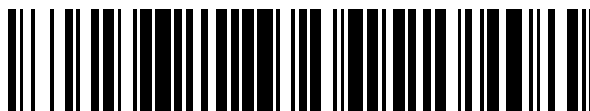


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 398 520**

51 Int. Cl.:

C07D 413/10 (2006.01)

A61K 31/42 (2006.01)

A01N 43/80 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **15.12.2006 E 11004187 (8)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **21.11.2012 EP 2360157**

54 Título: **5-Aril-isoxazolininas para controlar plagas de invertebrados**

30 Prioridad:

16.12.2005 US 751226 P

21.12.2005 US 752511 P

03.10.2006 US 849037 P

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:

19.03.2013

73 Titular/es:

**E. I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY
(100.0%)
1007 Market Street
Wilmington, DE 19898, US**

72 Inventor/es:

**LAHM, GEORGE PHILIP;
PAHUTSKI, THOMAS FRANCIS JR.;
LONG, JEFFREY, KEITH;
PATEL, KANU MAGANBHAI y
SMITH, BENJAMIN KENNETH**

74 Agente/Representante:

DE ELZABURU MÁRQUEZ, Alberto

ES 2 398 520 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

5-Aril-isoxazolininas para controlar plagas de invertebrados

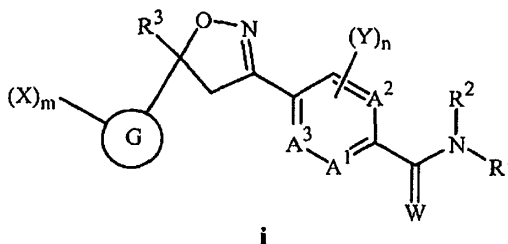
Campo de la invención

Esta invención se refiere a ciertas isoxazolininas, sus N-óxidos, sales y composiciones adecuadas para usos agronómicos y no agronómicos, que incluyen aquellos usos enumerados posteriormente, y métodos de su uso para controlar plagas de invertebrados tales como artrópodos en entornos tanto agronómicos como no agronómicos.

Fundamento de la invención

El control de plagas de invertebrados es extremadamente importante para conseguir una alta eficacia en los cultivos. El daño ocasionado por las plagas de invertebrados en los cultivos agronómicos en crecimiento y almacenados puede provocar una reducción significativa en la productividad y, por lo tanto, dar por resultado un aumento de costes para el consumidor. También es importante el control de plagas de invertebrados en silvicultura, cultivos de invernaderos, plantas ornamentales, cultivos de viveros, productos de fibra y alimentarios almacenados, en ganadería, en artículos domésticos, césped, productos de la madera y en salud pública y animal. Muchos productos están disponibles comercialmente para estos fines, pero sigue existiendo la necesidad de nuevos compuestos que sean más eficaces, menos costosos, menos tóxicos, más seguros desde el punto de vista medioambiental o que tengan diferentes modos de acción.

La publicación de patente PCT WO 05/085216 describe derivados de isoxazolinina de Fórmula i como insecticidas

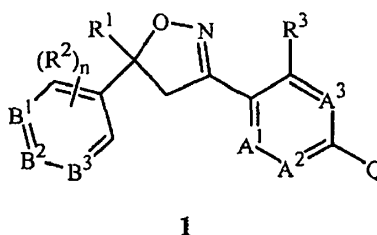


en donde, entre otros, cada uno de A¹, A² y A³ son independientemente C o N; G es un anillo de benceno; W es O o S; y X es halógeno o haloalquilo C₁-C₆.

El documento US 2005/250822 describe compuestos de benzanilida sustituidos para usar como pesticidas.

Compendio de la invención

Esta invención está dirigida a compuestos de Fórmula 1 que incluyen todos los isómeros geométricos y estereoisómeros, N-óxidos y sales de los mismos, y composiciones que los contienen y su uso para controlar plagas de invertebrados:



en donde:

A¹, A² y A³ se seleccionan independientemente del grupo que consiste en CR³ y N;

B¹, B² y B³ se seleccionan independientemente del grupo que consiste en CR² y N;

R¹ es alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquilocicloalquilo C₄-C₇ o cicloalquilalquilo C₄-C₇, cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de R⁶;

cada R² es independientemente H, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆ tio, haloalquil C₁-C₆ tio, alquil C₁-C₆ sulfonilo, haloalquil C₁-C₆ sulfonilo, alquil C₁-C₆ sulfonilo, haloalquil C₁-C₆ sulfonilo, alquil C₁-C₆ amino, dialquil C₂-C₆ amino, alcoxi C₂-C₄ carbonilo, -CN o -NO₂;

cada R³ es independientemente H, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₃-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquino C₃-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil

C₁-C₆ tio, haloalquil C₁-C₆ tio, alquil C₁-C₆ sulfinilo, haloalquil C₁-C₆ sulfinilo, alquil C₁-C₆ sulfonilo, haloalquil C₁-C₆ sulfonilo, -N(R⁴)R⁵, -C(W)N(R⁴)R⁵, -C(W)OR⁵, -CN o -NO₂;

Q es -S(O)₂N(R²¹)R²², -S(O)_pR²⁵ o -S(O)(=NR²⁸)R²⁹;

5 cada R⁴ es independientemente H, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquilcicloalquilo C₄-C₇, cicloalquilalquilo C₄-C₇, alquil C₂-C₇ carbonilo o alcoxi C₂-C₇ carbonilo;

cada R⁵ es independientemente H; o alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquilcicloalquilo C₄-C₇ o cicloalquilalquilo C₄-C₇, cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes independientemente seleccionados de R⁷;

10 cada R⁶ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆ tio, alquil C₁-C₆ sulfinilo, alquil C₁-C₆ sulfonilo, -CN o -NO₂;

cada R⁷ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆ tio, alquil C₁-C₆ sulfinilo, alquil C₁-C₆ sulfonilo, -CN, -NO₂ o Q¹;

cada R⁸ es independientemente un anillo fenilo o un anillo piridinilo, cada anillo opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de R⁹;

15 cada R⁹ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆ tio, haloalquil C₁-C₆ tio, alquil C₁-C₆ sulfinilo, haloalquil C₁-C₆ sulfinilo, alquil C₁-C₆ sulfonilo, haloalquil C₁-C₆ sulfonilo, alquil C₁-C₆ amino, dialquil C₂-C₆ amino, alquil C₂-C₄ carbonilo, alcoxi C₂-C₄ carbonilo, alquil C₂-C₇ aminocarbonilo, dialquil C₃-C₇ aminocarbonilo, -OH, -NH₂, -COOH, -CN o -NO₂;

20 cada Q¹ es independientemente un anillo fenilo o un anillo heterocíclico, saturado o insaturado, de 5 o 6 miembros, cada anillo sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientemente seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆ tio, haloalquil C₁-C₆ tio, alquil C₁-C₆ sulfinilo, haloalquil C₁-C₆ sulfinilo, alquil C₁-C₆ sulfonilo, haloalquil C₁-C₆ sulfonilo, alquil C₁-C₆ amino, dialquil C₂-C₆ amino, -CN, -NO₂, -C(W)N(R¹⁰)R¹¹, -C(O)OR¹¹ y R¹²;

25 cada R¹⁰ es independientemente H, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquilcicloalquilo C₄-C₇, cicloalquilalquilo C₄-C₇, alquil C₂-C₇ carbonilo o alcoxi C₂-C₇ carbonilo;

cada R¹¹ es independientemente H; o alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquilcicloalquilo C₄-C₇, cicloalquilalquilo C₄-C₇ o R¹²;

cada R¹² es independientemente un anillo fenilo o un anillo piridinilo, cada anillo opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes independientemente seleccionados de R¹³;

30 cada R¹³ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆ tio, haloalquil C₁-C₆ tio, alquil C₁-C₆ sulfinilo, haloalquil C₁-C₆ sulfinilo, alquil C₁-C₆ sulfonilo, haloalquil C₁-C₆ sulfonilo, alquil C₁-C₆ amino, dialquil C₂-C₆ amino, alquil C₂-C₄ carbonilo, alcoxi C₂-C₄ carbonilo, alquil C₂-C₇ aminocarbonilo, dialquil C₃-C₇ aminocarbonilo, -OH, -NH₂, -COOH, -CN o -NO₂;

35 R²¹ es H, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquilcicloalquilo C₄-C₇, cicloalquilalquilo C₄-C₇, alquil C₂-C₇ carbonilo o alcoxi C₂-C₇ carbonilo;

R²² es H; o alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquilcicloalquilo C₄-C₇ o cicloalquilalquilo C₄-C₇, cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes independientemente seleccionados de R²³;

40 cada R²³ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆ tio, alquil C₁-C₆ sulfinilo, alquil C₁-C₆ sulfonilo, -CN o -NO₂; o un anillo fenilo o un anillo piridinilo, cada anillo opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes independientemente seleccionados de R²⁴;

45 cada R²⁴ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆ tio, haloalquil C₁-C₆ tio, alquil C₁-C₆ sulfinilo, haloalquil C₁-C₆ sulfinilo, alquil C₁-C₆ sulfonilo, haloalquil C₁-C₆ sulfonilo, alquil C₁-C₆ amino, dialquil C₂-C₆ amino, alquil C₂-C₄ carbonilo, alcoxi C₂-C₄ carbonilo, alquil C₂-C₇ aminocarbonilo, dialquil C₃-C₇ aminocarbonilo, -OH, -NH₂, -COOH, -CN o -NO₂;

R²⁵ es alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquilcicloalquilo C₄-C₇ o cicloalquilalquilo C₄-C₇, cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de R²⁶;

50 cada R²⁶ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆ tio, alquil C₁-C₆ sulfinilo, alquil C₁-C₆ sulfonilo, alquil C₂-C₇ carbonilo, alcoxi C₂-C₇ carbonilo, -CN o -NO₂; o un anillo fenilo o un anillo piridinilo, cada anillo opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes independientemente seleccionados de R²⁷;

cada R²⁷ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆ tio, haloalquil C₁-C₆ tio, alquil C₁-C₆ sulfinilo, haloalquil C₁-C₆ sulfinilo, alquil C₁-C₆ sulfonilo, haloalquil C₁-C₆ sulfonilo, alquil C₁-C₆ amino, dialquil C₂-C₆ amino, alquil C₂-C₄ carbonilo, alcoxi C₂-C₄ carbonilo, alquil C₂-C₇ aminocarbonilo, dialquil C₃-C₇ aminocarbonilo, -OH, -NH₂, -COOH, -CN o -NO₂;

- 5 R²⁸ es H, halógeno, -CN, -NO₂, alquil C₂-C₇ carbonilo, haloalquil C₂-C₇ carbonilo, alcoxi C₂-C₇ carbonilo, alquil C₂-C₇ aminocarbonilo, dialquil C₃-C₇ aminocarbonilo, alquil C₁-C₆ sulfonilo o haloalquil C₁-C₆ sulfonilo; o

R²⁸ es alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, (alcoxi C₁-C₆)-(alquil C₁-C₆) o alquil C₁-C₆ tio, cada uno sustituido opcionalmente con halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₁-C₆, halocicloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, -CN o -NO₂;

- 10 R²⁹ es alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquilcicloalquilo C₄-C₇ o cicloalquilalquilo C₄-C₇, cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de R²⁶;

cada W es independientemente O o S;

p es 0, 1 o 2; y

n es 0, 1 o 2.

- 15 Esta invención también proporciona una composición que comprende un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido o una sal del mismo, y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en un tensioactivo, un diluyente sólido y un diluyente líquido. En una realización, esta invención también proporciona una composición para controlar una plaga de invertebrados que comprende una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido o una sal del mismo, y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que
20 consiste en un tensioactivo, un diluyente sólido y un diluyente líquido, comprendiendo también opcionalmente dicha composición una cantidad biológicamente eficaz de al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional.

- Esta invención también proporciona una composición de pulverización para controlar una plaga de invertebrados que comprende una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido o una sal del mismo, o la composición descrita con anterioridad y un propulsor. La presente invención proporciona también la
25 composición descrita anteriormente en forma de una composición de pulverización en donde el diluyente líquido es un propulsor. Esta invención también proporciona una composición cebo para controlar una plaga de invertebrados que comprende una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido o sal del mismo, o la composición descrita en la realización anterior, uno o más materiales alimenticios, opcionalmente un atrayente, y
30 opcionalmente un humectante. Esta invención proporciona además la composición descrita anteriormente en forma de una composición cebo en donde el diluyente sólido y/o el diluyente líquido comprenden uno o más materiales alimenticios, comprendiendo dicha composición opcionalmente un atrayente y/o un humectante.

- Esta invención proporciona además un dispositivo trampa para controlar una plaga de invertebrados que comprende dicha composición cebo y una carcasa adaptada para recibir dicha composición cebo, en donde la carcasa tiene al
35 menos una abertura dimensionada para permitir que la plaga de invertebrados pase a través de la abertura de tal modo que la plaga de invertebrados pueda acceder a dicha composición cebo desde una localización exterior a la carcasa, y en donde la carcasa está adaptada adicionalmente para que esté situada dentro o cerca de un lugar de actividad potencial o conocida para la plaga de invertebrados.

- Esta invención también proporciona un método para controlar una plaga de invertebrados que comprende poner en
40 contacto la plaga de invertebrados o su entorno con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido o una sal del mismo, (por ejemplo, como una composición descrita en este documento). Esta invención también se refiere a dicho método, en donde la plaga de invertebrados o su entorno se pone en contacto con una composición que comprende una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido o una sal del mismo, y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en un
45 tensioactivo, un diluyente sólido y un diluyente líquido, comprendiendo además dicha composición opcionalmente una cantidad biológicamente eficaz de al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional.

- Esta invención proporciona además un método para proteger una semilla de una plaga de invertebrados que comprende poner en contacto la semilla con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula 1, un
50 *N*-óxido o una sal del mismo. Esta invención se refiere además a una semilla tratada que comprende un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido o una sal del mismo, en una cantidad de aproximadamente 0,0001 a 1% en peso de la semilla antes del tratamiento.

- Esta invención proporciona además una composición para proteger un animal de una plaga parasitaria de invertebrados que comprende una cantidad parasiticidamente eficaz de un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido o una sal del mismo, y a menos un vehículo. La presente invención proporciona además la composición descrita
55 anteriormente en una forma para la administración oral. Esta invención proporciona además un método no

terapéutico para proteger un animal de una plaga parasitaria de invertebrados que comprende administrar al animal una cantidad parasiticidamente eficaz de un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido o una sal del mismo.

Detalles de la invención

5 Como se usan en este documento, los términos "comprende", "que comprende", "incluye", "que incluye", "tiene", "que tiene", "contiene" o "que contiene", o cualquier variación distinta de los mismos, están destinados a cubrir una inclusión no exclusiva. Por ejemplo, una composición, una mezcla, procedimiento, método, artículo o aparato que comprende una lista de elementos que no está necesariamente limitada a solo aquellos elementos si no que puede incluir otros elementos no enumerados expresamente o inherentes a dicha composición, mezcla, procedimiento, método, artículo o aparato. Además, a menos que se afirme expresamente lo contrario, "o" se refiere a una o
10 inclusiva y no a una o exclusiva. Por ejemplo, una condición A o B se satisface por cualquiera de lo siguiente: A es verdadero (o está presente) y B es falso (o no está presente), A es falso (o no está presente) y B es verdadero (o está presente), y tanto A como B son verdaderos (o están presentes).

Asimismo, se pretende que los artículos indefinidos "un" y "uno(a)" que preceden a un elemento o componente de la invención no sean restrictivos con respecto al número de casos (es decir, sucesos) del elemento o componente. Por lo tanto, "un" o "uno(a)" deben leerse para que incluyan uno o al menos uno, y la forma singular de la palabra del elemento o componente también incluye el plural a menos que el número signifique obviamente que es el singular.
15

Como se menciona en esta descripción, el término "plaga de invertebrados" incluye artrópodos, gasterópodos y nematodos de importancia económica como plagas. El término "artrópodo" incluye insectos, ácaros, arañas, escorpiones, ciempiés, milpiés; cochinillas y escutigeras. El término "gasterópodo" incluye caracoles, babosas y otros estilomatóforos. El término "helmintos" incluye gusanos en los filos de Nematelmintos, Platelminchos y Acantocéfalos tales como: gusanos redondos, gusanos de corazón y nematodos fitófagos (Nematoda), distomas (Trematoda), tenias (Cestoda) y gusanos de cabeza espinosa.
20

En el contexto de esta descripción, "control de plaga de invertebrados" implica la inhibición del desarrollo de la plaga de invertebrados (incluyendo mortalidad, reducción de alimentación y/o interrupción de apareamiento), y las expresiones relacionadas se definen de manera análoga.
25

El término "agronómico" se refiere a la producción de cultivos tales como para alimentos y fibras e incluye el cultivo de maíz, soja y otras leguminosas, arroz, cereal (por ejemplo, trigo, avena, cebada, centeno, arroz, maíz), hortalizas de hoja (por ejemplo, lechuga, col, y otros cultivos de col), hortalizas de fruto (por ejemplo, tomates, pimiento, berenjena, repollos y cucurbitáceas), patatas, batatas, uvas, algodón, frutos de árboles (por ejemplo, frutos de pepitas, grano y cítricos), frutas pequeñas (bayas, guindas) y otros cultivos especiales (por ejemplo, colza, girasol, olivos). El término "no agronómico" se refiere a granazones distintos a los cultivos; tales como cultivos hortícolas distintos (por ejemplo; plantas de invernadero, vivero u ornamentales que no han crecido en un campo), estructuras residenciales, agrícolas, comerciales e industriales, césped (por ejemplo, granja de césped, pastos, campo de golf, césped residencial, campos deportivos de recreo, etc.), productos de madera, productos almacenados, gestión agroforestal y de la vegetación, aplicaciones de salud pública (seres humanos) y salud animal (por ejemplo, animales domésticos tales como mascotas, ganado y aves de corral, animales no domésticos tales como la vida silvestre).
30
35

En las indicaciones anteriores, el término "alquilo", usado sólo o en palabras compuestas tales como "alquiltio" o "haloalquilo" incluye alquilo de cadena lineal o ramificada, tal como metilo, etilo, *n*-propilo, *i*-propilo, o los diferentes isómeros de butilo, pentilo o hexilo. "Alquenilo" incluye alquenos de cadena lineal o ramificada tales como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, y los diferentes isómeros de butenilo, pentenilo y hexenilo. "Alquenilo" incluye además polienos tales como, 1,2-propadienilo y 2,4-hexadienilo. "Alquinilo" incluye alquinos de cadena lineal o ramificada tales como etinilo, 1-propinilo, 2-propinilo y los diferentes isómeros de butinilo, pentinilo y hexinilo. "Alquinilo" también puede incluir restos compuestos por múltiples triples enlaces tales como 2,5-hexadiinilo.
40

"Alcoxi" incluye, por ejemplo, metoxi, etoxi, *n*-propiloxi, isopropiloxi y los diferentes isómeros butoxi, pentoxi y hexiloxi. "Alquiltio" incluye restos alquiltio de cadena lineal o ramificada tales como metiltio, etiltio, y los diferentes isómeros de propiltio, butiltio, pentiltio y hexiltio. "Alquilsulfinito" incluye ambos enantiómeros de un grupo alquilsulfinito. Los ejemplos de "alquilsulfinito" incluyen $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})-$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})-$ y los diferentes isómeros de butilsulfinito, pentilsulfinito y hexilsulfinito. Los ejemplos de "alquilsulfonilo" incluyen $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})_2-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2-$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})_2-$, y los diferentes isómeros de butilsulfonilo, pentilsulfonilo y hexilsulfonilo. "Alquilamino", "dialquilamino" y similares, se definen de forma análoga a los ejemplos anteriores. "Cicloalquilo" incluye, por ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo. El término "alquilocicloalquilo" denota la sustitución de alquilo en un resto de cicloalquilo e incluye, por ejemplo, etilciclopropilo, *i*-propilciclobutilo, 3-metilciclopentilo y 4-metilciclohexilo. El término "cicloalquilalquilo" denota la sustitución de cicloalquilo en un resto alquilo. Ejemplos de "cicloalquilalquilo" incluyen ciclopropilmetilo, ciclopentiletilo y otros restos cicloalquilo unidos a grupos alquilo de cadena lineal o ramificada.
45
50
55

El término "halógeno", sólo o en palabras compuestas tales como "haloalquilo", incluye flúor, cloro, bromo o yodo. Además, cuando se usa en palabras compuestas tales como "haloalquilo", dicho alquilo puede estar parcial o

totalmente sustituido con átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes. Ejemplos de "haloalquilo" incluyen F_3C- , $ClCH_2-$, CF_3CH_2- y CF_3CCl_2- . Los términos "halocicloalquilo", "haloalcoxi", "haloalquilitio" y similares, se definen de forma análoga al término "haloalquilo". Los ejemplos de "haloalcoxi" incluyen CF_3O- , CCl_3CH_2O- , $HCF_2CH_2CH_2O-$ y CF_3CH_2O- . Los ejemplos de "haloalquilitio" incluyen CCl_3S- , CF_3S- , CCl_3CH_2S- y $ClCH_2CH_2CH_2S-$. Los ejemplos de "haloalquilsulfinilo" incluyen $CF_3S(O)-$, $CCl_3S(O)-$, $CF_3CH_2S(O)-$ y $CF_3CF_2S(O)-$. Los ejemplos de "haloalquilsulfonilo" incluyen $CF_3S(O)_2-$, $CCl_3S(O)_2-$, $CF_3CH_2S(O)_2-$ y $CF_3CF_2S(O)_2-$.

"Alquilcarbonilo" denota restos alquilo de cadena lineal o ramificada unidos a un resto $C(=O)$. Los ejemplos de "alquilcarbonilo" incluyen $CH_3C(=O)-$, $CH_3CH_2CH_2C(=O)-$ y $(CH_3)_2CHC(=O)-$. Los ejemplos de "alcoxicarbonilo" incluyen $CH_3OC(=O)-$, $CH_3CH_2OC(=O)-$, $CH_3CH_2CH_2OC(=O)-$, $(CH_3)_2CHOC(=O)-$ y los diferentes isómeros de butoxi o pentoxicarbonilo.

El número total de átomos de carbono en un grupo sustituyente se indica mediante el prefijo "C_i-C_j" donde i y j son números de 1 a 7. Por ejemplo, alquil C₁-C₄ sulfonilo indica de metilsulfonilo a butilsulfonilo; alcoxi alquilo C₂ indica CH_3OCH_2 ; alcoxi alquilo C₃ indica, por ejemplo, $CH_3CH(OCH_3)$, $CH_3OCH_2CH_2$ o $CH_3CH_2OCH_2$; y alcoxi alquilo C₄ indica los diversos isómeros de un grupo alquilo sustituido con un grupo alcoxi que contiene un total de cuatro átomos de carbono, incluyendo los ejemplos $CH_3CH_2CH_2OCH_2$ y $CH_3CH_2OCH_2CH_2$.

Cuando un compuesto está sustituido con un sustituyente que porta un subíndice que indica que el número de dichos sustituyentes puede exceder de 1, dichos sustituyentes (cuando exceden de 1) están seleccionados de forma independiente del grupo de sustituyentes definidos, por ejemplo, $(R^2)_n$, n es 1 o 2. Cuando un grupo contiene un sustituyente que puede ser hidrógeno, por ejemplo R^c , entonces, cuando este sustituyente se toma como hidrógeno, se reconoce que este es equivalente a dicho grupo que no está sustituido.

"Aromático" indica que cada uno de los átomos del anillo está esencialmente en el mismo plano y tiene un orbital p perpendicular al plano del anillo, y en el que $(4n + 2)$ electrones π , donde n es un número entero positivo, están asociados con el anillo para cumplir con la regla de Hückel.

Los términos "anillo heterocíclico" o "heterociclo" denotan un anillo en que al menos un átomo que forma el esqueleto anular no es carbono, por ejemplo, nitrógeno, oxígeno o azufre. Típicamente, un anillo heterocíclico contiene no más de 4 nitrógenos, no más de 2 oxígenos y no más de 2 azufres. A menos que se indique otra cosa, un anillo heterocíclico puede ser un anillo saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado. Cuando un anillo heterocíclico completamente insaturado satisface la regla de Hückel, entonces dicho anillo también se denomina un "anillo heteroaromático", "anillo heterocíclico aromático". A menos que se indique otra cosa, los anillos y sistemas anulares heterocíclicos pueden estar unidos a través de cualquier carbono o nitrógeno disponible por sustitución de un hidrógeno en dicho carbono o nitrógeno.

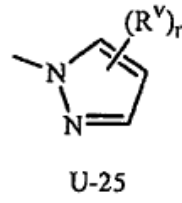
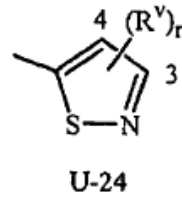
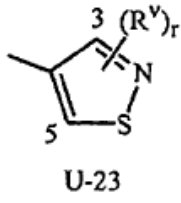
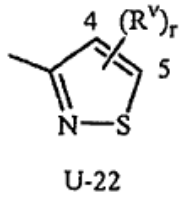
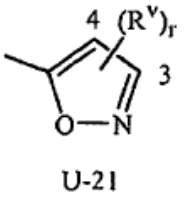
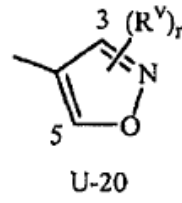
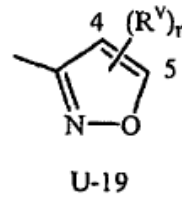
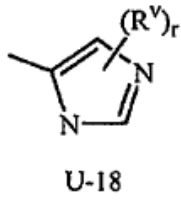
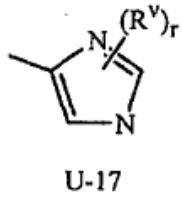
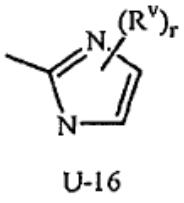
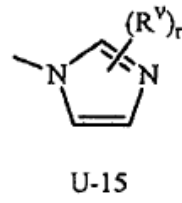
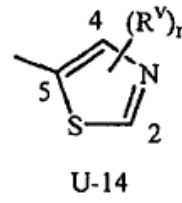
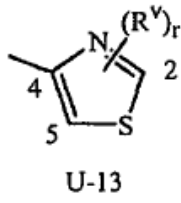
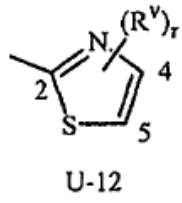
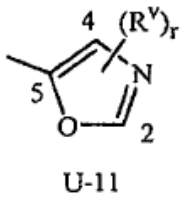
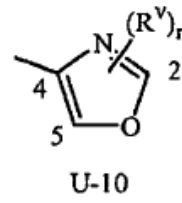
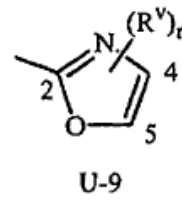
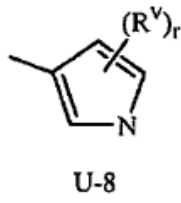
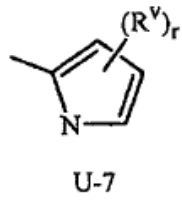
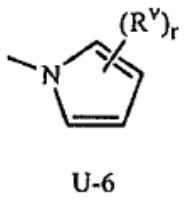
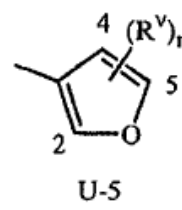
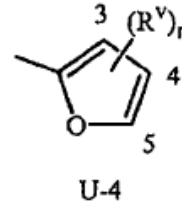
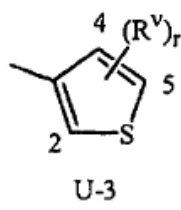
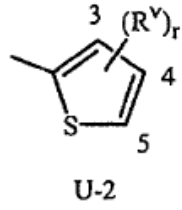
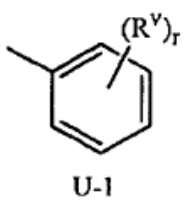
El término "opcionalmente sustituido" en conexión con los anillos heterocíclicos se refiere a grupos que no están sustituidos o que tienen al menos un sustituyente distinto de hidrógeno que no extingue la actividad biológica que posee por el análogo no sustituido. Tal como se usa en este documento, las siguientes definiciones se aplicarán a menos que se indique otra cosa. El término "opcionalmente sustituido" se usa indistintamente con la frase "sustituido o no sustituido" o con el término "(no) sustituido." A menos que se indique otra cosa, un grupo opcionalmente sustituido puede tener un sustituyente en cada posición sustituible del grupo, y cada sustitución es independientemente de la otra.

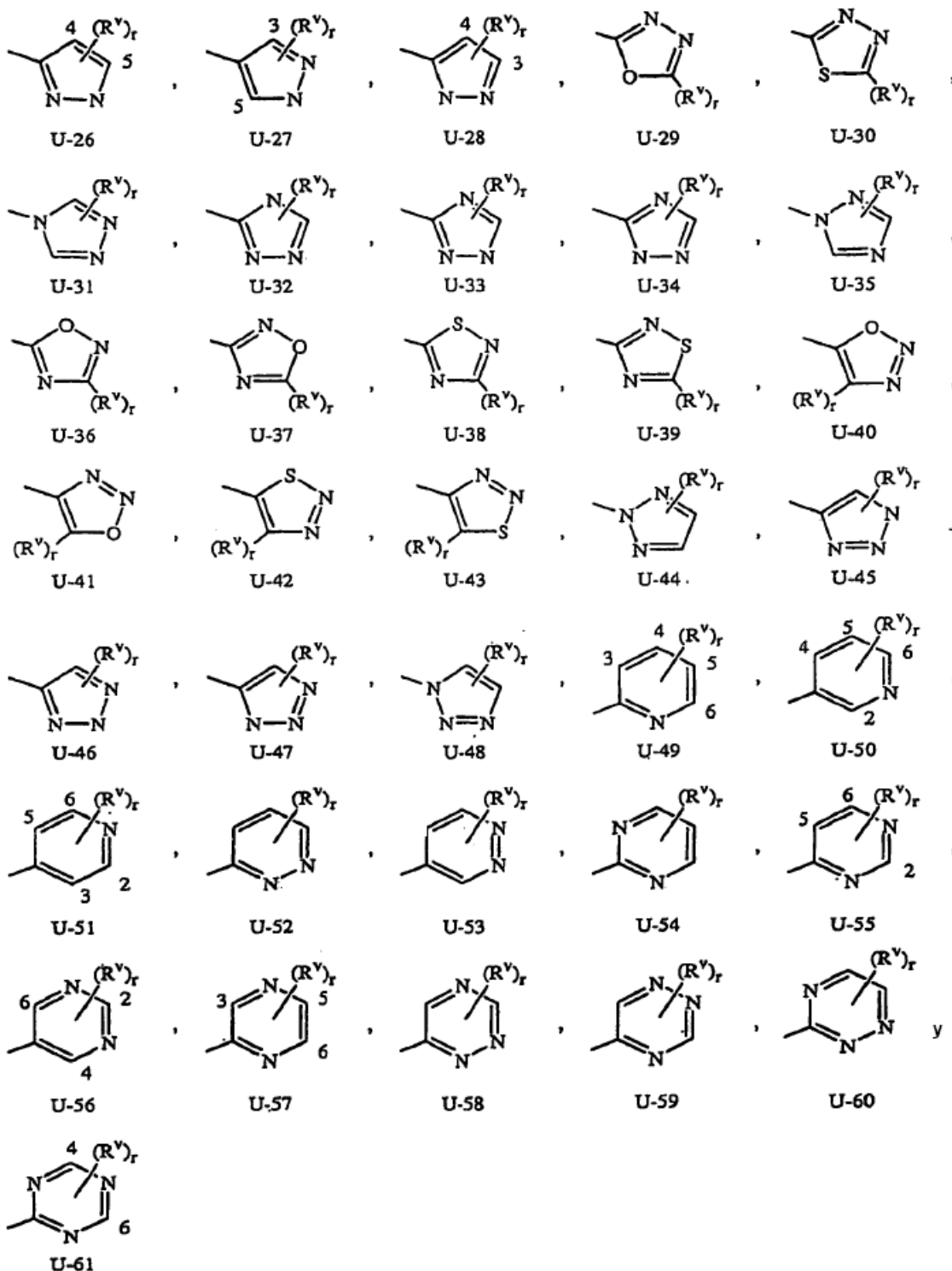
Cuando Q^1 es un heterociclo de 5 o 6 miembros, que contiene nitrógeno, puede estar unido a través de cualquier átomo del anillo de carbono o nitrógeno disponible, a menos que se describa otra cosa.

Tal como se anota con anterioridad, Q^1 puede ser (entre otros) fenilo opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de un grupo de sustituyentes como se define en el Compendio de la Invención. Un ejemplo de fenilo opcionalmente sustituido con uno a cinco sustituyentes es el anillo ilustrado como U-1 en el Objeto Expuesto 1, en donde R^v se selecciona de un grupo de sustituyentes como se define en el Compendio de la Invención para Q^1 y r es un número entero de 0 a 5.

Tal como se anota con anterioridad, Q^1 puede ser (entre otros) un anillo heterocíclico de 5 o 6 miembros, que puede estar saturado o insaturado, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de un grupo de sustituyentes tal como se define en el Compendio de la Invención. Ejemplos de un anillo heterocíclico aromático insaturado, de 5 o 6 miembros, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes, incluyen los anillos U-2 a U-61 ilustrados en el Objeto Expuesto 1 en donde R^v es cualquier sustituyente como se define en el Compendio de la Invención para Q^1 , y r es un número entero de 0 a 4, limitado por el número de posiciones disponibles en cada grupo U. Como U-29, U-30, U-36, U-37, U-38, U-39, U-40, U-41, U-42 y U-43 tienen solo una posición disponible, para estos grupos U, r se limita a los números enteros 0 o 1, y que r sea 0 significa que el grupo U no está sustituido y un hidrógeno está presente en la posición indicada por $(R^v)_r$.

Objeto Expuesto 1





5 Aunque los grupos R^v se muestran en las estructuras U-1 a U-61, debe apreciarse que no necesitan estar presentes ya que son sustituyentes opcionales. Debe apreciarse que, cuando R^v es H y está unido a un átomo, es lo mismo que si dicho átomo no está sustituido. Los átomos de nitrógeno que requieren sustitución para completar su valencia están sustituidos con H o R^v . Debe apreciarse que cuando el punto de unión entre $(R^v)_r$ y el grupo U se ilustra como flotante, $(R^v)_r$ puede unirse a cualquier átomo de carbono o átomo de nitrógeno disponible del grupo U. Debe apreciarse que cuando el punto de unión del grupo U se ilustra como flotante, el grupo U puede estar unido al resto de Fórmula 1 a través de cualquier carbono o nitrógeno disponible del grupo U por sustitución de un átomo de

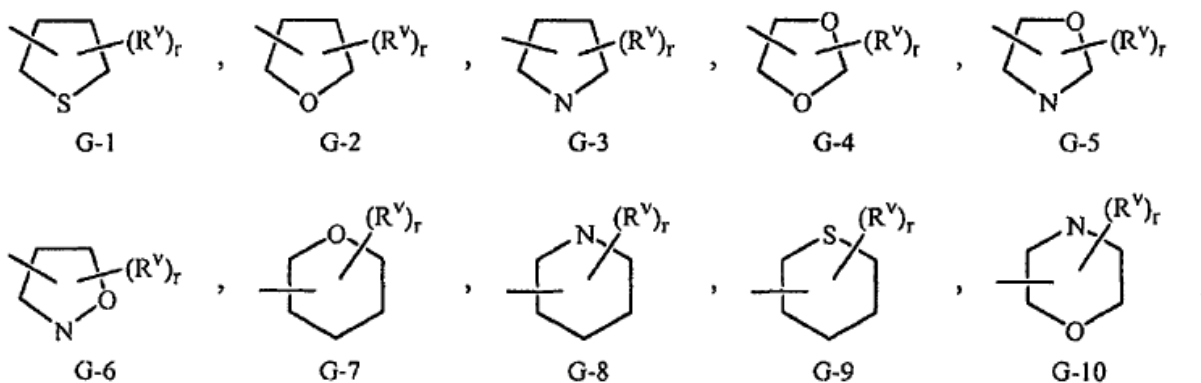
hidrógeno. Debe apreciarse que algunos grupos U sólo pueden estar sustituidos con menos de 4 grupos R^y (por ejemplo, U-2 a U-5, U-7 a U-48, y U-52 a U-61).

