

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 399 572**

51 Int. Cl.:

C07D 261/04 (2006.01)

A01N 43/80 (2006.01)

A61K 31/42 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **30.09.2008** **E 08835800 (7)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **19.12.2012** **EP 2193124**

54 Título: **Compuestos de naftaleno isoxazolina para el control de plagas de invertebrados**

30 Prioridad:

03.10.2007 US 997504 P

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:
02.04.2013

73 Titular/es:

E. I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY
(100.0%)
1007 MARKET STREET
WILMINGTON, DE 19898, US

72 Inventor/es:

LONG, JEFFREY, KEITH;
SELBY, THOMAS, PAUL y
XU, MING

74 Agente/Representante:

DE ELZABURU MÁRQUEZ, Alberto

ES 2 399 572 T3

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

DESCRIPCIÓN

Compuestos de naftaleno isoxazolina para el control de plagas de invertebrados

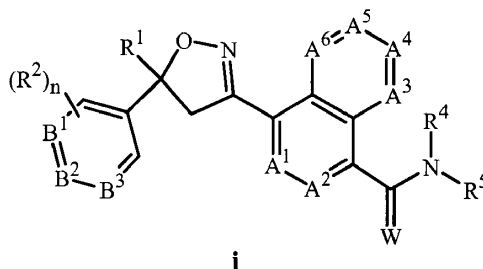
Campo de la invención

Esta invención se refiere a ciertas naftaleno isoxazolininas, sus N-óxidos, sales y composiciones adecuadas para usos agronómicos y no agronómicos, y métodos para su uso en el control de plagas de invertebrados tales como artrópodos en entornos tanto agronómicos como no agronómicos.

Antecedentes 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, pueden ocasionar un aumento de costes para el consumidor. También es importante el control de las plagas de invertebrados en silvicultura, cultivos de invernaderos, plantas ornamentales, cultivos de viveros, productos de fibra y alimentarios almacenados, ganadería, artículos domésticos, césped, productos de la madera, y la salud pública y de los animales. Muchos productos están comercialmente disponibles 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 07/079162 describe derivados de isoxazolina de Fórmula i como insecticidas

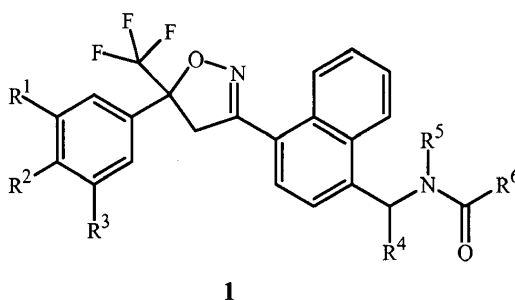


en donde, *entre otros*, A¹ hacia A⁶ son independientemente C o N; W es O o S; R⁴ es H o alquilo C₁-C₆; y R⁵ es H, OR¹⁰, NR¹¹R¹² o Q¹.

Las naftaleno isoxazolininas de la presente invención no se describen en esta publicación.

Compendio de la invención

Esta invención se dirige a compuestos de Fórmula 1 (incluyendo todos los isómeros geométricos y estereoisómeros), N-óxidos y sales de los mismos, y composiciones que los contienen y su uso para el control de plagas de invertebrados:



en donde

R¹ es halógeno, haloalquilo C₁-C₃ o haloalcoxi C₁-C₃;

R² es H, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₃ o haloalquilo C₁-C₃;

R³ es H, halógeno, haloalquilo C₁-C₃ o haloalcoxi C₁-C₃;

R⁴ es H, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₃ o haloalquilo C₁-C₃;

R⁵ es H, CH₃, alquil C₂-C₇ carbonilo, haloalquil C₂-C₄ carbonilo, alcoxi C₂-C₇ carbonilo o CH₂O(alquilo C₁-C₃);

	R ⁶	es grupo alquilo C ₁ -C ₆ sustituido opcionalmente con halógeno, OR ¹¹ , S(O) _n R ¹² o NR ¹³ C(O)R ¹⁴ ; o
	R ⁶	es cicloalquilo C ₃ -C ₆ o cicloalquil C ₄ -C ₇ alquilo, cada uno opcionalmente sustituido con 1 a 4 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, alquilo C ₁ -C ₂ , haloalquilo C ₁ -C ₂ y hasta 1 ciclopropilo; o
5	R ⁶	es (CH ₂) _m Q; o
	R ⁶	es OR ⁸ o NR ^{9a} R ^{9b} ;
	Q	es un anillo saturado de 4 a 6 miembros que contiene átomos de carbono y un O o S(O) _n como miembros del anillo y opcionalmente sustituidos con 1 o 2 R ¹⁰ ;
	R ⁸	es alquilo C ₁ -C ₄ o haloalquilo C ₁ -C ₄ ;
10	R ^{9a}	es alquilo C ₁ -C ₄ , haloalquilo C ₁ -C ₄ o cicloalquilo C ₃ -C ₆ ;
	R ^{9b}	es H, alquilo C ₁ -C ₄ , haloalquilo C ₁ -C ₄ o cicloalquilo C ₃ -C ₆ ;
	cada R ¹⁰	es independientemente halógeno, ciano o alquilo C ₁ -C ₂ ;
	R ¹¹	es H, alquilo C ₁ -C ₄ o haloalquilo C ₁ -C ₄ ;
	R ¹²	es alquilo C ₁ -C ₄ o haloalquilo C ₁ -C ₄ ;
15	R ¹³	es H o alquilo C ₁ -C ₄ ;
	R ¹⁴	es alquilo C ₁ -C ₄ , haloalquilo C ₁ -C ₄ o cicloalquilo C ₃ -C ₆ ;
	m	es 0 o 1; y
	cada n	es independientemente 0, 1 o 2.

