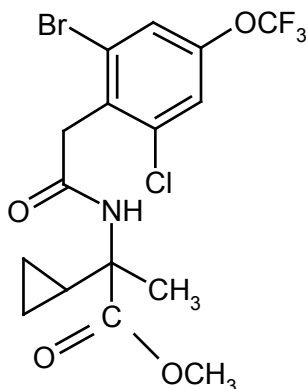
Ejemplo II-1



10 Se disponen en atmósfera de argón 4,3 g (22 mmol) de éster metílico de ácido 1-amino-tetrahidropiranyl-carboxílico x HCl en 40 ml de tetrahidrofurano exento de agua y se añaden 6,2 ml (44 mmol) de trietilamina. Se agita durante 5 min y se añaden 7,6 g de ácido 2,6-dibromo-4-trifluorometoxi-fenilacético, se agita de nuevo durante 15 min a temperatura ambiente, se añaden 4,4 ml de trietilamina y se añade gota a gota inmediatamente 1,2 ml de oxocloruro de fósforo de modo que la solución hierva moderadamente. Se agita durante 30 min a reflujo. Se evapora la mezcla de reacción a vacío y se purifica el residuo por cromatografía en columna en gel de sílice (diclorometano/éster etílico de ácido acético = 3:1)

15 Rendimiento: 8,5 g (79 % del valor teórico), p.f.: 212 °C

Ejemplo II-19

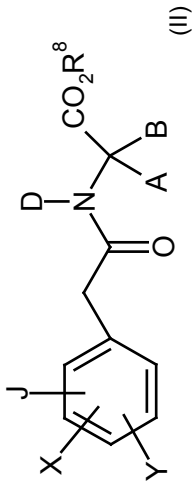


ES 2 372 319 T3

5 Se añaden a 2,513 ml de ácido sulfúrico 3,46 g (8,13 mmol) del compuesto según el **ejemplo XIX-1** en 10 ml de diclorometano. Se agita durante 3 h a 35 °C y se añaden 20 ml de metanol. Se agita durante 4 h a 60° y se agita luego a temperatura ambiente durante la noche. Se añaden otros 2 ml de ácido sulfúrico, ya que el educto aún no ha reaccionado. Se agita durante 4 horas a 60 °C. Según el control por cromatografía de capa fina se añade la solución de reacción sobre 100 ml de agua, se separa la fase orgánica y se seca sobre sulfato de sodio. Luego se evapora el disolvente usando el evaporador giratorio.


Rendimiento: 3,31 g (88 % del valor teórico)

De forma análoga a los ejemplos (II-1) y (II-19) y según las indicaciones generales para la preparación se obtiene los siguientes compuestos de fórmula (II):






Ej. nº	J	X	Y	D	A	B	R ⁸	P.f.°C	Isómero
II-2	2-OCF ₃	H	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	CH ₃	105	β
II-3	5-OCF ₃	2-Br	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	CH ₃	Aceite	β
II-4	5-OCF ₃	2-Br	H	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -	CH ₃	125	-
II-5	5-OCF ₃	2-Br	H	H	-(CH ₂) ₂ -C ₂ H ₄ O ₂ -(CH ₂) ₂ -	-(CH ₂) ₂ -C ₂ H ₄ O ₂ -(CH ₂) ₂ -	CH ₃	138	-
II-6	5-OCF ₃	2-Br	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -	CH ₃	100	β
II-7	4-OCF ₃	2-Br	6-Br	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₃ -	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₃ -	CH ₃	102	β
II-8	5-OCF ₃	2-Br	H	H	-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₂) ₂ -CH ₂ -OCH ₃	-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₂) ₂ -CH ₂ -OCH ₃	CH ₃	Cera	β
II-9	4-OCF ₃	2-Br	6-Br	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -	CH ₃	186	β
II-10	4-OCF ₃	2-Br	6-Cl	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	127-129	-

(continuación)

Ej. nº	J	X	Y	D	A	B	R ⁸	P.f.°C	Isómero
II-11	4-OCF ₃	2-Br	6-Cl	H	-CH ₂ -CHOC ₄ H ₉ -(CH ₂) ₃ -		CH ₃	*0,89 (t, 3H, <u>CH₃</u>) 3,97 (d, 2H, Ar- <u>CH₂</u>), 7,32 y 7,44 (cada unos, 1H, Ar- <u>H</u>)	Trans
II-12	4-OCF ₃	2-Br	6-Cl	-(CH ₂) ₃ -		H	CH ₃	*4,02 (d, 2H, Ar- <u>CH₂</u>) 7,26 y 7,38 (cada s, 1H, Ar- <u>H</u>), 4,53 (m, 1H, C(2)- <u>H</u>)	-
II-13	4-OCF ₃	2-Br	6-Cl		CH ₃	H	CH ₃	*1,51 (d, 3H, <u>CH₃</u>) 4,24 (s, 2H, Ar- <u>CH₂</u>) 7,26 y 7,38 (cada s, 1H, Ar- <u>H</u>)	-
II-14	4-OCF ₃	2-Br	6-Br	H	-CH ₂ -CHOC ₄ H ₉ -(CH ₂) ₃ -		CH ₃	*0,91 (t, 3H, <u>CH₃</u>) 4,03 (s, 2H, Ar- <u>CH₂</u>) 7,51 (s, 2H, Ar- <u>H</u>)	β
II-15	4-OCF ₃	2-Br	6-Br	-(CH ₂) ₃ -		H	CH ₃	*4,53 (m, 1H, C(2)- <u>H</u>), 4,09 (d, 2H, Ar- <u>CH₂</u>) 7,44 (s, 2H, Ar- <u>H</u>)	-

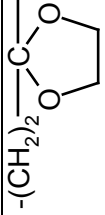
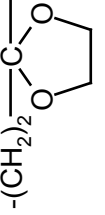
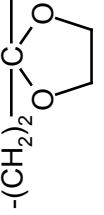
(continuación)

Ej. nº	J	X	Y	D	A	B	R ⁸	P.f.°C	Isómero.
II-16	4-OCF ₃	2-Br	6-Br		CH ₃	H	CH ₃	*1,51 (d, 3H, <u>CH₃</u>) 4,31 (s, 2H, Ar- <u>CH₂</u>) 7,44 (s, 2H, Ar-H)	-
II-17	4-OCF ₃	2-Br	6-Br	H		CH ₃	CH ₃	**1,29 (m, 1H, <u>CH</u> -ciclopropilo), 3,98 (d, 2H, Ar- <u>CH₂</u>) 7,47 (s, 2H, Ar-H)	-
II-18	4-OCF ₃	2-Br	6-Br	H	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	**1,60 (s, 3H, <u>CH₃</u>), 4,01 (d, 2H, Ar- <u>CH₂</u>) 7,47 (s, 2H, Ar-H)	-
II-19	4-OCF ₃	2-Br	6-Cl	H		CH ₃	CH ₃	**1,46 (s, 3H, <u>CH₃</u>), 3,94 (d, 2H, Ar- <u>CH₂</u>) 7,30 y 7,43 (cada unos, 1H, Ar-H)	-
II-20	4-OCF ₃	2-Br	6-Cl	H	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	**1,59 (s, 3H, <u>CH₃</u>) 3,97 (d, 2H, Ar- <u>CH₂</u>) 7,30 y 7,43 (cada unos, 1H, Ar-H)	-
II-21	4-OCF ₃	2-OCH ₃	6-Br	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	110 °C	-
II-22	4-OCF ₃	2-OCH ₃	6-Br	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ - <u>OCH₃</u>)	CH ₃	CH ₃	**3,33 (s, 3H, CH- <u>OCH₃</u>) 6,72 y 7,11 (cada unos, 1H, Ar-H)	β

(continuación)

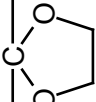
Ej. nº	J	X	Y	D	A	B	R ⁸	P.f.°C	Isómero
II-23	5-OCF ₃	2-Br	H	H	-CH ₂ -CH-(CH ₂) ₃ - CH ₂ -OCH ₃		CH ₃	117	β
II-24	4-OCF ₃	2-OCH ₃	6-Cl	H	-CH ₂ -CHOC ₄ H ₉ -(CH ₂) ₃ -		CH ₃	**0,93 (t, 3H, CH ₃) 3,91 (d, 2H, Ar-CH ₂) 6,71 y 6,98 (cada unos, 1H, Ar-H)	β
II-25	4-OCF ₃	2-OCH ₃	6-Cl		-(CH ₂) ₃ -	H	CH ₃	**3,68 (s, 3H, Ar-OCH ₃) 4,53 (m, 1H, C(2)-H) 6,63 y 6,91 (cada unos, 1H, Ar-H)	-
II-26	4-OCF ₃	2-OCH ₃	6-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	**3,33 (s, 3H, CH-OCH ₃) 6,84 y 6,96 (s, 1H, Ar-H)	β
II-27	4-OCF ₃	2-OCH ₃	6-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		CH ₃	170	-
II-28	4-OCF ₃	2-Cl	6-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	168	β
II-29	4-OCF ₃	2-Cl	6-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		CH ₃	182	-
II-30	4-OCF ₃	2-Br	6-Br	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	170	-
II-31	4-OCF ₃	2-Br	6-Br	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	180	β
II-32	4-OCF ₃	2-Br	6-Br	H	-CH ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₃ -		CH ₃	Aceite	α
II-34	4-OCF ₃	2-OCH ₃	6-OCH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	137-139	β
II-35	4-OCF ₃	2-CH ₃	6-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	164-168	β

(continuación)

Ej. nº	J	X	Y	D	A	B	R ⁸	P.f.°C	Isómero
II-36	4-OCF ₃	2-CH ₃	6-CH ₃	H	-CH ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₃ -		CH ₃	141-144	B
II-37	4-OCF ₃	2-Cl	6-CH ₃	H	-CH ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		C ₂ H ₅	** 1)	Mezcla aprox. 1:1
II-38	4-OCF ₃	2-Cl	6-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	164	β
II-39	4-OCF ₃	2-Br	6-Br	H	-(CH ₂) ₂ -C  -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	180	-
II-40	4-OCF ₃	2-OCH ₃	6-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -C  -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	143	-
II-41	4-OCF ₃	2-Cl	6-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -C  -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	160	-
II-42	4-OCF ₃	2-Br	6-Br	H	-(CH ₂) ₂ -CH-(CH ₂) ₂ - CH ₂ -OCH ₃		CH ₃	173	β
II-43	2-OCF ₃	4-Br	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	134	β
II-44	2-OCF ₃	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		CH ₃	132	-
II-45	2-OCF ₃	6-Cl	4-Br	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		CH ₃	144	-
II-46	2-OCF ₃	4-Cl	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	133	β
II-47	2-OCF ₃	6-CH ₃	4-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	138	β
II-48	2-OCF ₃	6-CH ₃	4-CH ₃	H	-CH ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₃ -		CH ₃	** 2)	β

Ej. nº	J	X	Y	D	A	B	R ⁸	P.f.°C	Isómero
II-49	2-OCF ₃	4-Br	H	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		CH ₃	142	-

(continuación)

Ej. nº	J	X	Y	D	A	B	R ⁸	P.f.°C	Isómero
II-50	2-OCF ₃	6-OCH ₃	4-Br	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		CH ₃	182	-
II-51	2-OCF ₃	6-Br	4-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		CH ₃	160	-
II-52	2-OCF ₃	6-OCH ₃	4-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		CH ₃	181	-
II-53	2-OCF ₃	6-Cl	4-Br	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	131	β
II-54	2-OCF ₃	6-Cl	4-Br	H	-CH ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₃ -		CH ₃	128	β
II-55	2-OCF ₃	6-Br	4-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	144	β
II-56	2-OCF ₃	6-Br	4-Br	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	138	β
II-57	2-OCF ₃	6-Cl	4-Br	H	-(CH ₂) ₂ -C(=O)-  -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	155	-
II-58	2-OCF ₃	6-Cl	4-Br	H	CH ₃ -(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	CH ₃	CH ₃	129	-
II-59	2-OCF ₃	6-OCH ₃	4-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	** 3	β
II-60	2-OCF ₃	6-Cl	4-CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	150-151	β
II-61	2-OCF ₃	6-Cl	4-CH ₃	H	-CH ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₃ -		CH ₃	120-123	β
II-62	2-OCF ₃	6-Cl	4-CH ₃	H	-CH ₂ -CHOC ₃ H ₇ -(CH ₂) ₃ -		CH ₃	*** 4	β
II-63	2-OCF ₃	6-CH ₃	4-Cl	H	-CH ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₃ -		CH ₃	*** 5	β
II-64	2-OCF ₃	6-OCH ₃	4-Cl	H	-CH ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₃ -		CH ₃	** 6	β
II-65	2-OCF ₃	6-C ₂ H ₅	4-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	** 7	β
II-66	2-OCF ₃	6-C ₂ H ₅	4-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -CH-(CH ₂) ₂ - CH ₂ -OCH ₃		CH ₃	** 8	β

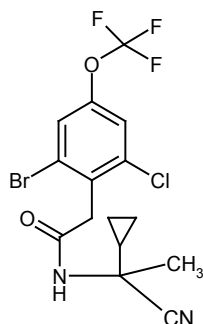
1) 3,11, 3,29 (cada unos, juntos 3H, OCH₃); 4,16 (m, 2H, OCH₂CH₃)

- 2) 3,08 (m, 1H, OCH); 3,63 (s, 2H, CH₂); 3,68 (s, 3H, OCH₃)
- 3) 3,19 (m, 1H, OCH); 3,68 (s, 3H, OCH₃); 3,90 (s, 3H, Ar OCH₃)
- 4) 3,21 (m, 1H, OCH); 3,68 (s, 3H, OCH₃); 3,76 (s, 2H, CH₂)
- 5) 3,11 (m, 1H, OCH); 3,62 (s, 3H, OCH₃); 3,76 (s, 2H, CH₂)
- 6) 3,15 (m, 1H, OCH); 3,60 (s, 2H, CH₂); 3,67 (s, 3H, OCH₃)
- 7) 3,15 (m, 1H, OCH); 3,63 (s, 2H, CH₂); 3,66 (s, 3H, OCH₃)
- 8) 3,31 (s, 3H, CH₂-OCH₃); 3,63 (s, 2H, CH₂); 3,66 (s, 3H, OCH₃)

* RMN ¹H (500 MHz, CDCl₃): desplazamientos δ en ppm

** RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃): desplazamientos δ en ppm

*** RMN ¹H (300 MHz, CDCl₃): desplazamientos δ en ppm

Ejemplo XIX-1

(XIX-1)

5 Se disponen 3 g (9 mmol) del compuesto según el ejemplo XVII-2, se añade 1 gota de DMF, se añaden 3,21 g (27 mmol) de cloruro de tionilo. Se agita hasta el final del desprendimiento gaseoso a reflujo, se evapora el SOCl_2 con el evaporador giratorio, se recoge el residuo en 3 ml de diclorometano (= solución 1).

Se disponen 2,62 ml de trietilamina en 10 ml de diclorometano, se añade gota a gota lentamente a 0°C a la solución 1. Se agita durante la noche a temperatura ambiente hasta que el producto de partida ha reaccionado, se añaden 10 ml de agua, se agita durante 10 minutos a temperatura ambiente, se extrae, se seca la fase orgánica sobre sulfato de sodio y se evapora en el evaporador giratorio.

10 Se hace reaccionar sin purificación adicional.

Rendimiento: 3,46 g (90 % del valor teórico)

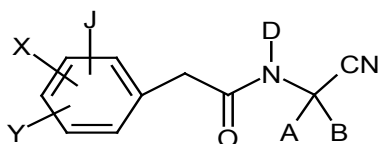
1,79 (s 3H, CH_3)

3,98 (s, 2H, Ar- CH_2)


7,32 y 7,44 (cada unos, 1H, Ar-H)

15 * RMN ^1H (500 MHz, CDCl_3) desplazamiento δ en ppm.

