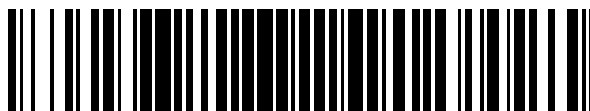


19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 377 481**

51 Int. Cl.:  
**C07D 401/04** (2006.01)  
**C07D 231/44** (2006.01)  
**A01N 43/56** (2006.01)  
**A01N 43/00** (2006.01)

12

### TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- 96 Número de solicitud europea: **06704557 .5**  
96 Fecha de presentación: **17.01.2006**  
97 Número de publicación de la solicitud: **1838693**  
97 Fecha de publicación de la solicitud: **03.10.2007**

54 Título: **DERIVADOS DE PIRAZOLE COMO PESTICIDAS.**

30 Prioridad:  
**21.01.2005 EP 05001182**

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:  
**28.03.2012**

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:  
**28.03.2012**

73 Titular/es:  
**MERIAL LTD.**  
**3239 SATELLITE BLVD.**  
**DULUTH, GA 30096-4640, US**

72 Inventor/es:  
**SCHNATTERER, Stefan;**  
**MAIER, Michael;**  
**LOCHHAAS, Friederike;**  
**KNAUF, Werner y**  
**SEEGER, Karl**

74 Agente/Representante:  
**Ponti Sales, Adelaida**

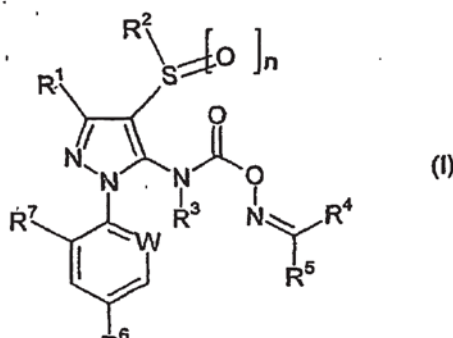
ES 2 377 481 T3

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

## DESCRIPCIÓN

Derivados de pirazole como pesticidas

- 5 [0001] La presente invención se refiere a nuevos derivados de fenilpirazole-oxima carbamato, a procesos para su preparación, a composiciones de los mismos, y a su uso para el control de plagas (incluyendo artrópodos y helmintos).
- [0002] El control de insectos, arácnidos y helmintos con compuestos de alcoxicarbonilamino- y haloalkoxycarbonilaminopirazole sustituidos en la posición 5 se ha descrito en, por ejemplo, EP-A-295,117, WO-A-2000/35,884 y WO-A-2003/74,493.
- 10 [0003] Además, WO-A-87/03,781 y WO-A-2003/74,492 describen derivados de 1-aril-pirazol y su uso como agentes pesticidas.
- [0004] Sin embargo, dado que los pesticidas modernos deben cumplir un amplio rango de exigencias, por ejemplo, con respecto al nivel, duración y espectro de acción, espectro de uso, toxicidad, combinación con otras sustancias activas, combinación con ayudantes de formulación o síntesis, y dado que es posible la aparición de resistencias, el desarrollo de dichas sustancias no se puede considerar nunca como concluido, y existe constantemente una
- 15 elevada demanda de nuevos compuestos que son ventajosos con respecto a los compuestos conocidos, por lo menos en lo que se refiere a algunos aspectos.
- [0005] Es un objeto de la presente invención proporcionar nuevos pesticidas que se puedan utilizar en animales de compañía domésticos.
- 20 [0006] Es ventajoso aplicar pesticidas a animales en forma oral para prevenir la posible contaminación de humanos o el medio circundante.
- [0007] Otro objetivo de la presente invención es proporcionar nuevos pesticidas que se puedan utilizar en dosis inferiores que los pesticidas existentes.
- [0008] Otro objeto de la invención es proporcionar nuevos pesticidas que sean sustancialmente no eméticos.
- 25 [0009] Otro objeto de la invención es proporcionar nuevos pesticidas que sean más seguros para el usuario y el medio ambiente.
- [0010] Otro objeto de la invención es proporcionar nuevos pesticidas que presenten una actividad mejorada contra los ectoparásitos en términos de tasa de aplicación y larga duración de actividad como ectoparasiticidas sistémicos.
- [0012] Los derivados del carbamato de aminopirazole sustituidos en la posición 5 de la presente invención se caracterizan por grupos cetona-oxima en el grupo carbamato.
- 30 [0013] La presente invención proporciona un compuesto que es un derivado de 5-oximecarbonilo-aminopirazole de fórmula I o una sal del mismo aceptable como pesticida:



donde:

35 W es =CR<sup>8</sup>- o =C(NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>)-,

R<sup>8</sup> es halógeno, alquilo o haloalquilo,

R<sup>9</sup> y R<sup>10</sup> son independientemente unos de otros hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>,

los grupos  $R^9$  y  $R^{10}$  están independientemente unos de otros opcionalmente sustituidos por uno o más de entre un halógeno, un cicloalquilo- $C_3-C_7$ , un arilo, un heteroarilo, alcoxi  $C_1-C_6$  y/o haloalcoxi  $C_1-C_6$ ,

$R^1$  es un ciano, un metilo, un trifluorometilo,  $-CS-NH_2$  o  $-C(=NR^{11})S(O)nR^{12}$ ,

$R^{11}$  es hidrógeno, alquilo o arilo,

5  $R^{12}$  es alquilo o arilo,

los grupos  $R^{11}$  y/o  $R^{12}$  están opcionalmente sustituidos por uno o más de entre halógeno, hidroxilo, oxo, nitro, ciano, amino, alquilo, alcoxi, alquiltio, cicloalquilo, arilo, heterociclilo y/o aralquilo,

$R^2$  es alquilo  $C_1-C_6$ , haloalquilo  $C_1-C_6$ , alqueno  $C_2-C_6$ , haloalqueno  $C_2-C_6$ , alquino  $C_2-C_6$  o haloalquino  $C_2-C_6$ ,

10  $R^3$  es hidrógeno, alquilo, alqueno, alquino, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, arilo, heterociclilo, aralquilo o heterocicliclalquilo, estando  $R^3$  opcionalmente sustituido por uno o más de entre halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, carboxi, éster de ácido carboxílico, oxo, alquilcarbonilo, haloalquilcarbonilo, cicloalquilcarbonilo, alquilocicloalquilcarbonilo, arilcarbonilo, aralquilo carbonilo, heterociclicarbonilo, heterocicliclalquilcarbonilo, amino, alquilo, alcoxi, haloalcoxi, alquenoiloxi, haloalquenoiloxi, alquinoiloxi, haloalquinoiloxi, alquiltio, haloalquiltio, cicloalquiltio, alquilocicloalquiltio, ariltio, aralquiltio, heterocicliiltio, heterociclicilo-alquiltio, alquilsulfoxidilo, haloalquilsulfoxidilo, alquilocicloalquilsulfoxidilo, arilsulfoxidilo, aralquilsulfoxidilo, heterociclicilsulfoxidilo, heterocicliclalquilsulfoxidilo, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, alquilocicloalquilo-sulfonilo, arilsulfonilo, aralquilsulfonilo, heterociclicilsulfonilo, heterocicliclalquilsulfonilo, cicloalquilo, cicloalquiloiloxi, arilo, arilo sustituido por uno o más de entre halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, ciano, nitro, alquiltio, haloalquiltio, cicloalquiltio, alquilocicloalquiltio, ariltio, aralquiltio, heterocicliiltio, heterocicliclalquiltio, alquilsulfoxidilo, haloalquilsulfoxidilo, cicloalquilsulfoxidilo, alquilocicloalquilsulfoxidilo, arilsulfoxidilo, aralquilsulfoxidilo, heterociclicilsulfoxidilo, heterocicliclalquilsulfoxidilo, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, cicloalquilsulfonilo, alquilocicloalquilsulfonilo, arilsulfonilo, aralquilsulfonilo, heterociclicilsulfonilo, heterocicliclalquilsulfonilo, y / o amino, un heterociclilo, un heterociclilo sustituido por uno o más de entre halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alquiltio, haloalquiltio, cicloalquiltio, alquilocicloalquiltio, ariltio, aralquiltio, heterocicliiltio, heterociclicilo-alquiltio, alquilsulfoxidilo, haloalquilsulfoxidilo, cicloalquilsulfoxidilo, alquilocicloalquilsulfoxidilo, arilsulfoxidilo, aralquilsulfoxidilo, heterociclicilsulfoxidilo, heterocicliclalquilsulfoxidilo, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, cicloalquilsulfonilo, alquilocicloalquilo-sulfonilo, arilsulfonilo, aralquilsulfonilo, heterociclicilsulfonilo, heterocicliclalquilsulfonilo, hidroxilo y/o oxo, aralquilo y/o heterocicliclalquilo,

30  $R^4$  y  $R^5$  son independientemente unos de otros hidrógeno, alquilo, alqueno, alquino, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, arilo, heterociclilo aralquilo o heterocicliclalquilo, o  $R^4$  y  $R^5$  junto con el átomo de carbono unido forman un anillo saturado o insaturado con cuatro a siete miembros que opcionalmente contiene átomos de oxígeno, azufre y/o nitrógeno en el anillo y/o que está fusionado con uno o más anillos heterocíclicos carbocíclicos saturados o insaturados, estando los grupos  $R^4$  y/o  $R^5$  o los anillos formados por  $R^4$  y  $R^5$  opcionalmente sustituidos por uno o más de entre halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, carboxi, éster de ácido carboxílico, oxo, alquilcarbonilo, haloalquilcarbonilo, cicloalquilcarbonilo, alquilocicloalquilcarbonil, arilcarbonilo, aralquilcarbonilo, heterociclicarbonilo, heterocicliclalquilcarbonilo, amino; alquilo, alcoxi, cicloalquiloiloxi, haloalcoxi, alquenoiloxi, haloalquenoiloxi, alquinoiloxi, haloalquinoiloxi, alquiltio, haloalquiltio, cicloalquiltio, alquilocicloalquiltio, ariltio, aralquiltio, heterocicliiltio, heterociclicilo-alquiltio, alquilsulfoxidilo, haloalquilsulfoxidilo, cicloalquilsulfoxidilo, alquilocicloalquilsulfoxidilo, arilsulfoxidilo, aralquilsulfoxidilo, heterociclicilsulfoxidilo, heterocicliclalquilsulfoxidilo, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, cicloalquilsulfonilo, alquilocicloalquilo-sulfonilo, arilsulfonilo, aralquilsulfonilo, heterociclicilsulfonilo, heterocicliclalquilsulfonilo, cicloalquilo, arilo, arilo sustituido por uno o más de entre halógeno, alquilo haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, ciano, nitro, alquiltio, haloalquiltio, cicloalquiltio, alquilocicloalquiltio, ariltio, aralquiltio, heterocicliiltio, heterocicliclalquiltio, alquilsulfoxidilo, haloalquilsulfoxidilo, cicloalquilsulfoxidilo, alquilocicloalquilsulfoxidilo, arilsulfoxidilo, aralquilsulfoxidilo, heterociclicilsulfoxidilo, heterocicliclalquilsulfoxidilo, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, cicloalquilsulfonilo, alquilocicloalquilsulfonilo, arilsulfonilo, aralquilsulfonilo, heterociclicilsulfonilo, heterocicliclalquilsulfonilo, y / o amino, heterociclilo, heterociclilo sustituido por uno o más de entre halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alquiltio, haloalquiltio, cicloalquiltio, alquilocicloalquiltio, ariltio, aralquiltio, heterocicliiltio, heterociclicilo-alquiltio, alquilsulfoxidilo, haloalquilsulfoxidilo, cicloalquilsulfoxidilo, alquilocicloalquilsulfoxidilo, arilsulfoxidilo, aralquilsulfoxidilo, heterociclicilsulfoxidilo, heterocicliclalquilsulfoxidilo, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, cicloalquilsulfonilo, alquilocicloalquilo-sulfonilo, arilsulfonilo, aralquilsulfonilo, heterociclicilsulfonilo, heterocicliclalquilsulfonilo, hidroxilo y/o oxo, aralquilo y/o heterocicliclalquilo,

$R^6$  es haloalquilo, haloalcoxi, halógeno o  $-SF_5$ ,  $R^7$  es halógeno, alquilo o  $-NR^{17}R^{18}$ ,

55  $R^{17}$  y  $R^{18}$  son independientemente unos de otros hidrógeno, alquilo  $C_1-C_6$ , alqueno  $C_2-C_6$  o alquino  $C_2-C_6$ , estando los grupos  $R^{17}$  y/o  $R^{18}$  opcionalmente sustituidos por uno o más de entre halógeno, cicloalquilo- $C_3-C_7$ , arilo, heteroarilo, alcoxi- $C_1-C_6$  o haloalcoxi- $C_1-C_6$ , y n es 0, 1, o 2.

**[0014]** En la presente descripción, incluyendo las reivindicaciones adjuntas, los sustituyentes antes mencionados tienen los siguientes significados:

Átomo halógeno significa fluoro, cloro, bromo o iodo.

El término "halo" delante del nombre de un radical significa que este radical está parcialmente o completamente halogenado, es decir, substituido por F, Cl, Br, o I, en cualquier combinación, preferentemente por F o Cl.

5 El término "alquilo" debe entenderse como un grupo hidrocarburo alifático saturado no-ramificado o ramificado. En general los grupos alquilo tienen de uno a diez átomos de carbono, preferentemente uno a ocho átomos de carbono. Algunos ejemplos de grupos alquilo son el metilo, etilo, propilo, isopropilo, 2- metilpropilo 1-butilo, 2-butilo, isobutilo, tert-butilo, 2-metilbutilo, 1,1-dimetilpropilo, n-pentilo, n-hexilo, n-heptilo, 2-etilhexilo u octilo.

El término "alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)" debe entenderse como un radical de hidrocarburo no-ramificado o ramificado que tiene de uno a seis átomos de carbono

10 **[0015]** Los radicales alquilo tienen preferentemente de 1 a 4 átomos de carbono.

**[0016]** El término "haloalquilo" significa un grupo alquilo donde uno o más átomos de hidrógeno están sustituidos por el mismo número de átomos halógenos idénticos o diferentes, preferentemente por fluoro y/o cloro.

15 **[0017]** Algunos ejemplos de grupos haloalquilo son el trifluorometilo, difluorometilo, monofluorometilo, 1- o 2-fluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, pentafluoroetilo, 1,1,2,2-tetrafluoroetilo, mono-, di- o triclorometilo, 1-fluoro-2-cloro-etilo, 1-cloro-2-fluoro-etilo o 1- o 2-cloroetilo.

**[0018]** Los radicales haloalquilo tienen preferentemente 1 o 2 átomos de carbono.

20 **[0019]** El término "alcoxi" significa un grupo hidrocarburo alifático saturado de cadena no-ramificada o ramificada que está conectado a través de un átomo de oxígeno a otro grupo. En general los grupos alcoxi tienen de uno a diez átomos de carbono. Preferentemente de uno a ocho átomos de carbono. Algunos ejemplos de grupos alcoxi son el metoxi, etoxi, propiloxi, isopropiloxi, 1-butiloxi, 2-butiloxi, isobutiloxi, tert-butiloxi, 2-metilbutiloxi, 1,1-dimetilpropiloxi, n-pentiloxi, n-hexiloxi, n-heptiloxi, 2-etilhexiloxi o octiloxi.

**[0020]** El término "Alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)" significa un grupo alcoxi cuya cadena de carbonos tiene el significado dado por la expresión "alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)".

25 **[0021]** El término "Haloalcoxi" significa un grupo alcoxi donde uno o más átomos de hidrógeno están sustituidos por átomos halógenos, preferentemente por fluoro y/o cloro. Ejemplos de grupos haloalcoxi son el trifluorometoxi, difluorometoxi, monofluorometoxi, pentafluoroetoxi, 1- o 2-fluoroetoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, clorometoxi, 2-cloroetoxi o el 1,1,2,2-tetrafluoro-etoxi.

30 **[0022]** El término "alquiltio" significa un grupo hidrocarburo alifático saturado de cadena no-ramificada o ramificada que está conectado a través de un átomo de azufre a otro grupo. En general los grupos alquiltio tienen de uno a diez átomos de carbono. Preferentemente de uno a ocho átomos de carbono. Algunos ejemplos de grupos alquiltio son el metiltio, etiltio, propiltio, isopropiltio, 1-butiltio, 2-butiltio, isobutiltio, tert-butiltio, 2-metilbutiltio, 1,1-dimetilpropiltio, n-pentiltio, n-hexiltio, n-heptiltio, 2-etilhexiltio u octiltio.

35 **[0023]** El término "alqueniilo" significa un grupo hidrocarburo alifático no-saturado de cadena no-ramificada o ramificada que tiene uno o más enlaces dobles no conjugados. En general los grupos alqueniilo tienen de uno a diez átomos de carbono. Preferentemente de uno a ocho átomos de carbono. Algunos ejemplos de grupos alqueniilo son el vinilo, alilo, 2-metil-2-propeniilo, 1- o 2-buteniilo, penteniilo, 2-metilpenteniilo, hexeniilo, hepteniilo u octeniilo.

**[0024]** El término "Alqueniilo-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)" significa una cadena de carbonos no-cíclica no-ramificada o ramificada que tiene un número de átomos de carbono que corresponde a este intervalo establecido y que contiene al menos un doble enlace que puede estar localizado en cualquier posición del radical insaturado respectivo.

40 **[0025]** El término "Alquinilo" significa un grupo hidrocarburo alifático no-saturado de cadena no-ramificada o ramificada que tiene uno o más enlaces triples no conjugados. En general los grupos alquinilo tienen de uno a diez átomos de carbono. Preferentemente de uno a ocho átomos de carbono. Algunos ejemplos de grupos alquinilo son el etinilo, propargilo, 2-metil-2-propinilo, 1-metil-2-propinilo, 2-butinilo, 3-butinilo, pentinilo, 2-metilpentinilo, hexinilo, heptinilo y octinilo.

45 **[0026]** El término "cicloalquilo" significa un grupo alquilo monocíclico y saturado alquil que tiene preferentemente de tres a siete átomos de carbono en el anillo, tal como el ciclopropil, ciclobutil, ciclopentil, ciclohexil, cicloheptil, ciclooctilo, ciclodecil; o un grupo alquilo saturado y bicíclico, tal como el norbornilo biciclo[2.2.2]octilo; o un sistema condensado y saturado, tal como el decahidronaftaleno. Se prefieren los grupos cicloalquilo monocíclicos con anillos de cinco o seis miembros.

50 **[0027]** El término "arilo" significa un grupo aromático carbocíclico hecho de átomos de carbono en anillo, preferentemente de seis a catorce, especialmente de seis a doce átomos de carbono en el anillo. Algunos ejemplos de grupos arilo son el fenilo, el naftilo, el bifeniilo, preferentemente el fenilo.

- [0028]** El término "heterociclilo" significa un grupo cíclico totalmente saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado que además tiene al menos un átomo de carbono de anillo o más heteroátomos en anillo que se seleccionan del grupo oxígeno, azufre y nitrógeno. Son posibles diferentes heteroátomos con la excepción de dos átomos de oxígeno adyacentes en el anillo. Los grupos heterociclilo contienen 1, 2 o 3 átomos en el anillo heterocíclico, preferentemente seleccionados del grupo constituido por N, O y S (incluyendo la forma oxidada del azufre). Los grupos heterociclilo son preferentemente radicales heterociclilo alifáticos que tienen de 3 a 7 átomos cíclicos o un radicales heteroaromáticos que tienen de 5 a 7 átomos cíclicos. Los grupos heteroaromáticos pueden ser sistemas aromáticos mono-, bi- o policíclicos en los cuales al menos un anillo contiene uno o más heteroátomos.
- [0029]** Algunos ejemplos de grupos heterociclilo son el tiofenilo, furilo, pirrolilo, tiazolilo, oxazolilo, imidazolilo, isotiazolilo, isoxazolilo, pirazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,3,4-triazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,2,4-triazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,3,4-tetrazolilo, -benzo[b]tiofenilo, benzo[b]furanilo, indolilo, benzo[c]tiofenilo, benzo[c]furanilo, isoindolilo, benzoxazolilo, benzotiazolilo, benzimidazolilo, benzisoxazolilo, benzisotiazolilo, benzopirazolilo, benzotiadiazolilo, benzotriazolilo, dibenzofuranilo, dibenzotiofenilo, carbazolilo, piridilo, pirazinilo, pirimidinilo, piridazinilo, 1,3,5-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,2,4,5-tetrazinilo, quinolinilo, isoquinolinilo, quinoxalinilo, quinazolinilo, cinnolinilo, 1,8-naftiridinilo, 1,5-naftiridinilo, 1,6-naftiridinilo, 1,7-naftiridinilo, ftalazinilo, piridopirimidinilo, purinilo, pteridinilo, 4H-quinolizinilo, piperidinilo, pirrolidinilo, oxazolinilo, tetrahidrofuranilo, tetrahidropirranilo, isoxazolidinilo, tiazolidinilo, thienilo, oxiranilo, oxetanilo, oxolanilo (= tetrahidrofurilo), oxanilo, pirrolidilo, piperidilo, piperizinilo, dioxolanilo, oxazolinilo, isoxazolinilo, oxazolidinilo, isoxazolidinilo y morfolinilo.
- [0030]** El término "grupo heteroaromático" o "grupo heteroarilo" es un subgrupo del término "grupo heterociclilo" y abarca la lista mencionada más arriba de compuestos heterocíclicos aromáticos totalmente insaturados.
- [0031]** Heterociclilo significa preferentemente un sistema de anillos insaturados, parcialmente saturados o aromáticos con tres a seis átomos de carbono en el anillo y uno a cuatro heteroátomos de anillo seleccionados del grupo oxígeno, azufre y nitrógeno o sus combinaciones.
- [0032]** Dos grupos junto con un átomo de carbono enlazado pueden formar un anillo saturado o insaturado carbocíclico con cuatro a siete miembros incluyendo un anillo aromático. Pueden formar un sistema de anillos o anillo donde un anillo está fusionado con uno o más anillos carbocíclicos o heterocíclicos saturados o insaturados, preferentemente con un anillo benceno. Algunos ejemplos de estos sistemas son las indanonas, tetralonas o cromanonas.
- [0033]** El término "cicloalquilalquilo" significa un grupo cicloalquilo que está conectado a través de un grupo alquileo a otro grupo. La parte alquileo es una porción de hidrocarburo saturada de cadena lineal o ramificada que tiene en general de uno a seis átomos de carbono.
- [0034]** El término "cicloalquiloxi" significa un grupo cicloalquilo que está conectado a través de un átomo de oxígeno con otro grupo.
- [0035]** El término "aralquil" significa un grupo arilo que está conectado a través de un grupo alquileo a otro grupo. La porción alquileo es una porción de hidrocarburo saturada de cadena lineal o ramificada que tiene en general de uno a seis átomos de carbono. Un grupo aralquilo preferido es el bencilo.
- [0036]** El término "heterocicilalquilo" significa un grupo heterociclilo que está conectado a través de un grupo alquileo a otro grupo. La porción alquileo es una porción de hidrocarburo saturada de cadena lineal o ramificada que tiene en general de uno a seis átomos de carbono.
- [0037]** Se prefieren los compuestos de fórmula I donde W es =C(halógeno)-.
- [0038]** Se prefieren los compuestos de fórmula I, donde R<sup>8</sup> es cloro o flúor.
- [0039]** Se prefieren los compuestos de fórmula I, donde R<sup>1</sup> es ciano, metilo, trifluorometil o -CS-NH<sub>2</sub>.
- [0040]** Más preferentemente R<sup>1</sup> es -CN o -CSNH<sub>2</sub> y el R<sup>1</sup> más preferido es -CN.
- [0041]** Se prefieren los compuestos de fórmula I, donde R<sup>2</sup> es haloalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>) y el más preferido es -CF<sub>3</sub>.
- [0042]** Se prefieren los compuestos de fórmula I, donde R<sup>3</sup> es hidrógeno, alquilo, alqueno, alquino, haloalquilo, haloalqueno o haloalquino.
- [0043]** Preferentemente R<sup>3</sup> es hidrógeno o alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) no sustituido o sustituido por uno o más radicales que se seleccionan del grupo que consiste en halógeno, alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquenoiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquenoiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), alquinoiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquinoiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>), S(O)<sub>p</sub>R<sup>19</sup>, CN, NO<sub>2</sub>, OH, R<sup>20</sup>, R<sup>21</sup>, COR<sup>19</sup>, NR<sup>22</sup>R<sup>23</sup>, OR<sup>19</sup>, COOH y CO<sub>2</sub>R<sup>19</sup>, donde R<sup>19</sup>, R<sup>20</sup>, R<sup>21</sup>, R<sup>22</sup>, R<sup>23</sup> y p son tal como se definen a continuación.
- [0044]** Más preferentemente R<sup>3</sup> es hidrógeno o alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>).

