

ESPAÑA



11) Número de publicación: 2 383 101

(2006.01)

(51) Int. CI.: C07D 275/06 (2006.01) C07D 275/04 (2006.01) C07D 417/12 C07D 417/14 (2006.01) A01N 43/80

(12) TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- (96) Número de solicitud europea: 08707884 .6
- (96) Fecha de presentación: **14.01.2008**
- (97) Número de publicación de la solicitud: 2064196 (97) Fecha de publicación de la solicitud: 03.06.2009
- (54) Título: Compuestos de 3-amino-1,2-bencisotiazol para combatir plagas animales II
- (30) Prioridad: 26.01.2007 US 886761 P

- (73) Titular/es: **BASF SE** 67056 Ludwigshafen, DE
- (45) Fecha de publicación de la mención BOPI: 18.06.2012
- (72) Inventor/es:

VON DEYN, Wolfgang; POHLMAN, Matthias; KAISER, Florian; DICKHAUT, Joachim; ANSPAUGH, Douglas D.; CULBERTSON, Deborah L. y **OLOUMI-SADEGHI, Hassan**

- (45) Fecha de la publicación del folleto de la patente: 18.06.2012
- (74) Agente/Representante: Carvajal y Urquijo, Isabel

ES 2 383 101 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 3-amino-1,2-bencisotiazol para combatir plagas animales II

La presente invención se relaciona con compuestos de 3-amino-1,2-bencisotiazol y con sus derivados imino isoméricos, así como con los enantiómeros, diastereómeros y sales de los mismos y con composiciones que comprenden tales compuestos. La invención también se relaciona con el uso de los compuestos de 3-amino-1,2-bencisotiazol, de sus sales o composiciones que los comprenden para combatir plagas de animales. Adicionalmente la invención se relaciona con métodos para aplicar tales compuestos.

Las plagas animales destruyen cultivos en crecimiento y recolectados y atacan instalaciones de madera y estructuras comerciales, produciendo grandes pérdidas económicas para el suministro de alimentos y la propiedad. Mientras que es conocido un gran número de agentes pesticidas, debido a la capacidad de apuntar a las plagas para desarrollar resistencia a dichos agentes, hay una necesidad vigente por nuevos agentes para combatir plagas animales. En particular, plagas animales tales como insectos y ácaros son difíciles de controlar de manera efectiva.

Por los tanto es un objeto de la presente invención proveer compuestos que tengan una buena actividad como pesticidas, especialmente contra insectos y ácaros difíciles de controlar.

Se ha encontrado que estos objetos son resueltos por los derivados de 3-amino-1,2-bencisotiazol de la fórmula general I:

$$R^2$$
 R^3
 R^4
 R^4
 R^5
 R^6
 R^6
 R^6
 R^6

en donde

n es 0, 1 o 2;

20

25

30

5

10

A es, A³ o

 R^9 se selecciona de C_1 - C_6 -alcoxi, C_1 - C_{10} -alquilo, C_2 - C_{10} -alquenilo, C_2 - C_{10} -alquinilo, C_3 - C_{10} -cicloalquilo, en donde los radicales alifáticos pueden ser no sustituidos, parcial o completamente halogenados y/o pueden portar uno o más radicales, seleccionados independientemente uno de otro del grupo consistente de CN, NO_2 , C_1 - C_{10} -alquilo, C_1 - C_{10} -haloalquilo C_3 - C_{10} -cicloalquilo y fenilo, siendo posible que el fenilo sea no sustituido, parcial o completamente halogenado y/o porte uno o más sustituyentes, seleccionados independientemente uno de otro del grupo consistente de C_1 - C_4 -haloalquilo, C_1 - C_4 -haloalquiltio, C_1 - C_4 -haloalquilo, C_1 -

R¹⁰ se selecciona de sustituyentes tal como se define para R¹² más abajo;

 R^{12} se selecciona de OR^d , NR^aR^b , C_1 - C_{10} -alquilo, C_2 - C_{10} -alquenilo, C_2 - C_{10} -alquinilo, C_3 - C_{10} -cicloalquilo, fenilo, naftilo y grupos heterocíclicos de 5 a 7 miembros saturados, parcial o completamente insaturados o aromáticos que contienen 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados de O, CO, S, SO₂, N, NH o N- C_1 - C_6 -alquilo, en donde los átomos

de carbono de todos los radicales mencionados y los miembros de anillo de los anillos heterocíclicos pueden ser no sustituidos, parcial o completamente halogenados y/o pueden portar uno o más radicales, seleccionado independientemente uno de otro del grupo consistente de CN, OH, NO₂, NH₂, C₁-C₁₀-alquilo, C₁-C₁₀-haloalquilo, C₁-C₁₀-alquillo, anillos heteroaromáticos de 5 o 6 miembros y sistemas de anillo heterobicíclicos fusionados aromáticos de 8, 9 10 miembros que contienen 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados de O, CO, S, SO₂, N, NH o N-C₁-C₆-alquilo, siendo posible para cada uno de los anillos aromáticos o heteroaromáticos ser no sustituidos, parcial o completamente halogenados y/o portan uno o más sustituyentes, seleccionados independientemente uno de otro del grupo consistente de C₁-C₁₀-alquilo, C₁-C₁₀-haloalquilo, C₁-C₁₀-haloalquinilo, C₂-C₁₀-haloalquinilo, C₂-C₁₀-haloalquinilo, C₂-C₁₀-haloalquilitio, C₁-C₁₀-alquilsulfinilo, C₁-C₁₀-alquilsulfonilo, C₁-C₁₀-haloalquiltio, C₁-C₁₀-alquillaminocarbonilo, C₁-C₁₀-alquillamino, di-(C₁-C₁₀-alquillamino, di-(C₁-C₁₀-alquillamino, C₃-C₁₀-cicloalquillo, C₁-C₁₀-alquillamino, di-(C₁-C₁₀-alquillamino, C₃-C₁₀-cicloalquillo, C₁-C₁₀-alquillamino, di-(C₁-C₁₀-alquillamino, C₁-C₁₀-alquillamino, di-(C₁-C₁₀-alquillamino, di-(C₁-C

R¹ se selecciona de CN, NO₂, NH₂, azido, halógeno, sulfonilamino, sulfenilamino, sulfinilamino, C(=O)Rc, C₁-C₁₀-15 alquilo, C₂-C₁₀-alquenilo, C₂-C₁₀-alquinilo, C₃-C₁₀-cicloalquilo, C₁-C₁₀-alquilsulfonilo, en donde los átomos de carbono del C₃-C₁₀-cicloalquilo y los radicales alifáticos mencionados pueden ser no sustituidos, parcial o completamente halogenados y/o pueden portar uno o más radicales, seleccionados del grupo consistente de CN, NO₂, NH₂, C₁-C₁₀-alcoxi, C₁-C₁₀-alquillo, C₁-C₁₀-alquilsulfinilo, C₁-C₁₀-alquilsulfonilo, C₁-C₁₀-haloalcoxi, C₁-C₁₀-haloalcoxi, C₁-C₁₀-haloalcoxi, C₁-C₁₀-alquillo, c₁-C₁₀-alq

R², R³ y R⁴ son seleccionados independientemente uno de otro de hidrógeno, halógeno, azido, COR^c. CN, NO₂, NH₂, C₁-C₁₀-alquillo, C₃-C₁₀-cicloalquilo, C₁-C₁₀-haloalquillo, C₁-C₁₀-alquiltio, C₁-C₁₀-alquilsulfinilo, C₁-C₁₀-alquilsulfinilo, C₁-C₁₀-haloalquiltio, C₂-C₁₀-alquillo, C₂-C₁₀-alquinilo, (C₁-C₁₀-alquil)amino, di(C₁-C₁₀-alquil)amino, sulfonilamino, sulfonilamino y sulfanilamino;

y en donde

5

10

35

R^a y R^b se seleccionan uno independientemente del otro del grupo consistente de, C₁-C₁₀-alquilo, C₃-C₁₀-cicloalquilo, 30 C₂-C₁₀-alquenilo, C₂-C₁₀-alquinilo, arilo y aromático, anillos heterocíclicos saturados, parcial o completamente insaturados, y en donde los átomos de carbono de todos los radicales mencionados pueden ser no sustituidos o parcial o completamente sustituidos con halógeno o C₁-C₁₀-alquil;

Rc se selecciona del grupo consistente de NH₂, C₁-C₁₀-alquilo, C₁-C₁₀-alcoxi, C₁-C₁₀-alquilamino, di(C₁-C₁₀-alquil) amino, arilo y un anillo heterocíclico de 3 a 7 miembros saturado, parcialmente insaturado o aromático, el cual puede contener como miembros de anillo 1, 2 o 3 heteroátomos no sustitutidos o sustituidos seleccionados del grupo consistente de O, S, SO, SO₂, N, NH y N-C₁-C₆-alquilo, y en donde los átomos de carbono de todos los radicales mencionados pueden ser no sustituidos o parcial o completamente sustituidos con halógeno o C₁-C₁₀-alquil;

Rd se selecciona del grupo consistente de hidrógeno, C_1 - C_{10} -alquilo, C_3 - C_{10} -cicloalquilo, C_2 - C_{10} -alquenilo, C_2 - C_{10} -alquinilo, arilo y aromático, anillos heterocíclicos saturados, parcial o completamente insaturados;

40 o los enantiómeros, diastereómeros o sales de los mismos

Dependiendo del patrón de sustitución, los compuestos de la fórmula I pueden contener uno o más centros quirales, en cuyo caso están presentes como mezclas de enantiómeros o diastereómeros. La materia objetivo de esta invención no son solamente las composiciones que contienen estas mezclas sino también aquellas que contienen los enantiómeros o diastereómeros puros.

Algunos compuestos similares de la fórmula I han sido descritos inter alia en DE-A-1915387, WO 03/87072, JP-A 06220030, DE-A 1670920 y DE-A 1545842. Los benzoisotiazoles útiles para tratar o evitar la infección por HCV pueden encontrarse en WO2006/091858. Sin embargo, no se ha divulgado aún una actividad insecticida, acaricida o nematicida de los compuestos de la fórmula I.

Los compuestos amino y amino-acilados1,2-bencisotiazol han sido descritos por Drabek en cuanto a su actividad insecticida en EP-A-207891, EP-A 191734, DE-A 3544436, EP-A 138762, EP-A 133418 y EP-A 110829, o 3-Amidinobencisotiazol 1,1-dióxidos para el mismo en EP-A 86748. La JP-A 01319467 describe la preparación de las amino-bencisotiazoles N-aciladas y sus derivados 1,2-dióxido como ingredientes activos para propósitos insecticidas. Los compuestos sulfonilo y las composiciones aficidas basadas en los derivados monosustituidos de 3-amino-1,2 -bencisotiazol-1,1-dióxido han sido descritas en EP-A-0033984. La última EP-A 33984 divulga 2-

cianobenceno sulfonamidas que tienen actividades aficida. Su actividad, sin embargo, no es satisfactoria. Compuestos similares a los de la EP-A 33984 se describen en WO2005/035486, en la solicitud internacional no publicada PCT/EP2006/068469 y en la solicitud de los Estados Unidos no publicada 60/787809.

Los compuestos de la fórmula I, y sus sales aceptables desde el punto de vista agrícola son altamente activos contra plagas de animales, esto es, artrópodos y nematodos nocivos, especialmente contra insectos y acáridos difíciles de controlar.

De acuerdo con lo anterior, la presente invención se relaciona con compuestos 3-amino-1,2-bencisotiazol de la fórmula general I y con sus sales útiles desde el punto de vista agrícola.

Además, la presente invención se relaciona con:

45

50

- composiciones agrícolas que comprenden una cantidad de al menos un compuesto de la fórmula I o un enantiómero, diastereómero o sal del mismo;
 - el uso de un compuesto de la fórmula I o un enantiómero, diastereómero o sal del mismo para combatir plagas animales;
- un método para combatir plagas animales que comprende poner en contacto las plagas animales, su hábitat, su terreno de crianza, suministro de alimentos, plantas, semillas, suelo, áreas, material o ambiente en el cual las plagas animales están creciendo o puedan crecer, o los materiales, plantas, semillas, suelos, superficies o espacios que van a ser protegidos del ataque o infestación animal con una cantidad efectiva como pesticida de al menos un compuesto de la fórmula I o un enantiómero, diastereómero o sal del mismo;
- un método para proteger cultivos del ataque o infestación por parte de plagas animales, que comprende poner en
 contacto un cultivo con una cantidad efectiva como pesticida de al menos un compuesto de la fórmula I o un enantiómero, diastereómero o sal del mismo;
 - un método para la protección de semillas frente a insectos del suelo y de las raíces y brotes de los sembrados de insectos del suelo y foliares que comprende poner en contacto las semillas antes de la siembra y/o después de la pregerminación con al menos un compuesto de la fórmula I, o los enantiómeros, diastereómeros o sales del mismo;
- 25 semillas que comprenden un compuesto de la fórmula I o un enantiómero, diastereómero o sal del mismo.

Las sales de los compuestos de la fórmula I son preferiblemente sales aceptables desde el punto de vista agrícola. Pueden formarse mediante un método habitual, 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 reacción un compuesto ácido de la fórmula I con una base adecuada.

Sales útiles desde el punto de vista agrícola adecuado son especialmente las sales de aquellos cationes o las sales de adición ácida de aquellos ácidos cuyos cationes y aniones, respectivamente, no tienen un 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 (NH₄⁺) y amonio sustituido en el cual de uno a cuatro de los átomos de hidrógeno son reemplazados por C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-alduilo, C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, hidroxi-C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo, fenilo o bencilo. Ejemplos de iones amonio sustituidos comprenden metilamonio, isopropilamonio, diisopropilamonio, trimetilamonio, tetrametilamonio, tetraetilamonio, tetrabutilamonio, 2-hidroxietilamonio, 2-(2-hidroxietoxi)etilamonio, bis(2-hidroxietil)amonio, benciltrimetilamonio, y benciltrietilamonio, adicionalmente iones fosfonio, iones sulfonio, preferiblemente tri(C₁-C₄-alquil)sulfonio, y iones sulfoxonio, preferiblemente tri(C₁-C₄-alquil)sulfoxonio.

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, hexafluorofosfato, benzoato, y los aniones de ácidos C_1 - C_4 alcanoicos, preferiblemente formiato, acetato, propionato y butirato. Pueden formarse haciendo reacción los compuestos de la fórmulas 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 individuales del grupo. El prefijo C_n-C_m indica en cada caso el número posible de átomos de carbono en el grupo.

"Halógeno" será tomado con el significado de fluoro, cloro, bromo y yodo.

30

35

40

45

50

55

El término "parcial o completamente halogenado" será tomado con el significado de uno o más, por ejemplo 1, 2, 3, 4 o 5 o todos los átomos de hidrógeno de un radical dado reemplazados por un átomo de halógeno, en particular por flúor o cloro.

- El término "Cn-Cm-alquil" tal como se usa aquí (y también en Cn-Cm-alquilamino, di-Cn-Cm-alquilamino, Cn-Cm-alquilamino di-(Cn-Cm-alquilamino) carbonilo, Cn-Cm-alquilamino, Cn-Cm-alquillamino, Cn-Cm-alquillo, Cn-cm-tillamino, Cn-Cm-alquillamino, Cn-Cm-alquillamino,
- El término "Cn-Cm-haloalquilo" tal como se utiliza aquí (y también en Cn-Cm-haloalquilsulfinilo y Cn-Cm-haloalquilsulfonilo) se refiere a un grupo alquilo de cadena recta o ramificada que tiene de n a m átomos de carbono, por ejemplo de 1 a 10 en particular de 1 a 6 átomos de carbono (como se mencionó anteriormente) donde algunos o todos los átomos de hidrógeno en estos grupos pueden ser reemplazados por átomos de halógeno como se mencionó anteriormente, por ejemplo 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-difluoroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 2,2-dicloro-2-fluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, pentafluoroetilo y similares. El término C1-C10-haloalquilo en particular comprende C1-C2-fluoroalquilo, el cual es sinónimo con metilo o etilo, donde 1, 2, 3, 4 o 5 átomos de hidrógeno son sustituidos por átomos de flúor, tales como fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2-d

De la misma forma, " C_n - C_m -alcoxi" y " C_n - C_m -alquiltio" (o C_n - C_m -alquilsufenilo, respectivamente) se refiere a grupos alquilo de cadena recta o ramificada que tienen de n a m átomos de carbono, por ejemplo de 1 a 10, en particular de 1 a 6 o 1 a 4 átomos de carbono (como se mencionó anteriormente) enlazados a través de enlaces oxígeno o azufre, respectivamente, en cualquier enlace en el grupo alquilo. Ejemplos incluyen C_1 - C_4 -alcoxi tales como metoxi, etoxi, propoxi, isopropoxi, butoxi, sec-butoxi, isobutoxi y tert-butoxi, adicionalmente C_1 - C_4 -alquiltio tales como metiltio, propiltio, isopropiltio, y n-butiltio.

De acuerdo con lo anterior, los términos "C_n-C_m-haloalcoxi" y "C_n-C_m-haloalquiltio" (o C_n-C_m-haloalquilsulfenilo, respectivamente) se refieren a grupos alquilo de cadena recta o ramificada que tienen de n a m átomos de carbono, por ejemplo 1 a 10, en particular 1 a 6 o 1 a 4 átomos de carbono (como se mencionó anteriormente) enlazados a través de enlaces de oxígeno o azufre, respectivamente, en cualquier enlace en el grupo alquilo, donde algunos o todos los átomos de hidrógeno en estos grupos pueden ser reemplazados por átomos de halógeno como se mencionó anteriormente, por ejemplo C₁-C₂-haloalcoxi, tales como clorometoxi, bromometoxi, diclorometoxi, triclorometoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, clorofluorometoxi, diclorofluorometoxi, clorodifluorometoxi, 1-cloroetoxi, 1-bromoetoxi, 2-fluoroetoxi, 2-fluoroetoxi, 2,2-difluoroetoxi, 2,2-difluoroetoxi, 2,2-difluoroetoxi, 2,2-difluoroetoxi, adicionalmente C₁-C₂-haloalquiltio, tales como clorometiltio, bromometiltio, diclorometiltio, triclorometiltio, fluorometiltio, difluorometiltio, trifluorometiltio, clorofluorometiltio, diclorofluorometiltio, 1-fluoroetiltio, 2,2-difluoroetiltio, 2,2-difluoroetiltio, 2,2-difluoroetiltio, 2,2-difluoroetiltio, 2,2-difluoroetiltio, 2,2-difluoroetiltio, 2,2-difluoroetiltio, 2,2-tricloroetiltio, y similares. De la misma forma, los términos C₁-C₂-fluoroalcoxi y C₁-C₂-fluoroalquiltio se refieren a C₁-C₂-fluoroalquilo el cual está enlazado al resto de la molécula a través de un átomo de oxígeno o un átomo de azufre, respectivamente.

El término "C₂-C_m-alquenilo" tal como se utiliza aquí implica un grupo hidrocarburo no saturado ramificado o no ramificado que tiene de 2 a m, por ejemplo, 2 a 10 o 2 a 6 átomos de carbono y un doble enlace en cualquier posición, tal como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-metil-etenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-1-propenilo, 2-metil-1-propenilo, 1-metil-2-propenilo, 1-metil-2-propenilo, 2-metil-1-butenilo, 3-metil-2-butenilo, 2-metil-2-butenilo, 3-metil-2-butenilo, 1-metil-3-butenilo, 2-metil-3-butenilo, 3-metil-3-butenilo, 1,1-dimetil-2-propenilo, 1,2-dimetil-1-propenilo, 1-etil-1-propenilo, 1-etil-2-propenilo, 1-hexenilo, 2-hexenilo, 3-hexenilo, 4-hexenilo, 5-hexenilo, 1-metil-1-pentenilo, 2-metil-1-pentenilo, 3-metil-1-pentenilo, 1-metil-3-pentenilo, 2-metil-3-pentenilo, 3-metil-3-pentenilo, 3-metil-3-pentenilo, 3-metil-3-pentenilo, 1-metil-3-pentenilo, 1-metil-3-pentenilo, 1-metil-3-pentenilo, 1-metil-3-pentenilo, 1,1-dimetil-3-butenilo, 1,1-dimetil-3-butenilo, 1,2-dimetil-1-butenilo, 1,3-dimetil-1-butenilo, 1,3-dimetil-1-butenilo, 2,3-dimetil-1-butenilo, 2,3-dimetil-1-butenilo, 2,3-dimetil-1-butenilo, 2,3-dimetil-2-butenilo, 2,3-dimet

dimetil-3-butenilo, 3,3-dimetil-1-butenilo, 3,3-dimetil-2-butenilo, 1-etil-1-butenilo, 1-etil-2-butenilo, 1-etil-3-butenilo, 2-etil-1-butenilo, 2-etil-2-butenilo, 2-etil-3-butenilo, 1,1,2-trimetil-2-propenilo, 1-etil-1-metil-2-propenilo, 1-etil-2-metil-1-propenilo, 1-etil-2-metil-2-propenilo.

El término "C₂-C_m-alquinilo" tal como se utiliza aquí se refiere a un grupo hidrocarburo insaturado ramificado o no ramificado que tiene de 2 a m, por ejemplo, de 2 a 10 o 2 a 6 átomos de carbono y contiene al menos un triple enlace tal como etinilo, propinilo, 1-butinilo, 2-butinilo, y similares.

El término " C_1 - C_4 -alcoxi- C_4 -alquil" tal como se utiliza se refiere a alquilo que tiene de 1 a 4 átomos de carbono, por ejemplo, como los ejemplos específicos mencionados anteriormente, donde un átomo de hidrógeno del radical alquilo es reemplazados por un grupo C_1 - C_4 -alcoxi.

El término "C₁-C₄-alquiltio-C₁-C₄-alquil" tal como se utiliza aquí se refiere a un alquilo que tiene de 1 a 4 átomos de carbono, donde un átomo de hidrógeno del radical alquilo es reemplazado por un grupo C₁-C₄-alquiltio.

El término "C₃-C_m-cicloalquil" tal como se utiliza aquí se refiere a radicales cicloalifáticos saturados de 3 a m miembros, por ejemplo ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloh

El término "arilo" tal como se utiliza aquí se refiere a un radical hidrocarburo aromático tal como naftilo o en particular fenilo.

El término "aril-C₁-C₄-alquil" tal como se utiliza aquí se refiere a un radical hidrocarburo aromático, el cual está enlazado al resto de la molécula a través de un grupo C₁-C₄-alquileno, comprendiendo ejemplos bencilo, 1-feniletilo o 2-feniletilo.

- El término "heterociclilo de 3 a 7" o "de 5 a 7" "miembros" o "grupo heterocíclico con miembros " tal como se utiliza aquí (y también en "heterociclil-C₁-C₄-alqui") se refiere a radicales heterocíclicos saturados, completa o parcialmente insaturados o aromáticos que tienen de 3 a 7 o de 5 a 7 miembros de anillo, donde 1, 2 o 3 miembros de anillo son heteroátomos, seleccionados de O, N y S o grupos de heteroátomos, seleccionados de S=O, S(O)2 o N-R siendo R H o alquilo. Ejemplos de anillos no aromáticos incluyen azetidiilo, pirrolidinilo, pirazolinilo, imidazolinilo, pirrolinilo, pirazolinilo, imidazolinilo, tetrahidrofuranilo, dihidrofuranilo, 1,3-dioxolanilo, dioxolenilo, tiolanilo, dihidrotienilo, oxazolidinilo, isoxazolidinilo, isoxazolidinilo, isoxazolidinilo, isoxazolidinilo, dihidropiranilo, tetrahidropiranilo, dioxanilo, tiopiranilo, dihidropiranilo, tetrahidropiranilo, tiopiranilo, dihidropiranilo, tetrahidropiranilo, tetrahidropiranilo, tetrahidropiranilo, morfolinilo, tiazinilo y similares. Ejemplos de anillos aromáticos se listan en el siguiente parágrafo.
- El término "heteroarilo de 3 a 7" o "de 5 a 7 miembros" o "grupo heteroaromático con miembros " tal como se utiliza aquí (y también en "heteroaril-C₁-C₄-alquilo") se refiere a un radical heterociclilo aromático que tiene de 3 a 7 o de 5 a 7 miembros de anillo, donde 1, 2 o 3 miembros de anillo son heteroátomos seleccionados de O, N y S o grupos de heteroátomos, seleccionados de S = o, S (O)₂ o NR siendo R H. Ejemplos para anillos heteroaromáticos de 3 a 7 miembros incluyen triazinilo, pirazinilo, piridilo, piridazinilo, piridilo, tienilo, furilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, triazolilo, tetrazolilo, tiazolilo, oxazolilo, tiadiazolilo, oxadiazolilo, isotiazolilo y isoxazolilo.
- 35 El término "heterociclil-C₁-C₄-alquil" tal como se utiliza aquí se refiere a heterocíclicos aromáticos o no aromáticos saturados, completa o parcialmente insaturados y los términos "heteroaril-C₁-C₄-alquil" tal como se utilizan aquí se refieren a radicales aromáticos, los cuales están enlazados al resto de la molécula a través de un grupo C₁-C₄-alquileno.

Preferencias

40 Con respecto al uso de acuerdo con la invención de los compuestos 3-amino-1,2-bencisotiazol de la fórmula I, se da preferencia particular a los siguientes significados de los sustituyentes y variables, en cada caso por sí mismos o en combinación:

Se da preferencia a 3-amino-1,2 bencisotiazol de la fórmula I, donde A es A³.

Se prefieren especialmente compuestos de 3-amino-1,2-bencisotiazol de fórmula I, en donde n es 1 y A es A³.

45 Se prefieren también compuestos de 3-amino-1,2-bencisotiazol de fórmula I, en donde n es 0 y A es A³.

Se da preferencia a compuestos de 3-amino-1,2-bencisotiazol de fórmula I, en donde R^1 se selecciona de halógeno, C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -haloalquilo, C_1 - C_6 - C_6 -haloalquilo, C_1 - C_6

Se da preferencia especialmente a compuestos de 3-amino-1,2-bencisotiazol de fórmula I, en donde R^1 se selecciona de halógeno, C_1 - C_6 -alcoxi y C_1 - C_6 -haloalcoxi.