De forma análoga al **ejemplo (XIX-1)** y según las indicaciones generales para la preparación se obtiene los siguientes compuestos de fórmula (XIX):

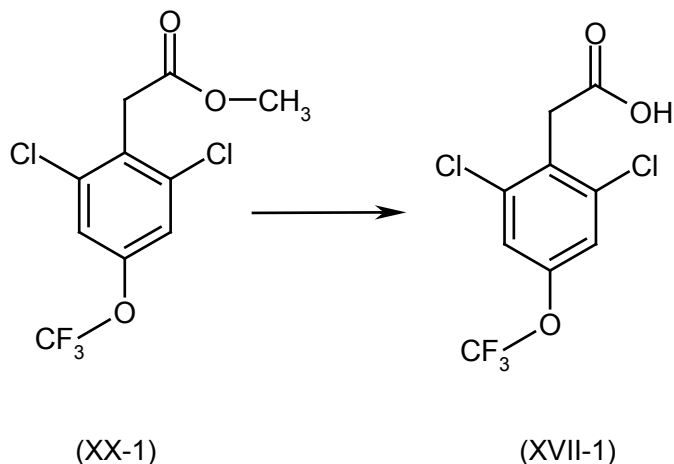


(XIX)

Ej. nº	J	X	Y	A	B	P.f.°C
XIX-2	4- OCF_3	2-Br	6-Cl	C_2H_5	CH_3	*1,67 (s 3H, CH_3) 3,97 (s, 2H, Ar- CH_2) 7,31 u, 7,43 (cada unos, 1H, Ar-H)
XIX-3	4- OCF_3	2-Br	6-Br		CH_3	*1,80 (s 3H, CH_3) 4,02 (s, 2H, Ar- CH_2) 7,49 (s, 2H, Ar-H)
XIX-4	4- OCF_3	2-Br	6-Br	C_2H_5	CH_3	130-132

con D = H

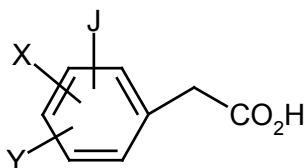
20 * RMN ^1H (500 MHz, CDCl_3) desplazamiento δ en ppm.

Ejemplo XVII-1

Se disponen 465 g (1,53 mol) del compuesto según el **ejemplo número XX-1** en NaOH al 10 % (1795,87 g = 4,49 mmol) a temperatura ambiente y se calienta a 40 °C. Se agita a 40 °C (control por cromatografía en capa fina). Finalizada la reacción se añaden 250 ml de diclorometano, se separa la fase orgánica, se acidifica la fase acuosa con HCl concentrado y se separa el precipitado por filtración con succión.

Rendimiento: 278 g (59 % del valor teórico)

De forma análoga al **ejemplo (XVII-1)** y según las indicaciones generales para la preparación se obtiene los siguientes compuestos de fórmula (XVII):

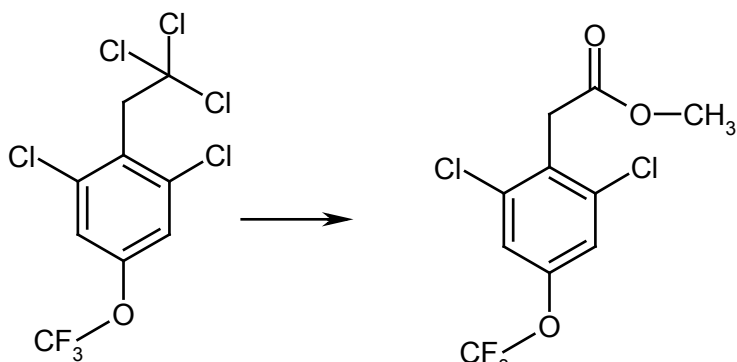


(XVII)

Ej. nº	J	X	Y	P.f.°C
XVII-2	4-OCF ₃	2-Br	6-Cl	144-145
XVII-3	4-OCF ₃	2-Br	6-Br	165-166
XVII-4	4-OCF ₃	2-OCH ₃	6-Br	149-150
XVII-5	4-OCF ₃	2-OCH ₃	6-Cl	135-137
XVII-6	4-OCF ₃	2-Cl	6-Cl	124
XVII-7	4-OCF ₃	2-OCH ₃	6-Cl	136-137
XVII-8	4-OCF ₃	2-OCH ₃	6-Br	148-149
XVII-9	4-OCF ₃	2-CH ₃	6-CH ₃	144-147

(continuación)

Ej. nº	J	X	Y	P.f.°C
XVII-10	4-OCF ₃	2-Cl	6-CH ₃	116-120
XVII-11	2-OCF ₃	2-Cl	4-Br	130
XVII-12	2-OCF ₃	6-CH ₃	4-CH ₃	140
XVII-13	2-OCF ₃	6-OCH ₃	4-Cl	138-140
XVII-14	2-OCF ₃	6-Cl	4-CH ₃	121-124
XVII-15	2-OCF ₃	6-C ₂ H ₅	4-Cl	107-108

Ejemplo XX-1

5

XXI-1

XX-1

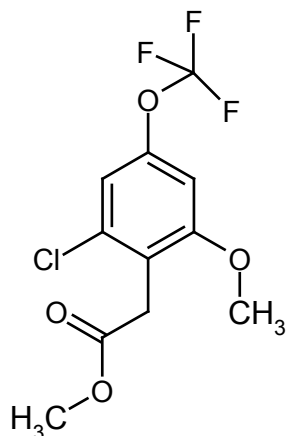
Se disponen 423,98 g de hidróxido de potasio en 2000 ml de metanol, se calientan a 50 °C, se añade gota a gota el compuesto según el **ejemplo XXI-1** disuelto en 1474 ml de metanol. Se agita durante la noche a aproximadamente 55 °C, luego se enfría y se ajusta con ácido sulfúrico concentrado a pH 3, se agita durante 1 hora a reflujo.

10

Se separa el disolvente por destilación y se recoge el precipitado en 500 ml de diclorometano y 500 ml de agua. Se separa la fase orgánica y se separa el disolvente por destilación.

Rendimiento: 465 g (52 % del valor teórico)

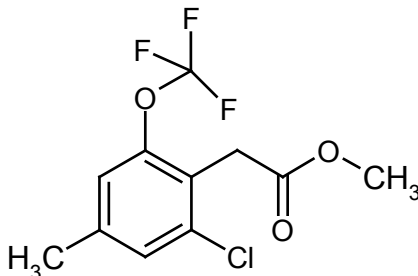
El compuesto XX-1 se hace reaccionar luego sin más purificación para la preparación del compuesto XVII-1.

Ejemplo XX-5

5 Se agita una mezcla de reacción compuesta por 1 g (2,88 mmol) del compuesto según el **ejemplo (XX-2)**, 1,56 g (8,6 mmol) de solución de metilato de sodio al 30 %, 0,083 g (0,57 mmol) de bromuro de cobre I y 0,78 g (10,5 mmol) de éster metílico de ácido acético a temperatura del baño de 120 °C aproximadamente durante 7 h. Se recoge en agua, se filtra y se ajusta el filtrado con HCl 1 N a pH 1, se extrae con éster etílico del ácido acético (ACOET), se seca sobre sulfato de sodio y se evapora con el evaporador giratorio. Se realiza la purificación con cromatografía en columna en gel de sílice con ACOET/n-heptano 1:1.

Rendimiento: 0,6 g (= 69 % del valor teórico)

10 Para los datos espectroscópicos véase la tabla del **ejemplo de fórmula (XX)**.

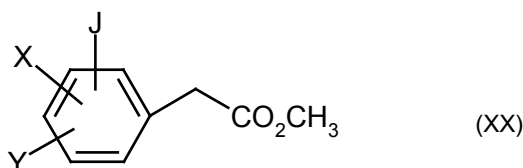
Ejemplo XX-13

15 Se disponen 2 g (5,7 mmol) del compuesto según el **ejemplo (XX-14)** en 40 ml de dioxano y 4 ml de agua y se añaden 1,11 g (8 mmol) de carbonato de potasio, 1,98 g (1,7 mmol) de tetraquitrifenilfosfinpaladio y 1,08 g (8,6 mmol) de trimetilboroxina. Se agita durante 4 horas a reflujo, se concentra la mezcla de reacción, se recoge con 50 ml de HCl 1 N, se extrae dos veces con 20 ml de éster etílico de ácido acético ACOET, se seca la fase orgánica sobre sulfato de sodio y se evapora con evaporador giratorio. Se purifica el residuo en gel de sílice con ACOET/n-heptano 1:9.

Rendimiento: 1 g (= 61 % del valor teórico)

Datos espectroscópicos, véase la tabla del ejemplo de fórmula (XX)

20 De forma análoga a los **ejemplos (XX-1), (XX-5) y (XX-13)** se pueden preparar los siguientes compuestos de fórmula (XX):



ES 2 372 319 T3

Ej. nº	J	X	Y	Datos de RMN ¹ H
XX-2	4-OCF ₃	2-Br	6-Cl	Reacción directa a XVII-2
XX-3	4-OCF ₃	2-Br	6-Br	Reacción directa a XVII-3
XX-4	4-OCF ₃	2-OCH ₃	6-Br	*3,71 (s, 3H, OCH ₃) 3,81 (s 3H, CO ₂ CH ₃) 3,84 (s, 2H, Ar-CH ₂) 6,68, 7,09 (2s, 2H-Ar-H)
XX-5	4-OCF ₃	2-OCH ₃	6-Cl	*3,68 (s, 3H, OCH ₃) 6,63, 6,91 (2s 2H, Ar-H)
XX-6	4-OCF ₃	2-CH ₃	6-CH ₃	P.f. 47 °C
XX-7	4-OCF ₃	2-Br	6-Cl	** 3,74 (s, 3H, OCH ₃) 4,05 (s, 2H, CH ₂) 7,28, 7,41 (cada s, 1H, ArH)
XX-8	4-OCF ₃	2-Cl	6-CH ₃	** 3,71 (s, 3H, OCH ₃) 3,83 (s, 2H, CH ₂) 6,99, 7,14 (cada s, 1H, ArH)
XX-9	2-OCF ₃	6-Br	4-Br	** 3,72 (s, 3H, OCH ₃) 3,87 (s, 2H, CH ₂) 7,41, 7,71 (cada s, 1H, ArH)
XX-10	2-OCF ₃	6-CH ₃	4-CH ₃	** 3,68 (s, 3H, OCH ₃) 3,70 (s, 2H, CH ₂) 6,92, 6,96 (cada s, 1H, ArH)

(continuación)

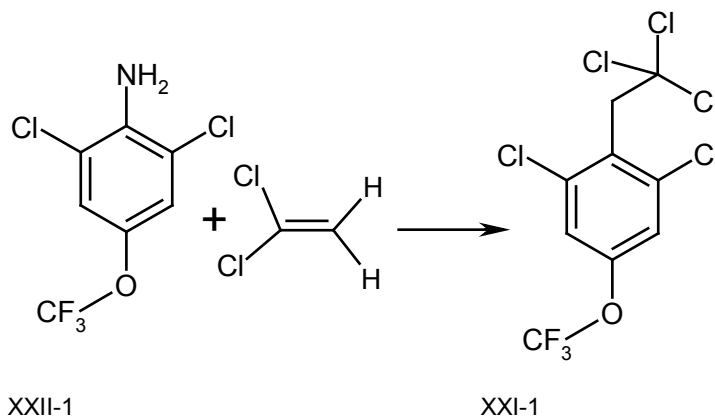
Ej. nº	J	X	Y	Datos de RMN ¹ H
XX-11	2-OCF ₃	6-OCH ₃	4-Cl	** 3,67 (s, 2H, CH ₂) 3,70 (s, 3H, OCH ₃) 3,85 (s, 3H, ArOCH ₃) 6,84, 6,95 (cada s, 1H, ArH)
XX-12	2-OCF ₃	6-CH ₃	4-Cl	*** 3,71 (pseudo s, 5H, CH ₂ y OCH ₃) 7,16 (s, 2H, ArH)
XX-13	2-OCF ₃	6-Cl	4-CH ₃	*** 3,71 (s, 3H, OCH ₃) 3,84 (s, 2H, CH ₂) 7,03, 7,21 (cada s, 1H, ArH)
XX-14	2-OCF ₃	6-Cl	4-Br	* 3,71 (s, 3H, OCH ₃) 3,83 (s, 3H, CH ₂) 7,37, 7,54 (cada 2d, 1H, ArH)

* RMN ¹H (500 MHz, CDCl₃): desplazamientos δ en ppm

** RMN ¹H (300 MHz, CDCl₃): desplazamientos δ en ppm

5 *** RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃): desplazamientos δ en ppm

Ejemplo XXI-1

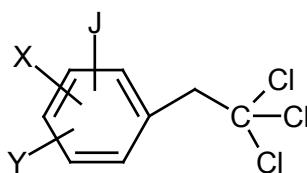


10 Se disponen nitrito de *terc*-butilo (229,9 g = 2,23 mol) y cloruro de cobre (II) (233,9 g = 1,74 mol) a temperatura ambiente en 1500 ml de acetonitrilo. Se vierte cloruro de vinilideno (733,6 g = 7,57 mmol) durante 40 min, luego se añade gota a gota 2,6-dicloro-4-trifluorometoxi-anilina (400 g = 1,3 mmol) en 1350 ml de acetonitrilo durante 5 h a aproximadamente 40 °C (ligeramente exotérmica, desprendimiento gaseoso inmediato), finalizado el desprendimiento gaseoso la temperatura aumenta hasta 60 °C y se agita durante aproximadamente durante 18 horas.

15 Se añade la mezcla de reacción en 4 litros de solución de HCl 1 N, se separa la fase orgánica, se extrae la fase acuosa con 300 ml de metil-*terc*-butiléter y se lava la fase orgánica con 2 litros de solución de HCl 1 N y se separa la fase orgánica. Se separa el disolvente por destilación.

Rendimiento: 573 g (53 % del valor teórico)

De forma análoga al **ejemplo (XXI-1)** se pueden preparar los siguientes compuestos de fórmula (XXI):



(XXI)

Ej. nº	J	X	Y
XXI-2	4-OCF ₃	2-Br	6-Cl
XXI-3	4-OCF ₃	2-Br	6-Br

Se usan los compuestos de fórmula XXI sin más purificación para la preparación de los compuestos de fórmula XX.

Ejemplo nº 1

5 Ensayo con Myzus (tratamiento de pulverización de MYZUPE)

Disolvente: 78 partes en peso de acetona
 1,5 partes en peso de dimetilformamida
 Emulsionante: 0,5 partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

10 Para la preparación de un preparado de principio activo conveniente, se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades dadas de disolvente y emulsionante y se diluye el concentrado con agua que contiene emulsionante a la concentración deseada.

Se pulverizan hojas de repollo chino (*Brassica pekinensis*), que están infestadas por todos los estadios del pulgón verde del melocotonero (*Myzus persicae*), con una preparación de principio activo de concentración deseada.

15 Después del tiempo deseado, se determina el efecto en %. A este respecto, 100 % significa que todos los pulgones habían muerto; 0 % significa que ningún pulgón había muerto.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de ejemplos de preparación muestran un efecto \geq 80 % con una cantidad de aplicación de 100 g/ha:

ejemplo nº I-c-5

20 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de ejemplos de preparación muestran un efecto \geq 80 % con una cantidad de aplicación de 500 g/ha:

25 ejemplo nº I-a-1, I-a-2, I-a-4, I-a-5, I-a-6, I-a-7, I-a-8, I-a-9, I-a-11- I-a-14, I-a-22, I-a-26, I-a-28, I-a-29, I-a-30, I-a-33, I-a-34, I-a-35, I-a-37- I-a-38, I-a-39, I-a-40, I-a-42, I-a-43, I-a-44, I-a-45, I-a-46, I-a-48, I-a-49- I-a-50, I-a-52, I-a-53, I-a-54, I-a-55, I-a-57, I-a-58, I-a-59, I-a-60, I-a-62- I-a-63, I-a-66, I-a-67- I-a-70, I-b-2, I-b-3, I-b-10, I-b-13, I-b-17, I-b-20, I-b-21, I-b-22, I-b-23, I-b-24, I-b-25, I-b-26, I-c-1, I-c-2, I-c-3, I-c-4, I-c-16, I-c-18, I-c-20, I-c-22, I-c-24, I-c-25, I-c-26, I-c-27, I-c-30, I-c-31, I-c-33, I-c-36

Ejemplo nº 2

Ensayo de *Tetranychus*; resistente a OP (tratamiento de pulverización TETRUR)

Disolvente: 78 partes en peso de acetona
 1,5 partes en peso de dimetilformamida

30 Emulsionante: 0,5 partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

Para la preparación de un preparado de principio activo conveniente, se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades dadas de disolvente y emulsionante y se diluye el concentrado con agua que contiene emulsionante a la concentración deseada.