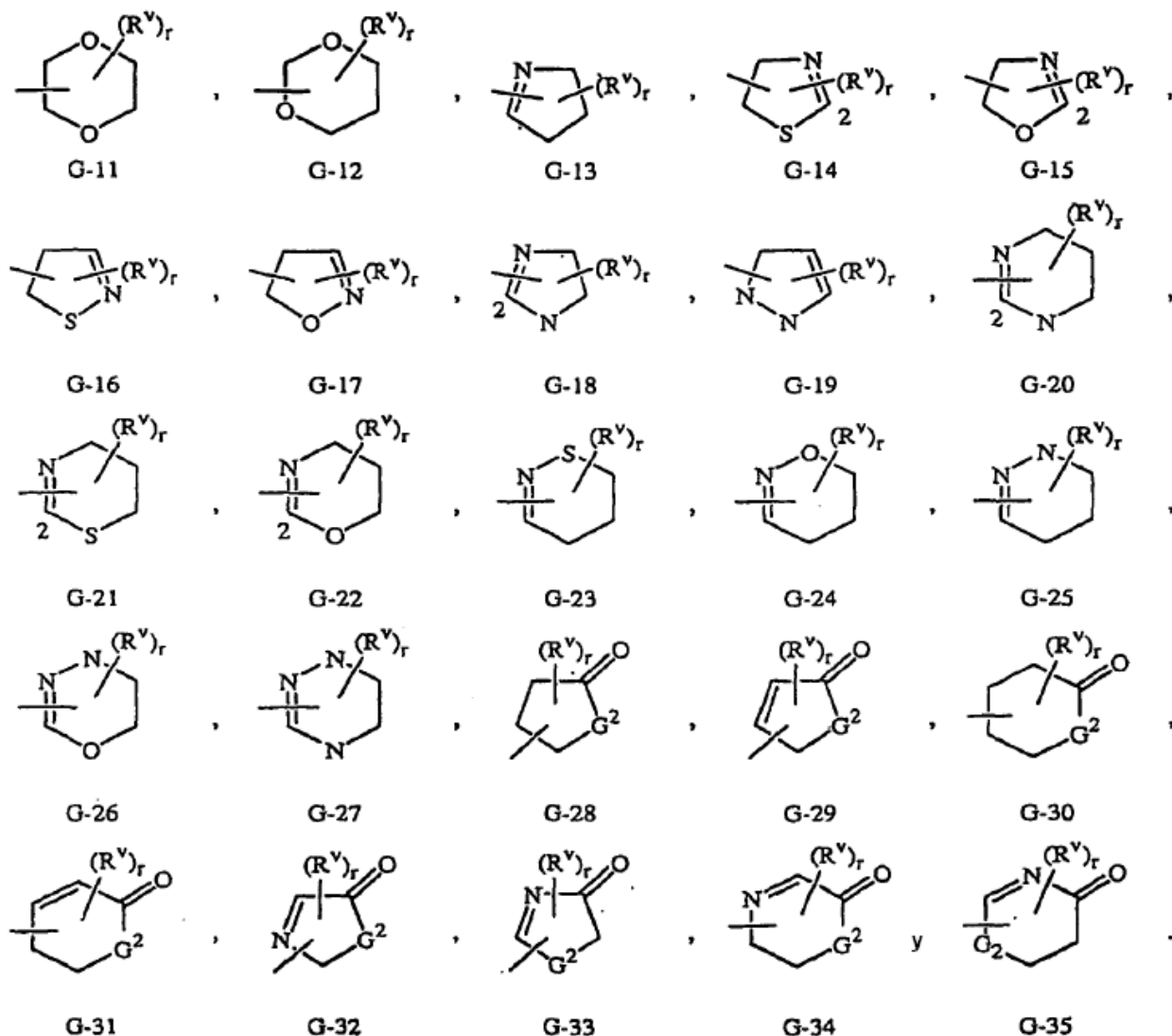
5 Debe apreciarse que cuando Q^1 es un anillo heterocíclico no aromático, saturado o insaturado, de 5 o 6 miembros, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados del grupo de sustituyentes tal como se define en el Compendio de la Invención para Q^1 , uno o dos miembros del anillo de carbono del heterociclo pueden estar opcionalmente en la forma oxidada de un resto carbonilo.

10 Los ejemplos de un anillo heterocíclico saturado de 5 o 6 miembros, o insaturado no aromático, incluyen los anillos G-1 a G-35 tal como se ilustra en el Objeto Expuesto 2. Debe apreciarse que cuando el punto de unión en el grupo G se ilustra como flotante, el grupo G puede estar unido al resto de Fórmula 1 a través de cualquier carbono o nitrógeno disponible del grupo G por sustitución de un átomo de hidrógeno. Los sustituyentes opcionales correspondientes a R^y pueden unirse a cualquier carbono o nitrógeno disponible por sustitución de un átomo de hidrógeno. Para estos anillos G, r es típicamente un número entero de 0 a 4, limitado por el número de posiciones disponibles en cada grupo G.

15 Debe apreciarse que cuando Q^1 comprende un anillo seleccionado de G-28 a G-35, G^2 se selecciona de O, S o N. Debe apreciarse que cuando G^2 es N, el átomo de nitrógeno puede completar su valencia por sustitución con o bien H o los sustituyentes como se definen en el Compendio de la Invención para Q^1 .

Objeto Expuesto 2





Se conoce una amplia variedad de métodos sintéticos en la técnica para permitir la preparación de anillos heterocíclicos aromáticos y no aromáticos; para revisiones extensas véase el conjunto de ocho volúmenes de Comprehensive Heterocyclic Chemistry, A. R. Katritzky y C. W. Rees editores jefe, Pergamon Press, Oxford, 1984 y el conjunto de doce volúmenes de Comprehensive Heterocyclic Chemistry II, A. R. Katritzky, C. W. Rees y E. F. V. Scriven editores jefe, Pergamon Press, Oxford, 1996.

Los compuestos de esta invención pueden existir como uno o más estereoisómeros. Los diversos estereoisómeros incluyen enantiómeros, diastereómeros, atropisómeros e isómeros geométricos. Un experto en la técnica apreciará que un estereoisómero puede ser más activo y/o puede mostrar efectos beneficiosos cuando está enriquecido con respecto al otro(s) estereoisómero(s) o cuando se separa del otro(s) estereoisómero(s). Además, el experto sabe como separar, enriquecer y/o preparar de forma selectiva dichos estereoisómeros. Los compuestos de la invención pueden estar presentes como una mezcla de estereoisómeros, estereoisómeros individuales, o como una forma ópticamente activa.

Un experto en la técnica apreciará que no todos los anillos heterocíclicos que contienen nitrógeno pueden formar *N*-óxidos ya que el nitrógeno requiere un par de electrones disponible para la oxidación al óxido; un experto en la técnica reconocerá los anillos heterocíclicos que contienen nitrógeno que pueden formar *N*-óxidos. Un experto en la técnica también reconocerá que aminas terciarias pueden formar *N*-óxidos. Los métodos sintéticos para la preparación de *N*-óxidos de anillos heterocíclicos y aminas terciarias son muy bien conocidos por un experto en la técnica incluyendo la oxidación de anillos heterocíclicos y aminas terciarias con peroxiácidos tales como ácido peracético y ácido *m*-cloroperbenzoico (MCPBA), peróxido de hidrógeno, hidroperóxidos de alquilo tales como hidroperóxido de *t*-butilo, perborato sódico y dioxiranos tales como dimetildioxirano. Estos métodos para la

preparación de *N*-óxidos se han descrito y revisado exhaustivamente en la bibliografía, véase, por ejemplo: T. L. Gilchrist en *Comprehensive Organic Synthesis*, vol. 7, páginas. 748-750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press; M. Tisler and B. Stanovnik en *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, vol. 3, pp 18-20, A. J. Boulton y A. McKillop, Eds., Pergamon Press; M. R. Grimmett y B. R. T. Keene en *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 43, pp. 149-161, A. R. Katritzky, Ed., Academic Press; M. Tisler y B. Stanovnik en *Advances in Heterocyclic Chemistry*, Vol. 9, pp. 285-291, A. R. Katritzky y A. J. Boulton, Eds., Academic Press; y G. W. H. Cheeseman y E. S. G. Werstiuk en *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 22, pp 390-392, A. R. Katritzky y A. J. Boulton, Eds., Academic Press.

Un experto en la técnica reconoce que debido a que en el medioambiente y bajo condiciones fisiológicas las sales de los compuestos químicos están en equilibrio con sus correspondientes formas no salinas, las sales comparten la utilidad biológica de las formas no salinas. Así, una amplia variedad de sales de los compuestos de Fórmula 1 son útiles para controlar las plagas de invertebrados (es decir, son agrícolamente adecuadas). Las sales de los compuestos de Fórmula 1 incluyen sales de adición de ácido con ácidos inorgánicos u orgánicos tales como ácido bromhídrico, clorhídrico, nítrico, fosfórico, sulfúrico, acético, butírico, fumárico, láctico, maleico, malónico, oxálico, propiónico, salicílico, tartárico, 4-toluensulfónico o valérico. Cuando un compuesto de Fórmula 1 contiene un resto ácido tal como un ácido carboxílico o fenol, las sales incluyen además las formadas con bases orgánicas o inorgánicas tales como piridina, trietilamina o amoniaco, o amidas, hidruros, hidróxidos o carbonatos de sodio, potasio, litio, calcio, magnesio o bario. Por consiguiente, la presente invención comprende los compuestos seleccionados de la Fórmula 1, *N*-óxidos y sales de los mismos adecuadas desde el punto de vista agrícola.

Las realizaciones de la presente invención tal como se describen en el Compendio de la Invención incluyen:

Realización 1. Un compuesto de Fórmula 1 en donde R^1 es alquilo C_1-C_3 opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de R^6 .

Realización 2. Un compuesto de la Realización 1, en donde R^1 es alquilo C_1-C_3 opcionalmente sustituido con halógeno.

Realización 3. Un compuesto de la Realización 2, en donde R^1 es alquilo C_1-C_3 sustituido con halógeno.

Realización 4. Un compuesto de la Realización 3, en donde R^1 es alquilo C_1-C_3 sustituido con F.

Realización 5. Un compuesto de la Realización 4, en donde R^1 es alquilo C_1-C_3 completamente sustituido con F.

Realización 6. Un compuesto de la Realización 5, en donde R^1 es CF_3 .

Realización 7. Un compuesto de Fórmula 1, en donde cada R^2 es independientemente H, halógeno, haloalquilo C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 o $-CN$.

Realización 8. Un compuesto de la Realización 7, en donde cada R^2 es independientemente H, halógeno, CF_3 , OCF_3 o $-CN$.

Realización 9. Un compuesto de la Realización 7, en donde cada R^2 es independientemente H o halógeno.

Realización 10. Un compuesto de Fórmula 1, en donde cada R^3 es independientemente H, halógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , haloalqueno C_3-C_6 , alquino C_2-C_6 , haloalquino C_3-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , $-N(R^4)R^5$, $-C(W)N(R^4)R^5$, $-CN$ o $-NO_2$.

Realización 11. Un compuesto de la Realización 10, en donde cada R^3 es independientemente H, halógeno, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alqueno C_2-C_4 , haloalqueno C_3-C_4 , alquino C_2-C_4 , haloalquino C_3-C_4 , ciclopropilo, alcoxi C_1-C_4 , $-C(W)N(R^4)R^5$, $-CN$ o $-NO_2$.

Realización 12. Un compuesto de la Realización 11, en donde cada R^3 es independientemente H, halógeno, alquilo C_1-C_2 , $-C\equiv CH$, $-CN$ o $-NO_2$.

Realización 13. Un compuesto de la Realización 12, en donde cada R^3 es H.

Realización 14. Un compuesto de la Realización 12, en donde cada R^3 es $-CN$.

Realización 19. Un compuesto de Fórmula 1, en donde cada R^4 es independientemente H, alquilo C_1-C_4 , alquil C_2-C_4 carbonilo o alcoxi C_2-C_4 carbonilo.

Realización 20. Un compuesto de la Realización 19, en donde cada R^4 es H.

Realización 21. Un compuesto de Fórmula 1, en donde cada R^5 es independientemente H; o alquilo C_1-C_4 , alqueno C_3-C_4 , alquino C_3-C_4 , cicloalquilo C_3-C_4 , alquilo C_4-C_7 o cicloalquilalquilo C_4-C_7 , cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de R^7 .

Realización 22. Un compuesto de la Realización 21 en donde cada R^5 es independientemente H; o alquilo C_1-C_4 opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de R^7 .

- Realización 23. Un compuesto de la Realización 22, en donde cada R^5 es independientemente H o alquilo C₁-C₄.
- Realización 24. Un compuesto de Fórmula 1, en donde cada R^7 es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄ tio, alquil C₁-C₄ sulfinilo, alquil C₁-C₄ sulfonilo, -CN, -NO₂ o Q¹.
- 5 Realización 25. Un compuesto de Fórmula 1, en donde Q¹ es un anillo fenilo, un anillo piridinilo, un anillo tiazolilo, un anillo pirazolilo, un anillo triazolilo o un anillo imidazolilo, cada anillo opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes independientemente seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, -CN, -C(W)N(R¹⁰)R¹¹, C(O)OR¹¹ y R¹².
- Realización 26. Un compuesto de Fórmula 1, en donde cada R^{10} es independientemente H, alquilo C₁-C₄, alquil C₂-C₄ carbonilo o alcoxi C₂-C₄ carbonilo.
- 10 Realización 27. Un compuesto de la Realización 26, en donde cada R^{10} es H.
- Realización 28. Un compuesto de Fórmula 1, en donde cada R^{11} es independientemente H; o alquilo C₁-C₄, alqueno C₃-C₄, alquinilo C₃-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, alquilocicloalquilo C₄-C₇, cicloalquilalquilo C₄-C₇ o R¹².
- Realización 29. Un compuesto de la Realización 28, en donde cada R^{11} es H o alquilo C₁-C₄.
- Realización 31. Un compuesto de Fórmula 1 en donde Q es -S(O)₂N(R²¹)R²².
- 15 Realización 32. Un compuesto de Fórmula 1 en donde R²¹ es H o alquilo C₁-C₆.
- Realización 33. Un compuesto de la Realización 32 en donde R²¹ es H o metilo.
- Realización 34. Un compuesto de Fórmula 1 en donde R²² es H; o alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, alquilocicloalquilo C₄-C₇ o cicloalquilalquilo C₄-C₇, cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de R²³.
- 20 Realización 35. Un compuesto de la Realización 34, en donde R²² es alquilo C₁-C₄ opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de R²³;
- Realización 36. Un compuesto de Fórmula 1, en donde cada R²³ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄ tio, alquil C₁-C₄ sulfinilo, alquil C₁-C₄ sulfonilo, -CN o -NO₂; o un anillo fenilo o un anillo piridinilo, cada anillo opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes independientemente seleccionados de R²⁴.
- 25 Realización 37. Un compuesto de la Realización 36 en donde cada R²³ es independientemente halógeno, alquil C₁-C₄ tio, -CN, un anillo fenilo o un anillo piridinilo.
- Realización 38. Un compuesto de Fórmula 1 en donde Q es -S(O)_pR²⁵.
- Realización 39. Un compuesto de Fórmula 1 en donde R²⁵ es alquilo C₁-C₄, alqueno C₃-C₄, alquinilo C₃-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, alquilocicloalquilo C₄-C₇ o cicloalquilalquilo C₄-C₇, cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de R²⁶.
- 30 Realización 40. Un compuesto de la Realización 39, en donde R²⁵ es alquilo C₁-C₄ opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de R²⁶.
- Realización 41. Un compuesto de la Realización 40 en donde R²⁵ es metilo, etilo o CH₂CF₃.
- 35 Realización 42. Un compuesto de Fórmula 1, en donde cada R²⁶ es independientemente halógeno, alcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄ tio, alquil C₁-C₄ sulfinilo, alquil C₁-C₄ sulfonilo, -CN o -NO₂.
- Realización 43. Un compuesto de la Realización 42, en donde cada R²⁶ es independientemente halógeno o -CN.
- Realización 44. Un compuesto de Fórmula 1 en donde Q es -S(O)(=N(R²⁸))R²⁹.
- Realización 45. Un compuesto de Fórmula 1 en donde R²⁸ es H, halógeno, alquilo C₁-C₄, -CN, -NO₂, haloalquil C₂-C₇ carbonilo o alcoxi C₂-C₇ carbonilo.
- 40 Realización 46. Un compuesto de la Realización 45 en donde R²⁸ es H, alquilo C₁-C₄, -CN o -NO₂.
- Realización 47. Un compuesto de Fórmula 1 en donde R²⁹ es alquilo C₁-C₄, alqueno C₃-C₄, alquinilo C₃-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, alquilocicloalquilo C₄-C₇ o cicloalquilalquilo C₄-C₇, cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de R²⁶.
- 45 Realización 48. Un compuesto de la Realización 47 en donde R²⁹ es alquilo C₁-C₄ opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de R²⁶.

Realización 49. Un compuesto de la Realización 48 en donde R^{29} es metilo, etilo o CH_2CF_3 .

Realización 50. Un compuesto de Fórmula 1, en donde W es O.

Realización 51. Un compuesto de Fórmula 1, en donde n es 0.

Realización 52. Un compuesto de Fórmula 1 en donde p es 1 o 2.

5 Realización 53. Un compuesto de Fórmula 1, en donde A^1 y A^2 son CR^3 ; y A^3 es CR^3 o N.

Realización 54. Un compuesto de la Realización 53, en donde A^3 es CR^3 .

Realización 55. Un compuesto de Fórmula 1, en donde A^1 es N; y A^2 y A^3 son CR^3 .

Realización 56. Un compuesto de Fórmula 1, en donde A^2 es N; y A^1 y A^3 son CR^3 .

Realización 57. Un compuesto de Fórmula 1, en donde A^1 es CR^3 ; y A^2 y A^3 son N.

10 Realización 58. Un compuesto de Fórmula 1, en donde A^2 es CR^3 ; y A^1 y A^3 son N.

Realización 59. Un compuesto de Fórmula 1, en donde A^3 es CR^3 ; y A^1 y A^2 son N.

Realización 60. Un compuesto de Fórmula 1, en donde B^1 , B^2 y B^3 son CR^2 .

Realización 61. Un compuesto de la Realización 60, en donde B^2 es CH.

Realización 62. Un compuesto de Fórmula 1, en donde B^1 es N; y B^2 y B^3 son CR^2 .

15 Realización 63. Un compuesto de Fórmula 1, en donde B^2 es N; y B^1 y B^3 son CR^2 .

Realización 64. Un compuesto de Fórmula 1, en donde B^2 es CR^2 ; y B^1 y B^3 son N.

Realización 65. Un compuesto de Fórmula 1 en donde R^{28} es distinto de halógeno.

20 Las realizaciones de esta invención, que incluyen las Realizaciones 1-14, 19-29, 31-65 anteriores, además de cualquier otra realización descrita en este documento, se pueden combinar de cualquier manera, y las descripciones de las variables en las realizaciones pertenecen no sólo a los compuestos de Fórmula 1 sino también a los compuestos de partida y los compuestos intermedios. Además, las realizaciones de esta invención, que incluyen las Realizaciones 1-14, 19-29, 31-65 anteriores, además de cualquier otra realización descrita en este documento y cualquier combinación de las mismas, pertenecen a las composiciones y métodos de la presente invención.

Las combinaciones de las Realizaciones 1-14, 19-29, 31-65 pueden ilustrarse mediante:

25 Realización A. Un compuesto de Fórmula 1, en donde

A^1 y A^2 son CR^3 ;

A^3 es CR^3 o N;

B^1 , B^2 y B^3 son CR^2 ;

R^1 es alquilo C_1 - C_3 opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de R^6 ;

30 cada R^2 es independientemente H, halógeno, haloalquilo C_1 - C_6 , haloalcoxi C_1 - C_6 o -CN;

cada R^3 es independientemente H, halógeno, alquilo C_1 - C_6 , haloalquilo C_1 - C_6 , alqueno C_2 - C_6 , haloalqueno C_3 - C_6 , alquino C_2 - C_6 , haloalquino C_3 - C_6 , cicloalquilo C_3 - C_6 , alcoxi C_1 - C_6 , haloalcoxi C_1 - C_6 , $-N(R^4)R^5$, $-C(W)N(R^4)R^5$, -CN o $-NO_2$;

cada R^4 es independientemente H, alquilo C_1 - C_4 , alquil C_2 - C_4 carbonilo o alcoxi C_2 - C_4 carbonilo;

35 cada R^5 es independientemente H; o alquilo C_1 - C_4 , alqueno C_3 - C_4 , alquino C_3 - C_4 , cicloalquilo C_3 - C_4 , alquilo cicloalquilo C_4 - C_7 o cicloalquilalquilo C_4 - C_7 , cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de R^7 ;

cada R^7 es independientemente halógeno, alquilo C_1 - C_4 , alcoxi C_1 - C_4 , alquil C_1 - C_4 tio, alquil C_1 - C_4 sulfinilo, alquil C_1 - C_4 sulfonilo, -CN, $-NO_2$ o Q^1 ;

40 Q^1 es un anillo fenilo, un anillo piridinilo, un anillo tiazolilo, un anillo pirazolilo, un anillo triazolilo o un anillo imidazolilo, cada anillo opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de halógeno, alquilo C_1 - C_3 , haloalquilo C_1 - C_3 , -CN, $-C(W)N(R^{10})R^{11}$, $C(O)OR^{11}$ y R^{12} ;

cada R¹⁰ es independientemente H, alquilo C₁-C₄, alquil C₂-C₄ carbonilo o alcoxi C₂-C₄ carbonilo; y

cada R¹¹ es independientemente H; o alquilo C₁-C₄, alquenilo C₃-C₄, alquinilo C₃-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, alquilocicloalquilo C₄-C₇, cicloalquilalquilo C₄-C₇ o R¹².

Realización E. Un compuesto de la realización A, en donde

5 R²¹ es H o alquilo C₁-C₆;

R²² es alquilo C₁-C₄ opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de R²³;

cada R²³ es independientemente halógeno, alquil C₁-C₄ tio, -CN, un anillo fenilo o un anillo piridinilo;

10 R²⁵ es alquilo C₁-C₄, alquenilo C₃-C₄, alquinilo C₃-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, alquilocicloalquilo C₄-C₇ o cicloalquilalquilo C₄-C₇, cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de R²⁶;

cada R²⁶ es independientemente halógeno, alcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄ tio, alquil C₁-C₄ sulfonilo, alquil C₁-C₄ sulfonilo, -CN o -NO₂;

R²⁸ es H, halógeno, alquilo C₁-C₄, -CN, -NO₂, haloalquil C₂-C₇ carbonilo o alcoxi C₂-C₇ carbonilo; y

15 R²⁹ es alquilo C₁-C₄, alquenilo C₃-C₄, alquinilo C₃-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, alquilocicloalquilo C₄-C₇ o cicloalquilalquilo C₄-C₇, cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de R²⁶.

Realización F. Un compuesto de la Realización E, en donde

R¹ es alquilo C₁-C₃ opcionalmente sustituido con halógeno;

cada R² es independientemente H, CF₃, OCF₃, halógeno o -CN;

20 cada R³ es independientemente H, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, haloalquenilo C₃-C₄, alquinilo C₂-C₄, haloalquinilo C₃-C₄, ciclopropilo, alcoxi C₁-C₄, -C(W)N(R⁴)R⁵, -CN o -NO₂;

cada R⁴ es H;

Q es -S(O)₂N(R²¹)R²²;

R²¹ es H o metilo; y

W es O.

25 Realización G. Un compuesto de la Realización F, en donde

A³ es CR₃;

B² es CH;

R¹ es CF₃;

cada R² es independientemente H o halógeno; y

30 cada R³ es independientemente H, halógeno, alquilo C₁-C₂, -C≡CH, -CN o -NO₂.

Realización H. Un compuesto de la realización E en donde

R¹ es alquilo C₁-C₃ opcionalmente sustituido con halógeno;

cada R² es independientemente H, CF₃, OCF₃, halógeno o -CN;

35 cada R³ es independientemente H, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, haloalquenilo C₃-C₄, alquinilo C₂-C₄, haloalquinilo C₃-C₄, ciclopropilo, alcoxi C₁-C₄, -C(W)N(R⁴)R⁵, -CN o -NO₂;

cada R⁴ es H;

Q es -S(O)_pR²⁵;

R²⁵ es alquilo C₁-C₄ opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de R²⁶;

40 cada R²⁶ es independientemente halógeno o -CN;

W es O; y

P es 1 o 2.

Realización I. Un compuesto de la realización H en donde

A³ es CR³;

5 B² es CH;

R¹ es CF₃;

cada R² es independientemente H o halógeno; y

cada R³ es independientemente H, halógeno, alquilo C₁-C₂, -C≡CH, -CN o -NO₂.

Realización J. Un compuesto de la realización E, en donde

10 R¹ es alquilo C₁-C₃ opcionalmente sustituido con halógeno;

cada R² es independientemente H, CF₃, OCF₃, halógeno o -CN;

cada R³ es independientemente H, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, haloalquenilo C₃-C₄, alquinilo C₂-C₄, haloalquinilo C₃-C₄, ciclopropilo, alcoxi C₁-C₄, -C(W)N(R⁴)R⁵, -CN o -NO₂;

cada R⁴ es H;

15 Q es -S(O)(=NR²⁸)R²⁹;

R²⁸ es H, alquilo C₁-C₄, -CN o -NO₂;

R²⁹ es alquilo C₁-C₄ opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de R²⁶;

cada R²⁶ es independientemente halógeno o -CN; y

20 W es O.

Realización K. Un compuesto de la Realización J en donde

A³ es CR³;

B² es CH;

R¹ es CF₃;

25 cada R² es independientemente H o halógeno; y

cada R³ es independientemente H, halógeno, alquilo C₁-C₂, -C≡CH, -CN o -NO₂.

Las realizaciones específicas incluyen compuestos de Fórmula 1 seleccionados del grupo que consiste en:

N-(ciclopropilmetil)-4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-2-metilbencenosulfonamida;

4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-2-metil-*N*-(2-piridinilmetil)bencenosulfonamida;

30 5-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-3-[4-(metilsulfonyl)fenil]-5-(trifluorometil)isoxazol];

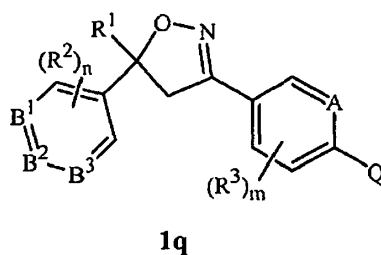
5-[(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-2-(metilsulfonyl)benzoniitrilo; y

3-[3-bromo-4-(metiltio)fenil]-5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)isoxazol.

Realizaciones más específicas incluyen cualquier combinación de los compuestos de Fórmula 1 seleccionados del grupo inmediatamente anterior.

35 Las Realizaciones de la presente invención también incluyen:

Realización A1. Un compuesto de Fórmula 1q, un *N*-óxido o una sal del mismo,



en donde:

A se selecciona del grupo que consiste en CR³ y N;

B¹, B² y B³ se seleccionan independientemente del grupo que consiste en CR² y N;

- 5 cada R¹ es alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquilocicloalquilo C₄-C₇ o cicloalquilalquilo C₄-C₇, cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de R⁶; R² es independientemente H, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆ tio, haloalquil C₁-C₆ tio, alquil C₁-C₆ sulfinilo, haloalquil C₁-C₆ sulfinilo, alquil C₁-C₆ sulfonilo, haloalquil C₁-C₆ sulfonilo, alquil C₁-C₆ amino, dialquil C₂-C₆ amino, alcoxi C₂-C₄ carbonilo, -CN o -NO₂;
- 10 cada R³ es independientemente H, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₃-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquino C₃-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆ tio, haloalquil C₁-C₆ tio, alquil C₁-C₆ sulfinilo, haloalquil C₁-C₆ sulfinilo, alquil C₁-C₆ sulfonilo, haloalquil C₁-C₆ sulfonilo, -N(R⁴)R⁵, -C(W)N(R⁴)R⁵, -C(W)OR⁵, -CN o -NO₂; Q es -S(O)₂N(R²¹)R²², -S(O)_pR²⁵ o -S(O)(=NR²⁸)R²⁹;
- 15 cada R⁴ es independientemente H, alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquilocicloalquilo C₄-C₇, cicloalquilalquilo C₄-C₇, alquil C₂-C₇ carbonilo o alcoxi C₂-C₇ carbonilo;
- cada R⁵ es independientemente H; o alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquilocicloalquilo C₄-C₇ o cicloalquilalquilo C₄-C₇, cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes independientemente seleccionados de R⁷;
- 20 cada R⁶ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆ tio, alquil C₁-C₆ sulfinilo, alquil C₁-C₆ sulfonilo, -CN o -NO₂;
- cada R⁷ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆ tio, alquil C₁-C₆ sulfinilo, alquil C₁-C₆ sulfonilo, -CN, -NO₂ o Q¹;
- cada R⁸ es independientemente un anillo fenilo o un anillo piridinilo, cada anillo opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de R⁹;
- 25 cada R⁹ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆ tio, haloalquil C₁-C₆ tio, alquil C₁-C₆ sulfinilo, haloalquil C₁-C₆ sulfinilo, alquil C₁-C₆ sulfonilo, haloalquil C₁-C₆ sulfonilo, alquil C₁-C₆ amino, dialquil C₂-C₆ amino, alquil C₂-C₄ carbonilo, alcoxi C₂-C₄ carbonilo, alquil C₂-C₇ aminocarbonilo, dialquil C₃-C₇ aminocarbonilo, -OH, -NH₂, -COOH, -CN o -NO₂;
- 30 cada Q₁ es independientemente un anillo fenilo o un anillo heterocíclico, saturado o insaturado, de 5 o 6 miembros, cada anillo opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes independientemente seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆ tio, haloalquil C₁-C₆ tio, alquil C₁-C₆ sulfinilo, haloalquil C₁-C₆ sulfinilo, alquil C₁-C₆ sulfonilo, haloalquil C₁-C₆ sulfonilo, alquil C₁-C₆ amino, dialquil C₂-C₆ amino, -CN, -NO₂, -C(W)N(R¹⁰)R¹¹, -C(O)OR¹¹ y R¹²;
- 35 cada R¹⁰ es independientemente H, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquilocicloalquilo C₄-C₇, cicloalquilalquilo C₄-C₇, alquil C₂-C₇ carbonilo o alcoxi C₂-C₇ carbonilo;
- cada R¹¹ es independientemente H; o alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquilocicloalquilo C₄-C₇, cicloalquilalquilo C₄-C₇ o R¹²;
- cada R¹² es independientemente un anillo fenilo o un anillo piridinilo, cada anillo opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes independientemente seleccionados de R¹⁵;
- 40 cada R¹³ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆ tio, haloalquil C₁-C₆ tio, alquil C₁-C₆ sulfinilo, haloalquil C₁-C₆ sulfinilo, alquil C₁-C₆ sulfonilo, haloalquil C₁-C₆ sulfonilo, alquil C₁-C₆ amino, dialquil C₂-C₆ amino, alquil C₂-C₄ carbonilo, alcoxi C₂-C₄ carbonilo, alquil C₂-C₇ aminocarbonilo, dialquil C₃-C₇ aminocarbonilo, -OH, -NH₂, -COOH, -CN o -NO₂;

R₂₁ es H, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquilocicloalquilo C₄-C₇, cicloalquilalquilo C₄-C₇, alquil C₂-C₇ carbonilo o alcoxi C₂-C₇ carbonilo;

5 R²² es H; o alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquilocicloalquilo C₄-C₇ o cicloalquilalquilo C₄-C₇, cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes independientemente seleccionados de R²³;

cada R²³ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆ tio, alquil C₁-C₆ sulfinilo, alquil C₁-C₆ sulfonilo, -CN o -NO₂; o un anillo fenilo o un anillo piridinilo, cada anillo opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes independientemente seleccionados de R²⁴;

10 cada R²⁴ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆ tio, haloalquil C₁-C₆ tio, alquil C₁-C₆ sulfinilo, haloalquil C₁-C₆ sulfinilo, alquil C₁-C₆ sulfonilo, haloalquil C₁-C₆ sulfonilo, alquil C₁-C₆ amino, dialquil C₂-C₆ amino, alquil C₂-C₄ carbonilo, alcoxi C₂-C₄ carbonilo, alquil C₂-C₇ aminocarbonilo, dialquil C₃-C₇ aminocarbonilo, -OH, -NH₂, -COOH, -CN o -NO₂;

R²⁵ es alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquilocicloalquilo C₄-C₇ o cicloalquilalquilo C₄-C₇, cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de R²⁶;

15 cada R²⁶ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆ tio, alquil C₁-C₆ sulfinilo, alquil C₁-C₆ sulfonilo, alquil C₂-C₇ carbonilo, alcoxi C₂-C₇ carbonilo, -CN o -NO₂; o un anillo fenilo o un anillo piridinilo, cada anillo opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes independientemente seleccionados de R²⁷;

20 cada R²⁷ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆ tio, haloalquil C₁-C₆ tio, alquil C₁-C₆ sulfinilo, haloalquil C₁-C₆ sulfinilo, alquil C₁-C₆ sulfonilo, haloalquil C₁-C₆ sulfonilo, alquil C₁-C₆ amino, dialquil C₂-C₆ amino, alquil C₂-C₄ carbonilo, alcoxi C₂-C₄ carbonilo, alquil C₂-C₇ aminocarbonilo, dialquil C₃-C₇ aminocarbonilo, -OH, -NH₂, -COOH, -CN o -NO₂;

R²⁸ es H, -CN, -NO₂, alquil C₂-C₇ carbonilo, haloalquil C₂-C₇ carbonilo; alcoxi C₂-C₇ carbonilo, alquil C₂-C₇ aminocarbonilo, dialquil C₃-C₇ aminocarbonilo, alquil C₁-C₆ sulfonilo o haloalquil C₁-C₆ sulfonilo; o

25 R²⁸ es alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, (alcoxi C₁-C₆)-(alquil C₁-C₆) o alquil C₁-C₆ tio, cada uno sustituido opcionalmente con halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₁-C₆, halocicloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, -CN o -NO₂;

R²⁹ es alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquilocicloalquilo C₄-C₇ o cicloalquilalquilo C₄-C₇, cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de R²⁶;

cada W es independientemente O o S;

30 p es 0, 1 o 2;

m es 1, 2 o 3; y

n es 1 o 2.

35 Es digno de mención que los compuestos de esta invención se caracterizan por patrones metabólicos favorables y/o residuales de suelo y muestran una actividad que controla un espectro de plagas de invertebrados agronómicas y no agronómicas.

40 De particular importancia, por razones del espectro del control de plagas de invertebrados e importancia económica, protección de los cultivos agronómicos del daño o lesión provocada por las plagas de invertebrados mediante el control de las plagas de invertebrados, son las realizaciones de la invención. Los compuestos de esta invención, debido a sus favorables propiedades de translocación o sistemicidad en plantas, también protegen las partes foliares u otras partes de plantas que no están directamente en contacto con un compuesto de Fórmula 1 o una composición que comprende el compuesto.

45 También se han de destacar como realizaciones de la presente invención, las composiciones que comprenden un compuesto de cualquiera de las Realizaciones precedentes, así como cualquier otra realización descrita en este documento, y cualquier combinación de las mismas, y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en un tensioactivo, un diluyente sólido y un diluyente líquido, comprendiendo además dichas composiciones opcionalmente al menos un compuesto o agente adicional biológicamente activo.

50 También son dignas de mención como realizaciones de la presente invención, las composiciones para controlar una plaga de invertebrados que comprenden una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de cualquiera de las Realizaciones precedentes, así como cualquier otra realización descrita en este documento, y cualquier combinación de las mismas, y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en un tensioactivo, un diluyente sólido y un diluyente líquido, comprendiendo además opcionalmente dicha composición una cantidad biológicamente eficaz de al menos un compuesto o agente adicional biológicamente activo. Las realizaciones de la

invención también incluyen métodos para controlar una plaga de invertebrados que comprende poner en contacto la plaga de invertebrados o su entorno con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de cualquiera de las Realización precedentes (por ejemplo, como una composición descrita en este documento).

