

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 380 051**

51 Int. Cl.:
C07D 233/50 (2006.01)
C07D 263/28 (2006.01)
C07D 277/18 (2006.01)
A61K 31/427 (2006.01)
A01N 43/78 (2006.01)
A61P 33/00 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- 96 Número de solicitud europea: **06819493 .5**
96 Fecha de presentación: **15.11.2006**
97 Número de publicación de la solicitud: **1960369**
97 Fecha de publicación de la solicitud: **27.08.2008**

54 Título: **Compuestos de indanilo y tetrahidronaftil-amino-azolina para combatir plagas animales**

30 Prioridad:
25.11.2005 US 739730 P

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:
08.05.2012

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:
08.05.2012

73 Titular/es:
BASF SE
67056 Ludwigshafen , DE

72 Inventor/es:
KORDES, Markus;
KORADIN, Christopher y
CULBERTSON, Deborah L.

74 Agente/Representante:
Carvajal y Urquijo, Isabel

ES 2 380 051 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

Compuestos de indanilo y tetrahidronaftil-amino-azolina para combatir plagas animales.

5 La presente invención se relaciona con compuestos de indanil- o tetrahidronaftil-amino-azolina, que son útiles para combatir plagas animales. La presente invención también se relaciona con métodos para combatir plagas animales y composiciones agrícolas para combatir plagas animales.

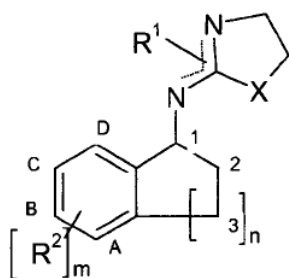
10 Las plagas animales y en particular los insectos, arácnidos y nematodos destruyen los cultivos en crecimiento y recolectados y atacan estructuras de madera y estructuras comerciales, produciendo pérdidas económicas grandes en el suministro de alimentos y a la propiedad. Mientras se conoce un gran número de agentes pesticidas, debido a la capacidad de las plagas objetivo para desarrollar resistencia a dichos agentes, hay una necesidad permanente por nuevos agentes para combatir insectos, arácnidos y nematodos.

Los compuestos similares a los de la fórmula I han sido descritos en DE-A1963192.

Sin embargo, estos compuestos descritos en DE-A1963192 están limitados en su actividad o con respecto a la amplitud de su espectro de actividad.

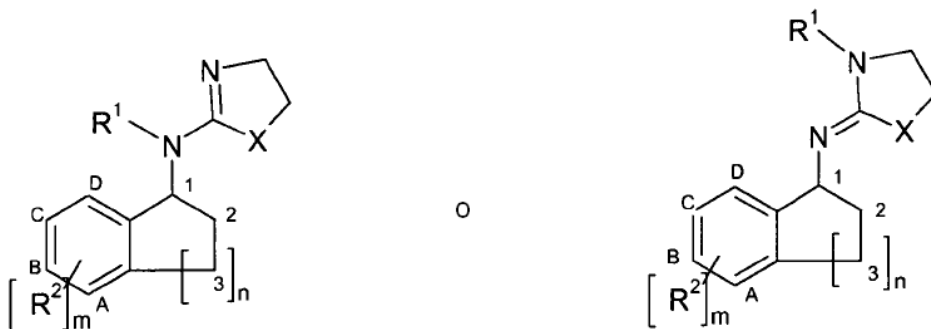
15 Por lo tanto es un objetivo de la presente invención proveer compuestos que tengan una buena actividad pesticida y que muestren un espectro de actividad amplio contra un gran número de diferentes plagas animales, especialmente contra insectos, arácnidos y nematodos difíciles de controlar.

Se ha encontrado que estos objetivos pueden lograrse mediante compuestos indanil- o tetrahidronaftil-amino-azolina de la fórmula I:



fórmula I;

20 que también están representadas por las dos siguientes fórmulas isoméricas



y en donde

n es 1 o 2;

m es 1,2,3 o 4, en donde cuando m es mayor que 1, los radicales R² pueden tener el mismo o diferentes significados

25 X es O, NR³, en donde

R³ es seleccionado de hidrógeno, ciano, nitro, formilo, C(=O)R^{3c}, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquino, C₃-C₈-cicloalquilo, C₁-C₆-alcoxi C₂-C₆-alquilamino, di(C₂-C₆-alquil)amino, (C₁-C₆-alcoxi)metileno, C₁-C₆-alquilsulfenilo, C₁-C₆-alquilsulfenilo o C₁-C₆-alquilsulfonilo en donde los átomos de carbono en los radicales alifáticos de los grupos antes mencionados pueden portar cualquier combinación de 1, 2 o 3 radicales, independientemente uno de otro
30 seleccionados del grupo consistente de halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, mercapto, amino, carboxilo, C₁-C₆-alquilo, C₁-

C₆-alcoxi, C₂-C₆-alqueniloxi, C₂-C₆-alquiniloxi, C₁-C₆-haloalcoxi y C₁-C₆-alquiltio, o C(O)NR^{3a}R^{3b}, (SO₂)NR^{3a}R^{3b}, fenilo, feniloxi o bencilo, cada uno de los tres radicales mencionados puede estar no sustituido o sustituido con 1 a 5 radicales, independientemente uno de otro seleccionados del grupo consistente de halógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-haloalquiltio, C₁-C₆-alcoxi y C₁-C₆-haloalcoxi radicales; y en donde

5 R^{3a} y R^{3b} son seleccionados cada uno independientemente de, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₂-C₆-alquenilo, o C₂-C₆-alquinilo.

10 R^{3c} es seleccionado de hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-alcoxi, (C₁-C₆-alquil)amino, di(C₁-C₆-alquil)amino, fenilo y heteroarilo, el cual puede ser un anillo heteroaromático, mono o bicíclico de 5 a 10 miembros, que contiene 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados de O, S y N

15 R¹ es seleccionado de hidrógeno, ciano, nitro, formilo, C(=O)R^{1c}, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, (C₁-C₆-alcoxi)metilen, C₁-C₆-alquilsulfonilo, C₁-C₆-alquilsulfenilo o C₁-C₆-alquilsulfonilo en donde los átomos de carbono en los radicales alifáticos de los grupos antes mencionados pueden portar cualquier combinación de 1, 2 o 3 radicales, independientemente uno de otro seleccionados del grupo consistente de halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, mercapto, amino, carboxilo, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alqueniloxi, C₁-C₆-alquiniloxi, C₁-C₆-haloalcoxi y C₁-C₆-alquiltio, o C(O)NR^{1a}R^{1b}, (SO₂)NR^{1a}R^{1b}, fenilo, feniloxi o bencilo, cada uno de los tres radicales mencionados puede estar no sustituido o sustituido con 1 a 5 radicales, independientemente uno de otro seleccionados del grupo consistente de halógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-haloalquiltio, C₁-C₆-alcoxi y C₁-C₆-haloalcoxi; y en donde

20 R^{1a} y R^{1b} son seleccionados cada uno independientemente de, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₂-C₆-alquenilo, o C₂-C₆-alquinilo.

25 R^{1c} es seleccionado de hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-alcoxi, (C₁-C₆-alquil)amino, di(C₁-C₆-alquil)amino, fenilo y heteroarilo, el cual puede ser un anillo heteroaromático, mono o bicíclico de 5 a 10 miembros, que contiene 1,2,3 o 4 heteroátomos seleccionados de O, S y N

R² es seleccionado de halógeno, C(C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₃-C₈-cicloalquil

donde el radical puede ser no sustituido, parcial o completamente halogenado.

o los enantiómeros y/o las sales aceptables desde el punto de vista agrícola y/o veterinario de los mismos; con la condición de que el compuesto de la fórmula I no sea 2-(4-tio-tert-butil-1-indanilamino)-oxazolina.

30 Por lo tanto, la presente invención se relaciona con compuestos de indanil- o tetrahidronaftil-amino-azolina de la fórmula I, o sus enantiómeros, y con las sales aceptables desde el punto de vista agrícola o veterinario de las mismas. Estos compuestos tienen una alta actividad pesticida y son activos contra un espectro de plagas animales, especialmente contra insectos, arácnidos y nematodos.

35 La invención también se relaciona con un método para combatir plagas animales, especialmente insectos, arácnidos y nematodos, que comprende poner en contacto las plagas animales, su hábitat, sus terrenos de crianza, sus suministros de alimentos, plantas, semillas, suelo, áreas, materiales o ambientes en los cuales las plagas animales crecen o pueden crecer, o los materiales, plantas, semillas, suelos, superficies o espacios que van a ser protegidos de un ataque o infestación por las plagas animales, especialmente insectos, arácnidos o nematodos, con una cantidad efectiva como pesticida de al menos un compuesto de indanil- o tetrahidronaftil-amino-azolina de la fórmula I y/o al menos una sal de los mismos aceptable desde el punto de vista agrícola.

Adicionalmente, la presente invención proporciona un método para proteger cultivos del ataque o infestación por plagas animales, especialmente insectos, arácnidos o nematodos, que comprende poner en contacto un cultivo con una cantidad efectiva como pesticida de al menos un compuesto de indanil- o tetrahidronaftil-amino-azolina de la fórmula I y/o al menos una sal del mismo.

45 Adicionalmente, la invención se relaciona con composiciones agrícolas, preferiblemente en la forma de soluciones, emulsiones, dispersiones oleosas de pastas, polvos, materiales para dispersión, pulverizables o en la forma de gránulos, directamente asperjables, que comprenden al menos un compuesto de indanil- o tetrahidronaftil-amino-azolina de la fórmula I tal como se define anteriormente o una sal del mismo, mezclado con uno o más vehículos inertes, sólidos o líquidos aceptables desde el punto de vista agronómico y, si se desea, al menos un surfactante.

50 La indanil- o tetrahidronaftil-amino-azolina ha sido descrita para uso farmacológico en la técnica convencional.

Wong. W. C et al, divulga una síntesis conveniente de 2-amino-2-oxazolininas y su evaluación farmacológica en receptores alfa-adrenérgicos humanos clonados (Bioorg. & Med. Chem. Lett, 4(19), 1994, p. 1217-22).

La degradación hidrolítica de los compuestos de oxametazolina está discutida por Yamana, T. et al. (Yakuzaigaku (1967), 27(3). P. 203-5)

5 En la US 3,296,077, la presencia de compuestos de 2-(1-tetrahidronaftilo amino)-imidazolinas puede encontrarse en composiciones de afeitado. Los compuestos de 2-(1-Tetrahidronaftilo amino)-imidazolina también están descritos por sus efectos simpatomiméticos en Nippon Yakurigaku Zasshi (1965), 61 (6), p. 479-89 por sus efectos vasoconstrictores en la US 4,520,014 o por su eficiencia en las composiciones nasales en Arzneimittelforschung 1962,12, p. 975-8.

10 Las US 2,883,410, US 2,870,161 y US 2,870,159 describen agentes de 2-(1-indanilamino)-oxazolinas como tranquilizantes en composiciones farmacéuticas, donde primero ambas describen 2-(4-tio-tert-butil-1-indanilamino)-oxazolina. La US 2,956,072 describe 2-(1-Tetrahidronaftilo amino)-oxazolinas para el mismo propósito.

Los derivados 2-(1-tetrahidronaftil amino) o derivados 2-(1-indanil amino) que tienen una sustitución tiazolina, oxazolina o imidazolina pueden encontrarse en US 3,636,219 y US 3,679,798, donde se describen por su efecto anticolinérgico.

15 Las aril-amino-oxazolinas o las aril-amino-tiazolinas han sido discutidas como pesticidas en DE-A 1 963 192 o en cuanto a protección de cultivos en DE-B 1 954 584.

20 En ninguno de los dos últimos documentos discute derivados, que revelen que las indanil- o tetrahidronaftil-amino-azolinas tengan un esquema de sustitución comparable, donde la parte aromática del sistema de anillo indanilo o tetrahidronaftilo sea sustituida. Preferiblemente la indanil- o tetrahidronaftil-amino-azolina es sustituida en las posiciones A y/o C y/o D. Preferiblemente la parte no condensada del sistema de anillo indanilo o tetrahidronaftilo permanece sin sustitución así como el anillo de azolina permanece sin sustitución.

25 Los compuestos de la fórmula I pueden tener uno o más centros de quiralidad, en cuyo caso están presentes como mezclas de estereoisómeros, tales como enantiómeros o diastereómeros. La presente invención proporciona tanto los estereoisómeros puros, por ejemplo los enantiómeros o diastereómeros puros, y mezclas de los mismos. Los compuestos de la fórmula I también pueden existir en la forma de tautómeros diferentes. La invención comprende los tautómeros individuales, si son separables, así como las mezclas de tautómeros.

Las sales de los compuestos de la fórmula I que son adecuadas para el uso de acuerdo con la invención son especialmente sales aceptables desde el punto de vista agrícola. Pueden formarse por métodos habituales, por ejemplo, haciendo reaccionar el compuesto con un ácido del anión en cuestión si el compuesto de la fórmula I tiene una funcionalidad básica o haciendo reaccionar un compuesto ácido de la fórmula I con una base adecuada.

30 Sales útiles adecuadas desde el punto de vista agrícola son especialmente sales de aquellos cationes o las sales de adición ácida de aquellos ácidos cuyos cationes y aniones, respectivamente, no tienen ningún efecto adverso sobre la acción de los compuestos de acuerdo con la presente invención. Cationes adecuados son en particular los iones de los metales alcalinos, preferiblemente litio, sodio y potasio, de los metales alcalinotérreos, preferiblemente calcio, magnesio y bario, y de los metales de transición, preferiblemente manganeso, cobre, zinc y hierro, y también amonio (NH_4^+) y amonio sustituido en los cuales 1 a 4 de los átomos de hidrógeno, están remplazados por C1-C4-alquilo, C1-C4-hidroalquilo, C1-C4-alcoxi, C1-C4-alcoxi-C1-C4-alquilo, hidroxil-C1-C4-alcoxi-C1-C4-alquilo, fenilo y/o bencilo.

40 Ejemplos de iones amonios sustituidos comprenden metilamonio, isopropilamonio, dimetilamonio, diisopropilamonio, trimetilamonio, tetrametilamonio, tetraetilamonio, tetrabutilamonio, 2-hidroxi-etilamonio, 2-(2-hidroxi-etoxi)etilamonio, bis(2-hidroxi-etil)amonio, benziltrimetilamonio y benziltrietilamonio, adicionalmente iones fosfonio, iones sulfonio, preferiblemente tri(C1-C4-alquil)sulfonio, y iones sulfoxonio, preferiblemente tri(C1-C4-alquil)sulfoxonio.

45 Los aniones de sales de adición ácida útiles son primariamente cloruro, bromuro, fluoruro, hidrógeno sulfato, sulfato, dihidrógeno fosfato, hidrógeno fosfato, fosfato, nitrato, hidrógeno carbonato, carbonato, hexafluorosilicato, hexafluoro fosfato, benzoato y los aniones de ácidos alcanóicos C1-C4, preferiblemente formiato, acetato, propionato y butirato. Pueden formarse haciendo reaccionar un compuesto de la fórmula I con un ácido del anión correspondiente, preferiblemente de ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico o ácido nítrico.

Las unidades estructurales orgánicas mencionadas en las definiciones anteriores de las variables son - como el término halógeno - términos colectivos para listados individuales de los miembros del grupo individual. Los prefijos $\text{C}_n\text{-C}_m$ indican en cada caso un número posible de átomos de carbono en el grupo.

50 El término halógeno denota en cada caso flúor, bromo, cloro o yodo, en particular flúor, cloro o bromo.

Ejemplos de otros significados son

El término "C₁-C₆-alquil" tal como se usa aquí y en las unidades estructurales de C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-alquilamino, di(C₁-C₆-alquil)amino, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-alquilsulfonilo, C₁-C₆-alquilsulfoxilo, C₁-C₆-alquilcarbonilo, C₁-C₆-alcoxycarbonilo, C₁-C₆-alquiltiocarbonilo, y C₁-C₆-alquilcarboniloxi se refiere a un grupo hidrocarburo saturado de

cadena recta o ramificada que tiene 1 a 6 átomos de carbono, especialmente 1 a 4 átomos de carbono, por ejemplo metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, butilo, 1-metilpropilo, 2-metilpropilo, 1,1-dimetiletilo, pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-dimetilpropilo, 1-etilpropilo, hexilo, 1,1-dimetilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, 1-metilpentilo, 2-metilpentilo, 3-metilpentilo, 4-metilpentilo, 1,1-dimetilbutilo, 1,2-dimetilbutilo, 1,3-dimetilbutilo, 2,2-dimetilbutilo, 2,3-dimetilbutilo, 3,3-dimetilbutilo, 1-etilbutilo, 2-etilbutilo, 1,1,2-trimetilpropilo, 1,2,2-trimetilpropilo, 1-etil-1-metilpropilo, 1-etil-2-metilpropilo, heptilo, octilo, 2-etilhexilo, nonilo y decilo y sus isómeros. C1-C4-alquilo significa por ejemplo metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, butilo, 1-metilpropilo, 2-metilpropilo o 1,1-dimetiletilo.

El término "C₁-C₆-haloalquil" tal como se usa aquí se refiere a un grupo alquilo saturado de cadena recta o ramificada que tiene 1 a 6 átomos de carbono (como se mencionó anteriormente), donde alguno o todos los átomos de hidrógeno en estos grupos pueden ser reemplazados por átomos de halógeno como se mencionó anteriormente, por ejemplo C1-C4-haloalquilo, tales como clorometilo, bromometilo, diclorometilo, triclorometilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorofluorometilo, diclorofluorometilo, clorodifluorometilo, 1-cloroetilo, 1-bromoetilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2-cloro-2-fluoroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 2,2-dicloro-2-fluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, pentafluoroetil y similares.

El término "C₁-C₆-alcoxi" tal como se usa aquí se refiere a un grupo alquilo saturado de cadena recta o ramificada que tiene 1 a 6 átomos de carbono (como se mencionó anteriormente) el cual está enlazado a través de un átomo de oxígeno. Ejemplos incluyen C₁-C₆-alcoxi tales como metoxi, etoxi, OCH₂-C₂H₅, OCH(CH₃)₂, n-butoxi, OCH(CH₃)-C₂H₅, OCH₂-CH(CH₃)₂, OC(CH₃)₃, n-pentoxi, 1-metilbutoxi, 2-metilbutoxi, 3-metilbutoxi, 1,1-dimetilpropoxi, 1,2-dimetilpropoxi, 2,2-dimetil-propoxi, 1-etilpropoxi, n-hexoxi, 1-metilpentoxi, 2-metilpentoxi, 3-metilpentoxi, 4-metilpentoxi, 1,1-dimetilbutoxi, 1,2-dimetilbutoxi, 1,3-dimetilbutoxi, 2,2-dimetilbutoxi, 2,3-dimetilbutoxi, 3,3-dimetilbutoxi, 1-etilbutoxi, 2-etilbutoxi, 1,1,2-trimetilpropoxi, 1,2,2-trimetilpropoxi, 1-etil-1-metilpropoxi, 1-etil-2-metilpropoxi y similares.

El término "C₁-C₆-haloalcoxi" tal como se usa aquí se refiere a un grupo C₁-C₆-alcoxi como se mencionó anteriormente en donde los átomos de hidrógeno están parcial o completamente sustituidos por flúor, cloro, bromo y/o yodo, i.e., por ejemplo,

C₁-C₆-haloalcoxi tales como clorometoxi, diclorometoxi, triclorometoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, clorofluorometoxi, diclorofluorometoxi, clorodifluorometoxi, 2-fluoroetoxi, 2-cloroetoxi, 2-bromoetoxi, 2-iodoetoxi, 2,2-difluoroetoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2-fluoroetoxi, 2-cloro-2,2-difluoroetoxi, 2,2-dicloro-2-fluoroetoxi, 2,2,2-tricloroetoxi, pentafluoroetoxi, 2-fluoropropoxi, 3-fluoropropoxi, 2,2-difluoropropoxi, 2,3-difluoropropoxi, 2-cloropropoxi, 3-cloropropoxi, 2,3-dicloropropoxi, 2-bromopropoxi, 3-bromopropoxi, 3,3,3-trifluoropropoxi, 3,3,3-tricloropropoxi, 2,2,3,3,3-pentafluoropropoxi, heptafluoropropoxi, 1-(fluorometil)-2-fluoroetoxi, 1-(clorometil)-2-cloroetoxi, 1-(bromometil)-2-bromoetoxi, 4-fluorobutoxi, 4-clorobutoxi, 4-bromobutoxi, nonafluorobutoxi, 5-fluoro-1-pentoxi, 5-cloro-1-pentoxi, 5-bromo-1-pentoxi, 5-iodo-1-pentoxi, 5,5,5-tricloro-1-pentoxi, undecafluoropentoxi, 6-fluoro-1-hexoxi, 6-cloro-1-hexoxi, 6-bromo-1-hexoxi, 6-iodo-1-hexoxi, 6,6,6-tricloro-1-hexoxi o dodecafluorohexoxi, en particular clorometoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, 2-fluoroetoxi, 2-cloroetoxi o 2,2,2-trifluoroetoxi.

El término "C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alquil" tal como se usa aquí se refiere a C₁-C₆-alquil en donde 1 átomo de carbono porta un radical C₁-C₆-alcoxi como se mencionó anteriormente. Ejemplos son CH₂-OCH₃, CH₂-OC₂H₅, n-propoximetilo, CH₂-OCH(CH₃)₂, n-butoximetilo, (1-metilpropoxi)metilo, (2-metilpropoxi)metilo, CH₂-OC(CH₃)₃, 2-(metoxi)etilo, 2-(etoxi)etilo, 2-(n-propoxi)etilo, 2-(1-metiletoxi)etilo, 2-(n-butoxi)etilo, 2-(1-metilpropoxi)etilo, 2-(2-metilpropoxi)etilo, 2-(1,1-dimetiletoxi)etilo, 2-(metoxi)propilo, 2-(etoxi)propilo, 2-(n-propoxi)propilo, 2-(1-metiletoxi)propilo, 2-(n-butoxi)propilo, 2-(1-metilpropoxi)propilo, 2-(2-metilpropoxi)propilo, 2-(1,1-dimetiletoxi)propilo, 3-(metoxi)propilo, 3-(etoxi)propilo, 3-(n-propoxi)propilo, 3-(1-metiletoxi)propilo, 3-(n-butoxi)propilo, 3-(1-metilpropoxi)propilo, 3-(2-metilpropoxi)propilo, 3-(1,1-dimetiletoxi)propilo, 2-(metoxi)butilo, 2-(etoxi)butilo, 2-(n-propoxi)butilo, 2-(1-metiletoxi)butilo, 2-(n-butoxi)butilo, 2-(1-metilpropoxi)butilo, 2-(2-metilpropoxi)butilo, 2-(1,1-dimetiletoxi)butilo, 3-(metoxi)butilo, 3-(etoxi)butilo, 3-(n-propoxi)butilo, 3-(1-metiletoxi)butilo, 3-(n-butoxi)butilo, 3-(1-metilpropoxi)butilo, 3-(2-metilpropoxi)butilo, 3-(1,1-dimetiletoxi)butilo, 4-(metoxi)butilo, 4-(etoxi)butilo, 4-(n-propoxi)butilo, 4-(1-metiletoxi)butilo, 4-(n-butoxi)butilo, 4-(1-metilpropoxi)butilo, 4-(2-metilpropoxi)butilo, 4-(1,1-dimetiletoxi)butilo y similares.

El término "(C₁-C₆-alquil)carbonilo" tal como se usa aquí se refiere a un grupo alquilo saturado de cadena recta o ramificada que tiene 1 a 6 átomos de carbono (como se mencionó anteriormente) enlazado a través del átomo de carbono del grupo carbonilo en el grupo alquilo. Ejemplos incluyen C₁-C₆-alquilcarbonilo tal como CO-CH₃, CO-C₂H₅, n-propilcarbonilo, 1-metiletilcarbonilo, n-butilcarbonilo, 1-metilpropilcarbonilo, 2-metilpropilcarbonilo, 1,1-dimetiletilcarbonilo, n-pentilcarbonilo, 1-metilbutilcarbonilo, 2-metilbutilcarbonilo, 3-metilbutilcarbonilo, 1,1-dimetilpropilcarbonilo, 1,2-dimetilpropilcarbonilo, 2,2-dimetilpropilcarbonilo, 1-etilpropilcarbonilo, n-hexilcarbonilo, 1-metilpentilcarbonilo, 2-metilpentilcarbonilo, 3-metilpentilcarbonilo, 4-metilpentilcarbonilo, 1,1-dimetilbutilcarbonilo, 1,2-dimetilbutilcarbonilo, 1,3-dimetilbutilcarbonilo, 2,2-dimetilbutilcarbonilo, 2,3-dimetilbutilcarbonilo, 3,3-dimetilbutilcarbonilo, 1-etilbutilcarbonilo, 2-etilbutilcarbonilo, 1,1,2-trimetilpropilcarbonilo, 1,2,2-trimetilpropilcarbonilo, 1-etil-1-metilpropilcarbonilo o 1-etil-2-metilpropilcarbonilo y similares.

El término "(C₁-C₆-alcoxi)carbonilo" tal como se usa aquí se refiere a un grupo alcoxi de cadena recta o ramificada (como se mencionó anteriormente) que tiene de 1 a 6 átomos de carbono enlazados a través del átomo de carbono

del grupo carbonilo, por ejemplo COOCH_3 , $\text{CO-OC}_2\text{H}_5$, $\text{CO-CH}_2\text{-C}_2\text{H}_5$, $\text{CO-OCH(CH}_3)_2$, n-butoxicarbonilo, $\text{CO-OCH(CH}_3)_2\text{-C}_2\text{H}_5$, $\text{CO-OCH}_2\text{-CH(CH}_3)_2$, $\text{CO-OC(CH}_3)_3$, n-pentoxicarbonilo, 1-metilbutoxicarbonilo, 2-metilbutoxicarbonilo, 3-metilbutoxicarbonilo, 2,2-dimetilpropoxicarbonilo, 1-etilpropoxicarbonilo, n-hexoxicarbonilo, 1,1-dimetilpropoxicarbonilo, 1,2-dimetilpropoxicarbonilo, 1-metilpentoxicarbonilo, 2-metilpentoxicarbonilo, 3-metilpentoxicarbonilo, 4-metilpentoxicarbonilo, 1,1-dimetilbutoxicarbonilo, 1,2-dimetilbutoxicarbonilo, 1,3-dimetilbutoxicarbonilo, 2,2-dimetilbutoxicarbonilo, 2,3-dimetilbutoxicarbonilo, 3,3-dimetilbutoxicarbonilo, 1-etilbutoxicarbonilo, 2-etilbutoxicarbonilo, 1,1,2-trimetilpropoxicarbonilo, 1,2,2-trimetilpropoxicarbonilo, 1-etil-1-metilpropoxicarbonilo o 1-etil-2-metilpropoxicarbonilo.