35 Se pulverizan discos de hojas de judías (*Phaseolus vulgaris*), que están infestadas por todos los estados de la araña roja común (*Tetranychus urticae*), con un preparado de principio activo de la concentración deseada.

Después del tiempo deseado, se determina el efecto en %. A este respecto, 100 % significa que todas las arañas

habían muerto. 0 % significa que ninguna araña había muerto.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de ejemplos de preparación muestran un efecto ≥ 80 % con una cantidad de aplicación de 20 g/ha:

ejemplos nº I-a-38, I-b-22, I-c-26

- 5 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de ejemplos de preparación muestran un efecto > 80 % con una cantidad de aplicación de 100 g/ha:

ejemplos nº I-a-1, I-a-7, I-a-8, I-a-9, I-a-10, I-a-18, I-a-19, I-a-22 I-a-26- I-a-28, I-a-29, I-a-31, I-a-33, I-a-35, I-a-37, I-a-39, I-a-40, I-a-41, I-a-43- I-a-44, I-a-47, I-a-48, I-a-49, I-a-51, I-a-52, I-a-53, I-a-54, I-a-55, I-a-56- I-a-57, I-a-60, I-a-61, I-a-62, I-a-63, I-a-66, I-a-67, I-a-70, I-b-2, I-b-3, I-b-6, I-b-7, I-b-8, I-b-12, I-b-13, I-b-17, I-b-20, I-b-21, I-b-23, I-b-24, I-b-25, I-b-26, I-c-10, I-c-11, I-c-12, I-c-13, I-c-14, I-c-15, I-c-16, I-c-17, I-c-20, I-c-24, I-c-27, I-c-31, I-c-36

10

Ejemplo nº 3

Ensayo de *Phaedon* (tratamiento de pulverización PHAECO)

Disolvente: 78 partes en peso de acetona

1,5 partes en peso de dimetilformamida

- 15 Emulsionante: 0,5 partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

Para la preparación de un preparado de principio activo conveniente, se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades dadas de disolvente y emulsionante, y se diluye el concentrado con agua que contiene emulsionante a la concentración deseada.

- 20 Se pulverizan discos de hojas de repollo chino (*Brassica pekinensis*) con un preparado de principio activo de la concentración deseada y, después del secado se aplican larvas de escarabajo de la mostaza (*Phaedon cochleariae*).

Después del tiempo deseado, se determina el efecto en %. A este respecto, 100 % significa que todas las larvas de escarabajo habían muerto. 0 % significa que ninguna larva de escarabajo había muerto.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de ejemplos de preparación muestran un efecto ≥ 80 % con una cantidad de aplicación de 500 g/ha:

- 25 ejemplos nº I-a-4, I-a-6, I-a-11, I-a-14, I-a-29, I-a-30, I-a-34, I-a-35, I-c-4, I-b-2, I-b-3, I-b-21, I-b-23, I-b-25, I-a-27, I-a-41, I-a-44, I-a-49, I-a-50, I-c-2, I-c-13, I-c-25, I-c-27, I-c-29, I-c-33

Ejemplo nº 4

Ensayo de *Nilaparvata lugens* (tratamiento hidropónico NILALU)

Disolvente: 78 partes en peso de acetona

1,5 partes en peso de dimetilformamida

30

Emulsionante: 0,5 partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

Para la preparación de un preparado de principio activo conveniente, se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades dadas de disolvente y emulsionante, y se diluye el concentrado con agua que contiene emulsionante a la concentración deseada.

- 35 La preparación de principio activo se pipetea en agua. La concentración dada se refiere a la cantidad de principio activo por unidad de volumen de agua (mg/l = ppm), a continuación se infestan con cigarras pardas del arroz (*Nilaparvata lugens*).

Después del tiempo deseado, se determina el efecto en %. A este respecto, 100 % significa que todas las cigarras del arroz habían muerto. 0 % significa que ninguna cigarra del arroz había muerto.

- 40 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de ejemplos de preparación muestran con una concentración de 500 ppm tras 7 días una actividad ≥ 80 %: I-a-4.

Ejemplo nº 5

Ensayo de *Spodoptera frugiperda* (tratamiento de pulverización SPODFR)

Disolvente: 78 partes en peso de acetona

1,5 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: 0,5 partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

5 Para la preparación de un preparado de principio activo conveniente, se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades dadas de disolvente y emulsionante, y se diluye el concentrado con agua que contiene emulsionante a la concentración deseada.

Se pulverizan hojas de maíz (*Zea mays*) con un preparado de principio activo de la concentración deseada y tras secado se aplican orugas del gusano cogollero (*Spodoptera frugiperda*).

Después del tiempo deseado se determina el efecto en %. A este respecto, 100 % significa que todos las orugas habían muerto, 0 % significa que ninguna oruga había muerto.

10 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de ejemplos de preparación muestran con una cantidad aplicada de 500 g i.a./ha tras 7 días una actividad ≥ 80 %: I-a-6, I-a-34, I-b-2, I-b-3, I-c-2, I-c-4.

Ejemplo nº 6

Ensayo de *Meloidogyne* (tratamiento de pulverización con MELGIN)

Disolvente: 80 partes en peso de acetona

15 Para la preparación de un preparado de principio activo conveniente, se mezcla 1 parte en peso de principio activo con la cantidad dada de disolvente y se diluye el concentrado con agua a la concentración deseada.

Se rellenan recipientes con arena, solución de principio activo, suspensiones de larvas de huevo *Meloidogyne incognita* y semillas de lechuga. Las semillas de lechuga germinan y las plantas se desarrollan. En las raíces se desarrollan agallas.

20 Después del tiempo deseado, se determina el efecto nematocida en función de la formación de agallas en %. A este respecto, 100 % significa que no se encontró ninguna agalla; 0 % significa que el número de agallas en las plantas tratadas corresponde al control no tratado.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de ejemplos de preparación muestran un efecto ≥ 80 % con una cantidad de aplicación de 20 ppm: ejemplo nº I-a-49, I-a-50, I-b-25, I-c-22.

Ejemplo nº 7

Ensayo de *Nephotettix* (NEPHCI)

Disolvente: 7 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: 1 parte en peso de alquilarilpoliglicoléter

30 Para la preparación de un preparado de principio activo conveniente, se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades dadas de disolvente y emulsionante, y se diluye el concentrado con agua que contiene emulsionante a la concentración deseada.

Se tratan plántulas de arroz (*Oryza sativa*) mediante inmersión en la preparación de principio activo de la concentración deseada y se aplican las cigarras verdes del arroz (*Nephotettix cincticeps*), en tanto las hojas estén aún húmedas.

35 Después del tiempo deseado, se determina el efecto en %. A este respecto, 100 % significa que todas las cicadelas habían muerto. 0 % significa que ninguna cigarra había muerto.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de ejemplos de preparación muestran con una cantidad aplicada de 100 ppm un efecto ≥ 80 %: ejemplo nº I-c-2.

Ejemplo nº 8

Ensayo de *Boophilus microplus* (inyección BOOPMI)

40 Ensayo de *Boophilus microplus* (inyección de BOOPMI)

Disolvente: dimetilsulfóxido

Para la preparación de un preparado de principio activo conveniente, se mezcla 1 parte en peso de principio activo con la cantidad dada de disolvente y se diluye el concentrado con disolvente a la concentración deseada.

Se inyecta la solución de principio activo en el abdomen (*Boophilus microplus*), se transfieren los animales a bandejas y

se mantienen en un ambiente climatizado.

Después del tiempo deseado, se determina el efecto en %. A este respecto, 100 % significa que ninguna garrapata ha depositado huevos fértiles.

5 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran un efecto ≥ 80 % con una cantidad de aplicación de 20 $\mu\text{g}/\text{animal}$: ejemplo n° I-a-1, I-a-3, I-a-9, I-a-28, I-a-29, I-a-38, I-a-39, I-b-20, I-b-21, I-c-20.

Ejemplo n° 9

Ensayo de *Lucilia cuprina* (LUCICU)

Disolvente: dimetilsulfóxido

10 Para la preparación de un preparado de principio activo conveniente, se mezcla 1 parte en peso de principio activo con la cantidad dada de disolvente y se diluye el concentrado con agua a la concentración deseada.

Recipientes que contienen carne de caballo que se trató con el preparado de principio activo de la concentración deseada se infestan con larvas de *Lucilia cuprina*.

15 Después del tiempo deseado, se determina la mortalidad en %. A este respecto, 100 % significa que todas las larvas habían muerto; 0 % significa que ninguna larva había muerto.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de ejemplos de preparación muestran un efecto ≥ 80 % a una cantidad de aplicación de 100 ppm: ejemplos n° I-a-29, I-a-38, I-b-21.

Ejemplo 10

Efecto herbicida antes del brote

20 Se disponen semillas de malas hierbas o plantas de cultivo mono- o dicotiledóneas en tiestos de fibra de madera con tierra arcillosa arenosa recubiertas con tierra. Se aplican después sobre la superficie de la tierra de cubierta los compuestos de ensayo formulados en forma de polvos humectables (WP) o como concentrado en emulsión (EC) como suspensión acuosa con una cantidad de aplicación de agua convertida de 800 l/ha con adición de 0,2 % de agente humectante.

25 Después del tratamiento, se colocan los tiestos en invernadero y se mantienen en buenas condiciones de crecimiento para las plantas de ensayo. Se realiza la evaluación visual de los daños en las plantas de ensayo después de un tiempo de ensayo de 3 semanas en comparación con controles no tratados (efecto herbicida en porcentaje (%): 100 % de efecto = las plantas se marchitan, 0 % de efecto = como las plantas control).

Efecto herbicida después del brote

30 Se disponen semillas de malas hierbas o plantas de cultivo mono- o dicotiledóneas en tiestos de fibra de madera con tierra arcillosa arenosa, se recubren con tierra y se ponen en invernadero en buenas condiciones de crecimiento. Se tratan las plantas de ensayo en el estado de una hoja 2-3 semanas después de la siembra. Se pulverizan los compuestos de ensayo en forma de polvo humectable (WP) o como concentrado en emulsión (EC) como suspensión acuosa con una cantidad de aplicación de agua de aproximadamente 800 l/ha con adición de 0,2 % de agente humectante sobre las partes verdes de la planta. Después de aprox. 3 semanas de tiempo de reposo de las plantas de ensayo en invernadero en condiciones óptimas de crecimiento, se evalúa visualmente el efecto de los preparados en comparación con controles no tratados (efecto herbicida en porcentaje (%): 100 % de efecto = las plantas se marchitan, 0 % de efecto= como las plantas control).

40 Los siguientes compuestos muestra antes del brote con 320 g/ha i.a. frente a *Lolium multiflorum* y *Setaria viridis* un efecto ≥ 80 %: I-a-2, I-a-22, I-a-25, I-a-26, I-a-27, I-a-29, I-a-38, I-a-39, I-a-46, I-a-49, I-a-50, I-a-51, I-a-52, I-a-54, I-a-57, I-a-59, I-a-60, I-a-61, I-a-62, I-a-63, I-a-64, I-a-65, I-a-66, I-a-67, I-a-68, I-a-70, I-b-13, I-b-15, I-b-17, I-b-21, I-b-22, I-b-24, I-b-25, I-b-26, I-c-16, I-c-18, I-c-22, I-c-26, I-c-29, I-c-30, I-c-31, I-c-32, I-c-33, I-c-34, I-c-35, I-c-36, I-c-37.

45 Los siguientes compuestos muestran después del brote con 80 g/ha i.a. frente a *Echinochloa crus-galli*, *Lolium multiflorum* y *Setaria viridis* un efecto ≥ 70 %: I-a-24, I-a-26, I-a-37, I-a-46, I-a-49, I-a-50, I-a-51, I-a-54, I-a-58, I-a-59, I-a-60, I-a-61, I-a-63, I-a-64, I-a-65, I-a-66, I-a-67, I-a-68, I-b-25, I-c-32, I-c-37.

Efecto herbicida después del brote

50 Se disponen semillas de malas hierbas o plantas de cultivo mono- o dicotiledóneas en tiestos de fibra de madera o en tiestos de plástico con tierra arcillosa arenosa, se recubren con tierra y se ponen en invernadero durante el periodo de vegetación también al aire libre fuera del invernadero, en buenas condiciones de crecimiento. Se tratan las plantas de ensayo en el estado de una a tres hoja 2-3 semanas después de la siembra. Se pulverizan los compuestos

de ensayo formulados en forma de polvo para pulverizar (WP) o líquido (EC) en distintas dosificaciones con una cantidad de aplicación de agua de aproximadamente 300 l/ha con adición de agente humectante (de 0,2 a 0,3 %) sobre las plantas y la superficie del suelo. De 3 a 4 semanas tras el tratamiento de las plantas de ensayo se evalúa visualmente el efecto de los preparados en comparación con controles no tratados (efecto herbicida en porcentaje (%): 100 % de efecto = las plantas se marchitan, 0 % de efecto= como las plantas control).

Uso de protectores

En caso de querer ensayar adicionalmente si los protectores pueden mejorar la tolerancia por las plantas de las sustancias de ensayo en las plantas de cultivo, se usan las siguientes posibilidades para la aplicación del protector:

- 10 - se desinfectan las semillas de plantas de cultivo antes de la siembra con la sustancia protectora (datos de las cantidades de protector en porcentaje referido al peso de semilla)
- se pulverizan las plantas de cultivo antes de la aplicación de las sustancias de ensayo con el protector con una cantidad determinada de aplicación por hectárea (habitualmente 1 día antes de la aplicación de las sustancias de ensayo)
- 15 - se aplica el protector junto con la sustancia de ensayo en forma de mezcla en tanque (datos de las cantidades de protector en g/Ha o con relación al herbicida).

Mediante la comparación del efecto de las sustancias de ensayo sobre las plantas de cultivo, que se han tratado sin y con protector, puede apreciarse el efecto de la sustancia protectora.

Ensayos en recipiente con cereales en invernadero

Mefenpir 1 día antes de la aplicación de herbicida

10 días tras aplicación

	Cantidad de aplicación g i.a./ha	Trigo de verano Observado (%)
(I-a-49)	100	40
	50	20
	25	10
(I-a-49)	100 + 50	0
+ Mefenpir	50 + 50	0
	25 + 50	0

ES 2 372 319 T3

28 días tras aplicación

	Cantidad de aplicación g i.a./ha	Cebada de verano observado (%)	Trigo de verano Observado (%)
(I-a-50)	100	60	70
	50	50	60
	25	30	40
	12,5	8	10
(I-a-50) + Mefenpir	100 + 50	30	20
	50 + 50	10	5
	25 + 50	5	0
	12,5 + 50	0	0

10 días tras aplicación

	Cantidad de aplicación g i.a./ha	Cebada de verano Observado (%)	Trigo de verano observado (%)
(I-b-24)	100	30	40
	50	30	40
	25	20	40
	12,5	10	30
(I-b-24) + Mefenpir	100 + 50	10	20
	50 + 50	8	10
	25 + 50	5	5
	12,5 + 50	5	0

28 días tras aplicación

	Cantidad de aplicación g i.a./ha	Trigo de verano Observado (%)
(I-b-24)	100	20
	50	20
(I-b-24) + Mefenpir	100 + 50	5
	50 + 50	5

10 días tras aplicación

	Cantidad de aplicación g i.a./ha	Trigo de verano Observado (%)
(I-b-25)	100	20
(I-b-25) + Mefenpir	100 + 50	0

Ejemplo 12

5 Ensayo de *Heliothis virescens* – Tratamiento de plantas transgénicas

Disolvente: 7 partes en peso de acetona,

Emulsionante: 1 parte en peso de alquilarilpoliglicoléter.