20 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 tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos. 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 consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos, comprendiendo dicha composición opcionalmente además una cantidad biológicamente eficaz de al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional.

25 Esta invención describe además una composición en pulverizador 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, o la composición descrita con anterioridad y 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 las composiciones descritas en las realizaciones anteriores, uno o más materiales alimenticios, opcionalmente un atrayente, y opcionalmente un humectante.

30 Esta invención describe 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 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 además para que esté situada dentro o cerca de un lugar de actividad potencial o conocida para la plaga de invertebrados.

35 Esta invención proporciona 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 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 tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos, comprendiendo además dicha composición opcionalmente una cantidad biológicamente eficaz de al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional.

40 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 *N*-óxido o una sal del mismo (por ejemplo, como una composición descrita en este documento). Esta invención se refiere además a la semilla tratada. Esta invención proporciona además un método 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 (por ejemplo, como una composición descrita en este documento).

Detalles de la invención

Como se usa en este documento, los términos "comprende", "que comprende", "incluye", "que incluye", "tiene", "que tiene", "contiene" o "que contiene", o cualquier otra variación de los mismos, se pretende que cubran 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" 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 ambos A y 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 ejemplos (es decir, sucesos) del elemento o componente. Por lo tanto, "un" o "uno(a)" deberían leerse para incluir 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 singular.

Cuando 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 sinfílicos. El término "gasterópodo" incluye caracoles, babosas y otros estilomatóforos. El término "nematodo" incluye todos los helmintos, tales como: gusanos redondos, gusanos del corazón y nematodos fitófagos (Nematoda), duelas (Tematoda), acantocéfalos y tenias (Cestoda).

En el contexto de esta descripción, "control de plaga de invertebrados" significa 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.

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, frutas de árbol (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 otras aplicaciones que cultivos del campo, tal como cultivos hortícolas (por ejemplo, plantas de invernadero, viveros u ornamentales no cultivados en el campo), estructuras residenciales, agrícolas, comerciales e industriales, césped (por ejemplo, granja de césped, pasto, campo de golf, césped, campo deportivo, etc.), productos de la madera, productos almacenados, gestión agro-forestal y de la vegetación, salud pública (por ejemplo, humanos) y salud animal (por ejemplo, animales domésticos tal como mascotas, ganado y volatería, animales no domesticados tales como animales salvajes).

En los recitados 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.

"Alcoxi" incluye, por ejemplo, metoxi, etoxi, n-propiloxi, isopropiloxi y los diferentes isómeros butoxi, pentoxi y hexiloxi.

"Cicloalquilo" incluye, por ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo. El término "cicloalquilalquilo" denota la sustitución de cicloalquilo en un resto de alquilo. Ejemplos de "cicloalquilalquilo" incluyen ciclopropilmetilo, ciclopentiletilo y otros restos cicloalquilo unidos a grupos alquilo de cadena lineal o ramificada.

El término "halógeno", ya sea solo o en palabras compuestas tal como "haloalquilo", o cuando se usa en descripciones tales como "alquilo sustituido con halógeno" incluye flúor, cloro, bromo o yodo. Además, cuando se usa en palabras compuestas tal como "haloalquilo", o cuando se usa en descripciones tales como "alquilo sustituido con halógeno", dicho alquilo puede estar parcial o totalmente sustituido con átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes. Los ejemplos de "haloalquilo" o "alquilo sustituido con halógeno" incluyen F_3C- , $ClCH_2-$, CF_3CH_2- y CF_3CCl_2- . El término "haloalcoxi" se define de forma análoga al término "haloalquilo". Los ejemplos de "haloalcoxi" incluyen CF_3O- , CCl_3CH_2O- , $HCF_2CH_2CH_2O-$ y CF_3CH_2O- .

"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 "alcoxycarbonilo" incluyen $CH_3OC(=O)-$, $CH_3CH_2OC(=O)-$, $CH_3CH_2CH_2OC(=O)-$, $(CH_3)_2CHOC(=O)-$ y los diferentes isómeros de butoxi o pentoxycarbonilo.

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 C_1-C_4 sulfonilo indica de metilsulfonilo a butilsulfonilo; alcoxi alquilo C_2 indica

CH₃OCH₂-; alcoxialquilo C₃ indica, por ejemplo, CH₃CH(OCH₃)-, CH₃OCH₂CH₂- o CH₃CH₂OCH₂-; y alcoxialquilo 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 CH₃CH₂CH₂OCH₂- y CH₃CH₂OCH₂CH₂-.