El término "(C₁-C₆-alquil)carboniloxi" tal como se usa aquí se refiere a un grupo alquilo saturado de cadena recta o ramificada que tiene 1 a 6 átomos de carbono (como se mencionó anteriormente) enlazado a través del átomo de carbono del grupo carboniloxi a cualquier enlace en el grupo alquilo, por ejemplo O-CO-CH_3 , $\text{O-CO-C}_2\text{H}_5$, n-propilcarboniloxi, 1-metiletilcarboniloxi, n-butilcarboniloxi, 1-metilpropilcarboniloxi, 2-metilpropilcarboniloxi, 1,1-dimetiletilcarboniloxi, n-pentilcarboniloxi, 1-metilbutilcarboniloxi, 2-metilbutilcarboniloxi, 3-metilbutilcarboniloxi, 1,1-dimetilpropilcarboniloxi o 1,2-dimetilpropilcarboniloxi.

El término "C₁-C₆-alquiltio (C₁-C₆-alquilsulfanilo: C₁-C₆-alquil-S-)" tal como se usa aquí se refiere a un grupo alquilo saturado de cadena recta o ramificada que tiene 1 a 6 átomos de carbono (como se mencionó anteriormente) el cual está enlazado a través de un átomo de azufre, por ejemplo C₁-C₄-alquiltio tal como metiltio, etiltio, propiltio, 1-metileiltio, butiltio, 1-metilpropiltio, 2-metilpropiltio, 1,1-dimetileiltio, n-pentiltiocarbonilo, 1-metilbutiltio, 2-metilbutiltio, 3-metilbutiltio, 2,2-dimetilpropiltio, 1-etilpropiltio, n-hexiltio, 1,1-dimetilpropiltio, 1,2-dimetilpropiltio, 1-metilpentiltio, 2-metilpentiltio, 3-metilpentiltio, 4-metilpentiltio, 1,1-dimetilbutiltio, 1,2-dimetilbutiltio, 1,3-dimetilbutiltio, 2,2-dimetilbutiltio, 2,3-dimetilbutiltio, 3,3-dimetilbutiltio, 1-etilbutiltio, 2-etilbutiltio, 1,1,2-trimetilpropiltio, 1,2,2-trimetilpropiltio, 1-etil-1-metilpropiltio o 1-etil-2-metilpropiltio.

El término "(C₁-C₆-alquiltio)carbonilo" tal como se usa aquí se refiere a un grupo alquiltio de cadena recta o ramificada (como se mencionó anteriormente) que tiene de 1 a 6 átomos de carbono enlazados a través del átomo de carbono del grupo carbonilo. Ejemplos incluyen CO-SCH_3 , $\text{CO-SC}_2\text{H}_5$, $\text{CO-SCH}_2\text{-C}_2\text{H}_5$, $\text{CO-SCH(CH}_3)_2$, n-butiltiocarbonilo, $\text{CO-SCH(CH}_3)_2\text{-C}_2\text{H}_5$, $\text{CO-SCH}_2\text{-CH(CH}_3)_2$, $\text{CO-SC(CH}_3)_3$, n-pentiltiocarbonilo, 1-metilbutiltiocarbonilo, 2-metilbutiltiocarbonilo, 3-metilbutiltiocarbonilo, 2,2-dimetilpropiltiocarbonilo, 1-etilpropiltiocarbonilo, n-hexiltiocarbonilo, 1,1-dimetilpropiltiocarbonilo, 1,2-dimetilpropiltiocarbonilo, 1-metilpentiltiocarbonilo, 2-metilpentiltiocarbonilo, 3-metilpentiltiocarbonilo, 4-metilpentiltiocarbonilo, 1,1-dimetilbutiltiocarbonilo, 1,2-dimetilbutiltiocarbonilo, 1,3-dimetilbutiltiocarbonilo, 2,2-dimetilbutiltiocarbonilo, 2,3-dimetilbutiltiocarbonilo, 3,3-dimetilbutiltiocarbonilo, 1-etilbutiltiocarbonilo, 2-etilbutiltiocarbonilo, 1,1,2-trimetilpropiltiocarbonilo, 1,2,2-trimetilpropiltiocarbonilo, 1-etil-1-metilpropiltiocarbonilo o 1-etil-2-metilpropiltiocarbonilo.

El término "C₁-C₆-alquilsulfonilo" (C₁-C₆-alquilsulfoxilo: C₁-C₆-alquil-S(=O)-), tal como se usa aquí se refiere a un grupo hidrocarburo saturado de cadena recta o ramificada (como se mencionó anteriormente) que tiene de 1 a 6 átomos de carbono enlazados a través del átomo de azufre del grupo sulfonilo a cualquier enlace del grupo alquilo, por ejemplo SO-CH_3 , $\text{SO-C}_2\text{H}_5$, n-propilsulfonilo, 1-metiletilsulfonilo, n-butilsulfonilo, 1-metilpropilsulfonilo, 2-metilpropilsulfonilo, 1,1-dimetiletilsulfonilo, n-pentilsulfonilo, 1-metilbutilsulfonilo, 2-metilbutilsulfonilo, 3-metilbutilsulfonilo, 1,1-dimetilpropilsulfonilo, 1,2-dimetilpropilsulfonilo, 2,2-dimetilpropilsulfonilo, 1-etilpropilsulfonilo, n-hexilsulfonilo, 1-metilpentilsulfonilo, 2-metilpentilsulfonilo, 3-metilpentilsulfonilo, 4-metilpentilsulfonilo, 1,1-dimetilbutilsulfonilo, 1,2-dimetilbutilsulfonilo, 1,3-dimetilbutilsulfonilo, 2,2-dimetilbutilsulfonilo, 2,3-dimetilbutilsulfonilo, 3,3-dimetilbutilsulfonilo, 1-etilbutilsulfonilo, 2-etilbutilsulfonilo, 1,1,2-trimetilpropilsulfonilo, 1,2,2-trimetilpropilsulfonilo, 1-etil-1-metilpropilsulfonilo o 1-etil-2-metilpropilsulfonilo.

El término "C₁-C₆-alquilamino" se refiere a un grupo amino secundario que porta un grupo alquilo como se definió anteriormente, e.g. metilamino, etilamino, propilamino, 1-metiletilamino, butilamino, 1-metilpropilamino, 2-metilpropilamino, 1,1-dimetiletilamino, pentilamino, 1-metilbutilamino, 2-metilbutilamino, 3-metilbutilamino, 2,2-dimetilpropilamino, 1-etilpropilamino, hexilamino, 1,1-dimetilpropilamino, 1,2-dimetilpropilamino, 1-metilpentilamino, 2-metilpentilamino, 3-metilpentilamino, 4-metilpentilamino, 1,1-dimetilbutilamino, 1,2-dimetilbutilamino, 1,3-dimetilbutilamino, 2,2-dimetilbutilamino, 2,3-dimetilbutilamino, 3,3-dimetilbutilamino, 1-etilbutilamino, 2-etilbutilamino, 1,1,2-trimetilpropilamino, 1,2,2-trimetilpropilamino, 1-etil-1-metilpropilamino o 1-etil-2-metilpropilamino.

El término "di(C₁-C₆-alquil)amino" se refiere a un grupo amino terciario que porta dos radicales alquilo como se definió más arriba, e.g. dimetilamino, dietilamino, di-n-propilamino, diisopropilamino, N-etil-N-metilamino, N-(n-propil)-N-metilamino, N-(isopropil)-N-metilamino, N-(n-butil)-N-metilamino, N-(n-pentil)-N-metilamino, N-(2-butil)-N-metilamino, N-(isobutil)-N-metilamino, N-(n-pentil)-N-metilamino, N-(n-propil)-N-etilamino, N-(isopropil)-N-etilamino, N-(n-butil)-N-etilamino, N-(n-pentil)-N-etilamino, N-(2-butil)-N-etilamino, N-(isobutil)-N-etilamino o N-(n-pentil)-N-etilamino.

El término "C₁-C₆-alquilsulfonilo" (C₁-C₆-alquil-S(=O)₂-) tal como se usa aquí se refiere a un grupo alquilo saturado de cadena recta o ramificada que tiene 1 a 6 átomos de carbono (como se mencionó anteriormente) el cual está enlazado a través del átomo de azufre del grupo sulfonilo a cualquier enlace en el grupo alquilo, por ejemplo $\text{SO}_2\text{-CH}_3$, $\text{SO}_2\text{-C}_2\text{H}_5$, n-propilsulfonilo, $\text{SO}_2\text{-CH(CH}_3)_2$, nbutilsulfonilo, 1-metilpropilsulfonilo, 2-metilpropilsulfonilo, $\text{SO}_2\text{-}$

C(CH₃)₃, n-pentilsulfonilo, 1-metilbutilsulfonilo, 2-metilbutilsulfonilo, 3-metilbutilsulfonilo, 1,1-dimetilpropilsulfonilo, 1,2-dimetilpropilsulfonilo, 2,2-dimetilpropilsulfonilo, 1-etilpropilsulfonilo, n-hexilsulfonilo, 1-metilpentilsulfonilo, 2-metilpentilsulfonilo, 3-metilpentilsulfonilo, 4-metilpentilsulfonilo, 1,1-dimetilbutilsulfonilo, 1,2-dimetilbutilsulfonilo, 1,3-dimetilbutilsulfonilo, 2,2-dimetilbutilsulfonilo, 2,3-dimetilbutilsulfonilo, 3,3-dimetilbutilsulfonilo, 1-etilbutilsulfonilo, 2-etilbutilsulfonilo, 1,1,2-trimetilpropilsulfonilo, 1,2,2-trimetilpropilsulfonilo, 1-etil-1-metilpropilsulfonilo o 1-etil-2-metilpropilsulfonilo.

El término "C₂-C₆-alqueno" tal como se usa aquí y en las unidades estructurales alqueno de C₂-C₆-alquenoilo, C₂-C₆-alquenoilamino, C₂-C₆-alquenoilitio, C₂-C₆-alquenoilsulfonilo, (C₂-C₆-alquenoil)carbonilo, (C₂-C₆-alquenoilo)carbonilo y (C₂-C₆-alquenoil)carbonilo se refiere a un grupo hidrocarburo insaturado de cadena recta o ramificada que tiene de 2 a 6 átomos de carbono y un doble enlace en cualquier posición, tal como eteno, 1-propeno, 2-propeno, 1-metil-eteno, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-1-propeno, 2-metil-1-propeno, 1-metil-2-propeno, 2-metil-2-propeno; 1-penteno, 2-penteno, 3-penteno, 4-penteno, 1-metil-1-butenilo, 2-metil-1-butenilo, 3-metil-1-butenilo, 1-metil-2-butenilo, 2-metil-2-butenilo, 3-metil-2-butenilo, 1-metil-3-butenilo, 2-metil-3-butenilo, 3-metil-3-butenilo, 1,1-dimetil-2-propeno, 1,2-dimetil-1-propeno, 1,2-dimetil-2-propeno, 1-etil-1-propeno, 1-etil-2-propeno, 1-hexeno, 2-hexeno, 3-hexeno, 4-hexeno, 5-hexeno, 1-metil-1-penteno, 2-metil-1-penteno, 3-metil-1-penteno, 4-metil-1-penteno, 1-metil-2-penteno, 2-metil-2-penteno, 3-metil-2-penteno, 4-metil-2-penteno, 1-metil-3-penteno, 2-metil-3-penteno, 3-metil-3-penteno, 4-metil-3-penteno, 1-metil-4-penteno, 2-metil-4-penteno, 3-metil-4-penteno, 4-metil-4-penteno, 1,1-dimetil-2-butenilo, 1,1-dimetil-3-butenilo, 1,2-dimetil-1-butenilo, 1,2-dimetil-2-butenilo, 1,2-dimetil-3-butenilo, 1,3-dimetil-1-butenilo, 1,3-dimetil-2-butenilo, 1,3-dimetil-3-butenilo, 2,2-dimetil-3-butenilo, 2,3-dimetil-1-butenilo, 2,3-dimetil-2-butenilo, 2,3-dimetil-3-butenilo, 3,3-dimetil-1-butenilo, 3,3-dimetil-2-butenilo, 1-etil-1-butenilo, 1-etil-2-butenilo, 1-etil-3-butenilo, 2-etil-1-butenilo, 2-etil-2-butenilo, 2-etil-3-butenilo, 1,1,2-trimetil-2-propeno, 1-etil-1-metil-2-propeno, 1-etil-2-metil-1-propeno y 1-etil-2-metil-2-propeno.

El término, "C₂-C₆-alquenoilo" tal como se usa aquí se refiere a un grupo alqueno saturado de cadena recta o ramificada que tiene de 2 a 6 átomos de carbono (como se mencionó anteriormente) el cual está enlazado a través de un átomo de oxígeno, tal como vinilo, alilo (propen-3-ilo), metililo, buten-4-ilo, etc.

El término "C₂-C₆-alquenoilitio" tal como se usa aquí se refiere a un grupo alqueno saturado de cadena recta o ramificada que tiene de 2 a 6 átomos de carbono (como se mencionó anteriormente) el cual está enlazado a través de un átomo de azufre, por ejemplo vinilsulfano, alilsulfano (propen-3-ilitio), metililsulfano, buten-4-ilsulfano, etc.

El término "C₂-C₆-alquenoilamino" tal como se usa aquí se refiere a un grupo alqueno saturado de cadena recta o ramificada que tiene de 2 a 6 átomos de carbono (como se mencionó anteriormente) el cual está enlazado a través de un átomo de azufre, por ejemplo vinilamino, alilamino (propen-3-ilamino), metililamino, buten-4-ilamino, etc.

El término "C₂-C₆-alquenoilsulfonilo" tal como se usa aquí se refiere a un grupo alqueno saturado de cadena recta o ramificada que tiene de 2 a 6 átomos de carbono (como se mencionó anteriormente) el cual está enlazado a través de un grupo sulfonilo (SO₂), por ejemplo vinilsulfonilo, alilsulfonilo (propen-3-ilsulfonilo), metililsulfonilo, buten-4-ilsulfonilo, etc.

El término "C₂-C₆-alquino" tal como se usa aquí y en las unidades estructurales alquino de C₂-C₆-alquinoilo, C₂-C₆-alquinoilamino, C₂-C₆-alquinoilitio, C₂-C₆-alquinoilsulfonilo, C₂-C₆-alquinoilcarbonilo, C₂-C₆-alquinoiloxycarbonilo y C₁-C₆-alquinoilcarbonilo se refiere a un grupo hidrocarburo insaturado de cadena recta o ramificada que tiene de 2 a 10 átomos de carbono y que contiene al menos un triple enlace, tal como etino, prop-1-in-1-ilo, prop-2-in-1-ilo, n-but-1-in-1-ilo, n-but-1-in-3-ilo, n-but-1-in-4-ilo, n-but-2-in-1-ilo, n-pent-1-in-1-ilo, n-pent-1-in-3-ilo, n-pent-1-in-4-ilo, n-pent-1-in-5-ilo, n-pent-2-in-1-ilo, n-pent-2-in-4-ilo, n-pent-2-in-5-ilo, 3-metilbut-1-in-3-ilo, 3-metilbut-1-in-4-ilo, n-hex-1-in-1-ilo, n-hex-1-in-3-ilo, n-hex-1-in-4-ilo, n-hex-1-in-5-ilo, n-hex-1-in-6-ilo, n-hex-2-in-1-ilo, n-hex-2-in-4-ilo, n-hex-2-in-5-ilo, n-hex-2-in-6-ilo, n-hex-3-in-1-ilo, n-hex-3-in-2-ilo, 3-metilpent-1-in-1-ilo, 3-metilpent-1-in-3-ilo, 3-metilpent-1-in-4-ilo, 3-metilpent-1-in-5-ilo, 4-metilpent-1-in-1-ilo, 4-metilpent-2-in-4-ilo o 4-metilpent-2-in-5-ilo y similares.

El término, "C₂-C₆-alquinoilo" tal como se usa aquí se refiere a un grupo alquino saturado de cadena recta o ramificada que tiene de 2 a 6 átomos de carbono (como se mencionó anteriormente) el cual está enlazado a través de un átomo de oxígeno, tal como propargilo (propin-3-ilo), butin-3-ilo, y butin-4-ilo.

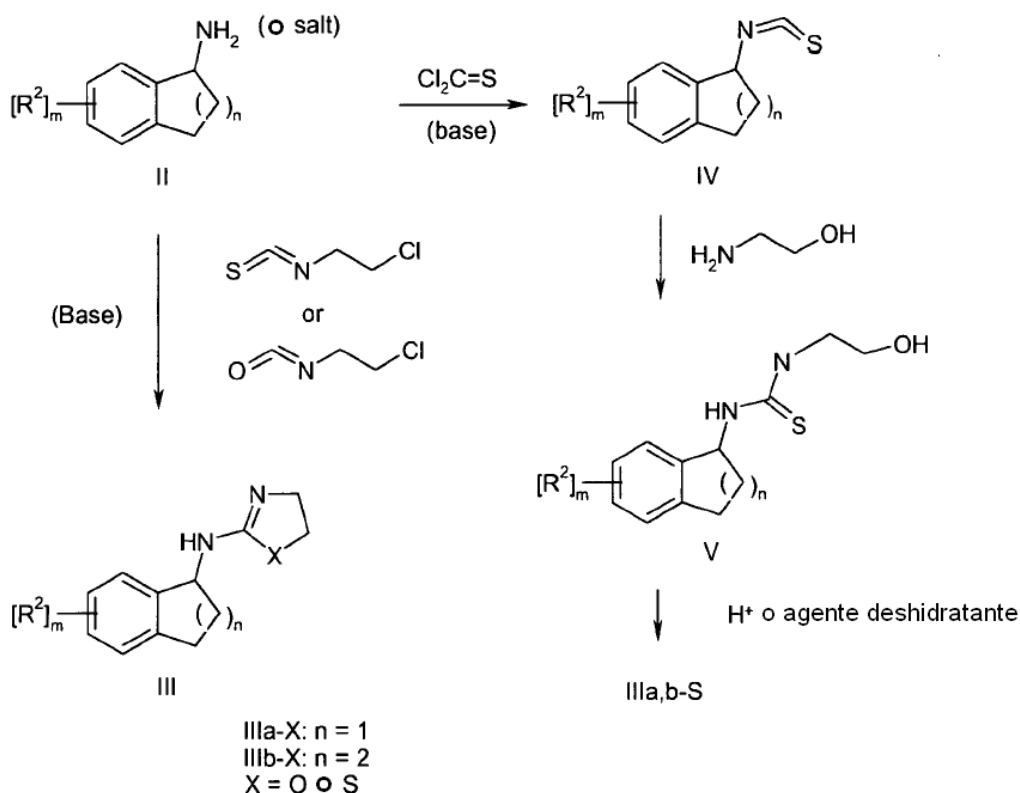
El término "C₂-C₆-alquenoilitio" tal como se usa aquí se refiere a un grupo alquino saturado de cadena recta o ramificada que tiene de 2 a 6 átomos de carbono (como se mencionó anteriormente) el cual está enlazado a través de un átomo de azufre, tal como propargilsulfano (propin-3-ilitio), butin-3-ilsulfano y butin-4-ilsulfano.

El término "C₂-C₆-alquenoilamino" tal como se usa aquí se refiere a un grupo alquino saturado de cadena recta o ramificada que tiene de 2 a 6 átomos de carbono (como se mencionó anteriormente) el cual está enlazado a través de un átomo de azufre, tal como propargilamino (propin-3-ilamino), butin-3-amino, y butin-4-ilamino.

El término "C₂-C₆-alquenoilsulfonilo" tal como se usa aquí se refiere a un grupo alquino saturado de cadena recta o ramificada que tiene de 2 a 6 átomos de carbono (como se mencionó anteriormente) el cual está enlazado a través de un grupo sulfonilo (SO₂), tal como propargilsulfonilo (propin-3-ilsulfonilo), butin-3-ilsulfonilo y butin-4-ilsulfonilo.

- El término "C₃-C₁₂-cicloalquil" tal como se usa aquí se refiere a un radical hidrocarburo mono, bi o policíclico que tiene de 3 a 12 átomos de carbono, en particular 3 a 6 átomos de carbono. Ejemplos de radicales monocíclicos comprenden ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo, ciclooctilo, ciclononilo y ciclododecilo. Ejemplos de radicales bicíclicos comprenden los bicíclo [2.2.1]heptilo, bicíclo[3.1.1]heptilo, bicíclo[2.2.2]octilo y bicíclo[3.2.1]nonilo. Ejemplos de radicales tricíclicos son adamantilo y homoadamantilo.
- El término "anillo mono o bicíclico heteroaromático" tal como se utiliza aquí se refiere a un radical heteroaromático monocíclico que tiene de 5 a 6 miembros de anillo, el cual puede comprender un anillo fusionado de 5, 6 o 7 miembros que tiene así un número total de miembros de anillo de 8 a 10, donde en cada caso, 1, 2, 3 o 4 de estos miembros de anillo son heteroátomos seleccionados, independientemente uno de otro, del grupo consistente de oxígeno, nitrógeno y azufre. El radical heterocíclico puede estar unido al resto de la molécula a través de un carbono miembro del anillo a través de un nitrógeno miembro del anillo. El anillo fusionado comprende C₅-C₇-cicloalquilo, C₅-C₇-cicloalqueno o heterocíclico y fenilo de 5 a 7 miembros.
- Ejemplos de anillos heteroaromáticos monocíclicos de 5 a 6 miembros incluyen triazinilo, pirazinilo, pirimidilo, piridazinilo, piridilo, tienilo, furilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, triazolilo, tetrazolilo, tiazolilo, oxazolilo, tiadiazolilo, oxadiazolilo, isotiazolilo e isoxazolilo.
- Ejemplos de anillos heteroaromáticos de 5 o 6 miembros que portan un anillo fenilo fusionados son quinolinilo, isoquinolinilo, indolilo, indolizínilo, isoindolilo, indazolilo, benzofurilo, benzotienilo, benzo[b]tiazolilo, benzoxazolilo, benzotiazolilo, benzoxazolilo, y bencimidazolilo. Ejemplos de anillos heteroaromáticos de 5 ó 6 miembros que portan un anillo cicloalqueno fusionado son dihidroindolilo, dihidroindolizínilo, dihidroisoindolilo, dihidrochinolinilo, dihidroisochinolinilo, cromenilo, cromanilo y similares.
- El término "heterocíclico de 5 a 7 miembros" comprende anillos heteroaromáticos monocíclicos como se definió más arriba y anillos heterocíclicos no aromáticos saturados o parcialmente insaturados que tienen de 5, 6 o 7 miembros de anillo. Ejemplos de anillos no aromáticos incluyen pirrolidinilo, pirazolinilo, imidazolinilo, pirrolinilo, pirazolinilo, imidazolinilo, tetrahydrofurano, dihydrofurano, 1,3-dioxolanilo, dioxolenilo, tiolanilo, dihydrothienilo, oxazolidinilo, isoxazolidinilo, oxazolinilo, isoxazolinilo, tiazolinilo, isotiazolinilo, tiazolidinilo, isotiazolidinilo, oxatiolanilo, piperidinilo, piperazinilo, piranilo, dihidropirano, tetrahydropirano, dioxanilo, tiopirano, dihydrotiopirano, tetrahydrotiopirano, morfolinilo, tiazinilo y similares.
- Con respecto a la actividad pesticida de los compuestos de la fórmula I, se da preferencia a aquellos compuestos de la fórmula I en los cuales las variables –independientemente una de otra o en combinación con cualquiera de las otras variables-, tenga los siguientes significados:
- Un compuesto Indanil- o Tetrahydro-naftil-amino-azolina de la fórmula I, en donde R¹ es seleccionado de hidrógeno, ciano, C(=O)R^{1c}, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquínilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, y en donde R^{1c} es seleccionado de hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquínilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, (C₁-C₆-alquil)amino, di(C₁-C₆-alquil)amino, fenilo y heteroarilo, el cual puede ser un anillo heteroaromático, mono o bicíclico de 5 a 10 miembros, que contiene 1,2,3 o 4 heteroátomos seleccionados de O,S y N. Más preferiblemente un compuesto Indanil- o Tetrahydro-naftil-amino-azolina de la fórmula I, en donde R¹ es hidrógeno.
- Un compuesto Indanil- o Tetrahydro-naftil-amino-azolina de la fórmula I, en donde R² es seleccionado de halógeno, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquínilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₁-C₆-alcoxi.
- Más preferiblemente un compuesto Indanil- o Tetrahydro-naftil-amino-azolina de la fórmula I, en donde R² es seleccionado de halógeno, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquínilo, C₁-C₆-alcoxi o C₃-C₈-cicloalquilo, en donde los radicales pueden ser no sustituidos, parcial o completamente halogenados.
- Un compuesto Indanil- o Tetrahydro-naftil-amino-azolina de la fórmula I, en donde m es 3 y R² está sustituido en las posiciones A, C y D.
- Un compuesto Indanil- o Tetrahydro-naftil-amino-azolina de la fórmula I, en donde m es 2 y R² está sustituido en las posiciones A y C. Un compuesto Indanil- o Tetrahydro-naftil-amino-azolina de la fórmula I, en donde m es 2 y R² está sustituido en las posiciones C y D.
- Un compuesto Indanil- o Tetrahydro-naftil-amino-azolina de la fórmula I, en donde m es 1 y R² está sustituido en la posición A.
- Un compuesto Indanil- o Tetrahydro-naftil-amino-azolina de la fórmula I, en donde m es 1 y R² está sustituido en la posición C.
- Un compuesto Indanil- o Tetrahydro-naftil-amino-azolina de la fórmula I, en donde X es S o O.
- Un compuesto Indanil- o Tetrahydro-naftil-amino-azolina de la fórmula I, en donde X es S.
- Se prefieren compuestos Indanil-amino-azolina de la fórmula 1, en donde n es 1.

El compuesto de la presente invención puede ser preparado por ejemplo a partir de las aminas correspondientes II por la ruta sintética delineada en el siguiente esquema:



5 De acuerdo con el método delineado en el esquema, una amina II es convertida en el isotiocianato IV correspondiente por medios convencionales, por ejemplo, haciendo reaccionar II con tiofosgeno (véase por ejemplo Houben-Weilo, E4, "Metoden der Organischen Chemie", chapter IIc, pp. 837-842, Georg Thieme Verlag 1983. El isotiocianato IV se hace reaccionar entonces con aminoetanol, obteniéndose por lo tanto la tiourea V.

La reacción del aminoetanol con isotiocianato IV puede llevarse a cabo con métodos estándar de la química orgánica, véase por ejemplo Biosci. Biotech. Biochem. 56 (7), 1062-65 (1992).

10 Las tioureas V así obtenidas pueden ciclizarse por medios convencionales obteniendo por lo tanto el compuesto de tiazolina deseado de la fórmula IIIa,b-S. La ciclización del compuesto V puede lograrse, por ejemplo, bajo catálisis ácida o bajo condiciones de deshidratación, por ejemplo, mediante la reacción de Mitsunobu (véase Tetrahedron Letters 1999, 40, 3125-3128).

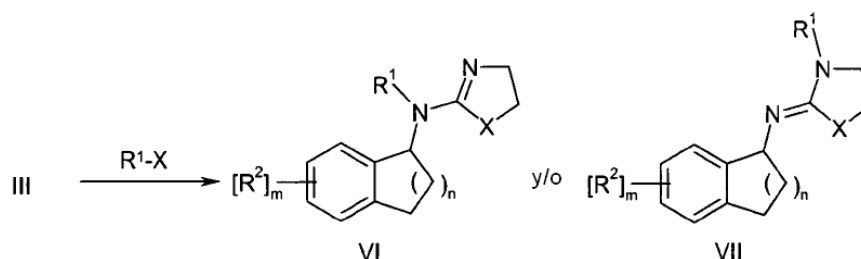
15 En nuestra solicitud de patente provisional de los Estados Unidos paralela, la cual se presenta simultáneamente, se describen tales métodos alternativos.