**[0045]** Se prefieren los compuestos de fórmula I, donde  $R^4$  y  $R^5$  son independientemente entre unos y otros alqueno, alqueno, haloalqueno o haloalqueno.

**[0046]** Preferentemente  $R^4$  y  $R^5$  son cada uno independientemente entre sí alqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), haloalqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), haloalqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), o son independientemente unos de otros fenilo, heterociclilo que están no sustituidos o sustituidos por uno o más radicales que se seleccionan del grupo que consiste en halógeno, alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquenoiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquenoiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), alquenoiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquenoiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>), cicloalquiloiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>), S(O)<sub>p</sub>R<sup>19</sup>, CN, NO<sub>2</sub>, OH, R<sup>20</sup>, R<sup>21</sup>, COR<sup>19</sup>, NR<sup>22</sup>R<sup>13</sup>, OR<sup>19</sup>, COOH y CO<sub>2</sub>R<sup>19</sup>,

o son cada uno independientemente alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) no sustituido o sustituido por uno o más radicales que se seleccionan del grupo que consiste en halógeno, alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquenoiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquenoiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), alquenoiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquenoiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>), cicloalquiloiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>), S(O)<sub>p</sub>R<sup>19</sup>, CN, NO<sub>2</sub>, OH, R<sup>20</sup>, R<sup>21</sup>, COR<sup>19</sup>, NR<sup>22</sup>R<sup>23</sup>, COOH y CO<sub>2</sub>R<sup>19</sup>, o

$R^4$  y  $R^5$  junto con el átomo de carbono enlazado pueden formar un anillo saturado de cuatro a siete miembros o un anillo insaturado de cinco a siete miembros, que opcionalmente contiene uno o más heteroátomos en el anillo que se seleccionan de entre O, S y N, estando el anillo no sustituido o sustituido por uno o más radicales que se seleccionan del grupo que consiste en halógeno, alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) y oxo, y si lo hay, cualquier átomo adicional de N del anillo está no sustituido o sustituido por un radical alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), CO-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) o CH<sub>2</sub>R<sup>20</sup>; o que está condensado como un anillo de benceno, donde R<sup>19</sup>, R<sup>20</sup>, R<sup>21</sup>, R<sup>22</sup>, R<sup>23</sup> y p son tal como se definen a continuación.

R<sup>6</sup> es muy preferentemente halógeno, alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), haloalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>) o -SF<sub>5</sub>, más preferentemente cloro o -CF<sub>3</sub>.

**[0047]** Se prefieren los compuestos de fórmula I, donde R<sup>7</sup> y R<sup>8</sup> son halógeno o R<sup>7</sup> es -NR<sup>17</sup>R<sup>18</sup>.

**[0048]** Se prefieren especialmente los compuestos de fórmula I, donde

R<sup>1</sup> es -CN,

R<sup>7</sup> es halógeno, -CH<sub>3</sub>, o -NR<sup>17</sup>R<sup>18</sup>,

R<sup>6</sup> es (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-haloalquilo, (C<sub>1</sub>C<sub>3</sub>)-haloalkoxi o -SF<sub>5</sub>,

R<sup>3</sup> es hidrógeno, alqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), haloalqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), haloalqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), o alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) no sustituido o sustituido por uno o más radicales que se seleccionan del grupo que consiste en halógeno, alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquenoiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquenoiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), alquenoiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquenoiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>), cicloalquiloiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>), -S(O)<sub>p</sub>R<sup>19</sup>, -CN, -NO<sub>2</sub>, -OH, -R<sup>20</sup>, R<sup>21</sup>, -COR<sup>19</sup>, -NR<sup>22</sup>R<sup>23</sup>, -OR<sup>9</sup>, -COOH y -CO<sub>2</sub>R<sup>19</sup>,

R<sup>2</sup> es alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), haloalqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>) o haloalqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>),

$R^4$  y  $R^5$  son cada uno independientemente alqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), haloalqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), haloalqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), o son cada uno independientemente fenilo, heterociclilo que están no sustituidos o sustituidos por uno o más radicales que se seleccionan del grupo que consiste en halógeno, alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquenoiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquenoiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), alquenoiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquenoiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>), cicloalquiloiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>), S(O)<sub>p</sub>R<sup>19</sup>, CN, NO<sub>2</sub>, OH, R<sup>20</sup>, R<sup>21</sup>, COR<sup>19</sup>, NR<sup>22</sup>R<sup>23</sup>, OR<sup>19</sup>, COOH y CO<sub>2</sub>R<sup>19</sup>,

o son cada uno independientemente alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) no sustituido o sustituido por uno o más radicales que se seleccionan del grupo que consiste en halógeno, alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquenoiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquenoiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), alquenoiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquenoiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>), cicloalquiloiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>), S(O)<sub>p</sub>R<sup>19</sup>, CN, NO<sub>2</sub>, OH, R<sup>20</sup>, R<sup>21</sup>, COR<sup>19</sup>, NR<sup>22</sup>R<sup>23</sup>, COOH y CO<sub>2</sub>R<sup>19</sup>, o

$R^4$  y  $R^5$  junto con el átomo de carbono enlazado pueden formar un anillo saturado de cuatro a siete miembros o un anillo insaturado de cinco a siete miembros, que opcionalmente contiene uno o más heteroátomos en el anillo que se seleccionan de entre O, S y N, estando el anillo no sustituido o sustituido por uno o más radicales que se seleccionan del grupo que consiste en halógeno, alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) y oxo, y si lo hay cualquier átomo adicional de N del anillo está no sustituido o sustituido por un alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), CO-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) o CH<sub>2</sub>R<sup>20</sup> radical; o que está condensado con un anillo de benceno,

R<sup>19</sup> es alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>), alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>), -(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>R<sup>20</sup> o -(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>R<sup>21</sup>,

R<sup>20</sup> es fenilo no sustituido o sustituido por uno o más radicales que se seleccionan del grupo que consiste en halógeno, alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), CN, NO<sub>2</sub>, S(O)<sub>p</sub>R<sup>19</sup> y NR<sup>22</sup>R<sup>23</sup>,

R<sup>21</sup> es heterociclilo no sustituido o sustituido por uno o más radicales que se seleccionan del grupo que consiste en halógeno, alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-haloalquilo, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkoxi, S(O)pR<sup>19</sup>, OH y oxo,

R<sup>22</sup> y R<sup>23</sup> son cada uno independientemente hidrógeno, alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alquenilo-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>) o alquinilo-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), donde los tres últimos grupos mencionados están no sustituidos o sustituidos por uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>), R<sup>20</sup>, R<sup>21</sup>, alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), y

n y p y q son cada uno independientemente cero, uno o dos.

**[0049]** Se prefieren muy especialmente los compuestos de fórmula I, donde:

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

R<sup>7</sup> y R<sup>8</sup> son Cl,

10 R<sup>6</sup> es CF<sub>3</sub>,

R<sup>3</sup> es hidrógeno o alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), y

R<sup>2</sup> es CF<sub>3</sub>.

**[0050]** Se prefieren especialmente los compuestos de fórmula I, donde:

15 R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> son cada uno independientemente alquenilo-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquenilo-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alquinilo-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquinilo-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), o son cada uno independientemente R<sup>20</sup>, R<sup>21</sup>, no sustituido o sustituido por uno o más radicales que se seleccionan del grupo que consiste en halógeno, alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alqueniloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), haloalqueniloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), alquiniloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquiniloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>), S(O)pR<sup>19</sup>, CN, NO<sub>2</sub>, OH, R<sup>20</sup>, R<sup>21</sup>, COR<sup>19</sup>, NR<sup>22</sup>R<sup>23</sup>, OR<sup>19</sup>, COOH y CO<sub>2</sub>R<sup>19</sup>, o son cada uno independientemente alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) no sustituido o sustituido por uno o más radicales que se seleccionan del grupo

20 que consiste en halógeno, alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alqueniloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), haloalqueniloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), alquiniloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquiniloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>), S(O)pR<sup>19</sup>, CN, NO<sub>2</sub>, OH, R<sup>20</sup>, R<sup>21</sup>, COR<sup>19</sup>, NR<sup>22</sup>R<sup>23</sup>, OR<sup>19</sup>, COOH y CO<sub>2</sub>R<sup>19</sup>,

R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> junto con el átomo de carbono enlazado pueden formar un anillo saturado de cuatro a siete miembros o un anillo insaturado de cinco a siete miembros, que opcionalmente contiene uno o más heteroátomos adicionales en el

25 anillo que se seleccionan de entre O, S y N, estando el anillo no sustituido o sustituido por uno o más radicales que se seleccionan del grupo que consiste en halógeno, alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) y oxo, y si lo hay cualquier átomo adicional de nitrógeno del anillo está no sustituido o sustituido por un alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), CO-alquilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) o CH<sub>2</sub>R<sup>20</sup> radical; o que está condensado con un anillo de benceno.

**[0051]** Estos compuestos tienen propiedades pesticidas valiosas.

30 **[0052]** La presente invención también comprende cualquier estereoisómero, enantiómero, isómero geométrico, y mezclas de estos.

**[0053]** Por el término "sales aceptables como pesticidas" se entienden sales, aniones o cationes conocidos y aceptados en la técnica para la formación de sales para uso pesticida.

35 **[0054]** Algunas sales adecuadas con bases, por ejemplo formadas por compuestos de fórmula I que contienen un grupo ácido carboxílico, que incluyen metal alcalino (por ejemplo sodio y potasio), metal alcalino-térreo (por ejemplo calcio y magnesio), sales de amonio y amina (por ejemplo dietanolamina, trietanolamina, octilamina, morfolina y diocilmetilamina). Algunas sales de adición ácidas adecuadas, por ejemplo formadas por compuestos de fórmula I que contienen un grupo amino, incluyen sales con ácidos inorgánicos, por ejemplo hidrocioratos, sulfatos, fosfatos y nitratos y sales con ácidos orgánicos, por ejemplo ácido acético.

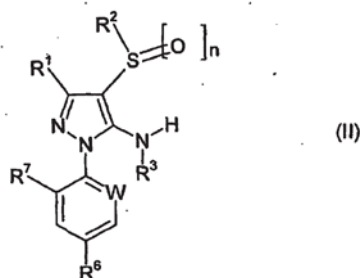
40 **[0055]** La expresión "uno o más radicales que se seleccionan del grupo que consiste en" en la definición debe entenderse como que significa en cada caso uno o más radicales idénticos o diferentes seleccionados del grupo establecido de radicales, a no ser que se definan expresamente limitaciones específicas.

**[0056]** El término plagas significa plagas de artrópodos (incluyendo insectos y arácnidos) y helmintos (incluyendo nemátodos).

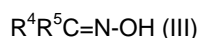
45 **[0057]** Los compuestos de fórmula general (I) pueden ser preparados por la aplicación o adaptación de procedimientos conocidos (es decir procedimientos hasta ahora utilizados o descritos en la literatura química).

**[0058]** En la descripción de procesos siguiente cuando los símbolos que aparecen en las fórmulas no se definen específicamente, se entiende que están "tal como se ha definido más arriba" de acuerdo con la primera definición de cada símbolo en la descripción.

**[0059]** Según otra característica adicional de la invención los compuestos de fórmula I en la cual  $R^1$  es ciano o halógeno, alquilo o haloalquilo y  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$ ,  $R^7$ , W y n son tales como se han definido más arriba, se pueden preparar mediante la reacción de un compuesto de fórmula (II):



5 en la cual  $R^1$  es ciano o halógeno, alquilo o haloalquilo y los otros valores son tales como se han definido más arriba, con un oxima de fórmula (III):



Y fosgeno  $COCl_2$  (o un precursor de fosgeno como el difosgeno o el trifosgeno) y una base.

**[0060]** La reacción se realiza en general empleando un disolvente tal como el tetrahidrofurano, el dioxano, el diclorometano o el acetonitrilo a una temperatura de  $0^\circ C$  a  $100^\circ C$ . La base es preferentemente una base orgánica tal como una amina terciaria, por ejemplo trietilamina o etildisopropilamina, o un hidruro de metal alcalino tal como el

hidruro de sodio, o un carbonato de metal alcalino tal como el carbonato de potasio o de sodio, o un fosfato de metal alcalino tal como un fosfato de sodio.

**[0061]** Según otra característica adicional de la invención los compuestos de fórmula I en la cual  $R^1$  es  $CSNH_2$ , y los otros valores son tales como se han definido más arriba, se pueden preparar mediante la reacción del compuesto de fórmula I correspondiente en la cual  $R^1$  es CN, con un hidrosulfuro de metal alcalino o alcalino-térreo, tal como litio, potasio, calcio o preferentemente hidrosulfuro de sodio, en un disolvente inerte como por ejemplo N,N-dimetilformamida, piridina, dioxano, tetrahidrofurano, sulfolano, sulfóxido de dimetilo, metanol o etanol a una temperatura desde  $-35^\circ C$  hasta  $50^\circ C$  preferentemente de  $0^\circ C$  a  $30^\circ C$ . Opcionalmente el hidrosulfuro puede generarse in situ mediante tratamiento con  $H_2S$  en presencia de una base orgánica, tal como un alcóxido metálico o trialkilamina o una base inorgánica, tal como un hidróxido alcalino o metal alcalino-térreo o un carbonato, tal como un carbonato de sodio, de potasio o de amonio. La utilización de un agente de formación de complejos metálicos, tal como un éter de corona, puede ser beneficioso para acelerar la reacción.

**[0062]** La reacción de sal de hidrosulfuro con el compuesto de fórmula I también puede realizarse en un sistema de disolvente agua/ orgánico en dos fases empleando un catalizador de transferencia de fase tal como un éter de corona o una sal de tetraalkiloamonio tal como un bromuro de tetra-n-butilamonio o cloruro de benziltrimetilamonio. Algunos disolventes orgánicos adecuados para la utilización en un sistema de dos fases con agua incluyen benceno, tolueno, diclorometano, 1-clorobutano y éter de metilo terciario-butilo.

**[0063]** Según otra característica adicional de la invención se pueden preparar los compuestos de fórmula I en la cual  $R^1$  es  $CSNH_2$ , y los otros valores son tales como se han definido más arriba, mediante la reacción del compuesto de fórmula I correspondiente en la cual  $R^1$  es CN, con un sulfuro de bis(trialkilsililo), preferentemente sulfuro de bis(trimetilsililo), en presencia de una base en general un alcóxido de metal alcalino tal como el metóxido de sodio, en un disolvente tal como la N,N-dimetilformamida, a una temperatura a partir de  $0^\circ C$  to  $60^\circ C$ . El proceso se describe en general en Lin, Ku y Shiao en Synthesis 1219 (1992). Según una característica de la invención los compuestos de fórmula I donde n es 1 o 2 y  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$ , Z y W son tal como se han definido arriba,

Se pueden preparar oxidando un compuesto correspondiente donde n es 0 o 1. La oxidación se suele llevar a cabo empleando un perácido tal como el ácido 3-cloroperbenzoico en un disolvente, tal como el diclorometano o en 1,2-dicloroetano, a una temperatura que va desde  $0^\circ C$  hasta la temperatura de reflujo del disolvente:

Los productos intermedios de fórmula II se pueden preparar tal como se describe en EP-A-295,117.

**[0064]** Los conjuntos de compuestos de la fórmula I que se pueden sintetizar mediante el proceso mencionado anteriormente también se pueden preparar de una manera paralela, y esto se realiza manualmente o de una manera semiautomática o totalmente automatizada. En este caso, es posible por ejemplo, automatizar el proceso de la reacción, el "work-up" o la purificación de los productos o de los intermedios. En total, esto debe entenderse que significa un procedimiento tal como se describe, por ejemplo, por S.H. DeWitt en "Annual Reports in Combinatorial Chemistry and Molecular Diversity: Automated Synthesis", Volumen 1, Verlag Escm 1997, páginas 69 a 77.



**[0065]** Se pueden utilizar un conjunto de aparatos comercialmente disponibles como los ofrecidos por, por ejemplo, Stem Corporation, Woodrolfe Road, Tollesbury, Essex, CM9 8SE, Inglaterra o H+P Labortechnik GmbH, Bruckmannring 28, 85764 Oberschleißheim, Alemania o Radleys, Shirehill, Saffron Walden, Essex, Inglaterra, para el procedimiento en paralelo de la reacción y "work-up".

- 5 **[0066]** Para la purificación en paralelo de compuestos de la fórmula I, o de intermedios obtenidos durante la preparación, se pueden utilizar entre otros, aparatos de cromatografía, por ejemplo, los de ISCO, Inc., 4700 Superior Street, Lincoln, NE 68504, Estados Unidos.

- [0067]** Los aparatos mencionados conducen a un procedimiento modular en el que las etapas individuales del proceso están automatizadas, pero las operaciones manuales se deben realizar entre las etapas del proceso. Esto se puede evitar mediante la utilización de sistemas de automatización semiintegrados o totalmente integrados, donde los módulos de automatización en cuestión son operador por ejemplo, robots. Dichos sistemas de automatización se puede obtener, por ejemplo, de Zymark Corporation, Zymark Center, Hopkinton, MA 01748, Estados Unidos.
- 10

- [0068]** Además de lo que se ha descrito aquí, los compuestos de la fórmula I se pueden preparar en parte o totalmente mediante métodos en soporte de fase sólida. Para este objetivo. Las etapas intermedias sintéticas o todas las etapas intermedias de la síntesis o de una síntesis adaptada para adecuar el procedimiento en cuestión están unidas a una resina sintética. Los métodos de síntesis en soporte de fase sólida se describen ampliamente en la literatura especializada, por ejemplo, Barry A. Bunin en "The Combinatorial index", Academic Press, 1998.
- 15

- [0069]** La utilización de métodos de síntesis en soporte de fase sólida permite una serie de protocolos que son conocidos de la literatura y que, a su vez, se pueden realizar manualmente o de una manera automatizada. Por ejemplo, el "método de la bolsita de té" (Houghten, US 4.631.211; Houghten et al., Proc. Natl. Acad. Sci, 1985, 82, 5131-5135), en el que se utilizan los productos por IRORI, 11149 North Torrey Pines Road, La Jolla, CA 92037, USA, pueden ser semiautomatizado. La automatización de las síntesis en paralelo en soporte de fase sólida se realiza satisfactoriamente, por ejemplo, mediante aparatos por Argonaut Technologies, Inc., 887 Industrial Road, San Carlos, CA 94070, Estados Unidos o MultiSynTech GmbH, Wullener Feld 4, 58454 Witten, Alemania.
- 20  
25

**[0070]** La preparación de los procesos descritos en la presente invención produce compuestos de la fórmula I en forma de conjuntos de sustancias que se denominan bibliotecas. La presente invención también se refiere a bibliotecas que comprenden por lo menos dos compuestos de la fórmula I.

**[0071]** Los compuestos de fórmula III se pueden preparar empleando procesos conocidos.

- 30 **[0072]** Los ejemplos siguientes no limitativos ilustran la preparación de los compuestos de fórmula I.

#### Ejemplos químicos

**[0073]** Los espectros NMR se realizaron en deuterocloroformo a no ser que se precise lo contrario.

**[0074]** En los ejemplos siguientes, las cantidades (y también los porcentajes) están basados en peso, a no ser que se precise lo contrario. Las ratios de disolvente están expresadas en volumen.