Son los más preferidos compuestos de 3-amino-1,2-bencisotiazol de fórmula I, en donde R¹ se selecciona de fluoro, cloro, difluorometoxi, diclorometoxi, trifluorometoxi o triclorometoxi.

5 Se da preferencia a compuestos 3-amino-1,2 bencisotiazol de fórmula I, donde R², R³ y R⁴ son seleccionados independientemente uno de otro del grupo consistente de hidrógeno y F, Cl, Br o I.

Se da preferencia especialmente a compuestos 3-amino-1,2 bencisotiazol de la fórmula I, donde R², R³ y R⁴ son seleccionados independientemente uno de otro entre hidrógeno o fluoro.

Los más preferidos son los compuestos de 3-amino-1,2 bencisotiazol de la fórmula I, donde R^2 , R^3 y R^4 son hidrógeno.

Se da preferencia a compuestos 3-amino-1,2 bencisotiazol de la fórmula I, donde A esA 3 , R 9 es C $_1$ -C $_6$ -alquilo y R 10 se selecciona de C $_1$ -C $_6$ -alquilo, C $_2$ -C $_6$ -alquenilo, C $_2$ -C $_6$ -alquinilo, C $_1$ -C $_6$ -alcoxi,C $_3$ -C $_1$ -cicloalquilo, en donde los radicales pueden ser no sustituidos, parcial o completamente halogenados y/o pueden portar uno o más radicales, seleccionado independientemente uno de otro del grupo consistente de CN,NO $_2$,NH $_2$,C $_1$ -C $_6$ -alcoxi,C $_1$ -C $_6$ -alquilsulfinilo,C $_1$ -C $_6$ -alquilsulfinilo, C $_1$ -C $_6$ -alquil)amino, di-(C $_1$ -C $_1$ -alquil)amino, di-(C $_1$ -C $_1$ -alquil)amino, C $_1$ -C $_1$ -cicloalquilo y fenilo, siendo posible que el fenilo sea no sustituido, parcial o completamente halogenado y/o que porte uno o más sustituyentes, independientemente uno de otro seleccionado del grupo consistente de C $_1$ -C $_4$ -alquilo, C $_1$ -C $_4$ -haloalquilo, C $_1$ -C $_4$ -haloalcoxi.

15

- También se da preferencia a compuestos 3-amino-1,2 bencisotiazol de la fórmula I, donde A esA³, R⁹ es C₁-C₆alquilo y R¹⁰ se selecciona de piridina, pirazina, pirimidina, pirazol, imdidazol, triazol, tiofeno, tiazol, oxazol, furano, 20 isotiazol, isoxazol, piperidina, tetrahidrofurano, dihidrofurano, tiolan, dihidrotiofeno, pirrolidina, dihidropirrol, dihidropirazol, dihidroxazol, dihidrotiazol, oxatiolan o oxazolidina, estando opcionalmente sustituido cada anillo con 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente uno de otro del grupo consistente de CN, OH, NO₂, NH₂, C₁- C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -haloalquilo, C_1 - C_6 -alquilsulfinilo, C_1 - C_6 -25 C₁-C₆-haloalquiltio, C₁-C₆-alcoxicarbonilo, (C₁-C₁₀-alquil)amino, di-(C₁-C₁₀-alquil)amino, C₃-C₁₀-cicloalquilo, fenilo y anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, siendo posible que los anillos aromáticos o heteroaromáticos sean no sustituidos, parcial o completamente halogenados y/o porten uno o más sustituyentes, independientemente uno de otro seleccionados del grupo consistente de C1-C4-alquilo, C1-C4-haloalquilo, C1-C4-alcoxi, C1-C4-haloalcoxi, C2-C6alquenilo, C_2 - C_6 -alquinilo, C_2 - C_6 -haloalquenilo, C_2 - C_6 -haloalquinilo, C_1 - C_6 -alquilsulfinilo, C_1 - C_6 -al 30 dialquilaminocarbonilo, (C₁-C₁₀-alquil)amino, di-(C₁-C₁₀-alquil)amino, C₃-C₁₀-cicloalquilo, C₃-C₁₀-halocicloalquilo, C₁₀-cicloalquilamino, C₂-C₆-alquilcarbonilo.
- Se da especial preferencia a los compuestos 3-amino-1,2 bencisotiazol de la fórmula I, donde A esA³, R⁹ es C₁-C₆-alquilo y R¹⁰ se selecciona de piridina, pirazina, pirimidina, pirazol, imdidazol, triazol, tiofeno, tiazol, oxazol, furano, isotiazol, isoxazol, piperidina, tetrahidrofurano, dihidrofurano, tiolan, dihidrotiofeno, pirrolidina, dihidropirrol, dihidropirazol, dihidrotiazol, oxatiolan o oxazolidina, estando cada anillo opcionalmente sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente uno de otro del grupo consistente de CN, OH, NO₂, NH₂, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-alquilsulfinilo, C₁-C₆-alquilsulfinilo, (C₁-C₁₀-alquil)amino, di-(C₁-C₁₀-alquil)amino, C₃-C₁₀-cicloalquilo, fenilo, piridina, pirimidina, tiofeno, isooxazol e isotiazol, siendo posible que los anillos aromáticos o heteroaromáticos sean no sustituidos, parcial o completamente halogenados y/o porten uno o más sustituyentes, independientemente uno de otro seleccionados del grupo consistente de C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alquilo, C₁-C₆-alquilolo, C₂-C₆-alquinilo, C₂-C₆-haloalquinilo, C₂-C₆-haloalquinilo, ciano, nitro, amino, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-alquilsulfinilo, C₁-C₆-a
- 45 Se da preferencia a compuestos de 3-amino-1,2-bencisotiazol de fórmula I, en donde R¹ se selecciona de halógeno, C₁-C₆-alcoxi o C₁-C₆-haloalcoxi y R², R³ y R⁴ son seleccionados independientemente uno de otro del grupo consistente de hidrógeno, F, CI, Br o I.

Se da preferencia especialmente a compuestos de 3-amino-1,2-bencisotiazol de fórmula I, en donde R^1 se selecciona de halógeno, C_1 - C_6 -alcoxi o C_1 - C_6 -haloalcoxi y R^2 , R^3 y R^4 son hidrógeno.

Se da preferencia a compuestos de 3-amino-1,2-bencisotiazol de fórmula I, en donde A esA³, R¹ se selecciona de C₁-C₆-alcoxi o C₁-C₆-haloalcoxi, R², R³ y R⁴ son seleccionados independientemente uno de otro del grupo consistente de hidrógeno, F, CI, Br o I,R⁹ es C₁-C₆-alquilo y R10 se selecciona deC₁-C₆-alquilo,C₂-C₆-alquinilo, C₁-C₆-alcoxi y C₃-C₁₀-cicloalquilo, donde los átomos de carbono de todos los radicales mencionados pueden estar no sustituidos, parcialmente o completamente halogenados y/o puede portar uno o más radicales,

independientemente uno de otro seleccionados cada uno del grupo consistente de CN, NO_2 , NH_2 , C_1 - C_6 -alcoxi, C_1 - C_6 -alquiltio, C_1 - C_6 -alquilsulfinilo, C_1 - C_6 -alquilsulfonilo, C_1 - C_6 -haloalcoxi, C_1 - C_6 -haloalquiltio, C_1 - C_6 -alcoxicarbonilo, $(C_1$ - C_1 0-alquil)amino, di- $(C_1$ - C_1 0-alquil)amino, C_3 - C_1 0-cicloalquilo fenilo o a un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros siendo posible que cada anillo sea no sustituido, parcial o completamente halogenado y/o porte uno o más sustituyentes, independientemente uno de otro seleccionados del grupo consistente de of C_1 - C_4 -alquilo, C_1 - C_4 -haloalquilo, C_1 - C_4 -alcoxi, C_1 - C_4 -haloalcoxi, C_2 - C_6 -alquinilo, C_2 - C_6 -haloalquinilo, C_2 - C_6 -haloalquinilo, C_1 - C_6 -alquilsulfonilo, C_1 - C_6 -haloalquiltio, C_2 - C_6 -alcoxicarbonilo, C_2 - C_6 -alquilaminocarbonilo, C_3 - C_6 -dialquilaminocarbonilo, C_1 - C_1 0-alquil)amino, di- C_1 - C_1 0-alquil)amino, C_2 - C_1 0-cicloalquilo, C_3 - C_1 0-cicloalquilo, C_3 - C_1 0-cicloalquilo, C_3 - C_1 0-cicloalquilo, C_2 - C_6 -alquilcarbonilo.

5

10

15

Se da preferencia especialmente a compuestos 3-amino-1,2 bencisotiazol de la fórmula I, donde A esA 3 , n es 0 , R 1 se selecciona de C_1 - C_6 -alcoxi o C_1 - C_6 -haloalcoxi, R 2 , R 3 y R 4 son hidrógeno, R 9 es C_1 - C_6 -alquilo y R 10 se selecciona de C_1 - C_6 -alquilo, C_3 - C_{10} -cicloalquilo o fenilo, donde los átomos de carbono o el anillo carbocíclico de los radicales puede ser no sustituido, parcial o completamente halogenado y/o pueden portar uno o más sustituyentes, independientemente uno de otro seleccionados del grupo consistente de C_1 - C_4 -alquilo, C_1 - C_4 -haloalquilo, C_1 - C_4 -haloalcoxi, C_2 - C_6 -alquenilo, C_2 - C_6 -alquinilo, C_2 - C_6 -haloalquenilo, C_2 - C_6 -haloalquiloilo, C_1 - C_6 -alquilsulfinilo, C_1 - C_6 -alquilsulfinilo, C_1 - C_6 -alquilsulfinilo, C_1 - C_6 -alquilsulfinilo, C_1 - C_6 -haloalquiltio.

Más preferidos son los compuestos 3-amino-1,2 bencisotiazol de la fórmula I, donde A es A³, n es 0, R¹ se selecciona de C₁-C₆-alcoxi o C₁-C₆-haloalcoxi, R², R³ y R⁴ son hidrógeno, R³ C₁-C₆-alquilo y R¹º se selecciona de piridina, pirazina, pirimidina, pirazol, imdidazol, triazol, tiofeno, tiazol, oxazol, furano, isotiazol, isoxazol, piperidina, tetrahidrofurano, dihidrofurano, tiolan, dihidrotiofeno, pirrolidina, dihidropirrol, dihidropirazol, dihidrotiazol, oxatiolan o oxazolidín cada anillo opcionalmente sustituido con uno a tres sustituyentes independientemente uno de otro seleccionados del grupo consistente de CN, OH, NO₂, NH₂, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi,C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-alquilsulfinilo, C₁-C₆-alquilsulfonilo, C₁-C₆-alquillo, heteroaromático de 5 o 6 miembros, siendo posible que los anillos aromáticos y heteroaromáticos sean no sustituidos, parcial o completamente halogenados y/o porten uno o más sustituyentes, independientemente uno de otro seleccionados del grupo consistente de C₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-haloalquilo, C₁-C₄-alcoxi, C₁-C₄-haloalcoxi, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₂-C₆-haloalquenilo, C₂-C₆-haloalquinilo, CN, NO₂, NH₂, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-alquillo, C₃-C₆-alquillo, C₁-C₆-alquillo, C₁-C₆-alquillo, C₃-C₆-alquillo, C₁-C₆-alquillo, C₃-C₆-alquillo, C₃-C₆-a

Ejemplos de compuestos preferidos de la fórmula I, donde R^1 , R^2 , R^3 y R^4 se definen individualmente en las tablas A1 a A154, y R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} se definen individualmente en la tabla A.

Tabla A1: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R⁴ son H, R² es H, R¹ es CH₃ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁵ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;

Tabla A2: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^3 y R^4 son H, R^2 es H, R^1 es C_2H_5 y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;

Tabla A3: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R⁴ son H, R² es H, R¹ es Cl y en donde R⁵ y R⁶ o R⁰ y R¹0 son como se define en una fila de la tabla A;

Tabla A4: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^3 y R^4 son H, R^2 es H, R^1 es F y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;

Tabla A5: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^3 y R^4 son H, R^2 es H, R^1 es CF_3 y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;

Tabla A6: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R⁴ son H, R² es H, R¹ es OCH₃ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁶ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;

Tabla A7: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R⁴ son H, R² es H, R¹ es OC₂H₅ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁶ y R¹0 son como se define en una fila de la tabla A;

Tabla A8: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R⁴ son H, R² es H, R¹ es OCF₃ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;

- Tabla A9: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^3 y R^4 son H, R^2 es H, R^1 es OCHF₂ y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A10: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R⁴ son H, R² es H, R¹ es OCCIF₂ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A11: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^3 y R^4 son H, R^2 es H, R^1 es OCF₂CHCIF y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A12: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^3 y R^4 son H, R^2 es F, R^1 es CH_3 y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A13: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^3 y R^4 son H, R^2 es F, R^1 es C_2H_5 y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A14: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R⁴ son H, R² es F, R¹ es CI y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A15: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R⁴ son H, R² es F, R¹ es F y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A16: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R⁴ son H, R² es F, R¹ es CF₃ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁰ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A17: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^3 y R^4 son H, R^2 es F, R^1 es OCH₃ y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A18: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R⁴ son H, R² es F, R¹ es OC₂H₅ y en donde R⁵ y 20 R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A19: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R⁴ son H, R² es F, R¹ es OCF₃ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A20: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R⁴ son H, R² es F, R¹ es OCHF₂ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A21: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R⁴ son H, R² es F, R¹ es OCCIF₂ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁰ y R¹0 son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A22: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^3 y R^4 son H, R^2 es F, R^1 es OCF₂CHCIF y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A23: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R⁴ son H, R² es CI, R¹ es CH₃ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A24: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^3 y R^4 son H, R^2 es CI, R^1 es C_2H_5 y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A25: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^3 y R^4 son H, R^2 es CI, R^1 es CI y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A26: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R⁴ son H, R² es CI, R¹ es F y en donde R⁵ y R⁶ o R⁰ y R¹0 son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A27: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^3 y R^4 son H, R^2 es CI, R^1 es CF_3 y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A28: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R⁴ son H, R² es CI, R¹ es OCH₃ y en donde R⁵ y R⁴ o R⁴ o R⁴ y R¹¹ son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A29: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^3 y R^4 son H, R^2 es CI, R^1 es OC_2H_5 y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;

- Tabla A30: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^3 y R^4 son H, R^2 es CI, R^1 es OCF $_3$ y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A31: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R⁴ son H, R² es CI, R¹ es OCHF₂ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A32: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R⁴ son H, R² es CI, R¹ es OCCIF₂ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁰ y R¹0 son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A33: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^3 y R^4 son H, R^2 es CI, R^1 es OCF₂CHCIF y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A34: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^3 y R^4 son H, R^2 es Br, R^1 es CH_3 y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A35: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^3 y R^4 son H, R^2 es Br, R^1 es C_2H_5 y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A36: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R⁴ son H, R² es Br, R¹ es CI y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A37: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R⁴ son H, R² es Br, R¹ es F y en donde R⁵ y R⁶ o R⁰ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
 - -Tabla A38: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^3 y R^4 son H, R^2 es Br, R^1 es CF_3 y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A39: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R⁴ son H, R² es Br, R¹ es OCH₃ y en donde R⁵ y R⁴ o R⁴ y R¹0 son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A40: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^3 y R^4 son H, R^2 es Br, R^1 es OC_2H_5 y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A41: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R⁴ son H, R² es Br, R¹ es OCF₃ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A42: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R⁴ son H, R² es Br, R¹ es OCHF₂ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁰ y R¹0 son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A43: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^3 y R^4 son H, R^2 es Br, R^1 es OCCIF₂ y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A44: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^3 y R^4 son H, R^2 es Br, R^1 es OCF₂CHCIF y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A45: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^3 y R^4 son H, R^2 es J, R^1 es CH_3 y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A46: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^3 y R^4 son H, R^2 es J, R^1 es C_2H_5 y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A47: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R⁴ son H, R² es J, R¹ es Cl y en donde R⁵ y R⁶ o R⁰ y R¹0 son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A48: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R⁴ son H, R² es J, R¹ es F y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A49: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R⁴ son H, R² es J, R¹ es CF₃ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁰ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A50: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^3 y R^4 son H, R^2 es J, R^1 es OCH₃ y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;

- Tabla A51: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^3 y R^4 son H, R^2 es J, R^1 es OC_2H_5 y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A52: Compuestos de la fórmula I; en donde cada uno de R^3 y R^4 son H, R^2 es J, R^1 es OCF $_3$ y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A53: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^3 y R^4 son H, R^2 es J, R^1 es OCHF $_2$ y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A54: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R⁴ son H, R² es J, R¹ es OCCIF₂ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁰ y R¹0 son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A55: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^3 y R^4 son H, R^2 es J, R^1 es OCF₂CHCIF y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A56: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^2 y R^4 son H, R^3 es F, R^1 es CH_3 y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A57: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^2 y R^4 son H, R^3 es F, R^1 es C_2H_5 y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A58: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R² y R⁴ son H, R³ es F, R¹ es CI y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A59: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^2 y R^4 son H, R^3 es F, R^1 es F y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A60: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R² y R⁴ son H, R³ es F, R¹ es CF₃ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁰ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A61: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^2 y R^4 son H, R^3 es F, R^1 es OCH₃ y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A62: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^2 y R^4 son H, R^3 es F, R^1 es OC_2H_5 y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A63: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R² y R⁴ son H, R³ es F, R¹ es OCF₃ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁰ y R¹0 son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A64: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^2 y R^4 son H, R^3 es F, R^1 es OCHF₂ y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A65: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R² y R⁴ son H, R³ es F, R¹ es OCCIF₂ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A66: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^2 y R^4 son H, R^3 es F, R^1 es OCF₂CHCIF y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A67: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^2 y R^4 son H, R^3 es CI, R^1 es CH_3 y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A68: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^2 y R^4 son H, R^3 es CI, R^1 es C_2H_5 y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A69: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R² y R⁴ son H, R³ es CI, R¹ es CI y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A70: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R² y R⁴ son H, R³ es CI, R¹ es F y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A71: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^2 y R^4 son H, R^3 es CI, R^1 es CF_3 y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;

- Tabla A72: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^2 y R^4 son H, R^3 es CI, R^1 es OCH $_3$ y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A73: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^2 y R^4 son H, R^3 es CI, R^1 es OC_2H_5 y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A74: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R² y R⁴ son H, R³ es CI, R¹ es OCF₃ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁰ y R¹0 son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A75: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R² y R⁴ son H, R³ es CI, R¹ es OCHF₂ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A76: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R² y R⁴ son H, R³ es CI, R¹ es OCCIF₂ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A77: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R² y R⁴ son H, R³ es CI, R¹ es OCF₂CHCIF y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A78: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R² y R⁴ son H, R³ es Br, R¹ es CH₃ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A79: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^2 y R^4 son H, R^3 es Br, R^1 es C_2H_5 y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A80: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R² y R⁴ son H, R³ es Br, R¹ es CI y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A81: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R² y R⁴ son H, R³ es Br, R¹ es F y en donde R⁵ y R⁶ o R⁰ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A82: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R² y R⁴ son H, R³ es Br, R¹ es CF₃ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A83: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R² y R⁴ son H, R³ es Br, R¹ es OCH₃ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A84: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R² y R⁴ son H, R³ es Br, R¹ es OC₂H₅ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A85: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R² y R⁴ son H, R³ es Br, R¹ es OCF₃ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A86: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R² y R⁴ son H, R³ es Br, R¹ es OCHF₂ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A87: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^2 y R^4 son H, R^3 es Br, R^1 es OCCIF₂ y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A88: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^2 y R^4 son H, R^3 es Br, R^1 es OCF₂CHCIF y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A89: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R² y R⁴ son H, R³ es J, R¹ es CH₃ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁰ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A90: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^2 y R^4 son H, R^3 es J, R^1 es C_2H_5 y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A91: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R² y R⁴ son H, R³ es J, R¹ es CI y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A92: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R² y R⁴ son H, R³ es J, R¹ es F y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;

- Tabla A93: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R² y R⁴ son H, R³ es J, R¹ es CF₃ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A94: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^2 y R^4 son H, R^3 es J, R^1 es OCH₃ y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A95: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^2 y R^4 son H, R^3 es J, R^1 es OC_2H_5 y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A96: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^2 y R^4 son H, R^3 es J, R^1 es OCF $_3$ y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A97: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R² y R⁴ son H, R³ es J, R¹ es OCHF₂ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A98: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R² y R⁴ son H, R³ es J, R¹ es OCCIF₂ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A99: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R² y R⁴ son H, R³ es J, R¹ es OCF₂CHCIF y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A100: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R² son H, R⁴ es F, R¹ es CH₃ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A101: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^3 y R^2 son H, R^4 es F, R^1 es C_2H_5 y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A102: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R² y R⁴ son H, R³ es J, R¹ es CI y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A103: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^2 y R^4 son H, R^3 es J, R^1 es F y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A104: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R² son H, R⁴ es F, R¹ es CF₃ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A105: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R² son H, R⁴ es F, R¹ es OCH₃ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁶ y R¹0 son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A106: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^3 y R^2 son H, R^4 es F, R^1 es OC_2H_5 y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A107: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R² son H, R⁴ es F, R¹ es OCF₃ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A108: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R² son H, R⁴ es F, R¹ es OCHF₂ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁶ y R¹ son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A109: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R² son H, R⁴ es F, R¹ es OCCIF₂ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A110: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R² son H, R⁴ es F, R¹ es OCF₂CHCIF y en donde R⁵ y R⁶ o R⁰ y R¹¹ son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A111: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^3 y R^2 son H, R^4 es CI, R^1 es CH $_3$ y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A112: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^3 y R^2 son H, R^4 es CI, R^1 es C_2H_5 y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A113: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^3 y R^2 son H, R^4 es CI, R^1 es CI y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;

- Tabla A114: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R² son H, R⁴ es CI, R¹ es F y en donde R⁵ y R⁶ o R⁰ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A115: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R² son H, R⁴ es CI, R¹ es CF₃ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A116: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R² son H, R⁴ es CI, R¹ es OCH₃ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁰ y R¹0 son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A117: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^3 y R^2 son H, R^4 es CI, R^1 es OC_2H_5 y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A118: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R² son H, R⁴ es CI, R¹ es OCF₃ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A119: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^3 y R^2 son H, R^4 es CI, R^1 es OCHF₂ y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A120: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R² son H, R⁴ es CI, R¹ es OCCIF₂ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A121: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R² son H, R⁴ es CI, R¹ es OCF₂CHCIF y en donde R⁵ y R⁶ o R⁰ y R¹¹ son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A122: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^3 y R^2 son H, R^4 es Br, R^1 es CH_3 y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A123: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^3 y R^2 son H, R^4 es Br, R^1 es C_2H_5 y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A124: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^3 y R^2 son H, R^4 es Br, R^1 es CI y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A125: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R² son H, R⁴ es Br, R¹ es F y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A126: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R² son H, R⁴ es Br, R¹ es CF₃ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁶ y R¹0 son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A127: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^3 y R^2 son H, R^4 es Br, R^1 es OCH₃ y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A128: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R² son H, R⁴ es Br, R¹ es OC₂H₅ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A129: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^3 y R^2 son H, R^4 es Br, R^1 es OCF₃ y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A130: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^3 y R^2 son H, R^4 es Br, R^1 es OCHF₂ y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A131: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R² son H, R⁴ es Br, R¹ es OCCIF₂ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁰ y R¹0 son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A132: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^3 y R^2 son H, R^4 es Br, R^1 es OCF₂CHCIF y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A133: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R² son H, R⁴ es J, R¹ es CH₃ y en donde R⁵ y R⁴ o R⁴ o R⁴ y R¹0 son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A134: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^3 y R^2 son H, R^4 es J, R^1 es C_2H_5 y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;

- Tabla A135: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R² son H, R⁴ es J, R¹ es Cl y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A136: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R² son H, R⁴ es J, R¹ es F y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A137: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R² son H, R⁴ es J, R¹ es CF₃ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁰ y R¹0 son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A138: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^3 y R^2 son H, R^4 es J, R^1 es OCH₃ y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A139: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R² son H, R⁴ es J, R¹ es OC₂H₅ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A140: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R² son H, R⁴ es J, R¹ es OCF₃ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A141: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R² son H, R⁴ es J, R¹ es OCHF₂ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A142: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R³ y R² son H, R⁴ es J, R¹ es OCCIF₂ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁰ y R¹0 son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A143: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^3 y R^2 son H, R^4 es J, R^1 es OCF₂CHCIF y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A144: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R⁴ y R² son F, R³ es H, R¹ es CH₃ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A145: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^4 y R^2 son F, R^3 es H, R^1 es C_2H_5 y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A146: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R⁴ y R² son F, R³ es H, R¹ es CI y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A147: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R⁴ y R² son F, R³ es H, R¹ es F y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A148: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R⁴ y R² son F, R³ es H, R¹ es CF₃ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A149: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R⁴ y R² son F, R³ es H, R¹ es OCH₃ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A150: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^4 y R^2 son F, R^3 es H, R^1 es OC_2H_5 y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A151: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R^4 y R^2 son F, R^3 es H, R^1 es OCF $_3$ y en donde R^5 y R^6 o R^9 y R^{10} son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A152: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R⁴ y R² son F, R³ es H, R¹ es OCHF₂ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
 - Tabla A153: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R⁴ y R² son F, R³ es H, R¹ es OCCIF₂ y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;
- Tabla A154: Compuestos de la fórmula I, en donde cada uno de R⁴ y R² son F, R³ es H, R¹ es OCF₂CHCIF y en donde R⁵ y R⁶ o R⁹ y R¹⁰ son como se define en una fila de la tabla A;

TABLA A:

Nº	Fórmula	R ⁵ , resp. R ⁹	R ⁶ , resp. R ¹⁰
C.I-1	R^{2} R^{3} R^{4} R^{9} R^{10} R^{10} R^{10} R^{3} R^{4} R^{4} R^{10}	CH ₃	Н
C.I-2	I.A ³ .0	CH ₃	F ₃ C
C.I-3	I.A ³ .0	CH ₃	Cl ₃ C
C.I-4	I.A ³ .0	CH ₃	Cl₂CH
C.I-5	I.A ³ .0	CH₃	CICH ₂
C.I-6	I.A ³ .0	CH ₃	CH ₃
C.I-7	I.A ³ .0	CH₃	CH ₃ CH ₂
C.I-8	I.A ³ .0	CH ₃	(CH ₃) ₂ CH
C.I-9	I.A ³ .0	CH₃	(CH₃)₃C
C.I-10	I.A ³ .0	CH ₃	CH ₃ CH ₂ CH ₂
C.I-11	I.A ³ .0	CH ₃	CH ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂
C.I-12	I.A ³ .0	CH₃	(CH ₃) ₃ CCH ₂
C.I-13	I.A ³ .0	CH₃	CH₃O
C.I-14	I.A ³ .0	CH ₃	CH₃CH₂O
C.I-15	I.A ³ .0	CH₃	F₃CCH₂O
C.I-16	I.A ³ .0	CH₃	CH₃NH
C.I-17	I.A ³ .0	CH₃	CH ₃ CH ₂ NH
C.I-18	I.A ³ .0	CH ₃	(CH ₃) ₂ N
C.I-19	I.A ³ .0	CH ₃	(CH ₃ CH ₂) ₂ N
C.I-20	I.A ³ .0	CH ₃	(CH ₃ CH ₂)CH ₃ N
C.I-21	I.A ³ .0	CH ₃	C ₆ H ₅ NH
C.I-22	I.A ³ .0	CH ₃	(C ₆ H ₅)CH ₃ N
C.I-23	I.A ³ . 0	CH ₃	(2,6-F ₂ C ₆ H ₃) NH

Nº	Fórmula	R ⁵ , resp. R ⁹	R ⁶ , resp. R ¹⁰
C.I-24	I.A ³ .0	CH ₃	(2,6-F ₂ C ₆ H ₃)CH ₃ N
C.I-25	I.A ³ .0	CH ₃	ciclopropilo
C.I-26	I.A ³ .0	CH ₃	ciclobutilo
C.I-27	I.A ³ .0	CH ₃	ciclopentilo
C.I-28	I.A ³ .0	CH ₃	ciclohexilo
C.I-29	I.A ³ .0	CH ₃	CNCH ₂
C.I-30	I.A ³ .0	CH ₃	CH₃OCH₂
C.I-31	I.A ³ .0	CH ₃	CH ₃ CH ₂ OCH ₂
C.I-32	I.A ³ .0	CH ₃	CH₃OCH₂CH₂
C.I-33	I.A ³ .0	CH ₃	F ₃ C CH ₂
C.I-34	I.A ³ .0	CH ₃	CH ₃ OCOCH ₂
C.I-35	I.A ³ .0	CH ₃	CH₃SCH₂
C.I-36	I.A ³ .0	CH ₃	CH ₃ CH ₂ SCH ₂
C.I-37	I.A ³ .0	CH ₃	CH ₃ SCH ₂ CH ₂
C.I-38	I.A ³ .0	CH ₃	C ₆ H ₅ CH ₂
C.I-39	I.A ³ .0	CH ₃	CH ₂ =CHCH ₂
C.I-40	I.A ³ .0	CH ₃	CH ₂ =CH
C.I-41	I.A ³ .0	CH ₃	CH₃CH=CH
C.I-42	I.A ³ .0	CH ₃	C ₆ H ₅
C.I-43	I.A ³ .0	CH ₃	2-F-C ₆ H ₄
C.I-44	I.A ³ .0	CH ₃	3-F-C ₆ H ₄
C.I-45	I.A ³ .0	CH ₃	4-F-C ₆ H ₄
C.I-46	I.A ³ .0	CH ₃	2-CI-C ₆ H ₄
C.I-47	I.A ³ .0	CH ₃	3-CI-C ₆ H₄
C.I-48	I.A ³ .0	CH ₃	4-CI-C ₆ H ₄
C.I-49	I.A ³ .0	CH ₃	2-CH ₃ -C ₆ H ₄

Nº	Fórmula	R ⁵ , resp. R ⁹	R ⁶ , resp. R ¹⁰
C.I-50	I.A ³ .0	CH ₃	3-CH ₃ -C ₆ H ₄
C.I-51	I.A ³ .0	CH ₃	4-CH ₃ -C ₆ H ₄
C.I-52	I.A ³ .0	CH₃	2-CH ₃ O-C ₆ H ₄
C.I-53	I.A ³ .0	CH₃	3-CH ₃ O-C ₆ H ₄
C.I-54	I.A ³ .0	CH₃	4-CH ₃ O-C ₆ H ₄
C.I-55	I.A ³ .0	CH₃	2-F ₃ C-C ₆ H ₄
C.I-56	I.A ³ .0	CH₃	3-F ₃ C-C ₆ H ₄
C.I-57	I.A ³ .0	CH₃	4-F ₃ C-C ₆ H ₄
C.I-58	I.A ³ .0	CH₃	2-Br-C ₆ H ₄
C.I-59	I.A ³ .0	CH₃	3-Br-C ₆ H ₄
C.I-60	I.A ³ .0	CH ₃	4-Br-C ₆ H ₄
C.I-61	I.A ³ .0	CH ₃	3-CN-C ₆ H ₄
C.I-62	I.A ³ .0	CH ₃	4-CN-C ₆ H ₄
C.I-63	I.A ³ .0	CH ₃	piridin-2-ilo
C.I-64	I.A ³ .0	CH ₃	piridin-3-ilo
C.I-65	I.A ³ .0	CH₃	piridin-4-ilo
C.I-66	I.A ³ .0	CH ₃	2-metil-piridin-5-ilo
C.I-67	I.A ³ .0	CH ₃	3-metil-piridin-2-ilo
C.I-68	I.A ³ .0	CH ₃	2-cloro-piridin-3-ilo
C.I-69	I.A ³ .0	CH ₃	2-cloro-piridin-4-ilo
C.I-70	I.A ³ .0	CH ₃	2-cloro-piridin-5-ilo
C.I-71	I.A ³ .0	CH ₃	2-cloro-piridin-6-ilo
C.I-72	I.A ³ .0	CH ₃	2-cloro-piridin-6-ilo
C.I-73	I.A ³ .0	CH ₃	4-trifluorometil-piridin-3-ilo
C.I-74	I.A ³ .0	CH ₃	3-metiltio-piridin-3-ilo
C.I-75	I.A ³ .0	CH ₃	2,3-dicloro-piridin-5-ilo

Nº	Fórmula	R ⁵ , resp. R ⁹	R ⁶ , resp. R ¹⁰
C.I-76	I.A ³ .0	CH ₃	2,5-dicloro-piridin-3-ilo
C.I-77	I.A ³ .0	CH ₃	2,6-dicloro-piridin-3-ilo
C.I-78	I.A ³ .0	CH ₃	3,5-dicloro-piridin-4-ilo
C.I-79	I.A ³ .0	CH ₃	N-metil-pirrol-2-ilo
C.I-80	I.A ³ .0	CH ₃	pirazin-2-ilo
C.I-81	I.A ³ .0	CH ₃	4-trifluorometil-pirimidin-5-ilo
C.I-82	I.A ³ .0	CH ₃	furan-2-ilo
C.I-83	I.A ³ .0	CH ₃	furan-3-ilo
C.I-84	I.A ³ .0	CH ₃	2-tetrahidrofuranilo
C.I-85	I.A ³ .0	CH ₃	3-tetrahidrofuranilo
C.I-86	I.A ³ .0	CH ₃	tiofen-2-ilo
C.I-87	I.A ³ .0	CH ₃	tiofen-3-ilo
C.I-88	I.A ³ .0	CH ₃	1-metil-3-trifluoro-metil-1H-pirazol-4-ilo
C.I-89	I.A ³ .0	CH ₃	1-metil-5-trifluoro-metil-1H-pirazol-4-ilo
C.I-90	I.A ³ . 0	CH ₃	isoxazol-5-ilo
C.I-91	I.A ³ .0	CH ₃	2,4-dimetil-tiazol-5-ilo
C.I-92	I.A ³ .0	CH ₃	4-trifluorometil-tiazol-5-ilo
C.I-93	I.A ³ .0	CH ₃	3-metil-isotiazol-5-ilo
C.I-94	I.A ³ .0	CH ₃	3,4-dicloro-isotiazol-5-ilo
C.I-95	I.A ³ . 0	CH ₃ CH ₂	Н
C.I-96	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	F ₃ C
C.I-97	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	Cl ₃ C
C.I-98	I.A ³ .0	CH₃CH₂	Cl ₂ CH
C.I-99	I.A ³ .0	CH₃CH₂	CICH ₂
C.I-100	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	CH ₃
C.I-101	I.A ³ .0	CH₃CH₂	CH₃CH₂

Nº	Fórmula	R ⁵ , resp. R ⁹	R ⁶ , resp. R ¹⁰
C.I-102	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	(CH ₃)₂CH
C.I-103	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	(CH ₃) ₃ C
C.I-104	I.A ³ .0	CH₃CH₂	CH₃CH₂CH₂
C.I-105	I.A ³ .0	CH₃CH₂	CH ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂
C.I-106	I.A ³ .0	CH₃CH₂	(CH ₃) ₃ CCH ₂
C.I-107	I.A ³ .0	CH₃CH₂	CH₃O
C.I-108	I.A ³ .0	CH₃CH₂	CH₃CH₂O
C.I-109	I.A ³ .0	CH₃CH₂	F₃CCH₂O
C.I-110	I.A ³ .0	CH₃CH₂	CH₃NH
C.I-111	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	CH₃CH₂NH
C.I-112	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	(CH ₃) ₂ N
C.I-113	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	(CH ₃ CH ₂) ₂ N
C.I-114	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	(CH ₃ CH ₂)CH ₃ N
C.I-115	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	C ₆ H ₅ NH
C.I-116	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	(C ₆ H ₅)CH ₃ N
C.I-117	I.A ³ .0	CH₃CH₂	(2,6-F ₂ C ₆ H ₃) NH
C.I-118	I.A ³ .0	CH₃CH₂	(2,6-F ₂ C ₆ H ₃)CH ₃ N
C.I-119	I.A ³ .0	CH₃CH₂	ciclopropilo
C.I-120	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	ciclobutilo
C.I-121	I.A ³ .0	CH₃CH₂	ciclopentilo
C.I-122	I.A ³ .0	CH₃CH₂	ciclohexilo
C.I-123	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	CNCH ₂
C.I-124	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	CH₃OCH₂
C.I-125	I.A ³ .0	CH₃CH₂	CH ₃ CH ₂ OCH ₂
C.I-126	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	CH ₃ OCH ₂ CH ₂
C.I-127	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	F₃C CH₂

Nº	Fórmula	R ⁵ , resp. R ⁹	R ⁶ , resp. R ¹⁰
C.I-128	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	CH₃OCOCH₂
C.I-129	I.A ³ .0	CH₃CH₂	CH₃SCH₂
C.I-130	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	CH ₃ CH ₂ SCH ₂
C.I-131	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	CH ₃ SCH ₂ CH ₂
C.I-132	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	C ₆ H₅CH₂
C.I-133	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
C.I-134	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	CH ₂ =CH
C.I-135	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	CH₃CH=CH
C.I-136	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	C ₆ H ₅
C.I-137	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	2-F-C ₆ H ₄
C.I-138	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	3-F-C ₆ H ₄
C.I-139	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	4-F-C ₆ H ₄
C.I-140	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	2-CI-C ₆ H ₄
C.I-141	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	3-CI-C ₆ H₄
C.I-142	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	4-CI-C ₆ H ₄
C.I-143	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	2-CH ₃ -C ₆ H ₄
C.I-144	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	3-CH ₃ -C ₆ H ₄
C.I-145	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	4-CH ₃ -C ₆ H ₄
C.I-146	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	2-CH ₃ O-C ₆ H ₄
C.I-147	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	3-CH ₃ O-C ₆ H ₄
C.I-148	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	4-CH ₃ O-C ₆ H ₄
C.I-149	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	2-F ₃ C-C ₆ H ₄
C.I-150	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	3-F ₃ C-C ₆ H ₄
C.I-151	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	4-F ₃ C-C ₆ H ₄
C.I-152	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	2-Br-C ₆ H ₄
C.I-153	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	3-Br-C ₆ H₄

Nº	Fórmula	R ⁵ , resp. R ⁹	R ⁶ , resp. R ¹⁰
C.I-154	I.A ³ .0	CH₃CH₂	4-Br-C ₆ H₄
C.I-155	I.A ³ .0	CH₃CH₂	3-CN-C ₆ H ₄
C.I-156	I.A ³ .0	CH₃CH₂	4-CN-C ₆ H ₄
C.I-157	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	piridin-2-ilo
C.I-158	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	piridin-3-ilo
C.I-159	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	piridin-4-ilo
C.I-160	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	2-metil-piridin-5-ilo
C.I-161	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	3-metil-piridin-2-ilo
C.I-162	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	2-cloro-piridin-3-ilo
C.I-163	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	2-cloro-piridin-4-ilo
C.I-164	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	2-cloro-piridin-5-ilo
C.I-165	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	2-cloro-piridin-6-ilo
C.I-166	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	2-cloro-piridin-6-ilo
C.I-167	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	4-trifluorometil-piridin-3-ilo
C.I-168	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	3-metiltio-piridin-3-ilo
C.I-169	I.A ³ .0	CH₃CH₂	2,3-dicloro-piridin-5-ilo
C.I-170	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	2,5-dicloro-piridin-3-ilo
C.I-171	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	2,6-dicloro-piridin-3-ilo
C.I-172	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	3,5-dicloro-piridin-4-ilo
C.I-173	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	N-metipirrol-2-ilo
C.I-174	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	pirazin-2-ilo
C.I-175	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	4-trifluorometil-pirimidin-5-ilo
C.I-176	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	furan-2-ilo
C.I-177	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	furan-3-ilo
C.I-178	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	2-tetrahidrofuranilo
C.I-179	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂	3-tetrahidrofuranilo

Nº	Fórmula	R ⁵ , resp. R ⁹	R ⁶ , resp. R ¹⁰
C.I-180	I.A ³ .0	CH₃CH₂	tiofen-2-ilo
C.I-181	I.A ³ .0	CH₃CH₂	tiofen-3-ilo
C.I-182	I.A ³ .0	CH₃CH₂	1-metil-3-trifluoro-metil-1H-pirazol-4-ilo
C.I-183	I.A ³ .0	CH₃CH₂	1-metil-5-trifluoro-metil-1H-pirazol-4-ilo
C.I-184	I.A ³ .0	CH₃CH₂	isoxazol-5-ilo
C.I-185	I.A ³ .0	CH₃CH₂	2,4-dimetil-tiazol-5-ilo
C.I-186	I.A ³ .0	CH₃CH₂	4-trifluorometil-tiazol-5-ilo
C.I-187	I.A ³ .0	CH₃CH₂	3-metil-isotiazol-5-ilo
C.I-188	I.A ³ .0	CH₃CH₂	3,4-dicloro-isotiazol-5-ilo
C.I-189	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	Н
C.I-190	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	F₃C
C.I-191	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	Cl ₃ C
C.I-192	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	Cl₂CH
C.I-193	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	CICH ₂
C.I-194	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	CH ₃
C.I-195	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	CH ₃ CH ₂
C.I-196	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	(CH ₃) ₂ CH
C.I-197	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	(CH₃)₃C
C.I-198	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	CH ₃ CH ₂ CH ₂
C.I-199	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	CH ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂
C.I-200	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	(CH ₃) ₃ CCH ₂
C.I-201	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	CH ₃ O
C.I-202	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	CH₃CH₂O
C.I-203	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	F₃CCH₂O
C.I-204	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	CH₃NH
C.I-205	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	CH₃CH₂NH

Nº	Fórmula	R ⁵ , resp. R ⁹	R ⁶ , resp. R ¹⁰
C.I-206	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	(CH ₃) ₂ N
C.I-207	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	(CH ₃ CH ₂) ₂ N
C.I-208	I.A ³ . 0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	(CH ₃ CH ₂)CH ₃ N
C.I-209	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	C ₆ H ₅ NH
C.I-210	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	(C ₆ H ₅)CH ₃ N
C.I-211	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	(2,6-F ₂ C ₆ H ₃) NH
C.I-212	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	(2,6-F ₂ C ₆ H ₃)CH ₃ N
C.I-213	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	ciclopropilo
C.I-214	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	ciclobutilo
C.I-215	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	ciclopentilo
C.I-216	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	ciclohexilo
C.I-217	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	CNCH ₂
C.I-218	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	CH₃OCH₂
C.I-219	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	CH ₃ CH ₂ OCH ₂
C.I-220	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	CH ₃ OCH ₂ CH ₂
C.I-221	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	F ₃ C CH ₂
C.I-222	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	CH ₃ OCOCH ₂
C.I-223	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	CH₃SCH₂
C.I-224	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	CH ₃ CH ₂ SCH ₂
C.I-225	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	CH ₃ SCH ₂ CH ₂
C.I-226	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	C ₆ H ₅ CH ₂
C.I-227	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
C.I-228	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	CH ₂ =CH
C.I-229	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	CH₃CH=CH
C.I-230	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	C ₆ H ₅
C.I-231	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	2-F-C ₆ H ₄

Nº	Fórmula	R ⁵ , resp. R ⁹	R ⁶ , resp. R ¹⁰
C.I-232	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	3-F-C ₆ H ₄
C.I-233	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	4-F-C ₆ H ₄
C.I-234	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	2-CI-C ₆ H ₄
C.I-235	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	3-CI-C ₆ H ₄
C.I-236	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	4-CI-C ₆ H ₄
C.I-237	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	2-CH ₃ -C ₆ H ₄
C.I-238	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	3-CH ₃ -C ₆ H ₄
C.I-239	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	4-CH ₃ -C ₆ H ₄
C.I-240	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	2-CH ₃ O-C ₆ H ₄
C.I-241	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	3-CH ₃ O-C ₆ H ₄
C.I-242	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	4-CH ₃ O-C ₆ H ₄
C.I-243	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	2-F ₃ C-C ₆ H ₄
C.I-244	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	3-F ₃ C-C ₆ H ₄
C.I-245	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	4-F ₃ C-C ₆ H ₄
C.I-246	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	2-Br-C ₆ H ₄
C.I-247	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	3-Br-C ₆ H ₄
C.I-248	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	4-Br-C ₆ H ₄
C.I-249	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	3-CN-C ₆ H ₄
C.I-250	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	4-CN-C ₆ H ₄
C.I-251	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	piridin-2-ilo
C.I-252	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	piridin-3-ilo
C.I-253	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	piridin-4-ilo
C.I-254	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	2-metil-piridin-5-ilo
C.I-255	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	3-metil-piridin-2-ilo
C.I-256	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	2-cloro-piridin-3-ilo
C.I-257	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	2-cloro-piridin-4-ilo

Nº	Fórmula	R ⁵ , resp. R ⁹	R ⁶ , resp. R ¹⁰
C.I-258	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	2-cloro-piridin-5-ilo
C.I-259	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	2-cloro-piridin-6-ilo
C.I-260	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	2-cloro-piridin-6-ilo
C.I-261	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	4-trifluorometil-piridin-3-ilo
C.I-262	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	3-metiltio-piridin-3-ilo
C.I-263	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	2,3-dicloro-piridin-5-ilo
C.I-264	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	2,5-dicloro-piridin-3-ilo
C.I-265	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	2,6-dicloro-piridin-3-ilo
C.I-266	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	3,5-dicloro-piridin-4-ilo
C.I-267	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	N-meti-pirrol-2-ilo
C.I-268	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	pirazin-2-ilo
C.I-269	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	4-trifluorometil-pirimidin-5-ilo
C.I-270	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	furan-2-ilo
C.I-271	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	furan-3-ilo
C.I-272	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	2-tetrahidrofuranilo
C.I-273	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	3-tetrahidrofuranilo
C.I-274	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	tiofen-2-ilo
C.I-275	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	tiofen-3-ilo
C.I-276	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	1-metil-3-trifluoro-metil-1H-pirazol-4-ilo
C.I-277	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	1-metil-5-trifluoro-metil-1H-pirazol-4-ilo
C.I-278	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	isoxazol-5-ilo
C.I-279	I.A ³ . 0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	2,4-dimetil-tiazol-5-ilo
C.I-280	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	4-trifluorometil-tiazol-5-ilo
C.I-281	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	3-metil-isotiazol-5-ilo

Nº	Fórmula	R ⁵ , resp. R ⁹	R ⁶ , resp. R ¹⁰
C.I-282	I.A ³ .0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	3,4-dicloro-isotiazol-5-ilo
C.I-283	R^{3} R^{4} R^{10} R^{10} R^{10} R^{10}	CH₃	Н
C.I-284	I.A ³ .1	CH ₃	F₃C
C.I-285	I.A ³ .1	CH ₃	Cl ₃ C
C.I-286	I.A ³ .1	CH₃	Cl ₂ CH
C.I-287	I.A ³ .1	CH ₃	CICH₂
C.I-288	I.A ³ .1	CH₃	CH₃
C.I-289	I.A ³ .1	CH ₃	CH ₃ CH ₂
C.I-290	I.A ³ .1	CH₃	(CH ₃)₂CH
C.I-291	I.A ³ .1	CH₃	(CH₃)₃C
C.I-292	I.A ³ .1	CH ₃	CH ₃ CH ₂ CH ₂
C.I-293	I.A ³ .1	CH₃	CH ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂
C.I-294	I.A ³ .1	CH₃	(CH ₃) ₃ CCH ₂
C.I-295	I.A ³ .1	CH₃	CH₃O
C.I-296	I.A ³ .1	CH₃	CH₃CH₂O
C.I-297	I.A ³ .1	CH₃	F₃CCH₂O
C.I-298	I.A ³ .1	CH₃	CH₃NH
C.I-299	I.A ³ .1	CH₃	CH₃CH₂NH
C.I-300	I.A ³ .1	CH₃	(CH₃) ₂ N
C.I-301	I.A ³ .1	CH₃	(CH₃CH₂)₂N
C.I-302	I.A ³ .1	CH₃	(CH₃CH₂)CH₃N
C.I-303	I.A ³ .1	CH₃	C ₆ H ₅ NH
C.I-304	I.A ³ .1	CH ₃	(C ₆ H ₅)CH ₃ N

Nº	Fórmula	R ⁵ , resp. R ⁹	R ⁶ , resp. R ¹⁰
C.I-305	I.A ³ .1	CH ₃	(2,6-F ₂ C ₆ H ₃) NH
C.I-306	I.A ³ .1	CH ₃	(2,6-F ₂ C ₆ H ₃)CH ₃ N
C.I-307	I.A ³ .1	CH ₃	ciclopropilo
C.I-308	I.A ³ .1	CH ₃	ciclobutilo
C.I-309	I.A ³ .1	CH ₃	ciclopentilo
C.I-310	I.A ³ .1	CH ₃	ciclohexilo
C.I-311	I.A ³ .1	CH ₃	CNCH₂
C.I-312	I.A ³ .1	CH ₃	CH ₃ OCH ₂
C.I-313	I.A ³ .1	CH ₃	CH ₃ CH ₂ OCH ₂
C.I-314	I.A ³ .1	CH ₃	CH ₃ OCH ₂ CH ₂
C.I-315	I.A ³ .1	CH ₃	F ₃ C CH ₂
C.I-316	I.A ³ .1	CH ₃	CH ₃ OCOCH ₂
C.I-317	I.A ³ .1	CH ₃	CH₃SCH₂
C.I-318	I.A ³ .1	CH ₃	CH ₃ CH ₂ SCH ₂
C.I-319	I.A ³ .1	CH ₃	CH ₃ SCH ₂ CH ₂
C.I-320	I.A ³ .1	CH ₃	C ₆ H ₅ CH ₂
C.I-321	I.A ³ .1	CH ₃	CH ₂ =CHCH ₂
C.I-322	I.A ³ .1	CH ₃	CH ₂ =CH
C.I-323	I.A ³ .1	CH ₃	CH₃CH=CH
C.I-324	I.A ³ .1	CH ₃	C ₆ H ₅
C.I-325	I.A ³ .1	CH ₃	2-F-C ₆ H ₄
C.I-326	I.A ³ .1	CH ₃	3-F-C ₆ H ₄
C.I-327	I.A ³ .1	CH ₃	4-F-C ₆ H ₄
C.I-328	I.A ³ .1	CH ₃	2-CI-C ₆ H ₄
C.I-329	I.A ³ .1	CH ₃	3-CI-C ₆ H₄
C.I-330	I.A ³ .1	CH₃	4-CI-C ₆ H ₄

Nº	Fórmula	R ⁵ , resp. R ⁹	R ⁶ , resp. R ¹⁰
C.I-331	I.A ³ .1	CH ₃	2-CH ₃ -C ₆ H ₄
C.I-332	I.A ³ .1	CH₃	3-CH ₃ -C ₆ H ₄
C.I-333	I.A ³ .1	CH ₃	4-CH ₃ -C ₆ H ₄
C.I-334	I.A ³ .1	CH ₃	2-CH ₃ O-C ₆ H ₄
C.I-335	I.A ³ .1	CH ₃	3-CH ₃ O-C ₆ H ₄
C.I-336	I.A ³ .1	CH ₃	4-CH ₃ O-C ₆ H ₄
C.I-337	I.A ³ .1	CH₃	2-F ₃ C-C ₆ H ₄
C.I-338	I.A ³ .1	CH ₃	3-F ₃ C-C ₆ H ₄
C.I-339	I.A ³ .1	CH ₃	4-F ₃ C-C ₆ H ₄
C.I-340	I.A ³ .1	CH ₃	2-Br-C ₆ H ₄
C.I-341	I.A ³ .1	CH ₃	3-Br-C ₆ H₄
C.I-342	I.A ³ .1	CH ₃	4-Br-C ₆ H ₄
C.I-343	I.A ³ .1	CH ₃	3-CN-C ₆ H ₄
C.I-344	I.A ³ .1	CH ₃	4-CN-C ₆ H ₄
C.I-345	I.A ³ .1	CH ₃	piridin-2-ilo
C.I-346	I.A ³ .1	CH ₃	piridin-3-ilo
C.I-347	I.A ³ .1	CH ₃	piridin-4-ilo
C.I-348	I.A ³ .1	CH ₃	2-metil-piridin-5-ilo
C.I-349	I.A ³ .1	CH ₃	3-metil-piridin-2-ilo
C.I-350	I.A ³ .1	CH ₃	2-cloro-piridin-3-ilo
C.I-351	I.A ³ .1	CH ₃	2-cloro-piridin-4-ilo
C.I-352	I.A ³ .1	CH ₃	2-cloro-piridin-5-ilo
C.I-353	I.A ³ .1	CH ₃	2-cloro-piridin-6-ilo
C.I-354	I.A ³ .1	CH ₃	2-cloro-piridin-6-ilo
C.I-355	I.A ³ .1	CH ₃	4-trifluorometil-piridin-3-ilo
C.I-356	I.A ³ .1	CH ₃	3-metiltio-piridin-3-ilo