5 Las realizaciones de la invención también incluyen una composición que comprende un compuesto de cualquiera de las Realizaciones anteriores, en forma de una formulación líquida para empapar el suelo. Las realizaciones de la invención también incluyen métodos para controlar una plaga de invertebrados que comprenden poner en contacto el suelo con una composición líquida como un empape de suelo que comprende una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de cualquiera de las Realizaciones anteriores.

10 Las realizaciones de la invención incluyen además una composición de pulverización para controlar una plaga de invertebrados que comprende una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de cualquiera de las Realización anteriores y un propulsor. Las realizaciones de la invención incluyen además una composición cebo para controlar una plaga de invertebrados que comprende una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de cualquiera de las Realizaciones anteriores, uno o más materiales comestibles, opcionalmente un atrayente y opcionalmente un humectante. Las realizaciones de la invención también incluyen un dispositivo para controlar una plaga de invertebrados que comprende dicha composición cebo y una carcasa adaptada para recibir dicha composición cebo, en donde la carcasa tiene al menos una abertura dimensionada para permitir que la plaga de invertebrados pase a través de la abertura de manera que la plaga de invertebrados pueda acceder a dicha composición cebo desde una posición exterior a la carcasa, y en donde la carcasa está adaptada además para colocarse dentro o cerca de un lugar de potencial o conocida actividad para la plaga de invertebrados.

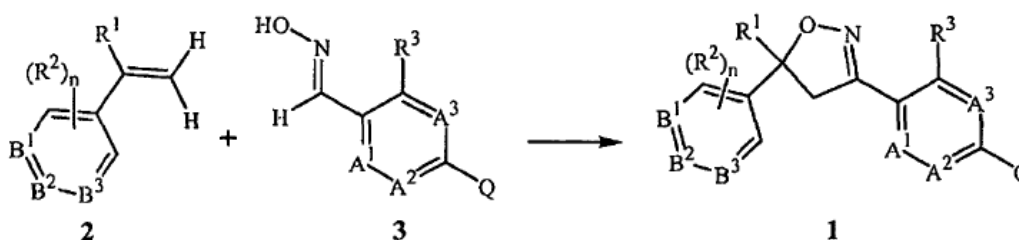
20 Las realizaciones de la invención incluyen también un método para proteger una semilla de una plaga de invertebrados que comprende poner en contacto la semilla con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto cualquiera de las Realizaciones anteriores. Las realizaciones de la invención incluyen además una semilla tratada que comprende un compuesto de cualquiera de las Realizaciones anteriores en una cantidad de aproximadamente 0,0001 a 1% en peso de la semilla antes del tratamiento.

25 Las realizaciones de la invención incluyen además una composición para proteger un animal de una plaga parasitaria de invertebrados que comprende una cantidad parasiticidamente eficaz de un compuesto de cualquiera de las Realizaciones anteriores y al menos un vehículo. Las realizaciones de la invención también incluyen una composición que comprende un compuesto de cualquiera de las Realizaciones precedentes en una forma para la administración oral. Las realizaciones de la invención incluyen además un método para proteger a un animal de una plaga parasitaria de invertebrados que comprende administrar al animal una cantidad parasiticidamente eficaz de un compuesto de cualquiera de las Realizaciones anteriores.

30 Los compuestos de Fórmula 1 se pueden preparar mediante uno o más de los siguientes métodos y variaciones como se describe en los Esquemas 1 y 4-8. Las definiciones de R^1 , R^2 , R^3 , R^{25} , A^1 , A^2 , A^3 , B^1 , B^2 , B^3 , n , p y Q en los compuestos de Fórmulas 1-10 posteriores son como se definen anteriormente para la Fórmula 1 en el Compendio de la Invención. Los compuestos de Fórmulas 1a y 1b son subconjuntos de los compuestos de Fórmula 1. Los compuestos de Fórmula 2a son un subconjunto de los compuestos de Fórmula 2.

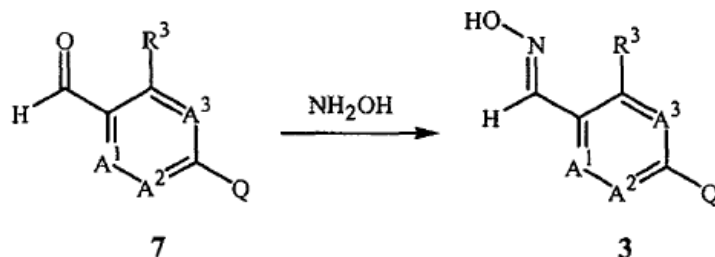
35 Los compuestos de Fórmula 1 se pueden preparar por la cicloadición de compuestos de Fórmula 2 con óxidos de nitrilo derivados de oximas de la Fórmula 3 tal como se resume en el Esquema 1. La reacción avanza típicamente a través de la intermediación de un cloruro de hidroxamilo generado in situ. En un procedimiento típico, se combina un reactivo de cloración tales como hipoclorito de sodio, N-clorosuccinimida, o cloramina-T con la oxima en presencia del estireno. Dependiendo de las condiciones pueden ser necesarias bases amina tales como piridina o trietilamina. La reacción se puede llevar a cabo en una amplia variedad de disolventes que incluyen tetrahidrofurano, éter dietílico, cloruro de metileno, dioxano y tolueno con temperaturas óptimas que oscilan desde la temperatura ambiente hasta la temperatura de reflujo del disolvente. El Ejemplo de Referencia 1, Etapa B, ilustra un procedimiento típico para esta reacción. Los procedimientos generales para la cicloadición de óxidos de nitrilo con olefinas están bien documentados en la bibliografía química. Para referencias relevantes véase Lee, Synthesis, 1982, 6, 508-509 y Kanemasa et al., Tetrahedron, 2000, 56, 1057-1064 además de las referencias citadas en esos documentos.

Esquema 1



Las oximas de Fórmula 3 están disponibles poniendo en contacto los aldehídos correspondientes de Fórmula 7 con hidroxilamina según los métodos conocidos como se muestra en el Esquema 4. Los aldehídos pueden prepararse mediante procedimientos sintéticos conocidos, y muchos son compuestos conocidos, estando algunos disponibles comercialmente.

Esquema 4

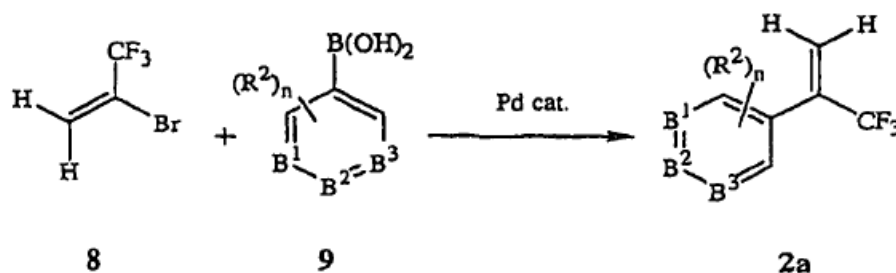


5

Un grupo especialmente útil de estirenos para la síntesis de compuestos de Fórmula 1 están representados por la Fórmula 2a tal como se muestra en el Esquema 5. Estos intermedios pueden prepararse mediante el acoplamiento catalizado por paladio de 2-bromo-3,3,3-trifluoropropeno (Fórmula 8) disponible comercialmente con ácidos arilborónicos de Fórmula 9. Los procedimientos generales para esta reacción están documentados en la bibliografía química, véase Pan et al., J. Fluorine Chemistry, 1999, 95, 167-170. Un procedimiento típico que usa condiciones modificadas se describe en el Ejemplo 1, Etapa A.

10

Esquema 5

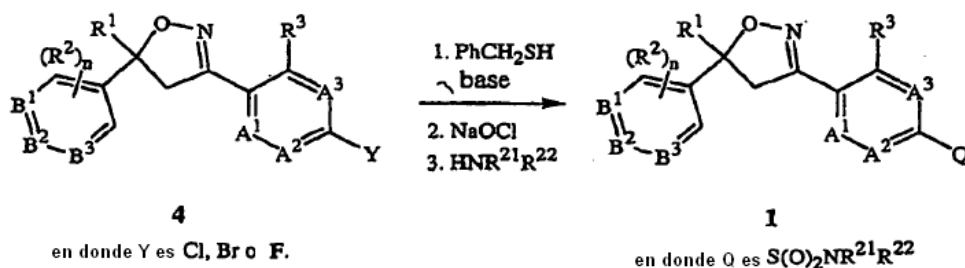


Los compuestos de Fórmula 1, en donde Q es $S(O)_2NR^{21}R^{22}$ pueden prepararse en tres etapas por desplazamiento directo de un haluro aromático de Fórmula 4 en donde Y es Cl, Br o F con un mercaptano tal como bencilmercaptano, seguido de oxidación al cloruro de sulfonilo y posterior conversión a la sulfonamida por reacción con una amina (Esquema 6). Reacciones de desplazamiento típicas implican el tratamiento del haluro aromático de Fórmula 4 con el mercaptano en un disolvente aprótico polar tal como *N,N*-dimetilformamida o *N,N*-dimetilacetamida y en presencia de una base inorgánica tal como carbonato de sodio, potasio o cesio. La oxidación del intermedio de benciltioéter al correspondiente cloruro de sulfonilo se consigue fácilmente con hipoclorito sódico al 5%, (lejía comercial) en disolventes tales como cloruro de metileno o cloroformo. La conversión a la sulfonamida se consigue mediante procedimientos conocidos de la bibliografía que implican el tratamiento del cloruro de sulfonilo con una amina ($HNR^{21}R^{22}$) en presencia de un barredor ácido tal como piridina, trietilamina u otras bases aminas. En ciertos casos, puede ser conveniente usar amina en exceso tanto como el nucleófilo como barredor ácido. El Ejemplo 4 ilustra un procedimiento típico para preparar compuestos de Fórmula 1 en donde Q es $S(O)_2NR^{21}R^{22}$.

15

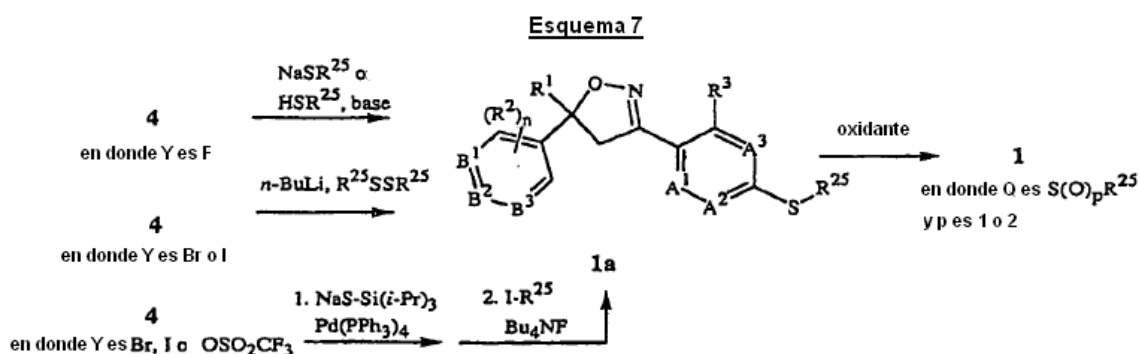
20

Esquema 6



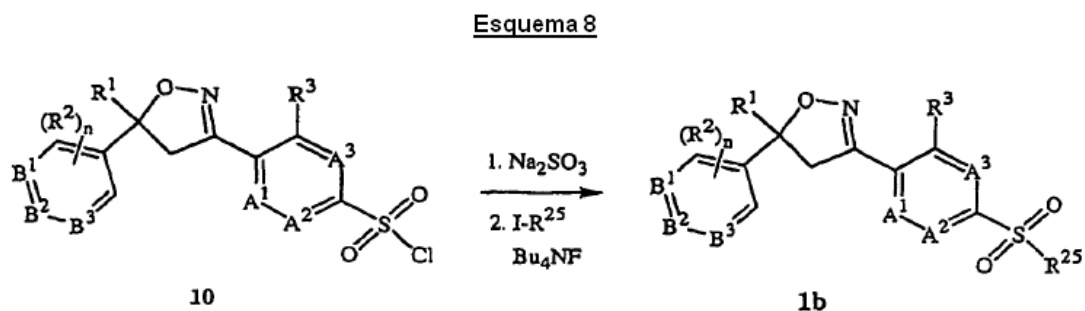
25

Los compuestos de Fórmula 1a (es decir, Fórmula 1 en donde Q es S(O)_pR²⁵ y p es 0) pueden prepararse por desplazamiento directo de un haluro aromático de Fórmula 4 en donde Y es Cl, Br o F con un mercaptano o su sal de metal alcalino, tal como metilmercaptano o tiometóxido sódico. La oxidación del grupo tioéter de la Fórmula 1a al grupo sulfinilo o sulfonilo (es decir, Fórmula 1 en donde Q es S(O)_pR²⁵ y p es 1 o 2) puede lograrse por métodos muy familiares a un experto en la técnica (Esquema 7). La reacción de desplazamiento típica implica el tratamiento del haluro aromático de Fórmula 4 con el mercaptano en un disolvente aprótico polar tal como *N,N*-dimetilformamida o *N,N*-dimetilacetamida y en presencia de una base inorgánica tal como carbonato de sodio, potasio o cesio, o por el uso de una sal del mercaptano (como se muestra en el Esquema 7). La sal de mercaptano está disponible comercialmente o puede prepararse de forma separada por tratamiento del mercaptano con una base fuerte tal como hidruro sódico. La oxidación de los compuestos de tioéter de Fórmula 1a a los compuestos de sulfinilo o sulfonilo de Fórmula 1 en donde Q es S(O)_pR²⁵ y p es 1 o 2, se consigue fácilmente por reacción con metaperyodato sódico o Oxone[®] (peroximonosulfato de potasio) en disolventes tales como agua o alcoholes, o ácido 3-cloroperoxisulfónico (MCPBA) en disolventes tales como cloruro de metileno o cloroformo.



De forma alternativa, los compuestos de Fórmula 1a pueden prepararse por intercambio metal-halógeno de un haluro aromático de Fórmula 4 en donde Y es Br o I con *n*-BuLi, seguido por reacción con un reactivo que contiene azufre (por ejemplo, disulfuro de etilo o metanotiol sulfonato de metilo). Los compuestos de Fórmula 1a pueden prepararse también por reacción catalizada por metal de transición de un haluro aromático o trifluorometanosulfonato de Fórmula 4 en donde Y es Br, I o OSO₂CF₃ con una sal de mercaptano tal como sal sódica de triisopropilsililmercaptano o sulfonato sódico, seguido por alquilación con un haluro tal como I-R²⁵ en presencia de un catalizador de transferencia de fase tal como fluoruro de tetrabutilamonio. El Ejemplo 5 ilustra el procedimiento típico para preparar compuestos de Fórmula 1 en donde Q es S(O)_pR²⁵ y p es 0. Los Ejemplos 6 y 7 ilustran los procedimientos típicos para preparar compuestos de Fórmula 1 en donde Q es S(O)_pR²⁵ y p es 2.

Los compuestos de Fórmula 1b (es decir, Fórmula 1 en donde Q es S(O)_pR²⁵ y p es 2) pueden prepararse por tratamiento de un cloruro de sulfinilo de Fórmula 10 con reactivos reductores como sulfito sódico (Na₂SO₃), seguido por tratamiento de la sal de sulfonato resultante con un agente alquilante y base para proporcionar la sulfona de Fórmula 1b.



Los cloruros de sulfinilo de Fórmula 10 pueden prepararse mediante las reacciones ilustradas en el Esquema 6 que implican desplazamiento directo de un haluro de arilo de Fórmula 4 con un mercaptano tal como bencilmercaptano seguido por oxidación al cloruro de sulfinilo.

Los compuestos de Fórmula 4 pueden prepararse de forma análoga mediante los métodos descritos para los compuestos de Fórmula 1 en el Esquema 1.

Se reconoce que algunos reactivos y condiciones de reacción descritos anteriormente para preparar compuestos de Fórmula 1 pueden no ser compatibles con ciertas funcionalidades presentes en el intermedio. En estos casos, la incorporación de secuencias de protección/desprotección o interconversiones de grupos funcionales en la síntesis ayudará a obtener los productos deseados. El uso y elección de los grupos protectores será evidente para un

experto en la síntesis química (véase, por ejemplo, Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. *Protective Groups in Organic Synthesis*, 2ª ed.; Wiley: Nueva York, 1991). Un experto en la técnica reconocerá que, en algunos casos, después de la introducción de un reactivo dado como se representa en cualquier esquema individual, puede ser necesario realizar etapas sintéticas de rutina adicionales no descritas en detalle para completar la síntesis de los compuestos de Fórmula 1. Un experto en la técnica reconocerá también que puede ser necesario realizar una combinación de las etapas ilustradas en los esquemas anteriores en un orden distinto del implicado por la secuencia particular presentada para preparar los compuestos de Fórmula 1.

El experto en la técnica reconocerá también que los compuestos de Fórmula 1 y los intermedios descritos en este documento se pueden someter a diversas reacciones electrófilas, nucleófilas, radicálicas, organometálicas, de oxidación y de reducción para añadir sustituyentes o modificar los sustituyentes existentes.

Sin elaboración adicional, se cree que el experto en la técnica, usando la descripción anterior, puede utilizar la presente invención a su alcance más completo. Por lo tanto, los siguientes Ejemplos pretenden ser únicamente ilustrativos y no limitantes de la descripción de ningún modo. Los espectros ^1H RMN se presentan en ppm campo abajo del tetrametilsilano; "s" significa singlete, "d" significa duplete, "t" significa triplete, "q" significa cuadruplete, "AB q" significa cuadruplete AB, "m" significa multiplete, "dd" significa duplete de dupletes, "dt" significa duplete de tripletes, "br s" significa singlete ancho y "br t" significa triplete ancho.

Ejemplo de Referencia 1

Preparación de 5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-3-[4-(1*H*-pirazol-1-il)fenil]-5-(trifluorometil)isoxazol

Etapa A: Preparación de 1,3-dicloro-5-[1-(trifluorometil)etenil]benceno

A una mezcla de tetrahidrofurano (33 mL), etilenglicoldimetiléter (33 mL), e hidróxido de potasio acuoso 4 N (33 mL) en un tubo sellado de 200 mL de Fisher-Porter se añadió ácido 3,5-diclorofenilborónico (8,72 g, 45,7 mmoles) y 2-bromo-3,3,3-trifluoropropeno (10,0 g, 57,2 mmoles), seguido por la adición de tetrakis(trifenilfosfina)-paladio (0) (264 mg, 0,229 mmoles). La mezcla se calentó a 75°C durante 3 h. Luego la mezcla de reacción se repartió entre dietiléter y agua. El extracto acuoso se lavó con éter dietílico (2 x 20 mL). Los extractos orgánicos se combinaron, se secaron (MgSO_4) y se concentraron a presión reducida para proporcionar un residuo. El residuo se purificó por cromatografía en gel de sílice y se eluyó con hexano para proporcionar 4,421 g del compuesto del título como un aceite claro.

^1H RMN (CDCl_3) δ 7,41 (s, 2H), 7,33 (s, 1H), 6,04 (d, 1H), 5,82 (d, 1H).

Etapa B: Preparación de 5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-3-[4-(1*H*-pirazol-1-il)fenil]-5-(trifluorometil)isoxazol

A una disolución de 4-(1*H*-pirazol-1-il)benzaldehído (1,0 g, 5,81 mmoles) en etanol (50 mL) se añadió una disolución acuosa de hidroxilamina al 50% en peso (1,0 mL, 15,2 mmoles). La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 3 h. La mezcla se concentró a presión reducida para dar un aceite ceroso, que se purificó por cromatografía en gel de sílice para proporcionar la oxima de [C(E)]-4-(1*H*-pirazol-1-il)benzaldehído como un sólido blanco (923 mg). Entonces a una disolución de la oxima de [C(E)]-4-(1*H*-pirazol-1-il)benzaldehído (923 mg, 4,94 mmoles) y 1,3-dicloro-5-(1-(trifluorometil)etenil]benceno (es decir, el producto del Ejemplo 1, Etapa A) (1,31 g, 5,44 mmoles) en tetrahidrofurano (25 mL) se añadió disolución acuosa de hipoclorito sódico (25 mL). Después de agitar toda la noche a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se repartió entre acetato de etilo y agua, y el extracto acuoso se extrajo adicionalmente con acetato de etilo dos veces. Los extractos orgánicos se combinaron, se secaron (MgSO_4) y se concentraron, y el sólido residual se purificó por cromatografía en gel de sílice y se eluyó con un gradiente de 0-50% de acetato de etilo en hexano para proporcionar el producto del título, un compuesto de la presente invención, como un sólido blanco (617 mg), p.f. 174-175°C.

^1H RMN ($\text{DMSO}-d_6$) δ 8,63 (d, 1H), 8,00 (d, 2H), 7,84 (m, 4H), 7,64 (d, 2H), 6,60 (m, 1H), 4,38 (AB q, 2H).

Ejemplo de Referencia 2

Preparación de 5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-3-[3-metil-4-(1*H*-pirazol-1-il)fenil]-5-(trifluorometil)isoxazol

Etapa A: Preparación de la oxima de [C(E)]-4-fluoro-3 metilbenzaldehído

A una disolución de 4-fluoro-3-metilbenzaldehído (5,0 g, 36,2 mmoles) en etanol (100 mL) se añadió disolución acuosa de hidroxilamina al 50% en peso (5,0 mL, 76,0 mmoles). La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 3 h. Después la mezcla se concentró a presión reducida para dar un aceite ceroso, que se purificó por cromatografía en gel de sílice y se eluyó con un gradiente de 0-25% de acetato de etilo en hexano para proporcionar el compuesto del título como un sólido blanco (4,971 g), p.f. 79-80°C.

^1H RMN (CDCl_3) δ 8,08 (s, 1H), 7,51 (br s, 1H), 7,43 (d, 1H), 7,36 (m, 1H), 7,01 (t, 1H), 2,29 (s, 3H).

Etapa B: Preparación de 5-(3,5-diclorofenil)-3-4-fluoro-3-metilfenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)isoxazol

5 A una disolución de oxima de [C(E)]-4-fluoro-3-metilbenzaldehído (es decir, el producto de la Etapa A) (4,971 g, 32,5 mmoles), 1,3-dicloro-5-(1-trifluorometil)etil]benceno (es decir, el producto del Ejemplo 1, Etapa A) (8,684 g, 35,7 mmoles), y tetrahidrofurano (200 mL), se añadió disolución acuosa de hipoclorito sódico (200 mL). Después de agitar 1 h a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se repartió entre acetato de etilo y agua, el extracto acuoso se extrajo adicionalmente con acetato de etilo dos veces. Los extractos orgánicos se combinaron, se secaron (MgSO₄), se concentraron, y el sólido residual se purificó por cromatografía en gel de sílice y se eluyó con un gradiente de acetato de etilo al 0-25% en hexano para proporcionar el compuesto del título como un aceite ceroso amarillo (10,515 g).

¹H RMN (CDCl₃) δ 7,52 (m, 3H), 7,45 (m, 1H), 7,41 (t, 1H), 7,05 (t, 1H), 4,07 (d, 1H), 3,68 (d, 1H), 2,29 (s, 3H).

10 Etapa C: Preparación de 5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-3-[3-metil-4-(1H-pirazol-1-il)fenil]-5-(trifluorometil)isoxazol

15 A una mezcla de carbonato de potasio (1,0 g, 7,24 mmoles) y pirazol (0,50 g, 7,35 mmoles) en *N,N*-dimetilformamida (5 mL), se añadió 5-(3,5-diclorofenil)-3-(4-fluoro-3-metilfenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)isoxazol (es decir, el producto de la Etapa B) (0,50 g, 1,27 mmoles). La mezcla de reacción se agitó vigorosamente durante 36 h a 120°C. Entonces la mezcla de reacción se absorbió en gel de sílice, se concentró, y se purificó por cromatografía en columna rápida en gel de sílice y se eluyó con un gradiente de acetato de etilo al 0-25% en hexano para proporcionar el producto del título, un compuesto de la presente invención, como un aceite amarillo (32,0 mg).

¹H RMN (CDCl₃) δ 7,75 (d, 1H), 7,64 (d, 2H), 7,58 (dd, 1H), 7,52 (d, 2H), 7,43 (m, 2H), 6,48 (t, 1H), 4,11 (d, 1H), 3,73 (d, 1H), 2,34 (s, 3H).

Ejemplo 4

20 Preparación de 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-2-metil-*N*-(2-piridinilmetil)-bencenosulfonamida

Etapa A: Preparación de 5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-3-[3-metil-4-[(fenilmetil)tio]fenil]-5-trifluorometil)isoxazol

25 A una disolución de 5-(3,5-diclorofenil)-3-(4-fluoro-3-metilfenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)isoxazol (es decir, el producto de la Etapa B del Ejemplo 2) (2,6 g, 6,65 mmoles) y carbonato de potasio (2,3 g, 16,6 mmoles) en *N,N*-dimetilformamida (25 mL) se añadió bencilmercaptano (0,782 mL, 6,65 mmoles). La mezcla de reacción se calentó a 90°C durante 4 h. La mezcla de reacción se enfrió entonces y se añadió agua en exceso, y la mezcla se extrajo con acetato de etilo (2 X 100 mL). Los extractos orgánicos se secaron (MgSO₄) y se concentraron a presión reducida para proporcionar un residuo sólido. El producto en bruto se purificó parcialmente por cromatografía de columna en gel de sílice eluído con mezclas de hexano y acetato de etilo para proporcionar un producto que contiene el compuesto del título (aproximadamente 80% de pureza, 2,8 g).

¹H RMN (CDCl₃) δ 7,50 (s, 2H), 7,41 (s, 2H), 7,42 (m, 2H), 7,26-7,40 (m, 7H), 4,16 (s, 2H), 4,1 (d, 1H), 3,65 (d, 1H).

Etapa B: Preparación de cloruro de 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-2-metilbencenosulfonilo

35 A una disolución de 5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-3-[3-metil-4-[(fenilmetil)tio]fenil]-5-(trifluorometil)isoxazol (es decir, el producto de la Etapa A) (2,88 g, 5,8 mmoles) en cloruro de metileno (50 mL) y agua (50 mL) se añadió ácido clorhídrico concentrado (1,92 mL, 20 mmoles) a 5°C, seguido por adición en gotas de hipoclorito sódico (6,15% - marca Clorox[®]) (50 mL). La mezcla de reacción se agitó entonces de forma vigorosa durante 1 h. La mezcla de reacción se añadió a cloruro de metileno (100 mL) y se lavó con agua (2 X 100 mL). Los extractos orgánicos se secaron (MgSO₄) y se concentraron para proporcionar el producto del título como un aceite (3,1 g).

40 ¹H RMN (CDCl₃) δ 8,15-7,3 (m, 6H), 4,1 (d, 1H), 3,7 (d, 1H), 2,83 (s, 3H).

Etapa C: Preparación de 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-2-metil-*N*-(2-piridinilmetil)-bencenosulfonamida

45 A una disolución de cloruro de 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-2-metilbencenosulfonilo (es decir, el producto de la Etapa B) (0,2 g, 0,42 mmoles) en acetonitrilo (20 mL), se añadió 2-(aminometil)piridina (0,108 mL, 1,05 mmoles). La mezcla de reacción se calentó a reflujo, y después se dejó agitar a temperatura ambiente durante 0,5 h. La mezcla se concentró entonces a sequedad y el producto en bruto se purificó por cromatografía en gel de sílice usando hexano:acetato de etilo (80:20) como eluyente. El producto aislado se trituró con una mezcla de éter y hexano para proporcionar el producto del título, un compuesto de la presente invención, como un sólido blanco (59 mg), p.f. 57-58°C.

50 ¹H RMN (CDCl₃) δ 8,47 (d, 1H), 8,04 (d, 1H), 7,50-7,6 (m, 5H), 7,43 (s, 1H), 7,16 (m, 1H), 7,09 (d, 1H), 6,24 (br t, 1H), 4,23 (d, 1H), 4,04 (d, 1H), 3,71 (d, 1H), 2,70 (s, 1H).

Ejemplo 5

Preparación de 5-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-2-(metiltio)benzonitrilo

5 A una suspensión agitada de tiometóxido sódico (0,21 g, 3 mmoles) y carbonato de potasio (0,28 g, 2 mmoles) en 4 mL de *N,N* dimetilformamida, se añadió una disolución de 5-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-2-fluorobenzonitrilo (preparado por un método similar al Ejemplo 2, Etapa A y Etapa B; 1,00 g, 2,48 mmoles) en *N,N*-dimetilformamida (6 mL). Esta mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 1 h. Entonces se añadió la parte adicional de tiometóxido sódico (0,21 g, 3 mmoles). Después de 15 minutos adicionales, se añadió agua, y la mezcla se extrajo sucesivamente con dietiléter y acetato de etilo. Los extractos orgánicos se combinaron y se lavaron varias veces con agua y disolución acuosa saturada de cloruro sódico, y después se secó sobre sulfato de magnesio, y se concentró para dejar un sólido de color crudo. El sólido se trituró con una mezcla de dietiléter y hexanos, se recogió en un lavador de vidrio, y se secó al aire para proporcionar el compuesto del título, un compuesto de la presente invención, como un sólido blanco (1,04 g).

^1H RMN (acetona- d_6) δ 8,0-8,1 (m, 2H), 7,66 (s, 2H), 7,62 (s, 1H), 7,6 (m, 1H), 4,45 (d, 1H), 4,29 (d, 1H).

Ejemplo 6

Preparación de 5-[(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-2-(metilsulfonil)benzonitrilo

15 A una disolución de 5-[(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-2-(metiltio)benzonitrilo (es decir, el producto del Ejemplo 5) (0,42 g, 1,0 mmol) en 20 mL de diclorometano se añadió ácido 3-cloroperóxibenzoico (0,90 g de perácido a ~77%, 4,0 mmoles) en una porción, y la mezcla se agitó a temperatura ambiente toda la noche. Se añadió disolución acuosa de bisulfito sódico, y después de varios minutos se añadió carbonato de potasio sólido. Las fases se separaron, y la fase orgánica se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró para dejar un sólido. El sólido se trituró con una mezcla de dietiléter y hexanos, se recogió en un lavador de vidrio, y se secó al aire para proporcionar el compuesto del título, un compuesto de la presente invención, como un sólido blanco (0,38 g).

^1H RMN (acetona- d_6) δ 8,42 (s, 1H), 8,38 (m, 1H), 8,26 (m, 1H), 7,67 (s, 3H), 4,59 (d, 1H), 4,41 (d, 1H), 3,39 (s, 3H).

Ejemplo 7

Preparación de 5-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-3-[4-(metilsulfonil)fenil]-5-(trifluorometil)isoxazol

25 Etapa A: Preparación de 3-(4-bromofenil)-5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)isoxazol

30 A una disolución de 4-bromobenzaldehído (3,70 g, 20 mmoles) en etanol (30 mL) se añadió hidroxilamina acuosa al 50% (1,25 mL, 21 mmoles) y ácido acético glacial (1,25 mL, 21 mmoles). Después de 30 minutos, la mezcla de reacción se diluyó con acetato de etilo y se lavó con agua y con disolución acuosa saturada de cloruro sódico, se secó sobre sulfato de magnesio, y se concentró hasta dejar un sólido blanco. A una disolución de este sólido en tetrahidrofurano (80 mL) y 1,3-dicloro-5-[1-(trifluorometil)etenil]benceno (es decir, el producto del Ejemplo 1, Etapa A) (4,82 g, 20 mmoles) se añadió una disolución acuosa de hipoclorito sódico (6,15% - marca Clorox[®]) (80 mL) en gotas durante 1 h. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 16 h. Las fases se separaron, y la fase acuosa se extrajo una vez con dietiléter. Las fases orgánicas combinadas se lavaron con disolución acuosa saturada de bisulfito sódico y disolución acuosa saturada de cloruro sódico, y se secaron sobre sulfato de magnesio, y se concentraron para dejar un sólido blanco. Este sólido se trituró con hexanos calientes (40°C), se dejó enfriar, y los sólidos se recogieron en un lavador de vidrio y se secaron para obtener el producto del título como un sólido blanco (5,25 g).

^1H RMN (CDCl₃) δ 7,5 - 7,6 (m, 6H), 7,43 (s, 1H), 4,06 (d, 1H), 3,68 (d, 1H)

Etapa B: Preparación de 5-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-3--4-(metilsulfonil)fenil]-5-(trifluorometil)isoxazol

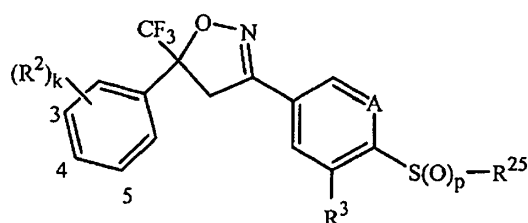
40 A una disolución de 3-(4-bromofenil)-5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)isoxazol (es decir, el producto de la Etapa A) (4,39 mg, 100 mmoles) en tetrahidrofurano (10 mL) enfriada por debajo de -75°C se añadió una disolución de *n*-butil-litio (disolución 2,5 M en hexanos) en gotas durante tres minutos, mientras se mantenía la temperatura a o por debajo de -72°C. En un minuto, se añadió en gotas metanosulfonotioato de S-metilo (0,11 mL, 1,2 mmoles). La mezcla de reacción se dejó agitar y calentar lentamente a temperatura ambiente, y después se vertió en disolución acuosa de hidróxido sódico 1N, y la mezcla se extrajo con acetato de etilo. La fase orgánica se lavó con disolución acuosa saturada de cloruro sódico, se secó sobre sulfato de magnesio, y se concentró. El residuo se sometió a cromatografía en gel de sílice eluido con acetato de etilo al 10% en hexanos. El material aislado se redisolvió en diclorometano (5 mL), se trató con ácido 3-cloroperóxibenzoico (~77%, 0,39 g, 1,7 mmoles) y se dejó agitar a temperatura ambiente durante 64 h. Se añadió ácido 3-cloroperóxibenzoico (~77%, 0,27 g, 1,2 mmoles) adicional, y la mezcla se agitó durante 4 h. A esta mezcla se añadió disolución acuosa saturada de bisulfito sódico, y después se añadió carbonato de potasio sólido cuidadosamente hasta que la evolución de gas cesó. Las fases se separaron, y la fase orgánica se lavó con disolución acuosa de hidróxido sódico 1N y con disolución acuosa saturada de cloruro sódico, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró. El residuo se trituró con dietiléter y hexanos para obtener un sólido que se recogió en un lavador de vidrio. El sólido se lavó con una mezcla de diéter y hexanos, y se secó para proporcionar el producto del título (0,12 g), un compuesto de la presente invención.

¹ H RMN (DMSO-d₆) δ 8,06 (m, 2H), 7,98 (m, 2H), 7,81 (s, 1 H), 7,64 (m, 2H), 4,43 (d, 1H), 4,37 (d, 1H), 3,27 (s, 3H).

Mediante los procedimientos descritos en este documento junto con métodos conocidos en la técnica, se pueden preparar los siguientes compuestos de las Tablas 1 y 2. Se usan las siguientes abreviaturas en las Tablas que siguen: -CN significa ciano, -NO₂ significa nitro, 2-Py significa 2-piridinilo, Ph significa fenilo, Me significa metilo, Et significa etilo, Pr significa propilo, *n* significa normal, *i* significa *iso*, *c* significa ciclo, *i*-Pr significa isopropilo, *c*-Pr significa ciclopropilo.

5

Tabla 1



en donde k es 1, 2, 3, 4 o 5.