De acuerdo con el método delineado en el esquema, una amina II también puede convertirse en azolinas III-x por reacción con 2-cloroetilisotiozonato o 2-cloroetilisocianato, por ejemplo como se describe en Bioorg. Med. Chem. Lett. 1994, 4, 2317-22 y subsecuente ciclización en presencia o ausencia de base o bajo las condiciones descritas más adelante.

20 Las aminas II están disponibles comercialmente o son conocidas en la técnica o pueden prepararse por métodos familiares para un químico orgánico y bien conocidos en la técnica, por ejemplo, EP 2812578 (aminas tipo indanilo) o US 3,953,506 (aminas tipo tetrahidronaftilo).

Los 1-Cloro-2-isotiocianatoetane (CAS-reg.-no.: 6099-88-3) y 2-cloroetilisocianate (CAS-reg.-no.: 1943-83-5) están disponibles comercialmente.

25 Los compuestos de la fórmula general VI o VII pueden obtenerse por reacción con un electrófilo adecuado tal como se delinea en el siguiente esquema, por ejemplo un reactivo alquilante o acilante, por ejemplo como se describe en WO 2005063724.



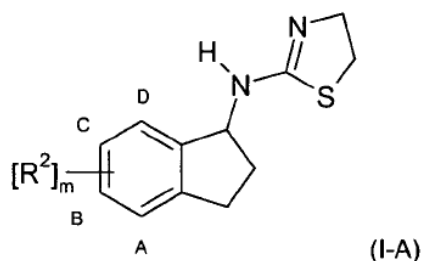
Las mezclas de reacción particulares se manipulan, como regla general, por métodos convencionales, por ejemplo eliminando el solvente, distribuyendo el residuo en una mezcla de agua y un solvente orgánico adecuado y aislando el producto a partir de la fase orgánica.

- 5 Los compuestos de indanil- o tetrahidronaftil-amino-azolona I pueden obtenerse en la preparación como mezclas de isómeros, los cuales sin embargo, si se desea, pueden separarse en los isómeros puros por métodos convencionales, por ejemplo, por cristalización o cromatografía (si es necesario, sobre un adsorbato ópticamente activo). Los isómeros ópticamente activos puros pueden sintetizarse, por ejemplo, a partir de materiales de partida ópticamente activos correspondientes.
- 10 En general, los compuestos indanil- o tetrahidronaftil-amino-azolona de la fórmula I pueden prepararse por lo métodos descritos anteriormente. Sin embargo, en casos individuales, ciertos compuestos I también pueden ser preparados ventajosamente a partir de otros compuestos por métodos convencionales tales como hidrólisis de ésteres, amidación, esterificación, escisión de éteres, olefinación, reducción, oxidación, etc.

A continuación se representan ejemplos preferidos de compuestos de la fórmula I de la presente invención:

- 15 1. Fórmula I-A - Compuestos de referencia.

Entre los compuestos de la fórmula I, se da preferencia a los siguientes compuestos de la fórmula I-A, donde $n = 1$, $\text{R}^1 = \text{H}$ con X siendo S:



- 20 en donde las variables m y R^2 tienen los significados dados más abajo. Ejemplos de estos compuestos son aquellos donde $[\text{R}^2]_m$ tiene el significado dado en cada línea de la tabla A (Compuestos I-A.1 a I-A.72).

Tabla A

Posición de R ² :	[R ²] _m			
	A	B	C	D
compuesto I-A.1	CH ₃	-	-	-
compuesto I-A.2	-	CH ₃	-	-
compuesto I-A.3	-	-	CH ₃	-
compuesto I-A.4	-	-	-	CH ₃
compuesto I-A.5	CH ₃	-	CH ₃	-
compuesto I-A.6	CH ₃	-	CH ₃	CH ₃
compuesto I-A.7	-	-	CH ₃	CH ₃
compuesto I-A.8	Cl	-	-	-
compuesto I-A.9	-	Cl	-	-
compuesto I-A.10	-	-	Cl	-
compuesto I-A.11	-	-	-	Cl
compuesto I-A.12	Cl	-	Cl	-
compuesto I-A.13	Cl	-	Cl	Cl
compuesto I-A.14	-	-	Cl	Cl
compuesto I-A.15	F	-	-	-
compuesto I-A.16	-	F	-	-
compuesto I-A.17	-	-	F	-
compuesto I-A.18	-	-	-	F
compuesto I-A.19	F	-	F	-
compuesto I-A.20	F	-	F	F
compuesto I-A.21	-	-	F	F
compuesto I-A.22	Br	-	-	-
compuesto I-A.23	-	Br	-	-
compuesto I-A.24	-	-	Br	-
compuesto I-A.25	-	-	-	Br
compuesto I-A.26	Br	-	Br	-
compuesto I-A.27	Br	-	Br	Br
compuesto I-A.28	-	-	Br	Br
compuesto I-A.29	CF ₃	-	-	-
compuesto I-A.30	-	CF ₃	-	-

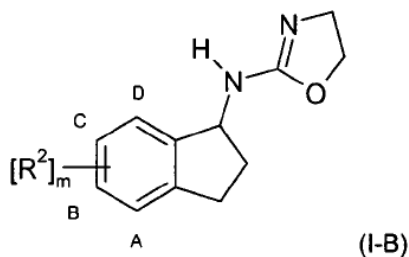
ES 2 380 051 T3

compuesto I-A.31	-	-	CF ₃	-
compuesto I-A.32	-	-	-	CF ₃
compuesto I-A.33	CF ₃	-	CF ₃	-
compuesto I-A.34	CF ₃	-	CF ₃	CF ₃
compuesto I-A.35	-	-	CF ₃	CF ₃
compuesto I-A.36	OCF ₃	-	-	-
compuesto I-A.37	-	OCF ₃	-	-
compuesto I-A.38	-	-	OCF ₃	-
compuesto I-A.39	-	-	-	OCF ₃
compuesto I-A.40	OCF ₃	-	OCF ₃	-
compuesto I-A.41	OCF ₃	-	OCF ₃	OCF ₃
compuesto I-A.42	-	-	OCF ₃	OCF ₃
compuesto I-A.43	CH ₃	-	Cl	-
compuesto I-A.44	Cl	-	CH ₃	-
compuesto I-A.45	CH ₃	-	F	-
compuesto I-A.46	F	-	CH ₃	-
compuesto I-A.47	CH ₃	-	Br	-
compuesto I-A.48	Br	-	CH ₃	-
compuesto I-A.49	CH ₃	-	CF ₃	-
compuesto I-A.50	CF ₃	-	CH ₃	-
compuesto I-A.51	CH ₃	-	OCF ₃	-
compuesto I-A.52	OCF ₃	-	CH ₃	-
compuesto I-A.53	Cl	-	F	-
compuesto I-A.54	F	-	Cl	-
compuesto I-A.55	Cl	-	Br	-
compuesto I-A.56	Br	-	Cl	-
compuesto I-A.57	Cl	-	CF ₃	-
compuesto I-A.58	CF ₃	-	Cl	-
compuesto I-A.59	Cl	-	OCF ₃	-
compuesto I-A.60	OCF ₃	-	Cl	-
compuesto I-A.61	F	-	Br	-
compuesto I-A.62	Br	-	F	-
compuesto I-A.63	F	-	CF ₃	-
compuesto I-A.64	CF ₃	-	F	-

compuesto I-A.65	F	-	OCF ₃	-
compuesto I-A.66	OCF ₃	-	F	-
compuesto I-A.67	Br	-	CF ₃	-
compuesto I-A.68	CF ₃	-	Br	-
compuesto I-A.69	Br	-	OCF ₃	-
compuesto I-A.70	OCF ₃	-	Br	-
compuesto I-A.71	CF ₃	-	OCF ₃	-
compuesto I-A.72	OCF ₃	-	CF ₃	-

2. Fórmula I-B

Entre los compuestos de la fórmula I, se da preferencia a los siguientes compuestos de la fórmula I-B, donde n= 1, R¹= H y X= O, y donde las variables m y R² tienen los significados dados más adelante.



5

Ejemplos de estos compuestos son aquellos donde [R²]_m tiene el significado dado en cada línea de la tabla B (compuestos I-B.1 a I-B.72). Algunos compuestos no son abarcados por el alcance de las reivindicaciones.

Tabla B

Posición of R ² :	[R ²] _m			
	A	B	C	D
compuesto I-B.1	CH ₃	-	-	-
compuesto I-B.2	-	CH ₃	-	-
compuesto I-B.3	-	-	CH ₃	-
compuesto I-B.4	-	-	-	CH ₃
compuesto I-B.5	CH ₃	-	CH ₃	-
compuesto I-B.6	CH ₃	-	CH ₃	CH ₃
compuesto I-B.7	-	-	CH ₃	CH ₃
compuesto I-B.8	Cl	-	-	-
compuesto I-B.9	-	Cl	-	-
compuesto I-B.10	-	-	Cl	-
compuesto I-B.11	-	-	-	Cl
compuesto I-B.12	Cl	-	Cl	-
compuesto I-B.13	Cl	-	Cl	Cl

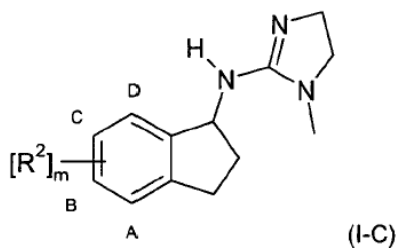
ES 2 380 051 T3

compuesto I-B.14	-	-	Cl	Cl
compuesto I-B.15	F	-	-	-
compuesto I-B.16	-	F	-	-
compuesto I-B.17	-	-	F	-
compuesto I-B.18	-	-	-	F
compuesto I-B.19	F	-	F	-
compuesto I-B.20	F	-	F	F
compuesto I-B.21	-	-	F	F
compuesto I-B.22	Br	-	-	-
compuesto I-B.23	-	Br	-	-
compuesto I-B.24	-	-	Br	-
compuesto I-B.25	-	-	-	Br
compuesto I-B.26	Br	-	Br	-
compuesto I-B.27	Br	-	Br	Br
compuesto I-B.28	-	-	Br	Br
compuesto I-B.29	CF ₃	-	-	-
compuesto I-B.30	-	CF ₃	-	-
compuesto I-B.31	-	-	CF ₃	-
compuesto I-B.32	-	-	-	CF ₃
compuesto I-B.33	CF ₃	-	CF ₃	-
compuesto I-B.34	CF ₃	-	CF ₃	CF ₃
compuesto I-B.35	-	-	CF ₃	CF ₃
compuesto I-B.36	OCF ₃	-	-	-
compuesto I-B.37	-	OCF ₃	-	-
compuesto I-B.38	-	-	OCF ₃	-
compuesto I-B.39	-	-	-	OCF ₃
compuesto I-B.40	OCF ₃	-	OCF ₃	-
compuesto I-B.41	OCF ₃	-	OCF ₃	OCF ₃
compuesto I-B.42	-	-	OCF ₃	OCF ₃
compuesto I-B.43	CH ₃	-	Cl	-
compuesto I-B.44	Cl	-	CH ₃	-
compuesto I-B.45	CH ₃	-	F	-
compuesto I-B.46	F	-	CH ₃	-
compuesto I-B.47	CH ₃	-	Br	-

compuesto I-B.48	Br	-	CH ₃	-
compuesto I-B.49	CH ₃	-	CF ₃	-
compuesto I-B.50	CF ₃	-	CH ₃	-
compuesto I-B.51	CH ₃	-	OCF ₃	-
compuesto I-B.52	OCF ₃	-	CH ₃	-
compuesto I-B.53	Cl	-	F	-
compuesto I-B.54	F	-	Cl	-
compuesto I-B.55	Cl	-	Br	-
compuesto I-B.56	Br	-	Cl	-
compuesto I-B.57	Cl	-	CF ₃	-
compuesto I-B.58	CF ₃	-	Cl	-
compuesto I-B.59	Cl	-	OCF ₃	-
compuesto I-B.60	OCF ₃	-	Cl	-
compuesto I-B.61	F	-	Br	-
compuesto I-B.62	Br	-	F	-
compuesto I-B.63	F	-	CF ₃	-
compuesto I-B.64	CF ₃	-	F	-
compuesto I-B.65	F	-	OCF ₃	-
compuesto I-B.66	OCF ₃	-	F	-
compuesto I-B.67	Br	-	CF ₃	-
compuesto I-B.68	CF ₃	-	Br	-
compuesto I-B.69	Br	-	OCF ₃	-
compuesto I-B.70	OCF ₃	-	Br	-
compuesto I-B.71	CF ₃	-	OCF ₃	-
compuesto I-B.72	OCF ₃	-	CF ₃	-

3. Fórmula I-C

Entre los compuestos de la fórmula I, se da preferencia a los siguientes compuestos de la fórmula I-C, donde $n = 1$, $R^1 = H$ y $X = N-CH_3$, y donde las variables m y R^2 tienen los significados dados más adelante.



5

Ejemplos de estos compuestos son aquellos donde $[R^2]_m$ tiene el significado dado en cada línea de la tabla C (compuestos I-C.1 a I-C.72). Algunos compuestos no son abarcados por el alcance de las reivindicaciones

Tabla C:

Posición of R ² :	[R ²] _m			
	A	B	C	D
compuesto I-C.1	CH ₃	-	-	-
compuesto I-C.2	-	CH ₃	-	-
compuesto I-C.3	-	-	CH ₃	-
compuesto I-C.4	-	-	-	CH ₃
compuesto I-C.5	CH ₃	-	CH ₃	-
compuesto I-C.6	CH ₃	-	CH ₃	CH ₃
compuesto I-C.7	-	-	CH ₃	CH ₃
compuesto I-C.8	Cl	-	-	-
compuesto I-C.9	-	Cl	-	-
compuesto I-C.10	-	-	Cl	-
compuesto I-C.11	-	-	-	Cl
compuesto I-C.12	Cl	-	Cl	-
compuesto I-C.13	Cl	-	Cl	Cl
compuesto I-C.14	-	-	Cl	Cl
compuesto I-C.15	F	-	-	-
compuesto I-C.16	-	F	-	-
compuesto I-C.17	-	-	F	-
compuesto I-C.18	-	-	-	F
compuesto I-C.19	F	-	F	-
compuesto I-C.20	F	-	F	F
compuesto I-C.21	-	-	F	F
compuesto I-C.22	Br	-	-	-
compuesto I-C.23	-	Br	-	-
compuesto I-C.24	-	-	Br	-
compuesto I-C.25	-	-	-	Br
compuesto I-C.26	Br	-	Br	-
compuesto I-C.27	Br	-	Br	Br
compuesto I-C.28	-	-	Br	Br
compuesto I-C.29	CF ₃	-	-	-
compuesto I-C.30	-	CF ₃	-	-
compuesto I-C.31	-	-	CF ₃	-

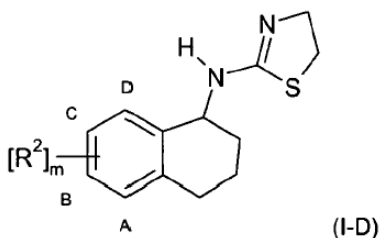
ES 2 380 051 T3

compuesto I-C.32	-	-	-	CF ₃
compuesto I-C.33	CF ₃	-	CF ₃	-
compuesto I-C.34	CF ₃	-	CF ₃	CF ₃
compuesto I-C.35	-	-	CF ₃	CF ₃
compuesto I-C.36	OCF ₃	-	-	-
compuesto I-C.37	-	OCF ₃	-	-
compuesto I-C.38	-	-	OCF ₃	-
compuesto I-C.39	-	-	-	OCF ₃
compuesto I-C.40	OCF ₃	-	OCF ₃	-
compuesto I-C.41	OCF ₃	-	OCF ₃	OCF ₃
compuesto I-C.42	-	-	OCF ₃	OCF ₃
compuesto I-C.43	CH ₃	-	Cl	-
compuesto I-C.44	Cl		CH ₃	-
compuesto I-C.45	CH ₃	-	F	-
compuesto I-C.46	F	-	CH ₃	-
compuesto I-C.47	CH ₃	-	Br	-
compuesto I-C.48	Br	-	CH ₃	-
compuesto I-C.49	CH ₃	-	CF ₃	-
compuesto I-C.50	CF ₃	-	CH ₃	-
compuesto I-C.51	CH ₃	-	OCF ₃	-
compuesto I-C.52	OCF ₃	-	CH ₃	-
compuesto I-C.53	Cl	-	F	-
compuesto I-C.54	F	-	Cl	-
compuesto I-C.55	Cl	-	Br	-
compuesto I-C.56	Br	-	Cl	-
compuesto I-C.57	Cl	-	CF ₃	-
compuesto I-C.58	CF ₃	-	Cl	-
compuesto I-C.59	Cl	-	OCF ₃	-
compuesto I-C.60	OCF ₃	-	Cl	-
compuesto I-C.61	F	-	Br	-
compuesto I-C.62	Br	-	F	-
compuesto I-C.63	F	-	CF ₃	-
compuesto I-C.64	CF ₃	-	F	-
compuesto I-C.65	F	-	OCF ₃	-

compuesto I-C.66	OCF ₃	-	F	-
compuesto I-C.67	Br	-	CF ₃	-
compuesto I-C.68	CF ₃	-	Br	-
compuesto I-C.69	Br	-	OCF ₃	-
compuesto I-C.70	OCF ₃	-	Br	-
compuesto I-C.71	CF ₃	-	OCF ₃	-
compuesto I-C.72	OCF ₃	-	CF ₃	-

4. Fórmula I-D - Compuestos de referencia

Entre los compuestos de la fórmula I, se da preferencia a los siguientes compuestos de la fórmula I-D, donde n= 2, R1= H y X= S,;



5

donde las variables m y R² tienen los significados dados más adelante.

Ejemplos de estos compuestos son aquellos donde [R²]_m tiene el significado dado en casa línea de la tabla D (compuestos I-D.1 a I-D.72) tabla D

Tabla D

Posición of R ² :	[R ²] _m			
	A	B	C	D
compuesto I-D.1	CH ₃	-	-	-
compuesto I-D.2	-	CH ₃	-	-
compuesto I-D.3	-	-	CH ₃	-
compuesto I-D.4	-	-	-	CH ₃
compuesto I-D.5	CH ₃	-	CH ₃	-
compuesto I-D.6	CH ₃	-	CH ₃	CH ₃
compuesto I-D.7	-	-	CH ₃	CH ₃
compuesto I-D.8	Cl	-	-	-
compuesto I-D.9	-	Cl	-	-
compuesto I-D.10	-	-	Cl	-
compuesto I-D.11	-	-	-	Cl
compuesto I-D.12	Cl	-	Cl	-
compuesto I-D.13	Cl	-	Cl	Cl

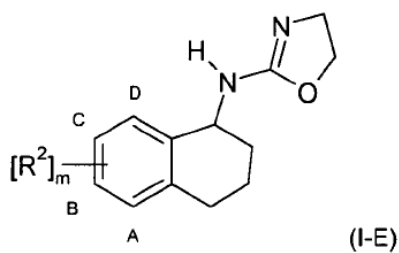
ES 2 380 051 T3

compuesto I-D.14	-	-	Cl	Cl
compuesto I-D.15	F	-	-	-
compuesto I-D.16	-	F	-	-
compuesto I-D.17	-	-	F	-
compuesto I-D.18	-	-	-	F
compuesto I-D.19	F	-	F	-
compuesto I-D.20	F	-	F	F
compuesto I-D.21	-	-	F	F
compuesto I-D.22	Br	-	-	-
compuesto I-D.23	-	Br	-	-
compuesto I-D.24	-	-	Br	-
compuesto I-D.25	-	-	-	Br
compuesto I-D.26	Br	-	Br	-
compuesto I-D.27	Br	-	Br	Br
compuesto I-D.28	-	-	Br	Br
compuesto I-D.29	CF ₃	-	-	-
compuesto I-D.30	-	CF ₃	-	-
compuesto I-D.31	-	-	CF ₃	-
compuesto I-D.32	-	-	-	CF ₃
compuesto I-D.33	CF ₃	-	CF ₃	-
compuesto I-D.34	CF ₃	-	CF ₃	CF ₃
compuesto I-D.35	-	-	CF ₃	CF ₃
compuesto I-D.36	OCF ₃	-	-	-
compuesto I-D.37	-	OCF ₃	-	-
compuesto I-D.38	-	-	OCF ₃	-
compuesto I-D.39	-	-	-	OCF ₃
compuesto I-D.40	OCF ₃	-	OCF ₃	-
compuesto I-D.41	OCF ₃	-	OCF ₃	OCF ₃
compuesto I-D.42	-	-	OCF ₃	OCF ₃
compuesto I-D.43	CH ₃	-	Cl	-
compuesto I-D.44	Cl	-	CH ₃	-
compuesto I-D.45	CH ₃	-	F	-
compuesto I-D.46	F	-	CH ₃	-
compuesto I-D.47	CH ₃	-	Br	-

compuesto I-D.48	Br	-	CH ₃	-
compuesto I-D.49	CH ₃	-	CF ₃	-
compuesto I-D.50	CF ₃	-	CH ₃	-
compuesto I-D.51	CH ₃	-	OCF ₃	-
compuesto I-D.52	OCF ₃	-	CH ₃	-
compuesto I-D.53	Cl	-	F	-
compuesto I-D.54	F	-	Cl	-
compuesto I-D.55	Cl	-	Br	-
compuesto I-D.56	Br	-	Cl	-
compuesto I-D.57	Cl	-	CF ₃	-
compuesto I-D.58	CF ₃	-	Cl	-
compuesto I-D.59	Cl	-	OCF ₃	-
compuesto I-D.60	OCF ₃	-	Cl	-
compuesto I-D.61	F	-	Br	-
compuesto I-D.62	Br	-	F	-
compuesto I-D.63	F	-	CF ₃	-
compuesto I-D.64	CF ₃	-	F	-
compuesto I-D.65	F	-	OCF ₃	-
compuesto I-D.66	OCF ₃	-	F	-
compuesto I-D.67	Br	-	CF ₃	-
compuesto I-D.68	CF ₃	-	Br	-
compuesto I-D.69	Br	-	OCF ₃	-
compuesto I-D.70	OCF ₃	-	Br	-
compuesto I-D.71	CF ₃	-	OCF ₃	-
compuesto I-D.72	OCF ₃	-	CF ₃	-

5. Fórmula I-E

Entre los compuestos de la fórmula I, se da preferencia a los siguientes compuestos de la fórmula I-E, donde n= 2, R1= H y X= O,:



donde las variable m y R^2 tienen los significados dados más adelante. Ejemplos de estos compuestos son aquellos donde $[R^2]_m$ tiene el significado dado en cada línea de la tabla E (compuestos I-E.1 a I-E.72). Algunos compuestos no son abarcados por el alcance de las reivindicaciones

Tabla E:

Posición of R^2 :	$[R^2]_m$			
	A	B	C	D
compuesto I-E.1	CH ₃	-	-	-
compuesto I-E.2	-	CH ₃	-	-
compuesto I-E.3	-	-	CH ₃	-
compuesto I-E.4	-	-	-	CH ₃
compuesto I-E.5	CH ₃	-	CH ₃	-
compuesto I-E.6	CH ₃	-	CH ₃	CH ₃
compuesto I-E.7	-	-	CH ₃	CH ₃
compuesto I-E.8	Cl	-	-	-
compuesto I-E.9	-	Cl	-	-
compuesto I-E.10	-	-	Cl	-
compuesto I-E.11	-	-	-	Cl
compuesto I-E.12	Cl	-	Cl	-
compuesto I-E.13	Cl	-	Cl	Cl
compuesto I-E.14	-	-	Cl	Cl
compuesto I-E.15	F	-	-	-
compuesto I-E.16	-	F	-	-
compuesto I-E.17	-	-	F	-
compuesto I-E.18	-	-	-	F
compuesto I-E.19	F	-	F	-
compuesto I-E.20	F	-	F	F
compuesto I-E.21	-	-	F	F
compuesto I-E.22	Br	-	-	-
compuesto I-E.23	-	Br	-	-

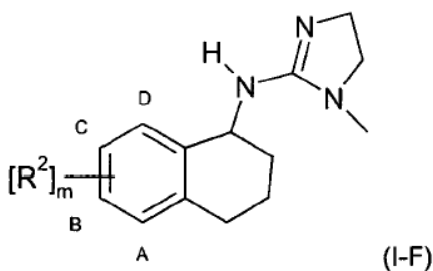
(continuación)

Posición of R ² :	[R ²] _m			
	A	B	C	D
compuesto I-E.24	-	-	Br	-
compuesto I-E.25	-	-	-	Br
compuesto I-E.26	Br	-	Br	-
compuesto I-E.27	Br	-	Br	Br
compuesto I-E.28	-	-	Br	Br
compuesto I-E.29	CF ₃	-	-	-
compuesto I-E.30	-	CF ₃	-	-
compuesto I-E.31	-	-	CF ₃	-
compuesto I-E.32	-	-	-	CF ₃
compuesto I-E.33	CF ₃	-	CF ₃	-
compuesto I-E.34	CF ₃	-	CF ₃	CF ₃
compuesto I-E.35	-	-	CF ₃	CF ₃
compuesto I-E.36	OCF ₃	-	-	-
compuesto I-E.37	-	OCF ₃	-	-
compuesto I-E.38	-	-	OCF ₃	-
compuesto I-E.39	-	-	-	OCF ₃
compuesto I-E.40	OCF ₃	-	OCF ₃	-
compuesto I-E.41	OCF ₃	-	OCF ₃	OCF ₃
compuesto I-E.42	-	-	OCF ₃	OCF ₃
compuesto I-E.43	CH ₃	-	Cl	-
compuesto I-E.44	Cl		CH ₃	-
compuesto I-E.45	CH ₃	-	F	-
compuesto I-E.46	F	-	CH ₃	-
compuesto I-E.47	CH ₃	-	Br	-
compuesto I-E.48	Br	-	CH ₃	-
compuesto I-E.49	CH ₃	-	CF ₃	-
compuesto I-E.50	CF ₃	-	CH ₃	-
compuesto I-E.51	CH ₃	-	OCF ₃	-
compuesto I-E.52	OCF ₃	-	CH ₃	-

compuesto I-E.53	Cl	-	F	-
compuesto I-E.54	F	-	Cl	-
compuesto I-E.55	Cl	-	Br	-
compuesto I-E.56	Br	-	Cl	-
compuesto I-E.57	Cl	-	CF ₃	-
compuesto I-E.58	CF ₃	-	Cl	-
compuesto I-E.59	Cl	-	OCF ₃	-
compuesto I-E.60	OCF ₃	-	Cl	-
compuesto I-E.61	F	-	Br	-
compuesto I-E.62	Br	-	F	-
compuesto I-E.63	F	-	CF ₃	-
compuesto I-E.64	CF ₃	-	F	-
compuesto I-E.65	F	-	OCF ₃	-
compuesto I-E.66	OCF ₃	-	F	-
compuesto I-E.67	Br	-	CF ₃	-
compuesto I-E.68	CF ₃	-	Br	-
compuesto I-E.69	Br	-	OCF ₃	-
compuesto I-E.70	OCF ₃	-	Br	-
compuesto I-E.71	CF ₃	-	OCF ₃	-
compuesto I-E.72	OCF ₃	-	CF ₃	-