Nº	Fórmula	R ⁵ , resp. R ⁹	R ⁶ , resp. R ¹⁰
C.I-357	I.A ³ .1	CH₃	2,3-dicloro-piridin-5-ilo
C.I-358	I.A ³ .1	CH ₃	2,5-dicloro-piridin-3-ilo
C.I-359	I.A ³ .1	CH ₃	2,6-dicloro-piridin-3-ilo
C.I-360	I.A ³ .1	CH ₃	3,5-dicloro-piridin-4-ilo
C.I-361	I.A ³ .1	CH ₃	N-metil-pirrol-2-ilo
C.I-362	I.A ³ .1	CH ₃	pirazin-2-ilo
C.I-363	I.A ³ .1	CH ₃	4-trifluorometil-pirimidin-5-ilo
C.I-364	I.A ³ .1	CH ₃	furan-2-ilo
C.I-365	I.A ³ .1	CH ₃	furan-3-ilo
C.I-366	I.A ³ .1	CH ₃	2-tetrahidrofuranilo
C.I-367	I.A ³ .1	CH ₃	3-tetrahidrofuranilo
C.I-368	I.A ³ .1	CH ₃	tiofen-2-ilo
C.I-369	I.A ³ .1	CH ₃	tiofen-3-ilo
C.I-370	I.A ³ .1	CH ₃	1-metil-3-trifluoro-metil-1H-pirazol-4-ilo
C.I-371	I.A ³ .1	CH ₃	1-metil-5-trifluoro-metil-1H-pirazol-4-ilo
C.I-372	I.A ³ .1	CH ₃	isoxazol-5-ilo
C.I-373	I.A ³ .1	CH ₃	2,4-dimetil-tiazol-5-ilo
C.I-374	I.A ³ .1	CH ₃	4-trifluorometil-tiazol-5-ilo
C.I-375	I.A ³ .1	CH ₃	3-metil-isotiazol-5-ilo
C.I-376	I.A ³ .1	CH₃	3,4-dicloro-isotiazol-5-ilo
C.I-377	I.A ³ .1	CH₃CH₂	Н
C.I-378	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	F₃C
C.I-379	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	Cl ₃ C
C.I-380	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	Cl ₂ CH
C.I-381	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	CICH₂
C.I-382	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	CH ₃

Nº	Fórmula	R ⁵ , resp. R ⁹	R ⁶ , resp. R ¹⁰
C.I-383	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	CH ₃ CH ₂
C.I-384	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	(CH ₃) ₂ CH
C.I-385	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	(CH₃)₃C
C.I-386	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	CH ₃ CH ₂ CH ₂
C.I-387	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	CH ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂
C.I-388	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	(CH ₃) ₃ CCH ₂
C.I-389	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	CH₃O
C.I-390	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	CH₃CH₂O
C.I-391	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	F ₃ CCH ₂ O
C.I-392	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	CH₃NH
C.I-393	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	CH₃CH₂NH
C.I-394	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	(CH₃)₂N
C.I-395	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	(CH ₃ CH ₂) ₂ N
C.I-396	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	(CH ₃ CH ₂)CH ₃ N
C.I-397	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	C ₆ H ₅ NH
C.I-398	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	(C ₆ H ₅)CH ₃ N
C.I-399	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	(2,6-F ₂ C ₆ H ₃) NH
C.I-400	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	(2,6-F ₂ C ₆ H ₃)CH ₃ N
C.I-401	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	ciclopropilo
C.I-402	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	ciclobutilo
C.I-403	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	ciclopentilo
C.I-404	I.A ³ .1	CH₃CH₂	ciclohexilo
C.I-405	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	CNCH₂
C.I-406	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	CH₃OCH₂
C.I-407	I.A ³ .1	CH₃CH₂	CH₃CH₂OCH₂
C.I-408	I.A ³ .1	CH₃CH₂	CH₃OCH₂CH₂

Nº	Fórmula	R ⁵ , resp. R ⁹	R⁵, resp. R¹⁰
C.I-409	I.A ³ .1	CH₃CH₂	F ₃ C CH ₂
C.I-410	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	CH₃OCOCH₂
C.I-411	I.A ³ .1	CH₃CH₂	CH₃SCH₂
C.I-412	I.A ³ .1	CH₃CH₂	CH₃CH₂SCH₂
C.I-413	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	CH ₃ SCH ₂ CH ₂
C.I-414	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	C ₆ H ₅ CH ₂
C.I-415	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
C.I-416	I.A ³ .1	CH₃CH₂	CH ₂ =CH
C.I-417	I.A ³ .1	CH₃CH₂	CH₃CH=CH
C.I-418	I.A ³ .1	CH₃CH₂	C ₆ H ₅
C.I-419	I.A ³ .1	CH₃CH₂	2-F-C ₆ H ₄
C.I-420	I.A ³ .1	CH₃CH₂	3-F-C ₆ H ₄
C.I-421	I.A ³ .1	CH₃CH₂	4-F-C ₆ H ₄
C.I-422	I.A ³ .1	CH₃CH₂	2-CI-C ₆ H ₄
C.I-423	I.A ³ .1	CH₃CH₂	3-CI-C ₆ H ₄
C.I-424	I.A ³ .1	CH₃CH₂	4-CI-C ₆ H ₄
C.I-425	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	2-CH ₃ -C ₆ H ₄
C.I-426	I.A ³ .1	CH₃CH₂	3-CH ₃ -C ₆ H ₄
C.I-427	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	4-CH ₃ -C ₆ H ₄
C.I-428	I.A ³ .1	CH₃CH₂	2-CH ₃ O-C ₆ H ₄
C.I-429	I.A ³ .1	CH₃CH₂	3-CH ₃ O-C ₆ H ₄
C.I-430	I.A ³ .1	CH₃CH₂	4-CH ₃ O-C ₆ H ₄
C.I-431	I.A ³ .1	CH₃CH₂	2-F₃C-C ₆ H₄
C.I-432	I.A ³ .1	CH₃CH₂	3-F ₃ C-C ₆ H ₄
C.I-433	I.A ³ .1	CH₃CH₂	4-F₃C-C ₆ H₄
C.I-434	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	2-Br-C ₆ H ₄

Nº	Fórmula	R ⁵ , resp. R ⁹	R ⁶ , resp. R ¹⁰
C.I-435	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	3-Br-C ₆ H ₄
C.I-436	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	4-Br-C ₆ H ₄
C.I-437	I.A ³ .1	CH₃CH₂	3-CN-C ₆ H₄
C.I-438	I.A ³ .1	CH₃CH₂	4-CN-C ₆ H ₄
C.I-439	I.A ³ .1	CH₃CH₂	piridin-2-ilo
C.I-440	I.A ³ .1	CH₃CH₂	piridin-3-ilo
C.I-441	I.A ³ .1	CH₃CH₂	piridin-4-ilo
C.I-442	I.A ³ .1	CH₃CH₂	2-metil-piridin-5-ilo
C.I-443	I.A ³ .1	CH₃CH₂	3-metil-piridin-2-ilo
C.I-444	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	2-cloro-piridin-3-ilo
C.I-445	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	2-cloro-piridin-4-ilo
C.I-446	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	2-cloro-piridin-5-ilo
C.I-447	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	2-cloro-piridin-6-ilo
C.I-448	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	2-cloro-piridin-6-ilo
C.I-449	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	4-trifluorometil-piridin-3-ilo
C.I-450	I.A ³ .1	CH₃CH₂	3-metiltio-piridin-3-ilo
C.I-451	I.A ³ .1	CH₃CH₂	2,3-dicloro-piridin-5-ilo
C.I-452	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	2,5-dicloro-piridin-3-ilo
C.I-453	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	2,6-dicloro-piridin-3-ilo
C.I-454	I.A ³ .1	CH₃CH₂	3,5-dicloro-piridin-4-ilo
C.I-455	I.A ³ .1	CH₃CH₂	N-metipirrol-2-ilo
C.I-456	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	pirazin-2-ilo
C.I-457	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	4-trifluorometil-pirimidin-5-ilo
C.I-458	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	furan-2-ilo
C.I-459	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	furan-3-ilo
C.I-460	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	2-tetrahidrofuranilo

Nº	Fórmula	R ⁵ , resp. R ⁹	R ⁶ , resp. R ¹⁰
C.I-461	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	3-tetrahidrofuranilo
C.I-462	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	tiofen-2-ilo
C.I-463	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	tiofen-3-ilo
C.I-464	I.A ³ .1	CH₃CH₂	1-metil-3-trifluoro-metil-1H-pirazol-4-ilo
C.I-465	I.A ³ .1	CH₃CH₂	1-metil-5-trifluoro-metil-1H-pirazol-4-ilo
C.I-466	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	isoxazol-5-ilo
C.I-467	I.A ³ .1	CH₃CH₂	2,4-dimetil-tiazol-5-ilo
C.I-468	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	4-trifluorometil-tiazol-5-ilo
C.I-469	I.A ³ .1	CH ₃ CH ₂	3-metil-isotiazol-5-ilo
C.I-470	I.A ³ .1	CH₃CH₂	3,4-dicloro-isotiazol-5-ilo
C.I-471	R^{2} R^{3} R^{4} R^{9} R^{10} R^{10} R^{10} R^{3} R^{4} R^{10} R^{10}	СН₃	н
C.I-472	I.A ³ .2	CH₃	F₃C
C.I-473	I.A ³ .2	CH₃	Cl ₃ C
C.I-474	I.A ³ .2	CH₃	Cl₂CH
C.I-475	I.A ³ .2	CH₃	CICH ₂
C.I-476	I.A ³ .2	CH₃	CH ₃
C.I-477	I.A ³ .2	CH₃	CH ₃ CH ₂
C.I-478	I.A ³ .2	CH ₃	(CH ₃) ₂ CH
C.I-479	I.A ³ .2	CH ₃	(CH ₃) ₃ C
C.I-480	I.A ³ .2	CH₃	CH ₃ CH ₂ CH ₂
C.I-481	I.A ³ .2	CH₃	CH ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂
C.I-482	I.A ³ .2	CH ₃	(CH ₃) ₃ CCH ₂

Nº	Fórmula	R ⁵ , resp. R ⁹	R ⁶ , resp. R ¹⁰
C.I-483	I.A ³ .2	CH ₃	CH₃O
C.I-484	I.A ³ .2	CH ₃	CH₃CH₂O
C.I-485	I.A ³ .2	CH ₃	F ₃ CCH ₂ O
C.I-486	I.A ³ .2	CH ₃	CH₃NH
C.I-487	I.A ³ .2	CH ₃	CH₃CH₂NH
C.I-488	I.A ³ .2	CH ₃	(CH₃)₂N
C.I-489	I.A ³ .2	CH ₃	(CH ₃ CH ₂) ₂ N
C.I-490	I.A ³ .2	CH ₃	(CH ₃ CH ₂)CH ₃ N
C.I-491	I.A ³ .2	CH ₃	C ₆ H₅NH
C.I-492	I.A ³ .2	CH ₃	(C ₆ H ₅)CH ₃ N
C.I-493	I.A ³ .2	CH ₃	(2,6-F ₂ C ₆ H ₃) NH
C.I-494	I.A ³ .2	CH ₃	(2,6-F ₂ C ₆ H ₃)CH ₃ N
C.I-495	I.A ³ . 2	CH ₃	ciclopropilo
C.I-496	I.A ³ .2	CH ₃	ciclobutilo
C.I-497	I.A ³ .2	CH ₃	ciclopentilo
C.I-498	I.A ³ .2	CH ₃	ciclohexilo
C.I-499	I.A ³ .2	CH ₃	CNCH₂
C.I-500	I.A ³ .2	CH ₃	CH₃OCH₂
C.I-501	I.A ³ .2	CH ₃	CH ₃ CH ₂ OCH ₂
C.I-502	I.A ³ .2	CH ₃	CH ₃ OCH ₂ CH ₂
C.I-503	I.A ³ .2	CH ₃	F ₃ C CH ₂
C.I-504	I.A ³ .2	CH ₃	CH₃OCOCH₂
C.I-505	I.A ³ .2	CH ₃	CH₃SCH₂
C.I-506	I.A ³ .2	CH ₃	CH₃CH₂SCH₂
C.I-507	I.A ³ .2	CH ₃	CH₃SCH₂CH₂
C.I-508	I.A ³ .2	CH₃	C ₆ H₅CH ₂

Nº	Fórmula	R ⁵ , resp. R ⁹	R ⁶ , resp. R ¹⁰
C.I-509	I.A ³ .2	CH₃	CH ₂ =CHCH ₂
C.I-510	I.A ³ .2	CH ₃	CH ₂ =CH
C.I-511	I.A ³ .2	CH₃	CH₃CH=CH
C.I-512	I.A ³ .2	CH₃	C ₆ H ₅
C.I-513	I.A ³ .2	CH₃	2-F-C ₆ H ₄
C.I-514	I.A ³ .2	CH₃	3-F-C ₆ H ₄
C.I-515	I.A ³ .2	CH₃	4-F-C ₆ H ₄
C.I-516	I.A ³ .2	CH₃	2-CI-C ₆ H ₄
C.I-517	I.A ³ .2	CH₃	3-CI-C ₆ H ₄
C.I-518	I.A ³ .2	CH₃	4-CI-C ₆ H ₄
C.I-519	I.A ³ .2	CH₃	2-CH ₃ -C ₆ H ₄
C.I-520	I.A ³ .2	CH₃	3-CH ₃ -C ₆ H ₄
C.I-521	I.A ³ .2	CH₃	4-CH ₃ -C ₆ H ₄
C.I-522	I.A ³ .2	CH₃	2-CH ₃ O-C ₆ H ₄
C.I-523	I.A ³ .2	CH₃	3-CH ₃ O-C ₆ H ₄
C.I-524	I.A ³ .2	CH₃	4-CH ₃ O-C ₆ H ₄
C.I-525	I.A ³ .2	CH₃	2-F ₃ C-C ₆ H ₄
C.I-526	I.A ³ .2	CH₃	3-F ₃ C-C ₆ H ₄
C.I-527	I.A ³ .2	CH₃	4-F ₃ C-C ₆ H ₄
C.I-528	I.A ³ .2	CH₃	2-Br-C ₆ H ₄
C.I-529	I.A ³ .2	CH₃	3-Br-C ₆ H₄
C.I-530	I.A ³ .2	CH₃	4-Br-C ₆ H ₄
C.I-531	I.A ³ .2	CH₃	3-CN-C ₆ H ₄
C.I-532	I.A ³ .2	CH₃	4-CN-C ₆ H ₄
C.I-533	I.A ³ .2	CH₃	piridin-2-ilo
C.I-534	I.A ³ .2	CH ₃	piridin-3-ilo

Nº	Fórmula	R ⁵ , resp. R ⁹	R ⁶ , resp. R ¹⁰
C.I-535	I.A ³ .2	CH₃	piridin-4-ilo
C.I-536	I.A ³ .2	CH₃	2-metil-piridin-5-ilo
C.I-537	I.A ³ .2	CH₃	3-metil-piridin-2-ilo
C.I-538	I.A ³ .2	CH ₃	2-cloro-piridin-3-ilo
C.I-539	I.A ³ .2	CH ₃	2-cloro-piridin-4-ilo
C.I-540	I.A ³ .2	CH₃	2-cloro-piridin-5-ilo
C.I-541	I.A ³ .2	CH₃	2-cloro-piridin-6-ilo
C.I-542	I.A ³ .2	CH ₃	2-cloro-piridin-6-ilo
C.I-543	I.A ³ .2	CH ₃	4-trifluorometil-piridin-3-ilo
C.I-544	I.A ³ .2	CH ₃	3-metiltio-piridin-3-ilo
C.I-545	I.A ³ .2	CH ₃	2,3-dicloro-piridin-5-ilo
C.I-546	I.A ³ .2	CH ₃	2,5-dicloro-piridin-3-ilo
C.I-547	I.A ³ .2	CH ₃	2,6-dicloro-piridin-3-ilo
C.I-548	I.A ³ .2	CH ₃	3,5-dicloro-piridin-4-ilo
C.I-549	I.A ³ .2	CH ₃	N-metil-pirrol-2-ilo
C.I-550	I.A ³ .2	CH ₃	pirazin-2-ilo
C.I-551	I.A ³ .2	CH ₃	4-trifluorometil-pirimidin-5-ilo
C.I-552	I.A ³ .2	CH ₃	furan-2-ilo
C.I-553	I.A ³ .2	CH ₃	furan-3-ilo
C.I-554	I.A ³ .2	CH ₃	2-tetrahidrofuranilo
C.I-555	I.A ³ .2	CH ₃	3-tetrahidrofuranilo
C.I-556	I.A ³ .2	CH₃	tiofen-2-ilo
C.I-557	I.A ³ .2	CH ₃	tiofen-3-ilo
C.I-558	I.A ³ .2	CH ₃	1-metil-3-trifluoro-metil-1H-pirazol-4-ilo
C.I-559	I.A ³ .2	CH₃	1-metil-5-trifluoro-metil-1H-pirazol-4-ilo
C.I-560	I.A ³ .2	CH₃	isoxazol-5-ilo

Nº	Fórmula	R ⁵ , resp. R ⁹	R ⁶ , resp. R ¹⁰
C.I-561	I.A ³ .2	CH ₃	2,4-dimetil-tiazol-5-ilo
C.I-562	I.A ³ .2	CH ₃	4-trifluorometil-tiazol-5-ilo
C.I-563	I.A ³ .2	CH ₃	3-metil-isotiazol-5-ilo
C.I-564	I.A ³ .2	CH ₃	3,4-dicloro-isotiazol-5-ilo
C.I-565	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	Н
C.I-566	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	F ₃ C
C.I-567	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	Cl ₃ C
C.I-568	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	Cl₂CH
C.I-569	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	CICH ₂
C.I-570	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	CH ₃
C.I-571	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	CH₃CH₂
C.I-572	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	(CH ₃) ₂ CH
C.I-573	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	(CH ₃) ₃ C
C.I-574	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	CH ₃ CH ₂ CH ₂
C.I-575	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	CH ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂
C.I-576	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	(CH ₃) ₃ CCH ₂
C.I-577	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	CH ₃ O
C.I-578	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	CH₃CH₂O
C.I-579	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	F ₃ CCH ₂ O
C.I-580	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	CH₃NH
C.I-581	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	CH ₃ CH ₂ NH
C.I-582	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	(CH ₃) ₂ N
C.I-583	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	(CH₃CH₂)₂N
C.I-584	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	(CH ₃ CH ₂)CH ₃ N
C.I-585	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	C ₆ H ₅ NH
C.I-586	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	(C ₆ H ₅)CH ₃ N

Nº	Fórmula	R ⁵ , resp. R ⁹	R ⁶ , resp. R ¹⁰
C.I-587	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	(2,6-F ₂ C ₆ H ₃) NH
C.I-588	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	(2,6-F ₂ C ₆ H ₃)CH ₃ N
C.I-589	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	ciclopropilo
C.I-590	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	ciclobutilo
C.I-591	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	ciclopentilo
C.I-592	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	ciclohexilo
C.I-593	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	CNCH₂
C.I-594	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	CH ₃ OCH ₂
C.I-595	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	CH ₃ CH ₂ OCH ₂
C.I-596	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	CH ₃ OCH ₂ CH ₂
C.I-597	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	F ₃ C CH ₂
C.I-598	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	CH₃OCOCH₂
C.I-599	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	CH₃SCH₂
C.I-600	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	CH₃CH₂SCH₂
C.I-601	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	CH₃SCH₂CH₂
C.I-602	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	C ₆ HSCH ₂
C.I-603	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
C.I-604	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	CH ₂ =CH
C.I-605	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	CH₃CH=CH
C.I-606	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	C ₆ H ₅
C.I-607	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	2-F-C ₆ H ₄
C.I-608	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	3-F-C ₆ H ₄
C.I-609	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	4-F-C ₆ H ₄
C.I-610	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	2-CI-C ₆ H ₄
C.I-611	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	3-Cl-C ₆ H₄
C.I-612	I.A ³ .2	CH₃CH₂	4-CI-C ₆ H ₄

Nº	Fórmula	R ⁵ , resp. R ⁹	R ⁶ , resp. R ¹⁰
C.I-613	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	2-CH ₃ -C ₆ H ₄
C.I-614	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	3-CH ₃ -C ₆ H ₄
C.I-615	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	4-CH ₃ -C ₆ H ₄
C.I-616	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	2-CH ₃ O-C ₆ H ₄
C.I-617	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	3-CH ₃ O-C ₆ H ₄
C.I-618	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	4-CH ₃ O-C ₆ H ₄
C.I-619	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	2-F ₃ C-C ₆ H ₄
C.I-620	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	3-F ₃ C-C ₆ H ₄
C.I-621	I.A ³ .2	CH₃CH₂	4-F ₃ C-C ₆ H ₄
C.I-622	I.A ³ .2	CH₃CH₂	2-Br-C ₆ H ₄
C.I-623	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	3-Br-C ₆ H₄
C.I-624	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	4-Br-C ₆ H ₄
C.I-625	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	3-CN-C ₆ H ₄
C.I-626	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	4-CN-C ₆ H ₄
C.I-627	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	piridin-2-ilo
C.I-628	I.A ³ .2	CH₃CH₂	piridin-3-ilo
C.I-629	I.A ³ .2	CH₃CH₂	piridin-4-ilo
C.I-630	I.A ³ .2	CH₃CH₂	2-metil-piridin-5-ilo
C.I-631	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	3-metil-piridin-2-ilo
C.I-632	I.A ³ .2	CH₃CH₂	2-cloro-piridin-3-ilo
C.I-633	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	2-cloro-piridin-4-ilo
C.I-634	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	2-cloro-piridin-5-ilo
C.I-635	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	2-cloro-piridin-6-ilo
C.I-636	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	2-cloro-piridin-6-ilo
C.I-637	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	4-trifluorometil-piridin-3-ilo
C.I-638	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	3-metiltio-piridin-3-ilo

(continuación)

Nº	Fórmula	R ⁵ , resp. R ⁹	R ⁶ , resp. R ¹⁰
C.I-639	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	2,3-dicloro-piridin-5-ilo
C.I-640	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	2,5-dicloro-piridin-3-ilo
C.I-641	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	2,6-dicloro-piridin-3-ilo
C.I-642	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	3,5-dicloro-piridin-4-ilo
C.I-643	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	N-metipirrol-2-ilo
C.I-644	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	pirazin-2-ilo
C.I-645	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	4-trifluorometil-pirimidin-5-ilo
C.I-646	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	furan-2-ilo
C.I-647	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	furan-3-ilo
C.I-648	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	2-tetrahidrofuranilo
C.I-649	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	3-tetrahidrofuranilo
C.I-650	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	tiofen-2-ilo
C.I-651	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	tiofen-3-ilo
C.I-652	I.A ³ .2	CH₃CH₂	1-metil-3-trifluoro-metil-1 H-pirazol-4-ilo
C.I-653	I.A ³ .2	CH₃CH₂	1-metil-5-trifluoro-metil-1H-pirazol-4-ilo
C.I-654	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	isoxazol-5-ilo
C.I-655	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	2,4-dimetil-tiazol-5-ilo
C.I-656	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	4-trifluorometil-tiazol-5-ilo
C.I-657	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	3-metil-isotiazol-5-ilo
C.I-658	I.A ³ .2	CH ₃ CH ₂	3,4-dicloro-isotiazol-5-ilo

Métodos de preparación

Compuestos de la formula I

$$R^2$$
 R^3
 R^4
 $(O)_n$ fórmula l

donde A tiene significado

 A^3 :

$$R^2$$
 R^3
 R^4
 R^9
 R^{10}
 R^{10}
 R^{10}

5 y los otros sustituyentes y variables son como se define anteriormente para la fórmula I, pueden prepararse en general haciendo reaccionar una bencisotiazolona activada de la fórmula II-a:

$$R^2$$
 R^3
 R^4
 R^3
 R^4
 R^4
 R^5
 R^6
 R^6

donde Y es halógeno o S-SO₂R y R es allí un alquilo, haloalquilo o un fenilo sustituido (por ejemplo, Y es mesilato, triflato y para-toluenosulfonato), y donde R^1 , R^2 , R^3 y R^4 son como se definen para la fórmula I.

10 Derivados activados adecuados del derivado de bencisotiazolona de la fórmula II-a que pueden utilizarse son, por ejemplo, los derivados 3-halobencisotiazol como 3-clorobencisotiazol o como se mencionó anteriormente los correspondientes sulfonatos, por ejemplo los triflatos o mesilatos.

Los derivados activados de las bencisotiazolonas de fórmula II-a pueden obtenerse de acuerdo con los siguientes esquemas:

15 P.0 3-Amino-bencisotiazol:

Los 3-Amino-bencisotiazoles (P0-I) pueden prepararse calentando un disulfuro adecuadamente sustituido (P0-II) junto con una amina y un agente oxidante tal como dimetilsulfóxido (DMSO) en un solvente polar tal como isopropanol tal como lo describen S. W. Walinsky et al. in Organic Process Research & Development 1999, 3, 126-130.

$$R^{2}$$

$$R^{3}$$

$$R^{4}$$

$$R^{4}$$

$$R^{2}$$

$$R^{3}$$

$$R^{4}$$

$$R^{2}$$

$$R^{3}$$

$$R^{4}$$

$$R^{4}$$

$$R^{5}$$

$$R^{7}$$

$$R^{9}$$

$$R^{9}$$

$$R^{1}$$

$$R^{1}$$

$$R^{2}$$

$$R^{1}$$

$$R^{2}$$

$$R^{1}$$

$$R^{2}$$

$$R^{3}$$

$$R^{4}$$

$$R^{5}$$

$$R^{6}$$

$$R^{7}$$

$$R^{9}$$

Los 2-ciano-disulfuros (P0-2) pueden prepararse a partir de los tiofenoles correspondientes (P0-3) utilizando agentes oxidantes tales como dimetilsulfóxido (DMSO) tal como lo reportan H. Boerzel et al. in Inorganic Chemistry 2003, 1604-1615.

$$R^2$$
 R^3
 R^4
 SH
 R^4
 R^4

Los 2-ciano-tiofenoles (P0-III) pueden prepararse a partir de bencisotiazoles (P0-IV) por tratamiento con bases fuertes tales como NaOCH₃ tal como lo describe J. Markert et al. in Liebigs Annalen d. Chemie 1980,768-778.