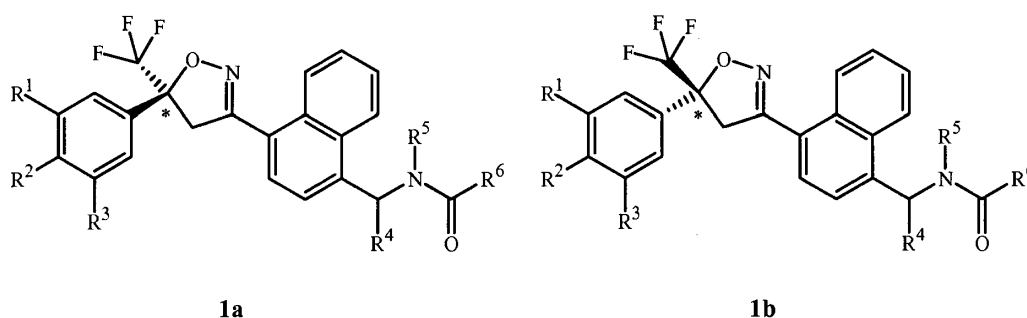
Cuando un grupo contiene un sustituyente que puede ser hidrógeno, por ejemplo R² o R⁶, entonces cuando este sustituyente se toma como hidrógeno, se reconoce que esto es equivalente a que dicho grupo no está sustituido.

Cuando un radical (por ejemplo, alquilo en la definición de R⁶) es "opcionalmente sustituido" con sustituyentes enumerados sin el número de sustituyentes en el radical afirmado, entonces el radical puede estar no sustituido o el radical puede estar sustituido con un número de sustituyentes que oscila de 1 hasta el número de las posiciones disponibles en el radical, y los sustituyentes unidos se seleccionan independientemente de los sustituyentes enumerados.

Cuando un radical (por ejemplo, cicloalquilo en la definición de R⁶) está opcionalmente sustituido con sustituyentes enumerados con el número de sustituyentes afirmado (por ejemplo, "1 a 4"), entonces el radical puede estar no sustituido o sustituido con un número de sustituyentes que oscila hasta el mayor número afirmado (por ejemplo, "4"), y los sustituyentes unidos se seleccionan independientemente de los sustituyentes enumerados. Cuando la lista de sustituyentes incluye un límite inferior para un sustituyente particular (por ejemplo, "hasta 1 ciclopropilo), esto restringe por consiguiente el número de ejemplos de ese sustituyente particular entre los sustituyentes unidos al radical. Así, con respecto a R⁶, mientras hasta cuatro sustituyentes pueden unirse al radical cicloalquilo, solo uno de los sustituyentes puede ser ciclopropilo.

Se conoce una amplia variedad de métodos sintéticos en la técnica para permitir la preparación de anillos y sistemas anulares 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 y atropisómeros. 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 u otros estereoisómeros o cuando se separa del otro u otros estereoisómeros. Además, el experto sabe cómo 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. Por ejemplo, dos posibles enantiómeros de Fórmula 1 se representan como Fórmula 1a y Fórmula 1b que implican el centro quiral de isoxazolina identificado con un asterisco (*). De forma análoga, otros centros quirales son posibles en, por ejemplo, R¹ y R⁶.



Las representaciones moleculares dibujadas en este documento siguen las convenciones estándar para representar la estereoquímica. Para indicar la estereoconfiguración, los enlaces que sobresalen del plano del dibujo y hacia el observador se denotan por cuñas sólidas en donde el extremo ancho de la cuña se une al átomo que sobresale del plano del dibujo hacia el observador. Los enlaces que van por debajo del plano del dibujo y se alejan del observador se denotan por cuñas punteadas en donde el extremo estrecho de la cuña se une al átomo que se aleja del observador. Las líneas de anchura constante indican enlaces con una dirección contraria o neutra respecto a los enlaces mostrados con cuñas sólidas o punteadas; las líneas de anchura constante representan además enlaces en moléculas o partes de moléculas en que no se pretende que se especifique ninguna estereoconfiguración particular.

Se cree que el enantiómero biológicamente más activo es la Fórmula 1a. La Fórmula 1a tiene la configuración (S) en el carbono quiral, y la Fórmula 1b tiene la configuración (R) en el carbono quiral.

Esta invención comprende mezclas racémicas, por ejemplo, cantidades iguales de los enantiómeros de las Fórmulas 1a y 1b. Además, esta invención incluye compuestos que están enriquecidos en comparación a la mezcla racémica en un enantiómero de Fórmula 1. También están incluidos los enantiómeros esencialmente puros de los compuestos de Fórmula 1, por ejemplo, Fórmula 1a y Fórmula 1b.

Cuando está enantioméricamente enriquecido, un enantiómero está presente en mayores cantidades que el otro, y la extensión de enriquecimiento puede definirse por una expresión de exceso enantiomérico ("ee"), que se define como $(2x-1) \cdot 100\%$, donde x es la fracción molar del enantiómero dominante en la mezcla (por ejemplo, un ee de 20% corresponde a una relación de enantiómeros de 60:40).

- 5 Preferiblemente las composiciones de esta invención tienen al menos un 50% de exceso enantiomérico; más preferiblemente al menos un 75% de exceso enantiomérico; aún más preferiblemente al menos un 90% de exceso enantiomérico; y lo más preferiblemente al menos un 94% de exceso enantiomérico del isómero más activo. De particular atención son las realizaciones enantioméricamente puras del isómero más activo.