$(R^2)_k$	R^3	A^3	p	R^{25}	$(R^2)_k$	R^3	A^3	p	R^{25}
3-Cl, 4-Cl	H	CH	0	Me	3-Cl, 5-Cl	H	CH	0	Me
3-Cl, 4-Cl	H	CH	0	CH ₂ F	3-Cl, 5-Cl	H	CH	0	CH ₂ F
3-Cl, 4-Cl	H	CH	0	CHF ₂	3-Cl, 5-Cl	H	CH	0	CHF ₂
3-Cl, 4-Cl	H	CH	0	Et	3-Cl, 5-Cl	H	CH	0	Et
3-Cl, 4-Cl	H	CH	0	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	CH	0	CH ₂ CF ₃
3-Cl, 4-Cl	H	CH	0	CH ₂ CN	3-Cl, 5-Cl	H	CH	0	CH ₂ CN
3-Cl, 4-Cl	H	CH	0	<i>n</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	H	CH	0	<i>n</i> -Pr
3-Cl, 4-Cl	H	CH	0	<i>i</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	H	CH	0	<i>i</i> -Pr
3-Cl, 4-Cl	H	CH	0	CH ₂ (2-Py)	3-Cl, 5-Cl	H	CH	0	CH ₂ (2-Py)
3-Cl, 4-Cl	H	CH	0	<i>c</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	H	CH	0	<i>c</i> -Pr
3-Cl, 4-Cl	H	CH	0	CH ₂ (<i>c</i> -Pr)	3-Cl, 5-Cl	H	CHF	0	CH ₂ (<i>c</i> -Pr)
3-Cl, 4-Cl	H	CH	0	CH ₂ C=CH ₂	3-Cl, 5-Cl	H	CH	0	CH ₂ C=CH ₂
3-Cl, 4-Cl	H	CH	0	CH ₂ C≡CH	3-Cl, 5-Cl	H	CH	0	CH ₂ C≡CH
3-Cl, 4-Cl	Me	CH	0	Me	3-Cl, 5-Cl	Me	CH	0	Me
3-Cl, 4-Cl	Me	CH	0	CH ₂ F	3-Cl, 5-Cl	Me	CH	0	CH ₂ F
3-Cl, 4-Cl	Me	CH	0	CHF ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	CH	0	CHF ₂
3-Cl, 4-Cl	Me	CH	0	Et	3-Cl, 5-Cl	Me	CH	0	Et
3-Cl, 4-Cl	Me	CH	0	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	CH	0	CH ₂ CF ₃
3-Cl, 4-Cl	Me	CH	0	CH ₂ CN	3-Cl, 5-Cl	Me	CH	0	CH ₂ CN
3-Cl, 4-Cl	Me	CH	0	<i>n</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	Me	CH	0	<i>n</i> -Pr
3-Cl, 4-Cl	Me	CH	0	<i>i</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	Me	CH	0	<i>i</i> -Pr
3-Cl, 4-Cl	Me	CH	0	CH ₂ (2-Py)	3-Cl, 5-Cl	Me	CH	0	CH ₂ (2-Py)
3-Cl, 4-Cl	Me	CH	0	<i>c</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	Me	CH	0	<i>c</i> -Pr
3-Cl, 4-Cl	Me	CH	0	CH ₂ (<i>c</i> -Pr)	3-Cl, 5-Cl	Me	CH	0	CH ₂ (<i>c</i> -Pr)
3-Cl, 4-Cl	Me	CH	0	CH ₂ C=CH ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	CH	0	CH ₂ C=CH ₂
3-Cl, 4-Cl	Me	CH	0	CH ₂ C≡CH	3-Cl, 5-Cl	Me	CH	0	CH ₂ C≡CH
3-Cl, 4-Cl	Cl	CH	0	Me	3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	0	Me
3-Cl, 4-Cl	Cl	CH	0	CH ₂ F	3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	0	CH ₂ F

ES 2 398 520 T3

$(R^2)_k$	R^3	A^3	p	R^{25}	$(R^2)_k$	R^3	A^3	p	R^{25}
3-Cl, 4-Cl	Cl	CH	0	CHF ₂	3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	0	CHF ₂
3-Cl, 4-Cl	Cl	CH	0	Et	3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	0	Et
3-Cl, 4-Cl	Cl	CH	0	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	0	CH ₂ CF ₃
3-Cl, 4-Cl	Cl	CH	0	CH ₂ CN	3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	0	CH ₂ CN
3-Cl, 4-Cl	Cl	CH	0	<i>n</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	0	<i>n</i> -Pr
3-Cl, 4-Cl	Cl	CH	0	<i>i</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	0	<i>i</i> -Pr
3-Cl, 4-Cl	Cl	CH	0	CH ₂ (2-Py)	3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	0	CH ₂ (2-Py)
3-Cl, 4-Cl	Cl	CH	0	<i>c</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	0	<i>c</i> -Pr
3-Cl, 4-Cl	Cl	CH	0	CH ₂ (<i>c</i> -Pr)	3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	0	CH ₂ (<i>c</i> -Pr)
3-Cl, 4-Cl	Cl	CH	0	CH ₂ C=CH ₂	3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	0	CH ₂ C=CH ₂
3-Cl, 4-Cl	Cl	CH	0	CH ₂ C≡CH	3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	0	CH ₂ C≡CH
3-Cl, 5-Cl	H	CH	1	Me	3-Cl, 5-Cl	H	CH	2	Me
3-Cl, 5-Cl	H	CH	1	CH ₂ F	3-Cl, 5-Cl	H	CH	2	CH ₂ F
3-Cl, 5-Cl	H	CH	1	CHF ₂	3-Cl, 5-Cl	H	CH	2	CHF ₂
3-Cl, 5-Cl	H	CH	1	Et	3-Cl, 5-Cl	H	CH	2	Et
3-Cl, 5-Cl	H	CH	1	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	CH	2	CH ₂ CF ₃
3-Cl, 5-Cl	H	CH	1	CH ₂ CN	3-Cl, 5-Cl	H	CH	2	CH ₂ CN
3-Cl, 5-Cl	H	CH	1	<i>n</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	H	CH	2	<i>n</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	H	CH	1	<i>i</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	H	CH	2	<i>i</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	H	CH	1	CH ₂ (2-Py)	3-Cl, 5-Cl	H	CH	2	CH ₂ (2-Py)
3-Cl, 5-Cl	H	CH	1	<i>c</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	H	CH	2	<i>c</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	H	CH	1	CH ₂ (<i>c</i> -Pr)	3-Cl, 5-Cl	H	CH	2	CH ₂ (<i>c</i> -Pr)
3-Cl, 5-Cl	H	CH	1	CH ₂ C=CH ₂	3-Cl, 5-Cl	H	CH	2	CH ₂ C=CH ₂
3-Cl, 5-Cl	H	CH	1	CH ₂ C≡CH	3-Cl, 5-Cl	H	CH	2	CH ₂ C≡CH
3-Cl, 5-Cl	Me	CH	1	Me	3-Cl, 5-Cl	Me	CH	2	Me
3-Cl, 5-Cl	Me	CH	1	CH ₂ F	3-Cl, 5-Cl	Me	CH	2	CH ₂ F
3-Cl, 5-Cl	Me	CH	1	CHF ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	CH	2	CHF ₂
3-Cl, 5-Cl	Me	CH	1	Et	3-Cl, 5-Cl	Me	CH	2	Et
3-Cl, 5-Cl	Me	CH	1	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	CH	2	CH ₂ CF ₃
3-Cl, 5-Cl	Me	CH	1	CH ₂ CN	3-Cl, 5-Cl	Me	CH	2	CH ₂ CN
3-Cl, 5-Cl	Me	CH	1	<i>n</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	Me	CH	2	<i>n</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	Me	CH	1	<i>i</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	Me	CH	2	<i>i</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	Me	CH	1	CH ₂ (2-Py)	3-Cl, 5-Cl	Me	CH	2	CH ₂ (2-Py)
3-Cl, 5-Cl	Me	CH	1	<i>c</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	Me	CH	2	<i>c</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	Me	CH	1	CH ₂ (<i>c</i> -Pr)	3-Cl, 5-Cl	Me	CH	2	CH ₂ (<i>c</i> -Pr)
3-Cl, 5-Cl	Me	CH	1	CH ₂ C=CH ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	CH	2	CH ₂ C=CH ₂
3-Cl, 5-Cl	Me	CH	1	CH ₂ C≡CH	3-Cl, 5-Cl	Me	CH	2	CH ₂ C≡CH
3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	1	Me	3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	2	Me
3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	1	CH ₂ F	3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	2	CH ₂ F
3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	1	CHF ₂	3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	2	CHF ₂

ES 2 398 520 T3

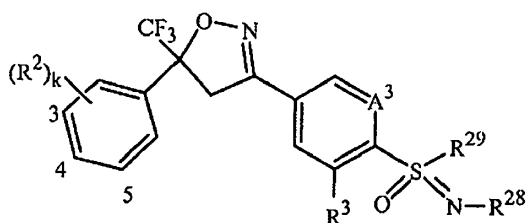
$(R^2)_k$	R^3	A^3	p	R^{25}	$(R^2)_k$	R^3	A^3	p	R^{25}
3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	1	Et	3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	2	Et
3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	1	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	2	CH ₂ CF ₃
3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	1	CH ₂ CN	3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	2	CH ₂ CN
3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	1	<i>n</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	2	<i>n</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	1	<i>i</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	2	<i>i</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	1	CH ₂ (2-Py)	3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	2	CH ₂ (2-Py)
3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	1	<i>c</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	2	<i>c</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	1	CH ₂ (<i>c</i> -Pr)	3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	2	CH ₂ (<i>c</i> -Pr)
3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	1	CH ₂ C=CH ₂	3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	2	CH ₂ C=CH ₂
3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	1	CH ₂ C≡CH	3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	2	CH ₂ C≡CH
3-Cl, 5-Cl	OMe	CH	0	Me	3-Cl, 5-Cl	CF ₃	CH	0	Me
3-Cl, 5-Cl	OMe	CH	0	CH ₂ F	3-Cl, 5-Cl	CF ₃	CH	0	CH ₂ F
3-Cl, 5-Cl	OMe	CH	0	CHF ₂	3-Cl, 5-Cl	CF ₃	CH	0	CHF ₂
3-Cl, 5-Cl	OMe	CH	0	Et	3-Cl, 5-Cl	CF ₃	CH	0	Et
3-Cl, 5-Cl	OMe	CH	0	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	CF ₃	CH	0	CH ₂ CF ₃
3-Cl, 5-Cl	OMe	CH	0	CH ₂ CN	3-Cl, 5-Cl	CF ₃	CH	0	CH ₂ CN
3-Cl, 5-Cl	OMe	CH	0	<i>n</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	CF ₃	CH	0	<i>n</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	OMe	CH	0	<i>i</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	CF ₃	CH	0	<i>i</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	OMe	CH	0	CH ₂ (2-Py)	3-Cl, 5-Cl	CF ₃	CH	0	CH ₂ (2-Py)
3-Cl, 5-Cl	OMe	CH	0	<i>c</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	CF ₃	CH	0	<i>c</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	OMe	CH	0	CH ₂ (<i>c</i> -Pr)	3-Cl, 5-Cl	CF ₃	CH	0	CH ₂ (<i>c</i> -Pr)
3-Cl, 5-Cl	OMe	CH	0	CH ₂ C=CH ₂	3-Cl, 5-Cl	CF ₃	CH	0	CH ₂ C=CH ₂
3-Cl, 5-Cl	OMe	CH	0	CH ₂ C≡CH	3-Cl, 5-Cl	CF ₃	CH	0	CH ₂ C≡CH
3-Cl, 5-Cl	OMe	CH	1	Me	3-Cl, 5-Cl	CF ₃	CH	1	Me
3-Cl, 5-Cl	OMe	CH	1	CH ₂ F	3-Cl, 5-Cl	CF ₃	CH	1	CH ₂ F
3-Cl, 5-Cl	OMe	CH	1	CHF ₂	3-Cl, 5-Cl	CF ₃	CH	1	CHF ₂
3-Cl, 5-Cl	OMe	CH	1	Et	3-Cl, 5-Cl	CF ₃	CH	1	Et
3-Cl, 5-Cl	OMe	CH	1	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	CF ₃	CH	1	CH ₂ CF ₃
3-Cl, 5-Cl	OMe	CH	1	CH ₂ CN	3-Cl, 5-Cl	CF ₃	CH	1	CH ₂ CN
3-Cl, 5-Cl	OMe	CH	1	<i>n</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	CF ₃	CH	1	<i>n</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	OMe	CH	1	<i>i</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	CF ₃	CH	1	<i>i</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	OMe	CH	1	CH ₂ (2-Py)	3-Cl, 5-Cl	CF ₃	CH	1	CH ₂ (2-Py)
3-Cl, 5-Cl	OMe	CH	1	<i>c</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	CF ₃	CH	1	<i>c</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	OMe	CH	1	CH ₂ (<i>c</i> -Pr)	3-Cl, 5-Cl	CF ₃	CH	1	CH ₂ (<i>c</i> -Pr)
3-Cl, 5-Cl	OMe	CH	1	CH ₂ C=CH ₂	3-Cl, 5-Cl	CF ₃	CH	1	CH ₂ C=CH ₂
3-Cl, 5-Cl	OMe	CH	1	CH ₂ C≡CH	3-Cl, 5-Cl	CF ₃	CH	1	CH ₂ C≡CH
3-Cl, 5-Cl	OMe	CH	2	Me	3-Cl, 5-Cl	CF ₃	CH	2	Me
3-Cl, 5-Cl	OMe	CH	2	CH ₂ F	3-Cl, 5-Cl	CF ₃	CH	2	CH ₂ F
3-Cl, 5-Cl	OMe	CH	2	CHF ₂	3-Cl, 5-Cl	CF ₃	CH	2	CHF ₂
3-Cl, 5-Cl	OMe	CH	2	Et	3-Cl, 5-Cl	CF ₃	CH	2	Et

ES 2 398 520 T3

$(R^2)_k$	R^3	A^3	p	R^{25}	$(R^2)_k$	R^3	A^3	p	R^{25}
3-Cl, 5-Cl	OMe	CH	2	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	CF ₃	CH	2	CH ₂ CF ₃
3-Cl, 5-Cl	OMe	CH	2	CH ₂ CN	3-Cl, 5-Cl	CF ₃	CH	2	CH ₂ CN
3-Cl, 5-Cl	OMe	CH	2	<i>n</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	CF ₃	CH	2	<i>n</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	OMe	CH	2	<i>i</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	CF ₃	CH	2	<i>i</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	OMe	CH	2	CH ₂ (2-Py)	3-Cl, 5-Cl	CF ₃	CH	2	CH ₂ (2-Py)
3-Cl, 5-Cl	OMe	CH	2	<i>c</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	CF ₃	CH	2	<i>c</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	OMe	CH	2	CH ₂ (<i>c</i> -Pr)	3-Cl, 5-Cl	CF ₃	CH	2	CH ₂ (<i>c</i> -Pr)
3-Cl, 5-Cl	OMe	CH	2	CH ₂ C=CH ₂	3-Cl, 5-Cl	CF ₃	CH	2	CH ₂ C=CH ₂
3-Cl, 5-Cl	OMe	CH	2	CH ₂ C≡CH	3-Cl, 5-Cl	CF ₃	CH	2	CH ₂ C≡CH
3-Cl, 5-Cl	CN	CH	0	Me	3-Cl, 5-Cl	CN	CH	1	Me
3-Cl, 5-Cl	CN	CH	0	CH ₂ F	3-Cl, 5-Cl	CN	CH	1	CH ₂ F
3-Cl, 5-Cl	CN	CH	0	CHF ₂	3-Cl, 5-Cl	CN	CH	1	CHF ₂
3-Cl, 5-Cl	CN	CH	0	Et	3-Cl, 5-Cl	CN	CH	1	Et
3-Cl, 5-Cl	CN	CH	0	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	CN	CH	1	CH ₂ CF ₃
3-Cl, 5-Cl	CN	CH	0	CH ₂ CN	3-Cl, 5-Cl	CN	CH	1	CH ₂ CN
3-Cl, 5-Cl	CN	CH	0	<i>n</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	CN	CH	1	<i>n</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	CN	CH	0	<i>i</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	CN	CH	1	<i>i</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	CN	CH	0	CH ₂ (2-Py)	3-Cl, 5-Cl	CN	CH	1	CH ₂ (2-Py)
3-Cl, 5-Cl	CN	CH	0	<i>c</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	CN	CH	1	<i>c</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	CN	CH	0	CH ₂ (<i>c</i> -Pr)	3-Cl, 5-Cl	CN	CH	1	CH ₂ (<i>c</i> -Pr)
3-Cl, 5-Cl	CN	CH	0	CH ₂ C=CH ₂	3-Cl, 5-Cl	CN	CH	1	CH ₂ C=CH ₂
3-Cl, 5-Cl	CN	CH	0	CH ₂ C≡CH	3-Cl, 5-Cl	CN	CH	1	CH ₂ C≡CH
3-Cl, 5-Cl	CN	CH	2	Me	3-Cl, 5-Cl	CN	CH	2	<i>i</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	CN	CH	2	CH ₂ F	3-Cl, 5-Cl	CN	CH	2	CH ₂ (2-Py)
3-Cl, 5-Cl	CN	CH	2	CHF ₂	3-Cl, 5-Cl	CN	CH	2	<i>c</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	CN	CH	2	Et	3-Cl, 5-Cl	CN	CH	2	CH ₂ (<i>c</i> -Pr)
3-Cl, 5-Cl	CN	CH	2	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	CN	CH	2	CH ₂ C=CH ₂
3-Cl, 5-Cl	CN	CH	2	CH ₂ CN	3-Cl, 5-Cl	CN	CH	2	CH ₂ C≡CH
3-Cl, 5-Cl	CN	CH	2	<i>n</i> -Pr					
3-Cl, 5-Cl	H	N	0	Me	3-Cl, 5-Cl	Cl	N	0	Me
3-Cl, 5-Cl	H	N	0	Et	3-Cl, 5-Cl	Cl	N	0	Et
3-Cl, 5-Cl	H	N	0	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Cl	N	0	CH ₂ CF ₃
3-Cl, 5-Cl	H	N	0	CH ₂ CN	3-Cl, 5-Cl	Cl	N	0	CH ₂ CN
3-Cl, 5-Cl	H	N	0	<i>n</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	Cl	N	0	<i>n</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	H	N	0	<i>i</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	Cl	N	0	<i>i</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	H	N	0	CH ₂ (2-Py)	3-Cl, 5-Cl	Cl	N	0	CH ₂ (2-Py)
3-Cl, 5-Cl	Me	N	0	Me	3-Cl, 5-Cl	OMe	N	0	Me
3-Cl, 5-Cl	Me	N	0	Et	3-Cl, 5-Cl	OMe	N	0	Et
3-Cl, 5-Cl	Me	N	0	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	OMe	N	0	CH ₂ CF ₃
3-Cl, 5-0	Me	N	0	CH ₂ CN	3-Cl, 5-Cl	OMe	N	0	CH ₂ CN

$(R^2)_k$	R^3	A^3	p	R^{25}	$(R^2)_k$	R^3	A^3	p	R^{25}
3-Cl, 5-Cl	Me	N	0	<i>n</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	OMe	N	0	<i>n</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	Me	N	0	<i>i</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	OMe	N	0	<i>i</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	Me	N	0	CH ₂ (2-Py)	3-Cl, 5-Cl	OMe	N	0	CH ₂ (2-Py)
3-Cl, 5-Cl	CF ₃	N	0	Me	3-Cl, 5-Cl	CN	N	0	Me
3-Cl, 5-Cl	CF ₃	N	0	Et	3-Cl, 5-Cl	CN	N	0	Et
3-Cl, 5-Cl	CF ₃	N	0	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	CN	N	0	CH ₂ CF ₃
3-Cl, 5-Cl	CF ₃	N	0	CH ₂ CN	3-Cl, 5-Cl	CN	N	0	CH ₂ CN
3-Cl, 5-Cl	CF ₃	N	0	<i>n</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	CN	N	0	<i>n</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	CF ₃	N	0	<i>i</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	CN	N	0	<i>i</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	CF ₃	N	0	CH ₂ (2-Py)	3-Cl, 5-Cl	CN	N	0	CH ₂ (2-Py)

Tabla 2



en donde k es 1, 2, 3, 4 o 5.

$(R^2)_k$	R^3	A^3	R^{28}	R^{29}	$(R^2)_k$	R^3	A^3	R^{28}	R^{29}
3-Cl, 5-Cl	H	CH	H	Me	3-Cl, 5-Cl	H	CH	COCF ₃	Me
3-Cl, 5-Cl	H	CH	H	Et	3-Cl, 5-Cl	H	CH	COCF ₃	Et
3-Cl, 5-Cl	H	CH	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	CH	COCF ₃	CH ₂ CF ₃
3-Cl, 5-Cl	H	CH	H	<i>i</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	H	CH	COCF ₃	<i>i</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	H	CH	H	<i>c</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	H	CH	COCF ₃	<i>c</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	H	Me	3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	COCF ₃	Me
3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	H	Et	3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	COCF ₃	Et
3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	COCF ₃	CH ₂ CF ₃
3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	H	<i>i</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	COCF ₃	<i>i</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	H	<i>c</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	COCF ₃	<i>c</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	Me	CH	H	Me	3-Cl, 5-Cl	Me	CH	COCF ₃	Me
3-Cl, 5-Cl	Me	CH	H	Et	3-Cl, 5-Cl	Me	CH	COCF ₃	Et
3-Cl, 5-Cl	Me	CH	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	CH	COCF ₃	CH ₂ CF ₃
3-Cl, 5-Cl	Me	CH	H	<i>i</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	Me	CH	COCF ₃	<i>i</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	Me	CH	H	<i>c</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	Me	CH	COCF ₃	<i>c</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	CN	CH	H	Me	3-Cl, 5-Cl	CN	CH	COCF ₃	Me
3-Cl, 5-Cl	CN	CH	H	Et	3-Cl, 5-Cl	CN	CH	COCF ₃	Et
3-Cl, 5-Cl	CN	CH	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	CN	CH	COCF ₃	CH ₂ CF ₃
3-Cl, 5-Cl	CN	CH	H	<i>i</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	CN	CH	COCF ₃	<i>i</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	CN	CH	H	<i>c</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	CN	CH	COCF ₃	<i>c</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	H	CH	CN	Me	3-Cl, 5-Cl	H	CH	NO ₂	Me
3-Cl, 5-Cl	H	CH	CN	Et	3-Cl, 5-Cl	H	CH	NO ₂	Et

$(R^2)_k$	R^3	A^3	R^{28}	R^{29}	$(R^2)_k$	R^3	A^3	R^{28}	R^{29}
3-Cl, 5-Cl	H	CH	CN	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	CH	NO ₂	CH ₂ CF ₃
3-Cl, 5-Cl	H	CH	CN	<i>i</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	H	CH	NO ₂	<i>i</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	H	CH	CN	<i>c</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	H	CH	NO ₂	<i>c</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	CN	Me	3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	NO ₂	Me
3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	CN	Et	3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	NO ₂	BE
3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	CN	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	NO ₂	CH ₂ CF ₃
3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	CN	<i>i</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	NO ₂	<i>i</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	CN	<i>c</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	Cl	CH	NO ₂	<i>c</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	Me	CH	CN	Me	3-Cl, 5-Cl	Me	CH	NO ₂	Me
3-Cl, 5-Cl	Me	CH	CN	Et	3-Cl, 5-Cl	Me	CH	NO ₂	Et
3-Cl, 5-Cl	Me	CH	CN	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	CH	NO ₂	CH ₂ CF ₃
3-Cl, 5-Cl	Me	CH	CN	<i>i</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	Me	CH	NO ₂	<i>i</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	Me	CH	CN	<i>c</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	Me	CH	NO ₂	<i>c</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	CN	CH	CN	Me	3-Cl, 5-Cl	CN	CH	NO ₂	Me
3-Cl, 5-Cl	CN	CH	CN	Et	3-Cl, 5-Cl	CN	CH	NO ₂	Et
3-Cl, 5-Cl	CN	CH	CN	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	CN	CH	NO ₂	CH ₂ CF ₃
3-Cl, 5-Cl	CN	CH	CN	<i>i</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	CN	CH	NO ₂	<i>i</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	CN	CH	CN	<i>c</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	CN	CH	NO ₂	<i>c</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	H	N	H	Me	3-Cl, 5-Cl	H	N	COCF ₃	Me
3-Cl, 5-Cl	H	N	H	Et	3-Cl, 5-Cl	H	N	COCF ₃	Et
3-Cl, 5-Cl	H	N	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	N	COCF ₃	CH ₂ CF ₃
3-Cl, 5-Cl	H	N	H	<i>i</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	H	N	COCF ₃	<i>i</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	H	N	H	<i>c</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	H	N	COCF ₃	<i>c</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	H	N	CN	Me	3-Cl, 5-Cl	H	N	NO ₂	Me
3-Cl, 5-Cl	H	N	CN	Et	3-Cl, 5-Cl	H	N	NO ₂	Et
3-Cl, 5-Cl	H	N	CN	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	N	NO ₂	CH ₂ CF ₃
3-Cl, 5-Cl	H	N	CN	<i>i</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	H	N	NO ₂	<i>i</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	H	N	CN	<i>c</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	H	N	NO ₂	<i>c</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	Cl	N	H	Me	3-Cl, 5-Cl	Cl	N	COCF ₃	Me
3-Cl, 5-Cl	Cl	N	H	Et	3-Cl, 5-Cl	Cl	N	COCF ₃	Et
3-Cl, 5-Cl	Cl	N	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Cl	N	COCF ₃	CH ₂ CF ₃
3-Cl, 5-Cl	Cl	N	H	<i>i</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	Cl	N	COCF ₃	<i>i</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	Cl	N	H	<i>c</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	Cl	N	COCF ₃	<i>c</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	Cl	N	CN	Me	3-Cl, 5-Cl	Cl	N	NO ₂	Me
3-Cl, 5-Cl	Cl	N	CN	Et	3-Cl, 5-Cl	Cl	N	NO ₂	Et
3-Cl, 5-Cl	Cl	N	CN	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Cl	N	NO ₂	CH ₂ CF ₃
3-Cl, 5-Cl	Cl	N	CN	<i>i</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	Cl	N	NO ₂	<i>i</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	Cl	N	CN	<i>c</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	Cl	N	NO ₂	<i>c</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	Me	N	H	Me	3-Cl, 5-Cl	Me	N	COCF ₃	Me
3-Cl, 5-Cl	Me	N	H	Et	3-Cl, 5-Cl	Me	N	COCF ₃	Et

$(R^2)_k$	R^3	A^3	R^{28}	R^{29}	$(R^2)_k$	R^3	A^3	R^{28}	R^{29}
3-Cl, 5-Cl	Me	N	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	N	COCF ₃	CH ₂ CF ₃
3-Cl, 5-Cl	Me	N	H	<i>i</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	Me	N	COCF ₃	<i>i</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	Me	N	H	<i>c</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	Me	N	COCF ₃	<i>c</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	Me	N	CN	Me	3-Cl, 5-Cl	Me	N	NO ₂	Me
3-Cl, 5-Cl	Me	N	CN	Et	3-Cl, 5-Cl	Me	N	NO ₂	Et
3-Cl, 5-Cl	Me	N	CN	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	N	NO ₂	CH ₂ CF ₃
3-Cl, 5-Cl	Me	N	CN	<i>i</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	Me	N	NO ₂	<i>i</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	Me	N	CN	<i>c</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	Me	N	NO ₂	<i>c</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	CN	N	H	Me	3-Cl, 5-Cl	CN	N	COCF ₃	Me
3-Cl, 5-Cl	CN	N	H	Et	3-Cl, 5-Cl	CN	N	COCF ₃	Et
3-Cl, 5-Cl	CN	N	H	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	CN	N	COCF ₃	CH ₂ CF ₃
3-Cl, 5-Cl	CN	N	H	<i>i</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	CN	N	COCF ₃	<i>i</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	CN	N	H	<i>c</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	CN	N	COCF ₃	<i>c</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	CN	N	CN	Me	3-Cl, 5-Cl	CN	N	NO ₂	Me
3-Cl, 5-Cl	CN	N	CN	Et	3-Cl, 5-Cl	CN	N	NO ₂	Et
3-Cl, 5-Cl	CN	N	CN	CH ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	CN	N	NO ₂	CH ₂ CF ₃
3-Cl, 5-Cl	CN	N	CN	<i>i</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	CN	N	NO ₂	<i>i</i> -Pr
3-Cl, 5-Cl	CN	N	CN	<i>c</i> -Pr	3-Cl, 5-Cl	CN	N	NO ₂	<i>c</i> -Pr

Formulación/Utilidad

Un compuesto de esta invención se usará generalmente como ingrediente activo de control de plagas de invertebrados en una composición, es decir, formulación, con al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos, que sirve como un vehículo. Los ingredientes de la formulación o composición se seleccionan para que sean coherentes con las propiedades físicas del ingrediente activo, modo de aplicación y factores medioambientales tales como tipo de suelo, humedad y temperatura.

Formulaciones útiles incluyen composiciones tanto líquidas como sólidas. Las composiciones líquidas incluyen disoluciones (incluyendo concentrados emulsionables), suspensiones, emulsiones (incluyendo microemulsiones y/o suspoemulsiones) y similares, que opcionalmente pueden espesarse hasta geles. Los tipos generales de composiciones líquidas acuosas son concentrado soluble, concentrado para suspensiones, suspensión para cápsulas, emulsión concentrada, microemulsión y suspoemulsión. Los tipos generales de composiciones líquidas no acuosas son concentrado emulsionable, concentrado microemulsionable, concentrado dispersable y dispersión en aceite.

Los tipos generales de composiciones sólidas son polvos de espolvoreo, polvos, gránulos, aglomerados, globulillos, pastillas, comprimidos, películas cargadas (incluyendo recubrimientos de semillas) y similares, que pueden ser dispersables en agua ("humectables") o solubles en agua. Las películas y los recubrimientos formados a partir de disoluciones formadoras de película o suspensiones fluidas son particularmente útiles para el tratamiento de semillas. El ingrediente activo puede estar (micro)encapsulado y formado además en una suspensión o formulación sólida; de forma alternativa, la formulación entera del ingrediente activo puede estar encapsulada (o "recubierta"). La encapsulación puede controlar o retrasar la liberación del ingrediente activo. Un gránulo emulsificable combina las ventajas tanto de una formulación de concentrado emulsificable como de una formulación granular seca. Las composiciones de alta resistencia se usan principalmente como intermedios para la formulación adicional.

Las formulaciones pulverizables se extienden típicamente en un medio adecuado antes de la pulverización. Tales formulaciones líquidas y sólidas se formulan para diluirse fácilmente en el medio de pulverización, normalmente agua. Los volúmenes de pulverización pueden oscilar de aproximadamente uno a varios miles de litros por hectárea, pero más típicamente están en el intervalo de aproximadamente diez a varios cientos de litros por hectárea. Las formulaciones pulverizables pueden mezclarse en depósito con agua u otro medio adecuado para el tratamiento foliar mediante aplicación aérea o terrestre, o para aplicación al medio de crecimiento de la planta. Las formulaciones líquidas y secas pueden dosificarse directamente en sistemas de irrigación por goteo o dosificarse en el surco durante el plantado. Las formulaciones líquidas y sólidas pueden aplicarse sobre semillas de cultivos y otra

vegetación deseable como tratamientos para semillas antes del plantado para proteger las raíces en desarrollo y otras partes subterráneas de la planta y/o el follaje a través de captación sistémica.

Las formulaciones contendrán típicamente cantidades eficaces de ingrediente activo, diluyente y tensioactivo, dentro de los siguientes intervalos aproximados que constituyen hasta 100 por cien en peso.

Porcentaje en Peso

	<u>Ingrediente activo</u>	<u>Diluyente</u>	<u>Tensioactivo</u>
Gránulos, Comprimidos y Polvos Dispersables en Agua y Solubles en Agua	0,001-90	0-99,999	0-15
Dispersiones en aceite, Suspensiones, Emulsiones, Disoluciones (incluyendo Concentrados Emulsionables)	1-50	40-99	0-50
Polvos de Espolvoreo	1-25	70-99	0-5
Gránulos y Aglomerados	0,001-99	5-99,999	0-15
Composiciones a Alta Resistencia	90-99	0-10	0-2

- 5 Los diluyentes sólidos incluyen, por ejemplo, arcillas tales como bentonita, montmorillonita, atapulgita y caolín, yeso, celulosa, dióxido de titanio, óxido de zinc, almidón, dextrina, azúcares (por ejemplo, lactosa, sacarosa), sílice, talco, mica, tierra diatomácea, urea, carbonato de calcio, carbonato y bicarbonato sódico y sulfato sódico. Se describen diluyentes sólidos típicos en Watkins et al., Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers, 2ª Ed., Dorland Books, Caldwell, Nueva Jersey.
- 10 Los diluyentes líquidos incluyen, por ejemplo, agua, *N,N*-dimetilalcanamidas (por ejemplo, *N,N*-dimetilformamida), limoneno, dimetilsulfóxido, *N*-alquilpirrolidonas (por ejemplo, *N*-metilpirrolidinona), etilenglicol, trietilenglicol, propilenglicol, dipropilenglicol, polipropilenglicol, carbonato de propileno, carbonato de butileno, parafinas (por ejemplo, aceites minerales blancos, parafinas normales, isoparafinas), alquilbencenos, alquilnaftalenos, glicerina, triacetato de glicerol, sorbitol, triacetina, hidrocarburos aromáticos, compuestos alifáticos desaromatizados, alquilbencenos, alquilnaftalenos, cetonas tales como ciclohexanona, 2-heptanona, isoforona y 4-hidroxi-4-metil-2-pentanona, acetatos tales como acetato de isoamilo, acetato de hexilo, acetato de heptilo, acetato de octilo, acetato de nonilo, acetato de tridecilo y acetato de isobornilo, otros ésteres tales como ésteres de lactato alquilados, ésteres dibásicos y γ -butirolactona, y alcoholes, que pueden ser lineales, ramificados, saturados o insaturados, tales como metanol, etanol, *n*-propanol, alcohol isopropílico, *n*-butanol, alcohol isobutílico, *n*-hexanol, 2-etilhexanol, *n*-octanol, decanol, alcohol isodecílico, isooctadecanol, alcohol cetílico, alcohol laurílico, alcohol tridecílico, alcohol oleílico, ciclohexanol, alcohol tetrahidrofurfurílico, diacetona alcohol y alcohol bencílico. Los diluyentes líquidos también incluyen ésteres de glicerol de ácidos grasos saturados e insaturados (típicamente C₆-C₂₂), tales como aceites de semillas y frutos de plantas (por ejemplo, aceites de oliva, ricino, linaza, sésamo, maíz, cacahuete, girasol, semillas de uva, cártamo, algodón, soja, colza, coco y almendra de palma), grasas de fuentes animales (por ejemplo, sebo de ternero, sebo de cerdo, manteca de cerdo, aceite de hígado de bacalao, aceite de pescado) y mezclas de los mismos. Los diluyentes líquidos también incluyen ácidos grasos alquilados (por ejemplo, metilados, etilados, butilados) en donde los ácidos grasos pueden obtenerse mediante hidrólisis de ésteres de glicerol procedentes de fuentes vegetales y animales, y pueden purificarse mediante destilación. Los diluyentes líquidos típicos se describen en Marsden, Solvents Guide, 2ª Ed., Interscience, Nueva York, 1950.
- 20
- 25
- 30 Las composiciones sólidas y líquidas de la presente invención a menudo incluyen uno o más tensioactivos. Cuando se añaden a un líquido, los tensioactivos (también conocidos como "agentes surfactantes") generalmente modifican, lo más a menudo reducen, la tensión superficial del líquido. Dependiendo de la naturaleza de los grupos hidrófilos y lipófilos en una molécula tensioactiva, los tensioactivos pueden ser útiles como agentes humectantes, dispersantes, emulsionantes o agentes antiespumantes.
- 35 Los tensioactivos pueden clasificarse como no iónicos, aniónicos o catiónicos. Tensioactivos no iónicos útiles para las presentes composiciones incluyen, aunque no se limitan a: alcoxilatos de alcohol tales como alcoxilatos de alcohol basados en alcoholes naturales y sintéticos (que pueden ser ramificados o lineales) y preparados a partir de los alcoholes y óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de los mismos; etoxilatos de amina, alcanolamidas y alcanolamidas etoxiladas; triglicéridos alcoxilados tales como aceites de soja, ricino y colza etoxilados; alcoxilatos de alquilfenol tales como etoxilatos de octilfenol, etoxilatos de nonilfenol, etoxilatos de dinonilfenol y etoxilatos de dodecilfenol (preparados a partir de los fenoles y óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de los mismos); polímeros de bloques preparados a partir de óxido de etileno u óxido de propileno y polímeros de bloques inversos donde los bloques terminales se preparan a partir de óxido de propileno; ácidos grasos etoxilados; ésteres y aceites grasos etoxilados; ésteres metílicos etoxilados; triestirilfenol etoxilado
- 40
- 45 (incluyendo los preparados a partir de óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de los mismos); ésteres de ácido graso, ésteres de glicerol, derivados basados en lanolina, ésteres de polietoxilato tales como ésteres de ácidos grasos de sorbitán polietoxilados, ésteres de ácidos grasos de sorbitol polietoxilados y

ésteres de ácidos grasos de glicerol polietoxilados; otros derivados de sorbitán tales como ésteres de sorbitán; tensioactivos poliméricos tales como copolímeros aleatorios, copolímeros de bloques, resinas alquídicas de peg (polietilenglicol), polímeros de injerto o tipo peine y polímeros de estrella; polietilenglicoles (pegs); ésteres de ácidos grasos de polietilenglicol; tensioactivos basados en silicona; y derivados de azúcar tales como ésteres de sacarosa, alquilpoliglicósidos y alquilpolisacáridos.