5

Dicho artículo también describe la síntesis de bencisotiazoles sustituidos (P0-IV) a partir de 2-cloro-benzaldehídos (P0-V) a través de reacción con azufre y amoniaco.

Alternativamente, los 2-ciano-disulfuros (P0-II) pueden prepararse a partir de 2-ciano-anilinas (P0-VI) a través de diazotación y reacción subsecuente de la sal de diazonio con Na₂S y azufre tal como lo describen V. M. Negrimovsky et al. in Phosphorus, Sulfur & The Related Elements 1995, 104, 161-167.

Las 2-ciano-anilinas (P0-VI) pueden prepararse a partir de 2-ciano-nitrobencenos (P0-VII) con un agente reductor tal como hierro tal como lo describen D. H. Klaubert in J. Med. Chem.1981, 24, 742-748.

5 Alternativamente las 3-amino-1,2-bencisotiazoles (P0-I) pueden prepararse a partir de 3-clorobenzo[d]isotiazol (P0-VIIIa) tal como lo describe H. Boeshagen et al. in Justus Liebig Annalen der Chemie, 1977, 20.

Los cloro-benzo[d]isotiazoles (P0-VIIIa) pueden obtenerse a partir de bencisotiazolonas (P0-IX) por reacción con un agente clorante tal como PCl₃ (descrito por J.P. Yevich et al. in Journal of Medicinal Chemistry 1986, 29, 359-369) o PCl₃/PCl₅ (S. G. Zlutin et al. Journal of Organic Chemistry 2000, 65, 8439-8443).

Los 3-amino-1,2-bencisotiazoles (P0-1) pueden obtenerse a partir de ácido trifluorometanosulfónico benzo[d]isotiazol-3-il éster (P0-VIIIb) en analogía con la US 5359068 por reacción de dichos compuestos con aminas. Esta última referencia describe el ácido trifluoro-metanosulfónico benzo[d]isotiazol-3-il éster (P0-VIIIb) obtenido a partir de las bencisotiazolonas.

$$R^{2} \longrightarrow R^{1} \longrightarrow R^{2} \longrightarrow R^{2$$

La referencia antes mencionada de S.G. Zlutin et al. también describe la síntesis de dichas bencisotiazolonas (P0-IX) a partir de 2-bencilsulfanil-benzamidas (PO-X) a través del tratamiento con un agente oxidante tal como SO₂Cl₂.

Alternativamente, otro método para preparar bencisotiazolonas (P-XIV) a partir de 2-(alquitio)benzonitrilos (P-XVI) en un procedimiento de un solo paso se describe en EP 1081141.

5 P.1 Aminobencisotiazol-1-mono-óxidos

El aminobencisotiazol (P0-I) puede oxidarse en analogía a un procedimiento descrito en Chemische Berichte, 103, 3166-3181 para producir la especie monooxigenada (P1-I). Agentes oxidantes adecuados son, por ejemplo, HNO₃, H₂O₂/ácido acético o ácido *m*-cloro-perbenzoico.

$$R^{2}$$

$$R^{3}$$

$$R^{4}$$

$$R^{3}$$

$$R^{4}$$

$$R^{5}$$

$$R^{4}$$

$$R^{5}$$

$$R^{4}$$

$$R^{7}$$

$$R^{7}$$

$$R^{7}$$

$$R^{7}$$

$$R^{7}$$

$$R^{7}$$

$$R^{9}$$

$$R^{1}$$

$$R^{1}$$

$$R^{2}$$

$$R^{3}$$

$$R^{4}$$

$$R^{5}$$

$$R^{7}$$

$$R^{9}$$

$$R^{1}$$

$$R^{1}$$

$$R^{1}$$

$$R^{2}$$

$$R^{3}$$

$$R^{4}$$

$$R^{5}$$

$$R^{1}$$

$$R^{2}$$

$$R^{4}$$

$$R^{5}$$

$$R^{5}$$

$$R^{7}$$

$$R^{7}$$

$$R^{9}$$

$$R^{1}$$

$$R^{1}$$

$$R^{2}$$

$$R^{3}$$

$$R^{4}$$

$$R^{5}$$

$$R^{5}$$

$$R^{7}$$

$$R^{9}$$

$$R^{1}$$

$$R^{2}$$

$$R^{3}$$

$$R^{4}$$

$$R^{5}$$

$$R^{5}$$

$$R^{5}$$

$$R^{5}$$

$$R^{7}$$

$$R^{7}$$

$$R^{7}$$

$$R^{7}$$

$$R^{7}$$

$$R^{7}$$

$$R^{7}$$

$$R^{9}$$

$$R^{1}$$

$$R^{2}$$

$$R^{3}$$

$$R^{4}$$

$$R^{5}$$

$$R^{7}$$

$$R^{7}$$

$$R^{9}$$

$$R^{1}$$

$$R^{2}$$

$$R^{3}$$

$$R^{4}$$

$$R^{5}$$

$$R^{7}$$

$$R^{7}$$

$$R^{9}$$

10 P.2 3-Aminobencisotiazol-1,1-dióxidos

Los 3-Aminobencisotiazol-1,1-dióxidos (P2-I) pueden obtenerse a partir de 3-Cloro-benzo[d]isotiazol 1,1-dióxidos adecuadamente sustituidos (P2-II) por reacción con una amina primaria en un solvente polar no prótico tal como tetrahidrofurano o dioxano tal como se describe en el Journal of the Chemical Socitey Perkin Transaction 2, 2001, 1315-1324.

$$R^{2} = R^{1} O R^{9}$$
(P2-II)

El 3-Cloro-benzo[d]isotiazol 1,1-dióxidos (P2-II) puede prepararse por la reacción de una sacarina adecuadamente sustituida (P2-III) con un agente clorante tal como ClCO₂CCl₃, PCl₅/POCl₃ o SOCl₂ tal como lo describe D. Dopp et al. en Síntesis 2001, 8, 1228-1235, by R. Salman in Chem. Eng. Data 1987, 32, 391 o by R. W. Lang in Helvetica Chimica Acta 1989, 72, 1248-1252.

5

Las sacarinas sustituidas (P2-III) pueden prepararse a través de la reacción de ésteres del ácido 2-clorosulfonil-benzoico (P2-IV) con amoniaco tal como lo describe M. C. Bell et al. in Bioorganic & Medicinal Letters 1991, No. 12, 733-736 o M. L. Trudell et al in Journal of Heterociclic Chem. 2004, 41, 435f.

Este último artículo también describe la síntesis de los mencionados ésteres del ácido 2-clorosulfonil-benzoico (P2-IV) a partir de los correspondientes antranilatos de metilo (P2-V) con diazotación y clorosulfonación subsecuentes. Un procedimiento similar está descrito por G. Hamprecht et al. in Chimia (2004), 58, 117-122.

En los casos donde los metilo antranilatos (P2-V) no estén disponibles comercialmente, pueden prepararse a partir del correspondiente metil éster del ácido 2-nitro benzoico (P2-VI) a través de hidrogenación catalítica tal como lo menciona J. F. W. Keana et al. in Bioorganic & Medicinal Chemistry 11 (2003) 1769-1780.

Alternativamente, sacarinas (P2-II) pueden prepararse por escisión de las correspondientes N-t-butilo sacarinas (P2-VII) mediante calentamiento con un ácido fuerte tal como ácido trifluoroacético en una forma descrita por K. F. Burri in Helvetica Chimica Acta 1990, 73, 69-80.

Las N-t-butilo sacarinas (P2-VII) pueden obtenerse a partir de las sulfonamidas correspondientes (P2-VIII) por una orto-metilación con bases tales como butilo litio o litiodiisopropilamida y subsecuente atrapamiento de las especies metalizadas con dióxido de carbono bajo cierre de anillo. El procedimiento está descrito por D. Becker et al. en Tetrahedron 1992, 2515-2522. La metalización puede llevarse a cabo tal como lo describe N. Murugesan et al. in J. Med. Chem. 1998, 41, 5198-5218.

10

15

Alternativamente, los 3-amino-1,2-bencisotiazol 1,1-dióxidos (P2-I) pueden prepararse también a partir de imidatos adecuadamente sustituidos (P2-IX) a través de una reacción con aminas primarias a temperatura elevada. La reacción puede llevarse a cabo bien sea pura o en un solvente adecuado, preferiblemente un solvente polar, de alto punto de ebullición tal como tetrahidrofurano (THF) o dioxano. De manera preferencia, la reacción se lleva a cabo pura. En casos donde la reacción se lleva a cabo pura, la temperatura preferida está entre temperatura ambiente y el punto de ebullición de la amina respectiva. En casos donde la reacción se lleva a cabo en un solvente, la temperatura preferida está entre la temperatura ambiente y el punto de ebullición del solvente respectivo. El sustituyente alquilo en este método es preferiblemente un sustituyente alquilo tal como metilo o etilo.

$$R^{2}$$

$$R^{3}$$

$$R^{4}$$

$$R^{3}$$

$$R^{4}$$

$$R^{5}$$

$$R^{4}$$

$$R^{5}$$

$$R^{4}$$

$$R^{5}$$

$$R^{7}$$

$$R^{7}$$

$$R^{8}$$

$$R^{7}$$

$$R^{9}$$

$$R^{2}$$

$$R^{4}$$

$$R^{5}$$

$$R^{9}$$

$$R^{1}$$

$$R^{1}$$

$$R^{1}$$

$$R^{1}$$

$$R^{1}$$

$$R^{2}$$

$$R^{3}$$

$$R^{4}$$

$$R^{5}$$

$$R^{4}$$

$$R^{5}$$

$$R^{4}$$

$$R^{5}$$

$$R^{4}$$

$$R^{5}$$

$$R^{5}$$

$$R^{5}$$

$$R^{5}$$

$$R^{5}$$

$$R^{5}$$

$$R^{4}$$

$$R^{5}$$

$$R^{5$$

Dichos imidatos (P2-IX) pueden obtenerse haciendo reaccionar un 2-cianobenceno sulfonamida (P2-X) con un ortoéster de un ácido carbónico en un procesos descrito de la misma forma en Journal of Organic Chemistry 1963, 28, 2902-2903. Dichas cianobencenos sulfonamidas (P2-X) pueden prepararse como se describe en WO 2005/035486.

Los compuestos I-A1-0 de la presente invención para los cuales A tiene el significado definido como A¹ y m= 0 pueden hacerse a través de una reacción de condensación de un derivado de aminobencisotiazol III-a con sulfóxidos adecuadamente sustituidos IV en combinación con un agente condensador adecuado. Agentes de condensación adecuados son, por ejemplo, oxicloruro de fósforo, óxido de fósforo (V), cloruro de metanosulfonilo, cloruro de sulfurilo, tricloruro de azufre, trifluoruro de boro, diciclohexilcarbodiimida, arilo cianatos o anhídridos de ácido, preferiblemente anhídrido trifluoroacético o anhídrido triflourometanosulfónico.

5

10

20

$$R^{2}$$
 R^{1}
 NH_{2}
 NH_{2}
 R^{3}
 R^{4}
 R^{5}
 R^{6}
 R^{5}
 R^{6}
 R^{3}
 R^{4}
 R^{5}
 R^{6}
 R^{5}
 R^{6}
 R^{1}
 R^{2}
 R^{5}
 R^{5}
 R^{5}
 R^{5}
 R^{6}
 R^{1}
 R^{2}
 R^{3}
 R^{4}
 R^{5}
 R^{5}
 R^{5}
 R^{5}

Los sulfóxidos de la fórmula IV pueden obtenerse de acuerdo con los procedimientos conocidos en la técnica, por ejemplo, como se describe en J. March, Advanced Organic Chemistry, 4th Edition, Wiley, 1992, p. 1297.

Alternativamente, dichos compuestos pueden prepararse haciendo reaccionar una bencisotiazolona activada sustituida adecuadamente II-a con un compuesto tio adecuadamente sustituido V en presencia de una base. Preferiblemente esta base es una amina tal como trietilamina o N-diisopropiletilamina (base de Huenig).

$$R^{2}$$
 R^{1}
 R^{5}
 R^{4}
 R^{6}
 R^{5}
 R^{6}
 R^{5}
 R^{6}
 R^{7}
 R^{6}
 R^{7}
 R^{7}
 R^{7}
 R^{7}
 R^{6}
 R^{7}
 R^{7

Los compuestos tio V pueden prepararse siguiendo un procedimiento descrito en Tetrahedron 1975, 31, 3035-3040.

En casos donde n es 0, 1 o 2, los compuestos I-A1-1 para los cuales m=1, pueden obtenerse a partir de los compuestos I-A1-0 para los cuales m=0 por tratamiento con un agente oxidante apropiado tal como H_2O_2 , NaOCI o ácido 3-cloro-perbenzoico en analogía a la síntesis descrita por el Journal of Heterociclic Chemistry 2005, 42, 599-607 (H_2O_2), Journal of Organic Chemistry 1984, 49, 2282-2284 (NaOCI) o Heterocicles 1998, 49, 181-190 (ácido meta-cloroperbenzoico (mcpba)):

Los compuestos I-A2 en los cuales A tiene el significado dado para A² pueden obtenerse a partir de los derivados aminobencisotiazol III-B a través de reacción con tio compuestos adecuadamente sustituidos VI en presencia de una base en analogía con la síntesis descrita por Fármaco 1992, 47, 265 -274. Bases adecuadas serían, por ejemplo, aminas como trietilamina, base de Huenig o piridina.

5

15

Los 3-amino-1,2-bencisotiazoles (P0-I) pueden obtenerse también a partir de 2-mercaptobenzonitrilos (P0-XII) o sus sales de metales alcalinos en analogía a L.K.A. Rahman et al., J.Chem.Soc. Perkin Trans I, 1983, 2973-2977 por reacción de dichos compuestos con aminas.

$$R^2$$
 R^3
 R^4
 R^4
 R^4
 R^4
 R^7
 R^4
 R^4
 R^7
 R^7
 R^8
 R^4
 R^4
 R^4
 R^7
 R^8
 R^4
 R^4
 R^7
 R^8
 R^8

P0-XII P0-

Los compuestos I-A³ en los cuales A tiene el significado dado para A³ pueden obtenerse a partir de derivados de aminobencisotiazol a través de reacción con un haluro de acilo (Hal-C (O)-R¹⁰), especialmente un cloruro de acilo, un anhídrido de ácido (R¹⁰-C(O)-OC(O)-R¹⁰) o un anhídrido de ácido mezclado en presencia de una base apropiada de acuerdo con los procedimientos conocidos en la técnica, por ejemplo, la EP 133418. Bases apropiadas incluyen bases orgánicas, por ejemplo, aminas terciarias, tales como aminas alifáticas, por ejemplo trimetilamina, trietilamina o diisopropiletilamina, aminas cicloalifáticos terciarias, por ejemplo N-metilpiperidina o aminas aromáticas, por ejemplo piridina, piridinas sustituidas tales como 2,4,6-colidina, 2,4-lutidina o 4-dimetilaminopiridina.

En los métodos de preparación descritos anteriormente, las variables R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R7, R8, R⁹ y R¹⁰ tienen los significados como se definió anteriormente, en particular los significados mencionados según se prefiera.

Si los compuestos individuales no pueden prepararse a través de las rutas anteriormente descritas, puede prepararse por derivación de otros compuestos I o por modificaciones a la medida de las rutas de síntesis descritas.

Las mezclas de reacción se manipulan de la forma habitual, por ejemplo, mezclando con agua, separando las fases, y, si es apropiado, purificar los productos crudos por cromatografía, por ejemplo sobre alúmina o sílica gel. Algunos de los intermedios y productos finales pueden obtenerse en la forma de aceites viscosos incoloros o de color pardo pálido, los cuales son liberados o purificados de componentes volátiles bajo presión reducida y a temperatura moderadamente elevada. Si los intermedios y los productos finales se obtienen como sólidos, pueden purificarse por recristalización o digestión.

Sales aceptables desde el punto de vista agrícola de los compuestos de la fórmula I pueden conformarse de una forma habitual, por ejemplo, por reacción con un ácido del anión en cuestión.

Plagas

45

50

55

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

- 15 insectos del orden de los lepidópteros (Lepidoptera), por ejemplo Agrotis ypsilon, Agrotis segetum, Alabama argillacea, Anticarsia gemmatalls, Argyrestia conjugella, Autographa gamma, Bupalus piniarius, Cacoecia murinana, Capua reticulana, Cheimatobia brumata, Choristoneura fumiferana, Choristoneura occidentalis, Cirphis unipuncta, Cydia pomonella, Dendrolimus pini, Diaphania nitidalis, Diatraea grandiosella, Earias insulana, Elasmopalpus lignosellus, Eupoecilia ambiguella, Evetria bouliana, Feltia subterranea, Galleria mellonella, Grapholitha funebrana, 20 Grapholitha molesta, Heliothis armigera, Heliothis virescens, Heliothis zea, Hellula undalis, Hibernia defoliaria, Hyphantria cunea, Hyponomeuta malinellus, Keiferia lycopersicella, Lambdina fiscellaria, Laphygma exigua, Leucoptera coffeella, Leucoptera scitella, Lithocolletis blancardella, Lobesia botrana, Loxostege sticticalis, Lymantria dispar, Lymantria monacha, Lyonetia clerkella, Malacosoma neustria, Mamestra brassicae, Orgyia pseudotsugata, Ostrinia nubilalis, Panolis flammea, Pectinophora gossypiella, Peridroma saucia, Phalera bucephela, Phthorimaea 25 operculella, Phyllocnistis citrella, Pieris brassicae, Plathypena scabra, Plutella xylostella, Pseudoplusia includens, Rhyacionia frustrana, Scrobipalpula absoluta, Sitotroga cerealella, Sparganothis pilleriana, Spodoptera frugiperda, Spodoptera littoralis, Spodoptera litura, Thaumatopoea pityocampa, Tortrix viridana, Trichoplusia ni y Zeiraphera canadensis.
- escarabajos (Coleoptera), por ejemplo Agrilus sinuatus, Agriotes lineatus, Agriotes obscurus, Amphimallus solstitialis, Anisandrus dispar, Anthonomus grandis, Anthonomus pomorum, Aphthona euphoridae, Athous haemorrhoidalis, Atomaria linearis, Blastophagus piniperda, Blitophaga undata, Bruchus rufimanus, Bruchus pisorum, Bruchus lentis, Byctiscus betulae, Cassida nebulosa, Cerotoma trifurcata, Cetonia aurata, Ceuthorrhynchus assimllis, Ceuthorrhynchus napi, Chaetocnema tibialis, Conoderus vespertinus, Crioceris asparagi, Ctenicera ssp., Diabrotica longicomis, Diabrotica semipunctata, Diabrotica 12-punctata Diabrotica speciosa, Diabrotica virgifera, Epilachna varivestis, Epitrix hirtipennis, Eutinobothrus brasiliensis, Hylobius abietis, Hypera brunneipennis, Hypera postica, Ips typographus, Lema bilineata, Lema melanopus, Leptinotarsa decemlineata, Limonius californicus, Lissorhoptrus oryzophilus, Melanotus communis, Meligetes aeneus, Melolontha hippocastani, Melolontha melolontha, Oulema oryzae, Otiorrhynchus sulcatus, Otiorrhynchus ovatus, Phaedon cochleariae, Phyllobius piri, Phyllotreta chrysocephala, Phyllophaga sp., Phyllopertha horticola, Phyllotreta nemorum, Phyllotreta striolata, Popillia japonica, Sitona lineatus y Sitophilus granaria,

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

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

termitas (Isóptera), por ejemplo, Calotermes flavicollis, Leucotermes flavipes, Heterotermes aureus, Reticulitermes flavipes, Reticulitermes virginicus, Reticulitermes lucifugus, Reticulitermes santonensis, Reticulitermes grassei, Termes natalensis, y Coptotermes formosanus,

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

bichos, áfidos, saltamontes, moscas blancas, insectos de escala, cícadas (Hemíptera), por ejemplo Acrosternum hilare, Blissus leucopterus, Cyrtopeltis notatus, Dysdercus cingulatus, Dysdercus intermedius, Eurygaster 10 integriceps, Euschistus impictiventris, Leptoglossus phyllopus, Lygus lineolaris, Lygus pratensis, Nezara viridula, Piesma quadrata, Solubea insularis, Thyanta perditor, Acyrthosiphon onobrychis, Adelges Iaricis, Aphidula nasturtii, Aphis fabae, Aphis forbesi, Aphis pomi, Aphis gossypii, Aphis grossulariae, Aphis schneideri, Aphis spiraecola, Aphis sambuci, Acyrthosiphon pisum, Aulacorthum solani, Bemisia argentifolii, Brachycaudus cardui, Brachycaudus helichysi, Brachycaudus persicae, Brachycaudus prunicola, Brevicoryne brassicae, Capitophorus horni, Cerosipha 15 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, Macrosiphon rosae, Megoura viciae, Melanaphis pirarius, Metopolophium dirhodum, Myzus persicae, Myzus ascalonicus, Myzus cerasi, Myzus varians, Nasonovia ribisnigri, Nilaparvata lugens, Pemphigus bursarius, Perkinsiella saccharicida, Phorodon humuli, Psylla 20 mali, Psylla piri, Rhopalomyzus ascalonicus, Rhopalosiphum maidis, Rhopalosiphum padi, Rhopalosiphum insertum, Sappaphis mala, Sappaphis mali, Schizaphis graminum, Schizoneura lanuginosa, Sitobion avenae, Trialeurodes vaporariorum, Toxoptera aurantiiand, Viteus vitifolii, Cimex lectularius, Cimex hemipterus, Reduvius senilis, Triatoma spp., y Arilus critatus.

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

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

Aracnoidea, tales como arácnidos (Acarina), por ejemplo las familias Argasidae, Ixodidae y Sarcoptidae, tales como Amblyomma americanum, Amblyomma variegatum, Ambryomma maculatum, Argas persicus, Boophilus annulatus, Boophilus decoloratus, Boophilus microplus, Dermacentor silvarum, Dermacentor andersoni, Dermacentor variabilis, Hyalomma truncatum, Ixodes ricinus, Ixodes rubicundus, Ixodes scapularis, Ixodes holociclus, Ixodes pacificus, Ornithodorus moubata, Ornithodorus hermsi, Ornithodorus turicata, Ornithonyssus bacoti, Otobius megnini, Dermanyssus gallinae, Psoroptes ovis, Rhipicephalus sanguineus, Rhipicephalus appendiculatus, Rhipicephalus evertsi, Sarcoptes scabiei, y Eriophyidae spp. such as Aculus schlechtendali, Phyllocoptrata oleivora y Eriophyes sheldoni, Tarsonemidae spp. tales como Phytonemus pallidus y Poliphagotarsonemus latus, Tenuipalpidae spp. tales como Brevipalpus phoenicis, Tetranychidae spp. tales como Tetranychus cinnabarinus, Tetranychus kanzawai, Tetranychus pacificus, Tetranychus telarius y Tetranychus urticae, Panonychus ulmi, Panonychus citri, y Oligonychus pratensis, Araneida, e.g. Latrodectus mactans, y Loxosceles reclusa,

pulgas (Sifonáptera), por ejemplo, Ctenocephalides felis, Ctenocephalides canis, Xenopsylla cheopis, Pulex irritans, Tunga penetrans, y Nosopsyllus fasciatus,

pez de plata, insecto del fuego (Tisanura), por ejemplo Lepisma saccharina y Thermobia domestica,

50 centípedos (Quilopoda), por ejemplo Escutigera coleoptrata,

milipedes (Diplopoda), por ejemplo Narceus spp.,

5

35

40

45

tijereta (Dermáptera), por ejemplo forficula auricularia,

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

colas de resorte (Colembola), por ejemplo Onychiurus ssp..