- 10 Los compuestos de Fórmula 1 pueden comprender centros quirales adicionales. Por ejemplo, los sustituyentes y otros constituyentes moleculares tal como R^4 y R^5 pueden contener en sí mismos centros quirales. Esta invención comprende mezclas racémicas además de estereconfiguraciones enriquecidas y esencialmente puras a esos centros quirales adicionales.

- 15 Los compuestos de esta invención pueden existir como uno o más isómeros conformacionales debido a la rotación restringida sobre el enlace amida en la Fórmula 1. Esta invención comprende mezclas de isómeros conformacionales. Además, esta invención incluye compuestos que están enriquecidos en un conformero respecto a los otros.

- 20 Un experto en la técnica apreciará que no todos los heterociclos que contienen nitrógeno pueden formar *N*-óxidos ya que el nitrógeno necesita un par de electrones disponible para la oxidación al óxido; un experto en la técnica reconocerá aquellos heterociclos que contienen nitrógeno que pueden formar *N*-óxidos. Un experto en la técnica también reconocerá que las aminas terciarias pueden formar *N*-óxidos. Los métodos sintéticos para la preparación de *N*-óxidos de heterociclos y aminas terciarias se conocen muy bien por un experto en la técnica, incluyendo la oxidación de heterociclos y aminas terciarias con peroxiacidos tales como ácido peracético y *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 de forma extensa en la bibliografía, véase, por ejemplo: T. L. Gilchrist en *Comprehensive Organic Synthesis*, vol. 7, pp. 748-750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press; M. Tisler y 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, páginas. 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.

- 35 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. Por consiguiente, la presente invención comprende compuestos seleccionados de Fórmula 1, *N*-óxidos y sales de los mismos adecuadas desde el punto de vista agrícola.

Realizaciones de la presente invención como se describen en el Compendio de la Invención incluyen (donde la Fórmula 1 como se usa en las siguientes Realizaciones incluyen *N*-óxidos y sales de los mismos):

- Realización 1. Un compuesto de Fórmula 1, en donde R^1 es halógeno.
- Realización 2. Un compuesto de Fórmula 1 en donde R^1 es haloalquilo C_1-C_3 .
- 45 Realización 3. Un compuesto de Fórmula 1 en donde R^1 es Cl, Br o CF_3 .
- Realización 4. Un compuesto de Fórmula 1 en donde R^2 es H, Cl o F.
- Realización 4a. Un compuesto de Fórmula 1 en donde R^2 es H.
- Realización 5. Un compuesto de Fórmula 1 en donde R^2 es Cl o F.
- Realización 6. Un compuesto de Fórmula 1 en donde R^3 es Cl, Br o CF_3 .
- 50 Realización 7. Un compuesto de Fórmula 1 en donde R^4 es H, ciano o CH_3 .
- Realización 7a. Un compuesto de Fórmula 1 en donde R^4 es H o ciano.
- Realización 7b. Un compuesto de Fórmula 1 en donde R^4 es H.

Realización 7c. Un compuesto de Fórmula 1 en donde R^4 es ciano.

Realización 7d. Un compuesto de Fórmula 1 en donde R^4 es CH_3 .

Realización 8. Un compuesto de Fórmula 1 en donde R^5 es H.

Realización 9. Un compuesto de Fórmula 1 en donde R^6 es ciclopropilo o isopropilo.

5 Realización 9a. Un compuesto de Fórmula 1, en donde R^6 es ciclopropilo.

Realización 10. Un compuesto de Fórmula 1, en donde R^6 es isopropilo.

Realización 11. Un compuesto de Fórmula 1 en donde R^6 es $CH_2CH_2SCH_3$.

Realización 12. Un compuesto de Fórmula 1 en donde R^6 es CF_2CF_3 .

Realización 13. Un compuesto de Fórmula 1 en donde R^6 es $CH_2NHC(O)CF_3$.

10 Las realizaciones de esta invención, incluyendo las Realizaciones 1-13 anteriores, además de cualquier otra realización descrita en este documento, se puede 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 útiles para preparar los compuestos de Fórmula 1. Además, las realizaciones de esta invención, incluyendo las Realizaciones 1-13 anteriores además de cualquier realización distinta 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 1-13 se ilustran por:

Realización A. Un compuesto de Fórmula 1, en donde

R^1 es Cl, Br o CF_3 ;

20 R^2 es H, Cl o F; y

R^3 es Cl, Br o CF_3 .

Realización B. Un compuesto de Fórmula 1, en donde

R^4 es H, ciano o CH_3 ; y

R^5 es H.

25 Realización C. Un compuesto de la Realización A, en donde

R^4 es H o ciano;

R^5 es H; y

R^6 es ciclopropilo o isopropilo.

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

35 De particular importancia son las realizaciones de la invención, por razones del espectro del control de plagas de invertebrados e importancia económica, protección de cultivos agronómicos del daño o lesión provocado por las plagas de invertebrados mediante el control de las plagas de invertebrados. 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 las plantas que no están directamente en contacto con un compuesto de Fórmula 1 o una composición que comprende el compuesto.