Tensioactivos aniónicos útiles incluyen, aunque no se limitan a: ácidos alquilarilsulfónicos y sus sales; etoxilatos de alcohol o alquilfenol carboxilados; derivados de sulfonato de difenilo; lignina y derivados de lignina tales como lignosulfonatos; ácidos maleico o succínico o sus anhídridos; sulfonatos de olefina; ésteres de fosfato tales como ésteres de fosfato de alcoxilatos de alcohol, ésteres de fosfato de alcoxilatos de alquilfenol y ésteres de fosfato de etoxilatos de estirilfenol; tensioactivos basados en proteínas; derivados de sarcosina; sulfato de estirilfenoléter; sulfatos y sulfonatos de aceites y ácidos grasos; sulfatos y sulfonatos de alquilfenoles etoxilados; sulfatos de alcoholes; sulfatos de alcoholes etoxilados; sulfonatos de aminas y amidas tales como *N,N*-alquiltauratos; sulfonatos de benceno, cumeno, tolueno, xileno y dodecil y tridecibencenos; sulfonatos de naftalenos condensados; sulfonatos de naftaleno y alquilnaftaleno; sulfonatos de petróleo fraccionado; sulfosuccinatos; y sulfosuccinatos y sus derivados tales como sales de dialquilsulfosuccinato.

Tensioactivos catiónicos útiles incluyen, aunque no se limitan a: amidas y amidas etoxiladas; aminas tales como *N*-alquilpropanodiaminas, tripropilentriaminas y dipropilentetraminas, y aminas etoxiladas, diaminas etoxiladas y aminas propoxiladas (preparadas a partir de las aminas y óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de los mismos); sales de amina tales como acetatos de amina y sales de diamina; sales de amonio cuaternario tales como sales cuaternarias, sales cuaternarias etoxiladas y sales dicuaternarias; y óxidos de amina tales como óxidos de alquildimetilamina y óxidos de bis-(2-hidroxietyl)-alquilamina.

También son útiles para las presentes composiciones las mezclas de tensioactivos no iónicos y aniónicos o mezclas de tensioactivos no iónicos y catiónicos. Tensioactivos no iónicos, aniónicos y catiónicos y sus usos recomendados se describen en una variedad de referencias publicadas que incluyen McCutcheon's Emulsifiers and Detergents, Ediciones Americana e Internacional anuales publicadas por McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; Sisely y Wood, Encyclopedia of Surface Active Agents, Chemical Publ. Co., Inc., Nueva York, 1964; y A. S. Davidson y B. Milwidsky, Synthetic Detergents, Séptima Edición, John Wiley and Sons, Nueva York 1987.

Las composiciones de esta invención también pueden contener auxiliares y aditivos de formulación, conocidos por los expertos en la técnica como asistentes de formulación (algunos de los cuales puede considerarse que también funcionan como diluyentes sólidos, diluyentes líquidos o tensioactivos). Dichos auxiliares y aditivos de formulación pueden controlar: el pH (tampones), la espumación durante el procesado (antiespumantes tales como poliorganosiloxanos), la sedimentación de ingredientes activos (agentes de suspensión), la viscosidad (espesantes tixotrópicos), el crecimiento microbiano dentro del recipiente (antimicrobianos), la congelación del producto (anticongelantes), el color (colorantes/dispersiones de pigmento), la eliminación por lavado (formadores de película o adherentes), la evaporación (retardantes de la evaporación) y otros atributos de la formulación. Los formadores de película incluyen, por ejemplo, poli(acetatos de vinilo), copolímeros de poli(acetato de vinilo), copolímero de polivinilpirrolidona-acetato de vinilo, poli(alcoholes vinílicos), copolímeros de poli(alcohol vinílico) y ceras. Ejemplos de auxiliares y aditivos de formulación incluyen los enumerados en McCutcheon's Volume 2: Functional Materials, ediciones Norteamericana e Internacional anuales publicadas por McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; y la Publicación PCT WO 03/024222.

El compuesto de Fórmula 1 y cualquier otro ingrediente activo se incorporan típicamente en las presentes composiciones disolviendo el ingrediente activo en un disolvente o triturando en un diluyente líquido o seco. Las disoluciones, que incluyen concentrados emulsificables, se pueden preparar por simple mezcla de los ingredientes. Si el disolvente de una composición líquida destinada al uso como un concentrado emulsificable es inmisible en agua, se añade típicamente un emulsionante para emulsionar el disolvente que contiene el agente activo en la dilución con agua. Las suspensiones de ingrediente activo, con diámetros de partícula de hasta 2.000 μm , pueden molerse en húmedo usando molinos de medios para obtener partículas con diámetros promedio por debajo de 3 μm . Las suspensiones acuosas puede convertirse en concentrados de suspensión acabados (véase, por ejemplo, el documento U.S. 3.060.084) o procesarse adicionalmente mediante secado por pulverización para formar gránulos dispersables en agua. Las formulaciones secas requieren habitualmente procedimientos de molienda en seco, que producen diámetros de partícula promedio en el intervalo de 2 a 10 μm . Los polvos de espolvoreo y los polvos pueden prepararse mediante mezcla y habitualmente molienda (tal como con un molino de martillos o un molino de energía de fluidos). Los gránulos y aglomerados se pueden preparar pulverizando el material activo sobre vehículos granulares preformados o por técnicas de aglomeración. Véase Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, 4 de diciembre de 1967, pp. 147-48, Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4^a Ed., McGraw-Hill, Nueva York, 1963, páginas 8-57 y siguientes, y el documento WO 91/13546. Los aglomerados pueden prepararse como se describe en el documento U.S. 4.172.714. Los gránulos dispersables en agua y solubles en agua pueden prepararse como se enseña en los documentos U.S. 4.144.050, U.S. 3.920.442 y DE 3.246.493. Los comprimidos pueden prepararse como se enseña en los documentos U.S. 5.180.587, U.S. 5.232.701 y U.S. 5.208.030. Las películas pueden prepararse como se enseña en los documentos GB 2.095.558 y U.S. 3.299.566.

5 Para información adicional respecto a la técnica de la formulación, véase T. S. Woods, "The Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture" en Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge, T. Brooks y T. R. Roberts, Eds., Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, pp. 120-133. Véase también el documento U.S. 3.235.361, de Col. 6, línea 16 a Col. 7, línea 19 y los Ejemplos 10-41; el documento U.S. 3.309.192, Col. 5, línea 43 a Col. 7, línea 62 y los Ejemplos 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138-140, 162-164, 166, 167 y 169-182; el documento U.S. 2.891.855, Col. 3, línea 66 a Col. 5, línea 17 y los Ejemplos 1-4; Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., Nueva York, 1961, páginas 81-96; Hance et al., Weed Control Handbook, 8ª Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989; y Developments in formulation technology, PJB Publications, Richmond, Reino Unido, 2000.

15 En los siguientes Ejemplos, todos los porcentajes están en peso y todas las formulaciones se preparan por las rutas convencionales. Los números de compuesto se refieren a los compuestos en las Tablas de índice A-C. Sin elaboración adicional, se cree que un experto en la técnica que use la descripción anterior puede utilizar la presente invención en su alcance más completo. Los Ejemplos siguientes se interpretan, por tanto, como meramente ilustrativos, y no limitantes de la descripción bajo ninguna forma en absoluto. Los porcentajes están en peso excepto cuando se indique otra cosa.

Ejemplo de Referencia A

Concentrado de Alta Potencia

Compuesto de Referencia 9	98,5%
aerogel de sílice	0,5%
sílice fino amorfo sintético	1,0%

Ejemplo de Referencia B

Polvo Humectable

Compuesto de Referencia 14	65,0%
Dodecifenol-polietilenglicol-éter	2,0%
Ligninsulfonato de sodio	4,0%
Silicoaluminato de sodio	6,0%
Montmorillonita (calcinada)	23,0%

Ejemplo de Referencia C

Gránulo

Compuesto de Referencia 26	10,0%
Gránulos de atapulgita (bajo contenido en materia volátil, 0,71/0,30 mm; Tamices U.S.S. N° 25-50)	90,0%

Ejemplo de Referencia D

Aglomerado Extruido

Compuesto de Referencia 38	25,0%
Sulfato de sodio anhidro	10,0%
Ligninsulfonato de calcio en bruto	5,0%
Alquilnaftalensulfonato de sodio	1,0%
Bentonita de calcio/magnesio	59,0%

Ejemplo de Referencia E

Concentrado Emulsionable

Compuesto de Referencia 42	10,0%
hexoleato de polioxietilensorbitol	20,0%
éster metílico de ácidos grasos C ₆ -C ₁₀	70,0%

Ejemplo de Referencia F

Microemulsión

Compuesto de Referencia 63	5,0%
Copolímero de polivinilpirrolidona-acetato de vinilo	30,0%
Alquilpoliglicósido	30,0%
Monooleato de glicerilo	15,0%
Agua	20,0%

Ejemplo de Referencia G

Tratamiento de semilla

Compuesto de Referencia 72	20,00%
Copolímero de polivinilpirrolidona-acetato de vinilo	5,00%
Cera ácida montana	5,00%
Ligninsulfonato de calcio	1,00%
Copolímeros de bloques de polioxietileno/polioxipropileno	1,00%
Alcohol estearílico (POE 20)	2,00%
Poliorganosilano	0,20%
Tinte de colorante rojo	0,05%
Agua	65,75%

Ejemplo H

Barra fertilizante

Compuesto 107	2,5%
Copolímero de pirrolidona-estireno	4,8%
16-Etoxilato de triestirilfenilo	2,3%
Talco	0,8%
Almidón de maíz	5,0%
Fertilizante de liberación lenta Nitrophoska® Permanent 15-9-15 (BASF)	36,0%
Caolín	38,0%
Agua	10,6%

Los compuestos de esta invención muestran actividad frente a un amplio espectro de plagas de invertebrados. Estas plagas incluyen invertebrados que habitan en una variedad de ambientes tales como, por ejemplo, follaje de plantas, raíces, suelo, cultivos cosechados u otros alimentos, estructuras de construcción o integumentos animales. Estas plagas incluyen, por ejemplo, invertebrados que se alimentan del follaje (incluyendo hojas, tallos, flores y frutas), semillas, lana, fibras textiles o sangre o tejidos animales, y que provocan por tanto lesión o daño, por ejemplo, a cultivos agronómicos en crecimiento o almacenados, bosques, cultivos de invernadero, plantas ornamentales, cultivos de vivero, alimentos almacenados o productos de fibras, o casas u otras estructuras o sus contenidos, o que son dañinos para la salud animal o la salud pública. Los expertos en la técnica apreciarán que no todos los compuestos son igualmente eficaces contra todos los estadios de crecimiento de todas las plagas.

- 5
- 10
- 15
- Estos compuestos y composiciones actuales son útiles por tanto agronómicamente para proteger los productos del campo de plagas de invertebrados fitófagos, y también no agronómicamente para proteger otros cultivos hortícolas y plantas de plagas de invertebrados fitófagos. Esta utilidad incluye proteger cultivos y otras plantas (es decir, tanto agronómicas como no agronómicas) que contienen material genético introducido por ingeniería genética (es decir, transgénicos) o modificados por mutagénesis para proporcionar rasgos ventajosos. Los ejemplos de dichos rasgos incluyen tolerancia a herbicidas, resistencia a plagas fitófagas (por ejemplo, insectos, ácaros, áfidos, arañas, nematodos, caracoles, hongos, bacterias y virus fitopatógenos), mejor crecimiento de plantas, mayor tolerancia a las condiciones de crecimiento adversas tales como altas o bajas temperaturas, baja o alta humedad del suelo y alta

salinidad, mayor florescencia o fructificación, mayores rendimientos de cosechado, maduración más rápida, mayor calidad y/o valor nutricional del producto cosechado, o mejor almacenamiento o propiedades de procesado mejoradas de los productos cosechados. Las plantas transgénicas se pueden modificar para expresar múltiples rasgos. Los ejemplos de plantas que contienen rasgos provistos por ingeniería genética o mutagénesis incluyen variedades de maíz, algodón, soja y patata que expresan una toxina insecticida de *Bacillus thuringiensis* tales como YIELD GARD®, KNOCKOUT®, STARLINK®, BOLLGARD®, NuCOTN® y NEWLEAF®, y variedades tolerantes a herbicidas de maíz, algodón, soja y semillas de colza tales como ROUNDUP READY®, LIBERTY LINK®, IMI®, STS® y CLEARFIELD®, además de cultivos que expresan *N*-acetiltransferasa (GAT) para proporcionar resistencia a herbicida glifosato, o cultivos que contienen el gen HRA que proporciona resistencia a herbicidas que inhiben la acetolactato sintasa (ALS). Los compuestos y composiciones actuales pueden interactuar sinérgicamente con rasgos introducidos por ingeniería genética o modificados por mutagénesis, mejorando así la expresión fenotípica o la efectividad de los rasgos o aumento de la efectividad del control de la plaga de invertebrados de los compuestos y composiciones actuales. En particular, los compuestos y composiciones actuales pueden interactuar sinérgicamente con la expresión fenotípica de proteínas u otros productos naturales tóxicos para las plagas de invertebrados para proporcionar un control más que aditivo de estas plagas.

Los usos no agronómicos se refieren al control de plagas de invertebrados en otras áreas distintas a los campos de plantas de cultivo. Los usos no agronómicos de los compuestos y composiciones actuales incluyen el control de plagas de invertebrados en granos, judías y otros alimentos almacenados, y en productos textiles tales como ropas y alfombras. Los usos no agronómicos de los compuestos y composiciones actuales también incluyen el control de plagas de invertebrados en plantas ornamentales, bosques, en astilleros, a lo largo de las cunetas y pasos de ferrocarriles, y en áreas con césped tales como explanadas de césped, campos de golf y pastos. Los usos no agronómicos de los actuales compuestos y composiciones también incluyen el control de plagas de invertebrados en casas y otros edificios que pueden estar ocupados por seres humanos y/o animales de compañía, granja, explotación, zoo u otros animales. Los usos no agronómicos de los actuales compuestos y composiciones también incluyen el control de plagas tales como termitas, que pueden dañar la madera u otros materiales estructurales usados en edificios.

Los usos no agronómicos de los actuales compuestos y composiciones también incluyen la protección de la salud humana y animal controlando plagas de invertebrados que son parasitarias o que transmiten enfermedades infecciosas. El control de parásitos animales incluye controlar los parásitos externos que son parasitarios para la superficie del cuerpo del animal huésped (por ejemplo, hombros, axilas, abdomen, parte interna de los muslos) y los parásitos internos que son parasitarios para el interior del cuerpo del animal huésped (por ejemplo, estómago, intestino, pulmón, venas, debajo de la piel, tejido linfático). Las plagas parasitarias externas o que transmiten enfermedades incluyen, por ejemplo, niguas, garrapatas, piojos, mosquitos, moscas, ácaros y pulgas. Los parásitos internos incluyen gusanos del corazón, anquilostomas y helmintos. Los compuestos y composiciones de la presente invención son apropiados para un control sistémico y/o no sistémico de infestación o infección de parásitos sobre animales. Los compuestos y composiciones de la presente invención son particularmente apropiados para combatir las plagas parasitarias externas o que transmiten enfermedades. Los compuestos y composiciones de la presente invención son adecuados para combatir parásitos que infestan animales de trabajo agrícola, tal como ganado bovino, ovejas, cabras, caballos, cerdos, burros, camellos, búfalos, conejos, gallinas, pavos, patos, gansos y abejas, mascotas y animales domésticos tales como perros, gatos, pájaros y peces de acuario; además de los llamados animales experimentales tales como hámsteres, conejillo de Indias, ratas y ratones. Al combatir estos parásitos, se reducen las mortalidades y la reducción de rendimiento (en términos de carne, leche, lana, pieles, huevos, miel, etc.), de modo que la aplicación de una composición que comprende un compuesto de la presente invención permite una explotación de los animales más económica y sencilla.

Ejemplos de plagas de invertebrados agronómicas o no agronómicas incluyen huevos, larvas y adultos del orden Lepidoptera, tales como orugas, gusanos cortadores, orugas agrimensoras y heliotinas en la familia Noctuidae (por ejemplo, barrenador rosado del tallo (*Sesamia inferens* Walker), barrenador del tallo de maíz (*Sesamia nonagrioides* Lefebvre), gusano meridional (*Spodoptera eridania* Cramer), gusano cogollero (*Spodoptera fugiperda* J. E. Smith), gusano soldado (*Spodoptera exigua* Hübner), oruga de la hoja de algodón (*Spodoptera littoralis* Boisduval), gusano mantequilla (*Spodoptera ornithogalli* Guenée), gusano grasiento (*Agrotis ipsilon* Hufnagel), oruga de las leguminosas (*Anticarsia gemmatalis* Hübner), gusano de la fruta verde (*Lithophane antennata* Walker), gusano del repollo (*Barathra brassicae* Linnaeus), gusano defoliador de la soja (*Pseudoplusia includens* Walker), taladrillo de la col (*Trichoplusia ni* Hübner), gusano del tabaco (*Heliothis virescens* Fabricius)); perforadores, barrenadores, gusanos del césped, gusanos de coníferas, gusanos de las coles y polillas de la familia Pyralidae (por ejemplo, perforador del maíz europeo (*Ostrinia nubilalis* Hübner), gusano de la naranja navel (*Amyelois transitella* Walker), oruga de la raíz del maíz (*Crambus caliginosellus* Clemens), gusanos peludos del césped (Pyralidae: *Crambinae*) tal como el gusano peludo del césped (*Herpetogramma licarsialis* Walker), barrenador del tallo de la caña de azúcar (*Chilo infuscatellus* Snellen), perforador del fruto del tomate (*Neoleucinodes elegantalis* Guenée), oruga verde enrolladora de hojas (*Cnaphalocerus medinalis*), gusano de la vid (*Desmia funeralis* Hübner), barrenador del melón (*Diaphania nitidalis* Stoll), gusano del brote de la col (*Helluala hydralis* Guenée), barrenador de tallos amarillos (*Scirpophaga incertulas* Walker), barrenador del brote temprano (*Scirpophaga infuscatellus* Snellen), barrenador blanco del tallo del arroz (*Scirpophaga innotata* Walker), barrenador de la copa de la caña de azúcar (*Scirpophaga nivella* Fabricius), barrenador de cabeza oscura del arroz (*Chilo polychrysus* Meyrick), gusano de la cabeza del repollo (*Crociodolomia*

binotalis English)); enrolladores, gusanos de la yema, gusanos de la semilla y gusanos de la fruta en la familia de Tortricidae (por ejemplo, polilla de las manzanas (*Cydia pomonella* Linnaeus), polilla de la uva (*Endopiza viteana* Clemens), polilla oriental del melocotonero (*Grapholita molesta* Busck), polilla codling falsa (*Cryptophlebia leucotreta* Meyrick), polilla de los cítricos (*Ecdytolopha aurantiana* Lima), enrollador bandeado rojo (*Argyrotaenia velutinana* Walker), rosquilla de bandas oblicuas (*Choristoneura rosaceana* Harris), polilla de la manzana marrón clara (*Epiphyas postvittana* Walker), polilla de la vid europea (*Eupoecilia ambiguella* Hübner), polilla de las yemas (*Pandemis pyrusana* Kearfott), rosquilla omnívora (*Platynota stultana* Walsingham), pandemis (*Pandemis cerasana* Hübner), oruga de la piel de los frutos (*Pandemis heparana* Denis & Schiffermüller)); y muchos otros lepidópteros económicamente importantes (por ejemplo, palomilla de dorso de diamante (*Plutella xylostella* Linnaeus), gusano rosado del algodón (*Pectinophora gossypiella* Saunders), lagarta peluda (*Lymantria dispar* Linnaeus), polilla del melocotón (*Carposina niponensis* Walsingham), oruga zapadora del melocotón (*Anarsia lineatella* Zeller), polilla de la patata (*Phthorimaea operculella* Zeller), minadora punteada del peral (*Lithocolletis blancardella* Fabricius), minador del manzano asiático (*Lithocolletis ringoniella* Matsumura), enrollador de las hojas de arroz (*Lerodea eufala* Edwards), minador del manzano (*Leucoptera scitella* Zeller)); huevos, ninfas y adultos del orden Blattodea que incluyen cucarachas de las familias Blattellidae y Blattidae (por ejemplo, cucaracha oriental (*Blatta orientalis* Linnaeus), cucaracha asiática (*Blatella asahinai* Mizukubo), cucaracha rubia (*Blatella germanica* Linnaeus), cucaracha de banda marrón (*Supella longipalpa* Fabricius), cucaracha americana (*Periplaneta americana* Linnaeus), cucaracha café (*Periplaneta brunnea* Burmeister), cucaracha de Madeira (*Leucophaea maderae* Fabricius), cucaracha café ahumada (*Periplaneta fuliginosa* Service), cucaracha australiana (*Periplaneta australasiae* Fabr.), cucaracha gris (*Nauphoeta cinerea* Olivier) y cucaracha lisa (*Symploce pallens* Stephens)); huevos, larvas y adultos de alimentación foliar, de alimentación de frutas, de alimentación de raíces, de alimentación de semillas y de alimentación de tejido vesicular, del orden Coleoptera que incluyen gorgojos de las familias Anthribidae, Bruchidae, y Curculionidae (por ejemplo, picudo del algodón (*Anthonomus grandis* Boheman), gorgojo acuático del arroz (*Lissorhoptrus oryzophilus* Kuschel), gorgojo del trigo (*Sitophilus granarius* Linnaeus), gorgojo del arroz (*Sitophilus oryzae* Linnaeus)), delumbis de Listronotus (*Listronotus maculicollis* Dietz), escarabajo del pasto (*Sphenophorus parvulus* Gyllenhal), escarabajo cazador (*Sphenophorus venatus vestitus*), gorgojo de Denver (*Sphenophorus cicatristriatus* Fahraeus)); pulgones, escarabajos del pepino, gusanos de las raíces, escarabajos foliares, escarabajos de la patata y minadores de la familia Chrysomelidae (por ejemplo, escarabajo de la patata de Colorado (*Leptinotarsa decemlineata* Say), gusano de la raíz del maíz occidental (*Diabrotica virgifera virgifera* LeConte)); abejorros y otros escarabajos de la familia Scarabaeidae (por ejemplo, escarabajo japonés (*Popillia japonica* Newman), escarabajo oriental (*Anomala orientalis* Waterhouse, *Exomala orientalis* (Waterhouse) Baraud), escarabajo enmascarado norteño (*Cyclocephala borealis* Arrow), escarabajo enmascarado sureño (*Cyclocephala immaculata* Olivier o *C. lurida* Bland), escarabajo pelotero y abejorro (*Aphodius* spp.), atenius negro del césped (*Ataenius spretulus* Haldeman), escarabajo verde de Junio (*Cotinis nitida* Linnaeus), escarabajo del jardín asiático (*Maladera castanea* Arrow), escarabajos de Mayo/Junio (*Phyllophaga* spp.) y escarabajo europeo (*Rhizotrogus majalis* Razoumowsky)); escarabajos de las alfombras de la familia Dermestidae; gusanos alambre de la familia Elateridae; escarabajos de la corteza de la familia Scolytidae y escarabajos de la harina de la familia Tenebrionidae. Además, las plagas agronómicas y no agronómicas incluyen: huevos, adultos y larvas del orden Dermoptera que incluyen tijeretas de la familia Forficulidae (por ejemplo, tijereta europea (*Forficula auricularia* Linnaeus), tijereta negra (*Chelisoches morio* Fabricius)); huevos, inmaduros, adultos y ninfas de los órdenes Hemiptera y Homoptera tales como chinches de plantas de la familia Miridae, cícadas de la familia Cicadidae, saltahojas (por ejemplo, *Empoasca* spp.) de la familia Cicadellidae, chinches de cama (por ejemplo, *Cimex lectularius* Linnaeus) de la familia Cimicidae, saltapuntas de las familias Fulgoroidae y Delphacidae, saltaárboles de la familia Membracidae, psílidos de la familia Psyllidae, moscas blancas de la familia Aleyrodidae, áfidos de la familia Aphididae, filoxeras de la familia Phylloxeridae, piojos harinosos de la familia Pseudococcidae, cochinitas de las familias Coccidae, Diaspididae y Margarodidae, insectos de encaje de la familia Tingidae, chinches hediondas de la familia Pentatomidae, chinches de los pastos (por ejemplo, chinche de la semilla (*Blissus leucopterus hirtus* Montandon) y chinchilla de los pastos (*Blissus insularis* Barber)) y otros chinches de la familia Lygaeidae, afróforas de la familia Cercopidae, chinches de la calabaza de la familia Coreidae, y chinches rojas y chinches tintóreos de la familia Pyrrhocoridae. También se incluyen huevos, larvas, ninfas y adultos del orden Acari (ácaros) tales como arañuelas rojas comunes y ácaros rojos en la familia Tetranychidae (por ejemplo, araña roja europea (*Panonychus ulmi* Koch), arañuela de dos puntos (*Tetranychus urticae* Koch), ácaro de McDaniel (*Tetranychus mcdanieli* McGregor)); falsas arañuelas rojas de la familia Tenuipalpidae (por ejemplo, ácaro rojo plano (*Brevipalpus lewisi* McGregor)); ácaros tostadores y ácaros de la yema en la familia Eriophyidae y otros ácaros de alimentación foliar y ácaros importantes en la salud humana y animal, es decir, ácaros del polvo de la familia Epidermoptidae, ácaros del folículo de la familia Demodicidae, ácaros de la harina de la familia Glycyphagidae, garrapatas en el orden Ixodidae (por ejemplo, garrapata del venado (*Ixodes scapularis* Say), garrapata de la oveja (*Ixodes holocyclus* Neumann), garrapata americana del perro (*Dermacentor variabilis* Say), garrapata estrella solitaria (*Amblyomma americanum* Linnaeus)) y sarnas y ácaros de la sarna en las familias Psoroptidae, Pyemotidae, y Sarcoptidae; huevos, adultos e inmaduros del orden Orthoptera que incluyen saltamontes, langostas y grillos (por ejemplo, saltamontes migratorios (por ejemplo, *Melanoplus sanguinipes* Fabricius, *M. differentialis* Thomas), langostas sudamericana (por ejemplo, *Schistocerca americana* Drury), langosta peregrina (*Schistocerca gregaria* Forskal), langosta migratoria (*Sitona migratoria* Linnaeus), saltamontes elegante (*Zonocerus* spp.), acheta doméstica (*Acheta domestica* Linnaeus), grillos cebollinos (por ejemplo, grillo topo del sur (*Scapteriscus vicinus* Scudder) y grillos cebolleros (*Scapteriscus borellii* Giglio-Tos)); huevos, adultos e inmaduros del orden Diptera que incluyen minadores (por ejemplo, *Liriomyza* spp. tal como minador de la hoja del chile (*Liriomyza sativae* Blanchard)), mosquillas, moscas de la fruta (Tephritidae), moscas frit (por ejemplo, *Oscinella frit*

Linnaeus), gusanos de la tierra, moscas domésticas (por ejemplo, *Musca doméstica* Linnaeus), moscas domésticas menores (por ejemplo, *Fannia canicularis* Linnaeus, *F. femoralis* Stein), moscas de los establos (por ejemplo, *Stomoxys calcitrans* Linnaeus), moscas de la cara, moscas de los cuernos, moscas azules (por ejemplo, *Chrysomya* spp., *Phormia* spp.), y otras plagas de moscas, tábanos (por ejemplo, *Tabanus* spp.), estros (por ejemplo, *Gastrophilus* spp., *Oestrus* spp.); larvas del ganado (por ejemplo, *Hypoderma* spp.), moscas del venado (por ejemplo, *Chrysops* spp.), garrapatas (por ejemplo, *Melophagus ovinus* Linnaeus) y otras Brachycera, mosquitos (por ejemplo, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp.), trípodos del guisante (por ejemplo, *Prosimulium* spp., *Simulium* spp.), mosquitos picadores, moscas de la arena, mosquitos y otros Nematocera; huevos, adultos e inmaduros del orden Thysanoptera que incluyen trípodos de la cebolla (*Thrips tabaci* Lindeman), trípodos de las flores (*Frankliniella* spp.), y otros trípodos de alimentación foliar; plagas de insectos del orden Hymenoptera que incluyen hormigas de la familia Formicidae que incluyen hormiga carpintera de florida (*Camponotus floridanus* Buckley), hormiga carpintera roja (*Camponotus ferrugineus* Fabricius), hormiga carpintera (*Camponotus pennsylvanicus* De Geer), hormiga de las patas blancas (*Technomyrmex albipes* fr. Smith), hormigas de cabeza grande (*Pheidole* sp.), hormiga fantasma (*Tapinoma melanocephalum* Fabricius); hormiga faraón (*Monomorium Pharaonis* Linnaeus), hormigueta de fuego (*Wasmannia auropunctata* Roger), hormiga brava (*Solenopsis geminata* Fabricius), hormiga roja de fuego (*Solenopsis invicta* Buren), hormiga argentina (*Iridomyrmex humilis* Mayr), hormiga loca (*Paratrechina longicornis* Latreille), hormiga de pavimento (*Tetramorium caespitum* Linnaeus), hormiga del maizal (*Lasius alienus* Förster) y hormiga olorosa doméstica (*Tapinoma sessile* Say). Otros Hymenoptera incluyen abejas (que incluyen abejas carpinteras), avispones, chaquetas amarillas, avispas y moscas de sierra (*Neodiprion* spp.; *Cephus* spp.); plagas de insectos del orden Isoptera que incluyen termitas de las familias Termitidae (por ejemplo, *Macrotermes* sp., *Odontotermes obesus* Rambur), Kalotermitidae (por ejemplo, *Cryptotermes* sp.) y Rhinotermitidae (por ejemplo, *Reticulitermes* sp., *Coptotermes* sp., *Heterotermes tenuis* Hagen), la termita subterránea oriental (*Reticulitermes flavipes* Kollar), la termita subterránea occidental (*Reticulitermes hesperus* Banks), termita subterránea de Formosa (*Coptotermes formosanus* Shiraki), la termita de algodón de las indias occidentales (*Incisitermes immigrans* Snyder), termita pulverizadora tropical de cabeza arrugada (*Cryptotermes brevis* Walker), termita de madera seca del sureste (*Incisitermes snyderi* Light), termita subterránea oscura (*Reticulitermes virginicus* Banks), termita de madera seca occidental (*Incisitermes minor* Hagen), termitas arbóreas tales como *Nasutitermes* sp. y otras termitas de importancia económica; plagas de insectos del orden Thysanura tales como pececillo de plata (*Lepisma saccharina* Linnaeus) e insecto de fuego (*Thermobia doméstica* Packard); plagas de insectos del orden Mallophaga y que incluyen el piojo de la cabeza (*Pediculus humanus capitis* De Geer), piojo del cuerpo (*Pediculus humanus* Linnaeus), piojo del cuerpo de la gallina (*Menacanthus stramineus* Nitzsch), piojo del perro (*Trichodectes canis* De Geer), piojo del plumón (*Gonioscotes gallinae* De Geer), piojo del cuerpo de la oveja (*Bovicola ovis* Schrank), piojo del ganado vacuno (*Haematopinus eurysternus* Nitzsch), piojo del ganado de nariz larga (*Linognathus vituli* Linnaeus) y otros piojos succionadores y mordedores parásitos que atacan a hombres y animales; plagas de insectos del orden Siphonoptera incluyendo la pulga de la rata oriental (*Xenopsylla cheopis* Rothschild), pulga del gato (*Ctenocephalides felis* Bouche), pulga del perro (*Ctenocephalides canis* Curtis), pulga de la gallina (*Ceratophyllus gallinae* Schrank), pulga pegajosa (*Echidnophaga gallinacea* Westwood), pulga humana (*Pulex irritans* Linnaeus) y otras pulgas que afectan a los mamíferos y a las aves. Otras plagas de artrópodos contempladas incluyen: arañas del orden Araneae tales como la araña solitaria marrón (*Loxosceles reclusa* Gertsch & Mulaik) y la viuda negra (*Latrodectus mactans* Fabricius), y ciempiés del orden Scutigeraomorpha tales como ciempiés doméstico (*Scutigera coleoptrata* Linnaeus). Los compuestos de la presente invención tienen también actividad en miembros de las clases Nematoda, Cestoda, Trematoda y Acanthocephala que incluyen miembros económicamente importantes de los órdenes Strongylida, Ascaridida, Oxiurida, Rhabditida, Spirurida y Enoplida tales como, pero no limitados a, plagas agrícolas económicamente importantes (es decir, nematodos de los nudos de la raíz del género *Meloidogyne*, nematodos de los prados del género *Pratylenchus*, nematodos atronadores de las raíces del género *Trichodorus*, etc.) y plagas para la salud animal y humana (es decir, todos los trematodos, tenias y ascárides económicamente importantes, tales como *Strongylus vulgaris* en caballos, *Toxocara canis* en perros, *Haemonchus contortus* en ovejas, *Dirofilaria immitis* Leidy en perros, *Anoplocephala perfoliata* en caballos, *Fasciola hepatica* Linnaeus en rumiantes, etc.).

Los compuestos de la invención muestran actividad particularmente alta contra plagas de la orden de Lepidoptera (por ejemplo, *Alabama argillacea* Hübner (gusano de la hoja de algodón), *Archips argyrospila* Walker (enrollador de la hoja del frutal), *A. rosana* Linnaeus (cacoecia de los frutales) y otras especies de *Archips*, *Chilo suppressalis* Walker (barrenador del tallo del arroz), *Cnaphalocrosis medinalis* Guenée (enrollador de la hoja del arroz), *Crambus caliginosellus* Clemens (gusano de la raíz del maíz), *Crambus teterrellus* Zincken (gusano tejedor de la remolacha), *Cydia pomonella* Linnaeus (polilla de las manzanas), *Earias insulana* Boisduval (taladro del algodonoero), *Earias vittella* Fabricius (gusano moteado), *Helicoverpa armigera* Hübner (oruga de las cápsulas de algodón), *Helicoverpa zea* Boddie (gusano del elote de maíz), *Heliothis virescens* Fabricius (cogollero del tabaco), *Herpetogramma licarsisalis* Walker (palomilla), *Lobesia botrana* Denis & Schiffermüller (polilla de la uva), *Pectinophora gossypiella* Saunders (gusano rosado del algodonoero), *Phyllocnistis citrella* Stainton (minador de la hoja de cítrico), *Pieris brassicae* Linnaeus (mariposa blanca grande de la col), *Pieris rapae* Linnaeus (mariposa blanca pequeña de la col), *Plutella xylostella* Linnaeus (palomilla de dorso de diamante), *Spodoptera exigua* Hübner (gusano soldado), *Spodoptera litura* Fabricius (rosquilla negra, gusano negro), *Spodoptera frugiperda* J. E. Smith (gusano trazador), *Trichoplusia ni* Hübner (falso medidor) y *Tuta absoluta* Meyrick (minador de la hoja del tomate)).