- También son adecuados para controlar nemátodos: nemátodos parasíticos de las plantas tales cono nemátodos de los brotes de raíz, *Meloidogyne hapla, Meloidogyne incognita, Meloidogyne javanica,* y otras especies de Meloidogyne; nemátodos de formación de quistes, *Globodera rostochiensis* y otras especies de Globodera; *Heterodera avenae, Heterodera glycines, Heterodera schachtii, Heterodera trifolii,* y otras especies de Heterodera; nemátodos de los bulbos de las semillas, especies de Anguina; nematos de tallo y foliares, especies de
- Afelencoides; nemátodos de Sting, Belonolaimus longicaudatus y otras especies de Belonolaimus; nemátodos del Pino, Bursafelencus xylofilus y otras especies de Bursafelencus; nemátodos de anillo, especies de Criconema, especies de Criconemoides, especies de Mesocriconema; nemátodos de tallo y bulbo, Ditilenchus destructor, Ditilenchus dipsaci y otras especies de Ditilenchus; nematodos taladro, especies de Dolichodorus; nematodos espirales, Heliocoty lenchus multicinctus y otras especies de Helicotilenchus; nematodos
- de daguilla y daguilloides, especies de Hemicicliophora y especies de Hemicriconemoides; especies de Hirshmanniella; nematodos de lanceta, especies de Hoploaimus; nematodos falsos de nódulos, especies de Nacobbus; nematodes de aguja, Longidorus elongatus y otras especies de Longidorus; nematodes de lesiones, Pratilenchus neglectus, Pratilenchus penetrans, Pratilenchus curvitatus, Pratilenchusgoodeyi y otras especies de Pratilenchus; nematodos perforadores, Radopholus similis y otras especies de Radopholus; nematodes reniformes,
- Rotilenchus robustus y otras especies de Rotilenchus; especies de Scutellonema; nemátodos achatados de raíz, Trichodorus primitivus y otras especies de Trichodorus, especies de Paratrichodorus; nematodos acróbatas, Tilenchorhynchus claytoni, Tilenchorhynchus dubius y otras especies de Tilenchorhynchus species; nematodos de cítricos, especies de Tilenchulus; nematodos cavadores, especies de Xiphinema; y otras especies de nemátodos parasíticos para las plantas.
- Los compuestos de la fórmula I son particularmente útiles para controlar insectos, preferiblemente insectos chupadores o perforadores tales como insectos de los géneros Tisanóptera, Himenóptera, Ortóptera, y Hemíptera, en particular las siguientes especies:

Thysanoptera: Frankliniella fusca, Frankliniella occidentalis, Frankliniella tritici, Scirtothrips citri, Thrips oryzae, Thrips palmi y Thrips tabaci,

Hymenoptera: Athalia rosae, Atta cephalotes, Atta sexdens, Atta texana, Hoplocampa minuta, Hoplocampa testudinea, Monomorium pharaonis, Solenopsis geminata y Solenopsis invicta,

Orthoptera: Acheta domestica, Blatta orientalis, Blaffella 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 asynamorus;

Hemíptera, en particular áfidos: Acyrthosiphon onobrychis, Adelges Iaricis, Aphidula nasturtii, Aphis fabae, Aphis forbesi, Aphis pomi, Aphis gossypii, Aphis grossulariae, Aphis schneideri, Aphis spiraecola, Aphis sambuci, Acyrthosiphon pisum, Aulacorthum solani, Brachycaudus cardui, Brachycaudus helichrysi, Brachycaudus persicae, Brachycaudus prunicola, Brevicoryne brassicae, Capitophorus horni, Cerosipha 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, Macrosiphon rosae, Megoura viciae, Melanaphis pirarius, Metopolophium dirhodum, Myzodes persicae, Myzus ascalonicus, Myzus cerasi, Myzus varians, Nasonovia ribis-nigri, Nilaparvata lugens, Pemphigus bursarius, Perkinsiella sacchaficida, Phorodon humuli, Psylla mali, Psylla piri, Rhopalomyzus ascalonicus, Rhopalosiphum maidis, Rhopalosiphum padi, Rhopalosiphum insertum, Sappaphis mala, Sappaphis mali, Schizaphis graminum, Schizoneura lanuginosa, Sitobion avenae, Trialeurodes vaporariorum, Toxoptera aurantiiand, y Viteus vitifolii;

Los compuestos de la fórmula I son particularmente útiles para controlar insectos de los órdenes Hemíptera y Tisanóptera y más preferiblemente para controlar áfidos.

50 Formulaciones

35

40

45

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 y método de aplicación en

particular. 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 una manera conocida (véase, por ejemplo, para una revisión US 3,060,084, EP-A 707 445 (para concentrado en 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 (Germany), 2001, 2. D. A. Knowles, Chemistry y Technology of Agrochemical Formulations, Kluwer Academic Publishers, Dordrecht, 1998 (ISBN 0-7514-0443-8), por ejemplo extendiendo el compuesto activo con auxiliares adecuados para la formulación de agroquímicos, tales como solventes y/o vehículos, si se desea emulsificantes, surfactantes y dispersantes, conservantes, agentes antiespumantes, agentes anticongelantes, para formulaciones para el tratamiento de semillas también opcionalmente colorantes y/o aglomerantes y/o agentes gelificantes.

15 Los solventes/vehículos que son adecuados son por ejemplo:

20

25

35

- 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 ciclohexanona, gamma-butirolactona), pirrolidonas (N-metil-pirrolidona (NMP), N-octilpirrolidona NOP), acetatos (glicol de diacetato), lactatos de alquilo, lactonas tales como g-butirolactona, glicoles, dimetilamidas 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, puede utilizarse también una mezcla de solventes.
- vehículos tales como minerales naturales triturados y minerales sintéticos triturados, tales como geles de sílica, ácido silícico finamente dividido, silicatos, talco, caolín, atarcilla, caliza, cal, tiza, bole, loess, arcilla, dolomita, tierra de diatomáceas, 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, tales como torta de cereales, torta de corteza de árboles, torta de madera y torta de cáscara de nueces, polvos de celulosa y otros vehículos sólidos.
- Emulsificantes adecuados son emulsificantes no iónicos y aniónicos (por ejemplo, éteres de alcoholes grasos de polioxietileno, alquilsulfonatos y arilsulfonatos).

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

Surfactantes adecuados son sales de metales alcalinos, alcalinotérreos y amonio del ácido lignosulfónico, ácido naftalenosulfónico, ácido fenolsulfónico, ácido dibutilnaftalensulfónico, alquilarilsulfonatos, sulfatos de alquilo, alquilo sulfonatos, sulfatos de alcoholes grasos, ácidos grasos y éteres de glicol y alcoholes de ácidos grasos sulfatados, adicionalmente condensados de naftaleno sulfonatados y derivados de naftaleno con formaldehído, condensados de naftaleno o de ácido naftalensulfónico con fenol y formaldehído, polioxietilen octilfenil éter, isooctilfenol etoxilado, octilfenol, nonilfenol, alquilfenilo poliglicol éteres, tributilfenilo poliglicol éter, tristearilfenilo poliglicol éter, alquilarilo poliéter alcoholes, alcohol y condensados de alcoholes grasos óxido de etileno, aceite de castor etoxilado, polioxietilen alquil éteres, polioxipropileno etoxilado, lauril alcohol poliglicol éter acetal, ésteres de sorbitol.

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

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

Conservantes adecuados son por ejemplo diclorofén o alcohol bencílico hemiformal

Espesantes adecuados son compuestos que confieren un comportamiento de flujo seudoplástico a la formulación, esto es, alta viscosidad en reposo y baja viscosidad en estado de agitación. Puede hacerse mención, en este contexto, por ejemplo, de espesantes comerciales basados en polisacáridos tales como goma 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 parte de microorganismos. Biocidas adecuados están, por ejemplo, basados en de isotiazolonas tales como los compuestos

comercializados bajo las marcas comerciales Proxel® de Avecia (o Arch) o Acticide® RS de Thor Chemie y Kathon® MK Rohm & Haas. 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 de compuesto activo. Si es apropiado, las composiciones del compuesto activos de acuerdo con la invención pueden comprender 1 a 5% en peso de regulador con base en la cantidad total de la formulación preparada, para regular el pH, la cantidad y tipo de regulador usado dependiendo de las propiedades químicas del compuesto activo o 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.

Las 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 o aceites de origen vegetal o animal, hidrocarburos alifáticos, cíclicos o aromáticos, por ejemplo tolueno, xileno, parafina, tetrahidronaftaleno, naftalenos alquilados o sus derivados, metanol, etanol, propanol, butanol, ciclohexanol, ciclohexanona, isoforona, solventes fuertemente polares, por ejemplo dimetilsulfóxido, N-metilpirrolidona y aqua.

Polvos, materiales para esparcir y pulverizados pueden prepararse mezclando o triturando concomitantemente las sustancias activas con un vehículo sólido.

Los granulados, por ejemplo gránulos recubiertos, gránulos impregnados y gránulos homogéneos, pueden prepararse mezclando los ingredientes activos con vehículos sólidos. Ejemplos de vehículos sólidos son tierras minerales tales como geles de sílica, silicatos, talco, caolín, atarcilla, caliza, cal, tiza, bole, 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, nitrato de amonio, ureas y productos de origen vegetal, tales como torta de cereal, torta de corteza de árboles, torta de madera y torta de cáscara de nueces, polvos de celulosa y otros vehículos sólidos.

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

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

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

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.
- 40 A) Concentrados solubles en agua (SL, LS)

5

30

35

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

- B) Concentrados dispersables (DC)
- 45 20 partes en peso del compuesto activo se disuelven 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 lo cual se obtiene una formulación con 20% (p/p) del compuesto activos.
 - C) Concentrados emulsificables (EC)

- 15 partes en peso del compuesto activo se disuelve en 7 partes en peso de xileno con adición de dodecilbencenosulfonato de calcio y aceite de castor etoxilado (en cada caso 5 partes en peso). La dilución con agua da una emulsión, con la cual se obtiene una formulación con 15% (p/p) de compuesto activo.
- D) Emulsiones (EW, EO, ES)
- 5 25 partes en peso del compuesto activo se disuelven en 35 partes en peso de xileno con adición de dodecilbencenosulfonato 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 Ultraturrax) y se convierte en una emulsión homogénea. La dilución con agua da una emulsión, con la cual se obtiene una formulación con 25% (p/p) del compuesto activo.
- 10 E) Suspensiones (SC, OD, FS)

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 del compuesto activo. La dilución con agua da una suspensión establa del compuesto activo, con lo cual se obtiene una formulación con 20% (p/p) del compuesto activo.

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

50 partes en peso del compuesto activo se trituran finamente con la adición de 50 partes en peso de dispersantes y humectantes y se convierten en gránulos dispersables en agua o solubles en agua por medio de dispositivos técnicos (por ejemplo, extrusión, torre de aspersión, lecho fluidizado). La dilución con agua da una dispersión o solución establa del compuesto activo, con lo cual se obtiene una formulación del 50% (p/p) del compuesto activo.

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

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

- H) Formulación en gel (GF)
- 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 establa del compuesto activo, con lo cual se obtiene una formulación con 20% (p/p) del compuesto activo.
- Productos que se aplican sin dilución para aplicaciones foliares. Para propósitos de tratamiento de semillas, tales
 productos pueden aplicarse a las semillas diluidos o no diluidos.
 - I) Polvos pulverizables (DP, DS)

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)
- 35 Se trituran finamente 0.5 partes en peso del compuesto activo y se asocian con 95.5 partes en peso de vehículos, con lo cual se obtiene una formulación con 0.5% (p/p) del compuesto activo. Los métodos actuales son extrusión, secado por aspersión o el lecho fluidizado. Esto da gránulos para ser aplicados sin dilución para uso foliar.
 - K) Soluciones ULV (UL)
- Se disuelven 10 partes en peso del compuesto activo en 90 partes en peso de un solvente orgánico, por ejemplo xileno. Esto da un producto que tiene 10% (p/p) del compuesto activo, el cual se aplica sin dilución para uso foliar.

Las formas de uso acuosas pueden prepararse a partir de concentrados para emulsión, pastas o polvos humectablas (polvos asperjables, dispersiones oleosas) agregando agua. Para preparar emulsiones, pastas o dispersiones oleosas, las sustancias, como tales o disueltas en un aceite o solvente, pueden homogenizarse en agua por medio de un humectante, aglomerante, dispersante o emulsificador. Alternativamente, es posible preparar

concentrados compuestos de sustancia activa, humectante, aglomerante, dispersante o emulsificante y, si es apropiado, solvente o aceite, y tales concentrados son adecuadas para dilución con agua.

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

- 5 Los ingredientes activos también puede utilizarse exitosamente en el proceso de volumen ultra bajo (ULV), siendo posible aplicar formulaciones que comprenden más de 95% en peso del ingrediente activo, o incluso aplicar el ingrediente activo sin aditivos.
- En el método de esta invención los compuestos I pueden 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 descritas más arriba, si es apropiado también se agregan sólo inmediatamente 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 haber sido tratadas con otros ingredientes activos.
- La siguiente lista M de pesticidas junto con los compuestos de acuerdo con la invención pueden utilizarse y con las cuales podrían producirse efectos sinérgicos, se entienden como ilustrativas de combinaciones posibles, pero no imponen ninguna limitación:
- M.1. Órgano(tio)fosfatos: acephate, azametiphos, azinphos-etilo, azinphosmetilo, cloretoxifos, clorfenvinphos, clormephos, clorpirifos, clorpirifosmetilo, coumaphos, cianophos, demeton-S-metilo, diazinon, diclorvos/ DDVP, dicrotophos, dimetoate, dimetilvinphos, disulfoton, EPN, etion, etoprophos, famphur, fenamiphos, fenitrotion, flupirazophos, fostiazate, heptenophos, isoxation, malation, mecarbam, methamidophos, metidation, mevinphos, monocrotophos, naled, ometoate, óxidometon-metilo, paration, paration-metilo, fenthoate, phorate, phosalone, phosmet, phosphamidon, phoxim, pirimiphos-metilo, profenofos, propetamphos, protiofos, piriaclofos, piridafention, quinalphos, sulfotep, tebupirimfos, temephos, terbufos, tetraclorvinphos, tiometon, triazophos, triclorfon, vamidotion;
- M.2. Carbamatos: aldicarb, alanycarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxicarboxim, carbarilo, carbofurano, carbosulfan, etiofencarb, fenobucarb, formetanate, furatiocarb, isoprocarb, metiocarb, metomilo, metolcarb, oxamilo, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, trimethacarb, XMC, xylylcarb, triazamate:
- M.3. Piretroides: acrinathrin, allethrin, d-cis-trans allethrin, d-trans allethrin, bifenthrin, bioallethrin, bioallethrin, Scylclopentenilo, bioresmethrin, cicloprothrin, cyfluthrin, beta-, yfluthrin, cyhalothrin, lambda-cyhalothrin, gammacyhalothrin, cypermethrin, alphacypermethrin, beta-cypermethrin, theta-cypermethrin, zeta-cypermethrin, cyfenothrin, deltamethrin, empenthrin, esfenvalerate, etofenprox, fenpropathrin, fenvalerate, flucythrinate, flumethrin, tau-fluvalinate, halfenprox, imiprothrin, permethrin, fenothrin, prallethrin, resmethrin, RU 15525, silafluofen, tefluthrin, tetramethrin, transfluthrin, ZXI 8901;
 - M.4. Imitadores de hormonas juveniles: hidroprene, kinoprene, metoprene, fenoxicarb, piriproxifen;
- 35 M.5. Compuestos agonistas/antagonistas del receptor nicotínico: acetamiprid, bensultap, cartap hidrocloride, clotianidin, dinotefurano, imidacloprid, tiametoxam, nitenpiram, nicotine, spinosad (agonista alostérico), tiacloprid, tiociclam, tiosultap-sodio y AKD1022.
 - M.6. Compuestos GABA antagonistas del canal de la puerta de cloro GABA: clordane, endosulfan, gamma-HCH (lindane); acetoprole, etiprole, fipronil, pirafluprole, piriprole, vaniliprol, el compuesto fenilpirazol de fórmula M^{6.1}

$$\begin{array}{c|c} O & S \\ \hline CF_3 & NH_2 \\ \hline H_2N & N \\ \hline CI & CI \\ \hline CF_3 \end{array} \qquad (M^{6.1})$$

40

- M.7. Activadores del canal de cloruro: abamectin, emamectin benzoate, milbemectin, lepimectin;
- M.8. Compuestos METI I: fenazaquin, fenpiroximate, pirimidifen, piridaben, tebufenpirad, tolfenpirad, flufenerim, rotenone;
- M.9. Compuestos METI II y III: acequinocilo, fluacyprim, hydrametilnon;
- 5 M.10. Desacoplantes de la fosforilación oxidativa: clorfenapir, DNOC;
 - M.11. Inhibidores de la fosforilación oxidativa: azociclotin, cyhexatin, diafenthiuron, fenbutatin óxido, propargita, tetradifon:
 - M.12. Perturbadores de muda: cyromazina, chromafenozide, halofenozide, metoxifenozide, tebufenozide;
 - M.13. Sinérgicos: butóxido de piperonilo, tribufos;
- 10 M.14. Compuestos bloqueadores del canal de sodio: indoxacarb, metaflumizone;
 - M.15. Fumigantes: bromuro de metilo, sulfurilo fluoruro de cloropicrina;
 - M.16. bloqueadores de la alimentación selectiva: crylotie, pymetrozine, flonicamid;
 - M.17. Inhibidores del crecimiento de gorgojo: clofentezine, hexytiazox, etoxazol;
- M.18. Inhibidores de la síntesis de quitina: buprofezin, bistrifluron, clorfluazuron, diflubenzuron, flucicloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, teflubenzuron, triflumuron;
 - M.19. Inhibidores de la biosíntesis de lípidos: spirodiclofen, spiromesifen, spirotetramat;
 - M.20. Agonistas octapaminérgicos: amitraz;

25

- M.21. Moduladores del receptor de rianodina: flubendiamida;
- M.22. Diversos: fosfuro de aluminio, amidoflumet, benclotiaz, benzoximate, bifenazate, bórax, bromopropilato, cianuro, cyenopirafen, cyflumetofen, chinometionato, dicofol, fluoroacetato, fosfina, piridalilo, pirifluquinazon, azufre, compuestos orgánicos de azufre, emético de tartar; compuestos de pirimidinilo alquiniléter M^{22.1} o compuestos de tiadiazolilo alquinileter M^{22.2}:

- donde R^{M-22} es metilo etilo y Het* es 3,3-dimetilpirrolidin-1-ilo, 3-metilpiperidin-1-ilo, 3,5-dimetilpiperidin-1-ilo, 3-trifluormetilpiperidin-1-ilo, hexahidroazepin-1-ilo, 2,6-dimetilhexahidroazepin-1-ilo o 2,6-dimetilmorfolin-4-ilo.
 - M.23. N-R'-2,2-dihalo-1-R"ciclo-propanecarboxamida-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' es metilo o etilo, halo es Cloro o bromo, R" es Hidrógeno o metilo y R"' es metilo o etilo;
 - M.24. Antranilamidas: clorantraniliprol, el compuesto de la fórmula M²⁴ 1

$$NC \xrightarrow{CH_3} O \xrightarrow{N} N \xrightarrow{N} CI \qquad (M^{24.1})$$

 $M.25. \ Compuestos \ de \ malononitrilo: \ CF_2HCF_2CF_2CF_2CH_2C(CN)_2CH_2CH_2CF_3 \ (2-(2,2,3,3,4,4,5,5-octafluoropentil)-2-(2,2,3,3,4,4,5,5) - (2,2,3,4,4,5,5) - (2,2,3,3,4,4,5,5) - (2,2,3,3,4,4,5,5) - (2,2,3,3,4,4,5,5) - (2,2,3,3,4,4,5,5) - (2,2,3,4,5,5) - (2,2,3,4,5,5) - (2,2,3,4,5,5) - (2,2,3,4,5) - (2,2,3,4,5) - (2,2,3,4,5) - (2,2,3,4,5) - (2,2,3,4,5) - (2$ (3.3.3-trifluoro-propil)malononitrilo). CF₃(CH₂)₂C(CN)₂CH₂(CF₂)5CF₂H, (2-(2,2,3,3,4,4,5,5,6.6.7.7-Dodecafluoroheptil)-2-(3,3,3-trifluoro-propil)-malononitrilo), CF₃(CH₂)₂C(CN)₂(CH₂)₂C(CF₃)₂F(2-(3,4,4,4-Tetrafluoro-3trifluorometil-butil)-2-(3,3,3-trifluoro-propil)-malononitrilo), $CF_3(CH_2)_2C(CN)_2(CF_2)_3CF_3$ (2-(3,3,4,4,5,5,6,6,6-5 Nonafluoro-hexil)-2-(3,3,3-trifluoro-propil)-malononitrilo), CF₂H(CF₂)₃CH₂C(CN)₂CH₂(CF₂)₃CF₂H(2,2-Bis- $(2,2,3,3,4,4,5,5-\text{octafluoro-pentil})-\text{malononitrilo}), CF_3(CH_2)_2C(CN)_2CH_2(CF_2)_3CF_3 (2-(2,2,3,3,4,4,5,5-\text{Nonafluoro-pentil})-\text{malononitrilo}), CF_3(CH_2)_2C(CN)_2CH_2(CF_2)_3CF_3 (2-(2,2,3,3,4,4,5,5-\text{Nonafluoro-pentil})-\text{malononitrilo})$ pentil)-2-(3,3,3-trifluoro-propil)-malononitrilo), $CF_3(CF_2)_2CH_2C(CN)_2CH_2(CF_2)_3CF_2H$ (2-(2,2,3,3,4,4,4-Heptafluorobutil)-2-(2,2,3,3,4,4,5,5-octafluoro-pentil)-malononitrilo), $CF_3CF_2CH_2C(CN)_2CH_2(CF_2)_3CF_2H$ 10 (2,2,3,3,4,4,5,5-Octafluoro-pentil)-2-(2,2,3,3,3-pentafluoro-propil)-malononitrilo), CF₂HCF₂CF₂CF₂CH₂C(CN)₂CH₂CH₂CF₂-CF₃(2-(2,2,3,3,4,4,5,5-octafluoropentil)-2-(3,3,4,4,4-pentafluorobutil)malonodinitrilo), $CF_3(CH_2)_2C(CN)_2CH_2(CF_2)_3CF_2H(2-(2,2,3,3,4,4,5,5-octafluoropentil)-2-(3,3,3-trifluoro-butil)-2-(3,3,3-trifluoro-b$ malononitrilo);

M.26. Perturbadores microbianos: *Bacillus thuringiensis* subsp. *Israelensi, Bacillus sphaericus, Bacillus thuringiensis* subsp. *Aizawai, Bacillus thuringiensis* subsp. *Kurstaki, Bacillus thuringiensis* subsp. *Tenebrionis*;

Los compuestos comercialmente disponibles del grupo M pueden encontrarse en The Pesticide Manual, 13th edición, British Crop Protection Councilo (2003) entre otras publicaciones.

Las tioamidas de la fórmula M^{6.1} y su preparación han sido descritas en WO 98/28279. La lepimectina es conocida de Agro Project, PJB Publications Ltd, November 2004. Benclotiaz y su preparación han sido descritos en EPA1 20 454621. Metidation y Paraoxon y su preparación han sido descritos en Farm Chemicals Handbook, Volume 88, Meister Publishing Company, 2001. Acetoprole y su preparación han sido descritos en WO 98/28277. Metaflumizone y su preparación han sido descritos en EP-A1 462 456. Flupirazofos se ha descrito en Pesticide Science 54, 1988. p.237-243 y inUS4822779. Pirafluprole y su preparación han sido descritos en JP 2002193709 y en WO01/00614. Piriprole y su preparación han sido descritos enWO98/45274 y inUS6335357. Amidoflumet y su preparación han sido 25 descritos en US 6221890 y in JP 21010907. Flufenerim y su preparación han sido descritos en WO 03/007717 y in WO 03/007718. AKD 1022 y su preparación han sido descritos en US 6300348. Cloranthraniliprole se ha descrito en WO01/70671, WO03/015519 y WO05/118552. Los derivados de anthranilamida de la fórmula $M^{24.1}$ han sido descritos en WO 01/70671, WO 04/067528 y WO 05/118552. Cyflumetofen y su preparación han sido descritos en WO 04/080180. El compuesto de aminoquinazolinona pirifluquinazon se ha descrito en EP A 109 7932. Los 30 compuestos de alquiniléter M22.1 y M22.2 están descritos e.g. en JP 2006131529. Los compuestos orgánicos de azufre han sido descritos en WO 2007060839. Los compuestos de malononitrilo han sido descritos en WO 02/089579, WO 02/090320, WO 02/090321, WO 04/006677, WO 05/068423, WO 05/068432 y WO 05/063694.

Los asociados de mezcla fungicida son los seleccionados del grupo F consistente de

- F.1 acilalaninas tales como benalaxilo, metalaxilo, ofurace, oxadixilo;
- F.2 derivados de amina tales como aldimorph, dodine, dodemorph, fenpropimorph, fenpropidin, guazatine, iminoctadine, spiroxamin, tridemorph;
 - F.3 anilinopirimidinas tales como pirimethanil, mepanipirim o cyrodinilo;
 - F.4 antibióticos tales como cicloheximid, griseofulvina, kasugamycin, natamicina, polioxina o streptomicina;
- F.5 azoles tales como bitertanol, bromoconazol, cyproconazol, difenoconazol, dinitroconazol, epoxiconazol, fenbuconazol, fluquiconazol, flusilazol, hexaconazol, imazalil, metconazol, myclobutanil, penconazol, propiconazol, procloraz, protioconazol, tebuconazol, triadimenol, triflumizol, triticonazol, flutriafol;
 - F.6 dicarboximidas tales como iprodion, myclozolin, procymidon, vinclozolin;

- F.7 ditiocarbamatos tales como ferbam, nabam, maneb, mancozeb, metam, metiram, propineb, policarbamate, thiram, ziram, zineb;
- F.8 compuestos heterocíclicos tales como anilazina, benomilo, boscalid, carbendazim, carboxin, oxicarboxin, cyazofamid, dazomet, ditianon, famoxadon, fenamidon, fenarimol, fuberidazol, flutolanil, furametpir, isoprotiolane, mepronil, nuarimol, probenazol, proquinazid, pirifenox, piroquilon, quinoxifen, siltiofam, tiabendazol, thifluzamid, tiophanate-metilo, tiadinil, triciclazol, triforine;
- F.9 fungicidas de cobre tales como mezcla de Bordeaux, acetato de cobre, oxicloruro de cobre, sulfato básico de cobre;
- F.10 derivados de nitrofenilo tales como inapacrilo, dinocap, dinobuton, nitrophthalisopropilo;
- 10 F.11 fenilpirroles tales como fenpicionilo o fludioxonil;
 - F.12 estrobilurines tales como azoxistrobin, dimoxistrobin, fluoxastrobin, kresoxim-metilo, metominostrobin, orysastrobin, picoxistrobin o trifloxistrobin;
 - F.13 derivados del ácido sulfénico tales como captafol, captan, dichlofluanid, folpet, tolilfluanid;
 - F.14 cinnemamidas y análogos tales como dimetomorph, flumetover o flumorph;
- 15 F.15 azufre, y otros fungicidas tales como acibenzolar-S-metilo, bentiavalicarb, carpropamid, clorothalonil, cyflufenamid, cymoxanil, dazomet, diclomezin, diclocymet, dietofencarb, edifenphos, ethaboxam, fenhexamid, fentinacetate, fenoxanil, ferimzone, fluazinam, fosetilo, fosetil-aluminum, iprovalicarb, hexaclorobenzene, metrafenon, pencicuron, propamocarb, phthalide, toloclofos-metilo, quintozene, zoxamid.

Aplicaciones

40

45

5

Las plagas animales, esto es, los insectos, arácnidos y nemátodos, la planta, suelo o agua en los cuales está creciendo la planta puede 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 directamente sobre la plaga animal o planta - típicamente al follaje, tallo o raíces de la planta) y el contacto indirecto (aplicar los compuestos/composiciones a la localización de la plaga animal o planta).