- 35 Ejemplo 1

Compuesto número 3-02

1-[2,6-dicloro-4-(trifluorometil)fenil]-5-[metil(((1-feniletidene)amino)oxi)carbonil] amino]-4-[(trifluorometil) sulfini]-1H-pirazole-3-carbonitrilo

- [0075]** A una mezcla de 1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-ciano-5-metilamino-4-trifluorometilsulfini-pirazole (0.5 g, 1.1 mmol), acetofenone-oxima (0.165 g, 1.2 mmol), diisopropiletilamina (0.43 g, 3.3 mmol) y 4-dimetilaminopiridina (41 mg, 0.3 mmol) en tetrahidrofurano (15 ml) se le añadió una solución de tolueno de fosgeno (0.66 g, 20%, 1.2 mmol) a 0-5°C. La mezcla se agitó a reflujo durante dos horas. El workup extractivo (heptano-acetato de etilo, agua) y cromatografía dieron como resultado el producto del título (Compuesto 3-02, 0.14 g) como un sólido; 1H-NMR: 2,25 (3H), 3,21 (3H), 7,42 y 7,68 (5H), 7,82 (2H); 19F-NMR: -64,3 (PhCF<sub>3</sub>); -72,9 (SO-CF<sub>3</sub>).
- 40

- 45 Ejemplo 2:

Compuesto número 4-08

- [0076]** A una mezcla de 1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-ciano-5-metilamino-4-trifluorometilsulfini-pirazole (0.5 g, 1.1 mmol), ciclohexanone-oxime (0.138 g, 1.2 mmol), diisopropiletilamina (0.43 g, 3.3 mmol) y 4-dimetilaminopiridina (41 mg, 0.3 mmol) en tetrahidrofurano (15 ml) se le añadió una solución de fosgeno (0.66 g, 20%, 1.2 mmol) a 0-5°C. La mezcla se agitó a reflujo durante dos horas. El workup extractivo (heptano-acetato de etilo, agua) y la cromatografía dieron como resultado el producto del título (Compuesto 4-08, 0.12 g) en forma de aceite; 1H-NMR: 1,62 y 1,74 (6H), 2,34 (4H), 3,11 (3H), 7,81 (2H); 19F-NMR: -63,8 (Ph-CF<sub>3</sub>), -72,4 (SO-CF<sub>3</sub>).
- 50

Tablas:

**[0077]** Los siguientes compuestos preferidos mostrados en las tablas 1 a 4 forman parte de la presente invención, y se prepararon o se pueden preparar según o de forma análoga a los ejemplos 1 a 4 mencionados más arriba o los procedimientos generales descritos más arriba.

5 **[0078]** Cuando se omiten los subíndices, debe entenderse igualmente que están presentes, por ejemplo CH<sub>2</sub> significa CH<sub>2</sub>.

**[0079]** En las tablas Me significa metilo, Et significa etilo, Pr significa propilo, Bu significa butilo, C<sub>5</sub>H<sub>11</sub> significa n-pentilo, C<sub>6</sub>H<sub>13</sub> significa n-hexilo, C<sub>2</sub>H<sub>4</sub> significa etileno, (-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-), cC<sub>3</sub>H<sub>5</sub> significa ciclopropilo, NHC<sub>3</sub>H<sub>6</sub> significa propileneamino, (-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH-), y Ph significa fenilo.

10 **[0080]** Los valores de desplazamiento <sup>19</sup>F-NMR se dan en ppm.

**[0081]** "Cpd No" significa Número de compuesto.

**[0082]** Los números de compuesto se dan solamente con finalidad de referencia.

Tabla 1: Compuestos de Fórmula I donde los sustituyentes tienen los siguientes significados:

R <sup>1</sup> es CN; R <sup>7</sup> y R <sup>8</sup> son Cl; R <sup>6</sup> y R <sup>2</sup> son ambos CF <sub>3</sub> ; R <sup>3</sup> es Me				
R <sup>4</sup> son R <sup>5</sup> son cada uno independientemente alquilo-(C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> ) o haloalquilo (C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> )				
Número de compuesto	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	n	mp.°C, NMR(ppm)
1-01	Me	Me	0	
1-02	Me	Me	1	19F:-63,8;-72,4;
1-03	Me	Me	2	
1-04	Me	Et	0	
1-05	Me	Et	1	
1-06	Me	Et	2	
1-07	Me	n-Pr	0	
1-08	Me	n-Pr	1	
1-09	Me	n-Pr	2	
1-10	Me	iPr	0	
1-11	Me	iPr	1	
1-12	Me	iPr	2	
1-13	Me	nBu	0	
1-14	Me	nBu	1	
1-15	Me	nBu	2	
1-16	Me	secBu	0	
1-17	Me	secBu	1	
1-18	Me	secBu	2	
1-19	Me	iBu	0	
1-20	Me	iBu	1	
1-21	Me	iBu	2	

ES 2 377 481 T3

1-22	Me	tBu	0	
1-23	Me	tBu	1	
1-24	Me	tBu	2	
1-25	Me	nC5H11	0	
1-26	Me	nC5H11	1	
1-27	Me	nC5H11	2	
1-28	Me	nC6H13	0	
1-29	Me	nC6H13	1	
1-30	Me	nC6H13	2	
1-31	Et	Et	0	
1-32	Et	Et	1	
1-33	Et	Et	2	
1-34	nPr	nPr	0	
1-35	nPr	nPr	1	
1-36	nPr	-nPr	2	
1-37	nBu	nBu	0	
1-38	nBu	nBu	1	
1-39	nBu	nBu	2	
1-40	Me	CF3	0	
1-41	Me	CF3	1	
1-42	Me	CF3	2	
1-43	Et	CF3	0	
1-44	Et	CF3	1	
1-45	Et	CF3	2	

Tabla 2: Compuestos de fórmula I donde los sustituyentes tienen los siguientes significados:

R <sup>1</sup> es CN; R <sup>7</sup> y R <sup>8</sup> son Cl; R <sup>6</sup> y R <sup>2</sup> son ambos CF <sub>3</sub> ; R <sup>3</sup> es Me;				
R <sup>4</sup> es alquilo-(C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> ) y R <sup>5</sup> es cicloalquilo-(C <sub>3</sub> -C <sub>7</sub> ) o cicloalquilo-(C <sub>3</sub> -C <sub>7</sub> )-alquilo-(C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> )				
Número de compuesto	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	n	mp. °C, NMR(ppm)
2-01	Me	cPr	0	
2-02	Me	cPr	1	
2-03	Me	cPr	2	
2-04	Me	cBu	0	
2-5	Me	cBu	1	
2-06	Me	cBu	2	

## ES 2 377 481 T3

2-07	Me	cC5H9	0	
2-08	Me	cC5H9	1	
2-09	Me	cC5H9	2	
2-10	Me	cC6H11	0	
2-11	Me	cC6H11	1	
2-12	Me	cC6H11	2	
2-13	Me	cC7H13	0	
2-14	Me	cC7H13	1	
2-15	Me	cC7H13	2	
2-16	Et	cPr	0	
2-17	Et	cPr	1	
2-18	Et	cPr	2	
2-19	Et	cBu	0	
2-20	Et	cBu	1	
2-21	Et	cBu	2	
2-22	Et	cC5H9	0	
2-23	Et	cC5H9	1	
2-24	Et	cC5H9	2	
2-25	Et	cC6H11	0	
2-26	Et	cC6H11	1	
2-27	Et	cC6H11	2	
2-28	Et	cC7H13	0	
2-29	Et	cC7H13	1	
2-30	Et	cC7H13	2	
2-31	Me	CH2cPr	0	
2-32	Me	CH2cPr	1	
2-33	Me	CH2cPr	2	
2-34	Me	CH2cBu	0	
2-35	Me	CH2cBu	1	
2-36	Me	CH2cBu	2	
2-37	Met	CH2cC5H9	0	
2-38	Me	CH2cC5H9	1	
2-39	Me	CH2cC5H9	2	
2-40	Me	CH2cC6H11	0	
2-41	Me	CH2cC6H11	1	

2-42	Me	CH <sub>2</sub> cC <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	2	
2-43	Me	CH <sub>2</sub> cC <sub>7</sub> H <sub>13</sub>	0	
2-44	Me	CH <sub>2</sub> cC <sub>7</sub> H <sub>13</sub>	1	
2-45	Me	CH <sub>2</sub> cC <sub>7</sub> H <sub>13</sub>	2	
2-46	Me	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> cPr	0	
2-47	Me	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> cPr	1	
2-48	Me	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> cPr	2	
2-49	Me	C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> cPr	0	
2-50	Me	C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> cPr	1	
2-51	Me	C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> cPr	2	
2-52	Me	C <sub>4</sub> H <sub>8</sub> cPr	0	
2-53	Me	C <sub>4</sub> H <sub>8</sub> cPr	1	
2-54	Me	C <sub>4</sub> H <sub>8</sub> cPr	2	

Tabla 3: Compuestos de fórmula I donde los sustituyentes tienen los siguientes significados:

R <sup>1</sup> es CN; R <sup>7</sup> y R <sup>8</sup> son Cl; R <sup>6</sup> y R <sup>2</sup> son ambos CF <sub>3</sub> ; R <sup>3</sup> es Me; R <sup>4</sup> es alquilo-(C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> ) o R <sup>20</sup> y R <sup>5</sup> son R <sup>20</sup> o R <sup>10</sup> o alquilo-(C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> ) sustituido por R <sup>20</sup>				
Número de compuesto	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	n	mp. °C, NMR(ppm)
3-01	Me	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	0	
3-02	Me	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	1	<sup>19</sup> F:-64,3;-72,9;
3-03	Me	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	2	
3-04	Et	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	0	
3-05	Et	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	1	
3-06	Et	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	2	
3-07	nPr	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	0	
3-08	nPr	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	1	
3-09	nPr	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	2	
3-10	nBu	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	0	
3-11	nBu	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	1	
3-12	nBu	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	2	
3-13	Me	4-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	0	
3-14	Me	4-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	1	
3-15	Me	4-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	2	
3-16	Me	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	0	
3-17	Me	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	1	

## ES 2 377 481 T3

3-18	Me	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	2	
3-19	Me	4-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	0	
3-20	Me	4-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	1	
3-21	Me	4-Br-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	2	
3-22	Me	4-MeO-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	0	
3-23	Me	4-MeO-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	1	
3-24	Me	4-MeO-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	2	
3-25	Me	2-piridilo	0	
3-26	Me	2-piridilo	1	
3-27	Me	2-piridilo	2	
3-28	Me	3-piridilo	0	
3-29	Me	3-piridilo	1	
3-30	Me	3-piridilo	2	
3-31	Me	4-piridilo	0	
3-32	Me	4-piridilo	1	
3-33	Me	4-piridilo	2	
3-34	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	0	
3-35	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	1	
3-36	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	2	
3-37	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	0	
3-38	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	1	
3-39	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	2	
3-40	Me	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	0	
3-41	Me	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	1	
3-42	Me	CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	2	
3-43	Me	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	0	
3-44	Me	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	1	
3-45	Me	C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	2	
3-46	Me	C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	0	
3-47	Me	C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	1	
3-48	Me	C <sub>3</sub> H <sub>6</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	2	
3-49	CF <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	0	
3-50	CF <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	1	
3-51	CF <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	2	

Tabla 4: Compuestos de fórmula I donde los sustituyentes tienen los siguientes significados:

R<sup>1</sup> es CN; R<sup>7</sup> y R<sup>8</sup> son Cl; R<sup>6</sup> y R<sup>2</sup> son ambos CF<sub>3</sub>; R<sup>3</sup> es Me; R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> están enlazados para formar junto con C de la unidad C=NO un anillo saturado de cuatro a siete miembros o un anillo insaturado de cinco a siete miembros.

Número compuesto	de	R <sup>4</sup> -R <sup>5</sup>	n	mp. °C, NMR (ppm)
4-01		C3H6	0	
4-02		C3H6	1	
4-03		C3H6	2	
4-04		C4H8	0	
4-05		C4H8	1	
4-06		C4H8	2	
4-07		C5H10	0	
4-08		C5H10	1	19F: -63,8; -72,4;
4-09		C5H10	2	
4-10		C6H12	0	
4-11		C6H12	1	
4-12		C6H12	2	
4-13		(1,2-C6H4)-C2H4	0	
4-14		(1,2-C6H4)-C2H4	1	19F: -64,3; -73,0;
4-15		(1,2-C6H4)-C2H4	2	
4-16		(1,2-C6H4)-C3H6	0	
4-17		(1,2-C6H4)-C3H6	1	
4-18		(1,2-C6H4)-C3H6	2	
4-19		CH2-(1,2-C6H4)-CH2	0	
4-20		CH2-(1,2-C6H4)-CH2	1	
4-21		CH2-(1,2-C6H4)-CH2	2	
4-22		CH2-(1,2-C6H4)-C2H4	0	
4-23		CH2-(1,2-C6H4)-C2H4	1	
4-24		CH2-(1,2-C6H4)-C2H4	2	
4-25		(1,2-C6H4)-O-C2H4	0	
4-26		(1,2-C6H4)-O-C2H4	1	
4-27		(1,2-C6H4)-O-C2H4	2	

Tabla 5: Compuestos de fórmula I donde los sustituyentes tienen los siguientes significados:

R <sup>1</sup> es CN; R <sup>7</sup> y R <sup>8</sup> son Cl; R <sup>6</sup> y R <sup>2</sup> son ambos CF <sub>3</sub> ; R <sup>3</sup> es H; R <sup>4</sup> y R <sup>5</sup> son ambos independientemente alquilo- (C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> ) no sustituido o sustituido				
Número de compuesto	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	n	mp.°C,NMR(ppm)
5-01	Me	Me	0	
5-02	Me	Me	1	
5-03	Me	Me	2	
5-04	Me	Et	0	
5-05	Me	Et	1	
5-06	Me	Et	2	
5-07	Me	n-Pr	0	
5-08	Me	n-Pr	1	
5-09	Me	n-Pr	2	
5-10	Me	i-Pr	0	
5-11	Me	i-Pr	1	
5-12	Me	i-Pr	2	
5-13	Me	n-Bu	0	
5-14	Me	n-Bu	1	
5-15	Me	n-Bu	2	
5-16	Me	secBu	0	
5-17	Me	secBu	1	
5-18	Me	secBu	2	
5-19	Me	i-Bu	0	
5-20	Me	i-Bu	1	
5-21	Me	i-Bu	2	
5-22	Me	t-Bu	0	
5-23	Me	t-Bu	1	
5-24	Me	t-Bu	2	
5-25	Me	n-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	0	
5-26	Me	n-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	1	
5-27	Me	n-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	2	
5-28	Me	n-C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	0	
5-29	Me	n-C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	1	
5-30	Me	n-C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	2	



5-31	Et	Et	0	
5-32	Et	Et	1	
5-33	Et	Et	2	
5-34	nPr	nPr	0	
5-35	nPr	nPr	1	
5-36	nPr	nPr	2	
5-37	nBu	nBu	0	
5-38	nBu	nBu	1	
5-39	nBu	nBu	2	
5-40	Me	CF3	0	
5-41	Me	CF3	1	
5-42	Me	CF3	2	
5-43	Et	CF3	0	
5-44	Et	CF3	1	
5-45	Et	CF3	2	

Tabla 6: Compuestos de fórmula I donde los sustituyentes tienen los siguientes significados:

R <sup>1</sup> es CN; R <sup>7</sup> y R <sup>8</sup> son Cl; R <sup>6</sup> y R <sup>2</sup> son ambos CF <sub>3</sub> ; R <sup>3</sup> es H; R <sup>4</sup> es alquilo -(C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> ) y R <sup>5</sup> es cicloalquilo-(C <sub>3</sub> -C <sub>7</sub> ) o cicloalquilo-(C <sub>3</sub> -C <sub>7</sub> )-alquilo-(C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> )				
Número de compuesto	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	n	mp. °C, NMR(ppm)
6-01	Me	cPr	0	
6-02	Me	cPr	1	
6-03	Me	cPr	2	
6-04	Me	cBu	0	
6-05	Me	cBu	1	
6-06	Me	cBu	2	
6-07	Me	cC <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	0	
6-08	Me	cC <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	1	
6-09	Me	cC <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	2	
6-10	Me	cC <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	0	
6-11	Me	cC <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	1	
6-12	Me	cC <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	2	
6-13	Me	cC <sub>7</sub> H <sub>13</sub>	0	
6-14	Me	cC <sub>7</sub> H <sub>13</sub>	1	
6-15	Me	cC <sub>7</sub> H <sub>13</sub>	2	

## ES 2 377 481 T3

6-16	Et	cPr	0	
6-17	Et	cPr	1	
6-18	Et	cPr	2	
6-19	Et	cBu	0	
6-20	Et	cBu	1	
6-21	Et	cBu	2	
6-22	Et	cC5H9	0	
6-23	Et	cC5H9	1	
6-24	Et	cC5H9	2	
6-25	Et	cC6H11	0	
6-26	Et	cC6H11	1	
6-27	Et	cC6H11	2	
6-28	Et	cC7H13	0	
6-29	Et	cC7H13	1	
6-30	Et	cC7H13	2	
6-31	Me	CH2cPr	0	
6-32	Me	CH2cPr	1	
6-33	Me	CH2cPr	2	
6-34	Me	CH2cBu	0	
6-35	Me	CH2cBu	1	
6-36	Me	CH2cBu	2	
6-37	Me	CH2cC5H9	0	
6-38	Me	CH2cC5H9	1	
6-39	Me	CH2cC5H9	2	
6-40	Me	CH2cC6H11	0	
6-41	Me	CH2cC6H11	1	
6-42	Me	CH2cC6H11	2	
6-43	Me	CH2cC7H13	0	
6-44	Me	CH2cC7H13	1	
6-45	Me	CH2cC7H13	2	
6-46	Me	C2H4cPr	0	
6-47	Me	C2H4cPr	1	
6-48	Me	C2H4cPr	2	
6-49	Me	C3H6cPr	0	
6-50	Me	C3H6cPr	1	

6-51	Me	C3H6cPr	2	
6-52	Me	C4H8cPr	0	
6-53	Me	C4H8cPr	1	
6-54	Me	C4H8cPr	2	

Tabla 7: Compuestos de fórmula I donde los sustituyentes tienen los siguientes significados:

R <sup>1</sup> es CN; R <sup>7</sup> y R <sup>8</sup> son Cl; R <sup>6</sup> y R <sup>2</sup> son ambos CF <sub>3</sub> ; R <sup>3</sup> es H; R <sup>4</sup> es alquilo-(C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> ) o R <sup>20</sup> y R <sup>5</sup> es R <sup>20</sup> o R <sup>21</sup> o alquilo-(C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> ) sustituido por R <sup>20</sup>				
Número de compuesto	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	n	mpo. °C, NMR(ppm)
7-01	Me	C6H5	0	
7-02	Me	C6H5	1	
7-03	Me	C6H5	2	
7-04	Et	C6H5	0	
7-05	Et	C6H5	1	
7-06	Et	C6H5	2	
7-07	nPr	C6H5	0	
7-08	nPr	C6H5	1	
7-09	nPr	C6H5	2	
7-10	nBu	C6H5	0	
7-11	nBu	C6H5	1	
7-12	nBu	C6H5	2	
7-13	Me	4-F-C6H4	0	
7-14	Me	4-F-C6H4	1	
7-15	Me	4-F-C6H4	2	
7-16	Me	4-Cl-C6H4	0	
7-17	Me	4-Cl-C6H4	1	
7-18	Me	4-Cl-C6H4	2	
7-19	Me.	4-Br-C6H4	0	
7-20	Me	4-Br-C6H4	1	
7-21	Me	4-Br-C6H4	2	
7-22	Me	4-MeO-C6H4	0	
7-23	Me	4-MeO-C6H4	1	
7-24	Me	4-MeO-C6H4	2	

7-25	Me	2-piridilo	0	
7-26	Me	2-piridilo	1	
7-27	Me	2-piridilo	2	
7-28	Me	3-piridilo	0	
7-29	Me	3-piridilo	1	
7-30	Me	3-piridilo	2	
7-31	Me	4-piridilo	0	
7-32	Me	4-piridilo	1	
7-33	Me	4-piridilo	2	
7-34	C6H5	C6H5	0	
7-35	C6H5	C6H5	1	
7-36	C6H5	C6H5	2	
7-37	4-Cl-C6H4	4-Cl-C6H4	0	
7-38	4-Cl-C6H4	4-Cl-C6H4	1	
7-39	4-Cl-C6H4	4-Cl-C6H4	2	
7-40	Me	CH2-C6H5	0	
7-41	Me	CH2-C6H5	1	
7-42	Me	CH2-C6H5	2	
7-43	Me	C2H4-C6H5	0	
7-44	Me	C2H4-C6H5	1	
7-45	Me	C2H4-C6H5	2	
7-46	Me	C3H6-C6H5	0	
7-47	Me	C3H6-C6H5	1	
7-48	Me	C3H6-C6H5	2	
7-49	CF3	C6H5	0	
7-50	CF3	C6H5	1	
7-51	CF3	C6H5	2	

Tabla 8: Compuestos de fórmula I donde los sustituyentes tienen los siguientes significados:

R <sup>1</sup> es CN; R <sup>7</sup> y R <sup>8</sup> son Cl; R <sup>6</sup> y R <sup>2</sup> son ambos CF <sub>3</sub> ; R <sup>3</sup> es H; R <sup>4</sup> y R <sup>5</sup> están unidos para formar juntos con el C de la unidad C=NO un anillo saturado con 4 a 7 miembros o un anillo no-saturado con 5 a 7 miembros			
Número de compuesto	R <sup>4</sup> -R <sup>5</sup>	n	mp.°C,NMR(ppm)
8-01	C3H6	0	
8-02	C3H6	1	
8-03	C3H6	2	
8-04	C4H8	0	

8-05	C4H8	1	
8-06	C4H8	2	
8-07	C5H10	0	
8-08	C5H10	1	
8-09	C5H10	2	
8-10	C6H12	0	
8-11	C6H12	1	
8-12	C6H12	2	
8-13	(1,2-C6H4)-C2H4	0	
8-14	(1,2-C6H4)-C2H4	1	
8-15	(1,2-C6H4)-C2H4	2	
8-16	(1,2-C6H4)-C3H6	0	
8-17	(1,2-C6H4)-C3H6	1	1
8-18	(1,2-C6H4)-C3H6	2	
8-19	CH2-(1,2-C6H4)-CH2	0	
8-20	CH2-(1,2-C6H4)-CH2	1	
8-21	CH2-(1,2-C6H4)-CH2	2	
8-22	CH2-(1,2-C6H4)-C2H4	0	
8-23	CH2-(1,2-C6H4)-C2H4	1	
8-24	CH2-(1,2-C6H4)-C2H4	2	
8-25	(1,2-C6H4)O-C2H4	0	
8-26	(1,2-C6H4)-O-C2H4	1	
8-27	(1,2-C6H4)-O-C2H4	2	

- [0083]** Según otra característica adicional de la presente invención se proporciona un procedimiento para el control de plagas en un lugar que comprende la aplicación en el lugar de una cantidad eficaz de un compuesto de fórmula I o de una de sus sales. Con esta finalidad, dicho compuesto se utiliza normalmente en la forma de compuesto 5 pesticida (es decir en asociación con diluyentes compatibles o transportadores y/o agentes tensoactivos adecuados para la utilización en composiciones pesticidas), por ejemplo tal como se describirá a continuación.