Los compuestos de la invención también tienen una actividad significativa sobre miembros del orden Homoptera que incluyen: *Acyrtosiphon pisum* Harris (áfido verde del guisante), *Aphis craccivora* Koch (áfido del guisante pinto), *Aphis fabae* Scopoli (áfido negro de la judía), *Aphis gossypii* Glover (áfido del algodón, áfido del melón), *Aphis pomi* De Geer (áfido del manzano), *Aphis spiraeicola* Patch (áfido espirea), *Aulacorthum solani* Kaltentbach (áfido de la dedalera), *Chaetosiphon fragaefolii* Cockerell (áfido del fresal), *Diuraphis noxia* Kurdjumov/Mordvilko (áfido ruso del trigo), *Dysaphis plantaginea* Paaserini (áfido rosado del manzano), *Eriosoma lanigerum* Hausmann (áfido lanudo de la manzana), *Hyalopterus pruni* Geoffroy (áfido harinoso del ciruelo), *Lipaphis erysimi* Kaltentbach (áfido del nabo), *Metopolophium dirrhodum* Walker (áfido de los cereales), *Macrosiphum euphorbiae* Thomas (áfido de la patata), *Myzus persicae* Sulzer (áfido del melocotonero-patata, áfido verde del melocotonero), *Nasonovia ribisnigri* Mosley (áfido de la lechuga), *Pemphigus* spp. (áfidos de las raíces y áfidos productores de agallas), *Rhopalosiphum maidis* Fitch (áfido de la hoja del maíz), *Rhopalosiphum padi* Linnaeus (áfido del cerezo negro americano-avena), *Schizaphis graminum* Rondani (chinche verde), *Sitobion avenae* Fabricius (áfido de las espigas), *Therioaphis maculata* Buckton (pulgón manchado de la alfalfa), *Toxoptera aurantii* Boyer de Fonscolombe (áfido negro de los cítricos), y *Toxoptera citricida* Kirkaldy (áfido pardo de los cítricos); *Adelges* spp. (adélgidos); *Phylloxera devastatrix* Pergande (filoxera de los pecanos); *Bemisia tabaci* Gennadius (mosca blanca del tabaco, mosca blanca de la batata), *Bemisia argentifolii* Bellows & Perring (mosca blanca de la hoja plateada), *Dialeurodes citri* Ashmead (mosca blanca de los cítricos) y *Trialeurodes vaporariorum* Westwood (mosca blanca de los invernaderos); *Empoasca fabae* Harris (saltahojas de la patata), *Laodelphax striatellus* Fallen (saltahojas pardo pequeño), *Macrolestes quadrilineatus* Forbes (saltahojas del aster), *Nephotettix cincticeps* Uhler (saltahojas verde), *Nephotettix nigropictus* Stål (saltahojas del arroz), *Nilaparvata lugens* Stål (saltahojas pardo), *Peregrinus maidis* Ashmead (saltahojas del maíz), *Sogatella furcifera* Horvath (saltahojas de dorso blanco), *Sogatodes orizicola* Muir (chicharritas del arroz), *Typhlocyba pomaria* McAtee (saltahojas del manzano blanco), *Erythroneoura* spp. (saltahojas de la vid); *Magidada septendecim* Linnaeus (cigarra periódica); *Icerya purchasi* Maskell (cochinilla algodonosa), *Quadraspidiotus perniciosus* Comstock (piojo de San José); *Planococcus citri* Risso (gorgojo algodonoso de los cítricos); *Pseudococcus* spp. (otro grupo de gorgojos); *Cacopsylla pyricola* Foerster (psila del peral), *Trioza diospyri* Ashmead (psila del caqui).

Los compuestos de esta invención también tienen actividad sobre miembros del orden Hemiptera que incluyen: *Acrosternum hilare* Say (chinche hedionda verde), *Anasa tristis* De Geer (chinche de la calabaza), *Blissus leucopterus leucopterus* Say (chinche común), *Cimex lectularius* Linnaeus (chinche de las camas), *Corythuca gossypii* Fabricius (chinche de encaje del algodón), *Cyrtopeltis modesta* Distant (chinche del tomate), *Dysdercus suturellus* Herrich-Schäffer (chinche tintórea), *Euchistus servus* Say (chinche hedionda marrón), *Euschistus variolarius* Palisot de Beauvois (chinche hedionda de una mancha), *Graptosthetus* spp. (grupo de chinches de semillas), *Leptoglossus corculus* Say (chinche de las piñas), *Lygus lineolaris* Palisot de Beauvois (chinche manchador), *Nezara viridula* Linnaeus (chinche hediondo verde del sur), *Oebalus pugnax* Fabricius (chinche hediondo del arroz), *Oncopeltus fasciatus* Dallas (chinche grande de las asclepias), *Pseudatomoscelis seriatus* Reuter (saltahojas del algodón). Otros órdenes de insectos controlados por los compuestos de la invención incluyen Thysanoptera (por ejemplo, *Frankliniella occidentalis* Pergande (trípodos de las flores), *Scirtothrips citri* Moulton (trípodos de los cítricos), *Sericothrips variabilis* Beach (trípodos de la soja), y *Thrips tabaci* Lindeman (trípodos de la cebolla); y el orden Coleoptera (por ejemplo, *Leptinotarsa decemlineata* Say (escarabajo de la patata de Colorado), *Epilachna varivestis* Mulsant (escarabajo mejicano del frijol) y gusanos alambre de los géneros *Agriones*, *Athous* o *Limonium*).

Nótese que algunos sistemas contemporáneos de clasificación ubican a los Homoptera como un suborden dentro del orden Hemiptera.

Es de interés el uso de compuestos de esta invención para controlar la mosca blanca del ciruelo (*Bemisia argentifolii*). Es de interés el uso de compuestos de esta invención para controlar los trípodos occidentales de las flores (*Frankliniella occidentalis*). Es de interés el uso de compuestos de esta invención para controlar el saltahojas de la patata (*Empoasca fabae*). Es de interés el uso de compuestos de esta invención para controlar el saltahojas del maíz (*Peregrinus maidis*). Es de interés el uso de compuestos de esta invención para controlar el pulgón del algodón (*Aphis gossypii*). Es de interés el uso de compuestos de esta invención para controlar el pulgón verde del melocotonero (*Myzus persicae*). Es de interés el uso de compuestos de esta invención para controlar la palomilla de dorso de diamante (*Plutella xylostella*). Es de interés el uso de compuestos de esta invención para controlar al gusano cogollero del maíz (*Spodoptera frugiperda*).

Los compuestos de esta invención también pueden mezclarse con uno o más compuestos o agentes biológicamente activos distintos que incluyen insecticidas, fungicidas, nematocidas, bactericidas, acaricidas, herbicidas, reguladores del crecimiento tales como estimuladores del enraizamiento, quimioesterilizantes, semioquímicos, repelentes, atrayentes, feromonas, estimuladores de la alimentación, otros compuestos biológicamente activos o bacterias, virus u hongos entomopatógenos para formar un pesticida de múltiples componentes que proporcione un espectro incluso más amplio de utilidad agronómica y no agronómica. Así, la presente invención pertenece también a una composición que comprende una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula 1, un N-óxido o una sal del mismo, y una cantidad eficaz de al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional, y puede comprender además al menos uno de un tensioactivo, un diluyente sólido o un diluyente líquido. Los otros compuestos o agentes biológicamente activos pueden formularse en composiciones que comprenden al menos uno de un tensioactivo y un diluyente sólido o líquido. Para mezclas de la presente invención, se pueden formular los otros compuestos o agentes biológicamente activos junto con los actuales compuestos, incluyendo los compuestos

de Fórmula 1, para formar una premezcla, o los otros compuestos o agentes biológicamente activos se pueden formular por separado de los actuales compuestos, incluyendo los compuestos de Fórmula 1, y las dos formulaciones combinarse antes de la aplicación (por ejemplo, en un tanque de pulverización) o, de forma alternativa, aplicados de forma sucesiva.

5 Otros compuestos o agentes biológicamente activos útiles en las composiciones de la presente invención se pueden seleccionar a partir de agentes de control de plagas de invertebrados que tienen un modo diferente de acción o una clase química diferente incluyendo lactonas macrocíclicas, neonicotinoides, ligandos del receptor de octopamina, ligandos del receptor de rianodina, agonistas de ecdisona, moduladores del canal de sodio, inhibidores de la síntesis de quitina, análogos de nereisotoxina, inhibidores del transporte de electrones mitocondriales, inhibidores de colinesterasa, insecticidas de ciclodieno, inhibidores de la muda, bloqueadores del canal de cloruro regulado por GABA (ácido γ -aminobutírico), mímicos de la hormona juvenil, inhibidores de la biosíntesis de lípidos y agentes biológicos que incluyen nucleopolihedrovirus (NPV), un miembro de *Bacillus thuringiensis*, una delta-endotoxina encapsulada de *Bacillus thuringiensis*; y un insecticida viral que se da de forma natural o genéticamente modificado. Dignos de mención son los compuestos o agentes biológicamente activos adicionales seleccionados a partir de insecticidas del grupo que consiste en piretroides, carbamatos, neonicotinoides, bloqueadores del canal de sodio neuronal, lactonas macrocíclicas insecticidas, antagonistas del ácido γ -aminobutírico, ureas insecticidas y mímicos de la hormona juvenil, un miembro de *Bacillus thuringiensis*, una delta-endotoxina de *Bacillus thuringiensis* y un insecticida viral que se da de forma natural o genéticamente modificado.

20 Digno de mención es una composición de la presente invención en donde al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional se selecciona a partir de insecticidas del grupo que consiste en lactonas macrocíclicas, neonicotinoides, ligandos del receptor de octopamina, ligandos del receptor de rianodina, agonistas de ecdisona, moduladores del canal de sodio, inhibidores de la síntesis de quitina, análogos de nereisotoxina, inhibidores del transporte de electrones mitocondriales, inhibidores de colinesterasa, insecticidas de ciclodieno, inhibidores de la muda, bloqueantes del canal de cloruro regulado por GABA, mímicos de la hormona juvenil, agentes biológicos e inhibidores de la biosíntesis de lípidos.

Ejemplos de dichos compuestos o agentes biológicamente activos con los que se pueden formular los compuestos de esta invención son: insecticidas tales como abamectina, acefato, acetamiprid, acetoprol, amidoflumet (S-1955), avermectina, azadiractina, azinfos-metilo, bifentrina, bifenazato, bistriflurona, buprofezina, carbofurano, cartap, clorfenapir, clorfluazurona, clorantraniliprol (DPX-E2Y45), clorpirifos, clorpirifos-metilo, cromafeno, clotianidina, ciflumetofeno, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, gamma-cihalotrina, lambda-cihalotrina, cipermetrina, cirmazina, deltametrina, diafentiurona, diazinona, dieldrina, diflubenzurona, dimeflutrina, dimetoato, dinotefurano, diofenolano, emamectina, endosulfano, esfenvalerato, etiprol, fenotiocarb, fenoxicarb, fenpropatrina, fenvalerato, fipronilo, flonicamid, flubendiamida, flucitrinato, tau-fluvalinato, flufenimer (UR-50701), flufenoxurona, fonofos, halofenozida, hexaflumurona, hidrametilnona, imidacloprid, indoxacarb, isofenfos, lufenurona, malationa, metaflumizona, metaldehído, metamidofos, metidationa, metomilo, metopreno, metoxiclor, metoflutrina, monocrotofos, metoxifenozida, monocrotofos, nitenpiram, nitiazina, novalurona, noviflumurona (XDE-007), oxamilo, parationa, parationa-metilo, permetrina, forato, fosalona, fosmet, fosfamidona, pirimicarb, profenofos, proflutrina, protrifenbuta, pimetozina, pirafuprol, piretrina, piridialilo, pirifluquinazona, piriprol, piriproxifeno, rotenona, rianodina, espinetoram, espinosad, espirodiclofeno, espiromesifeno (BSN 2060), espirotetramato, sulprofos, tebufenozida, teflubenzurona, teflutrina, terbufos, tetraclorvinfos, tiacloprid, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap-sodio, tolfenpirad, tralometrina, triazamato, triclorfona y triflumurona; fungicidas tales como acibenzolar, aldimorfo, amisulbrom, azaconazol, azoxistrobina, benalaxilo, benomilo, bentiavalicarb, bentiavalicarb-isopropilo, binomial, bifenilo, bitertanol, blastidina-S, mezcla de Bordeaux (sulfato de cobre tribásico), boscalid/nicobifeno, bromuconazol, bupirimato, butiobato, carboxina, carpropamid, captafol, captano, carbendazim, cloroneb, clorotalonilo, clozolinato, clotrimazol, oxiclóruo de cobre, sales de cobre tales como sulfato de cobre e hidróxido de cobre, ciazofamid, ciflunamida, cimoxanilo, ciproconazol, ciprodinilo, diclofluanid, diclocimet, diclomezina, diclorano, dietofencarb, difenoconazol, dimetomorfo, dimoxiestrobina, diniconazol, diniconazol-M, dinocap, discostrobina, ditianona, dodomorfo, dodina, econazol, etaconazol, edifenfos, epoxiconazol, etaboxam, etirimol, etridiazol, famoxadona, fenamidona, fenarimol, fenbuconazol, fencaramid, fenfuram, fenhexamida, fenoxanilo, fenciclonilo, fenpropidina, fenpropimorfo, acetato de fentina, hidróxido de fentina, ferbam, ferfurazoato, ferimzina, fluazinam, fludioxonilo, flumetover, fluopicolida, fluoxastrobina, fluquinconazol, fluquinconazol, flusilazol, flusulfamida, flutolanilo, flutriafol, folpet, fosetilo-aluminio, fuberidazol, furalaxilo, furametapir, hexaconazol, himexazol, guazatina, imazalilo, imibenconazol, iminoctadina, iodicarb, ipconazol, iprobenfos, iprodiona, iprovalicarb, isoconazol, isoprotilano, kasugamicina, kresoxim-metilo, mancozeb, mandipropamida, maneb, mapanipirina, mefenoxam, mepronilo, metalaxilo, metconazol, metasulfocarb, metiram, metominostrobina/fenominostrobina, mepanipirim, metrafenona, miconazol; miclobutanilo, neo-asozina (metanoarsoniato férrico), nuarimol, octilnona, ofurace, orisastrobina, oxadixilo, ácido oxolínico, oxpoconazol, oxicarboxina, paclobutrazol, penconazol, penciclorona, pentioproprad, perfurazoato, ácido fosfónico, ftalida, picobenzamid, picoxiestrobina, polioxina, probenazol, procloraz, procimidona, propamocarb, hidrocloreuro de propamocarb, propiconazol, propineb, proquinazid, protioconazol, piraclostrobina, priazofos, pirifenox, pirimetanilo, pirifenox, pirolnitrina, piroquilona, quinconazol, quinoxifeno, quintozeno, siltiofam, simeconazol, espiroxamina, estreptomycin, azufre, tebuconazol, tecrazeno, tecloftalam, tecnazeno, tetraconazol, tiabendazol, tifulzamida, tiofanato, tiofanato-metilo, tiram, tiadinilo, tolclófos-metilo, tolfufluanid, triadimefona, triadimenol, triarimol, triazóxido, tridemorfo, trimopramida triciclazol, trifloxistrobina, triforina, triticonazol, uniconazol, validamicina, vinclozolina, zineb,

ziram y zoxamida; nematocidas tales como aldicarb, imiciafos, oxamilo y fenamifos; bactericidas tales como estreptomocina; acaricidas tales como amitraz, quinometionato, clorobencilato, cihexatina, dicofol, dienoclor, etoxazol, fenazaquina, óxido de fenbutatina, fenpropratrina, fenpiroximato, hexitiazox, propargita, piridabeno y tebufenpirad; y agentes biológicos incluyendo bacterias entomopatógenas, tales como *Bacillus thuringiensis* subesp. *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subesp. *kurstaki*, y las delta-endotoxinas encapsuladas de *Bacillus thuringiensis* (por ejemplo, Cellcap, MPV, MPVII); hongos entomopatógenos, tales como el hongo verde de la muscardina; y virus entomopatógenos que incluyen baculovirus, nucleopolihedrovirus (NPV) tales como *Helicoverpa zea* nucleopolihedrovirus (HzNPV), *Anagrapha falcifera* nucleopolihedrovirus (AfNPV); y virus de granulosis (*GV*) tales como virus de granulosis *Cydia pomonella* (CpGV).

Los compuestos de esta invención y composiciones de los mismos se pueden aplicar a plantas transformadas genéticamente para expresar proteínas tóxicas para las plagas de invertebrados (tales como delta-endotoxinas de *Bacillus thuringiensis*). El efecto de los compuestos de control de plagas de invertebrados aplicados de forma exógena de esta invención puede ser sinérgico con las proteínas tóxicas expresadas.

Referencias generales para estos protectores agrícolas (es decir, insecticidas, fungicidas, nematocidas, acaricidas, herbicidas y agentes biológicos) incluyen The Pesticide Manual, 13ª Edición, C. D. S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, Reino Unido, 2003 y The BioPesticide Manual, 2ª Edición, L. G. Copping, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, Reino Unido, 2001.

Digno de mención es una composición de la presente invención en donde al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional se selecciona del grupo que consiste en abamectina, acefato, acetamiprida, acetoprol, aldicarb, amidoflumet, amitraz, avermectina, azadiractina, azinfos-metilo, bifentrina, bifenazato, bistriflurona, buprofezina, carbofurano, cartap, quinometionato, clorfenapir, clorfluazurona, clorantraniliprol, clorpirifos, clorpirifos-metilo, clorobenzilato, cromafenoazida, clotianidina, ciflumetofeno, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, gamma-cihalotrina, lambda-cihalotrina, cihexatina, cipermetrina, ciromazina, deltametrina, diafenturona, diazinona, dicofol, dieldrina, dienoclor, diflubenzurona, dimeflutrina, dimetoato, dinotefurano, diofenolano, emamectina, endosulfano, esfenvalerato, etiprol, etoxazol, fenamifos, fenazaquina, óxido de fenbutatina, fenotiocarb, fenoxicarb, fenpropratrina, fenpiroximato, fenvalerato, fipronilo, flonicamid, flubendiamida, flucitrinato, tau-fluvalinato, flufenerim, flufenoxurona; fonofos, halofenozida, hexaflumurona, hexitiazox, hidrametilnona, imiciafos, imidacloprid, indoxacarb, isofenfos, lufenurona, malationa, metaflumizona, metaldehído, metamidofos, metidationa, metomilo, metopreno, metoxiclor, metoxifenozida, metoflutrina, monocrotofos, nitenpiram, nitiazina, novalurona, noviflumurona, oxamilo, parationa, parationa-metilo, permetrina, forato, fosalona, fosmet, fosfamidona, pirimicarb, profenofos, proflutrina, propargite, protrifenbute, pimetrozina, pirafuprol, piretrina, piridabeno, piridalilo, pirifluquinazona, piriprol, piriproxifeno, rotenona; rianodina, espinetoram, espinosad, espiridiclofeno, espiromesifeno (BSN 2060), espirotetramato, sulprofos, tebufenozida, tebufenpirad, teflubenzurona, teflutrina, terbufos, tetraclorvinfos, tialoprid, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap-sodio, tolfenpirad, tralometrina, triazamato, triclorfona, triflumurona, *Bacillus thuringiensis* subesp. *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subesp. *kurstaki*, nucleopolihedrovirus, una delta-endotoxina encapsulada de *Bacillus thuringiensis*, baculovirus, bacterias entomopatógenas, virus entomopatógenos y hongos entomopatógenos.

De mención particular es una composición de la presente invención en donde el al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional se selecciona del grupo que consiste en abamectina, acefato, acetamiprid, acetoprol, amidoflumet, avermectina, azadiractina, azinfos-metilo, bifentrina, bifenazato, bistriflurona, buprofezina, carbofurano, cartap, clorfenapir, clorfluazurona, clorpirifos, clorpirifos-metilo, cromafenoazida, clotianidina, ciflumetofeno, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, lambda-cihalotrina, cipermetrina, ciromazina, deltametrina, diafenturona, diazinona, dieldrina, diflubenzurona, dimeflutrina, dimetoato, dinotefurano, diofenolano, emamectina, endosulfano, esfenvalerato, etiprol, fenotiocarb, fenoxicarb, fenpropratrina, fenvalerato, fipronilo, flonicamid, flubendiamida, flucitrinato, tau-fluvalinato, flufenerim, flufenoxurona, fonofos, gamma-cihalotrina, halofenozida, hexaflumurona, hidrametilnona, imidacloprid, indoxacarb, isofenfos, lufenurona, malationa, metaflumizona, metaldehído, metamidofos, metidationa, metomilo, metopreno, metoxiclor, metoxifenozida, metoflutrina, monocrotofos, nitenpiram, nitiazina, novalurona, noviflumurona, oxamilo, parationa, parationa-metilo, permetrina, forato, fosalona, fosmet, fosfamidona, pirimicarb, profenofos, proflutrina, protrifenbute, pimetrozina, pirafuprol, piretrina, piridalilo, pirifluquinazona, piriprol, piriproxifeno, rotenona, rianodina, S1812 (Valent), espinosad, espiridiclofeno, espiromesifeno, espirotetramat, sulprofos, tebufenozida, teflubenzurona, teflutrina, terbufos, tetraclorvinfos, tiacloprid, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap-sodio, tolfenpirad, tralometrina, triazamato, triclorfona, triflumurona, aldicarb, imiciafos, fenamifos, amitraz, quinometionato, clorobenzilato, cihexatina, dicofol, dienoclor, etoxazol, fenazaquina, óxido de fenbutatina, fenpropratrina, fenpiroximato, hexitiazox, propargita, piridabeno, tebufenpirad, *Bacillus thuringiensis aizawai*, *Bacillus thuringiensis kurstaki*, delta endotoxina de *Bacillus thuringiensis*, baculovirus, bacteria entomopatógena, virus entomopatógeno y hongo entomopatógeno.

Es también de interés una composición de la presente invención en donde al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional se selecciona del grupo que consiste en abamectina, acetamiprid, amitraz, avermectina, azadiractina, bifentrina, buprofezina, cartap, clorantraniliprol, clorfenapir, clorpirifos, clotianidina, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, lambda-cihalotrina, cipermetrina, ciromazina, deltametrina, dieldrina, dinotefurano, diofenolano, emamectina, endosulfano, esfenvalerato, etiprol, fenotiocarb, fenoxicarb, fenvalerato, fipronilo, flonicamida, flubendiamida, flufenoxurona; hexaflumurona, hidrametilnona, imidacloprid, indoxacarb,

lufenufona, metaflumizona, metomilo, metopreno, metoxifeno, nitenpiram, nitiazina, novalurona, oxamilo, pymetrozina, piretrina, piridabeno, piridalilo, piriproxifeno, rianodina, espinetoram, espinosad, espiroclorfen, espiromesifeno, tebufenozida, tiacloprid, tiametoxilo, tiodicarb, tiosultap-sodio, tralometrina, triazamato, triflumurona, *Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*, nucleopolihedrovirus y una delta-endotoxina encapsulada de *Bacillus thuringiensis*.

Digna de mención adicional es una composición de la presente invención en donde el al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional se selecciona del grupo que consiste en abamectina, acetamiprid, amitraz, una diamida antranílica, avermectina, azadiractina, beta-ciflutrina, bifentrina, buprofezina, cartap, clorfenapir, clorpirifos, clotianidina, ciflutrina, cihalotrina, cipermetrina, ciromazina, deltametrina, dieldrina, dinotefurano, diofenolano, emamectina, benzoato de ebnamectina, endosulfano, esfenvalerato, tetiprol, fenotiocarb, fenoxicarb, fenvalerato, fipronilo, flonicamid, flufenoxurona, hexaflumurona, hidrametilnona, imidacloprid, indoxacarb, lambda-cihalotrina, lufenurona, metaflumizona, metomilo, metopreno, metoxifeno, nitenpiram, nitiazina, novalurona, NPR, oxamilo, pimetrozina, piretrina, piridabeno, piridalilo, piriproxifeno, rianodina, espinosad, espiroclorfen, espiromesifeno, tebufenozida, tiacloprid, tiametoxam, tiodicarb, tralometrina, triazamato, triflumurona, *Bacillus thuringiensis*, delta toxina de *Bacillus thuringiensis* y *Beauveria bassiana*.

Para realizaciones en donde se usan uno o más de estos diversos compañeros de mezcla, la relación en peso de estos diversos compañeros de mezcla (en total) al compuesto de Fórmula 1 está típicamente entre aproximadamente 1:3000 y aproximadamente 3000:1. Son de interés las relaciones en peso entre aproximadamente 1:300 y aproximadamente 300:1 (por ejemplo, relaciones entre aproximadamente 1:30 y aproximadamente 30:1). Un experto en la técnica puede determinar con facilidad a través de simple experimentación las cantidades biológicamente eficaces de ingredientes activos necesarias para el espectro deseado de actividad biológica. Será evidente que incluir estos componentes adicionales puede expandir el espectro de plagas de invertebrados controladas más allá del espectro controlado por el compuesto solo de Fórmula 1.

En ciertos ejemplos, las combinaciones de un compuesto de esta invención con otros compuestos o agentes biológicamente activos (en particular, control de plagas de invertebrados) (es decir, ingredientes activos) pueden dar como resultado un efecto más que aditivo (es decir, sinérgico). Siempre es deseable reducir la cantidad de ingredientes activos liberados en el medio ambiente mientras se asegura un control de las plagas eficaz. Cuando la sinergia de ingredientes activos para el control de plagas de invertebrados se produce con tasas de aplicación que dan niveles agrónomicamente satisfactorios de control de plagas de invertebrados, tales combinaciones pueden ser ventajosas para reducir los costes de producción de cultivos y reducir la carga ambiental.

Es de interés una combinación de un compuesto de Fórmula 1 con al menos otro ingrediente activo de control de plagas de invertebrados. Es de interés particular una combinación tal donde el otro ingrediente activo de control de plagas de invertebrados tenga un sitio diferente de acción del compuesto de Fórmula 1. En ciertos casos, será particularmente ventajosa para la gestión de la resistencia, una combinación con al menos un ingrediente activo distinto para el control de plagas de invertebrados que tenga un espectro de control similar aunque un diferente sitio de acción. De esta forma, una composición de la presente invención puede comprender además una cantidad biológicamente eficaz de al menos un ingrediente activo de control de plagas de invertebrados adicional que tiene un espectro de control similar aunque un sitio de actuación diferente. Poner en contacto una planta modificada genéticamente para expresar un compuesto de plagas de invertebrados (por ejemplo, proteína) o el sitio de la planta con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de esta invención, puede proporcionar también un espectro más amplio de protección de plantas y ser ventajoso para la gestión de la resistencia.

La Tabla A enumera combinaciones específicas de un compuesto de Fórmula 1 con otros agentes de control de plagas de invertebrados ilustrativos de las mezclas, composiciones y métodos de la presente invención. La primera columna de la Tabla A enumera los agentes de control de plagas de invertebrados específicos (por ejemplo, "Abamectina" en la primera línea). La segunda columna de la Tabla A enumera el modo de acción (si se conoce) o clase química de los agentes de control de plagas de invertebrados. La tercera columna de la Tabla A enumera la(s) realización(es) de intervalos de relaciones en peso para las relaciones a las que el agente de control de plagas de invertebrados se puede aplicar respecto a un compuesto de Fórmula 1, uno *N*-óxido o una sal del mismo, (por ejemplo, "50:1 a 1:50" de abamectina respecto a un compuesto de Fórmula 1 en peso). Así, por ejemplo, la primera línea de la Tabla A describe específicamente la combinación de un compuesto de Fórmula 1 con abamectina que puede aplicarse en una relación de pesos entre 50:1 a 1:50. Las líneas restantes de la Tabla A se van a construir de forma similar. De interés adicional, la Tabla A enumera combinaciones específicas de un compuesto de Fórmula 1 con otros agentes de control de plagas de invertebrados ilustrativos de las mezclas, composiciones y métodos de la presente invención e incluye realizaciones adicionales de intervalos de relaciones en peso para grados de aplicación.

ES 2 398 520 T3

Tabla A

Agente de Control de Plagas de Invertebrados	Modo de Acción o Clase Química	Relación en Peso Típica
Abamectina	lactonas macrocíclicas	entre 50:1 y 1:50
Acetamiprid	neonicotinoides	entre 150:1 y 1:200
Amitraz	ligandos del receptor de octopamina	entre 200:1 y 1:100
Avermectina	lactonas macrocíclicas	entre 50:1 y 1:50
Azadiractina	agonistas de ecdisona	entre 100:1 y 1:120
Beta-ciflutrina	moduladores del canal de sodio	entre 150:1 y 1:200
Bifentrina	moduladores del canal de sodio	entre 100:1 y 1:10
Buprofezina	inhibidores de la síntesis de quitina	entre 500:1 y 1:50
Cartap	análogos de nereistoxina	entre 100:1 y 1:200
Clorantraniliprol	ligandos del receptor de rianodina	100:1 a 1: 120
Clorfenapir	inhibidores del transporte de electrones mitocondriales	entre 300:1 y 1:200
Clorpirifos	inhibidores de la colinesterasa	entre 500:1 y 1:200
Clotianidina	neonicotinoides	entre 100:1 y 1:400
Ciflutrina	moduladores del canal de sodio	entre 150:1 y 1:200
Cihalotrina	moduladores del canal de sodio	entre 150:1 y 1:200
Cipermetrina	moduladores del canal de sodio	entre 150:1 y 1:200
Ciromazina	inhibidores de la síntesis de quitina	entre 400:1 y 1:50
Deltametrina	moduladores del canal de sodio	entre 50:1 y 1:400
Dieldrina	insecticidas de ciclodieno	entre 200:1 y 1:100
Dinotefurano	neonicotinoides	entre 150:1 y 1:200
Diofenolano	inhibidor de la muda	entre 150:1 y 1:200
Emamectina	lactonas macrocíclicas	entre 50:1 y 1:10
Endosulfano	insecticidas de ciclodieno	entre 200:1 y 1:100
Esfenvalerato	moduladores del canal de sodio	entre 100:1 y 1:400
Etiprol	bloqueadores del canal de cloruro regulado por GABA	entre 200:1 y 1:100
Fenotiocarb		entre 150:1 y 1:200
Fenoxicarb	mímicos de la hormona juvenil	entre 500:1 y 1:100
Fenvalerato	moduladores del canal de sodio	entre 150:1 y 1:200
Fipronilo	bloqueadores del canal de cloruro regulado por GABA	entre 150:1 y 1:100
Fonicamida		entre 200:1 y 1:100
Flubendiamida	ligandos del receptor de rianodina	entre 100:1 y 1:120
flufenoxurona	inhibidores de la síntesis de quitina	entre 200:1 y 1:100
hexaflumurona	inhibidores de la síntesis de quitina	entre 300:1 y 1:50
Hidrametilnona	inhibidores del transporte de electrones mitocondriales	entre 150:1 y 1:250
Imidacloprid	neonicotinoides	entre 1000:1 y 1:1000

ES 2 398 520 T3

Agente de Control de Plagas de Invertebrados	Modo de Acción o Clase Química	Relación en Peso Típica
Indoxacarb	moduladores del canal de sodio	entre 200:1 y 1:50
Lambda-cihalotrina	moduladores del canal de sodio	entre 50:1 y 1:250
lufenurona	inhibidores de la síntesis de quitina	entre 500:1 y 1:250
Metaflumizona		entre 200:1 y 1:200
Metomilo	inhibidores de la colinesterasa	entre 500:1 y 1:100
Metopreno	mímicos de la hormona juvenil	entre 500:1 y 1:100
Metoxifeno	agonistas de ecdisona	entre 50:1 y 1:50
Nitenpiram	neonicotinoides	entre 150:1 y 1:200
Nitiazina	neonicotinoides	entre 150:1 y 1:200
novalurona	inhibidores de la síntesis de quitina	500:1 a 1:150
Oxamilo	inhibidores de la colinesterasa	entre 200:1 y 1:200
Pimetrozina		entre 200:1 y 1:100
Piretrina	moduladores del canal de sodio	entre 100:1 y 1:10
Piridabeno	inhibidores del transporte de electrones mitocondriales	entre 200:1 y 1:100
Piridalilo		entre 200:1 y 1:100
Piriproxifeno	mímicos de la hormona juvenil	entre 500:1 y 1:100
Rianodina	ligandos del receptor de rianodina	entre 100:1 y 1:120
Espinetoram	lactonas macrocíclicas	entre 150:1 y 1:100
Espinosad	lactonas macrocíclicas	entre 500:1 y 1:10
Espirodiclofeno	inhibidores de la biosíntesis de lípidos	entre 200:1 y 1:200
Espiromesifeno	inhibidores de la biosíntesis de lípidos	entre 200:1 y 1:200
Tebufenozida	agonistas de ecdisona	entre 500:1 y 1:250
Tiacloprid	neonicotinoides	entre 100:1 y 1:200
Tiametoxam	neonicotinoides	entre 1250:1 y 1:1000
Tiodicarb	inhibidores de la colinesterasa	entre 500:1 y 1:400
Tiosultap-sodio		entre 150:1 y 1:100
Tralometrina	moduladores del canal de sodio	entre 150:1 y 1:200
Triazamato	inhibidores de la colinesterasa	entre 250:1 y 1:100
triflumurona	inhibidores de la síntesis de quitina	entre 200:1 y 1:100
<i>Bacillus thuringiensis</i>	agentes biológicos	entre 50:1 y 1:10
delta-endotoxina de <i>Bacillus thuringiensis</i>	agentes biológicos	entre 50:1 y 1:10
NPV (por ejemplo, Gemstar)	agentes biológicos	entre 50:1 y 1:10

Una realización de agentes de control de plagas de invertebrados (por ejemplo, insecticidas y acaricidas) para mezclar con compuestos de esta invención incluyen moduladores del canal de sodio tales como bifentrina, cipermetrina, cihalotrina, lambda-cihalotrina, ciflutrina, beta-ciflutrina, deltametrina, dimeflutrina, esfenvalerato, fenvalerato, indoxacarb, metoflutrina, proflutrina, piretrina y tralometrina; inhibidores de la colinesterasa tales como clorpirifos, metomilo, oxamilo, tiodicarb y triazamato; neonicotinoides tales como acetamiprid, clotianidina, dinotefurano, imidacloprid, nitenpiram, nitiazina, tiacloprid y tiametoxam; lactonas macrocíclicas insecticidas tales como espinetoram, espinosad, abamectina, avermectina y emamectina; bloqueadores del canal del cloruro regulados por GABA (ácido γ -aminobutírico) tales como endosulfano, etiprol y fipronilo; inhibidores de la síntesis de

5

quitina tales como buprofezina, ciromazina, flufenoxurona, hexaflumurona, lufenurona, novalurona, noviflumurona y triflunzurona; mímicos de la hormona juvenil tales como diofenolano, fenoxicarb, metopreno y piriproxifeno; ligandos del receptor de octopamina tal como amitraz; agonistas de ecdisona tales como azadiractina, metoxifenozida y tebufenozida; ligandos del receptor de rianodina tales como rianodina, diamidas antranílicas tales como clorantraniliprol (véase la patente de EE.UU. 6.747.047, publicaciones PCT WO 2003/015518 y WO 2004/067528) y flubendiamida (véase la patente de EE.UU. 6.603.044); análogos de nereistoxina tal como cartap; inhibidores del transporte de electrones mitocondriales tales como clorfenapir, hidrametilnona y piridabeno; inhibidores de la biosíntesis de lípidos tales como espirodiclofeno y espiromesifeno; insecticidas de ciclodieno tales como dieldrina; ciflumetofeno; fenotiocarb; flonicamid; metaflumizona; pirafuprol; piridalilo; piriprol; pimetrozina; espirotetramat; y tiosultap-sodio. Una realización de agentes biológicos para mezclar con compuestos de esta invención incluyen nucleopolihedrovirus tales como HzNPV y AfNPV; *Bacillus thuringiensis* y delta-endotoxinas encapsuladas de *Bacillus thuringiensis* tales como Cellcap, MPV y MPVII; además de insecticidas víricos que se dan de forma natural y genéticamente modificados que incluyen miembros de la familia Baculoviridae además de hongos entomófagos. Es de interés que la composición de la presente invención en donde el al menos un compuesto o agente adicional biológicamente activo se selecciona de los Agentes de Control de Plagas de Invertebrados enumerados en la Tabla A anterior. También es de interés la composición de la presente invención en donde el al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional se selecciona del grupo que consiste en cipermetrina, cihalotrina, ciflutrina, beta-ciflutrina, esfenvalerato, fenvalerato, tralometrino, fenotiocarb, metomilo, oxamilo, tiodicarb, acetamiprida, clotianidina, imidacloprid, tiametoxam, tiacloprid, indoxacarb, espinosad, abamectina, avermectina, emamectina, endosulfano, etiprol, fipronilo, flufenoxurona, triflumurona, diofenolano, piriproxifeno, pimetrozina, amitraz, *Bacillus thuringiensis aisawai*, *Bacillus thuringiensis kurstaki*, delta endotoxina de *Bacillus thuringiensis* y hongos entomófagos.