6. Fórmula I-F

Entre los compuestos de la fórmula I, se da preferencia a los siguientes compuestos de la fórmula I-F, donde n= 2, R1= H y X= N-CH₃:



5

donde las variables m y R² tienen los significados dados más abajo. Ejemplos de estos compuestos son aquellos donde [R²]_m tiene el significado dado en cada línea de la tabla F (los compuestos I-F.1 a I-F.72). Algunos compuestos no son abarcados por el alcance de las reivindicaciones

Tabla F:

Posición of R ² :	[R ²] _m			
	A	B	C	D

ES 2 380 051 T3

compuesto I-F.1	CH ₃	-	-	-
compuesto I-F.2	-	CH ₃	-	-
compuesto I-F.3	-	-	CH ₃	-
compuesto I-F.4	-	-	-	CH ₃
compuesto I-F.5	CH ₃	-	CH ₃	-
compuesto I-F.6	CH ₃	-	CH ₃	CH ₃
compuesto I-F.7	-	-	CH ₃	CH ₃
compuesto I-F.8	Cl	-	-	-
compuesto I-F.9	-	Cl	-	-
compuesto I-F.10	-	-	Cl	-
compuesto I-F.11	-	-	-	Cl
compuesto I-F.12	Cl	-	Cl	-
compuesto I-F.13	Cl	-	Cl	Cl
compuesto I-F.14	-	-	Cl	Cl
compuesto I-F.15	F	-	-	-
compuesto I-F.16	-	F	-	-
compuesto I-F.17	-	-	F	-
compuesto I-F.18	-	-	-	F
compuesto I-F.19	F	-	F	-
compuesto I-F.20	F	-	F	F
compuesto I-F.21	-	-	F	F
compuesto I-F.22	Br	-	-	-
compuesto I-F.23	-	Br	-	-
compuesto I-F.24	-	-	Br	-
compuesto I-F.25	-	-	-	Br
compuesto I-F.26	Br	-	Br	-
compuesto I-F.27	Br	-	Br	Br
compuesto I-F.28	-	-	Br	Br
compuesto I-F.29	CF ₃	-	-	-
compuesto I-F.30	-	CF ₃	-	-
compuesto I-F.31	-	-	CF ₃	-
compuesto I-F.32	-	-	-	CF ₃
compuesto I-F.33	CF ₃	-	CF ₃	-
compuesto I-F.34	CF ₃	-	CF ₃	CF ₃

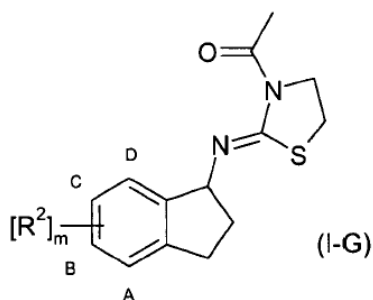
ES 2 380 051 T3

compuesto I-F.35	-	-	CF ₃	CF ₃
compuesto I-F.36	OCF ₃	-	-	-
compuesto I-F.37	-	OCF ₃	-	-
compuesto I-F.38	-	-	OCF ₃	-
compuesto I-F.39	-	-	-	OCF ₃
compuesto I-F.40	OCF ₃	-	OCF ₃	-
compuesto I-F.41	OCF ₃	-	OCF ₃	OCF ₃
compuesto I-F.42	-	-	OCF ₃	OCF ₃
compuesto I-F.43	CH ₃	-	Cl	-
compuesto I-F.44	Cl		CH ₃	-
compuesto I-F.45	CH ₃	-	F	-
compuesto I-F.46	F	-	CH ₃	-
compuesto I-F.47	CH ₃	-	Br	-
compuesto I-F.48	Br	-	CH ₃	-
compuesto I-F.49	CH ₃	-	CF ₃	-
compuesto I-F.50	CF ₃	-	CH ₃	-
compuesto I-F.51	CH ₃	-	OCF ₃	-
compuesto I-F.52	OCF ₃	-	CH ₃	-
compuesto I-F.53	Cl	-	F	-
compuesto I-F.54	F	-	Cl	-
compuesto I-F.55	Cl	-	Br	-
compuesto I-F.56	Br	-	Cl	-
compuesto I-F.57	Cl	-	CF ₃	-
compuesto I-F.58	CF ₃	-	Cl	-
compuesto I-F.59	Cl	-	OCF ₃	-
compuesto I-F.60	OCF ₃	-	Cl	-
compuesto I-F.61	F	-	Br	-
compuesto I-F.62	Br	-	F	-
compuesto I-F.63	F	-	CF ₃	-
compuesto I-F.64	CF ₃	-	F	-
compuesto I-F.65	F	-	OCF ₃	-
compuesto I-F.66	OCF ₃	-	F	-
compuesto I-F.67	Br	-	CF ₃	-
compuesto I-F.68	CF ₃	-	Br	-

compuesto I-F.69	Br	-	OCF ₃	-
compuesto I-F.70	OCF ₃	-	Br	-
compuesto I-F.71	CF ₃	-	OCF ₃	-
compuesto I-F.72	OCF ₃	-	CF ₃	-

7. Fórmula I-G - Compuestos de referencia

Entre los compuestos de la fórmula I, se da preferencia a los siguientes compuestos de la fórmula I-G, donde n= 1, R¹= H₃C-CO y X= S,



5

donde las variables m y R² tienen los significados dados más adelante. Ejemplos de estos compuestos son aquellos donde [R²]_m tienen el significado dado en cada una de las líneas de la tabla G (I-G.1 a I-G.72)

Tabla G:

Posición of R ² :	[R ²] _m			
	A	B	C	D
compuesto I-G.1	CH ₃	-	-	-
compuesto I-G.2	-	CH ₃	-	-
compuesto I-G.3	-	-	CH ₃	-
compuesto I-G.4	-	-	-	CH ₃
compuesto I-G.5	CH ₃	-	CH ₃	-
compuesto I-G.6	CH ₃	-	CH ₃	CH ₃
compuesto I-G.7	-	-	CH ₃	CH ₃
compuesto I-G.8	Cl	-	-	-
compuesto I-G.9	-	Cl	-	-
compuesto I-G.10	-	-	Cl	-
compuesto I-G.11	-	-	-	Cl
compuesto I-G.12	Cl	-	Cl	-
compuesto I-G.13	Cl	-	Cl	Cl
compuesto I-G.14	-	-	Cl	Cl
compuesto I-G.15	F	-	-	-
compuesto I-G.16	-	F	-	-

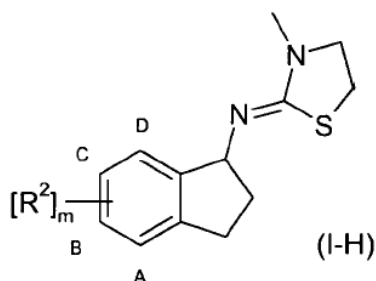
ES 2 380 051 T3

compuesto I-G.17	-	-	F	-
compuesto I-G.18	-	-	-	F
compuesto I-G.19	F	-	F	-
compuesto I-G.20	F	-	F	F
compuesto I-G.21	-	-	F	F
compuesto I-G.22	Br	-	-	-
compuesto I-G.23	-	Br	-	-
compuesto I-G.24	-	-	Br	-
compuesto I-G.25	-	-	-	Br
compuesto I-G.26	Br	-	Br	-
compuesto I-G.27	Br	-	Br	Br
compuesto I-G.28	-	-	Br	Br
compuesto I-G.29	CF ₃	-	-	-
compuesto I-G.30	-	CF ₃	-	-
compuesto I-G.31	-	-	CF ₃	-
compuesto I-G.32	-	-	-	CF ₃
compuesto I-G.33	CF ₃	-	CF ₃	-
compuesto I-G.34	CF ₃	-	CF ₃	CF ₃
compuesto I-G.35	-	-	CF ₃	CF ₃
compuesto I-G.36	OCF ₃	-	-	-
compuesto I-G.37	-	OCF ₃	-	-
compuesto I-G.38	-	-	OCF ₃	-
compuesto I-G.39	-	-	-	OCF ₃
compuesto I-G.40	OCF ₃	-	OCF ₃	-
compuesto I-G.41	OCF ₃	-	OCF ₃	OCF ₃
compuesto I-G.42	-	-	OCF ₃	OCF ₃
compuesto I-G.43	CH ₃	-	Cl	-
compuesto I-G.44	Cl	-	CH ₃	-
compuesto I-G.45	CH ₃	-	F	-
compuesto I-G.46	F	-	CH ₃	-
compuesto I-G.47	CH ₃	-	Br	-
compuesto I-G.48	Br	-	CH ₃	-
compuesto I-G.49	CH ₃	-	CF ₃	-
compuesto I-G.50	CF ₃	-	CH ₃	-

compuesto I-G.51	CH ₃	-	OCF ₃	-
compuesto I-G.52	OCF ₃	-	CH ₃	-
compuesto I-G.53	Cl	-	F	-
compuesto I-G.54	F	-	Cl	-
compuesto I-G.55	Cl	-	Br	-
compuesto I-G.56	Br	-	Cl	-
compuesto I-G.57	Cl	-	CF ₃	-
compuesto I-G.58	CF ₃	-	Cl	-
compuesto I-G.59	Cl	-	OCF ₃	-
compuesto I-G.60	OCF ₃	-	Cl	-
compuesto I-G.61	F	-	Br	-
compuesto I-G.62	Br	-	F	-
compuesto I-G.63	F	-	CF ₃	-
compuesto I-G.64	CF ₃	-	F	-
compuesto I-G.65	F	-	OCF ₃	-
compuesto I-G.66	OCF ₃	-	F	-
compuesto I-G.67	Br	-	CF ₃	-
compuesto I-G.68	CF ₃	-	Br	-
compuesto I-G.69	Br	-	OCF ₃	-
compuesto I-G.70	OCF ₃	-	Br	-
compuesto I-G.71	CF ₃	-	OCF ₃	-
compuesto I-G.72	OCF ₃	-	CF ₃	-

8. Fórmula I-H - Compuestos de referencia

Entre los compuestos de la fórmula I, se da preferencia a los siguientes compuestos de la fórmula I-H, donde n= 1, R1= H₃C y X= S



5

donde las variables m y R² tienen los significados dados más adelante. Ejemplos de estos compuestos son aquellos donde [R²]_m tienen el significado dado en cada línea de la tabla H (compuestos I-H.1 a I-H.72).

Tabla H:

	[R ²] _m
--	--------------------------------

ES 2 380 051 T3

Posición of R ² :	A	B	C	D
compuesto I-H.1	CH ₃	-	-	-
compuesto I-H.2	-	CH ₃	-	-
compuesto I-H.3	-	-	CH ₃	-
compuesto I-H.4	-	-	-	CH ₃
compuesto I-H.5	CH ₃	-	CH ₃	-
compuesto I-H.6	CH ₃	-	CH ₃	CH ₃
compuesto I-H.7	-	-	CH ₃	CH ₃
compuesto I-H.8	Cl	-	-	-
compuesto I-H.9	-	Cl	-	-
compuesto I-H.10	-	-	Cl	-
compuesto I-H.11	-	-	-	Cl
compuesto I-H.12	Cl	-	Cl	-
compuesto I-H.13	Cl	-	Cl	Cl
compuesto I-H.14	-	-	Cl	Cl
compuesto I-H.15	F	-	-	-
compuesto I-H.16	-	F	-	-
compuesto I-H.17	-	-	F	-
compuesto I-H.18	-	-	-	F
compuesto I-H.19	F	-	F	-
compuesto I-H.20	F	-	F	F
compuesto I-H.21	-	-	F	F
compuesto I-H.22	Br	-	-	-
compuesto I-H.23	-	Br	-	-
compuesto I-H.24	-	-	Br	-
compuesto I-H.25	-	-	-	Br
compuesto I-H.26	Br	-	Br	-
compuesto I-H.27	Br	-	Br	Br
compuesto I-H.28	-	-	Br	Br
compuesto I-H.29	CF ₃	-	-	-
compuesto I-H.30	-	CF ₃	-	-
compuesto I-H.31	-	-	CF ₃	-
compuesto I-H.32	-	-	-	CF ₃
compuesto I-H.33	CF ₃	-	CF ₃	-

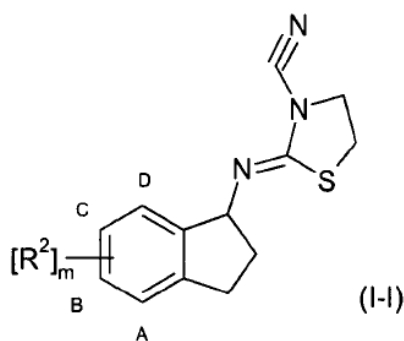
ES 2 380 051 T3

compuesto I-H.34	CF ₃	-	CF ₃	CF ₃
compuesto I-H.35	-	-	CF ₃	CF ₃
compuesto I-H.36	OCF ₃	-	-	-
compuesto I-H.37	-	OCF ₃	-	-
compuesto I-H.38	-	-	OCF ₃	-
compuesto I-H.39	-	-	-	OCF ₃
compuesto I-H.40	OCF ₃	-	OCF ₃	-
compuesto I-H.41	OCF ₃	-	OCF ₃	OCF ₃
compuesto I-H.42	-	-	OCF ₃	OCF ₃
compuesto I-H.43	CH ₃	-	Cl	-
compuesto I-H.44	Cl		CH ₃	-
compuesto I-H.45	CH ₃	-	F	-
compuesto I-H.46	F	-	CH ₃	-
compuesto I-H.47	CH ₃	-	Br	-
compuesto I-H.48	Br	-	CH ₃	-
compuesto I-H.49	CH ₃	-	CF ₃	-
compuesto I-H.50	CF ₃	-	CH ₃	-
compuesto I-H.51	CH ₃	-	OCF ₃	-
compuesto I-H.52	OCF ₃	-	CH ₃	-
compuesto I-H.53	Cl	-	F	-
compuesto I-H.54	F	-	Cl	-
compuesto I-H.55	Cl	-	Br	-
compuesto I-H.56	Br	-	Cl	-
compuesto I-H.57	Cl	-	CF ₃	-
compuesto I-H.58	CF ₃	-	Cl	-
compuesto I-H.59	Cl	-	OCF ₃	-
compuesto I-H.60	OCF ₃	-	Cl	-
compuesto I-H.61	F	-	Br	-
compuesto I-H.62	Br	-	F	-
compuesto I-H.63	F	-	CF ₃	-
compuesto I-H.64	CF ₃	-	F	-
compuesto I-H.65	F	-	OCF ₃	-
compuesto I-H.66	OCF ₃	-	F	-
compuesto I-H.67	Br	-	CF ₃	-

compuesto I-H.68	CF ₃	-	Br	-
compuesto I-H.69	Br	-	OCF ₃	-
compuesto I-H.70	OCF ₃	-	Br	-
compuesto I-H.71	CF ₃	-	OCF ₃	-
compuesto I-H.72	OCF ₃	-	CF ₃	-

9. Fórmula I-I- Compuestos de referencia

Entre los compuestos de la fórmula I, se da preferencia a los siguientes de la fórmula I-I donde n= 1, R¹= CN y X= S



- 5 donde las variables m y R² tienen los significados dados más abajo. Ejemplos de estos compuestos son aquellos donde [R²]_m tiene el significado dado cada línea de la tabla I (compuestos I-I.1 a I-I.72)

Tabla I:

Posición of R ² :	[R ²] _m			
	A	B	C	D
compuesto I-I.1	CH ₃	-	-	-
compuesto I-I.2	-	CH ₃	-	-
compuesto I-I.3	-	-	CH ₃	-
compuesto I-I.4	-	-	-	CH ₃
compuesto I-I.5	CH ₃	-	CH ₃	-
compuesto I-I.6	CH ₃	-	CH ₃	CH ₃
compuesto I-I.7	-	-	CH ₃	CH ₃
compuesto I-I.8	Cl	-	-	-
compuesto I-I.9	-	Cl	-	-
compuesto I-I.10	-	-	Cl	-
compuesto I-I.11	-	-	-	Cl
compuesto I-I.12	Cl	-	Cl	-
compuesto I-I.13	Cl	-	Cl	Cl
compuesto I-I.14	-	-	Cl	Cl
compuesto I-I.15	F	-	-	-

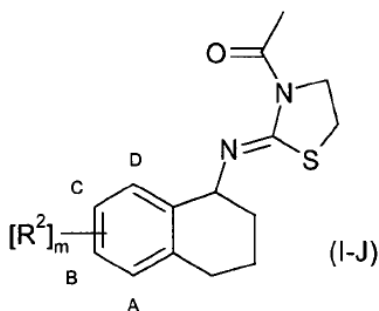
ES 2 380 051 T3

compuesto I-I.16	-	F	-	-
compuesto I-I.17	-	-	F	-
compuesto I-I.18	-	-	-	F
compuesto I-I.19	F	-	F	-
compuesto I-I.20	F	-	F	F
compuesto I-I.21	-	-	F	F
compuesto I-I.22	Br	-	-	-
compuesto I-I.23	-	Br	-	-
compuesto I-I.24	-	-	Br	-
compuesto I-I.25	-	-	-	Br
compuesto I-I.26	Br	-	Br	-
compuesto I-I.27	Br	-	Br	Br
compuesto I-I.28	-	-	Br	Br
compuesto I-I.29	CF ₃	-	-	-
compuesto I-I.30	-	CF ₃	-	-
compuesto I-I.31	-	-	CF ₃	-
compuesto I-I.32	-	-	-	CF ₃
compuesto I-I.33	CF ₃	-	CF ₃	-
compuesto I-I.34	CF ₃	-	CF ₃	CF ₃
compuesto I-I.35	-	-	CF ₃	CF ₃
compuesto I-I.36	OCF ₃	-	-	-
compuesto I-I.37	-	OCF ₃	-	-
compuesto I-I.38	-	-	OCF ₃	-
compuesto I-I.39	-	-	-	OCF ₃
compuesto I-I.40	OCF ₃	-	OCF ₃	-
compuesto I-I.41	OCF ₃	-	OCF ₃	OCF ₃
compuesto I-I.42	-	-	OCF ₃	OCF ₃
compuesto I-I.43	CH ₃	-	Cl	-
compuesto I-I.44	Cl		CH ₃	-
compuesto I-I.45	CH ₃	-	F	-
compuesto I-I.46	F	-	CH ₃	-
compuesto I-I.47	CH ₃	-	Br	-
compuesto I-I.48	Br	-	CH ₃	-
compuesto I-I.49	CH ₃	-	CF ₃	-

compuesto I-I.50	CF ₃	-	CH ₃	-
compuesto I-I.51	CH ₃	-	OCF ₃	-
compuesto I-I.52	OCF ₃	-	CH ₃	-
compuesto I-I.53	Cl	-	F	-
compuesto I-I.54	F	-	Cl	-
compuesto I-I.55	Cl	-	Br	-
compuesto I-I.56	Br	-	Cl	-
compuesto I-I.57	Cl	-	CF ₃	-
compuesto I-I.58	CF ₃	-	Cl	-
compuesto I-I.59	Cl	-	OCF ₃	-
compuesto I-I.60	OCF ₃	-	Cl	-
compuesto I-I.61	F	-	Br	-
compuesto I-I.62	Br	-	F	-
compuesto I-I.63	F	-	CF ₃	-
compuesto I-I.64	CF ₃	-	F	-
compuesto I-I.65	F	-	OCF ₃	-
compuesto I-I.66	OCF ₃	-	F	-
compuesto I-I.67	Br	-	CF ₃	-
compuesto I-I.68	CF ₃	-	Br	-
compuesto I-I.69	Br	-	OCF ₃	-
compuesto I-I.70	OCF ₃	-	Br	-
compuesto I-I.71	CF ₃	-	OCF ₃	-
compuesto I-I.72	OCF ₃	-	CF ₃	-

10. Fórmula I-J - Compuestos de referencia

Entre los compuestos de la fórmula I, se da preferencia a los siguiente compuestos de la fórmula I-J, donde $n = 2$, $R^1 = H_3C-CO$ y $X = S$



- 5 donde las variables m y R^2 tienen los significados dados más adelante. Ejemplo de estos compuestos son aquellos donde $[R^2]_m$ tienen los significados dados en cada línea de la tabla J (compuestos I-J.1 a I-J.72)

Tabla J:

Posición of R ² :	[R ²] _m			
	A	B	C	D
compuesto I-J.1	CH ₃	-	-	-
compuesto I-J.2	-	CH ₃	-	-
compuesto I-J.3	-	-	CH ₃	-
compuesto I-J.4	-	-	-	CH ₃
compuesto I-J.5	CH ₃	-	CH ₃	-
compuesto I-J.6	CH ₃	-	CH ₃	CH ₃
compuesto I-J.7	-	-	CH ₃	CH ₃
compuesto I-J.8	Cl	-	-	-
compuesto I-J.9	-	Cl	-	-
compuesto I-J.10	-	-	Cl	-
compuesto I-J.11	-	-	-	Cl
compuesto I-J.12	Cl	-	Cl	-
compuesto I-J.13	Cl	-	Cl	Cl
compuesto I-J.14	-	-	Cl	Cl
compuesto I-J.15	F	-	-	-
compuesto I-J.16	-	F	-	-
compuesto I-J.17	-	-	F	-
compuesto I-J.18	-	-	-	F
compuesto I-J.19	F	-	F	-
compuesto I-J.20	F	-	F	F
compuesto I-J.21	-	-	F	F
compuesto I-J.22	Br	-	-	-

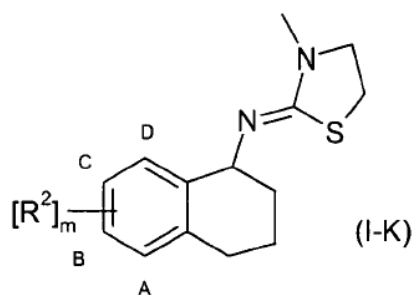
(continuación)

Posición of R ² :	[R ²] _m			
	A	B	C	D
compuesto I-J.23	-	Br	-	-
compuesto I-J.24	-	-	Br	-
compuesto I-J.25	-	-	-	Br
compuesto I-J.26	Br	-	Br	-
compuesto I-J.27	Br	-	Br	Br
compuesto I-J.28	-	-	Br	Br
compuesto I-J.29	CF ₃	-	-	-
compuesto I-J.30	-	CF ₃	-	-
compuesto I-J.31	-	-	CF ₃	-
compuesto I-J.32	-	-	-	CF ₃
compuesto I-J.33	CF ₃	-	CF ₃	-
compuesto I-J.34	CF ₃	-	CF ₃	CF ₃
compuesto I-J.35	-	-	CF ₃	CF ₃
compuesto I-J.36	OCF ₃	-	-	-
compuesto I-J.37	-	OCF ₃	-	-
compuesto I-J.38	-	-	OCF ₃	-
compuesto I-J.39	-	-	-	OCF ₃
compuesto I-J.40	OCF ₃	-	OCF ₃	-
compuesto I-J.41	OCF ₃	-	OCF ₃	OCF ₃
compuesto I-J.42	-	-	OCF ₃	OCF ₃
compuesto I-J.43	CH ₃	-	Cl	-
compuesto I-J.44	Cl		CH ₃	-
compuesto I-J.45	CH ₃	-	F	-
compuesto I-J.46	F	-	CH ₃	-
compuesto I-J.47	CH ₃	-	Br	-
compuesto I-J.48	Br	-	CH ₃	-
compuesto I-J.49	CH ₃	-	CF ₃	-
compuesto I-J.50	CF ₃	-	CH ₃	-
compuesto I-J.51	CH ₃	-	OCF ₃	-
compuesto I-J.52	OCF ₃	-	CH ₃	-

compuesto I-J.53	Cl	-	F	-
compuesto I-J.54	F	-	Cl	-
compuesto I-J.55	Cl	-	Br	-
compuesto I-J.56	Br	-	Cl	-
compuesto I-J.57	Cl	-	CF ₃	-
compuesto I-J.58	CF ₃	-	Cl	-
compuesto I-J.59	Cl	-	OCF ₃	-
compuesto I-J.60	OCF ₃	-	Cl	-
compuesto I-J.61	F	-	Br	-
compuesto I-J.62	Br	-	F	-
compuesto I-J.63	F	-	CF ₃	-
compuesto I-J.64	CF ₃	-	F	-
compuesto I-J.65	F	-	OCF ₃	-
compuesto I-J.66	OCF ₃	-	F	-
compuesto I-J.67	Br	-	CF ₃	-
compuesto I-J.68	CF ₃	-	Br	-
compuesto I-J.69	Br	-	OCF ₃	-
compuesto I-J.70	OCF ₃	-	Br	-
compuesto I-J.71	CF ₃	-	OCF ₃	-
compuesto I-J.72	OCF ₃	-	CF ₃	-

11. Fórmula I-K - Compuestos de referencia

Entre los compuestos de la fórmula I, se da preferencia a los siguientes compuestos de la fórmula I-K, donde n= 2, R1= H₃C, X= S



5

donde las variables y R² tienen los significados dados más abajo. Ejemplos de estos compuestos son aquellos donde [R²]_m tienen el significado dado en cada línea de la tabla K (compuestos I-K.1 a I-K.72)

Tabla K:

Posición of R ² :	[R ²] _m			
	A	B	C	D

ES 2 380 051 T3

compuesto I-K.1	CH ₃	-	-	-
compuesto I-K.2	-	CH ₃	-	-
compuesto I-K.3	-	-	CH ₃	-
compuesto I-K.4	-	-	-	CH ₃
compuesto I-K.5	CH ₃	-	CH ₃	-
compuesto I-K.6	CH ₃	-	CH ₃	CH ₃
compuesto I-K.7	-	-	CH ₃	CH ₃
compuesto I-K.8	Cl	-	-	-
compuesto I-K.9	-	Cl	-	-
compuesto I-K.10	-	-	Cl	-
compuesto I-K.11	-	-	-	Cl
compuesto I-K.12	Cl	-	Cl	-
compuesto I-K.13	Cl	-	Cl	Cl
compuesto I-K.14	-	-	Cl	Cl
compuesto I-K.15	F	-	-	-
compuesto I-K.16	-	F	-	-
compuesto I-K.17	-	-	F	-
compuesto I-K.18	-	-	-	F
compuesto I-K.19	F	-	F	-
compuesto I-K.20	F	-	F	F
compuesto I-K.21	-	-	F	F
compuesto I-K.22	Br	-	-	-
compuesto I-K.23	-	Br	-	-
compuesto I-K.24	-	-	Br	-
compuesto I-K.25	-	-	-	Br
compuesto I-K.26	Br	-	Br	-
compuesto I-K.27	Br	-	Br	Br
compuesto I-K.28	-	-	Br	Br
compuesto I-K.29	CF ₃	-	-	-
compuesto I-K.30	-	CF ₃	-	-
compuesto I-K.31	-	-	CF ₃	-
compuesto I-K.32	-	-	-	CF ₃
compuesto I-K.33	CF ₃	-	CF ₃	-
compuesto I-K.34	CF ₃	-	CF ₃	CF ₃