**[0084]** El término "compuesto de la invención" tal como se emplea a continuación abarca un aminopirazole carbamato sustituido en posición 5 de fórmula I tal como se ha definido arriba y o una de sus sales aceptables como pesticida.

- 10 [0085]** Un aspecto de la presente invención tal como se ha definido arriba es un procedimiento para el control de plagas en un lugar. El lugar incluye, por ejemplo, la propia plaga, el lugar (planta, campo, bosque, huerto, vía de agua, el suelo, producto de planta, o similares) donde la plaga reside o se alimenta, o un sitio susceptible de infestación futura por la plaga. Por lo tanto, el compuesto de la invención puede aplicarse directamente a la plaga, al lugar donde reside o se alimenta la plaga, o un lugar susceptible de una infestación futura por la plaga.
- 15 [0086]** Tal como es evidente a partir de los usos pesticidas anteriores, la presente invención proporciona compuestos activos como pesticidas y métodos de uso de dichos compuestos para el control de un conjunto de especies de plagas que incluyen: artrópodos, especialmente insectos o ácaros, o nemátodos de plantas. El compuesto de la presente invención se puede utilizar por tanto de manera ventajosa en usos prácticos, por ejemplo, en cultivos agrícolas u hortícolas, en silvicultura, en medicina veterinaria o en la cría de ganado o en la salud pública.

**[0087]** Los compuestos de la presente invención se pueden utilizar, por ejemplo, en las siguientes aplicaciones y en las siguientes plagas:

- Para el control de insectos de tierra, tales como el gusano de la raíz del maíz, termitas (especialmente para la protección de estructuras), gusanos de raíz, gusanos de alambre, gorgojos de raíz, barrenadores del tallo, gusanos cortadores, áfidos de la raíz o larvas. También se pueden utilizar para proporcionar una actividad contra nemátodos patogénicos de plantas, tales como nemátodos de los nódulos, quiste, daga, lesión o del tallo o el bulbo, o contra ácaros. Para el control de plagas de tierra, por ejemplo, el gusano de la raíz del maíz, los compuestos se aplican de manera ventajosa o se incorporan en una relación eficaz en la tierra en la que se plantan o se van a plantar los cultivos o a las semillas o raíces de las plantas en crecimiento.
- 5 En el área de la salud pública, los compuestos son especialmente útiles en el control de muchos insectos, especialmente moscas de la porquería u otras plagas de Díptera, tales como, moscas domésticas, moscas de los establos, moscas soldados, moscas del cuerno, moscas del venado, tábanos, mosquitos pequeños, "punkies", moscas prietas, o mosquitos.
- [0088]** En la protección de productos almacenados, por ejemplo, cereales, incluyendo grano o harina, cacahuets, alimento de animales, madera o utensilios domésticos, por ejemplo, alfombras y tejidos, los compuestos de la presente invención son útiles contra el ataque por artrópodos, más especialmente escarabajos, incluyendo, gorgojos, polillas o ácaros, por ejemplo *Ephestia* spp. (polillas de la harina), *Anthrenus* spp. (escarabajos de alfombra), *Tribolium* spp. (escarabajos de la harina), *Sitophilus* spp. (gorgojos de grano) o *Acarus* spp. (ácaros).
- 15 **[0089]** En el control de cucarachas, hormigas o termitas o plagas de artrópodos similares en instalaciones domésticas o industriales infestadas o en el control de larvas de mosquitos en canales, pozos, depósitos u otras fuentes de agua corriente o estancada.
- [0090]** Para el tratamiento de cimientos, estructuras o tierra en la prevención del ataque en la construcción por termitas, por ejemplo, *Reticulitermes* spp., *Heterotermes* spp., *Coptotermes* spp.
- 20 **[0091]** Además, se ha descubierto que los compuestos de la invención presentan una acción insecticida elevada contra insectos que destruyen materiales técnicos.
- 25 **[0092]** Como ejemplo y preferentemente – pero sin limitarse a estos – se dan los siguientes insectos:
- Escarabajos tales como *Hylotrupes bajulus*, *Clorophorus pilosis*, *Anobium punctatum*, *Xestobium rufovillosum*, *Ptilinus pecticornis*, *Dendrobium pertinex*, *Ernobius mollis*, *Priobium carpini*, *Lyctus brunneus*, *Lyctus africanus*, *Lyctus planicollis*, *Lyctus linearis*, *Lyctus pubescens*, *Trogoxilon aequale*, *Minthes rugicollis*, *Xyleborus spec.*
- 30 *Tryptodendron spec.* *Apate monachus*, *Bostrychus capucins*, *Heterobostrychus brunneus*, *Sinoxilon spec.* *Dinoderus minutus*;
- Hymenoptera tales como *Sirexjuvencus*, *Urocerus gigas*, *Urocerus gigas taignus*, *Urocerus augur*;
- Termitas tales como *Kaloterms flavicollis*, *Cryptotermes brevis*, *Heterotermes indicola*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes santanensis*, *Reticulitermes lucifugus*, *Mastotermes darwiniensis*, *Zootermopsis nevadensis*,
- 35 *Coptotermes formosanus*;
- Lepismas tales como el *Lepisma saccharina*.
- [0093]** En el contexto presente, se entiende que los materiales técnicos significan materiales no vivientes tales como preferentemente plásticos, adhesivos, pegamentos, papel y cartón, piel, madera, productos de fabricación de madera y pinturas.
- 40 **[0094]** Al mismo tiempo los compuestos de la invención se pueden emplear contra las incrustaciones, en especial cascotes de embarcaciones, pantallas, redes, edificios, muelles e instalaciones de señalización que están en contacto con el mar o aguas salobres.
- [0095]** Además, los compuestos de la invención se pueden emplear en combinación con otros compuestos activos como agentes anti-incrustaciones.
- 45 **[0096]** Los compuestos activos son adecuados para el control de plagas domésticas, para la protección de la higiene y el almacenamiento, especialmente insectos, arácnidos y ácaros que aparecen en espacios cerrados tales como apartamentos, entradas de fábricas, oficinas, cabinas de vehículos, etc. Pueden emplearse solos o en combinación con otros compuestos activos y auxiliares en productos insecticidas domésticos para el control de estas plagas. Son activos contra especies sensibles y resistentes y en todas las fases de desarrollo. Estas plagas incluyen:
- 50 El orden de los Scorpionidea por ejemplo *Buthus occitanus*.

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

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

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

El orden de los Isopoda por ejemplo *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*.

El orden de los Diplopoda por ejemplo. *Blaniulus guttulatus*, *Polydesmus* spp..

El orden de los Chilopoda por ejemplo *Geophilus* spp..

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

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

El orden de los Saltatoria por ejemplo *Acheta domesticus*.

- 15 El orden de los Dermaptera por ejemplo *Forficula auricularia*.

El orden de los Isoptera por ejemplo *Kaloterms* spp., *Reticuliterms* spp.

El orden de los Psocoptera por ejemplo *Lepinatus* spp., *Liposcelis* spp.,

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

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

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

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

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

El orden de los Anoplura por ejemplo *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pemphigus* spp., *Phylloera vastatrix*, *ftirus pubis*.

El orden de los Heteroptera por ejemplo *Cimex hemipterus*, *Cimex lectularius*, *Rhodinus prolixus*, *Triatoma infestans*.

- 35 La utilización en el sector insecticida doméstico se lleva a cabo solo o en combinación con otros compuestos activos adecuados tales como los fosfatos, los carbamatos los piretroides, neonicotinoideos, reguladores del crecimiento o compuestos activos de otras clases de insecticidas.

**[0097]** La utilización se lleva a cabo con aerosoles, agentes de rociado no presurizados, por ejemplo aerosoles por bomba o espolvoreado, nebulizadores, perlizadores, de espuma, geles, productos de evaporación con plaquetas de evaporación de celulosa o de plástico, evaporadores líquidos, evaporadores de gel y membrana, evaporadores accionados por impulsor, sistemas de evaporación sin energía o pasivos, papeles matamoscas, trampas de la mosca, geles para moscas, como granulados o en polvo, en cebos dispersados o agrupados.

- 40 **[0098]** En la agricultura contra adultos, larvas y huevos de lepidópteros (mariposas y polillas), por ejemplo, *Heliothis* spp. tal como *Heliothis virescens* (gusano cogollero), *Heliothis armigera* y *Heliothis zea*. Contra adultos y larvas de coleópteros (escarabajos), por ejemplo, *Anthonomus* spp., por ejemplo, *grandis* (gorgojo del tallo del algodón), *Leptinotarsa decemlineata* (escarabajo de la patata de Colorado), *Diabrotica* spp. (gusanos de la raíz del maíz). Contra heterópteros (Hemiptera y Homoptera), por ejemplo, *Psylla* spp., *Bemisia* spp., *Trialeurodes* spp., *Aphis* spp., *Myzus* spp., *Megoura viciae*, *Phylloxera* spp., *Nephotettix* spp. (saltamontes de las hojas de arroz), *Nilaparvata* spp.
- 45

**[0099]** Contra dípteros, por ejemplo, *Musca* spp. Contra Thysanoptera, tales como *Thrips tabaci*. Contra Orthoptera, tales como *Locusta* y *Schistocerca* spp., (langostas y grillos), por ejemplo *Gryllus* spp., y *Acheta* spp., por ejemplo, *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Blatella germanica*, *Locusta migratoria migratorioides*, y *Schistocerca gregaria*. Contra Collembola, por ejemplo, *Periplaneta* spp. y *Blatella* spp. (cucarachas).

- 5 **[0100]** Contra artrópodos de importancia agrícola, tales como Acari (ácaros), por ejemplo, *Tetranychus* spp., y *Panonychus* spp.,

**[0101]** Contra nemátodos que atacan plantas o árboles de importancia para la agricultura, silvicultura, u horticultura de forma directa o mediante la expansión de enfermedades bacterianas, virales, por micoplasma o fúngicas de las plantas. Por ejemplo, los nemátodos de nódulos, tales como *Meloidogyne* spp. (por ejemplo, *M. incognita*).

- 10 **[0102]** En el campo de la medicina veterinaria o la cría de ganado o en el mantenimiento de la salud pública contra artrópodos que son parasitarios de forma interna o externa sobre los vertebrados, particularmente vertebrados de sangre caliente, por ejemplo, animales domésticos, por ejemplo, ternera, oveja, cabra, equinos, cerdos, aves de corral, perros o gatos, por ejemplo Acarina, incluyendo garrapatas (por ejemplo, garrapatas de cuerpo blando, incluyendo *Argasidae* spp., por ejemplo, *Argas* spp. y *Ornithodoros* spp. (por ejemplo, *Ornithodoros moubata*); garrapatas de cuerpo duro, incluyendo *Ixodidae* spp., por ejemplo, *Boophilus* spp., por ejemplo, *Boophilus microplus*, *Rhipicephalus* spp., por ejemplo, *Rhipicephalus appendiculatus* y *Rhipicephalus sanguineus*; ácaros (por ejemplo, *Damalinia* spp.); pulgas (por ejemplo, *Ctenocephaluros* spp., por ejemplo, *Ctenocephaluros felis* (pulga del gato) y *Ctenocephaluros canis* (pulga del perro)); piojos, por ejemplo, *Menopon* spp.; Díptera (por ejemplo, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Musca* spp., *Hypoderma* spp.); Hemiptera.; Dictyoptera (por ejemplo, *Periplaneta* spp., *Blatella* spp.); Hymenoptera; por ejemplo, contra infecciones del tracto gastrointestinal causadas por gusanos nemátodos parasitarios, por ejemplo, miembros de la familia *Trichostrongylidae*.

**[0103]** En un aspecto preferido de la presente invención, los compuestos de fórmula I se utilizan para el control de parásitos de animales. Preferiblemente, el animal a tratar es un animal de compañía doméstico, tal como un perro o un gato.

- 25 **[0104]** Los parásitos a controlar incluyen por ejemplo: El orden de los Anoplurida por ejemplo *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phtirus* spp., *Solenopotes* spp. El orden de los Mallophagida y los subórdenes *Amblycerina* y *Ischnocera* por ejemplo *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Damalina* spp., *Trichodectes* spp., *Felicola* spp. El orden de los Díptera y los subórdenes *Nematocera* y *Brachycera* 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., *Hidrotaea* spp., *Stomoxis* 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. El orden de los Siphonaptera por ejemplo *Pulex* spp., *Ctenocephalides* spp., *Xenopsylla* spp., *Ceratophyllus* spp. El orden de los Heteroptera por ejemplo *Cimex* spp., *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongylus* spp. El orden de los Blattaria por ejemplo *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Blattella germanica*, *Supella* spp. La subclase Acari (Acarina) y el orden de los Meta- y Mesostigmata por ejemplo *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Otobius* spp., *Ixodes* spp., *Amblyomma* spp., *Boophilus* spp., *Dermacentor* spp., *Haemophysalis* spp., *Hyalomma* spp., *Rhipicephalus* spp., *Dermanyssus* spp., *Raillietia* spp., *Pneumonyssus* spp., *Sternostoma* spp., *Varroa* spp. El orden de los Actiniedida (Prostigmata) y Acaridida (Astigmata) por ejemplo *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp., *Ornithocheyletia* spp., *Myobia* spp., *Psorergates* spp., *Demodex* spp., *Trombicula* spp., *Listrophorus* spp., *Acarus* spp., *Tyrophagus* spp., *Caloglyphus* spp., *Hypodectes* spp., *Pterolichus* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Otodectes* spp., *Sarcoptes* spp., *Notoedres* spp., *Knemidocoptes* spp., *Cytodites* spp., *Laminosioptes* spp.

- 45 **[0105]** Los compuestos de la invención se estructura (I) también son adecuados para el control de artrópodos que afectan a animales para la agricultura tales como ganado vacuno, ovejas, cabras, caballos, cerdos, burros, camellos, búfalos, conejos, gallinas, pavos, patos, gansos, abejas y otros animales domésticos tales como perros, gatos, pájaros, peces de acuario, así como los llamados animales de experimentación tales como hámsters, cobayas, ratas y ratones. Mediante el control de estos artrópodos se reducirán las tasas mortales y las pérdidas de prestaciones (en carne, leche, lana, pieles, huevos, miel, etc.) de modo que es posible una ganadería más económica y simple  
50 mediante los compuestos de la invención.

- [0106]** La utilización de los compuestos activos en el sector veterinario y la ganadería se realiza con medios conocidos por la administración entérica en forma de, por ejemplo, comprimidos, cápsulas, bebidas, pociones, granulados, pastas, bolos, a través de alimentación, supositorios, por administración parenteral, por ejemplo, mediante la inyección (intramuscular, subcutánea, intravenosa, intraperitoneal, entre otros), implantes, mediante la  
55 aplicación nasal, mediante la administración tópica, en forma de, por ejemplo, inmersión, pulverización, vertido, lavado, trituración y con ayuda de aparatos que contienen el compuesto activo, tales como collares, marcadores de oreja, marcadores de cola, bandas de extremidades, cabestros, dispositivos marcadores, etc

**[0107]** Durante el uso en el ganado bovino, aves de corral, animales domésticos, etc, los compuestos activos de la estructura (I) se pueden utilizar como formulaciones (por ejemplo, polvo, emulsiones, agentes fluidos) que contienen



a los compuestos activos en una cantidad de 1 a 80 % en peso, directamente o después de diluir de 100 a 10.000 veces en dilución o como baño químico.

**[0108]** Según otro aspecto de la invención los compuestos de fórmula (I) o sales o composiciones de los mismos se utilizan para la preparación de un medicamento veterinario.

- 5 **[0109]** Por lo tanto, otra característica de la invención se refiere a la utilización de un compuesto de fórmula I o una sal del mismo, o de una composición del mismo, para el control de plagas.

**[0110]** Las plagas mencionadas más arriba incluyen por ejemplo: el orden de los Anoplura (Phthiraptera) por ejemplo *Damalinea* spp., *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Trichodectes* spp.

- 10 **[0111]** La clase de arácnidos por ejemplo *Acarus siro*, *Aceria sheldoni*, *Aculops* spp., *Aculus* spp., *Amblyomma* spp., *Argas* spp., *Boophilus* spp., *Brevipalpus* spp., *Bryobia praetiosa*, *Chorioptes* spp., *Derma nyssus gallinae*, *Eotetranychus* spp., *Epitimerus piri*, *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*.

- 15 **[0112]** La clase de los bivalvos por ejemplo *Dreissena* spp.

**[0113]** El orden de los Chilopoda por ejemplo *Geophilus* spp., *Scutigera* spp.

- [0114]** El orden de los Coleoptera por ejemplo *Acanthoscelides obtectus*, *Adoretus* spp., *Agelastica alni*, *Agriotes* spp., *Amphimallon solstitialis*, *Anobium punctatum*, *Anoplophora* spp., *Anthonomus* spp., *Anthrenus* spp., *Apogonia* spp., *Atomaria* spp., *Attagenus* spp., *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp., *Ceuthorrhynchus* spp., *Cleonus mendicus*,  
20 *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*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lixus* spp., *Lyctus* spp., *Meligethes aeneus*, *Melolontha melolontha*, *Migdolus* spp., *Monochamus* spp., *Naupactus xanthographus*, *Niptus hololeucus*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus surinamensis*,  
25 *Otiorrhynchus sulcatus*, *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllophaga* spp., *Popillia japonica*, *Premnotrypes* spp., *Psylliodes chrysocephala*, *Ptinus* spp., *Rhizobius ventralis*, *Rhizopertha dominica*; *Sitophilus* spp., *Sfenophorus* spp., *Sternechus* spp., *Symphyletes* spp., *Tenebrio molitor*, *Tribolium* spp., *Trogoderma* spp., *Tychius* spp., *Xylotrechus* spp., *Zabrus* spp.

**[0115]** El orden de los Collembola por ejemplo *Onychiurus armatus*.

- 30 **[0116]** El orden de los Dermaptera por ejemplo *Forficula auricularia*.

**[0117]** El orden de los Diplopoda por ejemplo *Bianiulus guttulatus*.

- [0118]** El orden de los Diptera por ejemplo *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Bibio hortulanus*, *Calliphora erythrocephala*, *Ceratitis capitata*, *Chrysomyia* spp., *Cochliomyia* spp., *Cordylobia anthropophaga*, *Culex* spp., *Cuterebra* spp., *Dacus oleae*, *Dermatobia hominis*, *Drosophila* spp., *Fannia* spp., *Gastrophilus* spp., *Hylemyia* spp., *Hyppobosca* spp.,  
35 *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.

**[0119]** La clase de los gastrópodos por ejemplo *Arion* spp., *Biomphalaria* spp., *Bulinus* spp., *Deroceras* spp., *Galba* spp., *Lymnaea* spp., *Oncomelania* spp., *Succinea* spp.

- [0120]** La clase de los helmintos por ejemplo *Ancylostoma duodenale*, *Ancylostoma ceylanicum*, *Acylostoma braziliensis*, *Ancylostoma* spp., *Ascaris lubricoides*, *Ascaris* spp., *Brugia malayi*, *Brugia timori*, *Bunostomum* spp., *Chabertia* spp., *Clonorchis* spp., *Cooperia* spp., *Dicrocoelium* spp., *Dictyocaulus filaria*, *Diphyllobothrium latum*, *Dracunculus medinensis*, *Echinococcus granulosus*, *Echinococcus multilocularis*, *Enterobius vermicularis*, *Faciola* spp., *Haemonchus* spp., *Heterakis* spp., *Hymenolepis nana*, *Hyostrongylus* spp., *Loa Loa*, *Nematodirus* spp., *Oesophagostomum* spp., *Opisthorchis* spp., *Onchocerca volvulus*, *Ostertagia* spp., *Paragonimus* spp., *Schistosoma* spp., *Strongyloides fuelleborni*, *Strongyloides stercoralis*, *Strongyloides* spp., *Taenia saginata*, *Taenia solium*, *Trichinella spiralis*, *Trichinella nativa*, *Trichinella britovi*, *Trichinella nelsoni*, *Trichinella pseudospiralis*, *Trichostrongylus* spp., *Trichuris trichuria*, *Wuchereria bancrofti*.

**[0121]** Además, se pueden controlar protozoos tales como los *Eimeria*.

- [0122]** El orden de los Heterópteros por ejemplo *Anasa tristis*, *Antestiopsis* spp., *Blissus* spp., *Calocoris* spp.,  
50 *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 persea*, *Rhodnius* spp., *Sahlbergella singularis*, *Scotinophora* spp., *Stephanitis nashi*, *Tibraca* spp., *Triatoma* spp.