Para la preparación de un preparado de principio activo conveniente, se mezcla 1 parte en peso de principio activo con la cantidad dada de disolvente y la cantidad dada de emulsionante, y se diluye el concentrado con agua a la concentración deseada.

10

Se tratan brotes de soja (*Glycine max*) de la variedad Roundup Ready (marca comercial de Monsanto Comp. EE.UU.) mediante inmersión en el preparado de principio activo de la concentración deseada, y se infestan con oruga del tabaco *Heliothis virescens* mientras las hojas sigan húmedas.

Después del tiempo deseado, se determina la mortalidad de los insectos.

5 **Ejemplo 13**

Ensayo de concentración límite / insectos de suelo – tratamiento de plantas transgénicas

Insecto de ensayo: larvas de *Diabrotica balteata* en el suelo

Disolvente: 7 partes en peso de acetona

Emulsionante: 1 parte en peso de alquilarilpoliglicoléter

10 Para la preparación de un preparado de principio activo conveniente, se mezcla 1 parte en peso de principio activo con la cantidad dada de disolvente, se añade la cantidad dada de emulsionante y se diluye el concentrado con agua a la concentración deseada.

15 El preparado de principio activo se vierte sobre el suelo. A este respecto la concentración del principio activo no tiene prácticamente papel alguno en el preparado, sólo es decisiva la cantidad en peso de principio activo por unidad de volumen de suelo, que se da en ppm (mg/l). Se rellena el suelo en tiestos de 0,25 l y se dejan reposar estos a 20 °C.

Inmediatamente después del inicio, se disponen en cada tiesto 5 granos de maíz pregerminados de la variedad YIELD GUARD (marca comercial de Monsanto Comp., EE.UU.). Después de 2 días, se ponen en los suelos tratados los correspondientes insectos de ensayo. Después de 7 días más, se determina el grado de efecto del principio activo mediante recuento de las plantas de maíz emergidas (1 planta= 20 % de efecto).

20 **Ejemplo 14**

Aumento de la penetración en la planta con sales de amonio o fosfonio y aumento sinérgico de la penetración en la planta con sales de amonio / fosfonio en combinación con el promotor de la penetración.

En este ensayo se midió la penetración de principios activos mediante cutículas aisladas enzimáticamente de hojas de manzano.

25 Se usaron hojas que se habían recortado en su estado desarrollado completo de manzanos del tipo Golden Delicious. El aislamiento de las cutículas se realizó del modo siguiente

- en primer lugar se cargaron los discos de hojas marcados y estampados por la parte inferior con colorante mediante filtración a vacío con una solución de pectinasa (0,2 a 2 %) tamponada a un valor de pH entre 3 y 4,

- luego se añadió azida sódica y

30 - se dejaron reposar los discos de hojas así tratados hasta que se deshizo la estructura de la hoja original y hasta que se deshizo la cutícula no celular.

35 Luego se usaron sólo las cutículas de las partes superiores de hojas libres de escisiones y pelos. Estas se lavaron varias veces alternativamente con agua que se renueva cada vez y una solución tampón de valor de pH 7. Se extendieron las cutículas limpias obtenidas finalmente sobre placas de teflón y se alisaron y secaron con una ligera corriente de aire.

40 En la siguiente etapa se concentraron las membranas de cutícula así obtenidas para estudios de transporte por membrana en células de difusión (= cámaras de transporte) de acero inoxidable. Para ello se colocaron las cutículas con una pinza axialmente sobre los bordes impregnados con grasa de silicona de las células de difusión y se cerraron con un anillo igualmente engrasado. Se seleccionó la disposición de modo que la parte externa morfológica de las cutículas se dirigiese hacia el exterior, por tanto al aire, mientras que la parte interna original daba al interior de la célula de difusión.

Las células de difusión estaban rellenas con una solución de etilenglicol/agua al 30 %. Para la determinación de la penetración se aplicaron respectivamente 10 µl del líquido de pulverización de la siguiente composición sobre la parte exterior de la cutícula. La aplicación del líquido de pulverización se realiza con agua corriente local de dureza media.

45 Después de la aplicación del líquido de pulverización se pudo evaporar el agua, se invirtieron las cámaras y se dispusieron en bañeras termostalizadas, en las que la temperatura y humedad del aire sobre la cutícula se regulaban con una débil corriente de aire sobre la cutícula con la capa de pulverización (20 °C, 60 % de humedad relativa). Se tomaron alícuotas a intervalos regulares desde un tomamuestras automático y se determinó el contenido en principio activo con HPLC.

ES 2 372 319 T3

Los resultados del ensayo se dan en la siguiente tabla. En cuanto a las cifras dadas se trata de valores promedio de 5 a 6 medidas. Se aprecia claramente que ya el sulfato de amonio solo mejora la penetración y junto con RME se da un efecto sobreaditivo (sinérgico).

Principio activo	Penetración tras 24h / %			
	EC	EC + AS (1 g/l)	EC + RME (1 g/l)	EC + RME (1 g/l) + AS (1 g/l)
Ejemplo I-a-73 0,2 g/l en agua/acetona 6:4	0,9	2,8	2,9	34,6
Ejemplo I-a-49 0,2 g/l en agua/acetona 6:4	0,24	0,6	1,4	26

5 RME = éster metílico de aceite de colza (uso formulado como 500 EW, datos de concentración en g de principio activo/s)

AS = sulfato de amonio

EC = concentrado emulsionable

Ejemplo 15: aumento del efecto mediante sales de amonio/fosfato

Ensayo de *Myzus persicae*

10 Disolvente: 7 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: 2 partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

Para la preparación de un preparado de principio activo conveniente se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades dadas de disolvente y emulsionante y se diluye el concentrado con agua a la concentración deseada. Para la aplicación con sales de amonio o de fosfonio se incorporan estas a una concentración de 1000 ppm del líquido de pulverización.

15

Se tratan plantas de pimiento (*Capsicum annuum*), que están fuertemente infestadas por el pulgón verde del melocotonero (*Myzus persicae*), mediante pulverización en húmedo con el preparado de principio activo a la concentración deseada. Después del tiempo deseado, se determina la mortalidad en %. A este respecto, 100 % significa que todos los animales habían muerto; 0 % significa que ninguno de los animales había muerto.

20 **Tabla**

Principio activo	Principio activo ppm	Grado de mortalidad / % tras 6 días	
			+ AS (1000 ppm)
I-a-32	20	0	85
I-a-39	20	10	40

AS = sulfato de amonio

Ejemplo 16

Ensayo de *Aphis gossypii*

Disolvente: 7 partes en peso de dimetilformamida

25 Emulsionante: 2 partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

Para la preparación de un preparado de principio activo conveniente se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades dadas de disolvente y emulsionante y se diluye el concentrado con agua que contiene emulsionante a la

concentración deseada. Para la aplicación con sales de amonio o de fosfonio se incorporan estas a una concentración de 1000 ppm del líquido de pulverización.

Se tratan plantas de algodón (*Gossypium hirsutum*), que están fuertemente infestadas por el pulgón del algodón (*Aphis gossypii*), con pulverización en húmedo con el preparado de principio activo a la concentración deseada.

- 5 Después del tiempo deseado, se determina la mortalidad en %. A este respecto, 100 % significa que todos los pulgones habían muerto; 0 % significa que ninguno de los pulgones había muerto.

Tabla

Principio activo	Principio activo ppm	Grado de mortalidad / % tras 6 días	
			+ AS (1000 ppm)
I-a-9	20	65	85
I-a-29	20	70	85
I-a-29	4	5	70

- 10 **Ejemplo 17: Aumento del efecto mediante sales de amonio/fosfonio en combinación con promotores de la penetración**

Ensayo de *Myzus persicae*

Disolvente: 7 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: 2 partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

- 15 Para la preparación de un preparado de principio activo conveniente se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades dadas de disolvente y emulsionante y se diluye el concentrado con agua a la concentración deseada. Para la aplicación con sales de amonio o de fosfonio y promotor de la penetración (éster metílico de aceite de colza 500 EW) se incorporan estos respectivamente a una concentración de 1000 ppm del líquido de pulverización.

- 20 Se tratan plantas de pimiento (*Capsicum annum*), que están fuertemente infestadas por el pulgón verde del melocotonero (*Myzus persicae*), mediante pulverización en húmedo con el preparado de principio activo a la concentración deseada. Después del tiempo deseado, se determina la mortalidad en %. A este respecto, 100 % significa que todos los animales habían muerto; 0 % significa que ninguno de los animales había muerto.

Tabla

Principio activo	Principio activo / ppm	Grado de mortalidad/ % tras 6 días			
			+ AS (1000 ppm)	+ RME (1000 ppm)	+ RME + AS (cada 1000 ppm)
I-a-29	20	0	70	95	100

Ejemplo 18

- 25 **Ensayo de *Aphis gossypii***

Disolvente: 7 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: 2 partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

- 30 Para la preparación de un preparado de principio activo conveniente se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades dadas de disolvente y emulsionante y se diluye el concentrado con agua que contiene emulsionante a la concentración deseada. Para la aplicación con sales de amonio o de fosfonio y promotor de la penetración (éster

ES 2 372 319 T3

metílico de aceite de colza 500 EW) se incorporan estos respectivamente a una concentración de 1000 ppm de i.a. del líquido de pulverización.

Se tratan plantas de algodón (*Gossypium hirsutum*), que están fuertemente infestadas por el pulgón del algodón (*Aphis gossypii*), con pulverización en húmedo con el preparado de principio activo a la concentración deseada.

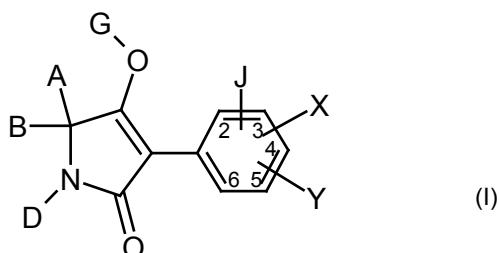
- 5 Después del tiempo deseado, se determina la mortalidad en %. A este respecto, 100 % significa que todos los pulgones habían muerto; 0 % significa que ninguno de los pulgones había muerto.

Tabla

Principio activo	Principio activo/ ppm	Grado de mortalidad / %			
		Tras 6 días			
			+ AS (1000 ppm)	+ RME (1000 ppm)	+ RME + AS (cada 1000 ppm)
I-a-32	4	5	30	70	80

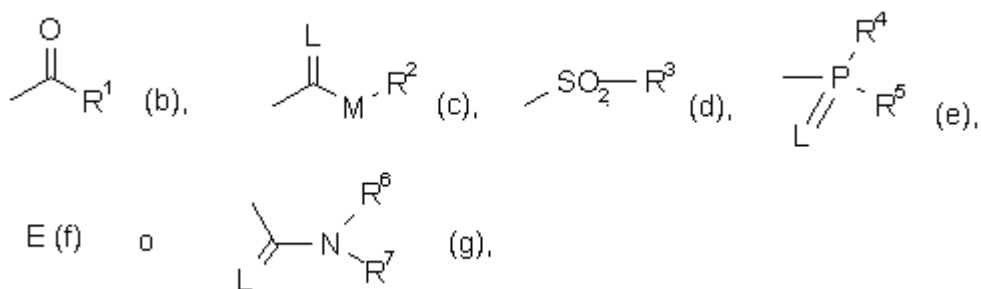
REIVINDICACIONES

1. Compuestos de fórmula (I)



en la que

- 5 J representa trifluorometoxi,
 X representa hidrógeno, alquilo, halógeno, haloalquilo, alcoxi o haloalcoxi,
 Y representa hidrógeno, alquilo, alcoxi o halógeno,
- con la condición de que al menos uno de los restos J, X ó Y se encuentre en la posición 2 del resto de fenilo y sea a este respecto distinto de hidrógeno,
- 10 A representa hidrógeno, alquilo, alquenoilo, alcoxialquilo, alquiltioalquilo respectivamente dado el caso sustituidos con halógeno, cicloalquilo dado el caso sustituido, saturado o insaturado, en el que dado el caso al menos un átomo del anillo está reemplazado por un heteroátomo, o representa arilo, arilalquilo o hetarilo respectivamente dado el caso sustituidos con halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, ciano o nitro,
 B representa hidrógeno, alquilo o alcoxialquilo, o
- 15 A y B junto con el átomo de carbono al que están unidos representan un ciclo no sustituido o sustituido, saturado o insaturado, que contiene dado el caso al menos un heteroátomo,
 D representa hidrógeno o un resto dado el caso sustituido del grupo de alquilo, alquenoilo, alquinilo, alcoxialquilo, cicloalquilo saturado o insaturado, en el que dado el caso uno o varios miembros del anillo están reemplazados por heteroátomos, arilalquilo, arilo, hetarilalquilo o hetarilo o
- 20 A y D junto con los átomos a los que están unidos representan un ciclo no sustituido o sustituido en la parte A, D, saturado o insaturado y que contiene dado el caso al menos un heteroátomo.
 G representa hidrógeno (a) o uno de los grupos



en los que

- 25 E representa un equivalente de ión metálico o un ión de amonio,
 L representa oxígeno o azufre,
 M representa oxígeno o azufre,
 R¹ representa alquilo, alquenoilo, alcoxialquilo, alquiltioalquilo, polialcoxialquilo respectivamente dado el caso sustituidos con halógeno o cicloalquilo dado el caso sustituido con halógeno, alquilo o alcoxi, que puede estar interrumpido por al menos un heteroátomo, fenilo, fenilalquilo, hetarilo, fenoxialquilo o hetariloxialquilo respectivamente dado el caso sustituidos sustituidos.
- 30

R² representa alquilo, alquenilo, alcoxilquilo, polialcoxilquilo respectivamente dado el caso sustituidos con halógeno o representa cicloalquilo, fenilo o bencilo respectivamente dado el caso sustituidos,

5 R³, R⁴ y R⁵ representan independientemente uno de otro alquilo, alcoxi, alquilamino, dialquilamino, alquiltio, alqueniltio, cicloalquiltio respectivamente dado el caso sustituidos con halógeno, o representan fenilo, bencilo, fenoxi o feniltio respectivamente dado el caso sustituidos,

R⁶ y R⁷ representan independientemente uno de otro hidrógeno, alquilo, cicloalquilo, alquenilo, alcoxi, alcoxilquilo respectivamente dado el caso sustituidos con halógeno, representan fenilo dado el caso sustituido, representan bencilo dado el caso sustituido, o junto con el átomo de N al que están unidos representan un ciclo interrumpido dado el caso por oxígeno o azufre.