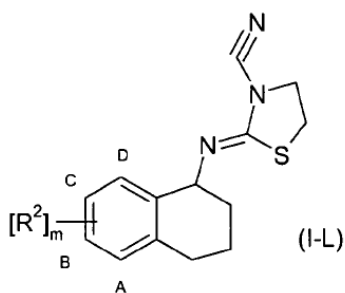
ES 2 380 051 T3

compuesto I-K.35	-	-	CF ₃	CF ₃
compuesto I-K.36	OCF ₃	-	-	-
compuesto I-K.37	-	OCF ₃	-	-
compuesto I-K.38	-	-	OCF ₃	-
compuesto I-K.39	-	-	-	OCF ₃
compuesto I-K.40	OCF ₃	-	OCF ₃	-
compuesto I-K.41	OCF ₃	-	OCF ₃	OCF ₃
compuesto I-K.42	-	-	OCF ₃	OCF ₃
compuesto I-K.43	CH ₃	-	Cl	-
compuesto I-K.44	Cl		CH ₃	-
compuesto I-K.45	CH ₃	-	F	-
compuesto I-K.46	F	-	CH ₃	-
compuesto I-K.47	CH ₃	-	Br	-
compuesto I-K.48	Br	-	CH ₃	-
compuesto I-K.49	CH ₃	-	CF ₃	-
compuesto I-K.50	CF ₃	-	CH ₃	-
compuesto I-K.51	CH ₃	-	OCF ₃	-
compuesto I-K.52	OCF ₃	-	CH ₃	-
compuesto I-K.53	Cl	-	F	-
compuesto I-K.54	F	-	Cl	-
compuesto I-K.55	Cl	-	Br	-
compuesto I-K.56	Br	-	Cl	-
compuesto I-K.57	Cl	-	CF ₃	-
compuesto I-K.58	CF ₃	-	Cl	-
compuesto I-K.59	Cl	-	OCF ₃	-
compuesto I-K.60	OCF ₃	-	Cl	-
compuesto I-K.61	F	-	Br	-
compuesto I-K.62	Br	-	F	-
compuesto I-K.63	F	-	CF ₃	-
compuesto I-K.64	CF ₃	-	F	-
compuesto I-K.65	F	-	OCF ₃	-
compuesto I-K.66	OCF ₃	-	F	-
compuesto I-K.67	Br	-	CF ₃	-
compuesto I-K.68	CF ₃	-	Br	-

compuesto I-K.69	Br	-	OCF ₃	-
compuesto I-K.70	OCF ₃	-	Br	-
compuesto I-K.71	CF ₃	-	OCF ₃	-
compuesto I-K.72	OCF ₃	-	CF ₃	-

12. Fórmula I-L - Compuestos de referencia

Entre los compuestos de la fórmula I, se da preferencia a los siguientes compuestos de la fórmula I-L donde n= 2, R¹= CN y X= S



5

donde las variables m y R² tienen los significados dados más abajo. Ejemplos de estos compuestos son aquellos donde [R²]_m tienen un significado dado en cada línea de la tabla L (Compuestos I-L.1 a I-L.72)

Tabla L:

Posición of R ² :	[R ²] _m			
	A	B	C	D
compuesto I-L.1	CH ₃	-	-	-
compuesto I-L.2	-	CH ₃	-	-
compuesto I-L.3	-	-	CH ₃	-
compuesto I-L.4	-	-	-	CH ₃
compuesto I-L.5	CH ₃	-	CH ₃	-
compuesto I-L.6	CH ₃	-	CH ₃	CH ₃
compuesto I-L.7	-	-	CH ₃	CH ₃
compuesto I-L.8	Cl	-	-	-
compuesto I-L.9	-	Cl	-	-
compuesto I-L.10	-	-	Cl	-
compuesto I-L.11	-	-	-	Cl
compuesto I-L.12	Cl	-	Cl	-
compuesto I-L.13	Cl	-	Cl	Cl
compuesto I-L.14	-	-	Cl	Cl
compuesto I-L.15	F	-	-	-
compuesto I-L.16	-	F	-	-

ES 2 380 051 T3

compuesto I-L.17	-	-	F	-
compuesto I-L.18	-	-	-	F
compuesto I-L.19	F	-	F	-
compuesto I-L.20	F	-	F	F
compuesto I-L.21	-	-	F	F
compuesto I-L.22	Br	-	-	-
compuesto I-L.23	-	Br	-	-
compuesto I-L.24	-	-	Br	-
compuesto I-L.25	-	-	-	Br
compuesto I-L.26	Br	-	Br	-
compuesto I-L.27	Br	-	Br	Br
compuesto I-L.28	-	-	Br	Br
compuesto I-L.29	CF ₃	-	-	-
compuesto I-L.30	-	CF ₃	-	-
compuesto I-L.31	-	-	CF ₃	-
compuesto I-L.32	-	-	-	CF ₃
compuesto I-L.33	CF ₃	-	CF ₃	-
compuesto I-L.34	CF ₃	-	CF ₃	CF ₃
compuesto I-L.35	-	-	CF ₃	CF ₃
compuesto I-L.36	OCF ₃	-	-	-
compuesto I-L.37	-	OCF ₃	-	-
compuesto I-L.38	-	-	OCF ₃	-
compuesto I-L.39	-	-	-	OCF ₃
compuesto I-L.40	OCF ₃	-	OCF ₃	-
compuesto I-L.41	OCF ₃	-	OCF ₃	OCF ₃
compuesto I-L.42	-	-	OCF ₃	OCF ₃
compuesto I-L.43	CH ₃	-	Cl	-
compuesto I-L.44	Cl	-	CH ₃	-
compuesto I-L.45	CH ₃	-	F	-
compuesto I-L.46	F	-	CH ₃	-
compuesto I-L.47	CH ₃	-	Br	-
compuesto I-L.48	Br	-	CH ₃	-
compuesto I-L.49	CH ₃	-	CF ₃	-
compuesto I-L.50	CF ₃	-	CH ₃	-

compuesto I-L.51	CH ₃	-	OCF ₃	-
compuesto I-L.52	OCF ₃	-	CH ₃	-
compuesto I-L.53	Cl	-	F	-
compuesto I-L.54	F	-	Cl	-
compuesto I-L.55	Cl	-	Br	-
compuesto I-L.56	Br	-	Cl	-
compuesto I-L.57	Cl	-	CF ₃	-
compuesto I-L.58	CF ₃	-	Cl	-
compuesto I-L.59	Cl	-	OCF ₃	-
compuesto I-L.60	OCF ₃	-	Cl	-
compuesto I-L.61	F	-	Br	-
compuesto I-L.62	Br	-	F	-
compuesto I-L.63	F	-	CF ₃	-
compuesto I-L.64	CF ₃	-	F	-
compuesto I-L.65	F	-	OCF ₃	-
compuesto I-L.66	OCF ₃	-	F	-
compuesto I-L.67	Br	-	CF ₃	-
compuesto I-L.68	CF ₃	-	Br	-
compuesto I-L.69	Br	-	OCF ₃	-
compuesto I-L.70	OCF ₃	-	Br	-
compuesto I-L.71	CF ₃	-	OCF ₃	-
compuesto I-L.72	OCF ₃	-	CF ₃	-

Debido a su excelente actividad, los compuestos de la fórmula I pueden ser utilizados para controlar plagas animales, en particular insectos, arácnidos y nematodos nocivos seleccionados.

5 Los compuestos de la fórmula I y las composiciones pesticidas que los comprenden son agentes efectivos para controlar plagas animales, seleccionados de insectos, arácnidos y nematodos. Las plagas animales controladas por los compuestos de la fórmula I incluyen por ejemplo:

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

- 5 escarabajos (Coleoptera), por ejemplo *Agrilus sinuatus*, *Agriotes lineatus*, *Agriotes obscurus*, *Amphimallus solstitialis*, *Anisandrus dispar*, *Anthonomus grandis*, *Anthonomus pomorum*, *Atomaria linearis*, *Blastophagus piniperda*, *Blitophaga undata*, *Bruchus rufimanus*, *Bruchus pisorum*, *Bruchus lentis*, *Byctiscus betulae*, *Cassida nebulosa*, *Ceratomyza trifurcata*, *Ceuthorrhinchus assimilis*, *Ceuthorrhinchus napi*, *Chaetocnema tibialis*, *Conoderus vespertinus*, *Crioceris asparagi*, *Diabrotica longicornis*, *Diabrotica 12-punctata*, *Diabrotica virgifera*, *Epilachna varivestis*, *Epitrix hirtipennis*, *Eutinobothrus brasiliensis*, *Hylobius abietis*, *Hypera brunneipennis*, *Hypera postica*, *Ips typographus*, *Lema bilineata*, *Lema melanopus*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Limonius californicus*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Melanotus communis*, *Meligetes aeneus*, *Melolontha hippocastani*, *Melolontha melolontha*, *Oulema oryzae*, *Ortiorrhinchus sulcatus*, *Otiorrhinchus ovatus*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllotreta chrysocephala*, *Phyllophaga*
- 10 sp., *Phyllopertha horticola*, *Phyllotreta nemorum*, *Phyllotreta striolata*, *Popillia japonica*, *Sitona lineatus* y *Sitophilus granaria*;
- dípteros (Diptera), por ejemplo *Aedes aegypti*, *Aedes vexans*, *Anastrepha ludens*, *Anopheles maculipennis*, *Ceratitis capitata*, *Chrysomya bezziana*, *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macellaria*, *Contarinia sorghicola*, *Cordylobia anthropophaga*, *Culex pipiens*, *Dacus cucurbitae*, *Dacus oleae*, *Dasineura brassicae*, *Fannia canicularis*,
- 15 *Gasterophilus intestinalis*, *Glossina morsitans*, *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hylemyia platura*, *Hypoderma lineata*, *Liriomyza sativae*, *Liriomyza trifolii*, *Lucilia caprina*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*, *Lycoria pectoralis*, *Mayetiola destructor*, *Musca domestica*, *Muscina stabulans*, *Oestrus ovis*, *Oscinella frit*, *Pegomya hysocyami*, *Phorbia antiqua*, *Phorbia brassicae*, *Phorbia coarctata*, *Rhagoletis cerasi*, *Rhagoletis pomonella*, *Tabanus bovinus*, *Tipula oleracea* y *Tipula paludosa*;
- 20 tripsos (Thysanoptera), e.g. *Dichromothrips corbeti*, *Frankliniella fusca*, *Frankliniella occidentalis*, *Frankliniella tritici*, *Scirtothrips citri*, *Thrips oryzae*, *Thrips palmi* y *Thrips tabaci*;
- himenópteros (Himenoptera), e.g. *Athalia rosae*, *Atta cephalotes*, *Atta sexdens*, *Atta texana*, *Hoplocampa minuta*, *Hoplocampa testudinea*, *Monomorium pharaonis*, *Solenopsis geminata* y *Solenopsis invicta*;
- 25 heterópteros (Heteroptera), e.g. *Acrosternum hilare*, *Blissus leucopterus*, *Cyrtopeltis notatus*, *Dysdercus cingulatus*, *Dysdercus intermedius*, *Eurygaster integriceps*, *Euschistus impictiventris*, *Leptoglossus phyllopus*, *Lygus lineolaris*, *Lygus pratensis*, *Nezara viridula*, *Piesma quadrata*, *Solubea insularis* y *Thyanta perditor*;
- homópteros (Homoptera), e.g. *Acyrtosiphon onobrychis*, *Adelges laricis*, *Aphidula nasturtii*, *Aphis fabae*, *Aphis forbesi*, *Aphis pomi*, *Aphis gossypii*, *Aphis grossulariae*, *Aphis schneideri*, *Aphis spiraecola*, *Aphis sambuci*, *Acyrtosiphon pisum*, *Aulacorthum solani*, *Bemisia argentifolii*, *Brachycaudus cardui*, *Brachycaudus helichrysi*,
- 30 *Brachycaudus persicae*, *Brachycaudus prunicola*, *Brevicorine brassicae*, *Capitophorus horni*, *Cerosiphia gossypii*, *Chaetosiphon fragaefolii*, *Cryptomyzus ribis*, *Dreyfusia nordmannianae*, *Dreyfusia piceae*, *Dysaphis radicola*, *Dysaulacorthum pseudosolani*, *Dysaphis plantaginea*, *Dysaphis piri*, *Empoasca fabae*, *Hyalopterus pruni*, *Hyperomyzus lactucae*, *Macrosiphum avenae*, *Macrosiphum euphorbiae*, *Macrosiphum rosae*, *Megoura viciae*, *Melanaphis pirarius*, *Metopolophium dirhodum*, *Myzodes persicae*, *Myzus ascalonicus*, *Myzus cerasi*, *Myzus persicae*,
- 35 *Myzus varians*, *Nasonovia ribis-nigri*, *Nilaparvata lugens*, *Pemphigus bursarius*, *Perkinsiella saccharicida*, *Phorodon humuli*, *Psylla mali*, *Psylla piri*, *Rhopalosiphum ascalonicus*, *Rhopalosiphum maidis*, *Rhopalosiphum padi*, *Rhopalosiphum insertum*, *Sappaphis mala*, *Sappaphis mali*, *Schizaphis graminum*, *Schizoneura lanuginosa*, *Sitobion avenae*, *Sogatella furcifera*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Toxoptera aurantiiand*, y *Viteus vitifolii*;
- 40 termitas (Isoptera), e.g. *Calotermes flavicollis*, *Leucotermes flavipes*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes lucifugus* und *Termes natalensis*;
- ortópteros (Orthoptera), e.g. *Acheta domestica*, *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Forficula auricularia*, *Gryllotalpa gryllotalpa*, *Locusta migratoria*, *Melanoplus bivittatus*, *Melanoplus femur-rubrum*, *Melanoplus mexicanus*, *Melanoplus sanguinipes*, *Melanoplus spretus*, *Nomadacris septemfasciata*, *Periplaneta americana*, *Schistocerca americana*, *Schistocerca peregrina*, *Stauronotus maroccanus* y *Tachycines asinamorus*;
- 45 arácnidos tales como arácnidos (Acarina), por ejemplo de las familias *Argasidae*, *Ixodidae* y *Sarcoptidae*, tal como *Amblyomma americanum*, *Amblyomma variegatum*, *Argas persicus*, *Boophilus annulatus*, *Boophilus decoloratus*, *Boophilus microplus*, *Dermacentor silvarum*, *Hyalomma truncatum*, *Ixodes ricinus*, *Ixodes rubicundus*, *Ornithodoros moubata*, *Otobius megnini*, *Dermanyssus gallinae*, *Psoroptes ovis*, *Rhipicephalus appendiculatus*, *Rhipicephalus evertsi*, *Sarcoptes scabiei*, y *Eriophyidae* spp. tal como *Aculus schlechtendali*, *Phyllocoptera oleivora* y *Eriophyes sheldoni*;
- 50 *Tarsonemidae* spp. tal como *Phytonemus pallidus* y *Poliphagotarsonemus latus*; *Tenuipalpidae* spp. tal como *Brevipalpus phoenicis*; *Tetranychidae* spp. tal como *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus kanzawai*, *Tetranychus pacificus*, *Tetranychus telarius* y *Tetranychus urticae*, *Panonychus ulmi*, *Panonychus citri*, y *oligonychus pratensis*;
- siphonatera, e.g. *Xenopsylla cheopsis*, *Ceratophyllus* spp .
- 55 Las composiciones y compuestos de la fórmula I son útiles para el control de nematodos, especialmente nemátodos parasíticos de plantas tales como nemátodos de los nódulos radiculares, *Meloidogine hapla*,

Meloidogine incognita, Meloidogine javanica, y otras especies de Meloidogine; cyst-forming nematodes, Globodera rostochiensis y otras especies de Globodera; Heterodera avenae, Heterodera glicines, Heterodera schachtii, Heterodera trifolii, y otras especies de Heterodera; Seed gall nematodes, especies de Anguina; Stem y foliar nematodes, especies de Aphelenchoides; Sting nematodes, Belonolaimus longicaudatus y otras especies de Belonolaimus; Pine nematodes, Bursaphelenchus xylophilus y otras especies de Bursaphelenchus; Ring nematodes, especies de Criconema, especies de Criconemella, especies de Criconemoides, especies de Mesocriconema; Stem y bulb nematodes, Ditylenchus destructor, Ditylenchus dipsaci y otras especies de Ditylenchus; AWI nematodes, especies de Dolichodorus; Spiral nematodes, Helicotylenchus multicinctus y otras especies de Helicotylenchus; Vainillas y nematodos vainoides, especies de Hemicicliophora y especies de Hemicriconemoides; especies de Hirshmanniella; nemátodos de lanceta, especies de Hoploaimus; nemátodos falsos de nódulos radiculares, especies de Nacobbus; nemátodos de aguja, Longidorus elongatus y otras especies de Longidorus; nemátodos de punta, especies de Pratylenchus; nemátodos de lesión, Pratylenchus neglectus, Pratylenchus penetrans, Pratylenchus curvatus, Pratylenchus goodeyi y otras especies de Pratylenchus; nemátodos, Radopholus similis y otras especies de Radopholus; nemátodos reniformes, Rotylenchus robustus y otras especies de Rotylenchus; especies de Scutellonema; nemátodos de raíces de maleza, Trichodorus primitivus y otras especies de Trichodorus, especies de Paratrichodorus; nemátodos acróbatas, Tylenchorhynchus claytoni, Tylenchorhynchus dubius y otras especies de Tylenchorhynchus; nemátodos de cítricos, especies de Tylenchulus; nemátodos cavadores, especies de Xiphinema; y otras especies de nemátodos parásitos de las plantas.

En una realización preferida de la invención los compuestos de la fórmula I se utilizan para controlar insectos o arácnidos, en particular insectos de los órdenes lepidóptera, coleóptera y homóptera y arácnidos del orden Acarina. Los compuestos de la fórmula I de acuerdo con la presente invención son útiles en particular para controlar insectos de los órdenes lepidóptera y homóptera.

Formulaciones

De acuerdo con lo anterior, la invención proporciona adicionalmente composiciones agrícolas para combatir tales plagas animales, que comprenden tal cantidad de al menos un compuesto de la fórmula I o al menos una sal útil desde el punto de vista agrícola de I y al menos un vehículo inerte líquido y/o sólido aceptable desde el punto de vista agronómico que tenga acción pesticida y, si se desea al menos un surfactante.

Tal composición puede contener un compuesto individual activo de la fórmula I o los enantiómeros del mismo o una mezcla de varios compuestos activos I de acuerdo con la presente invención. La composición de acuerdo con la presente invención puede comprender un isómero individual o mezclas de isómeros así como tautómeros individuales o mezclas de tautómeros.

Para uso en un método de acuerdo con la presente invención, los compuestos I pueden ser convertidos en las formulaciones habituales, por ejemplo, soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, pulverizables, pastas, gránulos y soluciones directamente asperjables. La forma de uso depende del propósito particular y del método de aplicación. Las formulaciones y los métodos de aplicación se escogen para asegurar en cada caso una distribución fina y uniforme del compuesto de la fórmula I de acuerdo con la presente invención.

Las formulaciones se preparan de forma conocida (véase por ejemplo para revisión US 3,060,084, EP-A 707 445 (para concentrados líquidos), Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, Dec. 4, 1967, 147-48, Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, pages 8-57 y et seq. WO 91/13546, US 4,172,714, US 4,144,050, US 3,920,442, US 5,180,587, US 5,232,701, US 5,208,030, GB 2,095,558, US 3,299,566, Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley y Sons, Inc., New York, 1961, Hance et al., Weed Control Handbook, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989 y Mollet, H., Grubemann, A., Formulation technology, Wiley VCH Verlag GmbH, Weinheim (Alemania), 2001, 2. D. A. Knowles, Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations, Kluwer Academic Publishers, Dordrecht, 1998 (ISBN 0-7514-0443-8)), por ejemplo extendiendo el compuesto activo con auxiliares adecuados para formulación de productos agroquímicos, tales como solventes y/o vehículos, si se desea emulsificantes, surfactantes y dispersantes, conservantes, agentes antiespumantes, agentes anticongelación, para formulación de tratamiento de semillas también opcionalmente colorantes y/o aglomerantes y/o agentes gelificantes.

Solventes/vehículos que son adecuados, son por ejemplo:

- solventes tales como agua, solventes aromáticos (por ejemplo productos Solvesso, xileno y similares) parafinas (por ejemplo fracciones minerales), alcoholes (por ejemplo metanol, butanol, pentanol, alcohol bencílico), cetonas (por ejemplo ciclohexano, gama-butirolactona) pirrolidonas (N-metil-pirrolidona (NMP), N-octilpirrolidona NOP), acetatos (diacetato de glicol), lactato de alquilo, lactonas tales como g-butirolactona, glicoles, dimetil amidas de ácidos grasos, ácidos grasos y ésteres de ácidos grasos, triglicéridos, aceites de origen vegetal o animal y aceites modificados tales como aceites vegetales alquilados. En principio, también pueden utilizarse mezclas de solventes.

- vehículos tales como minerales naturales terrestres y minerales sintéticos terrestres, tales como geles de sílica, ácidos silícico finamente dividido, silicatos, talco, caolín, atarcilla, caliza, cal, tiza, bolo, loess, arcilla, dolomita, tierra de diatomáceas, escoma, sulfato de calcio y sulfato de magnesio, óxido de magnesio, materiales sintéticos

triturados, fertilizantes, tales como por ejemplo, sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, ureas y productos de origen vegetal como tortas de cereales, tortas de cortezas de árboles, tortas de madera y tortas de cubiertas de nueces, polvos de celulosa y otros vehículos sólidos.

5 Emulsificantes adecuados son emulsificantes no iónicos y aniónicos (por ejemplo, éteres de alcoholes grasos con polioxietileno, alquilsulfonatos y arilsulfonatos).

Ejemplos de dispersantes son licores residuales de lignina-sulfito y metilcelulosa.

10 Surfactantes adecuados son sales de metales alcalinos, metales alcalinotérreos y de amonio de ácidos lignosulfónicos, ácido naftalenosulfónico, ácido fenolsulfónico, ácido dibutilnaftalenosulfónico, alquilarilsulfonatos, sulfatos de alquilo, sulfonatos de alquilo, sulfatos de alcoholes grasos, ácidos grasos y glicol éteres de alcoholes grasos sulfatados, adicionalmente condensados de naftaleno y derivados de naftaleno sulfonados con formaldehído, condensados de naftaleno o de ácido naftalenosulfónico con fenol y formaldehído, polioxietileno octilfenil éter, etoxilated isooctilfenol, octilfenol, nonilfenol, alquilfenilo poliglicol éteres, tributilfenilo poliglicol éter, tristearilfenilo poliglicol éter, alquilarilo poliéter alcoholes, alcohol y condensados de alcohol graso/óxido de etileno, etoxilated aceite de castor, polioxietileno alquil éteres, polioxipropileno etoxilado, alcohol laurílico poliglicol éter acetal, ésteres de sorbitol.

15 También pueden agregarse a la formulación agentes anticongelantes tales como glicerina, etilén glicol, propilén glicol y bactericidas.

Agentes antiespumantes adecuados son por ejemplo agentes basados en silicio o estearato de magnesio.

Conservantes adecuados son por ejemplo diclorofén y alcohol bencílico hemiformal

20 Espesantes adecuados son compuestos, que confieren un comportamiento de flujo pseudoplástico a la formulación, esto es, alta viscosidad en reposo y baja viscosidad en estado agitado. Puede hacerse mención, en este contexto, por ejemplo, de espesantes comerciales basados en polisacáridos, tales como Xanthan Gum® (Kelzan® de Kelco), Rhodopol® 23 (Rhone Poulenc) o Veegum® (de R.T. Vanderbilt), o filosilicatos orgánicos, tales como Attaclay® (de Engelhardt). Agentes antiespumantes adecuados para las dispersiones de acuerdo con la invención son, por ejemplo, emulsiones de silicona (tales como, por ejemplo, Silikon® SRE, Wacker o Rhodorsil® de Rhodia), alcoholes de cadena larga, ácidos grasos, compuestos organofluorados y mezclas de los mismos. Pueden agregarse biocidas para estabilizar las composiciones de acuerdo con la invención contra el ataque por microorganismos. Los biocidas adecuados están basados, por ejemplo, en isotiazolonas tales como los compuestos comercializados bajo las marcas comerciales Proxel® de Avecia (o Arch) o Acticide® RS de Thor Chemie y Kathon® MK de Rohm & Haas.

25 Agentes anticongelantes adecuados son polioles orgánicos, por ejemplo etilén glicol, propilén glicol o glicerol. Estos se emplean usualmente en cantidades de no más de 10% en peso, con base en el peso total de la composición del compuesto activo. Si es apropiado, las composiciones de compuesto activo de acuerdo con la invención puede comprender 1 a 5% en peso de regulador, con base en la cantidad total de la formulación preparada, para regular el pH, dependiendo la cantidad y tipo de regulador usado de las propiedades químicas del compuesto activo o de los compuestos activos. Ejemplos de reguladores son sales de metales alcalinos de ácidos inorgánicos u orgánicos débiles, tales como, por ejemplo, ácido fosfórico, ácido borónico, ácido acético, ácido propiónico, ácido cítrico, ácido fumárico, ácido tartárico, ácido oxálico y ácido succínico.

40 Sustancias que son adecuados para la preparación de soluciones, emulsiones, pastas o dispersiones oleosas directamente asperjables son fracciones de aceite mineral de punto de ebullición medio a alto, tales como queroseno o aceite diesel, adicionalmente aceites de alquitrán de carbón y aceites de origen vegetal o animal, hidrocarburos alifáticos, cíclicos y aromáticos, por ejemplo tolueno, xileno, parafina, tetrahidronaftaleno, naftalenos alquilados o sus derivados, metanol, etanol, propanol, butanol, ciclohexanol, ciclohexanona, isoforona, solventes polares fuertes, por ejemplo dimetilsulfóxido, N-metilpirrolidona y agua.

45 Los pulverizados, materiales para aspersion y polvos pueden prepararse mezclando o triturando concomitantemente las sustancias activas con un vehículo sólido.

50 Los gránulos, por ejemplo los gránulos recubiertos, gránulos impregnados y gránulos homogéneos, pueden prepararse enlazando los ingredientes activos a vehículos sólidos. Ejemplos de vehículos sólidos son tierras minerales tales como sílica geles, silicatos, talco, caolín, atarcilla, caliza, cal, tiza, bolo, loess, arcilla, dolomita, tierra de diatomáceas, sulfato de calcio, sulfato de magnesio, óxido de magnesio, materiales sintéticos triturados, fertilizantes, tales como, por ejemplo, sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, ureas y productos de origen vegetal tales como tortas de cereales, tortas de corteza de árbol, tortas de madera y tortas de cubierta de nueces, polvos de celulosa y otros vehículos sólidos.

55 En general, las formulaciones comprenden de 0.01 a 95% en peso, preferiblemente de 0.1 a 90% en peso, de los ingredientes activos. Los ingredientes activos se emplean con una pureza del 90% a 100%, preferiblemente de 95% a 100% (de acuerdo con un espectro de RMN).

Para propósitos de tratamiento de semillas, las formulaciones respectivas pueden ser diluidas de 2 a 10 veces llevando a concentraciones en las preparaciones listas para el uso de 0.01 a 60% en peso de compuesto activo por peso, preferiblemente 0.1 a 40% en peso.