Los compuestos de la fórmula I o las composiciones pesticidas que los comprenden pueden utilizarse para proteger las plantas en crecimiento y plantas del ataque o infestación por plagas animales, especialmente insectos, acáridos 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 cultivos en crecimiento como recolectados.

- Además, las plagas animales pueden controlarse poniendo en contacto la plaga objetivo, su fuente de alimentación, hábitat, tierra de crianza o su localización con una cantidad efectiva como pesticida de los compuestos de la fórmula I. Como tal, la aplicación puede ser llevada a cabo antes o después de la infección de la localización, cultivos en crecimiento o cultivos recolectados por parte de la plaga.
- Los compuestos de la invención también pueden aplicarse de manera preventiva en lugares en los cuales 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 parte de plagas poniendo en contacto la planta con una cantidad efectiva como pesticida de los compuestos de la fórmula I. Como tal, "poner en contacto" incluye tanto el 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).

"Localización" significa un hábitat, terreno de crianza, 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, retardo, prevención y 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 la composición también variará de acuerdo con las condiciones prevalentes

tales como el efecto y duración pesticida deseados, clima, especies objetivo, localización, modo de aplicación, y similares.

En el caso de tratamiento de suelo o de aplicación al sitio o refugio de las plagas o nido, la cantidad de ingrediente activo varía desde 0.0001 a 500 g por 100 m², preferiblemente de 0.001 a 20 g por 100 m².

5 Las tasas de aplicación habituales en la protección de materiales son, por ejemplo, de 0.01 g a 1000 g de compuesto activo por m² de material tratado, deseablemente de 0.1 g a 50 g por m².

Las composiciones insecticidas para uso en la impregnación de materiales contiene 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.

Para uso en el tratamiento de plantas en cultivo, la tasa de aplicación de los ingredientes activos en 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.

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

Los compuestos de la invención también pueden aplicarse contra plagas de insectos diferentes a las de los cultivos, tales como hormigas, termitas, avispas, moscas, mosquitos, grillos o cucarachas. Para uso contra dichas plagas diferentes a las de los cultivos, los compuestos de la fórmula I se utilizan 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 formas y configuraciones diversas adecuadas para la aplicación respectiva (por ejemplo, gránulos, bloques, barras, discos). Los cebos líquidos pueden llenarse en dispositivos diversos para asegurar una aplicación apropiada, por ejemplo, contenedores abiertos, dispositivos para aspersión, fuentes de goteo o fuentes de evaporación. Los geles pueden estar basados en matrices acuosas u oleosas y pueden formularse de acuerdo con las necesidades particulares en término de capacidad de adhesión, retención de humedad o características de envejecimiento.

El cebo empleado en la composición es un producto, el cual suficientemente atractivo para incitar a los insectos tales como hormigas, termitas, avispas, moscas, mosquitos, grillos etc., o cucarachas a comerlo. La capacidad de atracción puede ser manipulada utilizando estimulantes para la alimentación o feromonas sexuales. Los estimulantes para alimentación se escogen, por ejemplo, pero no exclusivamente, de proteínas animales y/o vegetales (tortas de carne, pescado o sangre, partes de insectos, yema de huevo), de grasas y aceites de origen animal y/o vegetal, o de 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. Las feromonas sexuales son conocidas por ser más específicas para los insectos. Las feromonas específicas se describen en la literatura y son conocidos para los experimentados en la técnica.

30

35

40

45

Para uso en las composiciones en cebo, el contenido típico de ingrediente activo va de 0.001% en peso a 15% en peso, deseablemente de 0.01% en peso a 5% en peso de compuesto activo.

La formación de los compuestos de la fórmula I en aerosoles (por ejemplo, en latas para aspersión) aspersiones en aceite o aspersiones con bomba son altamente adecuadas 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, metiletilcetona), hidrocarburos parafínicos (por ejemplo, querosenos) que tengan rangos de ebullición de aproximadamente 50 a 250°C, dimetilformamida, N-metilpirrolidona, dimetilsulfóxido, hidrocarburos aromáticos tales como tolueno, xileno, agua, auxiliares adicionales tales como emulsificantes tales como monooleato de sorbitol, etoxilato de olehilo que tiene de 3 a 7 moles de óxido de etileno, alcoholes grasos etoxilados, aceites perfumados tales como aceites etéreos, ésteres de 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, dimetiléter, dióxido de carbono, oxidonitroso o mezclas de estos gases.

50 Las formulaciones para aspersión oleosas difieren de las recetas en aerosol en que no se utilizan propelentes.

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

Los compuestos de la fórmula I y sus composiciones respectivas también pueden utilizarse en alambres para mosquito y fumigantes, cartuchos de humo, placas vaporizadoras o vaporizadores a largo término y también en papeles para polillas, paños para polillas u otro sistemas vaporizadores independientes del calor.

Los métodos para controlar enfermedades infecciosas trasmitidas por insectos (por ejemplo, malaria, dengue y fiebre amarilla, filariasis linfática y leishmaniasis) con compuesto de la fórmula I y sus composiciones respectivas también comprenden el tratamiento de superficies de refugios y casas, aspersión del aire e impregnación de cortinas, tiendas, artículos de vestimenta, camas, trampas para moscas tse tse o similares. Las composiciones insecticidas para aplicación a fibras, textiles, tejidos, materiales no tejidos, material de redes u hojas y lienzos comprenden preferiblemente una mezcla que incluye el insecticida, opcionalmente un repelente y al menos un aglomerante. Los repelentes adecuados por ejemplo son N,N-dietil-meta-toluamida (DEET) N,N-dietilfenilacetamida (DEPA), 1-(3-ciclohexan-1-il-carbonil)-2-metilpiperine, (2-hidroximetilciclohexil) lactona del ácido acético, 2-etil-1,3hexandiol, indalona, Metilneodecanamida (MNDA), un piretroide no utilizado para el control de insectos tal como {(+/-)-3-allil-2-metil-4-oxociclopent-2-(+)-enil-(+)-trans-crisantemato (Esbiothrin), un repelente derivado de o idéntico a extractos vegetales tales como limoneno, eugenol, (+)-Eucamalol (1), (-)-1-epi-eucamalol o extractos crudos de plantas tales como Eucalyptus maculata, Vitex rotundifolia, Cymbopogan martinii, Cymbopogan citratus (limonaria), Cimpogan nartdus (citronela). 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 dietilenicamente, tales como estireno, y dienos alifáticos, tales como butadieno.

La impregnación de las cortinas y camas se hace general sumergiendo el material textilo en emulsiones o dispersiones del insecticida o asperjándolo sobre las camas. Los compuestos de la fórmula I y sus composiciones pueden utilizarse para proteger materiales de madera tales como árboles, cercas de madera, tablones, etc., y construcciones tales como casas, graneros, 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 las hormigas y las termitas para evitar daños a cultivos o a seres humanos (por ejemplo, cuando las plagas invaden casas e instalaciones públicas). Los compuestos de la fórmula I se aplican no solamente a la superficie circundante del suelo o en el suelo bajo los pisos con el fin de proteger los materiales de madera sino que también pueden aplicarse a artículos recubiertos de madera tales como superficies de concreto bajo el piso, postes de soporte, troncos, aglomerados, muebles, etc., artículos de madera tales como tablaros de partículas, semitablones, etc., y artículos de vinilo tales como alambres eléctricos recubiertos, láminas de vinilo, material aislante del calor tal como espumas de estireno, etc. En caso de aplicación contra hormigas que causan daños a 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.

Tratamiento de Semillas

5

10

15

20

25

30

35

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

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

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

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

El término tratamiento de semillas comprende todas las técnicas de tratamiento de semillas adecuadas conocidas en la técnica, tales como recubrimiento de semillas, cubrimiento de semillas, empolvamiento de semillas, inmersión de semillas y peletización de semillas.

La presente invención también comprende semillas recubiertas con o que contienen el compuesto activo.

- El término "compuesto 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 es (re)plantado, puede absorber el ingrediente activo.
- Una semilla adecuada es semilla de cereales, cultivos de raíz, cultivos oleaginosos, vegetales, especias, ornamentales, por ejemplo, semilla de durum y otros trigos, cebada, avena, centeno, maíz (maíz de forraje y el maíz de azúcar/maíz dulce y maíz de campo), soja, cultivos oleaginosos, crucíferas, algodón, girasoles, plátanos, arroz, colza oleaginosa, colza de nabo, remolacha de azúcar, remolacha de forraje, berenjenas, patatas, pastos, césped, turba, pasto para forraje, tomates, puerros, calabaza/calabacines, repollo, lechuga iceberg, pimientas, cocombros, melones, especias de bracica, melones, judías, guisantes, ajo, cebollas, zanahorias, plantas tuberosas tales como patatas, caña de azúcar, tabaco, uvas, petunias, geranio/pelargonios, margaritas y claveles.

Además, el compuesto activo puede ser utilizado para el tratamiento de semillas a partir de plantas, que toleran la acción de herbicidas fungicidas o insecticidas que obedecen al cruzamiento, incluyendo métodos de ingeniería genética.

- Por ejemplo, el compuesto activo puede emplearse en el tratamiento de semillas de plantas que son resistentes a herbicidas del grupo consistente de sulfonilureas, imidazolinonas, glufocinato-amonio o glifosato-isopropilamonio y sustancias activas análogas (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 de 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 plantas existentes, las cuales pueden ser generadas por ejemplo por métodos de cruzamiento tradicional 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 algodón 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 modificada en ácidos grasos (WO-91/13972).

La aplicación del tratamiento de semillas del compuesto activo se lleva a cabo asperjando o pulverizando las semillas antes de sembrar las plantas y antes de la aparición de las plantas.

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

- 35 A Concentrados solubles (SL, LS)
 - D Emulsiones (EW, EO, ES)
 - 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)
- 40 H Formulaciones en gel (GF)

45

I Polvos pulverizables (DP, DS)

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

En una realización preferida se utiliza una formulación FS para el 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 un solvente, preferiblemente agua.

Formulaciones FS especialmente preferidas de compuestos de la fórmula I para el tratamiento de semillas comprenden usualmente de 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 un humectante y de 0.5 a 15% en peso de un agente dispersante, hasta 20% en peso, por ejemplo, de 5 a 20% en peso 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, por ejemplo de 1 a 40% en peso de un aglomerante (agente de unión/adhesión), opcionalmente hasta 5% en peso, por ejemplo de 0.1 a 5% en peso de un espesante, opcionalmente de 0.1 a 2% en peso de un agente antiespumante, y opcionalmente un conservante tal como un biocida , antioxidante o similares, por ejemplo en una cantidad de 0.01 a 1% en peso y un agente de relleno/vehículo hasta en 100% en peso.

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

Los aglomerantes pueden ser agregados para mejorar la adhesión de los materiales activos sobre las semillas después del tratamiento: Aglomerantes adecuados son homo y copolímeros de óxidos de alquileno tales como óxido de etileno u óxido de polipropileno, polivinilacetato, polivinilalcoholes, polivinilpirrolidonas y copolímeros de los mismos, copolímeros de etileno-acetato de vinilo, homo y copolímeros acrílicos, polietilenamidas, polietilenamidas y polietileniminas, polisacáridos tales como celulosas, tilosa y almidón, homo y copolímeros de poliolefinas tales como copolímeros de olefina/anhídrido maleico, poliuretanos, poliesteres, homo y copolímeros de poliestireno.

Opcionalmente, también pueden incluirse colorantes en la formulación. Colorantes o pigmentos adecuados para formulaciones de tratamiento de semillas son Rodamina B, C.I. Pigmento rojo 112, C.I. Rojo solvente 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 34, pigmento naranja 5, pigmento verde 36, pigmento verde 7, pigmento blanco 6, pigmento marrón 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.

Ejemplos de un agente gelificante es carraginato (Satiagel®)

30 En tratamiento de semillas, las tasas de aplicación de los compuestos I va generalmente de 0.1 g a 10 kg por 100 kg de semilla, 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.

La invención por lo tanto también se relaciona con semillas que comprenden un compuesto de la fórmula I, o una sal de I útilo desde el punto de vista agrícola, tal como se define aquí. La cantidad del compuesto I o la sal útilo desde el punto de vista agrícola del mismo variará en general de 0.1 g a 10 kg por 100 kg de semilla, preferiblemente 1 g a 5 kg por 100 kg de semilla, en particular de 1 g a 1000 g por 100 kg de semilla. Para cultivos específicos tales como lechuga la tasa puede ser más alta.

La presente invención se ilustra ahora en detalles adicionales mediante los siguientes ejemplos.

Ejemplos

15

20

25

35

40 La presente invención se ilustra ahora en detalles adicionales mediante los siguientes ejemplos

Algunos de los ejemplos de compuestos preferidos están caracterizados por sus datos físicos en la siguiente tabla C. La caracterización se realiza mediante cromatografía líquida de alto rendimiento/espectrometría de masas (HPLC/MS), por RMN o por sus puntos de fusión.

Columna de HPLC analítica: columna RP-18 Chromolith Speed ROD de Merck KgaA, Alemania). Elusión: acetonitrilo + 0.1% de ácido trifluoroacético (TFA)/agua + 0.1% de ácido trifluroacético (TFA) en una proporción que va de 5:95 a 95:5 en 5 minutos a 40°C. Alternativamente, los compuestos fueron caracterizados adicionalmente o en vez de ello mediante sus puntos de fusión.

Algunos compuestos fueron caracterizados por ¹H-RMN. Las señales son caracterizadas por el desplazamiento químico (ppm) versus tetrametilsilano, por su multiplicidad y por su integral (número relativo de átomos de hidrógeno

dados). Se utilizan las siguientes abreviaturas para caracterizar la multiplicidad de las se \tilde{n} ales: M =multiplete, q = cuarteto, T =triplete, d = doblete, y s =singlete.

Tabla C:

Compuesto ejemplo	Estructura de compuesto	Punto de fusión Fp[ºC]	HPLC-MS (t _r = tiempo de retención) o ¹ H RMN (en CDCl ₃): δ [ppm]
1.			t _r = 2.16 min, m/z= 295 [M+23]
2.			t _r = 2.31 min, m/z= 305 [M+1]
3.	C' J'		t _r = 2.75 min, m/z= 255 [M+1]
4.	O=S-N		t _r = 2.11 min, m/z= 257 [M+1]
5.			t _r = 2.62 min, m/z= 251 [M+1]
6.			t _r = 2.25 min, m/z= 245 [M+1]

Compuesto ejemplo	Estructura de compuesto	Punto de fusión Fp[°C]	HPLC-MS (t _r = tiempo de retención) o ¹ H RMN (en CDCl ₃): δ [ppm]
7.			t _r = 2.32 min, m/z= 237 [M+1]
8.	CI N		t _r = 2.45 min, m/z= 241 [M+1]
9.	CI NO		t _r = 2.79 min, m/z= 255 [M+1]
10.	C N C		t _r = 3.07 min, m/z= 269 [M+1]
11.	CI NO S		t _r = 2.84 min, m/z= 267 [M+1]
12.	CI N F F		t _r = 3.39 min, m/z= 295 [M+1]
13.	CI NO SIN		t _r = 3.08 min, m/z= 269 [M+1]

Compuesto ejemplo	Estructura de compuesto	Punto de fusión Fp[ºC]	HPLC-MS (t _r = tiempo de retención) o ¹ H RMN (en CDCl ₃): δ [ppm]
14.			t _r = 3.39 min, m/z= 317 [M+1]
15.	C S		t _r = 3.35 min, m/z= 283 [M+1]
16.	CI NO S		tr =3.12 min, m/z= 281 [M+1]
17.	CI NO S		t _r = 3.14 min, m/z= 303 [M+1]
18.	S S S S S S S S S S S S S S S S S S S		t _r = 2.06 min, m/z= 291 [M+1]
19.	CI N F F		t _r = 3.69 min, m/z= 309 [M+1]

Compuesto ejemplo	Estructura de compuesto	Punto de fusión Fp[ºC]	HPLC-MS (t _r = tiempo de retención) o ¹ H RMN (en CDCl ₃): δ [ppm]
20.			t _r = 2.93 min, m/z= 301 [M+1]
21.	S F F		t _r = 3.14 min, m/z= 327 [M+1]
22.	CHANGE OF THE PARTY OF THE PART		t _r = 2.86 min, m/z= 301 [M+1]
23.			t _r = 3.28 min, m/z= 349 [M+1]
24.			t _r = 3.15 min, m/z= 315 [M+1]
25.			t _r = 2.53 min, m/z= 273 [M+1]

Compuesto ejemplo	Estructura de compuesto	Punto de fusión Fp[°C]	HPLC-MS (t _r = tiempo de retención) o ¹ H RMN (en CDCl ₃): δ [ppm]
26.	N F F		t _r = 2.62 min, m/z= 341 [M+1]
27.	F I O		t _r = 2.84 min, m/z= 287 [M+1]
28.	F N F F		t _r = 2.35 min, m/z= 327 [M+1]
29.			t _r = 2.89 min, m/z= 299 [M+1]
30.	S S S S S S S S S S S S S S S S S S S		t _r = 2.79 min, m/z= 287 [M+1]
31.			t _r = 3.16 min, m/z= 335 [M+1]

Compuesto ejemplo	Estructura de compuesto	Punto de fusión Fp[ºC]	HPLC-MS (t _r = tiempo de retención) o ¹ H RMN (en CDCl ₃): δ [ppm]
32.			t _r = 3.12 min, m/z= 313 [M+1]
33.	F F O		¹ H RMN (in CDCl ₃): δ [ppm] = 1.04 (t, 3H),1.20 (t, 3H), 1.89 (m, 1H), 2.10 (m, 1H), 3.41 (m, 1H), 4.22 (m, 1H), 6.68 (t, 1H), 7.19 (t, 1H), 7.57 (t, 1H), 7.75 (d, 1H)
34.			t _r = 3.12 min, m/z= 349 [M+1]
35.			t _r = 2.95 min, m/z= 335 [M+23]
36.	ST.N.		t _r = 2.63 min, m/z= 251 [M+1]
37.			t _r = 2.95 min, m/z= 299 [M+1]

Compuesto ejemplo	Estructura de compuesto	Punto de fusión Fp[°C]	HPLC-MS (t _r = tiempo de retención) o ¹ H RMN (en CDCl ₃): δ [ppm]
38.	J. S.		¹ H RMN (in CDCl ₃): δ [ppm] = 0.50 (m, 1H), 0.61 (m, 1H), 1.02 (m, 2H), 3.30 (s, 3H), 3.92 (s, 3H), 6.79 (d, 1H), 7.48 (m, 2H)
39.			t _r = 2.90 min, m/z= 265 [M+1]
40.			t _r = 3.17 min, m/z= 313 [M+1]
41.			t _r = 3.07 min, m/z= 277 [M+1]
42.	o la		t _r = 2.89 min, m/z= 265 [M+1]
43.			t _r = 3.12 min, m/z= 279 [M+1]

Compuesto ejemplo	Estructura de compuesto	Punto de fusión Fp[°C]	HPLC-MS (t _r = tiempo de retención) o ¹ H RMN (en CDCI ₃): δ [ppm]
44.	S N O		t _r = 2.49 min, m/z= 303 [M+1]
45.	F F Q		t _r = 2.74 min, m/z= 317 [M+1]
46.	F S CI		t _r = 3.03 min, m/z= 370 [M+1]
47.	S C C C C C C C C C C C C C C C C C C C		t _r = 3.26 min, m/z= 384 [M+1]
48.	CI NO.		t _r = 2.39 min, m/z= 271 [M+1]
49.	S F F F	141-143°C	

Compuesto ejemplo	Estructura de compuesto	Punto de fusión Fp[°C]	HPLC-MS (t _r = tiempo de retención) o ¹ H RMN (en CDCl ₃): δ [ppm]
50.	F S		t _r = 2.97 min, m/z= 301 [M+1]
51.	CI NO		t _r = 3.06 min, m/z= 271 [M+1]
52.	CI NO FF		t _r = 3.35 min, m/z= 325 [M+1]
53.	CI N N		t _r = 2.95 min, m/z= 284 [M+1]
54.	CI NO		t _r = 2.34 min, m/z= 270 [M+1]
55.	CI NO F		t _r = 3.17 min, m/z= 368 [M+1]

Compuesto ejemplo	Estructura de compuesto	Punto de fusión Fp[°C]	HPLC-MS (t _r = tiempo de retención) o ¹ H RMN (en CDCl ₃): δ [ppm]
56.	CI N N F		t _r = 2.97 min, m/z= 354 [M+1]
57.	o Control of the cont		t _r = 2.88 min, m/z= 334 [M+1]
58.	Color Services		t _r = 2.97 min, m/z= 338 [M+1]
59.	CI NO S		t _r = 3.23 min, m/z= 352 [M+1]
60.	F F S		t _r = 3.23 min, m/z= 382 [M+1]

Compuesto ejemplo	Estructura de compuesto	Punto de fusión Fp[ºC]	HPLC-MS (t _r = tiempo de retención) o ¹ H RMN (en CDCl ₃): δ [ppm]
61.	F F O		t _r = 3.31 min, m/z= 386 [M+1]
62.	CI		t _r = 3.11 min, m/z= 348 [M+1]
63.	F F O O		t _r = 2.49 min, m/z= 303 [M+1]
64.	F F O O		t _r = 2.74 min, m/z= 317 [M+1]
65.	F Z Z Z Z		t _r = 3.66 min, m/z= 504 [M+1]

Compuesto ejemplo	Estructura de compuesto	Punto de fusión Fp[°C]	HPLC-MS (t _r = tiempo de retención) o ¹ H RMN (en CDCl ₃): δ [ppm]
66.	F F CI		t _r = 3.83 min, m/z= 518 [M+1]
67.	F F O CI		t _r = 3.03 min, m/z= 370 [M+1]
68.	F F O CI		t _r = 3.24 min, m/z= 384 [M+1]
69.	F N CI	117-120	
70.	F P P P P P P P P P P P P P P P P P P P		t _r = 3.87 min, m/z= 482 [M+1]

Compuesto ejemplo	Estructura de compuesto	Punto de fusión Fp[ºC]	HPLC-MS (t _r = tiempo de retención) o ¹ H RMN (en CDCl ₃): δ [ppm]
71.	CI NO O		t _r = 2.39 min, m/z= 271 [M+1]
72.	F F F F	141-143	
73.	Br N CI		t _r = 3.42 min, m/z= 516 [M+1]
74.	F F O O S N		t _r = 2.97 min, m/z= 301 [M+1]
75.	Br N N N N N N N N N N N N N N N N N N N		¹ H RMN (in CDCl ₃): δ [ppm] = 3.32 (s, 3H), 3.93 (s, 3H), 5.51 (s, 1H), 6.78 (d, 1H), 7.40 (m, 1H), 7.49 (m, 2H), 7.89 (d, 1H), 8.48 (d, 1H)

Compuesto ejemplo	Estructura de compuesto	Punto de fusión Fp[ºC]	HPLC-MS (t _r = tiempo de retención) o ¹ H RMN (en CDCl ₃): δ [ppm]
76.	CI NO		t _r = 2.88 min, m/z= 334 [M+1]
77.	CI NO		t _r = 2.97min, m/z= 338 [M+1]
78.	CI NO S		t _r = 3.23 min, m/z= 352 [M+1]
79.	F F S S		t _r = 3.23 min, m/z= 382 [M+1]

Compuesto ejemplo	Estructura de compuesto	Punto de fusión Fp[ºC]	HPLC-MS (t _r = tiempo de retención) o ¹ H RMN (en CDCl ₃): δ [ppm]
80.	F F N O		t _r = 3.31 min, m/z= 386 [M+1]
81.			t _r = 3.11 min, m/z= 348 [M+1]
82.	F F O N O N O N O N O N O N O N O N O N		t _r = 3.00 min, m/z= 368 [M+1]
83.	F F O		t _r = 3.07 min, m/z= 372 [M+1]
84.	F F N O O		t _r = 3.31 min, m/z= 372 [M+1]

Ejemplos de síntesis

5

10

40

50

S.3 N-Etil-N-(4-metoxi-benzo[d]isotiazol-3-il)-acetamida [Compuesto de ejemplo 5 (de la tabla C)]