40 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 dichas composiciones opcionalmente también al menos un compuesto o agente adicional biológicamente activo.

45 También son dignas de mención como realizaciones de la presente invención las composiciones para controlar una plaga de invertebrados que comprende 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 también dichas composiciones opcionalmente 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 Realizaciones precedentes (por ejemplo, como una composición descrita en este documento).

La invención también proporciona una composición que comprende un compuesto de cualquiera de las Realizaciones precedentes, 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 precedentes.

La invención proporciona además una composición de pulverización para controlar una plaga de invertebrados que comprende una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de cualquiera de las Realizaciones precedentes y un propulsor. La invención proporciona además una composición cebo para controlar una plaga de invertebrados que comprende una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de cualquiera de las Realizaciones precedentes, uno o más materiales comestibles, opcionalmente un atrayente y opcionalmente un humectante. La invención describe además 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 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 además para que esté situada dentro o cerca del lugar de una potencial o conocida actividad para la plaga de invertebrados.

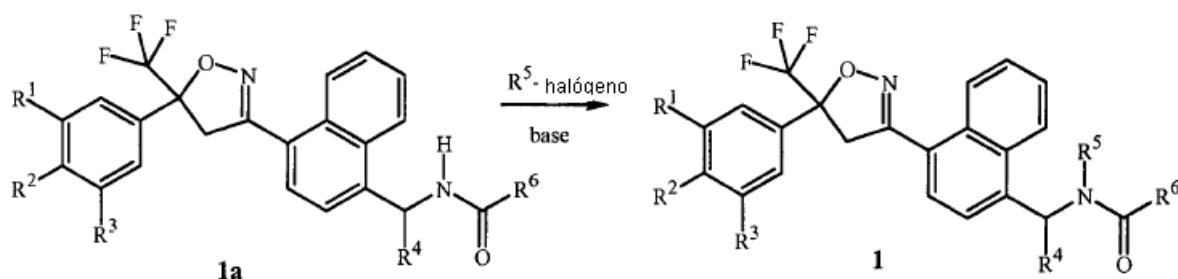
Las realizaciones de la invención incluyen también métodos para proteger una semilla de una plaga de invertebrados que comprende poner en contacto la semilla con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto cualquiera de las Realizaciones precedentes.

La invención describe además una cantidad parasitariamente eficaz de un compuesto de cualquiera de las realizaciones precedentes para usar en la protección de un animal de una plaga parasitaria de invertebrados.

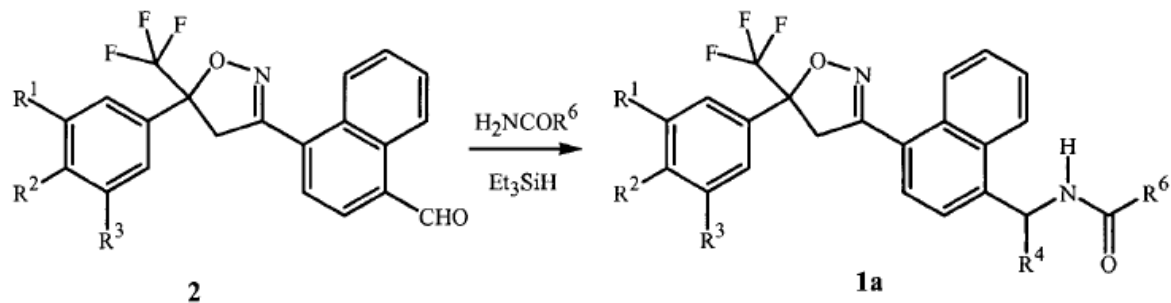
Uno o más de los siguientes métodos y variaciones tal como se describen en los Esquemas 1-7 pueden usarse para preparar los compuestos de Fórmula 1. Las definiciones de R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 y R^6 en los compuestos de las Fórmulas 1-11 posteriores son como se definen anteriormente en el Compendio de la Invención, a menos que se indique de otro modo. La Fórmula 1a es un subconjunto de la Fórmula 1.

Los compuestos de Fórmula 1 pueden prepararse por métodos conocidos en la técnica como se muestra en el Esquema 1. Por ejemplo, los compuestos de la Fórmula 1a pueden hacerse reaccionar con R^5 -halógeno en presencia de una base para proporcionar compuestos de Fórmula 1 en donde R^5 es distinto de H.