5 El compuesto de la fórmula I puede ser usado como tal, en la forma de sus formulaciones o las formas de uso preparadas a partir de las mismas, por ejemplo en la forma de soluciones, polvos, suspensiones o dispersiones, emulsiones, dispersiones en aceite, pastas, productos pulverizables, materiales para dispersión o gránulos, directamente asperjables, por medio de aspersión, atomización, pulverización, dispersión o vertimiento. Las formas de uso dependen completamente de los propósitos buscados, están previstas para asegurar en cada caso la distribución más fina posible de los compuestos activos de acuerdo con la invención.

10 Las formas de uso acuosas pueden prepararse a partir de concentrados en emulsión, pastas o polvos humectables (polvos asperjables, dispersiones en aceite) agregando agua. Para preparar emulsiones, pastas o dispersiones en aceite, las sustancias, como tales o disueltas en un aceite o solvente, pueden homogenizarse en agua por medio de un humectante, aglomerante, dispersante o emulsificante. Alternativamente, es posible preparar concentrados compuestos de sustancias activas, humectantes, aglomerantes, dispersante o emulsificantes y, si es apropiado, un solvente o un aceite, y tales concentrados son adecuados para dilución con agua.

15 Las concentraciones del ingrediente activo en los productos listos para el uso pueden variar dentro de rangos relativamente amplios. En general, van de 0.0001 a 10%, preferiblemente de 0.01 a 1% en peso.

20 Los ingredientes activos también pueden utilizarse exitosamente en el proceso de volumen ultra bajo (ULV), siendo posible aplicar formulaciones que comprenden 95% en peso de ingrediente activo, o incluso aplicar el ingrediente activo sin aditivos.

Los siguientes son ejemplos de formulaciones:

1. Productos para dilución con agua. Para propósitos de tratamiento de semillas, tales productos pueden aplicarse a la semilla diluidos o no diluidos.

A) Concentrados solubles en agua (SL, LS)

25 10 partes en peso del compuesto activo se disuelven en 90 partes en peso de agua o un solvente soluble en agua. Como alternativa, se agregan humectantes u otros auxiliares. El compuesto activo se disuelve por dilución con agua, mediante lo cual se obtiene una formulación al 10% (p/p) de compuesto activo.

B) Concentrados dispersables (DC)

30 Se disuelven 20 partes en peso del compuesto activo en 70 partes en peso de ciclohexanona con adición de 10 partes en peso de un dispersante, por ejemplo polivinilpirrolidona. La dilución con agua da una dispersión, mediante la cual se obtienen una formulación con 20% (p/p) de compuestos activos.

C) Concentrados emulsificables (EC)

35 Se disuelven 15 partes en peso de los compuestos activos en 7 partes en peso de xileno con adición de dodecibencenosulfonato de calcio y aceite de castor etoxilado (en cada caso 5 partes en peso). La dilución con agua produce una emulsión, mediante la cual se obtiene una formulación con 15% (p/p) de compuestos activos.

D) Emulsiones (EW, EO, ES)

40 Se disuelven 25 partes en peso del compuesto activo en 35 partes en peso de xileno con adición de dodecibencenosulfonato de calcio y aceite de castor etoxilado (en cada caso 5 partes en peso). Esta mezcla se introduce en 30 partes en peso de agua por medio de una máquina emulsificadora (por ejemplo Ultraturax) y se convierte en una emulsión homogénea. La dilución con agua da una emulsión, mediante la cual se obtiene una formulación con 25% (p/p) de compuesto activo.

E) Suspensiones (SC, OD, FS)

45 En un molino de bolas con agitación, se trituran 20 partes en peso del compuesto activo con adición de 10 partes en peso de dispersantes, humectantes y 70 partes en peso de agua o de un solvente orgánico para dar una suspensión fina de compuesto activo. La dilución con agua da una suspensión estable del compuesto activo, con la cual se obtiene una formulación con 20% (p/p) de compuesto activo.

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

50 Se trituran finamente 50 partes en peso del compuesto activo con la adición de 50 partes en peso de dispersantes y humectantes y se fabrican gránulos dispersables en agua o gránulos solubles en agua por medio de dispositivos técnicos (por ejemplo, extrusión, torre de aspersión, lecho fluidizado). La dilución con agua da una dispersión o

solución estable del compuesto activo, mediante la cual se obtiene una formulación con 50% (p/p), del compuesto activo.

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

5 Se trituran 75 partes en peso del compuesto activo en un rotor-estator con la adición de 25 partes en peso de dispersantes, humectantes y sílica gel. La dilución con agua da una dispersión o solución estable del compuesto activo, con la cual se obtiene una formulación del 75% (p/p) del compuesto activo.

H) Formulación en gel (GF)

10 En un molino de bolas con agitación, se trituran 20 partes en peso del compuesto activo con la adición de 10 partes en peso de dispersantes, 1 parte en peso de un agente gelificante, humectantes y 70 partes en peso de agua o de un solvente orgánico para dar una suspensión fina del compuesto activo. La dilución con agua da una suspensión estable del compuesto activo, con la cual se obtiene una formulación con 20% (p/p), del compuesto activo.

2. Productos para aplicar no diluidos para aplicaciones foliares. Para propósitos de tratamiento de semillas, tales productos pueden aplicarse a la semilla diluidos o no diluidos.

I) Polvos pulverizables (DP, DS)

15 5 partes en peso del compuesto activo se trituran finamente y se mezclan de manera íntima con 95 partes en peso de caolín finamente dividido. Esto da un producto pulverizable que tiene 5% (p/p) del compuesto activo.

J) Gránulos (GR, FG, GG, MG)

20 Se trituran finamente 0.5 partes en peso del compuesto activo y se asocian con 95.5 partes en peso de vehículos, mediante lo cual se obtiene una formulación con 0.5% (p/p) de compuesto activo. Los métodos habituales son extrusión, aspersión-secado o lecho fluidizado. Esto da gránulos que se pueden aplicar sin dilución para uso foliar.

K) Soluciones ULV (UL)

10 partes en peso del compuesto activo se disuelven en 90 partes en peso de un solvente orgánico, por ejemplo, xileno. Esto da un producto que tiene 10% (p/p) de compuesto activo, el cual se aplica sin dilución para uso foliar.

25 Pueden agregarse diversos tipos de aceites, humectantes, adyuvantes, herbicidas, fungicidas, otros pesticidas o bactericidas a los ingredientes activos, si es apropiado justo inmediatamente antes del uso (mezcla en tanque). Estos agentes se mezclan usualmente con los agentes de acuerdo con la invención en una relación de peso de 1:10 a 10:1.

30 Los compuestos y composiciones de la presente invención, compuestos I, puede aplicarse con otros ingredientes activos, por ejemplo con otros pesticidas, insecticidas, herbicidas, fertilizantes tales como nitrato de amonio, urea, potasa y superfosfato, fitotóxicos y reguladores del crecimiento de las plantas, aseguradores y nematicidas. Estos ingredientes adicionales pueden utilizarse secuencialmente o en combinación con las composiciones antes descritas, si es apropiado también agregados únicamente justo antes del uso (mezcla en tanque). Por ejemplo, las plantas pueden ser asperjadas con una composición de esta invención bien sea antes o después de ser tratadas con otros ingredientes activos.

35 Estos agentes activos adicionales pueden mezclarse con los agentes usados de acuerdo con la invención en una proporción en peso de 1:10 a 10:1. Mezclando los compuestos I o las composiciones que los comprenden en la forma de uso como pesticidas con otros pesticidas da como resultado frecuentemente un espectro de acción pesticida más amplio.

40 La siguiente lista M de pesticidas junto con los cuales pueden utilizarse los compuestos de acuerdo con la invención y con los cuales se podría producir efectos sinérgicos potenciales pretende ilustrar las posibles combinaciones, pero no impone ninguna limitación:

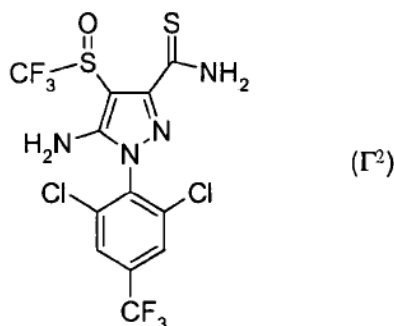
45 M.1. Organo(tio)fosfatos: acephate, azametifos, azinphos-metilo, clorpirifos, clorpirifos-metilo, clorfenvinphos, diazinon, diclorvos, dicrotophos, dimetoate, disulfoton, etion, fenitrotion, fention, isoxation, malation, metamidophos, metidation, metil-paration, mevinphos, monocrotophos, oxydemeton-metilo, paraoxon, paration, fenothoate, phosalone, phosmet, fosfamidon, phorate, phoxim, pirimiphos-metilo, profenofos, protiofos, sulprophos, tetraclorvinphos, terbufos, triazophos, triclorfon;

M.2. Carbamatos: alanycarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, carbarilo, carbofuran, carbosulfan, fenoxicarb, furatiocarb, metiocarb, metomilo, oxamilo, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, triazamate;

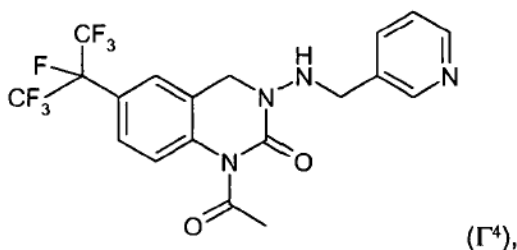
50 M.3. Piretroides: allethrin, bifenthrin, cyfluthrin, cyhalothrin, cyfenothrin, cypermethrin, alpha-cypermethrin, betacypermethrin, zeta-cypermethrin, deltamethrin, empenthrin, esfenvalerate, etofenprox, fenpropathrin,

fenvalerate, imiprothrin, lambda-cyhalothrin, permethrin, prallethrin, pirethrin I y II, resmethrin, silafluofen, tau-fluvalinate, tefluthrin, tetramethrin, tralomethrin, transfluthrin, profluthrin, dimefluthrin;

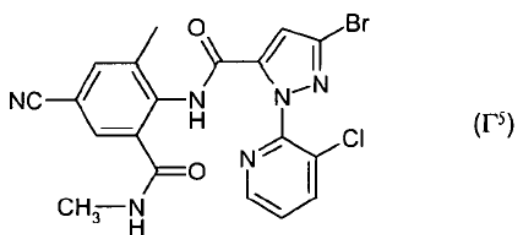
- 5 M.4. Reguladores del crecimiento: a) inhibidores de la síntesis de quitina: benzoilureas: clorfluazuron, diflubenzuron, flucicloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, teflubenzuron, triflumuron; buprofezin, diofenolan, hexytiazox, etoxazole, clofentazine; b) antagonistas de la ecdysona: halofenozide, metoxyfenozide, tebufenozide, azadirachtin; c) juvenoides: piriproxyfen, metoprene, fenoxicarb; d) inhibidores de la biosíntesis de lípidos: spirodiclofen, spiromesifen, spirotetramat;
- M.5. Compuestos agonistas/antagonistas del receptor nicotínico: clotianidin, dinotefuran, imidacloprid, tiametoxam, nitenpiram, acetamiprid, tiacloprid y AKD-1022;
- 10 M.6. Compuestos antagonistas de GABA: acetoprole, endosulfan, etiprole, fipronil, vanilprole, pirafluprole, piriprole, the fenylpirazole compound de la fórmula Γ^2



- M.7. Insecticidas de lactona macrocíclica: abamectin, emamectin, milbemectin, lepimectin, spinosad
- M.8. Compuestos METI I: fenazaquin, piridaben, tebufenpirad, tolfenpirad, flufenerim;
- 15 M.9. Compuestos METI II y III: acequinocilo, fluacyprim, hydrametilnon;
- M.10. Compuestos desacoplantes: clorfenapir;
- M.11. Compuestos inhibidores de la fosforilación oxidativa: cyhexatin, diafenthiuron, fenbutatin oxide, propargite;
- M.12. Compuestos perturbadores de la muda: cyromazine;
- M.13. Compuestos inhibidores de la oxidasa de función mixta: piperonilo butóxido;
- 20 M.14. Compuestos bloqueadores del canal de sodio: indoxacarb, metaflumizone,
- M.15. Diversos: amitraz, benclotiaz, bifenazate, cartap, flonicamid, piridalilo, pimetrozine, sulfur, tiociclám, flubendiamida, cyenopirafen, flupirazofos, cyflumetofen, amidoflumet, pirifluquinazon, el compuesto aminoquinazolinona de la fórmula Γ^4



- 25 N-R'-2,2-dihalo-1-R''ciclo-porpanocarboxamida-2-(2,6-dicloro- α,α,α -tri-fluoro-p-tolil)hidrazona o N-R'-2,2-di (R''')propionamida-2-(2,6-dicloro- α,α,α -trifluoro-p-tolil)-hidrazona, en donde R' is metilo o etilo, halo es cloro o bromo, R'' es hidrógeno o metilo y R''' is metilo o etilo, compuestos de antranilamida como clorantranilprole o el compuesto de la fórmula Γ^5



y compuestos de malononitrilo como se describen en JP 2002 284608, WO 02/89579, WO 02/90320, WO 02/90321, WO 04/06677, WO 04/20399, JP 2004 99597, WO 05/68423, WO 05/68432, o WO 05/63694, especialmente los compuestos de $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$, $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_5\text{CF}_2\text{H}$, $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CF}_3)_2\text{F}$, $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2(\text{CH}_2)_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$, $\text{CF}_2\text{H}(\text{CF}_2)_3\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$, $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$, $\text{CF}_3(\text{CF}_2)_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$, y $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$.

Los compuestos comercialmente disponibles del grupo M pueden encontrarse en The Pesticide Manual, 13th edición, British Crop Protection Council (2003) entre otras publicaciones. Las tioamidas de fórmula Γ2 y su preparación han sido descritas en WO 98/28279. La Lepimectina también es conocida de Agro Project, PJB Publications Ltd, November 2004. El benclotiaz y su preparación han sido descritos en EP-A1 454621. El Metidatió y el Paraoxona y su preparación han sido descritos en Farm Chemicals Handbook, Volume 88, Meister Publishing Company, 2001. El Acetoprol y su preparación han sido descritos en WO 98/28277. Metaflumizona y su preparación se han descrito en EPA1 462 456. Flupirazofos han sido descritos en Pesticide Science 54, 1988, p.237-243 y en US 4822779. Pirafluprole y su preparación se han descrito en JP 2002193709 y en WO 01/00614. Piriprole y su preparación se han descrito en WO 98/45274 y en US 6335357. Amidoflumet y su preparación han sido descritos en US 6221890 y en JP 21010907. Flufenimerim y su preparación han sido descritos en WO 03/007717 y en WO 03/007718. Cyflumetofen y su preparación han sido descritos en WO 04/080180. El compuesto aminoquinazolinona de la fórmula Γ4 ha sido descrito en EP A 109 7932.

Antranilamidas de la fórmula Γ5 y su preparación han sido descritos en WO 01/70671; WO 02/48137; WO 03/24222, WO 03/15518, WO 04/67528; WO 04/33468; y WO 05/118552. Los compuestos de malononitrilo $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$, $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_5\text{CF}_2\text{H}$, $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CF}_3)_2\text{F}$, $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2(\text{CH}_2)_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$, $\text{CF}_2\text{H}(\text{CF}_2)_3\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$, $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$, $\text{CF}_3(\text{CF}_2)_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$, y $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$ han sido descritos en WO 05/63694.

Asociados de mezcla fungicidas son los seleccionados del grupo F consistente de

F.1 acilalaninas tal como benalaxilo, metalaxilo, ofurace, oxadixyl;

F.2 derivados de amina tal como aldimorph, dodine, dodemorph, fenpropimorph, fenpropidin, guazatine, iminoctadine, spiroxamin, tridemorph;

F.3 anilino pirimidinas tal como pirimetanil, mepanipirim o cyrodinyl;

F.4 antibióticos tal como cicloheximid, griseofulvin, kasugamicina, natamicina, polioxin o estreptomycin;

F.5 azoles tal como bitertanol, bromoconazole, cyproconazole, difenoconazole, dinitroconazole, epoxiconazole, fenbuconazole, fluquiconazole, flusilazole, hexaconazole, imazalil, metconazole, myclobutanil, penconazole, propiconazole, procloraz, protriocnazole, tebuconazole, triadimefon, triadimenol, triflumizol, triticonazole, flutriafol;

F.6 dicarboximidias tal como iprodion, myclozolin, procimidon, vinclozolin;

F.7 ditiocarbamatos tal como ferbam, nabam, maneb, mancozeb, metam, metiram, propineb, policarbamato, thiram, ziram, zineb;

F.8 compuestos heterocíclicos tal como anilazine, benomilo, boscalid, carbendazim, carboxin, oxicarboxin, cyazofamid, dazomet, ditianon, famoxadon, fenamidon, fenarimol, fuberidazole, flutolanil, furametpir, isoprothiolane, mepronil, nuarimol, probenazole, proquinazid, pirifenox, piroquilon, quinoxifen, siltiofam, tiabendazole, thifluzamid, tiophanate-metilo, tiadinil, triciclazole, triforine;

F.9 fungicidas de cobre tal como mezcla de Bordeaux, acetato de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato básico de cobre;

F.10 derivados de nitrofenilo tal como binapacril, dinocap, dinobuton, nitroftalisopropilo;

F.11 fenilpirroles tal como fempiclonil o fludioxonil;

F.12 estrobilurinas tal como azoxystrobin, dimoxystrobin, fluoxastrobin, kresoxim-metilo, metominostrobin, orysastrobin, picoxystrobin o trifloxystrobin;

F.13 derivados del ácido sulfénico tal como captafol, captan, dichlofluanid, folpet, toliifluanid;

F.14 cinemamidas y análogos tal como dimetomorph, flumetover o flumorph;

- 5 F.15 azufre, y otros fungicidas tal como acibenzolar-S-metilo, bentiavalicarb, carpropamid, clorothalonil, cyflufenamid, cimoxanil, dazomet, diclomezin, diclocimet, dietofencarb, edifenphos, etaboxam, fenhexamid, fentinacetate, fenoxanil, ferimzone, fluazinam, fosetilo, fosetil-aluminum, iprovalicarb, hexaclorobenceno, metrafenon, pencicuron, propamocarb, ftalide, toloclofosmetilo, quintozene, zoxamid.

Aplicaciones

- 10 La plaga animal, esto es los insectos, arácnidos y nematodos, la planta, suelo o agua en el cual la planta está creciendo pueden ponerse en contacto con los presentes compuestos I o composiciones que los contienen por cualquier método de aplicación conocido en la técnica. Como tal, "poner en contacto" incluye tanto contacto directo (aplicar los compuestos/composiciones sobre la plaga animal o planta - típicamente al follaje, tallo o raíces de la planta) y contacto indirecto (aplicar los compuestos/composiciones al sitio de localización de la plaga animal o
- 15 planta).

Los compuestos de la fórmula I o las composiciones pesticidas que los comprenden pueden utilizarse para proteger plantas en crecimiento y cultivos de ataque o infestación por plagas animales, especialmente insectos, ácaros o arácnidos poniendo en contacto la planta/cultivo con una cantidad efectiva como pesticida de los compuestos de la fórmula I. El término "cultivo" se refiere tanto a los cultivos en crecimiento como a los recolectados.

- 20 Además, las plagas animales pueden controlarse poniendo en contacto la plaga objetivo, su fuente de alimentación, hábitat, terrenos de cría o sus localizaciones con una cantidad efectiva como pesticida de los compuestos de la fórmula I. Como tal, la aplicación puede llevarse a cabo antes o después de la infección de la localización, de los cultivos en crecimiento o de los cultivos recolectados por parte de la plaga.

- 25 Los compuestos de la invención también pueden aplicarse de forma preventiva en lugares donde se espera la presencia de las plagas.

- Los compuestos de la fórmula I también pueden utilizarse para proteger plantas en crecimiento del ataque o infestación por plagas poniendo en contacto la planta con una cantidad efectiva como pesticida de compuestos de la fórmula I. Como tal, "poner en contacto" incluye tanto contacto directo (aplicar los compuestos/composiciones directamente sobre la plaga y/o planta – típicamente al follaje, tallo o raíces de la planta) y contacto indirecto (aplicar los compuestos/composiciones a la localización de la plaga y/o planta).
- 30

"Localización" significa un hábitat, terreno de cría, planta, semilla, suelo, área, material o ambiente en el cual una plaga o parásito está creciendo o puede crecer.

- En general, "cantidad efectiva como pesticida" significa la cantidad de ingrediente activo necesaria para alcanzar un efecto observable sobre el crecimiento, incluyendo los efectos de necrosis, muerte, retardamiento, prevención y
- 35 eliminación, destrucción o de alguna otra forma disminución de la presencia y actividad del organismo objetivo. La cantidad efectiva como pesticida puede variar para los diversos compuestos/composiciones usados en la invención. Una cantidad efectiva como pesticida de las composiciones también variará de acuerdo con las condiciones prevalentes tales como efecto y duración pesticidas deseados, clima, especies objetivo, localización, modo de aplicación, y similares.

- 40 Los compuestos de la fórmula I son efectivos a través tanto de contacto (vía suelo, vidrio, pared, camas, alfombras, partes de plantas o partes de animales) e ingestión (cebo, o parte de planta).

Para uso contra hormigas, termitas, avispas, moscas, mosquitos, saltamontes o cucarachas, los compuestos de la fórmula I se usan preferiblemente en una composición en cebo.

- El cebo puede ser una preparación líquida, sólida o semisólida (por ejemplo un gel). Los cebos sólidos pueden conformarse en diversas formas y configuraciones adecuadas a la aplicación respectiva, por ejemplo gránulos, bloques, barras, discos. Los cebos líquidos pueden llenarse en diversos dispositivos para asegurar una aplicación apropiada, por ejemplo, contenedores abiertos, dispositivos de aspersión, fuentes de goteo o fuentes de evaporación. Los geles pueden basarse en matrices acuosas u oleosas y pueden formularse de acuerdo con las necesidades particulares en términos de adhesividad, retención de humedad o características de envejecimiento.
- 45

- 50 El cebo empleado en la composición es un producto, que es suficientemente atractivo para incitar los insectos tales como hormigas, termitas, avispas, moscas, mosquitos, saltamontes, etc., o cucarachas a comerlo. La atracción puede manipularse utilizando estimulantes de la alimentación o feromonas sexuales. Se escogen estimulantes para la alimentación, por ejemplo, pero no exclusivamente, de proteínas animales y/o vegetales (carne, pescado, sangre,

- partes de insectos, yema de huevo), de grasas y aceites de origen animal y/o vegetal, o mono-, oligo- o poliorganosacáridos, especialmente de sacarosa, lactosa, fructosa, dextrosa, glucosa, almidón, pectina o incluso melazas o miel. Partes frescas o decadentes de frutas, cultivos, plantas, animales, insectos o partes específicas de los mismos pueden también servir como estimulante para la alimentación. Se sabe que las feromonas sexuales son más específicas para los insectos. Feromonas específicas se describen en la literatura y son conocidas para las personas experimentadas en la técnica.
- Las formulaciones de los compuestos de la fórmula I como aerosoles (por ejemplo en latas de aspersión), aspersiones en aceite o aspersiones por bombeo son altamente adecuados para el usuario no profesional para controlar plagas tales como moscas, pulgas, garrapatas, mosquitos o cucarachas. Las recetas en aerosol están compuestas preferiblemente del compuesto activo, solventes tales como alcoholes inferiores (por ejemplo metanol, etanol, propanol, butanol), cetonas (por ejemplo acetona, metil etil cetona), hidrocarburos parafínicos (por ejemplo, querosenos) que tienen rangos de ebullición de aproximadamente 50 a 250°C, dimetilformamida, N-metilpirrolidona, dimetil sulfóxido, hidrocarburos aromáticos tales como tolueno, xileno, agua, auxiliares adicionales tales como emulsificantes tales como monooleato de sorbitol, etoxilato de oleilo que tienen 3-7 moles de óxido de etileno, etoxilado de alcoholes grasos, aceites perfumados tales como aceites etéreos, ésteres o ácidos grasos medios con alcoholes inferiores, compuestos de carbonilo aromáticos, si es apropiado estabilizantes tales como benzoato de sodio, surfactantes anfotéricos, epóxidos inferiores, ortoformiato de trietilo y, si se requiere, propelentes tales como propano, butano, nitrógeno, aire comprimido, dimetil éter, dióxido de carbono, óxido nitroso o mezclas de estos gases.
- Las formulaciones de aspersión en aceite difieren de las recetas en aerosol en que no se utilizan propelentes.
- Los compuestos de la fórmula I y sus composiciones respectivas pueden utilizarse en mosquiteros y alambres de fumigación, cartuchos de humo, placas vaporizadoras o vaporizadores a largo plazo y también en papeles para polillas, paños para polillas u otros sistemas vaporizadores independientes del calor.
- Los métodos para controlar enfermedades infecciosas transmitidas por insectos (por ejemplo, malaria, dengue y fiebre amarilla, filariasis linfática y leishmaniasis) con compuestos de la fórmula I y sus respectivas composiciones comprenden también tratar superficies de construcciones y casas, aspersión en aire e impregnación de cortinas, tiendas, artículos de vestuario, camas, trampas para mosca tsetsé o similares. Las composiciones insecticidas para aplicación a telas, textiles, tejidos, material no tejido, material para redes o láminas y tarpaulinas comprenden preferiblemente una mezcla que incluye el insecticida, opcionalmente un repelente y al menos un aglomerante. Repelentes adecuados por ejemplo son N,N-Dietil-meta-toluamida (DEET), N,N-dietilfenilacetamida (DEPA), 1-(3-ciclohexan-1-il-carbonil)-2-metilpiperina, ácido (2-hidroximetilciclohexil) acético lactona, 2-etil-1,3-hexandiol, indalon, Metilneodecanamida (MNDA), un piretroide no utilizado para el control de insectos tal como {(+/-)-3-allyl-2-metil-4-oxociclopent-2-(+)-enil-(+)-trans-crisantemato (Esbiothrin), un repelente derivado de o idéntico a extractos de plantas tales como limoneno, eugenol, (+)-Eucamalo (1), (-)-1-epi-eucamalo o extractos crudos vegetales de plantas tales como Eucalyptus maculata, Vitex rotundifolia, Cimopogon martinii, Cimopogon citratus (limonaria), Cimopogon nartdus (citronela). Los aglomerantes adecuados se seleccionan por ejemplo de polímeros y copolímeros de ésteres vinílicos de ácidos alifáticos (tales como acetato de vinilo y versatato de vinilo), ésteres acrílico y metacrílico de alcoholes, tales como acrilato de butilo, 2-etilhexilacrilato, y acrilato de metilo, hidrocarburos insaturados mono- y dietilénicamente, tales como estireno, y dienos alifáticos tales como butadieno.
- La impregnación de cortinas y camas se hace en general sumergiendo el material textil en emulsiones o dispersiones del insecticida o asperjándolos sobre las camas.
- Los compuestos de la fórmula I y sus composiciones pueden utilizarse para proteger materiales de madera tales como árboles, cercas, durmientes, etc., y construcciones tales como casas, casas exteriores, fábricas, pero también materiales de construcción, muebles, cueros, fibras, artículos de vinilo, alambres y cables eléctricos, etc., frente a hormigas y/o termitas, y para controlar hormigas y termitas y evitar que hagan daño a cultivos o seres humanos (por ejemplo, cuando las plagas invaden las casas y las instalaciones públicos). Los compuestos de la fórmula I se aplican no solamente en la superficie del suelo circundante o en el suelo bajo el piso con el fin de proteger los materiales de madera sino que también puede aplicarse a artículos elaborados en madera tales como superficies de concreto bajo el piso, soportes, vigas, aglomerados, muebles, etc., artículos de madera tales como tableros de partículas, tableros medios, etc., y artículos de vinilo, tales como alambres eléctricos recubiertos, láminas de vinilo, material aislante del calor, tales como espumas de estireno, etc. En caso de aplicación contra hormigas que afectan cultivos o seres humanos, el controlador de hormigas de la presente invención se aplica a los cultivos o al suelo circundante, o se aplica directamente al nido de las hormigas o similares.
- En el caso del tratamiento de suelos o para aplicación al sitio de alojamiento de las plagas o nido, la cantidad de ingrediente activo varía desde 0.0001 a 500 g por 100 m², preferiblemente desde 0.001 a 20 g por 100 m².
- Las tasas de aplicación habituales en la protección de materiales son, por ejemplo, de 0.01 g hasta 1000 g del compuesto activo por m² al material tratado, deseablemente de 0.1 g a 50 g por m².