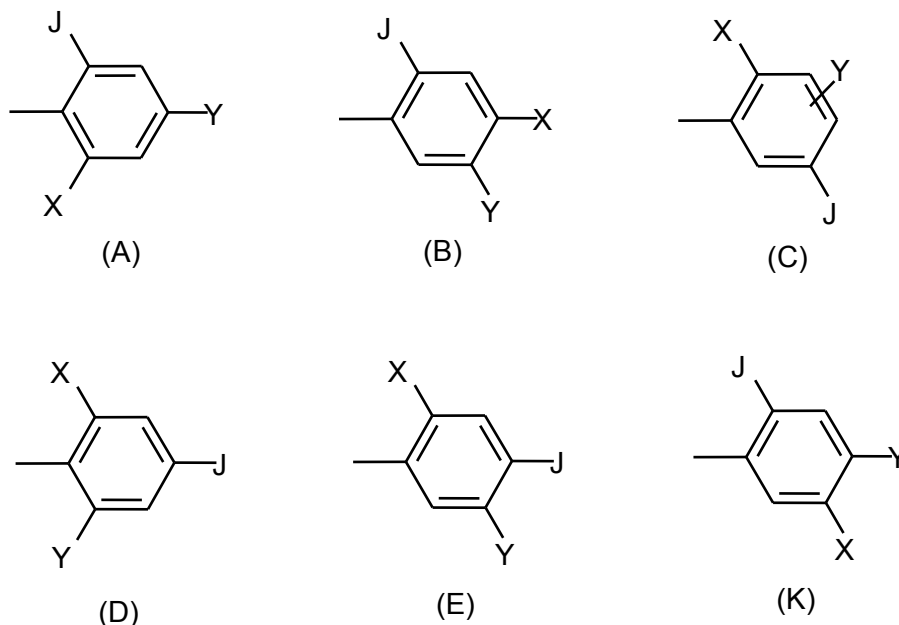
10 2. Compuestos de fórmula (I) según la reivindicación 1, en la que

J representa trifluorometoxi,

X representa hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₆ o haloalcoxi C₁-C₄,

Y representa hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ o halógeno,

15 con la condición de que al menos uno de los restos J, X ó Y se encuentre en la posición 2 del resto fenilo y a este respecto sea distinto de hidrógeno y en donde resulta el siguiente modelo de sustitución de fenilo



en donde en el modelo de sustitución de fenilo (C), (E) (D) y (K), X e Y son al mismo tiempo distintos de hidrógeno,

20 A representa hidrógeno o alquilo C₁-C₁₂, alquenilo C₃-C₈, alcoxi C₁-C₁₀-alquilo C₁-C₈, alquil C₁-C₁₀-tio-alquilo C₁-C₆, respectivamente dado el caso sustituidos con halógeno, cicloalquilo C₃-C₈ dado el caso sustituido con halógeno, alquilo C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆, en el que están reemplazados dado el caso uno o dos miembros del anillo no directamente adyacentes por oxígeno y/o azufre, o representa fenilo, naitilo, hetarilo con 5 a 6 átomos de anillo, fenil-alquilo C₁-C₆ o naitil-alquilo C₁-C₆, respectivamente dado el caso sustituidos con halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, ciano o nitro,

B representa hidrógeno, alquilo C₁-C₁₂ o alcoxi C₁-C₈-alquilo C₁-C₆ o

25 A, B y el átomo de carbono al que están unidos representan cicloalquilo C₃-C₁₀ saturado o cicloalquilo C₅-C₁₀ insaturado, en los que está reemplazado dado el caso un miembro del anillo por oxígeno o azufre y que están dado el caso sustituidos una o dos veces con alquilo C₁-C₈, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₆-alcoxi C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆-alcoxi C₁-C₂, cicloalquilo C₃-C₁₀, haloalquilo C₁-C₈, alcoxi C₁-C₈, alquil C₁-C₈-tio, halógeno o fenilo o

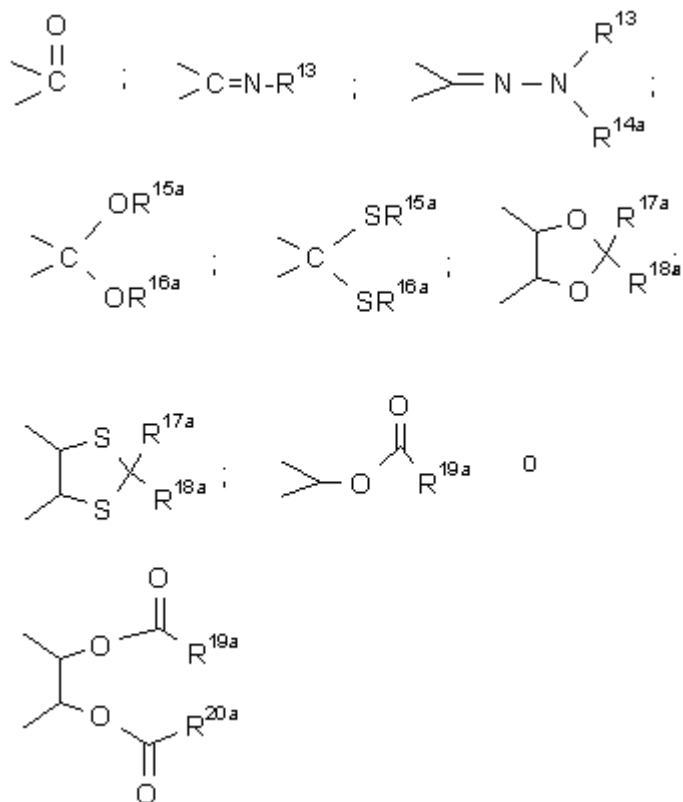
30 A, B y el átomo de carbono al que están unidos representan cicloalquilo C₃-C₆, que está sustituido con un grupo alquilenodiol dado el caso sustituido con alquilo C₁-C₄ que contiene dado el caso uno o dos átomos de oxígeno y/o azufre no directamente adyacentes, o con un grupo alquilendioxi o con un grupo alquilendioxi, que con el átomo de carbono al que está unido forma un anillo adicional de cinco a ocho miembros o

A, B y el átomo de carbono al que están unidos representan cicloalquilo C₃-C₈ o cicloalqueno C₅-C₈, en los que dos sustituyentes junto con los átomos de carbono a los que están unidos representan alcano C₂-C₆-diilo, alqueno C₂-C₆-diilo o alcanodieno C₄-C₆-diilo respectivamente dado el caso sustituidos con alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ o halógeno, en los que está reemplazado dado el caso un grupo metileno por oxígeno o azufre,

5 D representa hidrógeno, alquilo C₁-C₁₂, alqueno C₃-C₈, alquinilo C₃-C₈, alcoxi C₁-C₁₀-alquilo C₂-C₈ respectivamente dado el caso sustituidos con halógeno, cicloalquilo C₃-C₈ dado el caso sustituido con halógeno, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄, en el que está reemplazado dado el caso un miembro del anillo por oxígeno o azufre o representa fenilo, hetarilo con 5 o 6 átomos de anillo, fenil-alquilo C₁-C₆ o hetaril-alquilo C₁-C₆ con 5 ó 6 átomos de anillo, respectivamente dado el caso sustituidos con halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, ciano o nitro o

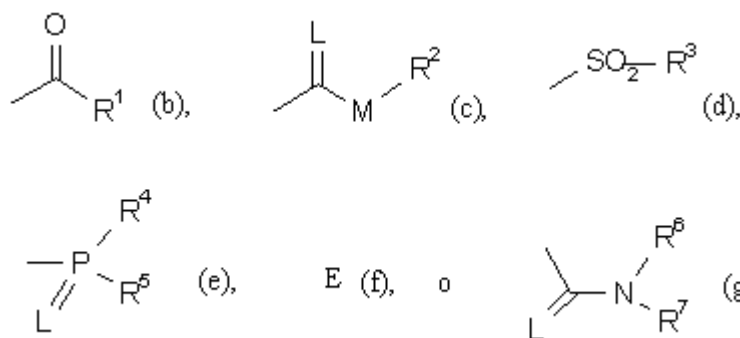
A y D representan juntos alcano C₃-C₆-diilo o alqueno C₃-C₆-diilo respectivamente dado el caso sustituidos, en los que está reemplazado dado el caso un grupo metileno por un grupo carbonilo, oxígeno o azufre y n los que como sustituyentes se tienen en cuenta respectivamente:

15 halógeno, hidroxilo, mercapto o alquilo C₁-C₁₀, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-tio, cicloalquilo C₃-C₇, fenilo o benciloxi, respectivamente dado el caso sustituido con halógeno, o una agrupación alcano C₃-C₆-diilo, agrupación alqueno C₃-C₆-diilo o una agrupación butadieno adicionales, que está sustituida dado el caso con alquilo C₁-C₆ o en la que dado el caso dos sustituyentes adyacentes con los átomos de carbono a los que están unidos forman un ciclo saturado o insaturado adicional con 5 ó 6 átomos de anillo, que puede contener oxígeno o azufre, o en el que dado el caso está contenido uno de los siguientes grupos



20

G representa hidrógeno (a) o uno de los grupos



en los que

E representa un equivalente de ión metálico o un ión amonio,

L representa oxígeno o azufre y

5 M representa oxígeno o azufre,

R^1 representa alquilo $\text{C}_1\text{-C}_{20}$, alquenilo $\text{C}_2\text{-C}_{20}$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_8$ -alquilo $\text{C}_1\text{-C}_8$, alquil $\text{C}_1\text{-C}_8$ -tio-alquilo $\text{C}_1\text{-C}_8$, poli-alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_8$ -alquilo $\text{C}_1\text{-C}_8$ respectivamente dado el caso sustituidos con halógeno, o cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_8$ dado el caso sustituido con halógeno, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ o alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$, en el que dado el caso uno o más miembros del anillo no directamente adyacentes están reemplazados por oxígeno y/o azufre,

10 representa fenilo dado el caso sustituido con halógeno, ciano, nitro, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$, haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, haloalcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$, alquil $\text{C}_1\text{-C}_6$ -tio o alquil $\text{C}_1\text{-C}_6$ -sulfonilo,

representa fenil-alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ dado el caso sustituido con halógeno, nitro, ciano, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$, haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ o haloalcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$,

representa hetarilo de 5 ó 6 miembros dado el caso sustituido con halógeno o alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$,

15 representa fenoxi-alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ dado el caso sustituido con halógeno o alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ o representa hetariloxi-alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ de 5 ó 6 miembros dado el caso sustituido con halógeno, amino o alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$,

R^2 representa alquilo $\text{C}_1\text{-C}_{20}$, alquenilo $\text{C}_2\text{-C}_{20}$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_8$ -alquilo $\text{C}_2\text{-C}_8$, poli-alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_8$ -alquilo $\text{C}_2\text{-C}_8$ respectivamente dado el caso sustituidos con halógeno,

Representa cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_8$ dado el caso sustituido con halógeno, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ o alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$ o

20 Representa fenilo o bencilo respectivamente dado el caso sustituidos con halógeno, ciano, nitro, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$, haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ o haloalcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$,

R^3 representa alquilo $\text{C}_1\text{-C}_8$ dado el caso sustituido con halógeno o representa fenilo o bencilo respectivamente dado el caso sustituidos con halógeno, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$, haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, haloalcoxi $\text{C}_1\text{-C}_4$, ciano o nitro,

25 R^4 y R^5 representan independientemente uno de otro alquilo $\text{C}_1\text{-C}_8$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_8$, alquil $\text{C}_1\text{-C}_8$ -amino, di-(alquil $\text{C}_1\text{-C}_8$)amino, alquil $\text{C}_1\text{-C}_8$ -tio, alquencil $\text{C}_2\text{-C}_8$ -tio, cicloalquil $\text{C}_3\text{-C}_7$ -tio respectivamente dado el caso sustituidos con halógeno, o representan fenilo, fenoxi o feniltio respectivamente dado el caso sustituidos con halógeno, nitro, ciano, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_4$, haloalcoxi $\text{C}_1\text{-C}_4$, alquil $\text{C}_1\text{-C}_4$ -tio, haloalquil $\text{C}_1\text{-C}_4$ -tio, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$ o haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$,

30 R^6 y R^7 representan independientemente uno de otro hidrógeno, representan alquilo $\text{C}_1\text{-C}_8$, cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_8$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_8$, alquenilo $\text{C}_3\text{-C}_8$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_8$ -alquilo $\text{C}_1\text{-C}_8$ respectivamente dado el caso sustituidos con halógeno, representan fenilo dado el caso sustituido con halógeno, haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_8$, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_8$ o alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_8$, bencilo dado el caso sustituido con halógeno, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_8$, haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_8$ o alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_8$ o juntos representan un resto alquilenilo $\text{C}_3\text{-C}_6$ dado el caso sustituido con alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, en el que está reemplazado dado el caso un átomo de carbono por oxígeno o azufre,

35 R^{13} representa hidrógeno, representa alquilo $\text{C}_1\text{-C}_8$ o alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_8$ respectivamente dado el caso sustituidos con halógeno, representa cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_8$ dado el caso sustituido con halógeno, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$ o alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_4$, en el que está reemplazado dado el caso un grupo metileno por oxígeno o azufre, o representa fenilo, fenil-alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$ o fenil-alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_4$ respectivamente dado el caso sustituidos con halógeno, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$, haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, haloalcoxi $\text{C}_1\text{-C}_4$, nitro o ciano,

R^{14a} representa hidrógeno o alquilo $\text{C}_1\text{-C}_8$ o

R¹³ y R^{14a} representan juntos alcano C₄-C₆-diilo,

R^{15a} y R^{16a} son iguales o distintos y representan alquilo C₁-C₆ o

R^{15a} y R^{16a} representan juntos un resto alcano C₂-C₄-diilo, que está dado el caso sustituido con alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ o con fenilo dado el caso sustituido con halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₄, nitro o ciano,

R^{17a} y R^{18a} representan independientemente uno de otro hidrógeno, representan alquilo C₁-C₈ dado el caso sustituido con halógeno o representan fenilo dado el caso sustituido con halógeno, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, nitro o ciano o

R^{17a} y R^{18a} representan junto con el átomo de carbono al que están unidos un grupo carbonilo o representan cicloalquilo C₅-C₇ dado el caso sustituido con halógeno, alquilo C₁-C₄ o alcoxi C₁-C₄, en el que está reemplazado dado el caso un grupo metileno por oxígeno o azufre,

R^{19a} y R^{20a} representan independientemente uno de otro alquilo C₁-C₁₀, alqueno C₂-C₁₀, alcoxi C₁-C₁₀, alquil C₁-C₁₀-amino, alqueno C₃-C₁₀-amino, di-(alquil C₁-C₁₀)amino o di-(alqueno C₃-C₁₀)amino.