- [0123]** El orden de los homópteros por ejemplo *Acyrtosiphon* spp., *Aeneolamia* spp., *Agonoseena*-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*, *Carnecephala fulgida*,  
5 *Ceratovacuna lanigera*, *Cercopidae*, *Ceroplastes* spp., *Chaetosiphon fragaefolii*, *Chionaspis tegalensis*, *Chlorita onukii*, *Chromaphis juglandicola*, *Chrysomphalus ficus*, *Cicadulina mbila*, *Coccoomytilus 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*, *Melanafis sacchari*, *Metcalfiella* spp., *Metopolophium dirhodum*, *Monellia costalis*, *Monelliopsis pecans*, *Myzus* spp., *Nasonovia ribisnigri*, *Nephotettix* spp., *Nilaparvata lugens*, *Oncometopia* spp., *Orthezia praelonga*, *Parabemisia myricae*, *Paratrioza* spp., *Parlatoria* spp., *Pemphigus* spp., *Peregrinus maidis*, *Fenacoccus* spp., *Phloeomyzus passerinii*, *Phorodon humuli*, *Phylloxera* spp., *Pinnaspis aspidistrae*, *Planococcus* spp., *Protospulvinaria piriformis*,  
10 *Pseudaulacaspis pentagona*, *Pseudococcus* spp., *Psylla* spp., *Pteromalus* spp., *Pirilla* spp., *Quadraspidiotus* 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*, *Trioza* spp., *Typhlocyba* spp., *Unaspis* spp., *Viteus vitifolii*.
- [0124]** El orden de los himenópteros por ejemplo *Diprion* spp., *Hoplocampa* spp., *Lasius* spp., *Monomorium pharaonis*, *Vespa* spp.
- [0125]** El orden de los isopodos por ejemplo *Armadillidium vulgare*, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*.
- [0126]** El orden de los isópteros por ejemplo *Reticulitermes* spp., *Odontotermes* spp..
- [0127]** El orden de los lepidópteros por ejemplo *Acronicta major*, *Aedia leucomelas*, *Agrotis* spp., *Alabama argillacea*,  
25 *Anticarsia* spp., *Barathra brassicae*, *Bucculatrix thurberiella*, *Bupalus piniarius*, *Cacoecia podana*, *Capua reticulana*, *Carpocapsa pomonella*, *Cheimatobia brumata*, *Chilo* spp., *Choristoneura fumiferana*, *Clysia ambiguella*, *Cnafalocerus* spp., *Earias insulana*, *Ephestia kuehniella*, *Euproctis chrysoorrhoea*, *Euxoa* spp., *Feltia* spp., *Galleria mellonella*, *Helicoverpa* spp., *Heliothis* spp., *Hofmannophila pseudospretella*, *Homona magnanima*, *Hyponomeuta padella*, *Laphygma* spp., *Lithocolletis blancardella*, *Lithophane antennata*, *Loxagrotis albicosta*, *Lymantria* spp.,  
30 *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*, *Piraustra nubilalis*, *Spodoptera* spp., *Thermesia gemmatalis*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*, *Torbrax viridana*, *Trichoplusia* spp.
- [0128]** El orden de los ortópteros por ejemplo *Acheta domesticus*, *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Gryllotalpa* spp., *Leucophaea maderae*, *Locusta* spp., *Melanoplus* spp., *Periplaneta americana*, *Schistocerca gregaria*.
- [0129]** El orden de los sifonápteros por ejemplo *Ceratophyllus* spp., *Xenopsylla cheopis*.
- [0130]** El orden de los symphyla por ejemplo *Scutigera* spp.
- [0131]** El orden de los tisanópteros por ejemplo *Baliothrips biformis*, *Enneothrips flavens*, *Frankliniella* spp., *Heliethrips* spp., *Hercinothrips femoralis*, *Kakothrips* spp., *Rhipiphorothrips cruentatus*, *Scirtothrips* spp., *Taeniothrips* spp.,  
40 *cardamoni*, *Thrips* spp.
- [0132]** El orden de los tisanura por ejemplo *Lepisma saccharina*.
- [0133]** Los nematodos parasitarios de planta incluyen, por ejemplo, *Anguina* spp., *Aphelenchoides* spp., *Belonoaimus* spp., *Bursaphelenchus* spp., *Ditylenchus dipsaci*, *Globodera* spp., *Heliocotylenchus* spp., *Heterodera* spp., *Longidorus* spp., *Meloidogyne* spp., *Pratylenchus* spp., *Radopholus similis*, *Rotylenchus* spp., *Trichodorus* spp.,  
45 *Tylenchorhynchus* spp., *Tylenchulus* spp., *Tylenchulus semipenetrans*, *Xiphinema* spp.
- [0134]** Los compuestos de estructura (I) de la invención se caracterizan especialmente por una acción fuerte contra áfidos (por ejemplo *Aphis gossypii* y *Myzus persicae*), larvas de escarabajo (por ejemplo *Phaedon cochleariae*), orugas de mariposa (por ejemplo *Plutella xylostella*, *Spodoptera exigua* y *Spodoptera frugiperda*).
- [0135]** Opcionalmente los compuestos de la invención también se pueden utilizar en determinadas concentraciones o cantidades de aplicación como herbicidas, protectores, reguladores de crecimiento, o como agentes de mejora de propiedades de plantas, o como microbicidas, por ejemplo como fungicidas, antimicóticos, bactericidas, viricidas (incluyendo agentes contra los viroides) o como agentes contra MLO (siglas de la expresión anclosajona correspondiente a organismos similares al Micoplasma) y RLO (organismos similares a la Rickettsia). También se pueden utilizar opcionalmente como productos intermedios o precursores para la síntesis de otros compuestos  
50 activos.

**[0136]** Según la invención, se pueden tratar todas las plantas y partes de plantas. Se entiende aquí por plantas todas las plantas y poblaciones de plantas tanto deseables como no deseables silvestres o cultígenos (incluyendo los cultígenos naturales). Los cultígenos pueden ser plantas que se pueden obtener por procedimientos convencionales de mejora y optimización o mediante procedimientos de ingeniería biotecnológica o genética o combinaciones de estos procedimientos, incluyendo las plantas transgénicas y las variedades de plantas protegidas o no por derechos de protección de variedades vegetales. Por partes de plantas se entienden las que están tanto por encima como por debajo del nivel del suelo y los órganos de las plantas tales como tallo, hoja, flor y raíz, incluyendo, por ejemplo, hojas, agujas, tallos, flores, partes en fructificación, frutas y semillas así como las raíces, bulbos, rizomas. La cosecha de cultivos, así como el material de reproducción vegetativa y generativa, por ejemplo esquejes, bulbos, rizomas, tallos y semillas también son partes de la planta.

**[0137]** En el uso práctico para el control de artrópodos, especialmente, insectos o ácaros, o helmintos, especialmente plagas de nemátodos de plantas, un método, por ejemplo, comprende aplicar a las plantas o al medio en el que crecen una cantidad eficaz de un compuesto de la presente invención. Para dicho método, el compuesto de la presente invención se aplica generalmente al foco en el que va a controlarse la infestación por artrópodos o nemátodos en una relación eficaz en el intervalo de aproximadamente 2 g a aproximadamente 1 kg del compuesto activo por hectárea del foco tratado. En condiciones ideales, dependiendo de la plaga a controlar, una relación inferior puede ofrecer una protección adecuada. Por otro lado, las condiciones climáticas adversas, la resistencia de la plaga u otros factores pueden requerir que el principio activo se utilice en relaciones más elevadas. La relación óptima depende normalmente de una serie de factores, por ejemplo, el tipo de plaga que se controla, el tipo o la etapa de crecimiento de la planta infestada, el espacio entre las hileras o también el método de aplicación. Preferiblemente, un intervalo de relación eficaz del compuesto activo es de aproximadamente 10 g/ha a aproximadamente 400 g/ha, más preferiblemente de aproximadamente 50 g/ha a aproximadamente 200 g/ha.

**[0138]** Cuando una plaga se encuentra en la tierra, el compuesto activo generalmente en una composición formulada, se distribuye uniformemente sobre el área a tratar (es decir, por ejemplo, tratamiento por difusión o bandas) de cualquier manera práctica y se aplica en relaciones de aproximadamente 10 g/ha a aproximadamente 400 g ai/ha, preferiblemente de aproximadamente 50 g/ha a aproximadamente 200 g ai/ha. Cuando se aplica por inmersión de la raíz a plántulas o irrigación discontinua a plantas, la solución líquida o suspensión contiene de aproximadamente 0,075 a aproximadamente 1000 mg ai/l, preferiblemente de aproximadamente 25 a aproximadamente 200 mg ai/l. La aplicación se puede realizar, si se desea, al campo o el área de crecimiento del cultivo generalmente o próxima a la semilla o planta a proteger del ataque.

**[0139]** El compuesto de la presente invención se puede lavar en la tierra mediante la pulverización con agua sobre el área o se puede dejar a la acción natural de la lluvia.

**[0140]** Durante o después de la aplicación, el compuesto formulado, si se desea, se puede distribuir mecánicamente en la tierra, por ejemplo mediante arado, disqueo o el uso de cadenas de arrastre. La aplicación puede ser anterior a la plantación, en la plantación o después de la plantación, pero antes o después de que haya brotado.

**[0141]** El compuesto de la presente invención y los métodos del control de plagas con el mismo son particularmente valiosos en la protección del campo, forraje, plantaciones, invernaderos, huertos o cultivos de viñas, de plantas ornamentales, árboles de plantación o forestales, por ejemplo: cereales (tales como, trigo o arroz), algodón, hortalizas (tales como, pimientos), cosechas del campo (tales como, remolacha azucarera, soja o colza oleaginosa), cosechas de pradera o forraje (tales como, maíz o sorgo), huertas o arboledas (tales como, de fruto de hueso o pepita o cítricos), plantas ornamentales, flores u hortalizas o matas en invernaderos o en jardines o parques, o árboles forestales (tanto de hoja caduca como perenne) en bosques, plantaciones o viveros.

**[0142]** También son valiosos en la protección de madera (en pie, caída, convertida, almacenada o estructural) del ataque, por ejemplo, por moscas de sierra o escarabajos o termitas.

**[0143]** Presentan aplicaciones en la protección de productos almacenados, tales como granos, frutas, frutos secos, especies o tabaco, tanto de forma completa, molidos o compuestos en productos, del ataque de polillas, escarabajos, ácaros o gorgojos de grano. También se protegen los productos de animales almacenados, tales como pieles, pelo, lana o plumas de forma natural o convertida (por ejemplo, como alfombras o tejidos) del ataque de polillas o escarabajos, así como carne, pescado o granos almacenados del ataque de escarabajos, ácaros o moscas.

**[0144]** Adicionalmente, el compuesto de la presente invención y los métodos de uso del mismo son particularmente valiosos en el control de artrópodos o helmintos que son perjudiciales, o se extienden o actúan como vectores de enfermedades de animales domésticos, por ejemplo, los mencionados anteriormente, y más especialmente en el control de pulgas, ácaros, piojos, pulgas, mosquitos pequeños o moscas por mordedura, molestia o con miiasis. Los compuestos de la presente invención son particularmente útiles en el control de artrópodos o helmintos que están presentes en animales huésped domésticos o que se alimentan de la piel o sobre la misma o chupan la sangre del animal, para cuyo objetivo se pueden administrar de manera oral, parenteral, percutánea o tópica.

**[0145]** Las composiciones descritas a continuación para la aplicación en cultivos en crecimiento o focos en crecimiento de cultivos o como la preparación de la semilla se pueden utilizar, en general, alternativamente, en la protección de productos almacenados, utensilios domésticos, propiedades o áreas del medio general. Los medios adecuados de aplicación de los compuestos de la presente invención incluyen:

- 5 a cultivos en crecimiento como pulverizadores foliares (por ejemplo, como un pulverizador en surcos), polvos, gránulos, vapores o espumas o también como suspensiones de composiciones finamente divididas o encapsuladas; como tratamientos de la tierra o la raíz mediante empapamiento líquido, polvos, gránulos, humos o espumas; a semillas de cultivos mediante la aplicación como preparación de semillas, por ejemplo, mediante emulsiones líquidas o polvos;
- 10 a animales infestados o expuestos a la infestación por artrópodos o helmintos, mediante la aplicación oral o tópica de composiciones en las que el principio activo muestra una acción inmediata y/o prolongada durante un periodo de tiempo contra los artrópodos o helmintos, por ejemplo, mediante la incorporación en el alimento o formulaciones farmacéuticas adecuadas ingeribles por vía oral, cebos comestibles, depósitos de sales, suplementos dietético, formulaciones de aplicación, pulverizadores, baños, por inmersión, duchas, chorros, polvos, grasas, champús,
- 15 cremas, embadurnes con cera o sistemas de autotratamiento del ganado;

al medio en general o a localizaciones específicas donde las plagas merodean, incluyendo productos almacenados, madera, utensilios domésticos, o instalaciones domésticas o industriales, como pulverizadores, vapores, polvos, humos, embadurnes de cera, lacas, gránulos o cebos, o en una alimentación por goteo a canales, pozos, depósitos u otras fuentes de agua corriente o estancada.

- 20 **[0146]** Los compuestos de fórmula I son particularmente útiles para el control de parásitos de animales cuando se aplican oralmente, y en un aspecto más preferido de la presente invención los compuestos de fórmula I se utilizan para el control de parásitos de animales mediante aplicación oral. Los compuestos de la fórmula I o sales de los mismos se pueden administrar antes, durante o después de las comidas. Los compuestos de la fórmula I o sales de los mismos se pueden mezclar con un portador y/o alimentos.

- 25 **[0147]** El compuesto de la fórmula I o la sal del mismo se administran de forma oral en una dosis al animal en un intervalo de dosis generalmente de 0,1 a 500 mg/kg del compuesto de la fórmula I o sal del mismo por kilogramo de peso corporal animal (mg/kg).

**[0148]** La frecuencia del tratamiento al animal, preferiblemente el animal doméstico a tratar por el compuesto de la fórmula I o sal del mismo es generalmente de aproximadamente una vez por semana a aproximadamente una vez al año, preferiblemente de aproximadamente una vez cada dos semanas a una vez cada tres meses.

- 30 Se gún otro aspecto preferido de la invención los compuestos de fórmula I se utilizan para proporcionar un largo periodo de control efectivo de parásitos de animales tras una aplicación oral única.

**[0149]** Los compuestos de la presente invención se pueden administrar de manera más ventajosa con otro material eficaz como parasiticida, tal como un endoparasiticida, y/o un ectoparasiticida, y/o un endectoparasiticida. Por ejemplo, dichos compuestos incluyen lactonas macrocíclicas, tales como avermectinas o milbemicinas, por ejemplo, ivermectina, piratel o un regulador del crecimiento en insectos, tal como lufenuron o metopreno.

- 35 **[0150]** Los compuestos de la fórmula I también se pueden utilizar para controlar organismos dañinos en cultivos de plantas conocidas modificadas genéticamente o plantas modificadas genéticamente aún por desarrollar. Como regla, las plantas transgénicas se diferencian por propiedades especialmente ventajosas, por ejemplo por la resistencia a agentes de protección de cultivos particulares, resistencia a enfermedades en plantas o patógenos de enfermedades en plantas, tales como, insectos particulares o microorganismos, tales como hongos, bacterias o virus. Otras propiedades particulares se refieren, por ejemplo, al material cosechado con respecto a la cantidad, calidad, propiedades de almacenamiento, composición y componentes específicos. De este modo, se identifican plantas transgénicas cuando se aumenta el contenido de almidón, o se altera la calidad del almidón, o cuando el material cosechado tiene una composición de ácidos grasos diferente.
- 40
- 45

**[0151]** Todas las plantas que han recibido mediante ingeniería de modificación genética material genético que confiere propiedades valiosas especialmente ventajosas ("rasgos") a estas plantas pertenecen a las plantas o variedades de plantas transgénicas (obtenidas por ingeniería genética) que deben ser preferentemente tratadas según la invención. Algunos ejemplos de estas propiedades son el crecimiento mejorado de las plantas, una mayor tolerancia hacia las altas o bajas temperaturas, una mayor tolerancia a la sequía o al contenido de sal en agua o en suelo, mejora del rendimiento de floración, cosecha simplificada, maduración acelerada, aumento de los rendimientos de cosecha, mejora de la calidad y / o el valor nutricional de la cosecha, mejor vida de almacenamiento y / o de procesado de los cultivos. Otros y especialmente destacados ejemplos de estas propiedades son una mayor resistencia de las plantas a plagas de animales y microbios, tales como insectos, ácaros, hongos patógenos de

- 50 planta, bacterias y / o virus, así como una mayor tolerancia de las plantas a ciertos herbicidas. Ejemplos de tales plantas transgénicas son los cultígenos importantes tales como los cereales (trigo, arroz), maíz, soja, patata, remolacha azucarera, tomate, guisantes, y otras variedades vegetales, algodón, tabaco, colza, así como plantas frutales (incluyendo las frutas tales como la manzana, pera, cítricos y uvas), de los cuales se destacan el maíz, soja,
- 55

- patata, algodón, tabaco y colza. Las propiedades ("rasgos") especialmente destacados son el aumento de la tolerancia de las plantas a los insectos, arácnidos, nematodos, gasterópodos mediante las toxinas que se forman en las plantas, especialmente aquellas que se producen en las plantas (en adelante conocidas como "plantas Bt") mediante el material genético del *Bacillus thuringiensis* (por ejemplo de los genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb y CryIF así como sus combinaciones).
- 5 especialmente las propiedades ("rasgos") tales como la resistencia aumentada de las plantas a los hongos, las bacterias y los virus mediante resistencia adquirida sistemáticamente (SAR), sistemina, fitoalexina, provocadores y genes de resistencia y las proteínas y toxinas expresadas correspondientemente. También se destacan especialmente las propiedades ("rasgos") tales como la resistencia aumentada de las plantas a determinados
- 10 compuestos herbicidas activos, por ejemplo imidazolinonas, sulfenilureas, glifosato o fosfotricina (por ejemplo gen "PAT"). Los genes respectivos que confieren las propiedades deseadas ("rasgos") también pueden darse en las plantas transgénicas combinadas entre sí. Ejemplos de estas " plantas Bt " son variedades de maíz, variedades de algodón, variedades de soja y variedades de patata que se comercializan bajo las marcas YIELD GARD® (por ejemplo maíz, algodón, soja), KnockOut® (por ejemplo maíz), StarLink® (por ejemplo maíz), Bollgard® (algodón),
- 15 Nucotn® (algodón) y NewLeaf® (patata). Ejemplos de plantas tolerantes a los herbicidas son variedades de maíz, variedades de algodón, y variedades de soja que se comercializan bajo las marcas Roundup Ready® (tolerancia hacia el glifosato, por ejemplo maíz, algodón, soja), Liberty Link® (tolerancia hacia la fosfotricina, por ejemplo colza), IMI® (tolerancia hacia las imidazolinonas) y STS® (tolerancia hacia las ureas de sulfonilo, por ejemplo maíz). También se mencionan como resistentes a los herbicidas (criadas convencionalmente por su tolerancia a los
- 20 herbicidas) plants comercializadas bajo las marcas Clearfield® (por ejemplo maíz). Obviamente, todo esto se aplica también a variedades de plantas que se desarrollarán o comercializarán en el futuro con estas propiedades genéticas ("rasgos").

- [0152]** Se prefiere el uso en cultivos transgénicos económicamente importantes de plantas útiles y ornamentales, por ejemplo, de cereales, tales como, trigo, cebada, centeno, copos de avena, mijo, arroz, yuca y maíz u otros
- 25 cultivos de remolacha azucarera, algodón, soja, colza oleaginosa, patatas, tomates, guisantes y otro tipo de hortalizas.

- [0153]** Cuando se utilizan en cultivos transgénicos, en particular aquellos que presentan resistencia a insectos, se observan frecuentemente efectos, además de los efectos contra organismos dañinos a observar en otros cultivos, que son específicos para la aplicación en el cultivo transgénico en cuestión, por ejemplo, un espectro alterado o
- 30 específicamente ampliado de plagas que se pueden controlar, o se pueden utilizar relaciones de aplicación alteradas para la aplicación.

**[0154]** Por tanto, la presente invención también se refiere al uso de compuestos de la fórmula I para el control de organismos dañinos en plantas de cultivos transgénicos.

- [0155]** Según una característica adicional de la presente invención, se proporciona una composición pesticida que comprende uno o más compuestos de la presente invención, tal como se han definido anteriormente, en asociación con, y preferiblemente dispersados homogéneamente en uno o más diluyentes o portadores y/o agentes
- 35 tensoactivos compatibles aceptables como pesticidas [es decir, diluyentes o portadores y/o agentes tensoactivos del tipo generalmente aceptado en la técnica como adecuados para el uso en composiciones pesticidas y que son compatibles con compuestos de la presente invención].

- [0156]** En la práctica, los compuestos de la presente invención la mayoría de las veces forman parte de composiciones. Estas composiciones se pueden utilizar para controlar artrópodos, especialmente insectos, o nemátodos de plantas o ácaros. Las composiciones pueden ser de cualquier tipo conocido en la técnica adecuado para la aplicación a la plaga deseada en cualquier instalación o área interna o externa. Estas composiciones contienen por lo menos un compuesto de la presente invención como principio activo en combinación o asociación
- 40 con uno o más de otros componentes compatibles que son, por ejemplo, portadores o diluyentes, adyuvantes, agentes tensoactivos, sólidos o líquidos, o similares, apropiados para el uso deseado y que son agrícola o medicinalmente aceptables. Estas composiciones, que se pueden preparar de cualquier manera conocida en la técnica, forman asimismo parte de la presente invención.

- [0157]** Los compuestos de la presente invención, en sus formulaciones comercialmente disponibles y en las formas de uso preparadas a partir de estas formulaciones, pueden estar presentes en mezclas con otras sustancias activas, tales como insecticidas, atrayentes, esterilizantes, acaricidas, nematocidas, fungicidas, sustancias reguladoras del crecimiento o herbicidas.
- 50

**[0158]** Los pesticidas incluyen, por ejemplo, ésteres fosfóricos, carbamatos, ésteres carboxílicos, formamidas, compuestos de estaño y materiales producidos por microorganismos.

- 55 **[0159]** Son componentes preferidos en mezclas:

Fungicidas:

Inhibición de síntesis de ácido nucléico:

benalaxilo, benalaxil-M, bupirinato, quiralexilo, clozilacona, dimetirimol, etirimol, furalaxilo, himexazol, metalaxil- M, ofurace, oxadixilo, ácido oxolinico

Inhibidores de la mitosis y la división celular:

benomilo, carbendazim, dietofencarb, fuberidazol, pencicurona, tiabendazol, tiofanato-metilo, zoxamida

5

Inhibición de respiración complejo I.

Diflumetorim

Inhibición de respiración complejo II.