La relaciones en peso de un compuesto, que incluye un compuesto de Fórmula 1, un N-óxido o una sal del mismo, al agente de control de plagas de invertebrados adicional están típicamente entre 1000:1 y 1:1000, con una realización estando entre 500:1 y 1:500, otra realización estando entre 250:1 y 1:200 y otra realización estando entre 100:1 y 1:50.

Se enumeran más abajo en la Tabla B las realizaciones de composiciones específicas que comprenden un compuesto de Fórmula 1 (los números de compuesto se refieren a compuestos en las Tablas de Índice B y C) y un agente adicional de control de plagas de invertebrados.

30

Tabla B

Mezcla Núm.	Comp. Núm.	y	Agente de Control de Plagas de Invertebrados	Mezcla Núm.	Comp. Núm.	y	Agente de Control de Plagas de Invertebrados
C-1	107	y	Abamectina	D-1	208	y	Abamectina
C-2	107	y	Acetamiprid	D-2	208	y	Acetamiprid
C-3	107	y	Amitraz	D-3	208	y	Amitraz
C-4	107	y	Avermectina	D-4	208	y	Avermectina
C-5	107	y	Azadiractina	D-5	208	y	Azadiractina
C-6	107	y	Beta-ciflutrina	D-6	208	y	Beta-ciflutrina
C-7	107	y	Bifentrina	D-7	208	y	Bifentrina
C-8	107	y	Buprofezina	D-8	208	y	Buprofezina
C-9	107	y	Cartap	D-9	208	y	Cartap
C-10	107	y	Clorantraniliprol	D-10	208	y	Clorantranitiprol
C-11	107	y	Clorfenapir	D-11	208	y	Clorfenapir
C-12	107	y	Clorpirifos	D-12	208	y	Clorpirifos
C-13	107	y	Clotianidina	D-13	208	y	Clotianidina
C-14	107	y	Ciflutrina	D-14	208	y	Ciflutrina
C-15	107	y	Cihalotrina	D-15	208	y	Cihalotrina
C-16	107	y	Cipermetrina	D-16	208	y	Cipermetrina
C-17	107	y	Ciromazina	D-17	208	y	Ciromazina
C-18	107	y	Deltametrina	D-18	208	y	Deltametrina

ES 2 398 520 T3

Mezcla Núm.	Comp. Núm.	y	Agente de Control de Plagas de Invertebrados	Mezcla Núm.	Comp. Núm.	y	Agente de Control de Plagas de Invertebrados
C-19	107	y	Dieldrina	D-19	208	y	Dieldrina
C-20	107	y	Dinotefurano	D-20	208	y	Dinotefurano
C-21	107	y	Diofenolano	D-21	208	y	Diofenolano
C-22	107	y	Emamectina	D-22	208	y	Emamectina
C-23	107	y	Endosulfano	D-23	208	y	Endosulfano
C-24	107	y	Esfenvalerato	D-24	208	y	Esfenvalerato
C-25	107	y	Etiprol	D-25	208	y	Etiprol
C-26	107	y	Fenotiocarb	D-26	208	y	Fenotiocarb
C-27	107	y	Fenoxicarb	D-27	208	y	Fenoxicarb
C-28	107	y	Fenvalerato	D-28	208	y	Fenvalerato
C-29	107	y	Fipronilo	D-29	208	y	Fipronilo
C-30	107	y	Flonicamida	D-30	208	y	Flonicamida
C-31	107	y	Flubendiamida	D-31	208	y	Flubendiamida
C-32	107	y	Flufenoxurona	D-32	208	y	Flufenoxurona
C-33	107	y	Hexaflumurona	D-33	208	y	Hexaflumurona
C-34	107	y	Hidrametilnona	D-34	208	y	Hidrametilnona
C-35	107	y	Imidacloprid	D-35	208	y	Imidacloprid
C-36	107	y	Indoxacarb	D-36	208	y	Indoxacarb
C-37	107	y	Lambda-cihalotrina	D-37	208	y	Lambda-cihalotrina
C-38	107	y	Lufenurona	D-38	208	y	Lufenurona
C-39	107	y	Metaflumizona	D-39	208	y	Metaflumizona
C-40	107	y	Metomilo	D-40	208	y	Metomilo
C-41	107	y	Metopreno	D-41	208	y	Metopreno
C-42	107	y	Metoxifenoazida	D-42	208	y	Metoxifenoazida
C-43	107	y	Nitenpiram	D-43	208	y	Nitenpiram
C-44	107	y	Nitiazina	D-44	208	y	Nitiazina
C-45	107	y	Novalurona	D-45	208	y	Novalurona
C-46	107	y	Oxamilo	D-46	208	y	Oxamilo
C-47	107	y	Pimetrozina	D-47	208	y	Pimetrozina
C-48	107	y	Piretrina	D-48	208	y	Piretrina
C-49	107	y	Piridabeno	D-49	208	y	Piridabeno
C-50	107	y	Piridalilo	D-50	208	y	Piridalilo
C-51	107	y	Piriproxifeno	D-51	208	y	Piriproxifeno
C-52	107	y	Rianodina	D-52	208	y	Rianodina
C-53	107	y	Espinetoram	D-53	208	y	Espinetoram
C-54	107	y	Espinosad	D-54	208	y	Espinosad
C-55	107	y	Espiroticlofeno	D-55	208	y	Espiroticlofeno
C-56	107	y	Espiromesifeno	D-56	208	y	Espiromesifeno
C-57	107	y	Tebufenozida	D-57	208	y	Tebufenozida

Mezcla Núm.	Comp. Núm.	y	Agente de Control de Plagas de Invertebrados	Mezcla Núm.	Comp. Núm.	y	Agente de Control de Plagas de Invertebrados
C-58	107	y	Tiacloprid	D-58	208	y	Tiacloprid
C-59	107	y	Tiametoxam	D-59	208	y	Tiametoxam
C-60	107	y	Tiodicarb	D-60	208	y	Tiodicarb
C-61	107	y	Tiosultap-sodio	D-61	208	y	Tiosultap-sodio
C-62	107	y	Tralometrina	D-62	208	y	Tralometrina
C-63	107	y	Triazamato	D-63	208	y	Triazamato
C-64	107	y	Triflumurona	D-64	208	y	Triflumurona
C-65	107	y	<i>Bacillus thuringiensis</i>	D-65	208	y	<i>Bacillus thuringiensis</i>
C-66	107	y	Delta-endotoxina de <i>Bacillus thuringiensis</i>	D-66	208	y	Delta-endotoxina de <i>Bacillus thuringiensis</i>
C-67	107	y	NPV (por ejemplo, Gemstar)	D-67	208	y	NPV (por ejemplo, Gemstar)

Las mezclas específicas enumeradas en la Tabla B combinan típicamente un compuesto de Fórmula 1 con el otro agente de plaga de invertebrados en las proporciones especificadas en la Tabla A.

5 Las plagas de invertebrados se controlan en aplicaciones agronómicas y no agronómicas por medio de la aplicación de uno o más compuestos de esta invención, típicamente en forma de una composición, en una cantidad biológicamente eficaz, al entorno de las plagas, incluyendo el sitio agronómico y/o no agronómico de infestación, al área a proteger o directamente sobre las plagas a controlar.

10 Así, la presente invención comprende un método para controlar una plaga de invertebrados en aplicaciones agronómicas y/o no agronómicas, que comprende poner en contacto la plaga de invertebrados o su entorno con una cantidad biológicamente eficaz de uno o más de los compuestos de la invención, o con una composición que comprende al menos uno de dichos compuestos o una composición que comprende al menos uno de dichos compuestos y una cantidad biológicamente eficaz de al menos un compuesto o agente adicional biológicamente activo. Los ejemplos de composiciones adecuadas que comprenden un compuesto de la invención y una cantidad biológicamente eficaz de al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional incluyen composiciones granulares en donde el compuesto activo adicional está presente en el mismo gránulo que el compuesto de la invención, o en gránulos separados de los del compuesto de la invención.

15 Para lograr un contacto con un compuesto o composición de la invención para proteger un cultivo de plagas de invertebrados, el compuesto o composición se aplica típicamente a la semilla del cultivo antes del plantado, al follaje (por ejemplo, hojas, tallos, flores, frutos) de plantas de cultivo o al suelo u otro medio de crecimiento antes o después de plantar el cultivo.

20 Una realización de un método de contacto es por pulverización. De forma alternativa, una composición granular que comprende un compuesto de la invención puede aplicarse al follaje de las plantas o al suelo. Los compuestos de esta invención se pueden repartir también de forma eficaz a través de la captación de la planta, poniendo en contacto la planta con una composición que comprende un compuesto de esta invención aplicado como un rociado de una formulación líquida en el suelo, una formulación granular en el suelo, un tratamiento en una caja de vivero o una inmersión de los trasplantes. Es de interés una composición de la presente invención en forma de una formulación líquida de empapado del suelo. También es de interés un método para controlar una plaga de invertebrados que comprende poner en contacto la plaga de invertebrados o su entorno con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de la presente invención o con una composición que comprende una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de la presente invención. También es de interés este método en donde el entorno es el suelo y la composición se aplica al suelo como una formulación de empapado del suelo. Es de interés adicional que los compuestos de esta invención también son efectivos por aplicación localizada al sitio de infestación. Otros métodos de contacto incluyen la aplicación de un compuesto o una composición de la invención mediante pulverizaciones directas y residuales, pulverizaciones aéreas, geles, recubrimientos de semillas, microencapsulaciones, captaciones sistémicas, cebos, marcadores, píldoras gruesas, nebulizadores térmicos, fumigadores, aerosoles, polvos y muchos otros. Una realización de un método de contacto es un gránulo, barra o comprimido fertilizante dimensionalmente estable que comprende un compuesto o composición de la invención. Los compuestos de esta invención también se pueden impregnar en materiales para fabricar dispositivos de control de invertebrados (por ejemplo, redes para insectos).

40 Los compuestos de esta invención también son útiles en tratamientos de semillas para proteger las semillas de plagas de invertebrados. En el contexto de la presente descripción y reivindicaciones, tratar una semilla implica

poner en contacto la semilla con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de esta invención, que se formula típicamente como una composición de la invención. Este tratamiento de semilla protege a la semilla de plagas invertebradas de suelos y generalmente también puede proteger raíces y otras partes de la planta en contacto con el suelo de la plántula que se desarrolla de la semilla en germinación. El tratamiento de semilla también puede proporcionar protección al follaje por translocación del compuesto de esta invención o un segundo ingrediente activo dentro de la planta en desarrollo. Pueden aplicarse tratamientos de semillas a todo tipos de semillas, incluyendo aquellas a partir de las que germinarán plantas genéticamente transformadas para expresar rasgos especializados. Los ejemplos representativos incluyen aquellas que expresan proteínas tóxicas para las plagas de invertebrados, tales como toxina de *Bacillus thuringiensis* o aquellas que expresan resistencia a herbicidas tales como glifosato acetiltransferasa, que proporciona resistencia al glifosato.

Un método de tratamiento de semillas es por pulverización o espolvoreo de la semilla con un compuesto de la invención (es decir, como una composición formulada) antes de sembrar las semillas. Las composiciones formuladas para el tratamiento de semillas comprenden en general un formador de película o un agente adhesivo. En consecuencia, una composición de recubrimiento de semilla de la presente invención comprende típicamente una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula 1, un N-óxido o una sal del mismo, y un formador de película o agente adhesivo. La semilla se puede recubrir por pulverización de un concentrado en suspensión fluido directamente en un lecho de volteo de semillas y luego secando las semillas. Alternativamente, se pueden pulverizar otros tipos de formulación tales como polvos humectados, disoluciones, suspoemulsiones, concentrados emulsificables y emulsiones en agua en la semilla. Este procedimiento es particularmente útil para aplicar recubrimientos de película sobre semillas. Diversas máquinas y procedimientos de recubrimiento están disponibles para el experto en la técnica. Los procedimientos adecuados incluyen los enumerados en P. Kosters et al., *Seed Treatment: Progress and Prospects*, 1994 BCPC Monográfico núm. 57, y las referencias enumeradas en el mismo.

La semilla tratada comprende típicamente un compuesto de la presente invención en una cantidad de aproximadamente 0,1 g a 1 kg por 100 kg de semilla (es decir, de aproximadamente 0,0001 a 1% en peso de la semilla antes del tratamiento). Una suspensión fluida formulada para el tratamiento de semillas comprende típicamente de aproximadamente 0,5 a aproximadamente 70% del ingrediente activo, de aproximadamente 0,5 a aproximadamente 30% de un adhesivo formador de película, de aproximadamente 0,5 a aproximadamente 20% de un agente de dispersión, de 0 a aproximadamente 5% de un espesante, de 0 a aproximadamente 5% de un pigmento y/o tinte, de 0 a aproximadamente 2% de un agente antiespumante, de 0 a aproximadamente 1% de un conservante, y de 0 a aproximadamente 75% de un diluyente líquido volátil.

Los compuestos de esta invención se pueden incorporar en una composición cebo que es consumida por una plaga de invertebrados o usada dentro de un dispositivo tal como una trampa, una estación de cebo, y similares. Dicha composición cebo puede estar en forma de gránulos que comprenden (a) ingredientes activos, a saber, una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula 1, un N-óxido o una sal del mismo; (b) uno o más materiales alimenticios; opcionalmente (c) un atrayente, y opcionalmente (d) uno o más humectantes. Son de interés los gránulos o composiciones cebo que comprenden entre aproximadamente 0,001-5% de ingredientes activos, aproximadamente 40-99% de material alimenticio y/o atrayente; y opcionalmente aproximadamente 0,05-10% de humectantes, que son eficaces en el control de plagas de invertebrados del suelo a tasas de aplicación muy bajas, particularmente con dosis del ingrediente activo que sean letales por la ingestión en vez que por contacto directo. Algunos materiales alimenticios pueden funcionar tanto como una fuente de alimento como un atrayente. Los materiales alimenticios incluyen carbohidratos, proteínas y lípidos. Los ejemplos de materiales alimenticios son harina vegetal, azúcar, almidones, grasa animal, aceite vegetal, extractos de levadura y sólidos de la leche. Los ejemplos de atrayentes son odorantes y aromatizantes, tales como fruta o extractos de plantas, perfumes, u otros componentes de animales o plantas, feromonas u otros agentes conocidos por atraer a una plaga objetivo de invertebrados. Los ejemplos de humectantes, es decir, agentes que retienen la humedad, son los glicoles y otros polioles, glicerina y sorbitol. Es de interés una composición cebo (y un método que utiliza dicha composición cebo) usado para controlar al menos una plaga de invertebrados seleccionada entre el grupo que consiste en hormigas, termitas y cucarachas. Un dispositivo para controlar una plaga de invertebrados puede comprender la composición cebo actual y una carcasa adaptada que aloje la composición cebo, en donde la carcasa tiene al menos una abertura dimensionada para permitir que la plaga de invertebrados pase a través de la abertura de tal modo que la plaga de invertebrados tenga acceso a la composición cebo desde una posición exterior a la carcasa, y en donde la carcasa se adapta además para situarse dentro o cerca de un lugar de actividad potencial o conocida para la plaga de invertebrados.

Los compuestos de esta invención pueden aplicarse sin otros adyuvantes, aunque la aplicación más frecuente será la de una formulación que comprende uno o más ingredientes activos con vehículos, diluyentes y tensioactivos adecuados y posiblemente en combinación con un alimento dependiendo del uso final contemplado. Un método de aplicación implica la pulverización de una dispersión acuosa o disolución de aceite refinado de un compuesto de la presente invención. Las combinaciones con aceites de pulverización, concentraciones con aceite de pulverización, esparcidores, adyuvantes, otros disolventes y agentes sinérgicos tales como butóxido de piperonilo, a menudo mejoran la eficacia del compuesto. Para usos no agronómicos, dichas pulverizaciones pueden aplicarse a partir de envases de pulverizado tales como una lata, una botella u otro envase, tanto por medio de una bomba como por su liberación a partir de un envase presurizado, por ejemplo, una lata presurizada de un pulverizador de aerosol. Dichas composiciones de pulverización pueden tomar diversas formas, por ejemplo, pulverizaciones, neblinas, espumas,

humos o niebla. Dichas composiciones de pulverización pueden por lo tanto comprender además propulsores, agentes espumantes, etc. según sea el caso. Es de interés una composición de pulverización que comprende una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto o una composición de la presente invención y un vehículo. Una realización de dicha composición de pulverización comprende una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto o una composición de la presente invención y un propulsor. Los propulsores representativos incluyen, aunque no se limitan a, metano, etano, propano, butano, isobutano, buteno, pentano, isopentano, neopentano, penteno, hidrofluorocarbonos, clorofluorocarbonos, dimetiléter, y las mezclas de los anteriores. Es de interés una composición de pulverización (y un método que utiliza dicha composición de pulverización dispensada a partir de un envase de pulverización) usada para controlar al menos una plaga de invertebrados seleccionada del grupo que consiste en mosquitos, moscas negras, moscas de los establos, moscas del venado, tábanos, avispas, véspulas, avispones, garrapatas, arañas, hormigas, mosquitos y similares, incluyendo de forma individual o en combinaciones.

Las aplicaciones no agronómicas incluyen la protección de un animal, en particular un vertebrado, más en particular, un vertebrado homeotérmico (por ejemplo, mamífero o ave) y más en particular, un mamífero, de una plaga parasitaria invertebrada administrando una cantidad parasiticidamente eficaz (es decir, biológicamente eficaz) de un compuesto de la invención, típicamente en forma de una composición formulada para uso veterinario, al animal a proteger. Por lo tanto, es de interés un método no terapéutico para proteger un animal que comprende administrar al animal de una cantidad parasiticidamente eficaz de un compuesto de la invención. Tal como se menciona en la presente descripción y reivindicaciones, los términos "parasiticida" y "parasiticidamente" hace referencia a efectos observables en una plaga parasitaria invertebrada para proporcionar protección a un animal de la plaga. Los efectos parasitarios se refieren típicamente a la reducción de la presencia o la actividad de la plaga parasitaria invertebrada diana. Estos efectos sobre la plaga incluyen necrosis, muerte, crecimiento retardado, movilidad reducida o menor capacidad de permanecer sobre o en el animal huésped, menor alimentación e inhibición de la reproducción. Estos efectos sobre plagas parasitarias invertebradas proporcionan el control (incluyendo prevención, reducción o eliminación) de la infestación parasitaria o la infección del animal. Ejemplos de plagas parasitarias invertebradas controladas por la administración de una cantidad parasiticidamente eficaz de un compuesto de la invención a un animal a proteger incluyen ectoparásitos (artrópodos, ácaros, etc.) y endoparásitos (helmintos, por ejemplo, nematodos, trematodos, cestodos, acantocefalinos, etc.). En particular, los compuestos de esta invención son eficaces frente a ectoparásitos que incluyen: moscas tales como *Haematobia (Lyperosia) irritans* (mosca de los cuernos), *Stomoxys calcitrans* (mosca de los establos), *Simulium* spp. (mosca negra), *Glossina* spp. (moscas tsetse), *Hydrotaea irritans* (mosca de la cabeza), *Musca autumnalis* (mosca de la cara), *Musca doméstica* (mosca doméstica), *Morellia simplex* (mosca del sudor), *Tabanus* spp. (tábano), *Hypoderma bovis*, *Hypoderma lineatum*, *Lucilia sericata*, *Lucilia cuprina* (mosca verde de la carne), *Calliphora* spp. (mosca de la carne), *Protophormia* spp., *Oestrus ovis* (estro), *Culicoides* spp. (mosquillas), *Hippobosca equina*, *Gastrophilus instestinalis*, *Gastrophilus haemorrhoidalis* y *Gastrophilus nasalis*; pulgas tales como *Bovicola (Damalinia) bovis*, *Bovicola equi*, *Haematopinus asini*, *Felicola subrostratus*, *Heterodoxus spiniger*, *Lignonathus setosus* y *Trichodectes canis*; melógafo tal como *Melofagus ovinus*; ácaros tales como *Psoroptes* spp., *Sarcoptes scabiei*, *Chorioptes bovis*, *Demodex equi*, *Cheiletiella* spp., *Notoedres cati*, *Trombicula* spp. y *Otodectes cyanotis* (ácaros de las orejas); garrapatas tales como *Ixodes* spp., *Boophilus* spp., *Rhipicephalus* spp., *Amblyomma* spp., *Dermacentor* spp., *Hyalomma* spp. y *Haemaphysalis* spp.; y pulgas tales como *Ctenocephalides felis* (pulga del gato) y *Ctenocephalides canis* (pulga del perro).

Las aplicaciones no agronómicas en el sector veterinario son por medios convencionales tales como por administración enteral en forma de, por ejemplo, comprimidos, cápsulas, bebidas, preparados de imbibición, granulados, pastas, bolos, procedimientos de alimentación o supositorios; o por administración parenteral, tales como por inyección (incluyendo intramuscular, subcutánea, intravenosa, intraperitoneal), implantes; por administración nasal; por administración tópica, por ejemplo, en forma de inmersión o baño, pulverización, lavado, recubrimiento con polvo, o aplicación a una pequeña área del animal, y a través de artículos tales como collares para el cuello, marcas para la oreja, bandas para la cola, bandas para las extremidades o bridas que comprenden compuestos o composiciones de la presente invención.

Típicamente, una composición parasiticida de acuerdo con la presente invención comprende una mezcla de un compuesto de Fórmula 1, un N-óxido o una sal del mismo, con uno o más vehículos farmacéutica o veterinariamente aceptables que comprenden excipientes y compuestos auxiliares seleccionados según la ruta pretendida de administración (por ejemplo, administración oral, tópica o parenteral tal como inyección) y de acuerdo con la práctica estándar. Además, se selecciona un vehículo adecuado en base a la compatibilidad con uno o más ingredientes activos en la composición, incluyendo consideraciones tales como estabilidad respecto al pH y contenido de humedad. Por lo tanto, es de interés una composición para proteger a un animal de una plaga parasitaria de invertebrados que comprende una cantidad parasitariamente eficaz de un compuesto de la invención y al menos un vehículo.

Para la administración parenteral, que incluye inyección intravenosa, intramuscular y subcutánea, se puede formular un compuesto de la presente invención en suspensión, disolución o emulsión en vehículos oleosos o acuosos y puede contener adyuvantes tales como agentes de suspensión, estabilización y/o dispersión. Las composiciones farmacéuticas para inyección incluyen disoluciones acuosas de formas hidrosolubles de ingredientes activos (por ejemplo, una sal de un compuesto activo), preferiblemente en tampones fisiológicamente compatibles que contienen otros excipientes o compuestos auxiliares conocidos en la técnica de la formulación farmacéutica.

Para la administración oral, que incluyen disoluciones (la forma de absorción más fácilmente disponible), emulsiones, suspensiones, pastas, geles, cápsulas, comprimidos, polvos en bolos, gránulos, retención ruminal y alimento/agua/bloques para lamer, se puede formular un compuesto de la presente invención con aglutinantes/rellenos conocidos en la técnica por ser adecuados para composiciones de administración oral, tales como azúcares (por ejemplo, lactosa, sacarosa, manitol, sorbitol), almidón (por ejemplo, almidón de maíz, almidón de trigo, almidón de arroz, almidón de patata), celulosa y derivados (por ejemplo, metilcelulosa, carboximetilcelulosa, etilhidroxicelulosa), derivados proteicos (por ejemplo, zeína, gelatina) y polímeros sintéticos (por ejemplo, poli(alcohol vinílico), polivinilpirrolidona). Si se desea, pueden añadirse lubricantes (por ejemplo, estearato de magnesio), agentes disgregantes (por ejemplo, polivinilpirrolidona reticulada, agar, ácido algínico) y tintes o pigmentos. Las pastas y geles también contienen a menudo adhesivos (por ejemplo, goma arábica, ácido algínico, bentonita, celulosa, goma de xantano, silicato coloidal de magnesio y aluminio) para ayudar a mantener la composición en contacto con la cavidad oral y que no sea fácilmente rechazada.

Si las composiciones parasiticidas están en forma de concentrados alimenticios, el vehículo se selecciona típicamente a partir de alimento de alto rendimiento, cereales alimenticios o concentrados proteicos. Estas composiciones que contienen concentrados alimenticios pueden comprender, además de ingredientes activos parasiticidas, de aditivos que promueven la salud animal o el crecimiento, calidad mejorada de la carne de animales para matanza o útiles de otra forma para el manejo animal. Estos aditivos pueden incluir, por ejemplo, vitaminas, antibióticos, agentes quimioterapéuticos, bacteriostatos, fungistatos, coccidiostatos y hormonas.

Se ha descubierto que los compuestos de la presente invención tienen propiedades farmacocinéticas y farmacodinámicas favorables para proporcionar disponibilidad sistémica de la administración oral e ingestión. Por lo tanto, después de la ingestión por el animal a proteger, las concentraciones parasiticidamente eficaces de los compuestos de la invención en el torrente sanguíneo protegen al animal tratado de plagas chupadoras de sangre tales como pulgas, garrapatas y piojos. Por lo tanto, es de interés una composición para proteger a un animal de una plaga parasitaria invertibrada en forma de administración oral (es decir, que comprende, además de una cantidad parasiticidamente eficaz de un compuesto de la invención, uno o más vehículos seleccionados de aglutinantes y rellenos apropiados para administración oral y vehículos de concentrados alimenticios).

Las formulaciones para administración tópica están típicamente en forma de un polvo, crema, suspensión, pulverización, emulsión, espuma, pasta, aerosol, ungüento, bálsamo o gel. Más típicamente, una formulación tópica es una disolución hidrosoluble que puede estar en forma de un concentrado que se diluye antes de usar. Las composiciones parasiticidas adecuadas para la administración tópica comprenden típicamente un compuesto de la presente invención y uno o más vehículos tópicamente adecuados. En aplicaciones de una composición parasiticida por vía tópica al exterior de un animal como una línea o mancha (es decir, tratamiento "spot-on"), se espera que el ingrediente activo migre sobre la superficie del activo para cubrir la mayor parte o toda su superficie externa. Como resultado, el animal tratado está particularmente protegido de plagas de invertibrados que se alimentan de la epidermis del animal tales como pulgas, garrapatas y piojos. En consecuencia, las formulaciones para administración localizada tópica a menudo comprenden al menos un disolvente orgánico para facilitar el transporte del ingrediente activo sobre la piel y/o la penetración en la epidermis del animal. Los disolventes comúnmente usados como vehículos en dichas formulaciones incluyen propilenglicol, parafinas, productos aromáticos, ésteres tales como miristato de isopropilo, glicoléteres y alcoholes tales como etanol y n-propanol.

La tasa de aplicación necesaria para un control eficaz (es decir, la "cantidad biológicamente eficaz") dependerá de factores tales como la especie de invertibrado a controlar, el ciclo de vida de la plaga, la fase de la vida, su tamaño, localización, momento del año, cultivo o animal hospedador, comportamiento de alimentación, comportamiento de apareamiento, humedad ambiental, temperatura y similares. En circunstancias normales son suficientes relaciones de aplicación de aproximadamente 0,01 a 2 kg de ingredientes activos por hectárea para controlar plagas en ecosistemas agronómicos, pero puede ser suficiente tan solo 0,0001 kg/hectárea o se puede requerir tanto como 8 kg/hectárea. Para aplicaciones no agronómicas, las proporciones de uso eficaces variarán de aproximadamente 1,0 a 50 mg/metro cuadrado, pero puede ser suficiente tan sólo 0,1 mg/metro cuadrado o puede necesitarse tanto como 150 mg/metro cuadrado. Un experto en la técnica puede determinar fácilmente la cantidad biológicamente eficaz necesaria para el nivel deseado de control de plagas de invertibrados.

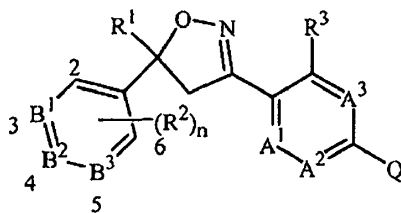
En general, para uso veterinario, un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido o una sal del mismo, se administra en una cantidad parasiticidamente eficaz a un animal a proteger de plagas parasitarias de invertibrados. Una cantidad parasiticidamente eficaz es la cantidad de ingrediente activo necesaria para lograr un efecto observable que reduce la aparición o la actividad de la plaga parasitaria de invertibrados diana. Un experto en la técnica apreciará que la dosis parasiticidamente eficaz puede variar para los diversos compuestos y composiciones de la presente invención, el efecto parasiticida deseado y duración, la especie de plaga de invertibrados diana, el animal a proteger, el modo de aplicación y similares, y la cantidad necesaria para lograr un resultado particular se puede determinar a través de simple experimentación.

Para la administración oral de animales homeotérmicos, la dosis diaria de un compuesto de la presente invención típicamente oscila de aproximadamente 0,01 mg/kg a aproximadamente 100 mg/kg, más típicamente de aproximadamente 0,5 mg/kg a aproximadamente 100 mg/kg, de peso corporal animal. Para administración tópica (por ejemplo, dérmica), los baños de inmersión y pulverizadores contienen típicamente de aproximadamente 0,5

ppm a aproximadamente 5000 ppm, más típicamente de aproximadamente 1 ppm a aproximadamente 3000 ppm, de un compuesto de la presente invención.

- 5 Las siguientes abreviaturas se usan en las Tablas de Índices A-D que siguen: *t* es terciario, *s* es secundario, *n* es normal, *i* es iso, *c* es ciclo. Me es metilo, Et es etilo, Pr es propilo, *i*-Pr es isopropilo, Bu es butilo, *c*-Pr es ciclopropilo, *t*-Bu es *terc*-butilo, Ph es fenilo, OMe es metoxi, CF₃ significa trifluorometilo, -CN es ciano y -NO₂ es nitro. La abreviatura "Ej." significa "Ejemplo" y va seguida de un número que indica en qué ejemplo se prepara el compuesto. En las Tablas de Índice A, B y C, (R²)_k se refiere a la combinación de (R²)_n como se muestra con ejemplos de CR² para B¹, B² y B³, y así *k* es 1, 2, 3, 4 o 5 para las Tablas de Índice A, B y C.

TABLA DE ÍNDICE DE REFERENCIA A



10

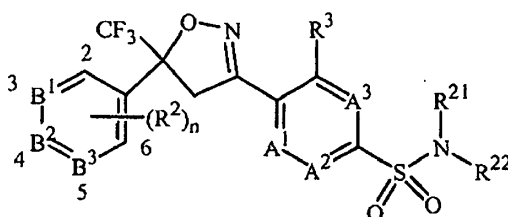
en donde B¹, B² y B³ son CR², y R³ es H.

Compuesto	R ¹	(R ²) _k	A ¹	A ²	A ³	Q	p.f. (°C)
Referencia 9	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	CH	CH	CH	1 <i>H</i> -1,2,4-triazol-1-ilo	181-182
Referencia 14	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	CH	C-Me	CH	1 <i>H</i> -1,2,4-triazol-1-ilo	126-127
Referencia 26	CF ₃	3-Br, 5-Br	CH	CH	CH	1 <i>H</i> -1,2,4-triazol-1-ilo	165-166
Referencia 38	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	CH	C-NO ₂	CH	1 <i>H</i> -1,2,4-triazol-1-ilo	61-62
Referencia 42	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	CH	C-CN	CH	1 <i>H</i> -1,2,4-triazol-1-ilo	64-66
Referencia 63	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	CH	C-Br	CH	1 <i>H</i> -1,2,4-triazol-1-ilo	72-73
Referencia 72	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	CH	C-CN	CH	1 <i>H</i> -tetrazol-1-ilo	84-85

*Véase la Tabla de Índice E para los datos de ¹H RMN

**Compuestos 43 y 44 son isómeros enantioméricos separados por cromatografía de columna quiral, aunque la configuración absoluta de cada compuesto no se ha determinado aún.

TABLA DE ÍNDICE B



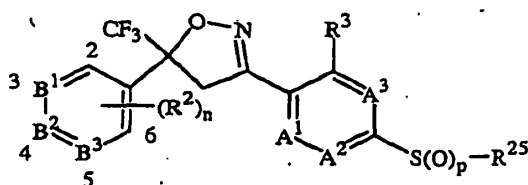
en donde B¹, B² y B³ son CR², y R³ es H.

Compuesto	(R ²) _k	A ¹	A ²	A ³	R ²¹	R ²²	p.f. (°C)
101	H	CH	C-Me	CH	H	<i>i</i> -Pr	*
102	3-Cl, 5-Cl	CH	C-Me	CH	H	<i>i</i> -Pr	*
103	3-Cl, 5-Cl	CH	C-Me	CH	H	CH ₂ CF ₃	*
104	H	CH	C-Me	CH	H	CH ₂ CF ₃	*
105	3-Cl, 5-Cl	CH	C-Me	CHF	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	*
106	3-Cl, 4-Cl	CH	C-Me	CH	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	*
107	3-Cl, 5-Cl	CH	C-Me	CH	H	CH ₂ - <i>c</i> -Pr	105-106

Compuesto	(R ²) _k	A ¹	A ²	A ³	R ²¹	R ²²	p.f. (°C)
108	3-Cl, 5-Cl	CH	C-Me	CH	Me	Me	142-143
109	3-Cl, 5-Cl	CH	C-Me	CH	H	CH ₂ CN	64-65
110	3-Cl, 5-Cl	CH	C-Me	CH	Me	CH ₂ Ph	*
111	3-Cl, 5-Cl	CH	C-Me	CH	H	Me	140-142
112	3-Cl, 5-Cl	CH	C-Me	CH	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	88-89
113 (Ej. 4)	3-Cl, 5-Cl	CH	C-Me	CH	H	CH ₂ -2-piridinilo	57-58
114	3-Cl, 5-Cl	CH	CH	CH	H	CH ₂ -2-piridinilo	*
115	3-Cl, 5-Cl	CH	CH	CH	H	<i>i</i> -Pr	133-134
116	3-Cl, 5-Cl	CH	CH	CH	H	CH ₂ CN	113-114
117	3-Cl, 5-Cl	CH	CH	CH	H	CH ₂ CF ₃	154-155
118	3-Cl, 5-Cl	CH	CH	CH	H	Me	58-59
119	3-Cl, 5-Cl	CH	C-Me	CH	H	H	129-130
120	3-Cl, 5-Cl	CH	C-Me	CH	H	CH ₂ C≡CH	*
121	3-Cl, 5-Cl	CH	C-Me	CH	H	CH ₂ C=CH ₂	73-74
122	3-Cl, 5-Cl	CH	C-Me	CH	H	<i>n</i> -Pr	101-102
123	3-Cl, 5-Cl	CH	C-Me	CH	H	Et	105-106
124	3-Cl, 5-Cl	CH	CH	N	Me	Me	137-138
125	3-Cl, 5-Cl	CH	C-CN	CH	Me	Me	197-198

*Véase la Tabla de Índice E para los datos de ¹H RMN

TABLA DE ÍNDICE C.



en donde B¹, B² y B³ son CR², y R³ es H.