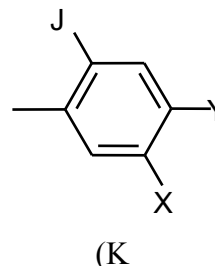
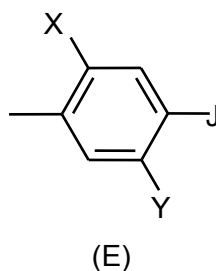
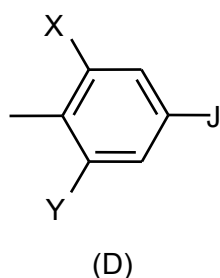
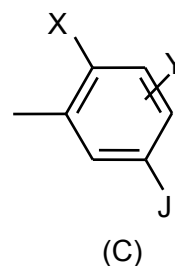
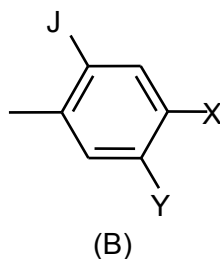
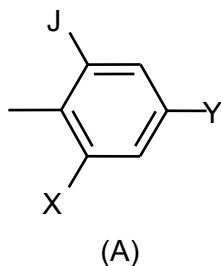
3. Compuestos de fórmula (I) según la reivindicación 1, en la que

J representa trifluorometoxi,

X representa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, alquilo C₁-C₄, trifluorometilo o alcoxi C₁-C₄,

Y representa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, alcoxi C₁-C₄ o alquilo C₁-C₄

con la condición de que al menos uno de los restos J, X o Y se encuentre en la posición 2 del resto fenilo y sea a este respecto distinto de hidrógeno, en donde resultan los siguientes modelos de sustitución de fenilo



en donde en el modelo de sustitución de fenilo (C), (D), (E) y (K), X e Y son al mismo tiempo distintos de hidrógeno,

A representa hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₂ respectivamente dado el caso sustituidos de una a tres veces con flúor o cloro, cicloalquilo C₃-C₆ dado el caso sustituido de una a dos veces con alquilo C₁-C₂ o alcoxi C₁-C₂, que puede estar interrumpido dado el caso con un átomo de oxígeno, representa fenilo o bencilo respectivamente dado el caso sustituidos de una de vez a dos veces con flúor, cloro, bromo, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₂, ciano o nitro,

B representa hidrógeno, alquilo C₁-C₄ o alcoxi C₁-C₂-alquilo C₁-C₂ o

A, B y el átomo de carbono al que están unidos representan cicloalquilo C₅-C₇ saturado o insaturado, en el que dado el caso un miembro del anillo está reemplazado por oxígeno o azufre y que está dado el caso sustituido de una a dos veces con alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₄-alcoxi C₁-C₂, cicloalquil C₃-C₆-metoxi, trifluorometilo o alcoxi C₁-C₆, o

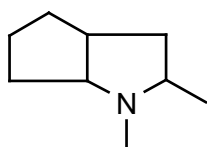
A, B y el átomo de carbono al que están unidos representan cicloalquilo C₅-C₆, que está sustituido con un grupo alquendiilo dado el caso sustituido con metilo o etilo y que contiene dado el caso uno o dos átomos de oxígeno o azufre no directamente adyacentes, con un grupo alquilendioxilo o con un grupo alquilenditiol que con el átomo de carbono al que está unido forma un anillo adicional de cinco o seis miembros, o

5 A, B y el átomo de carbono al que están unidos representan cicloalquilo C₃-C₆ o cicloalqueno C₅-C₆, en los que dos sustituyentes junto con los átomos de carbono a los que están unidos representan alcano C₂-C₄-diilo, alqueno C₂-C₄-diilo o butadienodiilo respectivamente dado el caso sustituidos con alquilo C₁-C₂ o alcoxi C₁-C₂,

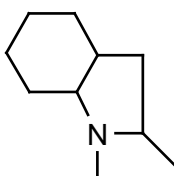
D representa hidrógeno, representa alquilo C₁-C₆, alqueno C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₂-C₃ respectivamente dado el caso sustituidos de una a tres veces con flúor, representa cicloalquilo C₃-C₆ dado el caso sustituido de una a dos veces con alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₂, en el que está reemplazado dado el caso un grupo metileno por oxígeno, o

A y D representan juntos alcano C₃-C₅-diilo dado el caso sustituido de una a dos veces, en el que puede estar reemplazado un grupo metileno por un grupo carbonilo, oxígeno o azufre, en donde como sustituyentes se tienen en cuenta alquilo C₁-C₂ o alcoxi C₁-C₂ o

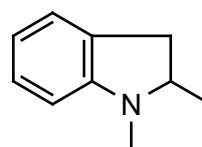
15 A y D representan junto con los átomos a los que están unidos, uno de los grupos AD-1 a AD-10:



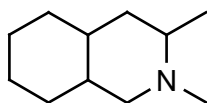
AD-1



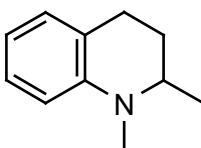
AD-2



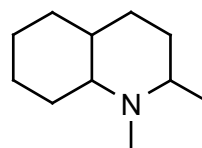
AD-3



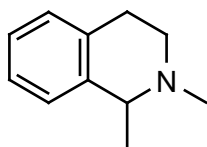
AD-4



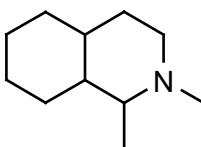
AD-5



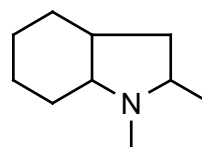
AD-6



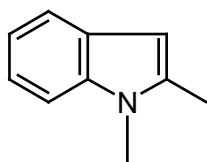
AD-7



AD-8

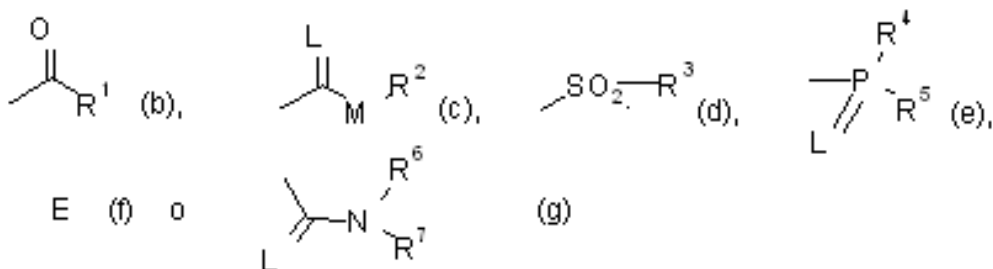


AD-9



AD-10

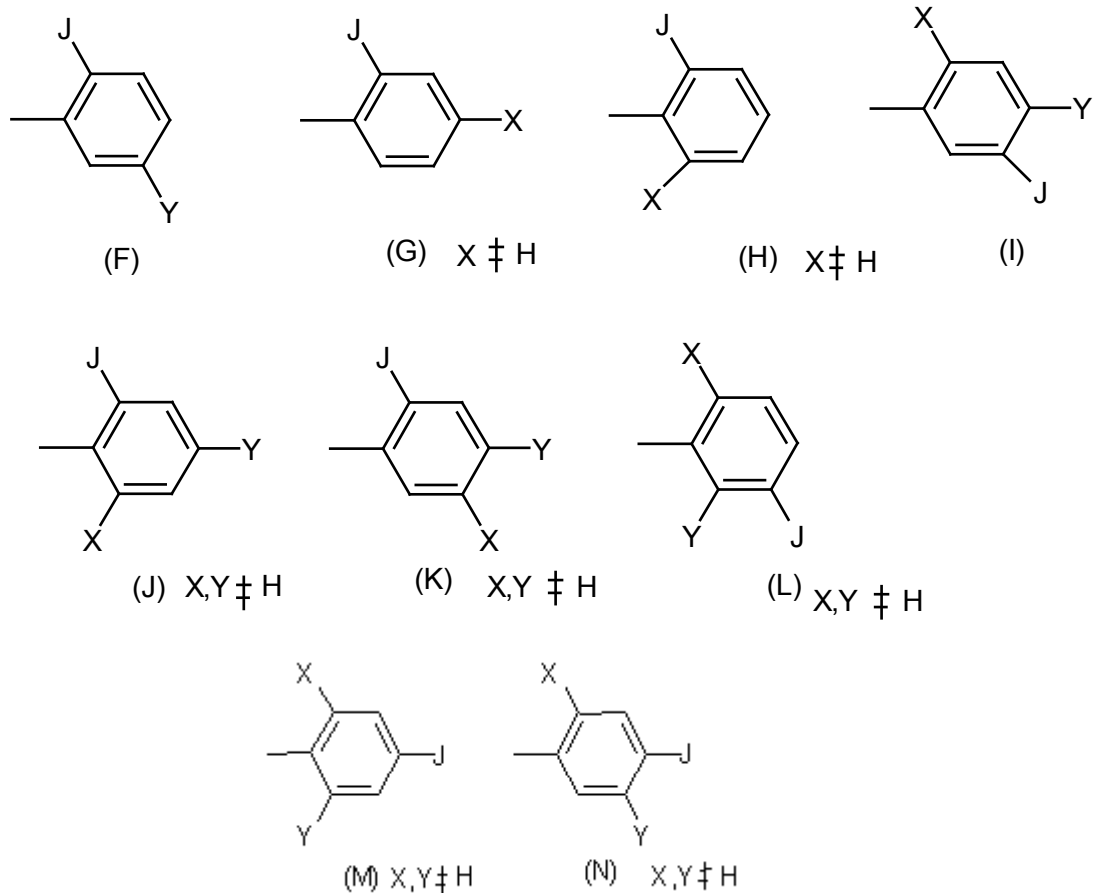
G representa hidrógeno (a) o uno de los grupos



en los que

- E representa un equivalente de ión metálico o un ión de amonio,
- L representa oxígeno o azufre y
- 5 M representa oxígeno o azufre,
- R^1 representa alquilo $\text{C}_1\text{-C}_8$, alquenilo $\text{C}_2\text{-C}_{18}$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alquilo $\text{C}_1\text{-C}_2$, alquil $\text{C}_1\text{-C}_4$ -tio-alquilo $\text{C}_1\text{-C}_2$ respectivamente dado el caso sustituidos de una a tres veces con flúor o cloro, o cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_6$ dado el caso sustituido de una a dos veces con flúor, cloro, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_2$ o alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_2$, en el que dado el caso están reemplazados uno o dos miembros del anillo no directamente adyacentes por oxígeno,
- 10 Representa fenilo dado el caso sustituido de una a dos veces con flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_4$, haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_2$ o haloalcoxi $\text{C}_1\text{-C}_2$,
- R^2 representa alquilo $\text{C}_1\text{-C}_8$, alquenilo $\text{C}_2\text{-C}_8$ o alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alquilo $\text{C}_2\text{-C}_4$ respectivamente dado el caso sustituidos de una a tres veces con flúor,
- representa cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_6$ dado el caso sustituido una vez con alquilo $\text{C}_1\text{-C}_2$ o alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_2$ o
- 15 representa fenilo o bencilo respectivamente dado el caso sustituidos de una a dos veces con flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_3$, trifluorometilo o trifluorometoxi,
- R^3 representa alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$ dado el caso sustituido de una a tres veces con flúor, o representa fenilo respectivamente dado el caso sustituido una vez con flúor, cloro, bromo, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_4$, trifluorometilo, trifluorometoxi, ciano o nitro,
- 20 R^4 representa alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$, alquil $\text{C}_1\text{-C}_6$ -amino, di-(alquil $\text{C}_1\text{-C}_6$)amino, alquil $\text{C}_1\text{-C}_6$ -tio, alquencil $\text{C}_3\text{-C}_4$ -tio, cicloalquil $\text{C}_3\text{-C}_6$ -tio, o representa fenilo, fenoxi o feniltio respectivamente dado el caso sustituidos una vez con flúor, cloro, bromo, nitro, ciano, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_3$, haloalcoxi $\text{C}_1\text{-C}_3$, alquil $\text{C}_1\text{-C}_3$ -tio, haloalquil $\text{C}_1\text{-C}_3$ -tio, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_3$ o trifluorometilo,
- R^5 representa alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$ o alquil $\text{C}_1\text{-C}_6$ -tio,
- 25 R^6 representa hidrógeno, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_6$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$, alquenilo $\text{C}_3\text{-C}_6$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$ -alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, representa fenilo dado el caso sustituido una vez con flúor, cloro, bromo, trifluorometilo, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$ o alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_4$, representa bencilo dado el caso sustituido una vez con flúor, cloro, bromo, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, trifluorometilo o alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_4$,
- R^7 representa alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, alquenilo $\text{C}_3\text{-C}_6$ o alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$ -alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$,
- 30 R^6 y R^7 representan juntos un resto alquileno $\text{C}_4\text{-C}_5$ dado el caso sustituido con metilo o etilo, en el que dado el caso está reemplazado un grupo metileno por oxígeno o azufre.
4. Compuestos de fórmula (I) según la reivindicación 1, en los que
- J representa trifluorometoxi,
- X representa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, propilo, metoxi o etoxi,
- 35 Y representa hidrógeno, cloro, bromo, metilo, etilo o metoxi,

con la condición de que al menos uno de los restos J, X o Y se encuentre en la posición 2 del resto fenilo y sea distinto de hidrógeno, en donde resultan los siguientes modelos de sustitución de fenilo



5 A --- representa hidrógeno, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$ o alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_2$ -alquilo $\text{C}_1\text{-C}_2$ respectivamente dado el caso sustituidos de una a tres veces con flúor, representa ciclopropilo, ciclopentilo o ciclohexilo, representa fenilo o bencilo sustituidos respectivamente dado el caso con flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, metoxi, etoxi, trifluorometilo, trifluorometoxi, ciano o nitro,

B --- representa hidrógeno, metilo o etilo o

10 A, B --- y el átomo de carbono al que están unidos representan cicloalquilo $\text{C}_5\text{-C}_6$ saturado, en el que dado el caso está reemplazado un miembro del anillo por oxígeno o azufre y que está dado el caso sustituido una vez con metilo, etilo, propilo, isopropilo, metoximetilo, metoximetilo, propoximetilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi, propoxi, butoxi, metoxietilo, etoxietilo, metoxietoxi, etoxietoxi, ciclopropilmetoxi, ciclopentilmetoxi o ciclohexilmetoxi, o

A, B --- y el átomo de carbono al que están unidos representan cicloalquilo C_6 , que dado el caso está sustituido con un grupo alquilendioxi que contiene dos átomos de oxígeno no directamente adyacentes, o

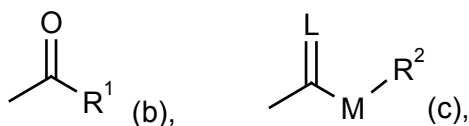
15 A, B --- y el átomo de carbono al que están unidos representan cicloalquilo $\text{C}_5\text{-C}_6$ o cicloalqueno $\text{C}_5\text{-C}_6$, en los que dos sustituyentes junto con los átomos de carbono a los que están unidos representan alcano $\text{C}_2\text{-C}_4$ -diilo o alqueno $\text{C}_2\text{-C}_4$ -diilo o butadienodiilo,

D --- representa hidrógeno, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, alqueno $\text{C}_3\text{-C}_4$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alquilo $\text{C}_2\text{-C}_3$ respectivamente dado el caso sustituidos de una vez a tres veces con flúor, representa ciclopropilo, ciclopentilo o ciclohexilo,

o

20 A y D representan juntos alcano $\text{C}_3\text{-C}_5$ -diilo dado el caso sustituido una vez con metilo o metoxi, en el que está reemplazado dado el caso un átomo de carbono por oxígeno o azufre o representa el grupo AD-1,

G --- representa hidrógeno (a) o representa uno de los grupos



-SO₂-R³ (d) o E (f),

en los que

L representa oxígeno o azufre,

M representa oxígeno o azufre y

5 E representa un ión amonio,

R¹ representa alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₁₇, alcoxi C₁-C₂-alquilo C₁, alquil C₁-C₂-tio-alquilo C₁, o ciclopropilo o ciclohexilo respectivamente dado el caso sustituidos una vez con flúor, cloro, metilo o metoxi,

Representa fenilo dado el caso sustituido una vez con flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metilo, metoxi, trifluorometilo o trifluorometoxi,

10 R² representa alquilo C₁-C₈, alqueno C₂-C₆ o alcoxi C₁-C₄-alquilo C₂-C₃, fenilo o bencilo respectivamente dado el caso sustituidos una vez con flúor,

R³ representa alquilo C₁-C₈.