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

10 Inhibición de respiración complejo III.

azoxistrobina, ciazofamida, dimoxistrobina, enestrobina, famoxadona, fenamidona, fluoxastrobina, cresoxim-metilo, metominostrobina, orisastrobina, piraclostrobina, picoxistrobina, trifloxistrobina,

Desacoplantes

dinocap, fluazinam

15 Inhibición de producción de ATP

acetato de fentina, cloruro de fentina, hidróxido de fentina, siltiofam

Inhibidores de la biosíntesis de aminoácidos y proteínas

andoprim, blastidina-S, ciprodinilo, casugamicina, clorhidrato de casugamicina hidratado, mepanipirim, pirimetanilo

Inhibidores de la transducción de señales

20 fenciclonilo, fludioxonilo, quinoxifeno

Inhibidores de la síntesis de lípidos y membranas

clozolinato, iprodiona, procimidona, vinclozolina ampropilfos, ampropilfos potásico, edifenfos, iprobenfos (IBP), isoprotilano, pirazofos tolclofos-metilo, bifenilo yodocarb, propamocarb, clorhidrato de propamocarb

Inhibidores de la biosíntesis de ergosterol

25 fenhexamida, 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, imazalilo, sulfato de imazalilo, oxpoconazol, fenarimol, flurprimidol, nuarimol, pirifenox, triforina, pefurazoato, procloraz, triflumizol, viniconazol, aldimorf, dodemorf, acetato de dodemorf, fenpropimorf, tridemorf, fenpropidina, espiroxamina, naftifina, piributicarb, terbmafina,

30

Inhibidores de la síntesis de la pared celular

bentiavalicarb, bialafos, dimetomorf, flumorf, iprovalicarb, polioxinas, polioxorima, validamicina A

Inhibidores de la biosíntesis de la melanina

35 capropamida, diclocimet, fenoxanilo, ftalida, piroquilona, triciclazol,

Inducción de resistencia

acibenzolar-S-metilo, probenazol, tiadinilo

Multisitio

40 captafol, captano, clorotalonilo, sales de cobre tales como: hidróxido de cobre, naftenato de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato de cobre, óxido de cobre, oxina cúprica y mezcla de Bordeaux, diclofluanida, ditianona, dodina, base libre de dodina, ferbam, fluorofolpet, guazatina, acetato de guazatina, iminoctadina, besilato de iminoctadinal,

triacetato de iminocetadina, mancozeb, mancozeb, maneb, metiram, metiram de cinc, propineb, azufre y preparaciones de azufre que contienen polisulfuro de calcio, tiram, toliifluanida, zineb, ziram,

- Mecanismo desconocido amibromdol, bentiazol, betoxazina, capsimicina, carvona, quinometionato, cloropicrina, cufraneb, citlufenamida, cimoxanilo, dazomet, debacarb, diclorofeno, diclorofeno, diclorofeno, difenzoquat, metilsulfato de difenzoquat, difenilamina, etaboxam, ferimazona, flumetover, flusulfamida, fluopicolida, fluoroimida, hexaclorobenceno, sulfato de 8-hidroxiquinolina, irumamicina, metasulfocarb, metrafenona, metilisotiocianato, mildiomicina, natamicina, dimetilditiocarbamato de níquel, nitrotal-isopropilo, octilinona, oxamocarb, oxifentiina, pentaclorofenol y sales, 2-fenilfenol y sales, piperalina, propanosina sódica, proquinazida, pirrolnitrina, quintoceno, tecloftalam, tecnaceno, triazoxida, triclámida, zarilámida y 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)-piridina, N-(4-cloro-2-nitrofenil)-N-etil-4-metilbenceno-sulfonamida, 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-(metoxime-tilen)benzoacetato de metilo, 4-cloro-alfa-propinilo-N-[2-[3-metoxi-4-(2-propinilo)fenil]etil]benzoacetamida, (2S)-N-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-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-dicloronicotinamida, N-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)metil-2,4-dicloronicotinamida, 2-butoxi-6-yodo-3-propilbenzopiranon-4-ona, N-[(Z)-[(ciclopropilmetoxi)imino]-[6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil]-2-benzoacetamida, N-(3-etil-3,5,5-trimetilciclohexil)-3-fenilamino-2-hidroxibenzamida, 2-[[[1-[3-(1-fluoro-2-feniletil)oxi]fenil]etiliden]amino]oxi]metil]-alfa-(metoxiimino)-N-metil-alfa-E-benzoacetamida, N-[2-[3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il]etil]-2-(trifluorometil)benzamida, N-(3',4'-dicloro-5-fluorobifenil-2-il)-3-(difluoroetil)]-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]-dimetilpropil-1H-imidazol-1-carbotioico, 2-(2-[[6-(3-cloro-2-metilfenoxi)-5-fluoropirimidin-4-il]oxi]fenil)-2-(metoxiimino)-N-metilacetamida

#### Bactericidas:

bronopol, diclorofeno, nitrapirina, dimetilditiocarbamato de níquel, kasugamicina, octilinona, ácido carboxílico

- 30 furano, oxitetraciclina, probenazol, streptomycin, tecloftalam, sulfato de cobre y otras preparaciones de cobre.

#### Insecticidas / acaricidas / nematocidas:

Inhibidores de la Acetilcolinesterasa (ACHE)

Carbamatos,

- 35 por ejemplo alanícarb, aldícarb, aldóxicarb, alixícarb, aminocarb, azametifos, bendiocarb, benfuracarb, bufencarb, butacarb, butocarboxim, butoxicarboxim, carbarilo, carbofuran, carbosulfan, chloetocarb, coumafós, cianofenós, cianofenós, dimetilan, etiofencarb, fenobucarb, fenotiocarb, formetanate, furatiocarb, isoprocarb, metam-sodio, metiocarb, metomilo, metolcarb, oxamilo, pirimicarb, promecarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, trimetacarb, XMC, xilícarb, triazamate

organofosfatos,

- 40 por ejemplo acefato, azametifos, azinfos (-metilo, -etilo), bromofos-etilo, bromfenvinfos (-metilo), butatiofos, cadusafos, carbofenotion, chloretofos, chlorfenvinfos, clormefos, clorpirifos (-metil/-etilo), coumafós, cianofenós, cianofenós, demeton-s-metilo, demeton-s-metilsulfon, dialifos, diazinon, diclofention, diclorvos/DDVP, dicrotofos, dimetoate, dimetilvinfos, dioxabenzofos, disulfoton, EPN, etion, etoprofos, etrimfos, famfur, fenamifos, fenitroton, fensulfotion, fention, flupirazofos, fonofos, formotion, fosmetilan, fostiazato, heptenofos, iodofenfos, iprobenfos, 45 isazofos, isofenfos, isopropilo o-salicilato, isoxation, malation, mecarbám, metacrifos, metamidofos, metidation, mevinfos, monocrotofos, naled, ometoato, oxidemeton-metilo, paration (-metil/-etilo), fentoato, forato, fosalone, fosmet, fosfamidon, fosfocarb, foxim, pirimifos (-metil/-etilo), profenofos, propafos, propetamfos, protiofos, protoato, piraclafos, piridafention, piridation, quinalfos, sebufos, sulfotep, sulprofos, tebupirimfos, temefos, terbufos, tetraclorvinfos, tiometon, triazofos, triclorfon, vamidotion

- 50 Bloqueadores y moduladores de canales de sodio dependientes del voltaje

Piretroides,

- por ejemplo acrinatrin, aletrín (d-cis-trans, d-trans), beta-ciflutrin, bifentrin, bioaletrín, isómero bioaletrín- s-ciclopentil-, bioetanometrin, biopermetrin, bioresmetrin, clovaportrin, cis-cipermetrin, cis-resmetrin, cis-permetrin, clocitrín, cicloprotrin, ciflutrin, cihalotrin, cipermetrin (alfa-, beta-, teta-, zeta-), cifenotrin, deltametrín, em-pentrin (isómero 1 R), 55 esfenvalerato, etofenprox, fenflutrin, fenpropatrin, fenpiritrín, fenvalerato, flubrocitrinato, flucitrinato, flufenprox,

flumetrin, fluvalinato, fubfenprox, gamma-cihalotrin, imiprotrin, kadetrin, lambda-cihalotrin, metoflutrín, permetrin (cis-, trans-), fenotrin (isómero 1R-trans), pralletrin, proflutrín, protrifenbute, piresmetrin, resmetrin, RU 15525, silafluofen, tau-fluvalinato, teflutrín, teralletrin, tetrametrin (isómero 1 R), tralome-trin, transflutrín, ZXI 8901, piretrins (piretrum)

DDT

5 Oxadiazinas

por ejemplo indoxacarb

Agonistas/antagonistas receptores de acetilcolina

Cloronicotinilos,

por ejemplo acetamiprid, clotianidin, dinotefuran, imidacloprid, nitenpiram, riitiazina, tiacloprid, tiametoxam

10 nicotina, bensultap, cartap

Moduladores de receptor de acetilcolina

Espinosinas

por ejemplo spinosad

Antagonistas de canal de cloruros controlados por GABA

15 Organocloruros

por ejemplo camfeclor, clordane, endosulfan, gamma-HCH, HCH, heptaclor, lindane, metoxiclor

fiproles

por ejemplo acetoprole, etiprole, fipronilo, vaniliprole Activadores de canal de cloruro

Mectinas,

20 por ejemplo abamectina, avermectina, emamectina, emamectina-benzoato, ivermectina, milbemectina, milbemicina

Miméticos de las hormonas juveniles

por ejemplo diofenolan, epofenonane, fenoxicarb, hidroprene, kinoprene, metoprene, piriproxifen, triprene

Agonistas/disruptores de la ecdisona

Diacilhidrazinas

25 por ejemplo cromafenozida, halofenozida, metoxifenozida, tebufenozida

Inhibidores de la biosíntesis de la quitina

Benzoilureas

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

30 buprofezina

ciromazina

Inhibidores de fosforilación oxidante, disruptores de ATP

diafentiuron

compuestos organotinas por ejemplo azociclotina, cihexatina, óxido de fenbutatina

35 Desacopladores de fosforilación oxidantes que actúan por interrupción de gradiente de protón H

Pirroles

por ejemplo clorfenapir

dinitrofenoles



por ejemplo binapacirt, dinobuton, dinocap, DNOC

Inhibidores de transporte de electrones Sitio-I

METIs

por ejemplo fenazaquin, fenpiroximato, pirimidifen, piridaben, tebufenpirad, tolfenpirad hidrametilnona dicofol

5 inhibidores de transporte de electrones Sitio-II

rotenonas

Inhibidores de transporte de electrones Sitio-III

Acequinocilo, fluacirpirim

Disruptores microbianos de la membrana del intestino de insecto

10 Variedades de bacillus turingiensis

Inhibidores de síntesis de grasas

ácidos tetrónicos

por ejemplo spirodiclofen, spiromesifen ácidos tetrámicos,

15 por ejemplo 3-(2,5-dimetilfenilo)-8-metoxi-2-oxo-1-azaspiro[4.5]dec-3-en-4-ilo carbonato de etilo (alias: ácido carbónico, 3-(2,5-dimetilfenilo)-8-metoxi-2-oxo-1-azaspiro[4.5]dec-3-en-4-ilo etilo ester, CAS Reg. No.: 382608-10-8) y ácido carbónico, cis-3-(2,5-dimetilfenilo)-8-metoxi-2-oxo-1-azaspiro[4.5]dec-3-en-4-ilo ester de etilo (CAS Reg. No.: 203313-25-1)]

Carboxamidas

por ejemplo flonicamida

20 Agonista octopaminérgico

por ejemplo amitraz

Inhibidores de ATPasa estimulados por magnesio,propargita

Ácido benzoico

Dicarboxamidas,

25 Por ejemplo flubendiamida

Análogos de la Nereistoxina,

por ejemplo oxalato de hidrógeno tiociclám, tiosultap-sodio

Hormonas o feromonas Biológicas,

30 azadiractinas, Bacillus spec., Beauveria spec., codlemone, Metarrhizium spec., Paecilomices spec., turingiensis, Verticillium spec.)

Compuestos activos con mecanismos desconocidos o no específicos de acción

Fumigantes, por ejemplo fosfuro de aluminio, bromuro de metilo, fluoruro de sulfurilo

Inhibidores de alimentación, por ejemplo criolita, flonicamida, pimetozina

inhibidores de crecimiento de ácaros (por ejemplo clofentezina, etoxazole, hexitiazox

35 amidoflumet, benclotiaz, benzoximato, bifenazato, bromopropilato, buprofezin, quinometionat, clordimeform, clorobenzilato, cloropicrin, clotiazoben, cicloprene, cyflumetofen, diciclanilo, fenoxacrim, fentrifanilo, flubenzimine, flufenerim, flutenzin, gossyplure, hydrametilnone, japonilure, metoxadiazona, petróleo, piperonilo butóxido, oleato de Potasio, pirafuprole, piridalilo, piriprole, sulfluramida, tetradifon, tetrasul, triaratene, verbutin

40 **[0160]** También es posible una mezcla con otros compuestos activos conocidos tales como herbicidas, fertilizantes, reguladores del crecimiento, protectores, semiquímicos o también con agentes para la mejora de las propiedades de las plantas.

**[0161]** Los compuestos activos de la invención también pueden estar presentes en sus formulaciones comerciales normales cuando se usan como insecticidas así como en las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones en mezcla con sinergistas. Los sinergistas son compuestos mediante los cuales se puede aumentar la actividad del compuesto activo sin que el propio sinergista sea él mismo activo.

5 **[0162]** Los compuestos activos de la invención también pueden estar presentes en sus formulaciones comerciales normales cuando se usan como insecticidas así como en las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones en mezcla con inhibidores que reducen la degradación del compuesto activo tras su utilización en el entorno de las plantas, sobre la superficie de las plantas o en tejidos de plantas.

10 **[0163]** Los componentes mencionados más arriba para combinaciones son conocidos como sustancias activas, varias de las cuales se describen en CH.R Worthing, S.B. Walquer, The Pesticide Manual, 12rd Edition, British Crop Protection Council, Farnham 2000.

15 **[0164]** Las dosis de utilización efectivas de los compuestos empleados en la invención pueden variar dentro de intervalos amplios, en especial en función de la naturaleza de la plaga a eliminar o el grado de infestación, por ejemplo, de plantaciones con estas plagas. En general, las composiciones según la invención suelen contener de aproximadamente 0.05 hasta aproximadamente 95% (en peso) de uno o más ingredientes activos según la invención, aproximadamente 1 hasta aproximadamente 95% de uno o más transportadores sólidos o líquidos y, opcionalmente, aproximadamente 0.1 hasta aproximadamente 50% de uno o más de otros componentes compatibles, tales como agentes tensoactivos o similares.

20 **[0165]** En la presente descripción, el término "transportador" indica un ingrediente orgánico o inorgánico, natural o sintético, con los que se combina el ingrediente activo para facilitar su aplicación, por ejemplo, a la planta, las semillas o al suelo. Por lo tanto, este transportador es en general inerte y debe ser aceptable (por ejemplo, aceptable agronómicamente, en especial para la planta tratada).

25 **[0166]** El transportador puede ser un sólido, por ejemplo, silicatos naturales o sintéticos, sílice, resinas, ceras, fertilizantes sólidos (por ejemplo sales de amonio), minerales naturales del suelo, tales como caolinas, arcillas, talco, tiza, cuarzo, attapulgita, montmorillonita, bentonita o tierra diatómea, o minerales naturales del suelo, tales como sílice, alumina, o silicatos, en especial silicatos de aluminio o magnesio. Como transportadores sólidos para gránulos son adecuados los siguientes: piedras naturales trituradas o fraccionadas tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita y dolomita; gránulos sintéticos de comida inorgánica u orgánica; gránulos de material orgánico tales como aserrín, cáscaras de coco, mazorcas de maíz, hojas de maíz o tallos de tabaco; kieselguhr, fosfato de tricalcio, corcho pulverizado, negro de carbono absorbente; polímeros solubles en agua, resinas, ceras; o fertilizantes sólidos. Estas composiciones sólidas pueden, si se desea, contener uno o más agentes humidificadores, dispersantes, emulsificadores o colorantes compatibles que, en estado sólido, también sirven como diluyentes.

**[0167]** Algunos transportadores sólidos adecuados lo son:

35 por ejemplo, sales de amonio y polvo mineral natural como un caolín, arcillas, talco, yeso, cuarzo, atapulgita, montmorillonita o tierra de diatomeas, polvos y minerales sintéticas tales como sílice muy dispersa, óxido de aluminio y silicatos, portadores de granulados adecuados son los siguientes: por ejemplo minerales naturales triturados y fraccionados tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita, así como granulados sintéticos de harinas inorgánicas y orgánicas, así como granulados de materiales orgánicos tales como papel, serrín, cáscaras de coco, mazorcas de maíz y tallos de tabaco; Algunos emulsificadores y agentes espumantes son; por ejemplo emulsificadores no ionogénicos y aniónicos tales como los ésteres ácidos grasos de polioxietileno, éteres ácidos grasos de polioxietileno, por ejemplo éteres de alquilarilpoliglicol, alquilsulfonatos, alquilsulfatos, arilsulfonatos e hidrolisatos de proteínas; adecuados como dispersantes lo son los materiales no iónicos y/o iónicos, por ejemplo de la clase de los éteres de alcohol-POE y/o POP, ésteres ácidos y/o POP o POE, éteres alquilaril- y/o POP o POE, aductos grasos y/o POP o POE, derivados de polioles POE- y/o POP, aductos de POE- y/o POP-sorbitan o azúcar,

40 sulfatos de alquilo o arilo, sulfonatos y fosfatos o los aductos de éteres PO respectivos. Además, oligo o polímeros adecuados, por ejemplo a partir de monómeros de vinilo, de ácido acrílico, de EO y/o PO solamente o en combinación con, por ejemplo (poli)alcoholes o (poli)aminas. Además se pueden usar la lignina y sus derivados ácidos sulfónicos, celulosas simples y modificadas, ácidos sulfónicos aromáticos y/o alifáticos así como sus aductos con formaldehído.

50 **[0168]** Se pueden utilizar en las formulaciones constructores de depósito tales como carboximetilcelulosa, polímeros naturales y sintéticos en polvo, granulados o de tipo látex, tales como la goma árabe, alcohol de polivinilo, acetato de polivinilo así como fosfolípidos naturales tales como las cefalina y lecitinas y fosfolípidos sintéticos.

55 **[0169]** El transportador también puede ser líquido, por ejemplo: agua, alcoholes, en especial butanol o glicol, así como sus éteres o ésteres, en especial acetato de metilglicol; cetonas, en especial acetona, ciclohexanona, metiletilo cetona, metilisobutilcetona, o isoforona; fracciones de petróleo tales como hidrocarburos de parafina o aromáticos, en especial xilenos o alquilo naftaleno; aceites minerales o vegetales; hidrocarburos alifáticos clorados, en especial tricloroetano o cloruro de metileno; hidrocarburos aromáticos clorados, en especial clorobencenos;

disolventes solubles en agua o fuertemente polares tales como dimetilformamida, dimetilo sulfóxido, o N-metilpirrolidona; gases líquidos; o similares o una mezcla de estos.

**[0170]** El agente tensoactivo puede ser un agente emulsificador, un agente dispersante o un agente humidificador de tipo iónico o no-iónico o una mezcla estos agentes tensoactivos.

- 5 **[0171]** Entre estos se cuentan por ejemplo, sales de ácidos poli acrílicos, sales de ácidos lignosulfónicos, sales de ácidos fenolesulfónicos o naftalenesulfónicos, policondensados de óxido de etileno con alcoholes grasos o ácidos grasos o ésteres grasos o aminas grasas, fenoles sustituidos (en especial alquilofenoles o arilfenoles), sales de ésteres ácidos sulfosuccínicos, derivados taurinos (en especial alquilo-tauratos), ésteres fosfóricos de alcoholes o de policondensados de óxido de etileno con fenoles, ésteres de ácidos grasos con polioles, o derivados funcionales de sulfato, sulfonato o fosfato de los compuestos mencionados. La presencia de al menos un agente tensoactivo es en general esencial cuando el ingrediente activo y/o el transportador inerte son solamente ligeramente solubles o no solubles y el agente transportador de la composición para la aplicación es agua.

- 15 **[0172]** Las composiciones de la invención pueden contener también otros aditivos tales como adhesivos o colorantes. Se pueden utilizar en las formulaciones adhesivos tales como carboximetilcelulosa o polímeros naturales o sintéticos en la forma de polvos, gránulos o celdas, tales como goma arábica, alcohol de polivinilo o acetato de polivinilo, fosfolípidos naturales, tales como cefalinas o lecitinas, o fosfolípidos sintéticos. Es posible utilizar colorantes tales como pigmentos inorgánicos, por ejemplo: óxidos de hierro, óxidos de titanio o azul prusiano;

colorantes orgánicos, tales como colorantes de alizarina, azo de metal o de ftalocianina, u oligoelementos tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno, o zinc.

- 20 **[0173]** Por lo tanto, para su aplicación en la agricultura, los compuestos de la invención tienen en general la forma de composiciones, en varias formas líquidas o sólidas.

- [0174]** Se pueden utilizar formas sólidas de composiciones tales como polvos (con un contenido del compuesto de la invención de hasta 80%), polvos o gránulos humidificables (incluyendo gránulos dispersables en agua), en especial aquellos obtenidos por extrusión, compactación, impregnación de un transportador granular, o granulación a partir de un polvo (estando el contenido del compuesto de la invención, en estos polvos o gránulos humidificables entre aproximadamente 0.5 y aproximadamente 80%). Se pueden utilizar composiciones sólidas homogéneas o heterogéneas que contienen uno o más compuestos de la invención, por ejemplo gránulos, pellets, briquetas o cápsulas, para tratar aguas estancadas o corrientes durante un periodo de tiempo. Un efecto similar se puede lograr empleando alimentación por goteo o intermitente de concentrados dispersables en agua tal como se describe aquí.

- 30 **[0175]** Las composiciones líquidas incluyen, por ejemplo, soluciones o suspensiones acuosas o no acuosas (tales como concentrados emulsificables, emulsiones, fluidos, dispersiones, o soluciones) o aerosoles. Las composiciones líquidas también incluyen, en particular, polvos humidificables de concentrados emulsificables, emulsiones, fluidos, dispersiones, aerosoles (o polvo para rociar), pastas o fluidos secos como formas de composiciones líquidas o destinadas a formar composiciones líquidas cuando se aplican, por ejemplo como aerosoles acuosos (incluyendo volumen bajo y muy bajo) o como nieblas o aerosoles.