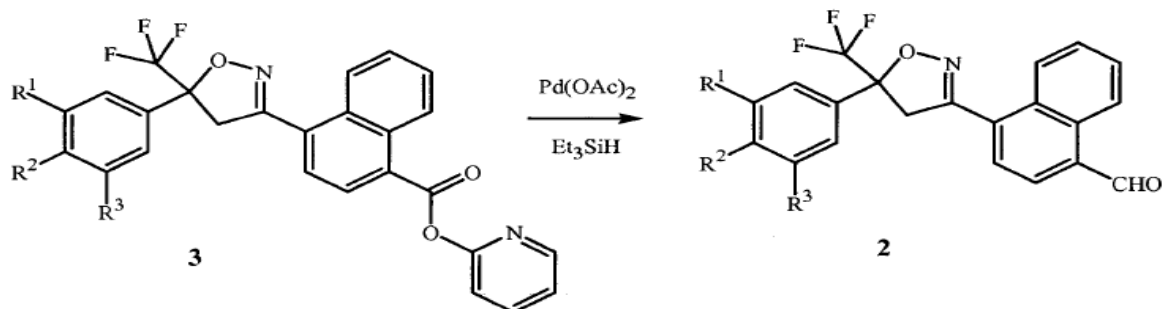
Esquema 1



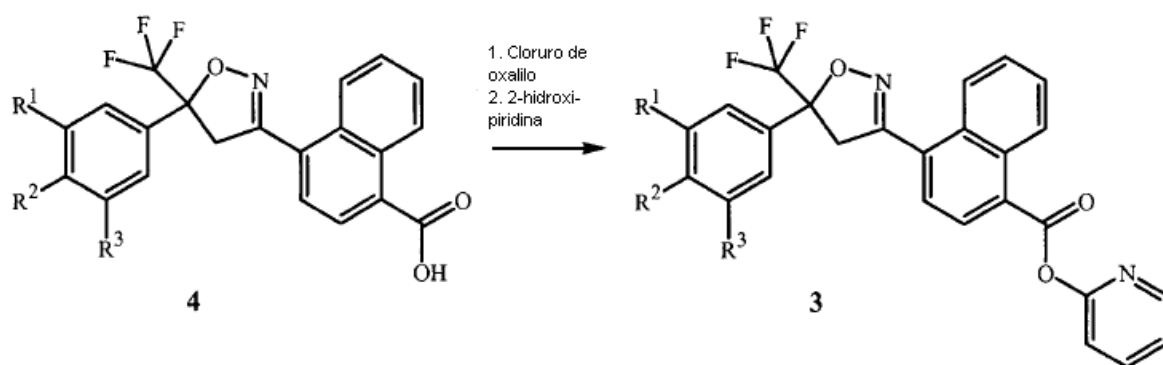
Los compuestos de Fórmula 1a en donde R^4 es H pueden prepararse por el método descrito en Tetrahedron Letters 1999, 2295 como se muestra en el Esquema 1a.

Esquema 1a

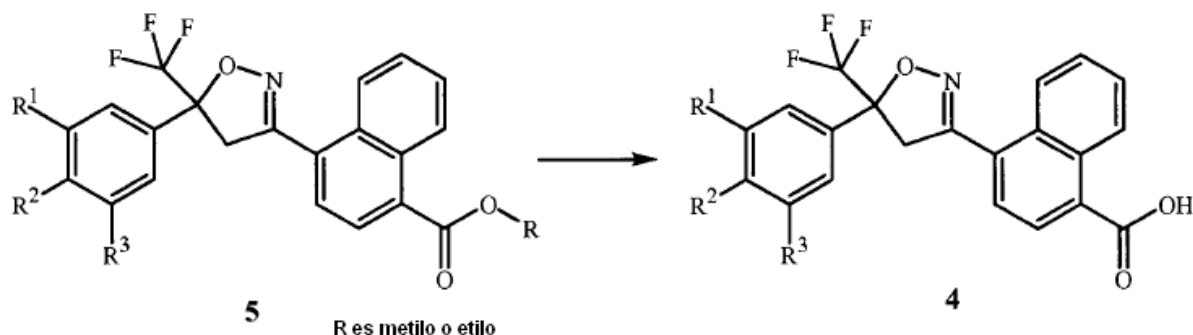
Los compuestos de Fórmula 2 pueden prepararse por el método descrito en Synlett 2006, 869 como se muestra en el Esquema 2.

Esquema 2

- 5 Los compuestos de Fórmula 3 pueden prepararse por métodos estándar conocidos en la técnica como se muestra en el Esquema 3.