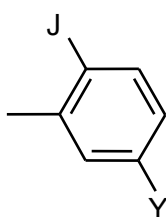
5. Compuestos de fórmula (I) según la reivindicación 1, en los que

J representa trifluorometoxi,

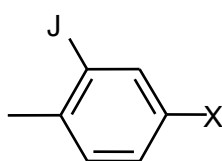
15 X representa hidrógeno, cloro, bromo, metilo, etilo o metoxi,

Y representa hidrógeno, cloro, bromo, metilo o metoxi,

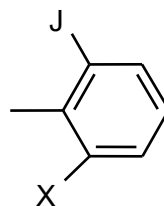
con la condición de que al menos uno de los restos J, X o Y se encuentre en la posición 2 del resto fenilo y sea distinto de hidrógeno, en donde resultan los siguientes modelos de sustitución de fenilo



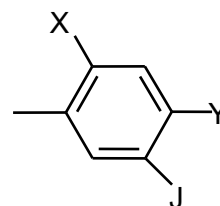
(F)



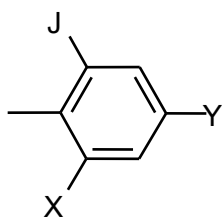
(G) X ≠ H



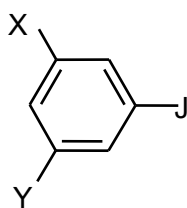
(H) X ≠ H



(I)



(J) X, Y ≠ H



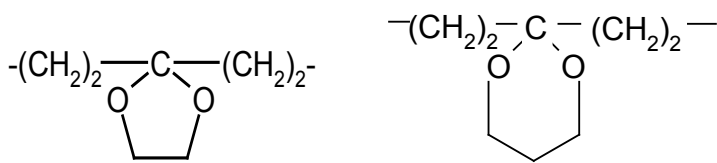
(M) X, Y ≠ H

20 A representa alquilo C₁-C₄ o cicloalquilo,

B representa hidrógeno o metilo,

A, B y el átomo de carbono al que están unidos representan cicloalquilo C₅-C₆ saturado, en el que está reemplazado dado el caso un miembro del anillo por oxígeno y que está dado el caso sustituido una vez con metoximetilo, metoxi, etoxi, propoxi o butoxi,

25 o

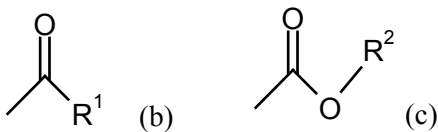


D representa hidrógeno o ciclopropilo,

o

A y D representan juntos alcano C₃-C₅-diilo,

5 G representa hidrógeno (a) o uno de los grupos

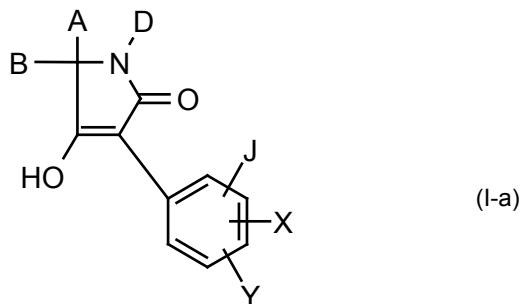


R¹ representa alquilo C₁-C₆,

R² representa alquilo C₁-C₈ o bencilo.

6. Procedimiento para la preparación de compuestos de fórmula (I) según la reivindicación 1, caracterizado porque para la obtención de

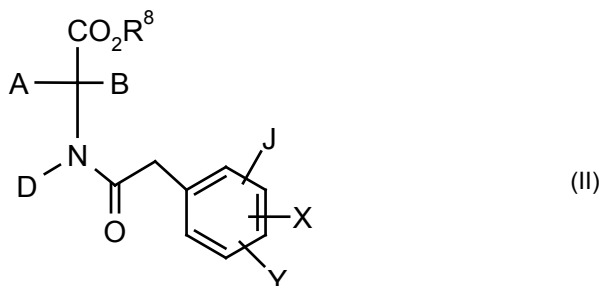
(A) compuestos de fórmula (I-a)



en la que

A, B, D, J, X e Y tienen los significados dados anteriormente,

15 se condensan intramolecularmente ésteres de N-acilminoácido de fórmula (II)



en la que

A, B, D, J, X e Y tienen los significados dados anteriormente,

y

20 R⁸ representa alquilo,

en presencia de un diluyente y en presencia de una base.

(B) compuestos de fórmula (I-b) mostrada anteriormente, en la que A, B, D, J, R¹, X, e Y tienen los significados dados anteriormente, se hacen reaccionar compuestos de fórmula (I-a) mostrada anteriormente, en la que A, B, D, J, X e Y tienen los significados dados anteriormente, respectivamente

5 (α) con halogenuros de ácido de fórmula (III)



en la que

R¹ tiene el significado dado anteriormente y

Hal representa halógeno

10 o

(β) con anhídridos de ácido carboxílico de fórmula (IV)



en la que

R¹ tiene el significado dado anteriormente,

15 dado el caso en presencia de un diluyente y dado el caso en presencia de un ligante de ácido;

(C) compuestos de fórmula (I-c) mostrada anteriormente, en la que A, B, D, J, R², M, X e Y tienen los significados dados anteriormente y L representa oxígeno, se hacen reaccionar compuestos de fórmula (I-a) mostrada anteriormente, en la que A, B, D, J, X e Y tienen los significados dados anteriormente, respectivamente

con ésteres de ácido clorofórmico o tioésteres de ácido clorofórmico de fórmula (V)

20
$$\text{R}^2\text{-M-CO-Cl} \quad (\text{V})$$

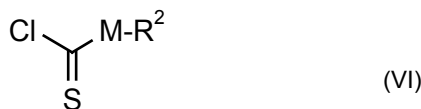
en la que

R² y M tienen los significados dados anteriormente,

dado el caso en presencia de un diluyente y dado el caso en presencia de un ligante de ácido;

25 (D) compuestos de fórmula (I-c) mostrada anteriormente, en la que A, B, D, J, R², M, X e Y tienen los significados dados anteriormente y L representa azufre, se hacen reaccionar compuestos de fórmula (I-a) mostrada anteriormente, en la que A, B, D, J, X e Y tienen los significados dados anteriormente, respectivamente

con ésteres de ácido cloromonotiofórmico o ésteres de ácido cloroditiofórmico de fórmula (VI)



en la que

30 M y R² tienen los significados dados anteriormente,

dado el caso en presencia de un diluyente y dado el caso en presencia de un ligante de ácido

y

35 (E) compuestos de fórmula (I-d) mostrada anteriormente, en la que A, B, D, J, R³, X e Y tienen los significados dados anteriormente, se hacen reaccionar compuestos de fórmula (I-a) mostrada anteriormente, en la que A, B, D, J, X e Y tienen los significados dados anteriormente, respectivamente

con cloruros de ácido sulfónico de fórmula (VII)



en la que

R^3 tiene el significado dado anteriormente,

dado el caso en presencia de un diluyente y dado el caso en presencia de un ligante de ácido,

- 5 (F) compuestos de fórmula (I-e) mostrada anteriormente, en la que A, B, D, J, L, R^4 , R^5 , X e Y tienen los significados dados anteriormente, se hacen reaccionar compuestos de fórmula (I-a) mostrada anteriormente, en la que A, B, D, J, X e Y tienen los significados dados anteriormente, respectivamente

con compuestos de fósforo de fórmula (VIII)



10 en la que

L, R^4 y R^5 tienen los significados dados anteriormente y

Hal representa halógeno,

dado el caso en presencia de un diluyente y dado el caso en presencia de un ligante de ácido,

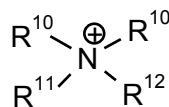
- 15 (G) compuestos de fórmula (I-f) mostrada anteriormente, en la que A, B, D, E, J, X e Y tienen los significados dados anteriormente, se hacen reaccionar compuestos de fórmula (I-a), en la que A, B, D, J, X e Y tienen los significados dados anteriormente, respectivamente

con compuestos metálicos o aminas de fórmulas (IX) o (X)



en la que

- 20 Me representa un metal mono o divalente, o un ión de amonio



t representa el número 1 ó 2 y

R^{10} , R^{11} , R^{12} representan independientemente unos de otros hidrógeno o alquilo,

dado el caso en presencia de un diluyente,

- 25 (H) compuestos de fórmula (I-g) mostrada anteriormente, en la que A, B, D, J, L, R^6 , R^7 , X e Y tienen los significados dados anteriormente, se hacen reaccionar compuestos de fórmula (I-a) mostrada anteriormente, en la que A, B, D, J, X e Y tienen los significados dados anteriormente, respectivamente

(α) con isocianatos o isotiocianatos de fórmula (XI)



30 en la que

R^6 y L tienen los significados dados anteriormente,

dado el caso en presencia de un diluyente y dado el caso en presencia de un catalizador o

(β) con cloruros de ácido carbámico o cloruros de ácido tricarbámico de fórmula (XII)



en la que

L, R⁶ y R⁷ tienen los significados dados anteriormente,

dado el caso en presencia de un diluyente y dado el caso en presencia de un ligante de ácido.

5

7. Agentes para combatir plagas y/o vegetaciones indeseadas, caracterizado por un contenido de al menos un compuesto de fórmula (I) según la reivindicación 1.

8. Procedimiento para combatir plagas animales y/o vegetaciones indeseadas, caracterizado porque se dejan actuar compuestos de fórmula (I) según la reivindicación 1 sobre plagas, vegetaciones indeseadas y/o su hábitat.

10 9. Uso de compuestos de fórmula (I) según la reivindicación 1 para combatir plagas animales y/o vegetaciones indeseadas.

10. Procedimiento para preparar agentes para combatir plagas y/o vegetaciones indeseadas, caracterizado porque se mezclan compuestos de fórmula (I) según la reivindicación 1 con diluyentes y/o sustancias tensioactivas.

15 11. Uso de compuestos de fórmula (I) según la reivindicación 1 para preparar agentes para combatir plagas y/o vegetaciones indeseadas.

12. Agentes que contienen un contenido efectivo de una combinación de principios activos que comprenden como componentes

(a') al menos un derivado de ácido tetrámico sustituido con trifluorometoxi-fenilo de fórmula (I), en la que A, B, D, G, J, X e Y tienen el significado dado anteriormente

20

y

(b') al menos un compuesto de mejora de la tolerancia por las plantas de cultivo del siguiente grupo de compuestos:

25

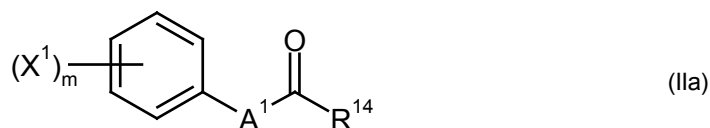
4-dicloroacetil-1-oxa-4-azaespiro[4.5]-decano (AD-67, MON-4660), 1-dicloroacetilhexahidro-3,3,8a-trimetil-pirrolo[1,2-a]pirimidin-6(2H)-ona (dicionona, BAS-145138), 4-dicloroacetil-3,4-dihidro-3-metil-2H-1,4-benzoxazina (benoxacor), éster 1-metilhexílico del ácido 5-cloroquinolin-8-oxiacético (cloquintocet-mexilo-véanse también compuestos relacionados en los documentos EP-A-86750, EP-A-94349, EP-A-191736, EP-A-492366), 3-(2-clorobencil)-1-(1-metil-1-feniletil)urea (cumilurón), α -(cianometoxiimino)fenilacetoneitrilo (ciometrinilo), ácido 2,4-diclorofenoxiacético (2,4-D), ácido 4-(2,4-diclorofenoxi)butírico (2,4-DB), 1-(1-metil-1-feniletil)-3-(4-metilfenil)urea (daimurón, dimrón), ácido 3,6-dicloro-2-metoxibenzoico (dicamba), éster S-1-metil-1-feniletilico del ácido piperidin-1-tiocarboxílico (dimepiperato), 2,2-dicloro-N-(2-oxo-2-(2-propenilamino)etil)-N-(2-propenil)acetamida (DKA-24), 2,2-dicloro-N,N-di-2-propenilacetamida (diclormida), 4,6-dicloro-2-fenil-pirimidina (fenclorim), éster etílico del ácido 1-(2,4-diclorofenil)-5-triclorometil-1H-1,2,4-triazol-3-carboxílico (fenclorazol-etilo - véanse también compuestos relacionados en los documentos EP-A-174562 y EP-A-346620), éster fenilmetílico del ácido 2-cloro-4-trifluorometiltiazol-5-carboxílico (flurazol), 4-cloro-N-(1,3-dioxolan-2-ilmetoxi)-α-trifluoro-acetofenonoxima (fluxofenim), 3-dicloroacetil-5-(2-furanil)-2,2-dimetiloxazolidina (furilazol, MON-13900), 4,5-dihidro-5,5-difenil-3-isoxazolcarboxilato de etilo (isoxadifeno-etilo - véanse también compuestos relacionados en el documento WO-A-95/07897), 3,6-dicloro-2-metoxibenzoato de 1-(etoxicarbonil)etilo (lactidiclor), ácido (4-cloro-o-toliloxi)acético (MCPA), ácido 2-(4-cloro-o-toliloxi)propiónico (mecoprop), 1-(2,4-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-metil-1H-pirazol-3,5-dicarboxilato de dietilo (mefenpir-dietilo - véanse también compuestos relacionados en el documento WO-A-91/07874), 2-diclorometil-2-metil-1,3-dioxolano (MG-191), 1-oxa-4-azaespiro[4.5]decano-4-carbodioato de 2-propenilo (MG-838), anhídrido del ácido 1,8-naftálico, α-(1,3-dioxolan-2-ilmetoximino)fenilacetoneitrilo (oxabetrinilo), 2,2-dicloro-N-(1,3-dioxolan-2-ilmetil)-N-(2-propenil)acetamida (PPG-1292), 3-dicloroacetil-2,2-dimetiloxazolidina (R-28725), 3-dicloroacetil-2,2,5-trimetiloxazolidina (R-29148), ácido 4-(4-cloro-o-tolil)butírico, ácido 4-(4-clorofenoxi)butírico, ácido difenilmetoxiacético, éster metílico del ácido difenilmetoxiacético, éster etílico del ácido difenilmetoxiacético, éster metílico del ácido 1-(2-clorofenil)-5-fenil-1H-pirazol-3-carboxílico, éster etílico del ácido 1-(2,4-diclorofenil)-5-metil-1H-pirazol-3-carboxílico, éster etílico del ácido 1-(2,4-diclorofenil)-5-isopropil-1H-pirazol-3-carboxílico, éster etílico del ácido 1-(2,4-diclorofenil)-5-(1,1-dimetiletil)-1H-pirazol-3-carboxílico, éster etílico del ácido 1-(2,4-diclorofenil)-5-fenil-1H-pirazol-3-carboxílico (véanse también compuestos relacionados en los documentos EP-A-269806 y EP-A-333131), éster etílico del ácido 5-(2,4-diclorobencil)-2-isoxazolin-3-carboxílico, éster etílico del

50

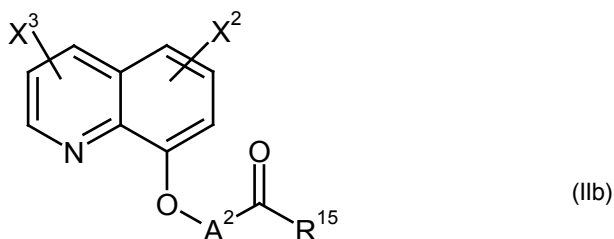
ácido 5-fenil-2-isoxazolin-3-carboxílico, éster etílico del ácido 5-(4-fluorofenil)-5-fenil-2-isoxazolin-3-carboxílico (véanse también compuestos relacionados en el documento WO-A-91/08202), éster (1,3-dimetilbut-1-ílico) del ácido 5-cloro-quinolin-8-oxi-acético, éster 4-aliloxi-butílico del ácido 5-cloro-quinolin-8-oxi-acético, éster 1-aliloxi-prop-2-ílico del ácido 5-cloro-quinolin-8-oxi-acético, éster metílico del ácido 5-cloro-quinoxalin-8-oxiacético, éster etílico del ácido 5-cloro-quinolin-8-oxi-acético, éster alílico del ácido 5-cloro-quinoxalin-8-oxi-acético, éster 2-oxoprop-1-ílico del ácido 5-cloro-quinolin-8-oxiacético, éster dietílico del ácido 5-cloro-quinolin-8-oxi-malónico, éster dialílico del ácido 5-cloro-quinoxalin-8-oxi-malónico, éster dietílico del ácido 5-cloro-quinolin-8-oxi-malónico (véanse también compuestos relacionados en el documento EP-A-582198), ácido 4-carboxicroman-4-ilacético (AC-304415, véase el documento EP-A-613618), ácido 4-clorofenoxi-acético, 3,3'-dimetil-4-metoxibenzofenona, 1-bromo-4-clorometilsulfonilbenceno, 1-[4-(N-2-metoxibenzoilsulfamoil)fenil]-3-metilurea (alias N-(2-metoxibenzoil)-4-[(metilaminocarbonil)amino]bencenosulfonamida), 1-[4-(N-2-metoxibenzoilsulfamoil)fenil]-3,3-dimetil-urea, 1-[4-(N-4,5-dimetilbenzoilsulfamoil)fenil]-3-metil-urea, 1-[4-(N-naftilsulfamoil)fenil]-3,3-dimetil-urea, N-(2-metoxi-5-metilbenzoil)-4-(ciclopropilaminocarbonil)-bencenosulfonamida,

y/o uno de los siguientes compuestos definidos con fórmulas generales

de fórmula general (IIa)



o de fórmula general (IIb)



o de fórmula (IIc)