- Etapa 1: 7.0 g (42 mmol) de 4-Metoxi-benzo[d]isotiazol [Drug. Res. 30(II), 11 (1980),1831-1838] se disolvieron en 150 ml de metilglicol y se agregaron 4.5 g (85 mmol) de metilato de sodio a temperatura ambiente. La mezcla se calentó a 80°C durante 4 horas, luego se agregaron 2.4 g (42 mmol) adicionales de metilato de sodio y la mezcla se agitó durante 1 hora. Después de 2 horas y de nuevo después de 4 horas adicionales se agregó 2.4 g (42 mmol) de metilato de sodio. La mezcla fue agitada durante la noche a temperatura ambiente. La sal de sodio resultante se utilizó sin purificación adicional. Se agregaron 82 g (1.3 mmo) de etilamina acuosa (70%) a la mezcla de reacción, la solución se enfrió a 0-5°C y se agregaron 40 g de hipoclorito de sodio acuoso al 12% gota a gota durante 20 minutos. La mezcla se agitó durante 1 hora a esta temperatura, luego se agregó agua y el producto fue extraído con acetato de etilo. La capa orgánica fue secada sobre sulfato de sodio, el solvente fue eliminado por destilación y el residuo fue purificado sobre sílica (eluyente: ciclohexanos/acetato de etilo) para producir 5.7 g (27 mmol) de Etil-(4-metoxi-benzo[d]isotiazol-3-il)-amina [¹H RMN (in CDCl₃): δ [ppm] = 1.32 (t, 3H), 3.58 (q, 2H), 3.98 (s, 3H), 6.28 (bs, 1H). 6.62 (d, 1H), 7.30 (m, 2H)].
- Etapa 2: Se disolvieron 0.5 g (2.4 mmol) de Etil-(4-metoxi-benzo[d]isotiazol-3-il)-amina en 20 ml de acetonitrilo a temperatura ambiente. Se agregaron 0.76 g (9.6 mmol) de piridina junto con una cantidad catalítica de dimetilaminopiridina, seguida por 0.58 g (7.2 mmol) de cloruro de acetilo. La agitación a temperatura ambiente continuó durante la noche. Se agregó agua y el producto fue extraído con diclorometano. La capa orgánica fue lavada con HCl acuoso (10%), hidrógeno carbonato de sodio saturado y agua. La capa orgánica fue secada sobre sulfato de sodio. El solvente fue retirado por destilación y el residuo fue purificado sobre sílica (eluyente: ciclohexano/acetato de etilo) para producir 0.47 g (1.88 mmol) del ejemplo de compuesto 5 (de la tabla C)
 - S.4 N-(4-Difluorometoxi-benzo[d]isotiazol-3-il)-N-etil-2,2,2-trifluoro-acetamida [Compuesto de ejemplo 26 (de la tabla C)]
- Etapa 1: Una mezcla de 40 ml de HCl concentrado, 20 mL de agua y 20 mL de metanol fue enfriada a 0-5°C. Se agregó 10 g (37 mmol) de cloruro de 2-Ciano-3-difluorometoxi-benzenesulfonilo [WO 2006/56433] a la solución en agitación seguida por 12.2 g (0.19 mol) de polvo de zinc en porciones pequeñas. La agitación se continuó a temperatura ambiente durante 2 horas. Se agregaron agua y acetato de etilo y la capa orgánica fue secada sobre sulfato de sodio. El solvente fue eliminado por destilación y el residuo fue purificado sobre sílica (eluyente: tolueno/acetona) para producir 2.62 g (12 mmol) de 2-Difluorometoxi-6-mercapto-benzamida.
- Etapa 2: Se disolvieron 2.1 g (9.6 mmol) de 2-Difluorometoxi-6-mercapto-benzamida en 90 ml de metanol. Se agregó una solución de 0.76 g de hidróxido de potasio (85%) en 90 ml de agua. Se disolvieron 1.6 g de ácido hidroxilamin-O-sulfónico y 1.26 g de hidróxido de potasio (85%) en 90 ml de agua y la solución se agregó gota a gota a la mezcla de reacción a 0°C. La agitación se continuó a 0°C durante 3 horas. La mezcla de reacción se extrajo 3 veces con diclorometano. La capa acuosa fue acidificada con HCl acuoso al (10%) y el producto fue extraído con diclorometano. La capa orgánica fue secada sobre sulfato de sodio. La evaporación del solvente dio 1.2 g (4.4 mmol) de 4-Difluorometoxi-benzo[d]isotiazol-3-ona (m.p. 176-177 °C).
 - Etapa 3: Se disolvieron 3.1 g (14 mmol) de Difluorometoxi-benzo[d]isotiazol-3-ona en 100 ml de diclorometano a temperatura ambiente. Se agregaron 1.13 g (14 mmol) de piridina. Se agregó gota a gota 4.0 g (14 mmol) de anhídrido trifluorometano sulfónico. La agitación a temperatura ambiente continuó durante 2 horas. Se agregó agua y el producto fue extraído con diclorometano. La capa orgánica fue lavada con HCl acuoso (10%) y agua. La capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio. El solvente fue eliminado por destilación para producir 4.3 g de ácido trifluorometano sulfónico 4-difluorometoxi-benzo[d]isotiazol-3-il éster el cual fue utilizado para la siguiente etapa sin purificación adicional.
- Etapa 4: Se disolvieron 0.5 g (1.4 mmol) de 4-difluorometoxi-benzo[d]isotiazol-3-il éster en 20 ml de tetrahidrofurano y se agregaron 0.23 g de éter y etilamina. La solución fue tratada durante 5 minutos con etilamina gaseosa y se agitó a temperatura ambiente durante 30 minutos adicionales. Se agregó agua y el producto fue extraído con acetato de etilo.
 - La capa orgánica fue lavada con carbonato de potasio acuoso (5%) y agua. La capa orgánica fue secada sobre sulfato de sodio. El solvente fue eliminado por destilación y el residuo fue purificado sobre sílica (eluyente: ciclohexano/acetato de etilo) para producir 0.14 g (0.46 mmol) (4-difluorometoxibenzo[d]isotiazol-3-il)-etil-amina.
 - Etapa 5: Se disolvieron 0.8 g (3.4 mmol) de (4-Difluorometoxi-benzo[d]isotiazol-3-il)-etil-amina en 50 ml de acetonitrilo a temperatura ambiente. Se agregaron 1.1 g (13.4 mmol) de piridina junto con una cantidad catalítica de dimetilamino piridina. Se agregó una solución de 0.72 g (3.4 mmol) de anhídrido trifluoroacético en 20 ml de acetonitrilo gota a gota. La agitación a temperatura ambiente se continuó durante 4 horas. Se agrego agua y el

producto fue extraído con acetato de etilo. La capa orgánica fue lavada con HCl acuoso (10%) y agua. La capa orgánica fue secada sobre sulfato de sodio. El solvente fue eliminado por destilación y el residuo que fue purificado por tratamiento con metilo tert-butiléter para producir 0.35 g (1.03 mmol) del ejemplo de compuesto 26 (de la tabla C).

5 B. Ejemplos biológicos de la acción contra plagas

Si no se describe otra cosa, los compuestos activos fueron formulados en un mezcla de 50% volumen – acetona: 50% volumen-agua. Se incluyó un surfactante no iónico (Kinetic®) en la solución a un volumen de 0.01% v/v.

En las siguientes pruebas, las soluciones formuladas de los compuestos activos se diluyeron hasta una concentración de ingrediente activo de 300 ppm y las soluciones diluidas fueron aplicadas en las pruebas mencionadas a continuación.

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

B.1 Áfido del algodón (Aphis gossypii)

10

15

40

Las plantas de algodón en la etapa de cotiledón fueron infestadas antes del tratamiento colocando una hoja completamente infestada de la principal colonia de áfidos sobre la parte superior de cada cotiledón. Se permitió que los áfidos se transfirieran durante la noche y la hoja huésped fue retirada. Los cotiledones infectados fueron entonces sumergidos y agitados en la solución de prueba durante 3 segundos y se dejaron secar en una cabina de extracción. Las plantas de prueba fueron mantenidas bajo iluminación fluorescente en un fotoperiodo de 24 horas a 25°C y 20-40% de humedad relativa. La mortalidad de los áfidos sobre las plantas tratadas, con respecto a la mortalidad sobre plantas de verificación no tratadas, se determinó después de 5 días.

20 En esta prueba los compuestos de ejemplo 1-25, 27-48, 63-65-68, 70, 71, 72, 73, 75, 76-81, 82, 83, 84, 85 suministraron a 300 ppm al menos 89% de mortalidad del áfido del algodón (Aphis gossypii, etapas de vida mixtas) en comparación con controles no tratados.

B.2 Áfido de melocotón verde (Myzus persicae)

Plantas de pimiento en la primera etapa de hoja verdadera fueron infestadas antes del tratamiento colocando hojas completamente infestadas de la colonia principal de áfidos sobre la parte superior de las plantas en tratamiento. Se permitió que los áfidos se transfirieran durante la noche para lograr una infestación 30-40 áfidos por planta y se retiraron las hojas huésped. Las hojas infestadas de las plantas de prueba fueron sumergidas entonces y agitadas en la solución de prueba durante 3 segundos y se dejaron secar en una cabina de extracción. Estas plantas fueron mantenidas bajo iluminación fluorescente en un fotoperíodo de 24 horas a 25°C y 20-40% de humedad relativa. La mortalidad sobre las plantas tratadas, con respecto a la mortalidad sobre las plantas de verificación no tratadas, fue determinada después de 5 días.

En esta prueba los compuestos de ejemplos 1-19, 25, 27-43, 44, 48, 63, 64, 67, 68, 71, 72, 76-78, 79-81 y 85 proporcionaros a 300 ppm al menos 89% mortalidad del áfido de melocotón verde en comparación con controles no tratados.

35 B.3 Áfido de fríjol de maíz (aphis craccivora)

El compuesto activo se disuelve a la concentración deseada en una mezcla 1:1 (volumen:volumen) de agua destilada: acetona. La solución de prueba se prepara en el día de uso.

Las plantas de fríjol de maíz en macetas colonizadas con aproximadamente 100 - 150 áfidos de diversas etapas fueron asperjadas después de que la población de la plaga había sido registrada. La reducción de la población fue establacida después de 24, 72 y 120 horas.

En esta prueba, los compuestos 63, 64, 76, 67, 71, 72, 75, 76-81, 82, 83, 84 y 85 a 300 ppm, mostraron por encima de 89% de mortalidad en comparación con controles no tratados.

B.4 Gusano soldado del Sur (Spodoptera eridania), segunda etapa larval

Los compuestos activos fueron formulados en acetona: agua 50:50 (volumen) y surfactante Kinetica™ a 100 ppm.

Un par de primeras hojas verdaderas de la judía Sieva lima fue sumergido en la solución de prueba y se dejó secar. Las hojas fueron colocadas entonces en una bolsa de cierre de cremallera plástica perforada y se agregaron entonces las larvas en segundo estado larval. A los 4 días, se hicieron observaciones de mortalidad y alimentación reducida.

5 B.5 Polilla de diamante negro (plutella xylostella)

10

El compuesto activo se disuelve a la concentración deseada en una mezcla de agua destilada: acetona 1:1 (volumen:volumen). La solución de prueba se prepara en el día del uso.

Hojas de repollo china fueron sumergidas en una solución de prueba y se secaron al aire. Las hojas de repollo tratadas fueron colocadas en caja de petri recubiertas con papel de filtro húmedo y se agregaron larvas de tercera etapa. Se registró la mortalidad 24, 72 y 120 horas después del tratamiento.

En esta prueba, el compuesto 82 a 300 ppm mostró por encima de 89% de mortalidad en comparación con controles no tratados.

REIVINDICACIONES

1. 3-amino-1,2-bencisotiazol compuestos de la fórmula I

$$R^2$$
 R^3
 R^4
 R^4

en donde

5 n es 0,1 o 2;

A esA3:

10

15

20

25

30

35

 R^9 se selecciona de C_1 - C_6 -alcoxi, C_1 - C_{10} -alquilo, C_2 - C_{10} -alquenilo, C_2 - C_{10} -alquinilo, C_3 - C_{10} -cicloalquilo, en donde los radicales alifáticos pueden ser no sustituidos, parcial o completamente halogenados y/o pueden portar uno o más radicales, seleccionados independientemente uno de otro del grupo consistente de CN, NO_2 , C_1 - C_{10} -alquilo, C_1 - C_{10} -haloalquilo C_3 - C_{10} -cicloalquilo y fenilo, siendo posible que el fenilo sea no sustituido, parcial o completamente halogenado y/o porte uno o más sustituyentes, seleccionados independientemente uno de otro del grupo consistente de C_1 - C_4 -haloalquilo, C_1 - C_4 -haloalcoxi, C_1 - C_4 -haloalquiltio, C_1 - C_4 -haloalquilo, C_1 - C_4 -h

R¹⁰ se selecciona de sustituyentes tal como se define para R¹² más abajo:

 R^{12} se selecciona de OR^d , NR^aR^b , C_1 - C_{10} -alquilo, C_2 - C_{10} -alquenilo, C_2 - C_{10} -alquinilo, C_3 - C_{10} -cicloalquilo, fenilo, naftilo y grupos heterocílicos de 5 a 7 miembros, saturado, parcial o completamente saturado o aromático que contiene 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados de O, CO, S, SO_2 , N, NH o N- C_1 - C_6 -alquilo, en donde los átomos de carbono de todos los radicales mencionados y los miembros de anillo de los anillos heterocíclicos pueden ser no sustituidos, parcial o completamente halogenados y/o pueden portar uno o más radicales, seleccionado independientemente uno de otro del grupo consistente de CN, OH, NO_2 , NH_2 , C_1 - C_{10} -alquilo, C_1 - C_{10} -haloalquilo, C_1 - C_{10} -alquilsulfinilo, C_1 - C_{10} -alquilsulfonilo, C_1 - C_{10} -haloalquiltio, C_1 - C_{10} -alquilsulfinilo, C_1 - C_{10} -alquilsulfonilo, C_1 - C_{10} -haloalquiltio, C_1 - C_{10} -alquil)amino, di- $(C_1$ - C_{10} -alquil)amino, C_3 - C_{10} -cicloalquilo, fenilo, anillos heteroaromáticos de 5 o 6 miembros y sistemas de anillo heterobicíclicos fusionados aromáticos de 8, 9 10 miembros que contienen 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados de O, CO, S, SO_2 , N, NH o N- C_1 - C_6 -alquilo, siendo posible para cada uno de los anillos aromáticos o heteroaromáticos ser no sustituidos, parcial o completamente halogenados y/o porte uno o más sustituyentes, seleccionados independientemente uno de otro del grupo consistente de C_1 - C_{10} -alquilo, C_1 - C_{10} -haloalquilo, C_1 - C_{10} -haloalquilo, C_1 - C_{10} -haloalquilio, C_1 - C_{10} -ha

- R¹ se selecciona de CN, NO₂, NH₂, azido, halógeno, sulfonilamino, sulfenilamino, sulfinilamino, C(=O)Rc, C₁-C₁₀-alquilo, C₂-C₁₀-alquenilo, C₂-C₁₀-alquinilo, C₃-C₁₀-cicloalquilo, C₁-C₁₀-alcoxi, C₁-C₁₀-alquiltio, (C₁-C₁₀-alquil) amino, di(C₁-C₁₀-alquil)amino, C₁-C₁₀-alquilsulfinilo, C₁-C₁₀-alquilsulfenilo y C₁-C₁₀-alquilsulfonilo, en donde los átomos de carbono del C₃-C₁₀-cicloalquilo y y los radicales alifáticos mencionados pueden ser no sustituidos, parcial o completamente halogenados y/o pueden portar uno o más radicales, seleccionados del grupo consistente de CN, NO₂, NH₂, C₁-C₁₀-alcoxi, C₁-C₁₀-alquiltio, C₁-C₁₀-alquilsulfinilo, C₁-C₁₀-alquilsulfonilo, C₁-C₁₀-haloalcoxi, C₁-C₁₀-haloalquiltio, (C₁-C₁₀-alquil)amino, di(C₁-C₁₀-alquil)amino, C3-C8-cicloalquilo y fenilo, siendo posible que el fenilo sea no sustituido, parcial o completamente halogenado y/o porte uno o más sustituyentes, seleccionados independientemente uno de otro del grupo consistente de C₁-C₁₀-alquilo, C₁-C₁₀-haloalquilo, C₁-C₁₀-haloalquilo, C₁-C₁₀-haloalquilo, C₁-C₁₀-haloalquilo, C₁-C₁₀-haloalcoxi;
 - R^2 , R^3 y R^4 son seleccionados independientemente uno de otro de hidrógeno, halógeno, azido, CORc, CN, NO₂, NH₂, C₁-C₁₀-alquilo, C₃-C₁₀-cicloalquilo, C₁-C₁₀-haloalquilo, C₁-C₁₀-alcoxi, C₁-C₁₀-alquiltio, C₁-C₁₀-alquilsulfinilo, C₁-C₁₀-alquilsulfonilo, C₁-C₁₀-haloalquiltio, C₂-C₁₀-alquenilo, C₂-C₁₀-alquinilo, (C₁-C₁₀-alquil) amino, di(C₁-C₁₀-alquil) amino, sulfonilamino, sulfonilamino, sulfonilamino;
- 15 y en donde

5

10

- R^a y R^b se seleccionan uno independientemente del otro del grupo consistente de, C_1 - C_{10} -alquilo, C_3 - C_{10} -cicloalquilo, C_2 - C_{10} -alquinilo, arilo y aromático, anillos heterocíclicos saturados, parcial o completamente insaturados, y en donde los átomos de carbono de todos los radicales mencionados pueden ser no sustituidos o parcial o completamente sustituidos con halógeno o C_1 - C_{10} -alquil;
- Rc se selecciona del grupo consistente de NH₂, C₁-C₁₀-alquilo,C₁-C₁₀-alcoxi, C₁-C₁₀-alquilamino, di(C₁-C₁₀-alquil) amino, arilo y un anillo heterocíclico de 3 a 7 miembros saturado, parcialmente insaturado o aromático, el cual puede contener como miembros de anillo 1, 2 o 3 heteroátomos no sustitutidos o sustituidos seleccionados del grupo consistente de O, S, SO, SO₂, N, NH y N-C₁-C₆-alquilo, y en donde los átomos de carbono de todos los radicales mencionados pueden ser no sustituidos o parcial o completamente sustituidos con halógeno o C₁-C₁₀-alquil;
- Rd se selecciona del grupo consistente de hidrógeno, C₁-C₁₀-alquilo, C₃-C₁₀-cicloalquilo, C₂-C₁₀-alquenilo, C₂-C₁₀-alquenilo, c₂-C₁₀-alquenilo, arilo y aromático, anillos heterocíclicos saturados, parcial o completamente insaturados;
 - o los enantiómeros, diastereómeros o sales de los mismos.
 - 2. Compuestos de 3-amino-1,2-bencisotiazol de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde n es 1.
 - 3. Compuestos de 3-amino-1,2-bencisotiazol de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde n es 0.
- 30 4. Compuestos de 3-amino-1,2-bencisotiazol de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde
 - R¹ se selecciona de halógeno, C₁-C₁₀-alquilo, C₁-C₁₀-haloalquilo, C₁-C₁₀-alcoxi y C₁-C₁₀-haloalcoxi.
 - 5. Compuestos de 3-amino-1,2-bencisotiazol de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde
 - R¹ se selecciona de halógeno, C₁-C₁₀-alcoxi y C₁-C₁₀-haloalcoxi.
 - 6. Compuestos de 3-amino-1,2-bencisotiazol de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde
- R¹ se selecciona de fluoro, cloro, difluorometoxi, diclorometoxi, trifluorometoxi o triclorometoxi.
 - 7. Compuestos de 3-amino-1,2-bencisotiazol de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde
 - R², R³ y R⁴ son seleccionados independientemente uno de otro del grupo consistente de hidrógeno y F, Cl, Br o I.
 - 8. Compuestos de 3-amino-1,2-bencisotiazol de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde
 - R², R³ y R⁴ are independently from one another selected from hidrógeno o fluoro.
- 9. Compuestos de 3-amino-1,2-bencisotiazol de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde
 R², R³ y R⁴ son hidrógeno.

10. Compuestos de 3-amino-1,2-bencisotiazol de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde,

R⁹ es C₁-C₆-alquil

5

10

15

25

30

y R^{10} se selecciona de OR^d , NR^aR^b , C_1 - C_{10} -alquilo, C_2 - C_{10} -alquenilo, C_2 - C_{10} -alquinilo, , C_3 - C_{10} -cicloalquilo y fenilo, en donde los radicales pueden ser no sustituidos, parcial o completamente halogenados y/o pueden portar uno o más radicales, seleccionado independientemente uno de otro del grupo consistente de CN, NO_2 , NH_2 , C_1 - C_{10} -alcoxi, C_1 - C_{10} -alquiltio, C_1 - C_{10} -alquilsulfinilo, C_1 - C_{10} -alquilsulfonilo, C_1 - C_{10} -haloalcoxi, C_1 - C_{10} -haloalquiltio, C_1 - C_{10} -alquil)amino, C_3 - C_1 0-cicloalquilo y fenilo, siendo posible que el fenilo sea no sustituido, parcial o completamente halogenado y/o porte uno o más sustituyentes, seleccionados independientemente uno de otro del grupo consistente de C_1 - C_{10} -alquilo, C_1 - C_{10} -haloalquilo, C_1 - C_{10} -alcoxi y C_1 - C_{10} -haloalcoxi.

11. Compuestos de 3-amino-1,2-bencisotiazol de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde

R¹ se selecciona de halógeno, C₁-C₆-alcoxi o C₁-C₆-haloalcoxi y

R², R³ y R⁴ son seleccionados independientemente uno de otro del grupo consistente de hidrógeno, F, Cl, Br o I.

12. Compuestos de 3-amino-1,2-bencisotiazol de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde

R¹ se selecciona de halógeno, C₁-C₆-alcoxi o C₁-C₆-haloalcoxi y

R², R³ y R⁴ son hidrógeno.

13. Compuestos de 3-amino-1,2-bencisotiazol de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde,

R¹ se selecciona de C₁-C₆-alcoxi o C₁-C₆-haloalcoxi;

R², R³ y R⁴ son seleccionados independientemente uno de otro del grupo consistente de hidrógeno, F, Cl, Br o I; y

20 R⁹ es C₁-C₆-alquilo y

 R^{10} se selecciona deC_1 - C_{10} -alquilo, C_2 - C_{10} -alquenilo, C_2 - C_{10} -alquinilo, C_1 - C_{10} -alcoxi y C_3 - C_{10} -cicloalquilo, en donde los átomos de carbono de todos los radicales mencionados pueden ser no sustitutidos, parcial o completamente halogenados y/o pueden portar uno o más radicales, seleccionado independientemente uno de otro del grupo consistente de CN, NO_2 , NH_2 , C_1 - C_{10} -alcoxi, C_1 - C_{10} -alquiltio, C_1 - C_{10} -alquilsulfinilo, C_1 - C_{10} -alquilsulfonilo, C_1 - C_{10} -haloalquiltio, C_1 - C_{10} -alcoxicarbonilo, $(C_1$ - C_{10} -alquil)amino, di- $(C_1$ - C_{10} -alquil)amino, C_3 - C_{10} -cicloalquilo, fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, siendo posible que cada anillo sea no sustituido, parcial o completamente halogenados y/o porte uno o más sustituyentes, seleccionados independientemente uno de otro del grupo consistente de CN, NO_2 , NH_2 , C_1 - C_{10} -alquilo, C_1 - C_{10} -alquilo, C_1 - C_{10} -alquilo, C_1 - C_{10} -alquilo, C_2 - C_{10} -haloalquenilo, C_2 - C_{10} -haloalquenilo, C_1 - C_{10} -alquiltio, C_1 - C_{10} -alquilsulfinilo, C_1 - C_{10} -alquilsulfinilo, C_1 - C_{10} -alquilsulfinilo, C_1 - C_{10} -alquilsulfinilo, C_1 - C_{10} -alquillyamino, di- C_1 - C_1 -alquillyamino, di- C_1 - C_1 -alquillyamino, C_1 - C_1 -alquillyamino,

- 14. Compuestos de 3-amino-1,2-bencisotiazol de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, en donde cuando n es 0,
- R¹ se selecciona de C₁-C₆-alcoxi o C₁-C₆-haloalcoxi;

R², R³ y R⁴ son hidrógeno

R9 es C1-C6-alquilo

y R¹⁰ se selecciona de C₁-C₆-alquilo , C₃-C₆-cicloalquilo o fenilo, en donde los átomos de carbono o el anillo carbocíclico de los radicales pueden ser no sustituidos, parcial o completamente halogenados y/o pueden portar uno o más sustituyentes, seleccionados independientemente uno de otro del grupo consistente de CN, NO₂, NH₂, C₁-C₁₀-alquilo, C₁-C₁₀-haloalquilo, C₁-C₁₀-haloalquilo, C₁-C₁₀-haloalquilo, C₂-C₁₀-haloalquilo, C₂-C₁₀-haloalquilo, C₁-C₁₀-haloalquiltio, C₁-C₁₀-alquilsulfinilo, C₁-C₁₀-alquilsulfinilo, C₁-C₁₀-haloalquiltio.

- 15. Una composición que comprende al menos un compuesto de 3-amino-1,2-bencisotiazol de la fórmula I de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 14, o el enantiómero, diastereómero o sal del mismo y al menos un vehículo líquido y/o sólido inerte.
- 16. Una composición agrícola que comprende tal cantidad efectiva como pesticida de al menos un compuesto de 3-amino-1,2-bencisotiazol de la fórmula I de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 14 o el enantiómero, diastereómero o sal útilo desde el punto de vista agrícolamente de los mismos, y al menos un vehículo líquido y/o sólido inerte aceptabla desde el punto de vista agrícolamente y, si se desea, al menos un surfactante.

5

10

15

- 17. Un método para combatir o controlar insectos, arácnidos o nemátodos que comprende poner en contacto un insecto, arácnido o nemátodos o su fuente de alimentación, hábitat o terrenos de crianza con una cantidad efectiva como pesticida de al menos un compuesto de 3-amino-1,2-bencisotiazol de la fórmula I de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 14 o los enantiómeros, diastereómeros o sales de los mismos o una composición que comprende al menos un compuesto de la fórmula I.
 - 18. Un método para proteger plantas en crecimiento del ataque o infestación por parte de insectos, arácnidos o nemátodos que comprende poner en contacto una planta, o suelo o agua en el cual está creciendo la planta, con una cantidad efectiva como pesticida de al menos un compuesto de 3-amino-1,2-bencisotiazol de la fórmula I de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 14 o los enantiómeros, diastereómeros o sus sales del mismo o una composición que comprende al menos un tal compuesto de la fórmula I.
 - 19. Un método como se define en las reivindicaciones 17 o 18, donde la plaga animal es del orden Homóptera o Tisanóptera.
- 20. Un método para la protección de semillas frente a insectos del suelo y de las raíces y brotes de las semillas frente a insectos del suelo y foliares que comprende poner en contacto las semillas antes de la siembra y/o después de la pregerminación con al menos un compuesto de 3-amino-1,2-bencisotiazol de la fórmula I de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 14 o los enantiómeros, diastereómeros o sales del mismo o una composición que comprende al menos un tal compuesto de la fórmula I.
- 25. El método de acuerdo con la reivindicación 20, donde el compuesto de 3-amino-1,2-bencisotiazol de la fórmula I se aplica en una cantidad que va de 100 mg a 10 kg por 100 kg de semillas.
 - 22. Un método de acuerdo con la reivindicación 20, donde las raíces y brotes resultantes de las plantas son protegidos.
- 23. Un método de acuerdo con la reivindicación 20, donde los brotes resultantes de las plantas son protegidos frente
 30 a áfidos.
 - 24. Semilla que comprende un compuesto 3-amino-1,2-bencisotiazol de la fórmula I o una sal útilo desde el punto de vista agrícola de I, tal como se define en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 14, en una cantidad que va de 0.1 g a 10 kg por 100 kg de semilla.