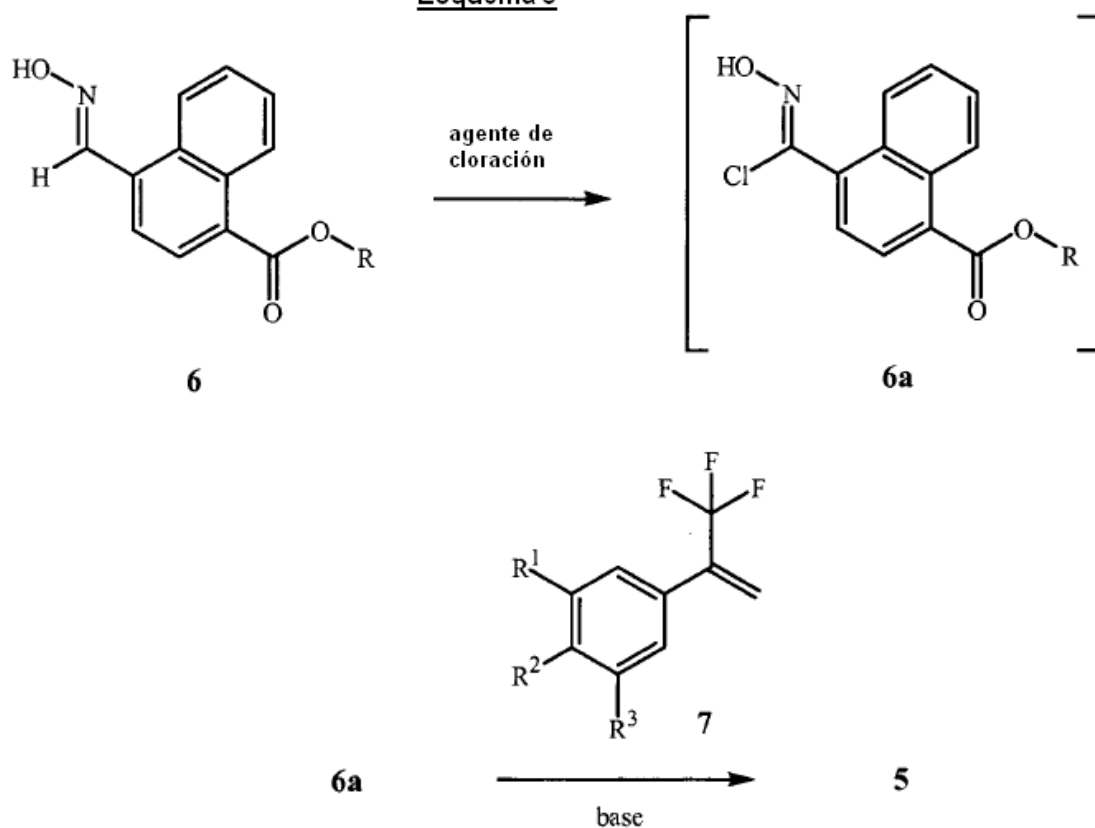
Esquema 3

Los compuestos de Fórmula 4 pueden prepararse por hidrólisis de ésteres de Fórmula 5, en donde R es metilo o etilo, como se muestra en el Esquema 4.

Esquema 4

En el método del Esquema 4, el éster de Fórmula 5 se convierte al correspondiente ácido carboxílico de Fórmula 4 mediante procedimientos generales bien conocidos en la técnica. Por ejemplo, el tratamiento de un éster metílico o etílico de Fórmula 5 con hidróxido de litio acuoso en tetrahidrofurano, seguido de acidulación da el correspondiente ácido carboxílico de Fórmula 4.

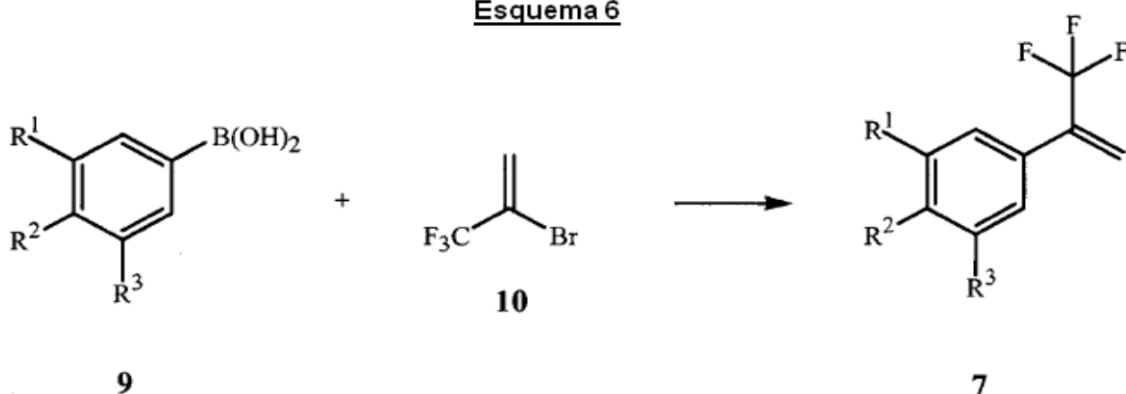
Los compuestos de Fórmula 5 pueden prepararse mediante la reacción de estirenos de Fórmula 7 con oximas de Fórmula 6 como se muestra en el Esquema 5.

Esquema 5

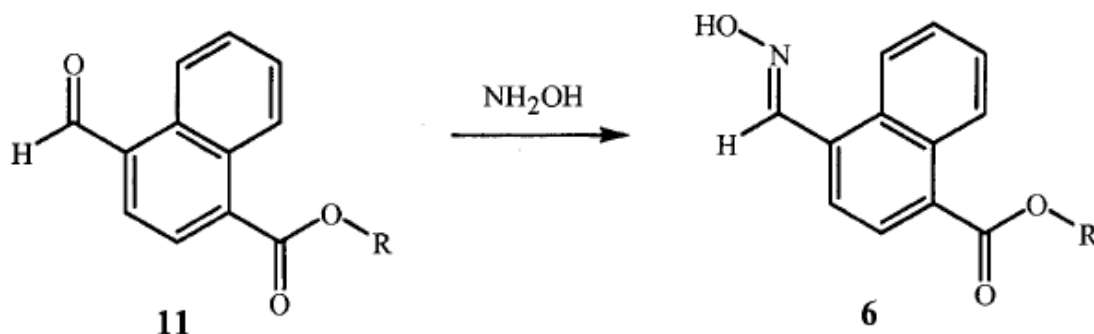
El método del Esquema 5 típicamente implica la cloración de oximas de Fórmula 6 para formar los cloruros de hidroximoilo de Fórmula 6a. Los intermedios de Fórmula 6a se deshidrocloran en condiciones básicas para formar óxidos de nitrilo, que sufren entonces cicloadición 1,3-dipolar con estirenos de Fórmula 7 para proporcionar compuestos de Fórmula 5. En un procedimiento típico, se combina un reactivo de cloración tal como hipoclorito de sodio, *N*-clorosuccinimida, o cloramina-T con la oxima en presencia del estireno. Dependiendo de las condiciones de reacción, las bases de amina tales como piridina o trietilamina pueden ser necesarias para facilitar la reacción de deshidrocloración. 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 que oscilan de temperatura