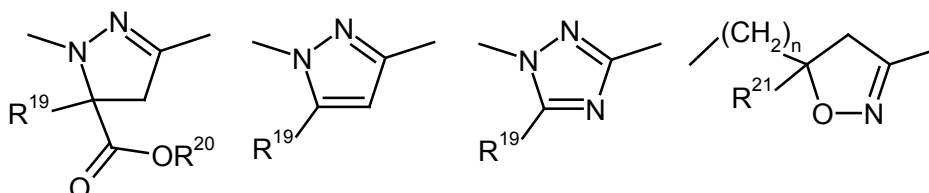


20

en las que

m representa un número 0, 1, 2, 3, 4 ó 5,

A¹ representa una de las agrupaciones heterocíclicas divalentes esquematizadas a continuación,



25 n representa un número 0, 1, 2, 3, 4 ó 5,

A² representa alcanodiílo de 1 ó 2 átomos de carbono dado el caso sustituido con alquilo C₁-C₄ y/o alcoxi C₁-C₄-carbonilo y/o alquenil C₁-C₄-oxicarbonilo,

R¹⁴ representa hidroxilo, mercapto, amino, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-tio, alquil C₁-C₆-amino o di(alquil C₁-C₄)-amino,

R¹⁵ representa hidroxilo, mercapto, amino, alcoxi C₁-C₇, alquenil C₁-C₆-oxi, alquenil C₁-C₆-oxialcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-

tio, alquil C₁-C₆-amino o di(alquil C₁-C₄)-amino,

R¹⁶ representa alquilo C₁-C₄ dado el caso sustituido con flúor, cloro y/o bromo,

5 R¹⁷ representa hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆ o alquino C₂-C₆ respectivamente dado el caso sustituidos con flúor, cloro y/o bromo, alcoxi C₁-C₄, dioxolanilalquilo C₁-C₄, furilo, furilalquilo C₁-C₄, tienilo, tiazolilo, piperidinilo, o fenilo dado el caso sustituido con flúor, cloro y/o bromo o alquilo C₁-C₄,

R¹⁸ representa hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆ o alquino C₂-C₆ respectivamente dado el caso sustituidos con flúor, cloro y/o bromo, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, dioxolanilalquilo C₁-C₄, furilo, furilalquilo C₁-C₄, tienilo, tiazolilo, piperidinilo o fenilo dado el caso sustituido con flúor, cloro y/o bromo o alquilo C₁-C₄,

10 R¹⁷ y R¹⁸ representan también conjuntamente alcano C₃-C₆-diilo u oxalcano C₂-C₅-diilo respectivamente dado el caso sustituidos con alquilo C₁-C₄, fenilo, furilo, un anillo bencénico condensado, o con dos sustituyentes que forman conjuntamente con el átomo de C al que están unidos un carbociclo de 5 ó 6 miembros,

R¹⁹ representa hidrógeno, ciano, halógeno o alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ o fenilo respectivamente dado el caso sustituidos con flúor, cloro y/o bromo,

15 R²⁰ representa hidrógeno, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ o tri(alquil C₁-C₄)-sililo respectivamente dado el caso sustituidos con hidroxilo, ciano, halógeno o alcoxi C₁-C₄,

R²¹ representa hidrógeno, ciano, halógeno o alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ o fenilo respectivamente dado el caso sustituidos con flúor, cloro y/o bromo,

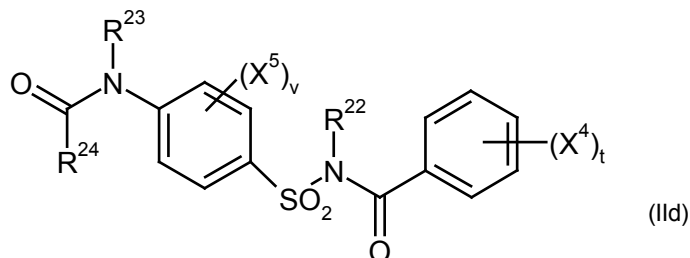
X¹ representa nitro, ciano, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄,

X² representa hidrógeno, ciano, nitro, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄,

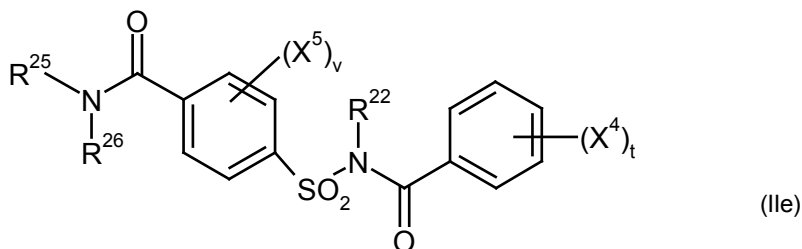
20 X³ representa hidrógeno, ciano, nitro, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄,

y/o los siguientes compuestos definidos mediante fórmulas generales

de fórmula general (IId)



o de fórmula general (IIe)



25

en las que

t representa un número 0, 1, 2, 3, 4 ó 5,

v representa un número 0, 1, 2, 3, 4 ó 5,

R²² representa hidrógeno o alquilo C₁-C₄,

30 R²³ representa hidrógeno o alquilo C₁-C₄,

R²⁴ representa hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-tio, alquil C₁-C₆-amino o di(alquil C₁-C₄)-amino

respectivamente dado el caso sustituidos con ciano, halógeno o alcoxi C₁-C₄, o cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆-oxi, cicloalquil C₃-C₆-tio o cicloalquil C₃-C₆-amino respectivamente dado el caso sustituidos con ciano, halógeno o alquilo C₁-C₄,

5 R²⁵ representa hidrógeno, alquilo C₁-C₆ dado el caso sustituido con ciano, hidroxilo, halógeno o alcoxi C₁-C₄, alquenilo C₃-C₆ o alquinilo C₃-C₆ respectivamente dado el caso sustituidos con ciano o halógeno, o cicloalquilo C₃-C₆ dado el caso sustituido con ciano, halógeno o alquilo C₁-C₄,

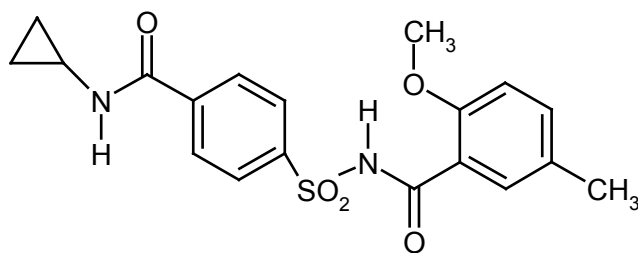
10 R²⁶ representa hidrógeno, alquilo C₁-C₆ dado el caso sustituido con ciano, hidroxilo, halógeno o alcoxi C₁-C₄, alquenilo C₃-C₆ o alquinilo C₃-C₆ respectivamente dado el caso sustituidos con ciano o halógeno, cicloalquilo C₃-C₆ dado el caso sustituido con ciano, halógeno o alquilo C₁-C₄, o fenilo dado el caso sustituido con nitro, ciano, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄, o junto con R²⁵ representa alcano C₂-C₆-diilo u oxaalcano C₂-C₅-diilo respectivamente dado el caso sustituidos con alquilo C₁-C₄,

X⁴ representa nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, formilo, sulfamoilo, hidroxilo, amino, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄, y

X⁵ representa nitro, ciano, carboxi, carbamoilo, formilo, sulfamoilo, hidroxilo, amino, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄.

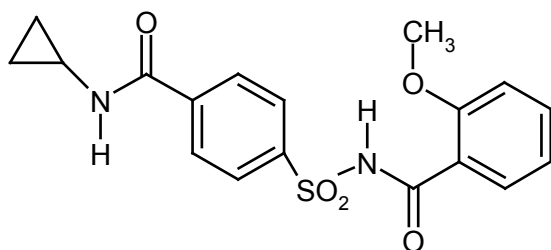
15 13. Agente según la reivindicación 12, en el que se selecciona el compuesto de mejora de la tolerancia por las plantas de cultivo del siguiente grupo de compuestos:

cloquintocet-mexilo, fenclorazol-etilo, isoxadifeno-etilo, mefenpir-dietilo, furilazol, fenclorim, cumilurón, dimrón o los compuestos



20

y



14. Agentes según una de las reivindicaciones 12 ó 13, en los que el compuesto de mejora de la tolerancia por las plantas de cultivo es cloquintocet-mexilo.

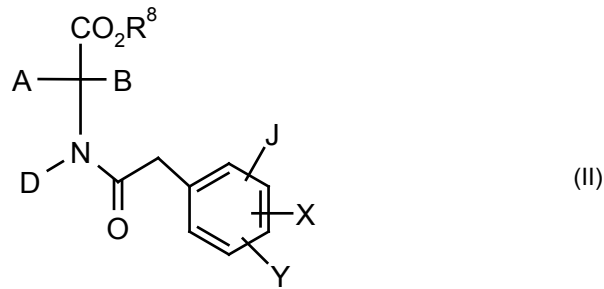
25 15. Agentes según una de las reivindicaciones 12 ó 13, en los que el compuesto de mejora de la tolerancia por las plantas de cultivo es mefenpir-dietilo.

16. Procedimiento para combatir vegetaciones indeseadas, caracterizado porque se deja actuar un agente según la reivindicación 12 sobre las plantas o su entorno.

17. Uso de un agente según la reivindicación 12 para combatir la vegetación indeseada.

30 18. Procedimiento para combatir la vegetación indeseada, caracterizado porque se deja actuar un compuesto de fórmula (I) según la reivindicación 1 y el compuesto de mejora de la tolerancia por las plantas de cultivo según la reivindicación 12 separadamente y en sucesión temporal cercana sobre las plantas o su entorno.

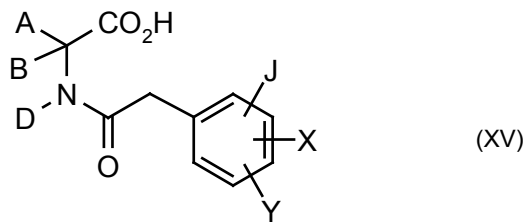
19. Compuestos de fórmula (II)



en la que

A, B, D, J, X e Y y R⁸ tienen los significados dados anteriormente.

20. Compuestos de fórmula (XV)

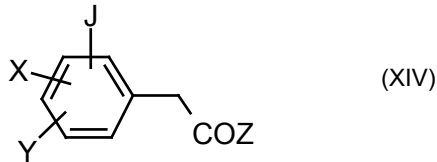


5

en la que

A, B, D, J, X e Y tienen los significados dados anteriormente.

21. Compuestos de fórmula (XIV)

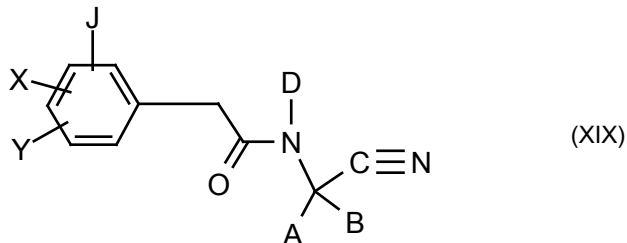


10

en la que

Z representa un grupo saliente introducido por medio de reactivos de activación de ácido carboxílico tales como carbonildiimidazol, carbonil-diimida (como por ej. Diciclohexilcarbonodiimida), reactivos de fosforilación (como por ej. POCl₃, BOP-Cl), agentes halogenantes por ej. cloruro de tionilo, cloruro de oxalilo, fosgeno o éster de ácido clorofórmico, J, X y Y tienen los significados dados anteriormente.

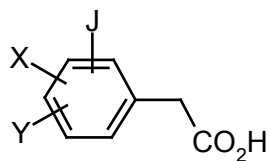
15 22. Compuestos de fórmula (XIX)



en la que

A, B, D, J, X e Y tienen los significados dados anteriormente.

23. Compuestos de fórmula (XVII)



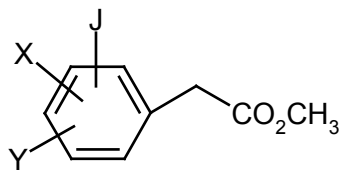
(XVII)

en la que

J, X e Y tienen el significado dado en la tabla

J	X	Y
4-OCF ₃	2-Cl	6-Cl
4-OCF ₃	2-Br	6-Cl
4-OCF ₃	2-Br	6-Br
4-OCF ₃	2-OCH ₃	6-Br
4-OCF ₃	2-OCH ₃	6-Cl
4-OCF ₃	2-Cl	6-Cl
4-OCF ₃	2-OCH ₃	6-Cl
4-OCF ₃	2-OCH ₃	6-Br
4-OCF ₃	2-CH ₃	6-CH ₃
4-OCF ₃	2-Cl	6-CH ₃
2-OCF ₃	6-Cl	4-Br
2-OCF ₃	6-CH ₃	4-CH ₃
2-OCF ₃	6-OCH ₃	4-Cl
2-OCF ₃	6-Cl	4-CH ₃
2-OCF ₃	6-C ₂ H ₅	4-Cl

24. Compuestos de fórmula (XX)



(XX)

5

en la que J, X e Y tienen los significados dados en la tabla

J	X	Y
4-OCF ₃	2-Cl	6-Cl
4-OCF ₃	2-Br	6-Cl

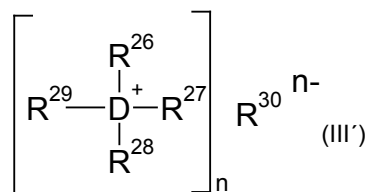
(continuación)

J	X	Y
4-OCF ₃	2-Br	6-Br
4-OCF ₃	2-OCH ₃	6-Br
4-OCF ₃	2-OCH ₃	6-Cl
4-OCF ₃	2-CH ₃	6-CH ₃
4-OCF ₃	2-Br	6-Cl
4-OCF ₃	2-Cl	6-CH ₃
2-OCF ₃	6-Br	4-Br
2-OCF ₃	6-CH ₃	4-CH ₃
2-OCF ₃	6-OCH ₃	4-Cl
2-OCF ₃	6-CH ₃	4-Cl
2-OCF ₃	6-Cl	4-CH ₃
2-OCF ₃	6-Cl	4-Br

25. Composición que comprende

- al menos un compuesto de fórmula (I) según la reivindicación 1 o un agente según la reivindicación 12 y

5 - al menos una sal de fórmula (III')



en la que

D representa nitrógeno o fósforo,

10 R²⁶, R²⁷, R²⁸ y R²⁹ representan independientemente unos de otros hidrógeno o alquilo C₁-C₈ respectivamente dado el caso sustituido o alqueno C₁-C₈ una o más veces insaturado, dado el caso sustituido, en donde los sustituyentes se pueden seleccionar de halógeno, nitro y ciano,

n representa 1, 2, 3 ó 4,

R³⁰ representa un anión inorgánico u orgánico.

15 26. Composición según la reivindicación 25, caracterizada porque contiene al menos un promotor de la penetración.

27. Procedimiento para el aumento del efecto de plaguicidas y/o herbicidas que contienen un principio activo de fórmula (I) según la reivindicación 1 o un agente según la reivindicación 12, caracterizado porque se prepara el agente listo para uso (caldo de pulverización) con uso de una sal de fórmula (III') según la reivindicación 25.

20 28. Procedimiento según la reivindicación 27, caracterizado porque el caldo de pulverización se prepara con uso de un promotor de la penetración.