- [0176]** Las composiciones líquidas, por ejemplo, en la forma de concentrados emulsificables o solubles comprenden en la mayoría de las veces aproximadamente de 5 a aproximadamente 80% en peso del ingrediente activo, mientras que las emulsiones o soluciones listas para su aplicación contienen, en su caso, aproximadamente de 0.01 a aproximadamente 20% del ingrediente activo. Aparte del disolvente, los concentrados emulsificables o solubles pueden contener, cuando sea necesario, aproximadamente de 2 a aproximadamente 50% de aditivos adecuados, tales como estabilizadores, agentes tensoactivos, agentes de penetración, inhibidores de la corrosión, colorantes o adhesivos. Se pueden obtener emulsiones de cualquier concentración buscada, que son en especial adecuadas para su aplicación, por ejemplo, a plantas, a partir de estos concentrados por dilución con agua. Estas composiciones están al alcance de las composiciones que se pueden emplear en la presente invención. Las emulsiones pueden estar en la forma de agua en aceite o aceite en agua y pueden tener una consistencia espesa.

**[0177]** Las composiciones líquidas de esta invención pueden ser usadas, además de en los usos normales, en agricultura por ejemplo para tratar sustratos o lugares infestados o que pueden ser infestados por artrópodos (u otras plagas controladas por los compuestos de esta invención) incluyendo establecimientos de almacenamiento o de procesado internos o al aire libre, contenedores o equipos o aguas corrientes o estancadas.

- 50 **[0178]** Se pueden aplicar todas estas dispersiones o emulsiones acuosas o mezclas para rociado, por ejemplo, a plantaciones mediante cualquier medio apropiado, principalmente por rociado, a velocidades que son en general del orden de aproximadamente 100 a aproximadamente 1,200 litros de mezcla de rociado por hectárea, aunque puede ser mayor o menor (por ejemplo volumen bajo o ultra bajo) dependiendo de las necesidades o de la técnica de aplicación. El compuesto o composiciones según la invención se aplican convenientemente a vegetación y en particular a raíces u hojas que contienen plagas a eliminar. Otro procedimiento de aplicación de los compuestos o composiciones según la invención es por quimigación, es decir, la adición de una formulación que contiene el ingrediente activo para irrigar con agua. Esta irrigación puede ser irrigación por rociado para pesticidas foliares o puede ser irrigación de suelo o subsuelo o para pesticidas sistémicos.

- [0179]** Las suspensiones de concentrado, que se pueden aplicar por rociado, se preparan para que produzcan un producto estable fluido que no se deposite (triturado fino) y suelen contener desde aproximadamente 10 a aproximadamente 75% en peso de ingrediente activo, desde aproximadamente 0.5 a aproximadamente 30% de agentes tensoactivos, desde aproximadamente 0.1 a aproximadamente 10% de agentes tixotrópicos, desde aproximadamente 0 a aproximadamente 30% de aditivos adecuados, tales como agentes anti-espuma, inhibidores de la corrosión, estabilizadores, agentes de penetración, adhesivos y, como transportador, agua o un líquido orgánico en el que el ingrediente activo es poco soluble o insoluble algunas sales orgánicas o inorgánicas se pueden disolver en el transportador para evitar la deposición o como anticongelante del agua.
- [0180]** Los polvos humidificables (o polvo para rociado) se suelen preparar para que contengan desde aproximadamente 10 a aproximadamente 80% en peso de ingrediente activo, desde aproximadamente 20 a aproximadamente 90% de transportador sólido, desde aproximadamente 0 a aproximadamente 5% de agente humidificador, desde aproximadamente 3 a aproximadamente 10% de agente dispersante y, cuando sea necesario, desde aproximadamente 0 a aproximadamente 80% de uno o más estabilizadores y/o otros aditivos, tales como agentes de penetración, adhesivos, agentes anti-formación de galletas, colorantes, o similares. Para obtener estos polvos humidificables, el ingrediente activo se mezcla totalmente en un mezclador adecuado con sustancias adicionales que se pueden impregnar sobre un relleno poroso y se tritura utilizando un triturador o molino adecuado. Esto produce polvos humidificables, cuya humidificabilidad y grado de suspensión son ventajosos. Se pueden suspender en agua para producir cualquier concentración deseada y esta suspensión se puede emplear muy ventajosamente para su aplicación al follaje de plantas.
- [0181]** Los "gránulos dispersables en agua (WG)" (gránulos que se dispersan inmediatamente en agua) tienen composiciones que son sustancialmente parecidas a los polvos humidificables.
- [0182]** Se pueden preparar por granulación de formulaciones descritas para los polvos humidificables, ya sea mediante camino húmedo (poner en contacto ingrediente activo finamente dividido con un relleno inerte y un poco de agua, por ejemplo de 1 a 20% en peso, o con una solución acuosa de un agente dispersante o de unión, y luego secar y poner máscara), o mediante un camino seco (compactación seguida de triturado y máscara).
- [0183]** Las concentraciones y tasa de las composiciones formuladas pueden variar según el procedimiento de aplicación o la naturaleza de las composiciones o utilización de estas. En términos generales, las composiciones para la aplicación para el control de plagas de artrópodos o nematodos de plantas suelen contener desde aproximadamente 0.00001 % a aproximadamente 95%, más especialmente desde aproximadamente 0.0005% a aproximadamente 50% en peso de uno o más compuestos de la invención, o de ingredientes activos totales (es decir los compuestos de la invención, junto con otras sustancias tóxicas para los artrópodos o nematodos de planta, elementos de sinergia, elementos de traza o estabilizadores). Las composiciones empleadas y su tasa de aplicación se seleccionaran para obtener el o los efectos deseados por el granjero, productor de ganado, el médico, o veterinario, el operario del control de plagas u otro experto en la materia.
- [0184]** Las composiciones sólidas o líquidas para la aplicación tópica a animales, madera, productos almacenados o bienes domésticos suelen contener desde aproximadamente 0.00005% a aproximadamente 90%, más especialmente desde aproximadamente 0.001 % a aproximadamente 10%, en peso de uno o más compuestos de la invención. Para la administración a animales por vía oral o parenteral, incluyendo composiciones líquidas o sólidas percutáneas, estos suelen contener desde aproximadamente 0.1 % a aproximadamente 90% en peso de uno o más compuestos de la invención. Los alimentos con medicamentos contienen normalmente desde aproximadamente 0.001% a aproximadamente 3% en peso de uno o más compuestos de la invención. Los concentrados o suplementos para el mezclado con alimentos contienen normalmente desde aproximadamente 5% a aproximadamente 90%, preferentemente desde aproximadamente 5% a aproximadamente 50%, en peso de uno o más compuestos de la invención. Los lamederos de sales minerales contienen normalmente desde aproximadamente 0.1% a aproximadamente 10% en peso de uno o más compuestos de fórmula I o sales aceptables como pesticidas de estos.
- [0185]** Los polvos o composiciones líquidas para su aplicación a ganado, bienes, establecimientos o zonas externas pueden contener desde aproximadamente 0.0001 % a aproximadamente 15%, más especialmente desde aproximadamente 0.005% a aproximadamente 2.0%, en peso, de uno o más compuestos de la invención. Unas concentraciones adecuadas en aguas tratadas están entre aproximadamente 0.0001 ppm y aproximadamente 20 ppm, más especialmente aproximadamente 0.001 ppm a aproximadamente 5.0 ppm de uno o más compuestos de la invención, y se pueden utilizar terapéuticamente en piscifactorías con tiempos de exposición adecuados. Los cebos comestibles pueden contener desde aproximadamente 0.01% a aproximadamente 5%, preferentemente desde aproximadamente 0.01 % a aproximadamente 1.0%, en peso, de uno o más compuestos de la invención.
- [0186]** Cuando se administra a vertebrados por vía parenteral, oral o percutánea u otros medios, la dosificación de los compuestos de la invención, dependerá de la especie, edad, o salud del vertebrado y de la naturaleza y grado de infestación actual o potencial por plagas de artrópodos o helmintos. Un única dosis de aproximadamente 0.1 a aproximadamente 100 mg, preferentemente de aproximadamente 2.0 a aproximadamente 20.0 mg, por kg de animal o dosis de aproximadamente 0.01 a aproximadamente 20.0 mg, preferentemente aproximadamente 0.1 a aproximadamente 5.0 mg, por kg de animal por día, para una medicación sostenida, son en general adecuadas por

administración oral o parenteral. Mediante la utilización y combinación de dispositivos de liberación sostenida de formulaciones, la dosis diaria requerida durante un periodo de meses se puede administrar a animales de una única vez.

- 5 **[0187]** Los siguientes EJEMPLOS 2A - 2M de composiciones ilustran composiciones para su utilización contra artrópodos, en especial ácaros o insectos, o nematodos de planta, que comprenden, como ingrediente activo, compuestos de la invención, tales como aquellos descritos ejemplos de preparados. Las composiciones descritas en los EJEMPLOS 2A - 2M pueden ser todos diluidos para dar como resultado una composición que se puede rociar en concentraciones adecuadas para la utilización en el campo. Las descripciones químicas genéricas de los ingredientes (para las cuales todos siguientes porcentajes están en porcentaje en peso), utilizadas en los
- 10 EJEMPLOS 2A - 2M siguientes, son tal como se muestra a continuación:

	Marca	Descripción química
	Etilan BCP	condensado de Nonilfenol óxido de etileno
	Soprofor BSU	condensado de Tristirilfenol óxido de etileno
	Arilan CA	una solución al 70% p/v de dodecilbencenosulfonato de calcio
15	Solvesso 150	disolvente C <sub>10</sub> aromático ligero
	Arylan S	dodecilbencenosulfonato de sodio Darvan NO <sub>2</sub> lignosulfonato de sodio
	Celite PF	transportador de silicato de magnesio sintético
	Sopropon T36	sales de sodio de ácidos policarboxícos
	Rhodigel 23	goma xantana polisacarido
20	Bentone 38	Derivado orgánico de montmorillonite de magnesio
	Aerosil	Dióxido de sílice microfino

EJEMPLO 2A

**[0188]**

	Ingrediente activo	7%
25	Etilan BCP	10%
	N-metilpirrolidone	83%

Un concentrado soluble en agua se prepara con la composición tal como se indica a continuación:

- 30 A una solución de Etilan BCP disuelta en una porción de N-metilpirrolidone se le añade el ingrediente activo con calentamiento y mezclado hasta que se disuelve. La solución resultante se completa en volumen con el disolvente restante.

EJEMPLO 2B

**[0189]** Un concentrado emulsificable (EC) se prepara con la composición tal como se indica a continuación:

	Ingrediente activo	25%(max)
	Soprophor BSU	10%
35	Arylan CA	5%
	N-metilpirrolidone	50%
	Solvesso 150	10%

**[0190]** Los primeros tres componentes se disuelven en N-metilpirrolidone y a esto se le añade luego el Solvesso 150 para llegar al volumen final.

EJEMPLO 2C

**[0191]**

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

Un polvo humidificable (WP) se prepara con la composición tal como se indica a continuación:

Los ingredientes se mezclan y asientan en un molino de martillo a polvo con un tamaño de partícula de menos de 50 micras.

EJEMPLO 2D

10 **[0193]**

	Ingrediente activo	40.00%
	Etilan BCP	1.00%
	Sopropon T360.	0.20%
	Etilen glicol	5.00%
15	Rhodigel 230.	0.15%
	Agua 53.	65%

Una formulación fluida acuosa se prepara con la composición tal como se indica a continuación:

Los ingredientes se mezclan íntimamente y se asientan en un molino de bolas hasta que se obtiene un tamaño de partícula de menos de 3 micras.

20 EJEMPLO 2E

**[0195]**

	Ingrediente activo	30.0%
	Etilan BCP	10.0%
	Bentone 38	0.5%
25	Solvesso 150	59.5%

**[0196]** Un concentrado de suspensión emulsificable se prepara con la composición tal como se indica a continuación:

Los ingredientes se mezclan íntimamente y se asientan en un molino de bolas hasta que se obtiene un tamaño de partícula de menos de 3 micras.

30 EJEMPLO 2F

**[0197]** Un gránulo dispersable en agua se prepara con la composición tal como se indica a continuación:

	Ingrediente activo	30%
	Darvan No 2	15%
	Arylan S	8%
35	Celite PF	47%

**[0198]** Los ingredientes se mezclan, micronizan en un molino movido por fluido y luego se granula en un pelletizador giratorio mediante rociado con agua (hasta 10%). Los gránulos resultantes se secan en un secador de lecho fluido para retirar el exceso de agua.

EJEMPLO 2G

**[0199]** Un polvo secante se prepara con la composición tal como se indica a continuación:

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

5 **[0200]** Los ingredientes se mezclan íntimamente y se asientan lo suficientemente para lograr un polvo fino. Este polvo puede aplicarse al lugar de infestación de artrópodos, por ejemplo en vertederos de rechazo, productos almacenados o bienes o animales domésticos infestados, o con riesgo de ser infestados por, artrópodos para controlarlos por ingestión oral. Unos medios adecuados para distribuir el polvo secante al lugar de infestación de artrópodos incluyen ventiladores mecánicos, manuales o dispositivos automáticos de tratamiento de ganado.

EJEMPLO 2H

10 **[0201]** Un cebo comestible se prepara con la composición tal como se indica a continuación:

Ingrediente activo	0.1 a 1.0%
Harina de trigo	80%
Melazas	19.9 a 19%

15 **[0202]** Los ingredientes se mezclan íntimamente y se conforman en forma de cebo. Este cebo comestible puede ser distribuido en un lugar, por ejemplo establecimientos domésticos o industriales, por ejemplo cocinas, hospitales o almacenes, o zonas al aire libre, infestados por artrópodos, por ejemplo hormigas, langostas, cucarachas o moscas, para controlar los artrópodos por ingestión oral.

EJEMPLO 2I

**[0203]** Una formulación de solución se prepara con una composición tal como se indica a continuación:

20	Ingrediente activo	15%
	Sulfóxido de dimetilo	85%

25 **[0204]** El ingrediente activo se disuelve en sulfóxido de dimetilo con mezclado y calentamiento si es necesario. Esta solución puede aplicarse de forma percutánea como aplicación por vertido en animales domésticos infestados por artrópodos o, tras esterilización por filtración a través de una membrana de politetrafluoroetileno (0.22 micrómetros de tamaño de poro), por inyección parenteral, a una velocidad de aplicación desde 1.2 a 12 ml de solución por 100 kg de animal.

EJEMPLO 2J

**[0205]**

30	Ingrediente activo	50%
	Etilan BCP	5%
	Aerosil	5%
	Celite PF	40%

**[0206]** Un polvo humidificable se prepara con la composición tal como se indica a continuación:

35 El Etilan BCP es absorbido sobre el Aerosil que luego se mezcla con los otros ingredientes y asientan en un molino de martillos para dar un polvo humidificable, que se puede diluir con agua a una concentración desde 0.001 % a 2% en peso del compuesto activo y aplicado a un lugar de infestación por artrópodos, por ejemplo, larvas dípteras o nematodos de planta, por rociado, o a animales domésticos infestados por, o con riesgo de infección por artrópodos, por rociado o inmersión, o por administración oral en agua de bebida, para controlar los artrópodos.

EJEMPLO 2K

[0207]

	Ingrediente activo
	Agente de densidad
	Agente de liberación lenta
5	Ligante

[0208] Una composición de bolo de liberación lenta se hace a partir de gránulos que contienen los siguientes componentes con porcentajes variables (similares a aquellos descritos para las composiciones previas) dependiendo de las necesidades:

10 Los ingredientes íntimamente mezclados se conforman en gránulos que son comprimidos a modo de bolo con una gravedad de 2 o más. Puede ser administrado oralmente a animales domésticos rumiantes para su retención en el retículo-rumen para proporcionar una liberación lenta y progresiva del compuesto activo durante un periodo de tiempo extendido para control de infestación de animales domésticos rumiantes por artrópodos.

EJEMPLO 2L

15 [0209] Una composición de liberación lenta en la forma de gránulos, pellets, briquetas o similares puede ser preparada con composiciones tal como siguen:

Ingrediente activo	0.5 a 25%
Cloruro de polivinilo	75 a 99.5%
Ftalato de dioctilo (plastificador)	

20 [0210] Los componentes se mezclan y son conformados con formas adecuadas por moldeado o fusión-extrusión. Estas composiciones son útiles, por ejemplo, para la adición a agua estancada o para fabricación de collares o etiquetas para las orejas para su fijación a animales domésticos para el control de plagas y liberación lenta.

EJEMPLO 2M

[0214] Un gránulo dispersable en agua se prepara con la composición tal como se indica a continuación:

	Ingrediente activo	85%(máx.)
25	Polivinilpirrolidone	5%
	Arcilla de attapulgita	6%
	Lauril Sulfato sodio	2%
	Glicerina	2%

30 [0212] Los ingredientes se mezclan como lodo con 45% de agua y serán triturados en húmedo hasta un tamaño de partícula de 4 micras, y luego secado por spray para eliminar el agua.

PROCEDIMIENTOS DE USO PESTICIDA

[0213] Se llevó a cabo el siguiente procedimiento de verificación representativo, empleando compuestos de la invención, para determinar la actividad parasitocida de compuestos de la invención.

Ejemplos biológicos

35 PROCEDIMIENTO A: Procedimiento de *screening* para verificar la sistemicidad de compuestos contra Ctenocephaluros felis (Pulga del gato)

40 [0214] Un recipiente de test se llenó con 10 adultos de Ctenocephaluros felis. Un cilindro de cristal se cerró en un extremo con un parafilm y se dispuso sobre el recipiente. La solución compuesto de test se pipeteó con sangre bovina y se añadió al cilindro de cristal. Los Ctenocephaluros felis tratados se mantuvieron en este test de perro artificial (sangre 37°C, 40-60 % de humedad relativa; Ctenocephaluros felis 20-22°C, 40-60 % de humedad relativa) y análisis realizado 24 y 48 horas tras la aplicación. Los números de compuesto 1-1, 1-2, 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-8, 1-9, 1-32, 1-33, 2-33 y 2-100 dieron al menos 90% de control de Ctenocephaluros felis a una concentración de test de 5ppm o menos.



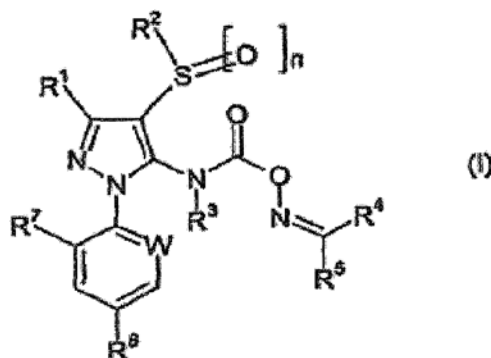
PROCEDIMIENTO B: Procedimiento de para verificar la actividad de contacto contra *Rhipicephalus sanguineus* (Garrapata marrón del perro)

5 **[0215]** Unas soluciones de los compuestos de test se vertieron sobre papel de filtro, se secaron y el papel de filtro se dispuso en tubos de test y se infestaron con 20-30 larvas (L1) de *Rhipicephalus sanguineus* y los tubos se cerraron con un clip. Los *Rhipicephalus sanguineus* tratados se mantuvieron en una cámara climática (25°C, 90% de HR) y se analizó el porcentaje de eficacia 24 horas y 48 horas tras aplicación comparadas con las de control no tratadas.

**[0216]** Los compuestos de número 1-02 dieron al menos 70% de control de contacto de *Rhipicephalus sanguineus* a una concentración de prueba de 100 ppm.