Las composiciones insecticidas para la impregnación de los materiales contienen típicamente de 0.001 a 95% en peso, preferiblemente de 0.1% a 45% en peso, y más preferiblemente de 1 a 25% en peso de al menos un repelente y/o insecticida.

5 Para uso en las composiciones de cebo, el contenido típico del ingrediente activo va de 0.001% en peso a 15% en peso, deseablemente de 0.001% en peso a 5% en peso del compuesto activo.

Para el uso en composiciones para aspersión, el contenido del ingrediente activo va de 0.001 a 80% en peso, preferiblemente de 0.01 a 50% en peso y lo más preferiblemente de 0.01 a 15% en peso.

10 Para uso en el tratamiento de plantas de cultivo, la tasa de aplicación de los ingredientes activos de esta invención puede estar en el rango de 0.1 g a 4000 g por hectárea, deseablemente de 25 g a 600 g por hectárea, más deseablemente de 50 g a 500 g por hectárea.

Tratamiento de semillas

Los compuestos de la fórmula I también son adecuados para el tratamiento de semillas con el fin de proteger la semilla de la plaga de insectos, en particular de plagas de insectos que viven en el suelo y de las raíces y brotes resultantes de las plantas contra plagas del suelo e insectos foliares.

15 Los compuestos de la fórmula I son particularmente útiles para la protección de semillas frente a plagas del suelo y de las raíces y brotes resultantes de la planta contra plagas del suelo e insectos foliares. Se prefiere la protección de las raíces y brotes de las plantas. Se prefiere más la protección de los brotes resultantes de las plantas frente a insectos perforadores y chupadores, donde la protección frente a los áfidos es la más preferida.

20 La presente invención comprende por lo tanto un método para la protección de semillas frente a insectos, en particular de insectos del suelo y foliares, comprendiendo dicho método poner en contacto las semillas antes de la siembra y/o después la pregerminación con un compuesto de la fórmula general I o una sal del mismo. En particular se prefiere un método donde las raíces y brotes de la planta son protegidos, más preferiblemente un método donde se protegen los brotes de las plantas frente a insectos perforadores y chupadores, lo más preferiblemente un método donde se protegen los brotes de las plantas frente a áfidos.

25 El término semilla abarca semillas y propágulos de las plantas de todas las clases incluyendo pero no limitándose a semillas verdaderas, partes de semillas, retoños, bulbos subterráneos, bulbos, frutas, tubérculos, granos, cortes, cortes de brotes y similares y en una realización preferida significa semillas verdaderas.

30 El término tratamiento de semillas comprende todas las técnicas de tratamiento de semillas conocidas en la técnica, tales como cubrimiento de semillas, recubrimiento de semillas, pulverización de semillas, inmersión de semillas y peletización de semillas. La presente invención también abarca semillas recubiertas con o que contienen el compuesto activo.

35 El término "recubierto con y/o que contiene" significa en general que el ingrediente activo está en su mayor parte sobre la superficie del producto de propagación en el momento de la aplicación, aunque una parte mayor o menor del ingrediente puede penetrar en el producto de propagación, dependiendo del método de aplicación. Cuando el dicho producto de propagación se replanta, puede absorber el ingrediente activo.

40 Semillas adecuadas son semillas de cereales, cultivos de raíz, cultivos oleosos, vegetales, especies, ornamentales, por ejemplo semillas de trigo durum o de otros trigos, cebada, avena, centeno, maíz (maíz de mazorca y maíz de azúcar/maíz dulce y de campo), soja, cultivos oleaginosas, crucíferas, algodón, girasoles, plátanos, arroz, colza oleaginosa, colza de rábano, remolacha de azúcar, remolacha de forraje, berenjenas, patatas, césped, pastos, turbas, pastos de forraje, tomates, puerros, calabacines/calabazas, repollo, lechuga iceberg, pimienta, cocombros, melones, especies de Brassica, melones, judías, guisantes, ajo, cebollas, zanahorias, plantas tuberosas tales como patatas, azúcar caña, tabaco, uvas, petunias, geranio/pelargonios, margaritas y claveles.

45 Además, el compuesto activo puede ser utilizado en el tratamiento de semillas de plantas, que toleran la acción de herbicidas o fungicidas o insecticidas, obedeciendo a los métodos de cruzamiento, incluyendo ingeniería genética.

50 Por ejemplo, el compuesto activo puede ser empleado en el tratamiento de semillas a partir de plantas, que son resistentes a herbicidas del grupo consistente de sulfonilureas, imidazolinonas, glufosinato de amonio o glifosato isopropilamonio y sustancias activas análogos (véase por ejemplo, EP-A-0242236, EP-A-242246) (WO 92/00377) (EPA-0257993, U.S. Pat. No. 5,013,659) o en plantas de cultivos transgénicos, por ejemplo algodón, con la capacidad de producir toxinas del *Bacillus thuringiensis* (toxinas Bt) que hacen las plantas resistentes a ciertas plagas (EP-A-0142924, EP-A-0193259),

Adicionalmente, el compuesto activo puede ser utilizado también para el tratamiento de semillas de plantas, que tienen características modificadas en comparación con las plantas existentes, que pueden ser generadas por ejemplo por métodos tradicionales de cruzamiento y/o la generación de mutantes o por procedimientos

recombinantes). Por ejemplo, se ha descrito un cierto número de casos de modificaciones recombinantes de plantas de cultivo para el propósito de modificar el almidón sintetizado en las plantas (por ejemplo, WO 92/11376, WO 92/14827, WO 91/19806) o de plantas de cultivos transgénicos que tienen una composición de ácidos grasos modificada (WO 91/13972).

- 5 La aplicación de tratamientos a semillas del compuesto activo se lleva a cabo asperjando o pulverizando las semillas antes de la siembra de las plantas y antes de la aparición de las plantas.

Las composiciones que son especialmente útiles para el tratamiento de semillas son por ejemplo:

A Concentrados solubles (SL, LS)

D Emulsiones (EW, EO, ES)

- 10 E Suspensiones (SC, OD, FS)

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

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

H Formulaciones en gel (GF)

I Polvos pulverizables (DP, DS)

- 15 Las formulaciones convencionales para tratamiento de semillas incluyen por ejemplo concentrados fluidos FS, soluciones LS, polvos para tratamiento en seco DS, polvos dispersables en agua para tratamiento en pasta WS, polvos solubles en agua SS y emulsiones ES y CE y formulaciones en gel GF. Estas formulaciones pueden aplicarse a la semilla diluidas o no diluidas. La aplicación a las semillas se lleva a cabo antes de la siembra, bien sea directamente sobre las semillas o después de haber pregerminado estas últimas

- 20 En una realización preferida se usa una formulación FS para un tratamiento de semillas. Típicamente, una formulación FS puede comprender 1-800 g/l de ingrediente activo, 1-200 g/l de surfactante, 0 a 200 g/l de agente anticongelante, 0 a 400 g/l de aglomerante, 0 a 200 g/l de un pigmento y hasta 1 litro de solvente, preferiblemente agua.

- 25 Formulaciones FS especialmente preferidas de los compuestos de la fórmula I para el tratamiento de semillas comprenden usualmente 0.1 a 80% en peso (1 a 800 g/l) del ingrediente activo, de 0.1 a 20% en peso (1 a 200 g/l) de al menos un surfactante, por ejemplo, 0.05 a 5% en peso de agua y de 0.5 a 15% en peso de un agente dispersante, hasta 20% en peso, por ejemplo de 5 a 20% de un agente anticongelante, de 0 a 15% en peso, por ejemplo, 1 a 15% en peso de un pigmento y/o un colorante, de 0 a 40 % en peso, e.g. 1 a 40 % en peso de un aglomerante (adhesivo/agente de adhesión), opcionalmente hasta 5 % en peso, por ejemplo 0.1 a 5% en peso de un espesante, opcionalmente de 0.1 a 2% de un agente antiespumante, y opcionalmente un conservante tal como un biocida, antioxidante o similar, por ejemplo en una cantidad de 0.01 a 1% en peso y un agente de relleno/vehículo hasta 100% en peso.

- 30 Las formulaciones para el tratamiento de semillas pueden comprender adicionalmente aglomerantes y opcionalmente colorantes.

- 35 Los aglomerantes pueden agregarse para mejorar la adhesión de los materiales activos sobre las semillas después del tratamiento. Aglomerantes adecuados son surfactantes EO/PO de copolímeros de bloque, pero también polivinilalcoholes, polivinilpirrolidonas, poliacrilatos, polimetacrilatos, polibutenos, poliisobutilenos, poliestireno, polietilenaminas, polietilenamidas, polietileniminas (Lupasol®, Polimin®), poliéteres, poliuretanos, polivinilacetato, tilosa y copolímeros derivados de estos polímeros.

- 40 Opcionalmente, también pueden incluirse colorantes en la formulación. Colorantes o pigmentos adecuados para formulaciones para el tratamiento de semillas son rodamina B, C.I. Pigmento rojo 112, C.I. Solvente rojo 1, pigmento azul 15:4, pigmento azul 15:3, pigmento azul 15:2, pigmento azul 15:1, pigmento azul 80, pigmento amarillo 1, pigmento amarillo 13, pigmento rojo 112, pigmento rojo 48:2, pigmento rojo 48:1, pigmento rojo 57:1, pigmento rojo 53:1, pigmento naranja 43, pigmento naranja 34, pigmento naranja 5, pigmento verde 36, pigmento verde 7, pigmento blanco 6, pigmento pardo 25, violeta básico 10, violeta básico 49, rojo ácido 51, rojo ácido 52, rojo ácido 14, azul ácido 9, amarillo ácido 23, rojo básico 10, rojo básico 108.

- 45 Ejemplos de un agente gelificante es carragenano (Satiagel®)

- 50 En el tratamiento de semillas, las tasas de aplicación de los compuestos I van generalmente de 0.1 g hasta 10 kg por 100 kg de semillas, preferiblemente de 1 g a 5 kg por 100 kg de semillas, más preferiblemente de 1 g a 1000 g por 100 kg de semillas y en particular de 1 g a 200 g por 100 kg de semillas. Para cultivos específicos tales como lechuga la tasa puede ser más alta.

La invención por lo tanto también se relaciona con semillas que comprenden un compuesto de la fórmula I y/o una sal útil desde el punto de vista agrícola de I, tal como se definió aquí. La cantidad del compuesto I o de la sal útil desde el punto de vista agrícola del mismo, en general variará de 0.1 g a 10 kg por 100 kg de semilla, preferiblemente de 1 g a 5 kg por 100 kg de semilla, en particular de 1 g a 1000 g por 100 kg de semilla.

5 Sanidad animal

Los compuestos de la fórmula I o los enantiómeros o las sales aceptables desde el punto de vista veterinario de los mismos también son en particular adecuados para utilizarse en el combate de parásitos en y sobre animales.

10 Un objeto de la presente invención por lo tanto es proveer nuevos métodos para controlar parásitos en y sobre animales. Otro objeto de la invención es proveer pesticidas más seguros para animales. Otro objeto de la invención es adicionalmente proveer pesticidas para animales que puedan ser utilizados en dosis inferiores a los pesticidas existentes. Y otro objeto de la invención es proveer pesticidas para animales, que provean un control residual prolongado de los parásitos.

15 La invención también se relaciona con composiciones que contienen una cantidad efectiva como parasitocida de los compuestos de la fórmula I o los enantiómeros o sales aceptables desde el punto de vista veterinario de los mismos y un vehículo aceptable, para combatir parásitos en y sobre animales.

La presente invención también proporciona un método para tratar, controlar, prevenir y proteger animales contra la infestación e infección por parásitos, que comprende administrar oralmente, por vía tópica o parenteral o aplicar a los animales una cantidad efectiva como parasitocida de un compuesto de la fórmula I o los enantiómeros o las sales aceptables desde el punto de vista veterinario de los mismos o una composición que los comprende.

20 La invención también provee un proceso para preparación de una composición para tratar, controlar, prevenir o proteger animales contra la infestación o infección por parásitos que comprende una cantidad efectiva como parasitocida de un compuesto de la fórmula I o los enantiómeros o sales aceptables desde el punto de vista veterinario de los mismos o una composición que los comprende.

25 La actividad de los compuestos contra las plagas agrícolas no sugiere su adecuabilidad para el control de endo y ectoparásitos en y sobre animales lo que requiere, por ejemplo, dosis bajas no eméticas, en el caso de la aplicación oral, compatibilidad metabólica con el animal, baja toxicidad y un manejo seguro.

Sorprendentemente se ha encontrado ahora que los compuestos de la fórmula I son adecuados para combatir endo y ectoparásitos en y sobre animales.

30 Los compuestos de la fórmula I o los enantiómeros o las sales aceptables desde el punto de vista veterinario de los mismos y las composiciones que los comprenden se utilizan preferiblemente para controlar y prevenir infestaciones e infecciones en animales incluyendo animales de sangre caliente (incluyendo humanos) y peces. Son adecuados por ejemplo para controlar y evitar infestaciones e infecciones en mamíferos tales como ganado, ovejas, cerdos, camellos, venados, caballos, cerdos, aves, conejos, cabras, perros y gatos, búfalos de agua, asnos, corzos y renos, y también en animales de piel tales como mink, chinchilla y mapache, aves tales como gallinas, gansos, pavos y patos y peces tales como peces de agua dulce y agua salada tales como trucha, carpa y anguilas.

35 Los compuestos de la fórmula I o los enantiómeros o las sales aceptables desde el punto de vista veterano de los mismos y las composiciones que los comprenden son utilizados preferiblemente para controlar y evitar infestaciones e infecciones en animales domésticos, tales como perros y gatos.

40 Las infestaciones en animales de sangre caliente y peces incluyen, pero no se limitan a, piojos, piojos mordedores, garrapatas, lombrices nasales, keds, moscas picadoras, moscas muscoides, moscas, larvas de moscas miasóticas, niguas, jejenes, mosquitos y pulgas.

Los compuestos de la fórmula I o los enantiómeros o las sales aceptables desde el punto de vista veterinario de los mismos y las composiciones que los comprenden son adecuados para el control sistémico y/o no sistémico de ecto y/o endoparásitos. Son activos contra todas o algunas de etapas de desarrollo.

45 Los compuestos de la fórmula I son especialmente útiles para combatir ectoparásitos.

Los compuestos de la fórmula I son especialmente útiles para combatir parásitos de los siguientes órdenes y especies, respectivamente:

50 pulgas (Siphonaptera), e.g. Ctenocephalides felis, Ctenocephalides canis, Xenopsylla cheopis, Pulex irritans, Tunga penetrans, y Nosopsyllus fasciatus, cockroaches (Blattaria - Blattodea), e.g. Blattella germanica, Blattella asahinae, Periplaneta americana, Periplaneta japonica, Periplaneta brunnea, Periplaneta fuliginosa, Periplaneta australasiae, y Blatta orientalis,

- moscas, mosquitos (Diptera), e.g. *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes vexans*, *Anastrepha ludens*, *Anopheles maculipennis*, *Anopheles crucians*, *Anopheles albimanus*, *Anopheles gambiae*, *Anopheles freeborni*, *Anopheles leucosphyrus*, *Anopheles minimus*, *Anopheles quadrimaculatus*, *Calliphora vicina*, *Chrysomya bezziana*, *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macellaria*, *Chrysops discalis*, *Chrysops silacea*, *Chrysops atlanticus*, *Cochliomyia hominivorax*, *Cordylobia anthropophaga*, *Culicoides furens*, *Culex pipiens*, *Culex nigripalpus*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex tarsalis*, *Culiseta inornata*, *Culiseta melanura*, *Dermatobia hominis*, *Fannia canicularis*, *Gasterophilus intestinalis*, *Glossina morsitans*, *Glossina palpalis*, *Glossina fuscipes*, *Glossina tachinoides*, *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hippelates* spp., *Hypoderma lineata*, *Leptoconops torrens*, *Lucilia caprina*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*, *Lycoria pectoralis*, *Mansonina* spp., *Musca domestica*, *Muscina stabulans*, *Oestrus ovis*, *Phlebotomus argentipes*, *Psorophora columbiae*, *Psorophora discolor*, *Prosimulium mixtum*, *Sarcophaga haemorrhoidalis*, *Sarcophaga* sp., *Simulium vittatum*, *Stomoxys calcitrans*, *Tabanus bovinus*, *Tabanus atratus*, *Tabanus lineola*, y *Tabanus similis*,
- piojos (Ftiraoptera), e.g. *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pthirus pubis*, *Haematopinus eurysternus*, *Haematopinus suis*, *Linognathus vituli*, *Bovicola bovis*, *Menopon gallinae*, *Menacanthus stramineus* y *Solenopotes capillatus*.
- garrapatas y gorgojos parasíticos (Parasitiformes): garrapatas (Ixodida), e.g. *Ixodes scapularis*, *Ixodes holociclus*, *Ixodes pacificus*, *Rhiphicephalus sanguineus*, *Dermacentor andersoni*, *Dermacentor variabilis*, *Amblyomma americanum*, *Amblyomma maculatum*, *Ornithodoros hermsi*, *Ornithodoros turicata* y parasitic mites (Mesostigmata), e.g. *Ornithonyssus bacoti* y *Dermanyssus gallinae*,
- Actiniedida (Prostigmata) y Acaridida (Astigmata) e.g. *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., y *Laminosioptes* spp,
- Bichos (Heteroptera): *Cimex lectularius*, *Cimex hemipterus*, *Reduvius senilis*, *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongylus* spp. y *Arilus critatus*, Anoplurida, e.g. *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Pthirus* spp., y *Solenopotes* spp,
- Mallophagida (subórdenes *Armblycerina* e *Ischnocerina*), e.g. *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepiquentron* spp., *Trichodectes* spp., y *Felicola* spp,
- Gusanos Nematoda:
- Gusanos frotadores y Trichinosis (Trichosyringida), e.g. *Trichinellidae* (*Trichinella* spp.), (*Trichuridae*) *Trichuris* spp., *Capillaria* spp,
- Rhabditida, e.g. *Rhabditis* spp, *Strongyloides* spp., *Helicephalobus* spp,
- Strongylida, e.g. *Strongylus* spp., *Ancylostoma* spp., *Necator americanus*, *Bunostomum* spp. (Hookworm), *Trichostrongylus* spp., *Haemonchus contortus*, *Ostertagia* spp., *Cooperia* spp., *Nematodirus* spp., *Dictyocaulus* spp., *Cyathostoma* spp., *Oesophagostomum* spp., *Stephanurus dentatus*, *Ollulanus* spp., *Chabertia* spp., *Stephanurus dentatus*, *Singamus trachea*, *Ancylostoma* spp., *Uncinaria* spp., *Globocephalus* spp., *Necator* spp., *Metastrongylus* spp., *Muellerius capillaris*, *Protostrongylus* spp., *Angiostrongylus* spp., *Parelaphostrongylus* spp. *Aleurostrongylus abstrusus*, y *Dioctophima renale*,
- Gusanos intestinales (Ascaridida), e.g. *Ascaris lumbricoides*, *Ascaris suum*, *Ascaridia galli*, *Parascaris equorum*, *Enterobius vermicularis* (Threadworm), *Toxocara canis*, *Toxascaris leonine*, *Skrjabinema* spp., y *Oxyuris equi*,
- Camallanida, e.g. *Dracunculus medinensis* (guinea worm)
- Spirurida, e.g. *Thelazia* spp. *Wuchereria* spp., *Brugia* spp., *Onchocerca* spp., *Dirofilari* spp.a, *Dipetalonema* spp., *Setaria* spp., *Elaeophora* spp., *Spirocerca lupi*, y *Habronema* spp.,
- Gusanos de cabeza espinosa (Acanthocephala), e.g. *Acanthocephalus* spp., *Macracanthorhynchus hirudinaceus* y *Oncicola* spp,
- Planarios (Plathelminthes):
- Lombrices del ganado (Trematoda), e.g. *Faciola* spp., *Fascioloides magna*, *Paragonimus* spp., *Dicrocoelium* spp., *Fasciolopsis buski*, *Clonorchis sinensis*, *Schistosoma* spp., *Trichobilharzia* spp., *Alaria alata*, *Paragonimus* spp., y *Nanocyetes* spp, *Cercomeromorpha*, en particular Cestoda (Tapeworms), e.g. *Diphyllobothrium* spp., *Tenia* spp., *Echinococcus* spp., *Dipylidium caninum*, *Multiceps* spp., *Himenolepis* spp., *Mesocestoides* spp., *Vampirolepis* spp., *Moniezia* spp., *Anoplocephala* spp., *Sirometra* spp., *Anoplocephala* spp., y *Himenolepis* spp.

Los compuestos de la fórmula I y las composiciones que los contienen son particularmente útiles para el control de plagas de los órdenes Diptera, Sifonáptera y Ixodida.

Además, se prefiere especialmente el uso de los compuestos de la fórmula I y las composiciones que los contienen para combatir mosquitos.

- 5 El uso de los compuestos de la fórmula I y las composiciones que los contienen para combatir moscas es una realización adicional preferida de la presente invención.

Adicionalmente, se prefiere especialmente el uso de compuestos de la fórmula I y las composiciones que los contienen para combatir pulgas.

- 10 El uso de los compuestos de la fórmula I y las composiciones que los contienen para combatir garrapatas es una realización adicional preferida de la presente invención.

Los compuestos de la fórmula I también son especialmente útiles para combatir endoparásitos (gusanos nematodos, gusanos de cabeza espinosa y planarios).

La administración puede llevarse a cabo tanto profiláctica como terapéuticamente.

- 15 La administración de los compuestos activos se lleva a cabo directamente o en la forma de preparaciones adecuadas, oralmente, por vía tópica/dérmica o parenteral.

Para la administración oral a animales de sangre caliente, los compuestos de la fórmula I pueden formularse como alimentos para animales, premezclas para alimentos de animales, concentrados para alimentación de animales, píldoras, soluciones, pastas, suspensiones, pociones, geles, tabletas, bolos y cápsulas. Además, los compuestos de la fórmula I pueden administrarse a los animales en su agua de abrevadero. Para administración oral, la forma de dosificación escogida debería proveer al animal con 0.01 mg/kg hasta 100 mg/kg de peso corporal del animal por día del compuesto de la fórmula I, preferiblemente con 0.5 mg/kg a 100 mg/kg de peso corporal del animal por día.

- 20

Alternativamente, los compuestos de la fórmula I pueden administrarse a los animales por vía parenteral, por ejemplo, por inyección intraluminal, intramuscular, intravenosa o subcutánea. Los compuestos de la fórmula I pueden dispersarse o disolverse en un vehículo fisiológicamente aceptable para inyección subcutánea. Alternativamente, los compuestos de la fórmula I pueden formularse en un implante para administración subcutánea. Además, el compuesto de la fórmula I puede administrarse por vía transdérmica a los animales. Para administración parenteral, la forma de dosificación escogida debería proveer al animal con 0.01 mg/kg hasta 100 mg/kg de peso corporal del animal por día del compuesto de la fórmula I.

- 25

Los compuestos de la fórmula I también pueden aplicarse por vía tópica a los animales en forma de gotas, polvos, pulverizados, collares, medallones, aspersiones, champús, formulaciones para aplicación y vertimiento y en ungüentos o en emulsiones aceite en agua o agua en aceite. Para aplicación tópica, las gotas y las aspersiones contienen usualmente 0.5 ppm a 5,000 ppm y preferiblemente de 1 ppm a 3,000 ppm del compuesto de la fórmula I. Además, los compuestos de la fórmula I pueden formularse en etiquetas para orejas para animales, particularmente cuadrúpedos tales como ganado y ovejas.

- 30

- 35 Preparaciones adecuadas son:

- Soluciones tales como soluciones orales, concentrados para administración oral después de la dilución, soluciones para el uso en la piel o cavidades corporales, formulaciones para vertimiento, geles;

- Emulsiones y suspensiones para administración oral o dérmica; preparaciones semisólidas;

- 40 - Formulaciones en las cuales el compuesto activo es procesado en una base de ungüento o en una emulsión aceite en agua o agua en aceite;

- Preparaciones sólidas tales como polvos, premezclas o concentrados, gránulos, pellas, tabletas, bolos, cápsulas; aerosoles e inhalantes, y artículos conformados que contienen el compuesto activo.

- 45 Las composiciones adecuadas para inyección se preparan disolviendo el ingrediente activo en un solvente adecuado y agregando opcionalmente ingredientes adicionales tales como ácidos, bases, sales reguladoras, conservantes y solubilizantes. Las soluciones se filtran y se empacan de manera estéril.

Solventes adecuados son solventes fisiológicamente tolerables tales como agua, alcoholes tales como etanol, butanol, alcohol bencílico, glicerol, propilenglicol, polietilenglicoles, N-metil-pirrolidona, 2-pirrolidona y mezclas de los mismos.

- 50 Los compuestos activos pueden disolverse opcionalmente en aceites vegetales o sintéticos fisiológicamente tolerables los cuales son adecuados para inyección.

Solubilizantes adecuados son solventes que promueven la disolución del compuesto activo en el solvente principal o evita su precipitación. Ejemplos son polivinilpirrolidona, alcohol polivinílico, aceite de castor polioxietilado y éster de sorbitano polioxietilado.

Conservantes adecuados son alcohol bencílico, triclorobutanol, ésteres del ácido p-hidroxibenzoico y n-butanol.

- 5 Las soluciones orales se administran directamente. Los concentrados se administran oralmente después de una dilución previa hasta la concentración de uso. Las soluciones y concentrados orales se preparan de acuerdo con el estado de la técnica y tal como se describió anteriormente para soluciones para inyección, no siendo necesarios los procedimientos estériles.

Las soluciones para uso sobre la piel son rociadas, esparcidas, frotadas, pulverizadas o asperjadas.

- 10 Las soluciones para uso sobre la piel se preparan de acuerdo con el estado de la técnica y de acuerdo a lo que se describe anteriormente para soluciones en inyección, no siendo necesarios los procedimientos estériles.