Compuesto	(R ²) _k	A ¹	A ²	A ³	A ²⁵	p	p.f. (°C)
201	H	CH	CH	CH	Me	2	164-166
202	3-Cl, 5-Cl	CH	CH	CH	CH ₂ -Ph	0	108-109
203	3-Cl, 5-Cl	CH	C-NO ₂	CH	CH ₂ -Ph	0	106-108
204	3-Cl, 5-Cl	CH	CH	N	CH ₂ -Ph	0	110-111
205	3-Cl, 5-Cl	CH	C-Br	CH	Me	0	*
206 (Ej. 5)	3-Cl, S-Cl	CH	C-CN	CH	Me	0	**
207	3-Cl, S-Cl	CH	C-CN	CH	Me	1	*
208 (Ej. 6)	3-Cl, 5-Cl	CH	C-CN	CH	Me	2	**
209 (Ej. 7)	3-Cl, 5-Cl	CH	CH	CH	Me	2	**
210	3-Cl, S-Cl	CH	C-CN	CH	Et	0	*
211	3-Cl, S-Cl	CH	C-CN	CH	Et	2	*

ES 2 398 520 T3

Compuesto	(R ²) _k	A ¹	A ²	A ³	A ²⁵	p	p.f. (°C)
212	3-Cl, 5-Cl	CH	C-Br	CH	Me	2	*
213	3-Cl, S-Cl	CH	C-Me	CH	Me	2	*
214	3-Cl, 5-Cl	CH	C-CN	CH	CH ₂ CF ₃	2	*

*Véase la Tabla de Índice E para los datos de ¹H RMN

** Véase el Ejemplo específico para los datos de ¹H RMN.

TABLA DE ÍNDICE E

Comp. Núm.	Datos de ¹ H RMN (disolución de CDCl ₃ a menos que se indique otra cosa) ^a
101	δ 8,11 (d, 1H), 7,68 (s, 1H), 7,6 (m, 3H), 7,44 (m, 3H), 3,77 (d, 1H), 2,65 (s, 3H), 2,63 (m, 1H), 1,32 (d, 6H).
102	δ 8,06 (d, 1H), 7,65 (s, 1H), 7,58 (d, 1H), 7,51 (s, 2H), 7,44 (s, 1H), 4,39 (d, 1H), 4,10, (d, 1H), 3,72, (d, 1H), 2,674 (s, 3H), 2,67 (m, 1H), 1,1 (d, 6H).
103	δ 8,04 (d, 1H), 7,67 (s, 1H), 7,58 (d, 1H), 7,50 (s, 2H), 7,44 (s, 1H), 4,97 (t, 1H), 4,1 (d, 1H), 3,71 (m, 3H), 2,68 (s, 3H).
104	δ 8,02 (d, 1H), 7,69 (s, 1H), 7,6 (m, 3H), 7,4 (m, 3H), 4,94 (t, 1H), 4,1 (d, 1H), 3,79 (d, 1H), 3,7 (m, 1H), 2,68 (s, 3H).
105	δ 8,13 (d, 1H), 7,68 (s, 1H), 7,64 (d, 1H), 7,5 (s, 2H), 7,44 (s, 1H), 4, (d, 1H), 3,72 (d, 1H), 3,25 (d, 2H), 2,73 (s, 3H), 2,1 (m, 1H), 0,98 (m, 6H).
106	δ 8,11 (d, 1H), 7,72 (d, 1H), 7,68 (s, 1H), 7,65 (d, 1H), 7,53 (d, 1H), 7,46 (d, 1H), 4,1 (d, 1H), 3,7 (d, 1H), 3,24 (d, 2H), 2,72 (s, 3H), 2,13 (m, 1H), 0,98 (m, 6H).
110	δ 7,99 (d, 1H), 7,67 (s, 1H), 7,6 (d, 1H), 7,52 (s, 2H), 7,44 (s, 1H), 7,3-7,4 (m, 4H), 7,24 (s, 1H), 4,316 (s, 1H), 4,1 (d, 1H), 3,72 (d, 1H), 2,70 (s, 3H), 2,69 (s, 3H).
114	δ 8,44 (d, 1H), 7,92, (d, 2H), 7,74 (d, 1H), 7,6 (t, 1H), 7,5 (s, 2H), 7,44 (s, 1H), 7,15 (d, 2H), 6,13 (br s, 1H), 4,27 (d, 2H), 4,07 (d, 1H), 3,69 (d, 1H).
120	δ 8,05 (d, 1H), 7,67 (s, 1H), 7,57 (d, 1H), 7,51 (s, 2H), 7,44 (s, 1H), 4,73 (t, 1H), 4,1 (d, 1H), 3,85 (d, 2H), 3,75 (d, 1H), 2,7 (s, 3H), 2,09 (s, 1H).
205	δ 7,78 (s, 1H), 7,6 (m, 1H), 7,5 (s, 2H), 7,4 (s, 1H), 7,15 (m, 1H), 4,05 (d, 1H), 3,62 (d, 1H), 2,5 (s, 3H).
207	δ 8,2 (m, 1H), 8,1 (m, 1H), 8,08 (m, 1H), 7,5 (s, 2H), 7,45 (s, 1H), 4,1 (d, 1H), 3,75 (d, 1H), 2,9 (s, 3H).
210	δ 7,85 (m, 1H), 7,8 (s, 1H), 7,5 (s, 2H), 7,42 (s, 1H), 7,39 (m, 1H), 4,04 (d, 1H), 3,66 (d, 1H), 3,1 (q, 2H), 1,4 (t, 3H).
211	δ 8,22 (m, 1H), 8,2 (s, 1H), 8,06 (m, 1H), 7,5 (s, 2H), 7,46 (s, 1H), 4,12 (d, 1H), 3,78 (d, 1H), 3,4 (q, 2H), 1,33 (t, 3H).
212	(Acetona-d ₆) δ 8,22 (m, 1H), 8,21 (s, 1H), 8,05 (m, 1H), 7,67 (s, 2H), 7,66 (s, 1H), 4,53 (d, 1H), 4,38 (d, 1H), 3,36 (s, 3H).
213	(Acetona-d ₆) δ 8,06 (m, 1H), 7,85 (s, 1H), 7,83 (m, 1H), 7,67 (s, 2H), 7,65 (m, 1H), 4,48 (d, 1H), 4,15 (d, 1H), 3,19 (s, 3H), 2,76 (s, 3H).
214	δ 8,3 (m, 1H), 8,25 (s, 1H), 8,1 (m, 1H), 7,5 (s, 2H), 7,45 (s, 1H), 4,26 (q, 2H), 4,12 (d, 1H), 3,87 (d, 1H).

a Los datos de ¹H RMN están en ppm campo abajo de tetrametilsilano. Los acoplamientos están designados como (s)-singlete, (d)-duplete, (t)-triplete, (q)-cuadruplete, (m)-multiplete, (dd)-duplete de dupletes, (br s)-singlete ancho.

Ejemplos bi ológicos de la invención

Los siguientes Ensayos demuestran la eficacia de control de los compuestos de esta invención en plagas específicas. La "eficacia del control" representa la inhibición del desarrollo de la plaga de invertebrados (que incluye la mortalidad) que provoca una alimentación reducida de forma significativa. Sin embargo, la protección de control de

plagas producida por los compuestos no se limita a estas especies. Véanse las Tablas de Índices A-C para las descripciones de los compuestos.

Ensayo A

5 Para evaluar el control de la palomilla de dorso de diamante (*Plutella xilostella*) la unidad de ensayo consistió en un pequeño envase abierto con una planta de rábano de 12-14 días en su interior. Esta planta se infestó previamente con 10-15 larvas recién nacidas en un trozo de material de alimentación de insectos mediante el uso de un muestreador de núcleo para retirar un trozo de una lámina de material de alimentación de insectos endurecida que tenía muchas larvas creciendo sobre ella y la transferencia del trozo que contiene las larvas y el material de alimentación a la unidad de ensayo. Las larvas se trasladaron a la planta de ensayo cuando se secó el trozo de material de alimentación.

10 Los compuestos de ensayo se formularon usando una disolución que contenía 10% de acetona, 90% de agua y 300 ppm de tensioactivo no iónico X-77™ Spreader Lo-Foam Formula que contenía alquilarilpolioxi-etileno, ácidos grasos libres, glicoles e isopropanol (Loveland Industries, Inc. Greeley, Colorado, EE.UU.). Los compuestos formulados se aplicaron en 1 mL de líquido a través de una boquilla atomizadora SUJ2 con un cuerpo a medida 1/8 JJ (Spraying Systems Co. Wheaton, Illinois, EE.UU.) colocada a 1,27 cm (0,5 pulgadas) por encima de la parte superior de cada unidad de ensayo. Todos los compuestos experimentales de estos ensayos se pulverizaron a 250 ppm y se replicó tres veces. Después de la pulverización del compuesto de ensayo formulado, cada unidad de ensayo se dejó secar durante 1 hora y después se puso encima una tapa negra reticulada. Las unidades de ensayo se mantuvieron durante 6 días en una cámara de crecimiento a 25°C y 70% de humedad relativa. El nivel de la eficacia de control del compuesto de ensayo se evaluó entonces visualmente en base al daño por alimentación foliar y la mortalidad larval de cada unidad de ensayo.

20 De los compuestos de Fórmula 1 ensayados, los siguientes proporcionaron niveles muy buenos a excelentes de eficacia de control (20% o menos de daño por alimentación u 80% o más mortalidad): 102, 103, 105, 107, 108, 109, 111, 112, 113, 114, 115, 116, 117, 118, 119, 120, 121, 122, 123, 205, 206, 207, 208, 209, 210, 211, 212, 213 y 301.

25 Ensayo B

Para evaluar el control de la oruga soldado (*Spodoptera frugiperda*), la unidad de ensayo consistió en un pequeño envase abierto con una planta de maíz de 4-5 días de edad en su interior. Esta planta se infestó previamente (usando un muestreador de núcleo) con 10-15 larvas de 1 día de edad en un pedazo de material de alimentación de insectos.

30 Se formularon los compuestos de ensayo 1, 2 y 3 y se pulverizaron a 250 ppm como se describe para el Ensayo A. Las aplicaciones se replicaron tres veces. Después de la pulverización, las unidades de ensayo se mantuvieron en una cámara de crecimiento y después se evaluaron visualmente como se describe en el Ensayo A.

35 De los compuestos de Fórmula 1 ensayados, los siguientes proporcionaron niveles excelentes de eficacia de control (20% o menos de daño por alimentación u 80% o más mortalidad): 105, 107, 108, 110, 111, 112, 113, 115, 117, 118, 119, 120, 121, 122, 123, 202, 205, 206, 207, 208, 209, 210, 211, 212 y 213.

Ensayo C

40 Para evaluar el control del áfido verde del melocotonero (*Myzus persicae*) a través de medios de contacto y/o sistémicos, la unidad de ensayo consistió en un pequeño envase abierto con una planta de rábano de 12-15 días de edad en el interior. Ésta se infestó previamente colocando en una hoja de la planta de ensayo 30-40 pulgones en un trozo de hoja extirpada de una planta de cultivo (método del corte de hoja). Las larvas se movieron a la planta de ensayo cuando el trozo de hoja se secó. Después de la infestación previa, se cubrió el suelo de la unidad de ensayo con una capa de arena.

45 Todos los compuestos de ensayo se formularon y se pulverizaron a 250 ppm como se describe para el Ensayo A y se replicaron tres veces. Después de la pulverización del compuesto de ensayo formulado, cada unidad de ensayo se dejó secar durante 1 hora y después se puso encima una tapa negra reticulada. Se mantuvieron las unidades de ensayo durante 6 días en una cámara de crecimiento a 19-21°C y 50-70% de humedad relativa. Se evaluó entonces visualmente la mortalidad de insectos en cada unidad de ensayo.

Ensayo D

50 Para evaluar el control del saltahojas de la patata (*Empoasca fabae* Harris) por medios de contacto y/o sistémicos, la unidad de ensayo consistió en un pequeño envase abierto con una planta de judías Longio de 5-6 días de edad (con las hojas primarias brotadas) en el interior. Se añadió arena blanca en la parte de arriba del suelo y se extirpó una de las hojas primarias antes de la aplicación. Se formularon los compuestos de ensayo y se pulverizaron a 250 ppm, y se replicaron tres veces como se describe para el Ensayo A. Después de la pulverización, se dejaron secar las unidades de ensayo durante 1 hora antes de infestarlas después con 5 saltahojas de la patata (adultos de 18 a 21 días de edad). Se colocó una tapa reticulada negra en la parte superior del cilindro. Se mantuvieron las unidades de

ES 2 398 520 T3

ensayo durante 6 días en una cámara de crecimiento a 19-21°C y 50-70% de humedad relativa. Se evaluó entonces visualmente la mortalidad de insectos en cada unidad de ensayo.

De los compuestos de Fórmula 1 ensayados, los siguientes dieron por resultado en 80% o más de mortalidad: 107, 108, 111, 207 y 212.

5 Ensayo E

Para evaluar el control del áfido del melón algodonero (*Aphis gossypii*) a través de medios de contacto y/o sistémicos, la unidad de ensayo consistió en un pequeño envase abierto con una planta de algodón de 6-7 días en el interior. Ésta se infestó previamente con 30-40 insectos en un trozo de hoja conforme al método del corte de hoja descrito para el Ensayo C, y se cubrió el suelo de la unidad de ensayo con una capa de arena. Se formularon los compuestos de ensayo y se pulverizaron a 250 ppm como se describe para el Ensayo A. Las aplicaciones se replicaron tres veces. Después de la pulverización del compuesto de ensayo formulado, cada unidad de ensayo se dejó secar durante 1 hora y después se puso encima una tapa negra reticulada. Se mantuvieron las unidades de ensayo durante 6 días en una cámara de crecimiento a 19-21°C y 50-70% de humedad relativa. Se evaluó entonces visualmente la mortalidad de insectos en cada unidad de ensayo.

15 Ensayo F

Para evaluar el control de los trípodos occidentales de las flores (*Frankliniella occidentalis*) por medios de contacto y/o sistémicos, la unidad de ensayo consistió en un pequeño envase abierto con una planta de judías Longio de 5-7 días de edad en el interior.

Los compuestos de ensayo se formularon y se pulverizaron a 250 ppm, y se replicaron tres veces tal como se describe para el ensayo A. Después de pulverizar, las unidades de ensayo se dejaron secar durante 1 hora, luego se añadieron 22-27 trípodos adultos a la unidad y luego se colocó una tapa negra reticulada en la parte superior. Se mantuvieron las unidades de ensayo durante 7 días a 25°C y 45-55% de humedad relativa. Se evaluó entonces visualmente la mortalidad de insectos en cada unidad de ensayo.

De los compuestos de Fórmula 1 ensayados, los siguientes dieron por resultado en 80% o más de mortalidad: 205, 209, 212 y 301.

Ensayo G

Para evaluar el control de la mosca blanca de las hojas plateadas (*Bemisia tabaci*), la unidad de ensayo consistió en una planta de algodón de 14-21 días de edad cultivada en medio Redi-earth® (Scotts Co.) con al menos dos hojas verdaderas infestadas con ninfas de 2ª y 3ª fase en la cara de abajo de las hojas.

Los compuestos de ensayo se formularon en no más de 2 ml de acetona y después se diluyeron con agua hasta 25-30 ml. Los compuestos formulados se aplicaron usando una boquilla asistida por aire de chorro plano (Spraying Systems 122440) a 69 kPa (10 psi). Las plantas se pulverizaron para escurrirse en un pulverizador giratorio. Todos los compuestos experimentales de este estudio se pulverizaron a 250 ppm y se replicaron tres veces. Después de la pulverización del compuesto de ensayo, las unidades de ensayo se mantuvieron durante 6 días en una cámara de crecimiento a 50-60% de humedad relativa y 28°C de temperatura diurna y 24°C de temperatura nocturna. Después, las hojas se retiraron y entonces se contaron las ninfas muertas y vivas para calcular el porcentaje de mortalidad.

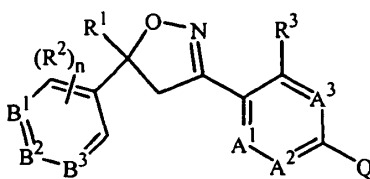
Ensayo H

Para evaluar el control de la pulga del gato (*Ctenocephalides felis* Bouche), se dosificó por vía oral un ratón CD-1® (de aproximadamente 30 g, macho, obtenido de Charles River Laboratories, Wilmington, MA) con un compuesto de ensayo en una cantidad de 10 mg/kg solubilizado en propilenglicol/glicerol formal (60:40). Dos horas después de la administración oral del compuesto de ensayo, se aplicaron aproximadamente 8 a 16 pulgas adultas a cada ratón. Las pulgas se evaluaron luego en cuanto a la mortalidad 48 horas después de la aplicación de pulgas al ratón.

De los compuestos ensayados, los siguientes compuestos provocaron el 20% o más de mortalidad: 205

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de Fórmula 1, un N-óxido, o una sal del mismo,



1

en donde:

- 5 A^1 , A^2 y A^3 se seleccionan independientemente del grupo que consiste en CR^3 y N;
 B^1 , B^2 y B^3 se seleccionan independientemente del grupo que consiste en CR^2 y N;
 R^1 es alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquilocicloalquilo C_4-C_7 o cicloalquilalquilo C_4-C_7 , cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de R^6 ;
- 10 cada R^2 es independientemente H, halógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , alquil C_1-C_6 tio, haloalquil C_1-C_6 tio, alquil C_1-C_6 sulfinilo, haloalquil C_1-C_6 sulfinilo, alquil C_1-C_6 sulfonilo, haloalquil C_1-C_6 sulfonilo, alquil C_1-C_6 amino, dialquil C_2-C_6 amino, alcoxi C_2-C_4 carbonilo, $-CN$ o $-NO_2$;
- 15 cada R^3 es independientemente H, halógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , haloalqueno C_3-C_6 , alquino C_2-C_6 , haloalquino C_3-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , alquil C_1-C_6 tio, haloalquil C_1-C_6 tio, alquil C_1-C_6 sulfinilo, haloalquil C_1-C_6 sulfinilo, alquil C_1-C_6 sulfonilo, haloalquil C_1-C_6 sulfonilo, $-N(R^4)R^5$, $-C(W)N(R^4)R^5$, $-C(W)OR^5$, $-CN$ o $-NO_2$;
- Q es $-S(O)_2N(R^{21})R^{22}$, $-S(O)_pR^{25}$ o $-S(O)(=NR^{28})R^{29}$;
- cada R^4 es independientemente H, alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquilocicloalquilo C_4-C_7 , cicloalquilalquilo C_4-C_7 , alquil C_2-C_7 carbonilo o alcoxi C_2-C_7 carbonilo;
- 20 cada R^5 es independientemente H; o alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquilocicloalquilo C_4-C_7 o cicloalquilalquilo C_4-C_7 , cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes independientemente seleccionados de R^7 ;
- cada R^6 es independientemente halógeno, alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , alquil C_1-C_6 tio, alquil C_1-C_6 sulfinilo, alquil C_1-C_6 sulfonilo, $-CN$ o $-NO_2$;
- 25 cada R^7 es independientemente halógeno, alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , alquil C_1-C_6 tio, alquil C_1-C_6 sulfinilo, alquil C_1-C_6 sulfonilo, $-CN$, $-NO_2$ o Q^1 ;
- cada R^8 es independientemente un anillo fenilo o un anillo piridinilo, cada anillo opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de R^9 ;
- 30 cada R^9 es independientemente halógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , alquil C_1-C_6 tio, haloalquil C_1-C_6 tio, alquil C_1-C_6 sulfinilo, haloalquil C_1-C_6 sulfinilo, alquil C_1-C_6 sulfonilo, haloalquil C_1-C_6 sulfonilo, alquil C_1-C_6 amino, dialquil C_2-C_6 amino, alquil C_2-C_4 carbonilo, alcoxi C_2-C_4 carbonilo, alquil C_2-C_7 aminocarbonilo, dialquil C_3-C_7 aminocarbonilo, $-OH$, $-NH_2$, $-COOH$, $-CN$ o $-NO_2$;
- 35 cada Q^1 es independientemente un anillo fenilo o un anillo heterocíclico, saturado o insaturado, de 5 o 6 miembros, cada anillo sustituido opcionalmente con uno o más sustituyentes independientemente seleccionados de halógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , alquil C_1-C_6 tio, haloalquil C_1-C_6 tio, alquil C_1-C_6 sulfinilo, haloalquil C_1-C_6 sulfinilo, alquil C_1-C_6 sulfonilo, haloalquil C_1-C_6 sulfonilo, alquil C_1-C_6 amino, dialquil C_2-C_6 amino, $-CN$, $-NO_2$, $-C(W)N(R^{10})R^{11}$, $-C(O)OR^{11}$ y R^{12} ;
- 40 cada R^{10} es independientemente H, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquilocicloalquilo C_4-C_7 , cicloalquilalquilo C_4-C_7 , alquil C_2-C_7 carbonilo o alcoxi C_2-C_7 carbonilo;
- cada R^{11} es independientemente H; o alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquilocicloalquilo C_4-C_7 , cicloalquilalquilo C_4-C_7 o R^{12} ;
- cada R^{12} es independientemente un anillo fenilo o un anillo piridinilo, cada anillo opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes independientemente seleccionados de R^{13} ;

cada R¹³ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆ tio, haloalquil C₁-C₆ tio, alquil C₁-C₆ sulfinilo, haloalquil C₁-C₆ sulfinilo, alquil C₁-C₆ sulfonilo, haloalquil C₁-C₆ sulfonilo, alquil C₁-C₆ amino, dialquil C₂-C₆ amino, alquil C₂-C₄ carbonilo, alcoxi C₂-C₄ carbonilo, alquil C₂-C₇ aminocarbonilo, dialquil C₃-C₇ aminocarbonilo, -OH, -NH₂, -COOH, -CN o -NO₂;

- 5 R²¹ es H, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alqueno C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquilcicloalquilo C₄-C₇, cicloalquilalquilo C₄-C₇, alquil C₂-C₇ carbonilo o alcoxi C₂-C₇ carbonilo;

R²² es H; o alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alqueno C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquilcicloalquilo C₄-C₇ o cicloalquilalquilo C₄-C₇, cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes independientemente seleccionados de R²³;

- 10 cada R²³ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆ tio, alquil C₁-C₆ sulfinilo, alquil C₁-C₆ sulfonilo, -CN o -NO₂; o un anillo fenilo o un anillo piridinilo, cada anillo opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes independientemente seleccionados de R²⁴;

cada R²⁴ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆ tio, haloalquil C₁-C₆ tio, alquil C₁-C₆ sulfinilo, haloalquil C₁-C₆ sulfinilo, alquil C₁-C₆ sulfonilo, haloalquil C₁-C₆ sulfonilo, alquil C₁-C₆ amino, dialquil C₂-C₆ amino, alquil C₂-C₄ carbonilo, alcoxi C₂-C₄ carbonilo, alquil C₂-C₇ aminocarbonilo; dialquil C₃-C₇ aminocarbonilo, -OH, -NH₂, -COOH, -CN o -NO₂;

- 15 R²⁵ es alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alqueno C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquilcicloalquilo C₄-C₇ o cicloalquilalquilo C₄-C₇, cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de R²⁶;

- 20 cada R²⁶ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆ tio, alquil C₁-C₆ sulfinilo, alquil C₁-C₆ sulfonilo, alquil C₂-C₇ carbonilo, alcoxi C₂-C₇ carbonilo, -CN o -NO₂; o un anillo fenilo o un anillo piridinilo, cada anillo opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes independientemente seleccionados de R²⁷;

- 25 cada R²⁷ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆ tio, haloalquil C₁-C₆ tio, alquil C₁-C₆ sulfinilo, haloalquil C₁-C₆ sulfinilo, alquil C₁-C₆ sulfonilo, haloalquil C₁-C₆ sulfonilo, alquil C₁-C₆ amino, dialquil C₂-C₆ amino, alquil C₂-C₄ carbonilo, alcoxi C₂-C₄ carbonilo, alquil C₂-C₇ aminocarbonilo, dialquil C₃-C₇ aminocarbonilo, -OH, -NH₂, -COOH, -CN o -NO₂;

R²⁸ es H, halógeno, -CN, -NO₂, alquil C₂-C₇ carbonilo, haloalquil C₂-C₇ carbonilo, alcoxi C₂-C₇ carbonilo, alquil C₂-C₇ aminocarbonilo, dialquil C₃-C₇ aminocarbonilo, alquil C₁-C₆ sulfonilo o haloalquil C₁-C₆ sulfonilo; o

- 30 R²⁸ es alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, (alcoxi C₁-C₆)-(alquil C₁-C₆) o alquil C₁-C₆ tio, cada uno sustituido opcionalmente con halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₁-C₆, halocicloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, -CN o -NO₂;

R²⁹ es alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alqueno C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquilcicloalquilo C₄-C₇ o cicloalquilalquilo C₄-C₇, cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de R²⁶;

cada W es independientemente O o S;

p es 0, 1 o 2; y

- 35 n es 1 o 2.

2. Un compuesto de la reivindicación 1 en donde

A¹ y A² son CR³;

A³ es CR³ o N;

B¹, B² y B³ son CR²;

- 40 R¹ es alquilo C₁-C₃ opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de R⁶;

cada R² es independientemente H, halógeno, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆ o -CN;

cada R³ es independientemente H, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₃-C₆, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₃-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, -N(R⁴)R⁵, -C(W)N(R⁴)R⁵, -CN o -NO₂;

- 45 cada R⁴ es independientemente H, alquilo C₁-C₄, alquil C₂-C₄ carbonilo o alcoxi C₂-C₄ carbonilo;

cada R⁵ es independientemente H; o alquilo C₁-C₄, alqueno C₃-C₄, alqueno C₃-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, alquilcicloalquilo C₄-C₇ o cicloalquilalquilo C₄-C₇, cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de R⁷;

cada R⁷ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄ tio, alquil C₁-C₄ sulfinilo, alquil C₁-C₄ sulfonilo, -CN, -NO₂ o Q¹;

5 Q¹ es un anillo fenilo, un anillo piridinilo, un anillo tiazolilo, un anillo pirazolilo, un anillo triazolilo o un anillo imidazolilo, cada anillo opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes independientemente seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, -CN, -C(W)N(R¹⁰)R¹¹, C(O)OR¹¹ y R¹²;

cada R¹⁰ es independientemente H, alquilo C₁-C₄, alquil C₂-C₄ carbonilo o alcoxi C₂-C₄ carbonilo; y

cada R¹¹ es independientemente H; o alquilo C₁-C₄, alqueno C₃-C₄, alquino C₃-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, alquilocicloalquilo C₄-C₇ o cicloalquilalquilo C₄-C₇ o R¹².

3. Un compuesto de la reivindicación 2 en donde

10 R²¹ es H o alquilo C₁-C₆;

R²² es alquilo C₁-C₄ opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de R²³;

cada R²³ es independientemente halógeno, alquil C₁-C₄ tio, -CN, un anillo fenilo o un anillo piridinilo;

15 R²⁵ es alquilo C₁-C₄, alqueno C₃-C₄, alquino C₃-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, alquilocicloalquilo C₄-C₇ o cicloalquilalquilo C₄-C₇, cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de R²⁶; y

cada R²⁶ es independientemente halógeno, alcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄ tio, alquil C₁-C₄ sulfinilo, alquil C₁-C₄ sulfonilo, -CN o -NO₂;

R²⁸ es H, halógeno, alquilo C₁-C₄, -CN, -NO₂, haloalquil C₂-C₇ carbonilo o alcoxi C₂-C₇ carbonilo; y

20 R²⁹ es alquilo C₁-C₄, alqueno C₃-C₄, alquino C₃-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, alquilocicloalquilo C₄-C₇ o cicloalquilalquilo C₄-C₇, cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de R²⁶.

4. Un compuesto de la reivindicación 3 en donde

R¹ es alquilo C₁-C₃ opcionalmente sustituido con halógeno;

cada R² es independientemente H, CF₃, OCF₃, halógeno o -CN;

25 cada R³ es independientemente H, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, haloalqueno C₃-C₄, alquino C₂-C₄, haloalquino C₃-C₄, ciclopropilo, alcoxi C₁-C₄, -C(W)N(R⁴)R⁵, -CN o -NO₂;

cada R⁴ es H;

Q es -S(O)₂N(R²¹)R²²;

R²¹ es H o metilo; y

W es O.

30 5. Un compuesto de la reivindicación 3 en donde

R¹ es alquilo C₁-C₃ opcionalmente sustituido con halógeno;

cada R² es independientemente H, CF₃, OCF₃, halógeno o -CN;

cada R³ es independientemente H, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, haloalqueno C₃-C₄, alquino C₂-C₄, haloalquino C₃-C₄, ciclopropilo, alcoxi C₁-C₄, -C(W)N(R⁴)R⁵, -CN o -NO₂;

35 cada R⁴ es H;

Q es -S(O)_pR²⁵;

R²⁵ es alquilo C₁-C₄ opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de R²⁶;

cada R²⁶ es independientemente halógeno o -CN;

40 W es O; y

p es 1 o 2.

6. Un compuesto de la reivindicación 3 en donde

R¹ es alquilo C₁-C₃ opcionalmente sustituido con halógeno;

cada R² es independientemente H, CF₃, OCF₃, halógeno o -CN;

5 cada R³ es independientemente H, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, haloalqueno C₃-C₄, alquino C₂-C₄, haloalquino C₃-C₄, ciclopropilo, alcoxi C₁-C₄, -C(W)N(R⁴)R⁵, -CN o -NO₂;

cada R⁴ es H;

Q es -S(O)(-NR²⁸)R²⁹;

R²⁸ es H, alquilo C₁-C₄, -CN o -NO₂;

10 R²⁹ es alquilo C₁-C₄ opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados independientemente de R²⁶;

cada R²⁶ es independientemente halógeno o -CN; y

W es O.

7. Un compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 4, 5 o 6 en donde

A³ es CR³;

15 B² es CH;

R¹ es CF₃;

cada R² es independientemente H o halógeno; y

cada R³ es independientemente H, halógeno, alquilo C₁-C₂, -C≡CH, -CN o -NO₂.

8. Un compuesto de la reivindicación 1 que está seleccionado del grupo que consiste en:

20 N-(ciclopropilmetil)-4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-2-metilbencenosulfonamida;

4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-2-metil-N-(2-piridinilmetil)bencenosulfonamida;

5-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-3-[4-(metilsulfonyl)fenil]-5-(trifluorometil)isoxazol];

5-[(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-2-(metilsulfonyl)benzotrilo; y

3-[3-bromo-4-(metiltio)fenil]-5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)isoxazol.

25 9. Una composición que comprende un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en un tensioactivo, un diluyente sólido y un diluyente líquido, comprendiendo adicionalmente dicha composición opcionalmente al menos un compuesto o agente adicional biológicamente activo.

30 10. Una composición para controlar una plaga de invertebrados que comprende una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en un tensioactivo, un diluyente sólido y un diluyente líquido, comprendiendo además opcionalmente dicha composición una cantidad biológicamente eficaz de al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional en donde al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional se selecciona de insecticidas del grupo que consiste en lactonas macrocíclicas, neonicotinoides, ligandos del receptor de octopamina, ligandos del receptor de rianodina, agonistas de ecdisona, moduladores del canal de sodio, inhibidores de la síntesis de quitina, análogos de nereisotoxina, inhibidores del transporte de electrones mitocondriales, inhibidores de colinesterasa, insecticidas de ciclodieno, inhibidores de la muda, bloqueantes del canal de cloruro regulado por GABA, mímicos de la hormona juvenil, inhibidores de la biosíntesis de lípidos y agentes biológicos que incluyen nucleopolihedrovirus, un miembro de *Bacillus thuringiensis*, una delta-endotoxina encapsulada de *Bacillus thuringiensis*; y un insecticida viral que se da de forma natural o genéticamente modificado; preferiblemente en donde al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional se selecciona del grupo que consiste en abamectina, acefato, acetamiprid, acetoprol, aldicarb, amidoflumet, amitraz, avermectina, azadiractina, azinfos-metilo, bifentrina, bifenazato, bistriflurona, buprofezina, carbofurano, cartap, quinometionato, clorfenapir, clorfluazurona, clorantraniliprol, clorpirifos, clorpirifos-metilo, clorobencilato, cromafenoazida, clotianidina, ciflumetofeno, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, gamma-cihalotrina, lambda-cihalotrina, cihexatina, cipermetrina, ciromazina, deltametrina, diafentiurona, diazinona, dicofol, dieldrina, dienoclor, diflubenzurona, dimeflutrina, dimetoato, dinotefurano, diofenolano, emamectina, endosulfano, esfenvalerato, etiprol, etoxazol, fenamifos,

fenazaquina, óxido de fenbutatina, fenotiocarb, fenoxicarb, fenpropatrina, fenpiroximato, fenvalerato, fipronilo, flonicamid, flubendiamida, flucitrinato, tau-fluvalinato, flufenerim, flufenoxurona, fonofos, halofenozida, hexaflumurona, hexitiazox, hidrametilnona, imiciafos, imidacloprid, indoxacarb, isofenfos, lufenurona, malationa, metaflumizona, metaldehído, metamidofos, metidationa, metomilo, metopreno, metoxiclor, metoxifenzida, metoflutrina, monocrotofos, nitenpiram, nitiazina, novalurona, noviflumurona, oxamilo, parationa, parationa-metilo, 5 permetrina, forato, fosadona, fosmet, fosfamidona, pirimicarb, profenofos, proflutrina, propargita, protrifenbute, pimetrozina, pirafluprol, piretrina, piridabeno, piridalilo, pirifluquinazona, piriprol, piriproxifeno, rotenona, rianodina, espinetoram, espinosad, espiroclorfen, espiromesifeno, espirotetramato, sulprofos, tebufenozida, tebufenpirad, teflubenzurona, teflutrina, terbufos, tetraclorvinfos, tiacloprid, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap-sodio, tolfenpirad, 10 tralometrino, triazamato, triclorfona, triflumurona, *Bacillus thuringiensis* subesp. *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subesp. *kurstaki*, nucleopolihedrovirus, una delta-endotoxina encapsulada de *Bacillus thuringiensis*, baculovirus, bacterias entomopatógenas, virus entomopatógenos y hongos entomopatógenos; más preferible en donde al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional se selecciona del grupo que consiste en abamectina, acetamiprid, amitraz, avermectina, azadiractina, bifentrina, buprofezina, cartap, clorantraniliprol, clorfenapir, 15 clorpirifos, clotianidina, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrino, lambda-cihalotrino, cipermetrina, ciromazina, deltametrino, dieldrina, dinotefurano, diofenolano, emamectina, endosulfano, esfenvalerato, etiprol, fenotiocarb, fenoxicarb, fenvalerato, fipronilo, flonicamid, flubendiamida, flufenoxurona, hexaflumurona, hidrametilnona, imidacloprid, indoxacarb, lufenurona, metaflumizona, metomilo, metopreno, metoxifenzida, nitenpiram, nitiazina, novalurona, oxamilo, pimetrozina, piretrina, piridabeno, piridalilo, piriproxifeno, rianodina, espinetoram, espinosad, 20 espiroclorfen, espiromesifeno, tebufenozida, tiacloprid, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap-sodio, tralometrino, triazamato, triflumurona, *Bacillus thuringiensis* subesp. *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subesp. *kurstaki*, nucleopolihedrovirus y una delta-endotoxina encapsulada de *Bacillus thuringiensis*.

11. La composición de la reivindicación 10 en la forma de una formulación líquida para empapamiento del suelo.
- 25 12 Una composición de pulverización para controlar una plaga de invertebrados que comprende:
- (a) una cantidad biológicamente eficaz del compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 o la composición de la reivindicación 10; y
- (b) un propulsor.
13. Una composición cebo para controlar una plaga de invertebrados que comprende:
- 30 (a) una cantidad biológicamente eficaz del compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 o la composición de la reivindicación 10;
- (b) uno o más materiales alimenticios;
- (c) opcionalmente un atrayente; y'
- (d) opcionalmente un humectante.
- 35 14. Un método para controlar una plaga de invertebrados que comprende poner en contacto la plaga de invertebrados o su ambiente con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 o una composición de la reivindicación 10.
- 15 Una composición para proteger a un animal de una plaga parasitaria de invertebrados que comprende una cantidad parasiticidamente eficaz de un compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1-8 y al menos un vehículo.