## REIVINDICACIONES

1. Compuesto de fórmula I o una sal de este aceptable como pesticida:



donde:

W es  $=CR^8$ - o  $=C(NR^9R^{10})$ -,

5  $R^8$  es halógeno, alquilo o haloalquilo,

$R^9$  y  $R^{10}$  son independientemente unos de otros hidrógeno, alquilo  $C_1$ - $C_6$ , alqueno  $C_2$ - $C_6$ , alquino  $C_2$ - $C_6$ ,

los grupos  $R^9$  y  $R^{10}$  están independientemente unos de otros opcionalmente sustituidos por uno o más de entre un halógeno, un cicloalquilo- $C_3$ - $C_7$ , un arilo, un heteroarilo, alcoxi  $C_1$ - $C_6$  y/o haloalcoxi  $C_1$ - $C_6$ ,

$R^1$  es un ciano, un metilo, un trifluorometilo,  $-CS-NH_2$  o  $-C(=NR^{11})S(O)nR^{12}$ ,

10  $R^{11}$  es hidrógeno, alquilo o arilo,

$R^{12}$  es alquilo o arilo,

los grupos  $R^{11}$  y/o  $R^{12}$  están opcionalmente sustituidos por uno o más de entre halógeno, hidroxilo, oxo, nitro, ciano, amino, alquilo, alcoxi, alquiltio, cicloalquilo, arilo, heterociclo y/o aralquilo,

$R^2$  es alquilo  $C_1$ - $C_6$ , haloalquilo  $C_1$ - $C_6$ , alqueno  $C_2$ - $C_6$ , haloalqueno  $C_2$ - $C_6$ , alquino  $C_2$ - $C_6$  o haloalquino  $C_2$ - $C_6$ ,

15  $R^3$  es hidrógeno, alquilo, alqueno, alquino, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, arilo, heterociclo, aralquilo o heterocicliclalquilo, estando  $R^3$  opcionalmente sustituido por uno o más de entre halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, carboxi, éster de ácido carboxílico, oxo, alquilcarbonilo, haloalquilcarbonilo, cicloalquilcarbonilo, alquilocicloalquilcarbonilo, arilcarbonilo, aralquilo carbonilo, heterociclicarbonilo, heterocicliclalquilcarbonilo, amino, alquilo, alcoxi, haloalcoxi, alquenoiloxi, haloalquenoiloxi, alquinoiloxi, haloalquinoiloxi, alquiltio, haloalquiltio, cicloalquiltio,

20 alquilocicloalquiltio, ariltio, aralquiltio, heterocicliiltio, heterociclico-alquiltio, alquilsulfoxidilo, haloalquilsulfoxidilo, cicloalquilsulfoxidilo, alquilocicloalquilsulfoxidilo, arilsulfoxidilo, aralquilsulfoxidilo, heterociclicsulfoxidilo, heterocicliclalquilsulfoxidilo, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, cicloalquilsulfonilo, alquilocicloalquilo-sulfonilo, arilsulfonilo, aralquilsulfonilo, heterociclicsulfonilo, heterocicliclalquilsulfonilo, cicloalquilo, cicloalquiloxi, arilo, arilo sustituido por uno o más de entre halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, ciano, nitro, alquiltio, haloalquiltio,

25 cicloalquiltio, alquilocicloalquiltio, ariltio, aralquiltio, heterocicliiltio, heterocicliclalquiltio, alquilsulfoxidilo, haloalquilsulfoxidilo, cicloalquilsulfoxidilo, alquilocicloalquilsulfoxidilo, arilsulfoxidilo, aralquilsulfoxidilo, heterociclicsulfonilo, heterocicliclalquilsulfonilo, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, cicloalquilsulfonilo, alquilocicloalquilsulfonilo, arilsulfonilo, aralquilsulfonilo, heterociclicsulfonilo, heterocicliclalquilsulfonilo, y / o amino, un heterociclo, un heterociclo sustituido por uno o más de entre halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi,

30 alquiltio, haloalquiltio, cicloalquiltio, alquilocicloalquiltio, ariltio, aralquiltio, heterocicliiltio, heterociclico-alquiltio, alquilsulfoxidilo, haloalquilsulfoxidilo, cicloalquilsulfoxidilo, alquilocicloalquilsulfoxidilo, arilsulfoxidilo, alquilsulfoxidilo, heterociclicsulfonilo, heterocicliclalquilsulfonilo, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, cicloalquilsulfonilo, alquilocicloalquilo-sulfonilo, arilsulfonilo, aralquilsulfonilo, heterociclicsulfonilo, heterocicliclalquilsulfonilo, hidroxilo y/o oxo, aralquilo y/o heterocicliclalquilo,

35  $R^4$  y  $R^5$  son independientemente unos de otros hidrógeno, alquilo, alqueno, alquino, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, arilo, heterociclo aralquilo o heterocicliclalquilo, o  $R^4$  y  $R^5$  junto con el átomo de carbono unido forman un anillo saturado o insaturado con cuatro a siete miembros que opcionalmente contiene átomos de oxígeno, azufre y/o nitrógeno en el anillo y/o que está fusionado con uno o más anillos heterocíclicos carbocíclicos saturados o insaturados, estando los grupos  $R^4$  y/o  $R^5$  o los anillos formados por  $R^4$  y  $R^5$  opcionalmente sustituidos por uno o

40 más de entre halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, carboxi, éster de ácido carboxílico, oxo, alquilcarbonilo, haloalquilcarbonilo, cicloalquilcarbonilo, alquilocicloalquilcarbonilo, arilcarbonilo, aralquilcarbonilo, heterociclicarbonilo,

- heterociclilalquilcarbonilo, amino; alquilo, alcoxi, cicloalquilo, haloalcoxi, alqueniolo, haloalqueniolo, alquiniolo, haloalquiniolo, alquiltio, haloalquiltio, cicloalquiltio, alquilocicloalquiltio, ariltio, aralquiltio, heterocicliiltio, heterocicliiloalquiltio, alquilsulfoxidilo, haloalquilsulfoxidilo, cicloalquilsulfoxidilo, alquilocicloalquilsulfoxidilo, arilsulfoxidilo, aralquilsulfoxidilo, heterocicliilsulfoxidilo, heterocicliilalquilsulfoxidilo, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, cicloalquilsulfonilo, alquilocicloalquilo-sulfonilo, arilsulfonilo, aralquilsulfonilo, heterocicliilsulfonilo, heterocicliilalquilsulfonilo, arilo, arilo sustituido por uno o más de entre halógeno, alquilo haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, ciano, nitro, alquiltio, haloalquiltio, cicloalquiltio, alquilocicloalquiltio, ariltio, aralquiltio, heterocicliiltio, heterocicliilalquiltio, alquilsulfoxidilo, haloalquilsulfoxidilo, cicloalquilsulfoxidilo, alquilocicloalquilsulfoxidilo, arilsulfoxidilo, aralquilsulfoxidilo, heterocicliilsulfoxidilo, heterocicliilalquilsulfoxidilo, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, cicloalquilsulfonilo, alquilocicloalquilsulfonilo, arilsulfonilo, aralquilsulfonilo, heterocicliilsulfonilo, heterocicliilalquilsulfonilo, y / o amino, heterocicliilo, heterocicliilo sustituido por uno o más de entre halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alquiltio, haloalquiltio, cicloalquiltio, alquilocicloalquiltio, ariltio, aralquiltio, heterocicliiltio, heterocicliiloalquiltio, alquilsulfoxidilo, haloalquilsulfoxidilo, cicloalquilsulfoxidilo, alquilocicloalquilsulfoxidilo, arilsulfoxidilo, aralquilsulfoxidilo, heterocicliilsulfoxidilo, heterocicliilalquilsulfoxidilo, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, cicloalquilsulfonilo, alquilocicloalquilsulfonilo, arilsulfonilo, aralquilsulfonilo, heterocicliilsulfonilo, heterocicliilalquilsulfonilo, hidroxilo y/o oxo, aralquilo y/o heterocicliilalquilo,

$R^6$  es haloalquilo, haloalcoxi, halógeno o  $-SF_5$ ,  $R^7$  es halógeno, alquilo o  $-NR^{17}R^{18}$ ,

- $R^{17}$  y  $R^{18}$  son independientemente uno de otros hidrógeno, alquilo  $C_1-C_6$ , alqueniolo  $C_2-C_6$  o alquiniolo  $C_2-C_6$ , estando los grupos  $R^{17}$  y/o  $R^{18}$  opcionalmente sustituidos por uno o más de entre halógeno, cicloalquilo- $C_3-C_7$ , arilo, heteroarilo, alcoxi- $C_1-C_6$  o haloalcoxi- $C_1-C_6$ , y n es 0, 1, o 2.

2. Compuesto según la reivindicación 1, donde W es  $=C(R^8)-$  y  $R^8$  es halógeno o haloalquilo o una sal del mismo aceptable como pesticida.

3. Compuesto según la reivindicación 2, donde  $R^8$  es cloro o flúor o una sal del mismo aceptable como pesticida.

4. Compuesto según la reivindicación 1, donde  $R^1$  es ciano, metilo, trifluorometil o  $-CS-NH_2$  o una sal del mismo aceptable como pesticida.

5. Compuesto según la reivindicación 4, donde  $R^1$  es  $-CN$  o  $-CS-NH_2$  o una sal del mismo aceptable como pesticida.

6. Compuesto según la reivindicación 1, donde  $R^1$  es haloalquilo- ( $C_1-C_3$ ), preferentemente cloro y  $-CF_3$  o una sal del mismo aceptable como pesticida.

7. Compuesto según la reivindicación 1, donde  $R^3$  es hidrógeno, alquilo, alqueniolo, alquiniolo, haloalquilo, haloalqueniolo o haloalqueniolo o una sal del mismo aceptable como pesticida.

8. Compuesto según la reivindicación 1 o una sal del mismo aceptable como pesticida, donde  $R^3$  es hidrógeno o alquil- ( $C_1-C_6$ ) sin sustituir o sustituido por uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, alcoxi- ( $C_1-C_6$ ), haloalcoxi- ( $C_1-C_6$ ), alqueniolo- ( $C_3-C_6$ ), haloalqueniolo- ( $C_3-C_6$ ), alquiniolo- ( $C_3-C_6$ ), haloalquiniolo- ( $C_3-C_6$ ), cicloalquil- ( $C_3-C_7$ ),  $S(O)_pR^{19}$ , CN,  $NO_2$ , OH,  $R^{20}$ ,  $R^{21}$ ,  $COR^{19}$ ,  $NR^{22}R^{23}$ ,  $OR^{19}$ ,  $COOH$  y  $CO_2R^{19}$ ,

donde  $R^{19}$  es alquil- ( $C_1-C_6$ ), haloalquil- ( $C_1-C_6$ ), cicloalquil- ( $C_3-C_7$ ), alquil- ( $C_1-C_4$ )-cicloalquil- ( $C_3-C_7$ ),  $-(CH_2)_qR^{20}$  o  $-(CH_2)_qR^{11}$ ,

$R^{20}$  es fenilo sin sustituir o sustituido por uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, alquil- ( $C_1-C_6$ ), haloalquil- ( $C_1-C_6$ ), alcoxi- ( $C_1-C_6$ ), haloalcoxi- ( $C_1-C_6$ ), CN,  $NO_2$ ,  $S(O)_pR^{19}$  y  $NR^{22}R^{23}$ ,

$R^{21}$  es heterocicliilo sin sustituir o sustituido por uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, alquil- ( $C_1-C_4$ ), haloalquil- ( $C_1-C_4$ ), alcoxi- ( $C_1-C_4$ ),  $S(O)_pR^{19}$ , OH y oxo,

$R^{22}$  y  $R^{23}$  son ambos independientemente hidrógeno, alquil- ( $C_1-C_6$ ), alqueniolo- ( $C_2-C_6$ ) o alquiniolo- ( $C_2-C_6$ ), donde los últimos tres grupos mencionados están no sustituidos o sustituidos por uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, cicloalquil- ( $C_3-C_7$ ),  $R^{20}$ ,  $R^{21}$ , alcoxi- ( $C_1-C_6$ ), haloalcoxi- ( $C_1-C_6$ ), y

n, p y q son cero, uno o dos.

9. Compuesto según la reivindicación 8, donde  $R^3$  es hidrógeno o alquil- ( $C_1-C_3$ ) o una sal del mismo aceptable como pesticida.

10. Compuesto según la reivindicación 1, donde  $R^4$  y  $R^5$  son independientemente uno de otro alqueniolo, alquiniolo, haloalqueniolo o haloalquiniolo o una sal del mismo aceptable como pesticida.

11. Compuesto según la reivindicación 1, donde  $R^4$  y  $R^5$  son independientemente uno de otros alqueniolo- ( $C_2-C_6$ ), haloalqueniolo- ( $C_2-C_6$ ), alquiniolo- ( $C_2-C_6$ ), haloalquiniolo- ( $C_2-C_6$ ), cicloalquil- ( $C_3-C_7$ ), cicloalquilo- ( $C_3-C_7$ )-alquil- ( $C_1-C_4$ ), o son independientemente uno de otros fenilo, heterocicliilo sin sustituir o sustituidos por uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, alcoxi- ( $C_1-C_6$ ), haloalcoxi- ( $C_1-C_6$ ), alqueniolo- ( $C_3-C_6$ ),

haloalqueniloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), alquiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquil -(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>), cicloalquiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>), S(O)<sub>p</sub>R<sup>19</sup>, CN, NO<sub>2</sub>, OH, R<sup>20</sup>, R<sup>21</sup>, COR<sup>19</sup>, NR<sup>22</sup>R<sup>23</sup>, OR<sup>19</sup>, COOH y CO<sub>2</sub>R<sup>19</sup>,

o son cada uno independientemente alquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) sin sustituir o sustituido por uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, alcoxi -(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alqueniloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), haloalqueniloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>),

5 alquiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquil -(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>), cicloalquiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>), S(O)<sub>p</sub>R<sup>19</sup>, CN, NO<sub>2</sub>, OH, R<sup>20</sup>, R<sup>21</sup>, COR<sup>19</sup>, NR<sup>22</sup>R<sup>23</sup>, COOH y CO<sub>2</sub>R<sup>19</sup>, o

R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> junto con el átomo de carbono unido pueden formar un anillo saturado con de cuatro a siete miembros o un anillo insaturado con de cinco a siete miembros, que opcionalmente contiene uno o más heteroátomos en el anillo seleccionados de entre O, S y N, estando el anillo sin sustituir o sustituido por uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, alquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquil -(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)y oxo, y si lo hay, cualquier átomo de nitrógeno adicional del anillo está sin sustituir o sustituido por un radical alquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), CO-alquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) o CH<sub>2</sub>R<sup>20</sup>; o que está condensado con un anillo de benceno, donde R<sup>19</sup>, R<sup>20</sup>, R<sup>21</sup>, R<sup>22</sup>, R<sup>23</sup> y p son tal como se definen en la reivindicación 8 o una sal del mismo aceptable como pesticida.

12. Compuesto según la reivindicación 1, donde R<sup>6</sup> es halógeno, alquil -(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), haloalquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)- o -SF<sub>5</sub>,  
15 preferentemente cloro o -CF<sub>3</sub> o una sal del mismo aceptable como pesticida

13. Compuesto según la reivindicación 1, donde R<sup>1</sup> y R<sup>8</sup> son halógeno o R<sup>1</sup> es -NR<sup>17</sup>R<sup>18</sup> o una sal del mismo aceptable como pesticida.

14. Compuesto según la reivindicación 1, donde

R<sup>1</sup> es -CN,

20 R<sup>7</sup> es halógeno, -CH<sub>3</sub> o -NR<sup>17</sup>R<sup>18</sup>,

R<sup>6</sup> es (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-haloalquil, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-haloalcoxi o -SF<sub>5</sub>,

R<sup>3</sup> es hidrógeno, alqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), haloalqueno -(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alquino-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquino-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquil -(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-alquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), o alquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) sin sustituir o sustituido por uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alqueniloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), haloalqueniloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), alquiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquil -(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>), cicloalquiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>), S(O)<sub>p</sub>R<sup>19</sup>, -CN, -NO<sub>2</sub>, OH, -R<sup>20</sup>, R<sup>21</sup>, -COR<sup>19</sup>, -NR<sup>22</sup>R<sup>23</sup>, -OR<sup>19</sup>, -COOH y -CO<sub>2</sub>R<sup>19</sup>,

25 R<sup>2</sup> es alquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquil -(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), haloalqueno -(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alquino-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)o haloalquino -(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>),

R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> son cada uno independientemente alqueno-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), haloalqueno -(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alquino-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquino -(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquil -(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-alquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), o son cada uno independientemente fenilo, heterociclilo sin sustituir o sustituidos por uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alqueniloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), haloalqueniloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), alquiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquil -(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>), cicloalquiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>), S(O)<sub>p</sub>R<sup>19</sup>, CN, NO<sub>2</sub>, OH, R<sup>20</sup>, R<sup>21</sup>, COR<sup>19</sup>, NR<sup>22</sup>R<sup>23</sup>, OR<sup>19</sup>, COOH y CO<sub>2</sub>R<sup>19</sup>, o son cada uno independientemente alquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) sin sustituir o sustituido por uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alqueniloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), haloalqueniloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), alquiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquil -(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>), cicloalcoxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>), S(O)<sub>p</sub>R<sup>19</sup>, CN, NO<sub>2</sub>, OH, R<sup>20</sup>, R<sup>21</sup>, COR<sup>19</sup>, NR<sup>22</sup>R<sup>23</sup>, COOH- y CO<sub>2</sub>R<sup>19</sup>, o

R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> junto con el átomo de carbono unido pueden formar un anillo saturado con de cuatro a siete miembros o un anillo insaturado con de cinco a siete miembros, que opcionalmente contiene uno o más heteroátomos en el anillo seleccionados de entre O, S y N, estando el anillo sin sustituir o sustituido por uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, alquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquil -(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)y oxo, y si lo hay, cualquier átomo de nitrógeno adicional del anillo está sin sustituir o sustituido por un radical alquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), CO-alquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) o CH<sub>2</sub>R<sup>20</sup> radical; o está condensado con un anillo de benceno,

R<sup>19</sup> es alquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquil -(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquil -(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>), alquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-cicloalquil -(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>), -(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>R<sup>20</sup> o - (CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>R<sup>21</sup>, R<sup>20</sup> es fenilo sin sustituir o sustituido por uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste de halógeno, alquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquil -(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), CN, NO<sub>2</sub>, S(O)<sub>p</sub>R<sup>19</sup> y NR<sup>22</sup>R<sup>23</sup>, R<sup>21</sup> es heterociclilo sin sustituir o sustituido por uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, alquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), haloalquil -(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), alcoxi -(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), S(O)<sub>p</sub>R<sup>19</sup>, OH y oxo,

R<sup>22</sup> y R<sup>23</sup> son cada uno independientemente hidrógeno, alquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alqueno-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) o alquino-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), estando los tres últimos grupos mencionados sin sustituir o sustituidos por uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, cicloalquil -(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>), R<sup>20</sup>, R<sup>21</sup>, alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), y

n y p y q son cada uno independientemente cero, uno o dos.

15. Compuesto según la reivindicación 1, donde:

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

R<sup>7</sup> y R<sup>8</sup> son Cl,

R<sup>6</sup> es CF<sub>3</sub>,

R<sup>3</sup> es hidrógeno o alquil - (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), y

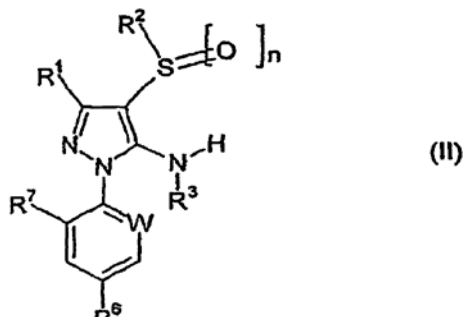
5 R<sup>2</sup> es CF<sub>3</sub>.

16. Compuesto según la reivindicación 1, donde:

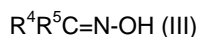
R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> son cada uno independientemente alqueniilo-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalqueniilo -(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), alquilo-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquiniilo - (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>), cicloalquilo-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-alquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), o son cada uno independientemente R<sup>20</sup>, R<sup>21</sup>, sin sustituir o sustituido por uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste de halógeno, alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>),  
 10 haloalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alqueniiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), haloalqueniiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), alquiniiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquiniiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquil - (C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>), S(O)<sub>p</sub>R<sup>19</sup>, CN, NO<sub>2</sub>, OH, R<sup>20</sup>, R<sup>21</sup>, COR<sup>19</sup>, NR<sup>22</sup>R<sup>23</sup>, OR<sup>19</sup>, COOH y CO<sub>2</sub>R<sup>19</sup>, o son cada uno independientemente alquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) sin sustituir o sustituido por uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, alcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalcoxi-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), alqueniiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), haloalqueniiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), alquiniiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquiniiloxi-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>), cicloalquil -(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>), S(O)<sub>p</sub>R<sup>19</sup>, CN, NO<sub>2</sub>, OH, R<sup>20</sup>, R<sup>21</sup>, COR<sup>19</sup>, NR<sup>22</sup>R<sup>23</sup>, OR<sup>19</sup>, COOH y  
 15 CO<sub>2</sub>R<sup>19</sup>,

R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> junto con el átomo de carbono al cual están ligados pueden formar un anillo saturado con cuatro a siete miembros o un ciclo insaturado con cinco a siete miembros, que opcionalmente contiene uno o más adicional heteroátomos en el anillo seleccionados de entre O, S y N, estando el anillo sin sustituir o sustituido por uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en halógeno, alquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), haloalquil -(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)y oxo, y si lo hay any  
 20 adicional anillo N átomo es sin sustituir o sustituido por a alquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), CO-alquil-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) o un radical CH<sub>2</sub>R<sup>20</sup>; o que está condensado con un anillo de benceno, donde R<sup>19</sup>, R<sup>20</sup>, R<sup>21</sup>, R<sup>22</sup>, R<sup>23</sup> y p son tal como se definen en la reivindicación 14.

17. Procedimiento para la preparación de un compuesto de fórmula I según la reivindicación 1, donde R<sup>1</sup> es ciano, halógeno, alquilo o haloalquilo y R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, W y n son tal como se definen en la reivindicación 1, que  
 25 comprende la etapa de reaccionar un compuesto de fórmula II:



donde R<sup>1</sup> es ciano, halógeno, alquilo o haloalquilo y R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, W y n son tal como se definen en la reivindicación 1, con un oxima de fórmula III, donde R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> son tal como se definen en la reivindicación 1



30 y un fosgeno o un precursor de fosgeno en presencia de una base.

18. Procedimiento para la preparación de un compuesto de fórmula I según la reivindicación 1, donde R<sup>1</sup> es -CSNH<sub>2</sub>, y R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, W y n son tal como se definen en la reivindicación 1, que comprende la etapa de reaccionar un compuesto de fórmula I, donde R<sup>1</sup> es CN, con sulfuros de hidrógeno metálicos alcalinos o alcalino-terreos en un disolvente inerte a una temperatura que va de -35°C a 50°C.

35 19. Procedimiento para la preparación de un compuesto de fórmula I según la reivindicación 1, donde R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> y W son tales como se definen en la reivindicación 1, y n es 1 o 2 y que comprende la oxidación de un compuesto de fórmula I, donde n es 0 o 1.

20. Composición pesticida que comprende como ingrediente activo al menos un compuesto de fórmula I según la reivindicación 1 o una sal del mismo aceptable como pesticida.

40 21. Composición pesticida según la reivindicación 20 que comprende diluyentes y/o portadores y/o agentes tensoactivos compatibles con dicho ingrediente activo.

22. Composición pesticida según la reivindicación 20 que es un medicamento veterinario y que está adaptado para su administración oral.
23. Utilización de un compuesto de fórmula I según la reivindicación 1 o una sal del mismo aceptable como pesticida en la preparación de un medicamento para el control de artrópodos, especialmente insectos o ácaros, o nematodos de planta.
24. Utilización de un compuesto de fórmula I según la reivindicación 1 o una sal del mismo aceptable como pesticida para la preparación de un agente de control de plagas, preferentemente de un insecticida y/o acaricida.
25. Utilización de un compuesto de fórmula I según la reivindicación 1 o de una sal del mismo aceptable como pesticida para la protección de plantas transgénicas contra plagas.
- 10 26. Utilización de un compuesto de fórmula I según la reivindicación 1 o de una sal del mismo aceptable como pesticida en la preparación de un medicamento para el control de artrópodos y/o helmintos en vertebrados, preferentemente en animales domésticos.
- 15 27. Procedimiento para controlar plagas en un lugar que comprende aplicar a este una cantidad efectiva de un compuesto de fórmula I o una sal del mismo aceptable como pesticida como el reivindicado en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 16, donde el lugar es la propia plaga, el suelo, un producto almacenado, un cultivo, un lugar de crecimiento de cultivo, bienes domésticos, una propiedad o zona del medio ambiente.
28. Compuesto de fórmula I según la reivindicación 1 o una sal del mismo aceptable como pesticida para su uso en el control de artrópodos y/o helmintos.