Solventes adecuados adicionales son polipropilén glicol, fenil etanol, fenoxietanol, ésteres tales como acetato de etilo o butilo, benzoato de bencilo, éteres tales como alquilenglicol alquiléter, por ejemplo, dipropilenglicol monometiléter, cetonas tales como acetona, metiletilcetona, hidrocarburos aromáticos, aceites vegetales y sintéticos, dimetilformamida, dimetilacetamida, transcuto y solketal, carbonato de propileno y mezclas de los mismos.

- 15

Puede ser ventajoso agregar espesantes durante la preparación. Espesantes adecuados son espesantes inorgánicos tales como bentonitas, ácido silícico coloidal, monoestearato de aluminio, espesantes orgánicos tales como derivados de celulosa, alcoholes polivinílicos y sus copolímeros, acrilatos y metacrilatos.

- 20 Los geles se aplican por distribución sobre la piel o se introducen en cavidades corporales. Los geles se preparan tratando soluciones que han sido preparadas tal como se describe en el caso de las soluciones para inyección con un aglomerante suficiente de tal forma que da como resultado un material claro que tiene una consistencia similar a un ungüento. Los espesantes empleados son los espesantes dados anteriormente.

Las formulaciones para vertimiento se vierten o se asperjan sobre áreas limitadas de la piel, penetrando el compuesto activo la piel y actuando sistémicamente.

- 25 Las formulaciones para vertimiento se preparan disolviendo, suspendiendo o emulsificando el compuesto activo en solventes o mezclas de solventes compatibles con la piel. Si es apropiado, se agregan otros auxiliares tales como colorantes, sustancias promotoras de la bioabsorción, antioxidantes, estabilizadores frente a la luz, adhesivos.

Solventes adecuados son: agua, alcanoles, glicoles, polietilenglicoles, polipropilenglicoles, glicerol, alcoholes aromáticos tales como alcohol bencílico, feniletanol, fenoxietanol, ésteres tales como acetato de etilo, acetato de butilo, benzoato de bencilo, éteres tales como éteres de alquilen glicol alquilo, tales como dipropilén glicol monoetil éter, dietilenglicol mono-butyl éter, cetonas tales como acetona, metil etil cetona, carbonatos cíclicos tales como carbonato de propileno, carbonato de etileno, hidrocarburos aromáticos y/o alifáticos, aceites vegetales o sintéticos, DMF, dimetilacetamida, n-alquilpirrolidonas tales como metilpirrolidona, N-butilpirrolidona o n-octilpirrolidona, N-metilpirrolidona, 2-pirrolidona, 2,2-dimetil-4-oximetilén-1,3-diox-olano y glicerol formal.

- 30

- 35 Colorantes adecuados son todos los colorantes permitidos para uso en animales y que pueden ser disueltos o suspendidos.

Sustancias promotoras de la absorción adecuada son, por ejemplo, DMSO, aceites de aplicación tales como miristato de isopropilo, pelargonato de dipropilenglicol, aceites de silicona y copolímeros de los mismos con poliéteres, ésteres de ácidos grasos, triglicéridos, alcoholes grasos.

- 40 Antioxidantes adecuados son sulfitos o metabisulfitos tales como metabisulfito de potasio, ácido ascórbico, butilhidroxitolueno, butilhidroxianisol, tocoferol.

Estabilizadores frente a luz adecuados son, por ejemplo, ácido novantisólico.

Adhesivos adecuados son, por ejemplo, derivados de la celulosa, derivados de almidón, poliácridatos, polímeros naturales tales como alginatos, gelatinas.

- 45 Las emulsiones pueden administrarse oralmente, por vía dérmica o como inyecciones.

Las emulsiones son bien del tipo agua en aceite o aceite en agua.

Se preparan disolviendo el compuesto activo, bien sea en la fase hidrófoba o en la hidrofílica y homogeneizándolas con el solvente de la otra fase con la ayuda de emulsificantes adecuados y, si es apropiado, otros auxiliares tales como colorantes, sustancias promotoras de la absorción, conservantes, antioxidantes, estabilizadores a la luz, sustancias potenciadoras de la viscosidad.

- 50

Fases hidrófobas adecuadas (aceites) son:

5 parafinas líquidas, aceites de silicona, aceites vegetales naturales tales como aceite de sésamo, aceite de almendras, aceite de castor, triglicéridos sintéticos tales como biglicéridos caprílico/cáprico, mezclas de triglicéridos con ácidos grasos vegetales de longitud de cadena C₈-C₁₂ u otros ácidos grasos naturales especialmente seleccionados, mezclas parciales de glicéridos de ácidos grasos saturados o insaturados posiblemente también con contenido de grupos hidroxilo, mono y diglicéridos de los ácidos grasos C₈-C₁₀,

10 ésteres de ácidos grasos tales como estearato de etilo, adipato de di-n-butirilo, laurato de hexilo, perlargonato de dipropilén glicol, ésteres de ácidos grasos ramificados o de longitud de cadena media con alcoholes grasos saturados de longitud de cadena C₁₆-C₁₈, miristato de isopropilo, palmitato de isopropilo, ésteres de ácido caprílico/cáprico de alcoholes grasos saturados de longitud de cadena C₁₂-C₁₈, estearato de isopropilo, oleato de oleilo, oleato de decilo, oleato de etilo, lactato de etilo, ésteres de ácidos grasos cerosos tales como grasa de la glándula coccigeal de pato, ftalato de dibutilo, adipato de diisopropilo, y mezclas de ésteres relacionadas con estos últimos, alcoholes grasos tales como alcohol isotridecílico, 2-octildodecanol, alcohol cetilestearílico, alcohol oleílico, ácidos grasos tales como ácido oleico y mezclas de los mismos.

15 Fases hidrofílicas adecuadas son: agua, alcoholes tales como propilén glicol, glicerol, sorbitol y mezclas de los mismos.

Emulsificantes adecuados son:

20 surfactantes no iónicos, por ejemplo, aceite de castor polietoxilado, monooleato de sorbitano polietoxilado, monoestearato de sorbitano, monoestearato de glicerol, estearato de polioxietilo, alquilfenol poliglicol éter; surfactantes anfófilos tales como N-lauril-p-iminodipropionato de di-sodio o lecitina; surfactantes aniónicos, tales como lauril sulfato de sodio, sulfatos de éteres de alcoholes grasos, mono/dialquil poliglicol éter y sales de monoetanolamina de ésteres de ácido ortofosfórico; surfactantes activos anticaciones, tales como cloruro de cetiltrimetilamonio.

25 Auxiliares adecuados adicionales son: sustancias que potencian la viscosidad y estabilizan la emulsión, tales como carboximetilcelulosa, metilcelulosa y otros derivados de celulosa y almidón, poliacrilatos, alginatos, gelatina, goma arábiga, polivinilpirrolidona, alcohol polivinílico, copolímeros de metil vinil éter y anhídrido maleico, polietilén glicoles, ceras, ácido silícico coloidal o mezclas de las sustancias mencionadas.

30 Las suspensiones pueden administrarse oralmente o por vía tópica/dérmica. Se preparan suspendiendo el compuesto activo en un agente de suspensión, si es apropiado con adición de otros auxiliares tales como agentes humectantes, colorantes, sustancias promotoras de la bioabsorción, conservantes, antioxidantes, estabilizadores a la luz.

Los agentes de suspensión en líquido son todos solventes y mezclas de solventes homogéneos.

Agentes humectantes adecuados (dispersantes) son los emulsificantes dados anteriormente.

Otros auxiliares que pueden mencionarse son los que se dan anteriormente.

35 Las preparaciones semisólidas pueden administrarse oralmente o por vía tópica/dérmica. Difieren de las suspensiones y emulsiones descritas anteriormente solamente por su viscosidad mayor.

Para la producción de preparaciones sólidas, el compuesto activo se mezcla con excipientes adecuados, si es apropiado con la adición de auxiliares, y se lleva a la forma deseada.

40 Excipientes adecuados son todas las sustancias inertes sólidas fisiológicamente tolerables. Se utilizan sustancias inorgánicas y orgánicas. Las sustancias inorgánicas son, por ejemplo, cloruro de sodio, carbonatos tales como carbonato de calcio, hidrogenocarbonatos, óxidos de aluminio, óxido de titanio, ácidos silícicos, tierras arcillosas, sílica precipitada o coloidal, o fosfatos. Las sustancias orgánicas son, por ejemplo, azúcar, celulosa, alimentos y piensos tales como leche en polvo, torta de animales, tortas y deshechos de granos y almidones.

Auxiliares adecuados son conservantes, antioxidantes y/o colorantes que se han mencionado anteriormente.

45 Otros auxiliares adecuados son lubricantes y deslizantes tales como estearato de magnesio, ácido esteárico, talco, bentonitas, sustancias promotoras de la desintegración, tales como almidón o polivinilpirrolidona entrecruzada, aglomerantes tales como almidón, gelatina o polivinilpirrolidona lineal, y aglomerantes en seco tales como celulosa microcristalina.

50 En general, "cantidad efectiva como parasitocida" significa la cantidad de ingrediente activo necesaria para alcanzar un efecto observable sobre el crecimiento, incluyendo los efectos de necrosis, muerte, retardamiento, prevención y eliminación, destrucción o disminución de alguna otra manera de la presencia y actividad del organismo objetivo. La cantidad efectiva como parasitocida puede variar para los diversos compuestos/composiciones usados en la

invención. Una cantidad efectiva como parasiticida de las composiciones también variará de acuerdo con las condiciones prevalentes tales como efecto y duración parasiticidas deseados, especie objetivo, modo de aplicación y similares.

5 Las composiciones que pueden utilizarse en la invención pueden comprender generalmente desde aproximadamente 0.001 a 95% del compuesto de la fórmula I.

En general es favorable aplicar los compuestos de la fórmula I en cantidades totales de 0.5 mg/kg a 100 mg/kg por día, preferiblemente 1 mg/kg a 50 mg/kg por día.

10 Las preparaciones listas para el uso contienen los compuestos que actúan contra parásitos, preferiblemente ectoparásitos en concentraciones de 10 ppm a 80 por ciento en peso, preferiblemente de 0.1 a 65 por ciento en peso, más preferiblemente de 1 a 50 por ciento en peso, lo más preferiblemente de 5 a 40 por ciento en peso.

Las preparaciones que se diluyen antes del uso contienen los compuestos que actúan contra ectoparásitos en concentraciones de 0.5 a 90 por ciento en peso, preferiblemente de 1 a 50 por ciento en peso.

15 Adicionalmente, las preparaciones comprenden los compuestos de la fórmula I contra endoparásitos en concentraciones de 10 ppm a 2 por ciento en peso, preferiblemente de 0.05 a 0.9 por ciento en peso, muy particularmente de forma preferible de 0.005 a 0.25 por ciento en peso.

En una realización preferida de la presente invención, la composición que comprende los compuestos de la fórmula I se aplica por vía dérmica/tópica.

20 En una realización preferida adicional, la aplicación tópica se lleva a cabo en la forma de artículos conformados que contienen el compuesto tales como collares, medallones, etiquetas para oreja, bandas para fijar a partes del cuerpo, y tiras y láminas adhesivas.

En general es favorable aplicar las formulaciones sólidas que liberan los compuestos de la fórmula I en cantidades totales de 10 mg/kg a 300 mg/kg, preferiblemente 20 mg/kg a 200 mg/kg, lo más preferiblemente de 25 mg/kg a 160 mg/kg de peso corporal del animal tratado en el transcurso de tres semanas.

25 Para la preparación de los artículos conformados, se utilizan termoplásticos y plásticos flexibles así como elastómeros y elastómeros termoplásticos. Los plásticos y elastómeros adecuados son resinas de polivinilo, poliuretano, poliacrilato, resinas epoxi, celulosa, derivados de celulosa, poliamidas y poliéster que son suficientemente compatibles con los compuestos de la fórmula I. Una lista detallada de plásticos y elastómeros así como de procedimientos de preparación para los artículos conformados se da por ejemplo en WO 03/086075.

La presente invención se ilustra ahora en detalle adicional mediante los siguientes ejemplos.

30 P. Ejemplos de preparación

Ejemplo de Referencia P.1: (4-Cloro-indan-1-il)-(4,5-dihidrotiazol-2-il)-amine (compuesto ejemplo 4 de la tabla 1)

35 A una solución de 4-cloro-indan-1-ilamine (390 mg) en dietil éter (20 ml) se agrega 1-cloro-2-isotiocianatoetane (283 mg) a 0°C y la solución se agita durante 2 horas a la misma temperatura. La mezcla de reacción se detiene con solución diluida de hidróxido de sodio y se extrae con dietil éter. El residuo se purifica sobre sílica gel para producir 240 mg del producto (41%).

Ejemplo de Referencia P.2: (7-Cloro-1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-il)-(4,5-dihidro-tiazol-2-il)-amine (Compuesto de ejemplo 9 de la tabla 1)

40 A una solución de 7-cloro-1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-ilamine (200 mg) en dietil éter (5 ml) se agrega una solución de 1-cloro-2-isotiocianatoetane (134 mg) en dietil éter (5 ml) a 0°C y la solución se agita durante 4 horas a la misma temperatura. La mezcla de reacción se detiene con solución diluida de hidróxido de sodio y se extrae con dietil éter. El residuo se purifica sobre sílica gel para producir 171 mg del producto (52%).

C. Compuestos de ejemplo de la fórmula 1:

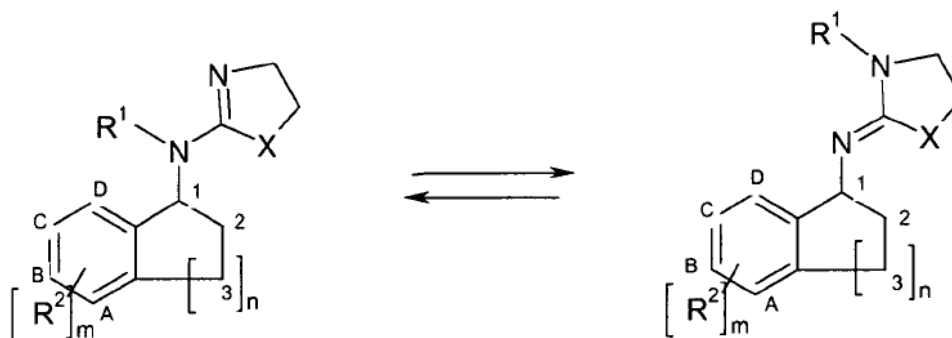


Tabla 1:

Ex.	n	R ¹	[R ²] _m				X	Datos fisicoquímicos (punto de fusión [°C])
			A	B	C	D		
1	1	H			Cl		S	163-164
2	1	H			F		S	146-147
3	1	H			Br		S	168-169
4	1	H	Cl				S	171-175
5	1	H	Cl		Cl		S	137-139
6	1	H	F		F		S	136-139
7	2	H	Cl		Cl		S	160-162
8	2	H			Br		S	161-163
9	2	H			Cl		S	168-171
10	1	H	CH ₃				S	122-127
11	2	H	Br				S	174-179
12	1	H			OCH ₃		S	143-145
13	1	H	F				S	137-141
14	1	H	OCH ₃				S	126-128
15	1	H			CH ₃		S	180-182
16	1	H	CN				S	121-124
17	1	H			CO ₂ CH ₃		s	204-206
18	1	H		CN			S	175-180
19	1	H				Cl	S	128-130
20	1	H	CH ₃			CH ₃	S	130-136
21	1	H	CH ₃		CH ₃		S	165-169
22	1	H	CH ₃	CH ₃			S	166-168
23	1	H		CO ₂ CH ₃			S	185-191
24	1	H		F			S	137-138

25	1	H			SCH ₃		S	144-146
26	1	H		Cl	OCH ₃		S	175-177
27	1	H				CN	S	172-175

B. Ejemplos de acción contra plagas

La acción de los compuestos de la fórmula I contra las plagas fue demostrada mediante los siguientes experimentos:

B.1 Áfidos del algodón (*Aphis gossypii*)

- 5 Se infestan plantas de algodón en el estado de cotiledón (variedad 'Delta Pine') con aproximadamente 100 áfidos cultivados en laboratorio colocando secciones infestadas de hojas sobre la parte superior de las plantas de prueba. Las secciones de hoja se retiran después de 24 horas. Los cotiledones de las plantas intactas se sumergen en soluciones en gradiente del compuesto de prueba. La mortalidad de los áfidos sobre las plantas tratadas, con respecto a las plantas de verificación, se determina después de 5 días.
- 10 En la prueba, los compuestos de ejemplos números 1-6, 9, 12, 13, 15, 21 y 24 a 300 ppm mostraron más de 80% de mortalidad en comparación con los controles no tratados.

B.2 Áfidos de melocotón verde (*Myzus persicae*)

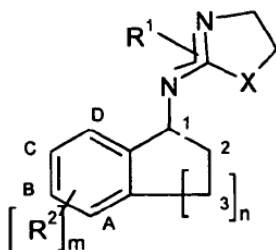
- 15 Plantas de pimienta en la etapa de segundo par de hojas (variedad 'California Wonder') se infecta con aproximadamente 40 áfidos cultivados en laboratorio colocando secciones de hojas infestadas sobre la parte superior de las plantas de prueba. Las secciones de hoja se retiran después de 24 horas. Las hojas de las plantas intactas se sumergen en soluciones en gradiente del compuesto de prueba. La mortalidad de los áfidos sobre las plantas tratadas, con respecto a la mortalidad sobre las plantas de verificación, se determina después de 5 días.

En esta prueba, los compuestos de ejemplo números 1-6, 9, 10, 12, 13, 15, 20, 21 y 24 a 300 ppm mostraron más de 80% de mortalidad en comparación con los controles no tratados.

20

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto tautomérico de Indanil- o Tetrahidronaftil-amino-azolina de la fórmula I



fórmula I

5 en donde

n es 1 o 2;

m es 1,2,3 o 4, en donde cuando m es mayor de 1, los radicales R² pueden tener el mismo o diferentes significados

X es O o NR³

10 en donde R³ es seleccionado de hidrógeno, ciano, nitro, formilo, C(=O)R^{3c}, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenoilo, C₂-C₆-alquinilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alquinilamino, di(C₂-C₆-alquinil)amino, (C₁-C₆-alcoxi)metilen, C₁-C₆-alquilsulfino, C₁-C₆-alquilsulfenilo o C₁-C₆-alquilsulfonilo en donde los átomos de carbono en los radicales alifáticos de los grupos antes mencionados pueden portar cualquier combinación de 1, 2 o 3 radicales, independientemente uno de otro seleccionados del grupo consistente de halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, mercapto, amino, carboxilo, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alquenoilo, C₂-C₆-alquinoxilo, C₁-C₆-haloalcoxi y C₁-C₆-alquiltio, o C(O)NR^{3a}R^{3b}, (SO₂)NR^{3a}R^{3b}, fenilo, feniloxi o bencilo, cada uno de los tres radicales mencionados puede estar no sustituido o sustituido con 1 a 5 radicales, independientemente uno de otro seleccionados del grupo consistente de halógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-haloalquiltio, C₁-C₆-alcoxi y C₁-C₆-haloalcoxi; y en donde

R^{3a} y R^{3b} son cada uno independientemente hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₂-C₆-alquenoilo, o C₂-C₆-alquinilo.

20 R^{3c} es seleccionado de hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenoilo, C₂-C₆-alquinilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-alcoxi, (C₁-C₆-alquil)amino, di(C₁-C₆-alquil) amino, fenilo y heteroarilo, el cual puede ser un anillo heteroaromático, mono o bicíclico de 5 a 10 miembros, que contiene 1,2,3 o 4 heteroátomos seleccionados de O, S y N;

25 R¹ es seleccionado de hidrógeno, ciano, nitro, formilo, C(=O)R^{1c}, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenoilo, C₂-C₆-alquinilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, (C₁-C₆-alcoxi)metilen, C₁-C₆-alquilsulfino, C₁-C₆-alquilsulfenilo o C₁-C₆-alquilsulfonilo en donde los átomos de carbono en los radicales alifáticos de los grupos antes mencionados pueden portar cualquier combinación de 1, 2 o 3 radicales, independientemente uno de otro seleccionados del grupo consistente de halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, mercapto, amino, carboxilo, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alquenoilo, C₂-C₆-alquinoxilo, C₁-C₆-haloalcoxi y C₁-C₆-alquiltio, o C(O)NR^{1a}R^{1b}, (SO₂)NR^{1a}R^{1b}, fenilo, feniloxi o bencilo, cada uno de los tres radicales mencionados puede estar no sustituido o sustituido con 1 a 5 radicales, independientemente uno de otro seleccionados del grupo consistente de halógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₈-alquiltio, C₁-C₆-haloalquiltio, C₁-C₆-alcoxi y C₁-C₆-haloalcoxi; y en donde

30 R^{1a} y R^{1b} son cada uno independientemente hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₂-C₆-alquenoilo, o C₂-C₆-alquinilo.

35 R^{1c} es seleccionado de hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenoilo, C₂-C₆-alquinilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-alcoxi, (C₁-C₆-alquil)amino, di(C₁-C₆-alquil) amino, fenilo y heteroarilo, el cual puede ser un anillo heteroaromático, mono o bicíclico de 5 a 10 miembros, que contiene 1,2,3 o 4 heteroátomos seleccionados de O, S y N;

40 R² es seleccionado de halógeno, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenoilo, C₂-C₆-alquinilo, C₁-C₆-alcoxi o C₃-C₈-cicloalquilo, en donde los radicales pueden ser no sustituidos, parcial o completamente halogenados;

o los enantiómeros y/o sales aceptables de los mismos desde el punto de vista agrícola y/o veterinario, con la condición de que el compuesto de la fórmula I no sea 2-(4-tio-tert-butil-1-indanilamino)-oxazolina.

2. Un compuesto Indanil- o Tetrahidronaftil-amino-azolina de la fórmula I, de acuerdo con la reivindicación 1, en donde
- R1 es seleccionado de hidrógeno, ciano, C(=O)R^{1c}, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquino, C₃-C₈-cicloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, y en donde
- 5 R^{1c} es seleccionado de hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alqueno, C₂-C₆-alquino, C₃-C₈-cicloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, (C₁-C₆-alquil)amino, di(C₁-C₆-alquil)amino, fenilo y heteroarilo, el cual puede ser un anillo heteroaromático, mono o bicíclico de 5 a 10 miembros, que contiene 1,2,3 o 4 heteroátomos seleccionados de O,S y N
3. Un compuesto Indanil- o Tetrahidronaftil-amino-azolina de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde R¹ es hidrógeno
- 10 4. Un compuesto Indanil- o Tetrahidronaftil-amino-azolina de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde m es 3 y R² está sustituido en las posiciones A, C y D.
5. Un compuesto Indanil- o Tetrahidronaftil-amino-azolina de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde m es 2 y R² está sustituido en las posiciones A y C
- 15 6. Un compuesto Indanil- o Tetrahidronaftil-amino-azolina de la fórmula I, de acuerdo con la reivindicación 1, en donde m es 2 y R² está sustituido en las posiciones C y D.
7. Un compuesto Indanil- o Tetrahidronaftil-amino-azolina de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde m es 1 y R² está sustituido en la posición A.
8. Un compuesto Indanil- o Tetrahidronaftil-amino-azolina de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde m es 1 y R² está sustituido en la posición C.
- 20 9. Un compuesto Indanil-amino-azolina de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde n es 1.
10. Un compuesto Tetrahidronaftil-amino-azolina de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde n es 2
11. Un compuesto Indanil- o Tetrahidronaftil-amino-azolina de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde m es 2 o 1
- 25 12. Un compuesto Indanil- o Tetrahidronaftil-amino-azolina de la fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde X es O
13. Una composición agrícola o veterinaria que comprende al menos un compuesto de indanil- o tetrahidronaftil-amino-azolina de la fórmula I tal como se definió en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 12 o los enantiómeros y/o al menos una sal útil desde el vista agrícola o veterinario de los mismos y al menos un líquido inerte y/o un vehículo aceptable desde el punto de vista agronómico y, si se desea, al menos un surfactante.
- 30 14. Un método para controlar plagas animales que comprende poner en contacto el hábitat, el terreno de cría o el suministro de alimentos de la plaga animal, o la planta, semilla, suelo, área, material o ambiente en el cual las plagas animales crecen o pueden crecer, o los materiales, plantas, semillas, suelos, superficies o espacios que se van a proteger del ataque o infestación de los animales con una cantidad efectiva como pesticida de al menos un compuesto de indanil- o tetrahidronaftil-amino-azolina de fórmula I tal como se define en cualquiera de las
- 35 reivindicaciones 1 a 12 o los enantiómeros o al menos una sal aceptable desde el punto de vista agrícola o veterinario de los mismos.
15. Un método para proteger cultivos del ataque o infestación por plagas animales, que comprende poner en contacto un cultivo con una cantidad efectiva como pesticida de al menos un compuesto de indanil- o tetrahidronaftil-amino-azolina de la fórmula I tal como se define en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 12 o los enantiómeros
- 40 o al menos una sal aceptable desde el punto de vista agrícola de los mismos.
16. El método tal como se define en la reivindicación 14 o 15, donde las plagas animales son insectos, arácnidos o nematodos.
17. El método tal como se define en la reivindicación 14 o 15, donde las plagas animales son insectos tales como Homóptera, Lepidóptera o coleóptera o arácnidos del orden Acarina
- 45 18. Un método para la protección de semillas frente a insectos del suelo y de las raíces y brotes de las semillas frente a insectos que comprende poner en contacto las semillas antes de la siembra y/ después de la pregerminación con un compuesto de indanil- o tetrahidronaftil-amino-azolina de la fórmula I tal como se define en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 15 o los enantiómeros y/o al menos una sal aceptable desde el punto de vista agrícola de los mismos, tal como se define en las reivindicaciones 1 a 12, en cantidades efectivas como
- 50 pesticidas.

19. El método de acuerdo con reivindicación 18, donde el compuesto de indanil- o tetrahidronaftil-amino-azolina se aplica en una cantidad que va de 0.1 g a 10 kg por 100 kg de semillas.
20. Un método de acuerdo con la reivindicación 18 o 19, donde se protegen las raíces y brotes resultantes de las plantas.
- 5 21. Un método de acuerdo con la reivindicación 18 a 20, donde los brotes resultantes de las plantas se protegen contra áfidos.
22. Una semilla que comprende un compuesto de indanil- o tetrahidronaftil-amino-azolina de la fórmula I tal como se define en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 12 o los enantiómeros y/o una sal aceptable desde el punto de vista agrícola de los mismos en una cantidad que va de 0.1 g a 10 kg por 100 kg de semillas.
- 10 23. El uso de una cantidad efectiva como parasitida de un compuesto de indanil o tetrahidronaftil-amino-azolina de la fórmula I tal como se define en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 12 o los enantiómeros y/o sal aceptable desde el punto de vista veterinario de los mismos para la preparación de una composición para tratar, controlar, prevenir o proteger animales contra la infestación o infección por parásitos por administración o aplicación oral, tópica o parenteral del compuesto de indanil- o tetrahidronaftil-amino-azolina a los animales.
- 15 24. Un proceso para la preparación de una composición para tratar, controlar, prevenir o proteger los animales contra la infestación o infección por parásitos que comprende una cantidad efectiva como parasitida del compuesto indanil- o tetrahidronaftil-amino-azolina de la fórmula I tal como se define en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 12 o los enantiómeros y/o una sal aceptable desde el punto de vista veterinario de los mismos.