ambiente a temperatura de reflujo del disolvente. Los procedimientos generales para la cicloadición de óxidos de nitrilo con olefinas están bien documentadas en la bibliografía química; por ejemplo, véase Lee, *Synthesis*, 1982, 6, 508-509; Kanemasa et al., *Tetrahedron*, 2000, 56, 1057-1064; documento EP 1.538.138-A1, además de las referencias citadas en ellos.

- 5 Los estirenos de Fórmula 7 pueden prepararse por acoplamiento catalizado con paladio de ácidos arilborónicos de Fórmula 9 con el 2-bromo-3,3,3-trifluoropropeno disponible comercialmente (Fórmula 10). Los procedimientos generales para este método como se muestra en el Esquema 6 se documentan en la bibliografía química; véase Pan et al., *J. Fluorine Chemistry*, 1999, 95, 167-170. Otros métodos para preparar estirenos de Fórmula 7 son bien conocidos en la técnica.

Esquema 6

- 10 Las oximas de Fórmula 6 pueden prepararse mediante la reacción de aldehídos de Fórmula 11, en donde R es como se define anteriormente, con hidroxilamina como se muestra en el Esquema 7. Por ejemplo, véase H. K. Jung et al. *Bioorg. Med. Chem.* 2004, 12, 3965. Los aldehídos de Fórmula 11 pueden prepararse mediante una amplia variedad de métodos conocidos en la técnica; algunos de los aldehídos son compuestos conocidos.

Esquema 7

- 15 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 los intermedios. 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 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 rutinarias adicionales no descritas en detalle para completar la síntesis de compuestos de Fórmula I. Un experto en la técnica también reconocerá que puede ser necesario realizar una combinación de las etapas ilustradas en los esquemas anteriores en un orden distinto al supuesto por la secuencia particular presentada para preparar los compuestos de Fórmula 1.

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

Se cree que un experto en la técnica que usa la descripción anterior, puede utilizar la presente invención sin elaboración adicional en su alcance más completo. Los siguientes Ejemplos de Síntesis, por lo tanto, se van a construir como únicamente ilustrativos y no limitantes de la descripción de ningún modo. Las etapas en los siguientes Ejemplos de Síntesis ilustran un procedimiento para cada etapa en una transformación sintética global, y el material de partida para cada etapa puede no haberse preparado necesariamente por una marcha preparativa particular cuyo procedimiento se describe en otros Ejemplos o Etapas. Los porcentajes están en peso excepto para mezclas de disolventes cromatográficos o cuando se indique otra cosa. Las partes y porcentajes para las mezclas de disolventes cromatográficos están en volumen a menos que se indique otra cosa. Los espectros ^1H RMN se presentan en ppm campo abajo del tetrametilsilano; "s" significa singlete, "d" significa doblete, "m" significa multiplete, "dd" significa doblete de dobletes, y "br s" significa singlete amplio.

Ejemplo de síntesis 1

- 15 Preparación de N-[[4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-1-naftalenil]metil]ciclopropanocarboxamida

Etapas A: Preparación de 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-1-naftalenocarboxilato de 2-piridinilo

- 20 A una suspensión agitada de ácido 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-1-naftalenocarboxílico (preparado según el procedimiento descrito en el documento WO 2007/079162, 1,50 g, 3,30 mmoles) en diclorometano (15 mL) a temperatura ambiente se añadió cloruro de oxalilo (0,58 mL, 6,60 mmoles) seguido por una gota de *N,N*-dimetilformamida. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas y después se concentró a vacío. El residuo se disolvió en diclorometano (10 mL) y se añadió a una suspensión agitada de 2-hidroxipiridina (0,38 g, 3,96 mmoles) y K_2CO_3 (1,37 g, 9,90 mmoles) en diclorometano (15 mL) a temperatura ambiente. La mezcla de reacción resultante se agitó a temperatura ambiente durante toda la noche. La mezcla de reacción se filtró a través de un tapón corto de auxiliar de filtro diatomatoso de Celite®, y el tapón se enjuagó con diclorometano. El filtrado combinado se concentró y el residuo se purificó mediante cromatografía de columna en gel de sílice usando hexano/EtOAc como diluyente para proporcionar el producto del título como un sólido amarillo (0,80 g, 46% de rendimiento). ^1H RMN (CDCl_3) δ 9,07 (d, 1H), 8,81 (d, 1H), 8,53 (d, 1H), 8,46 (d, 1H), 7,90 (dd, 1H), 7,70 (m, 2H), 7,62 (d, 1H), 7,58 (s, 2H), 7,44 (s, 1H), 7,34 (dd, 1H), 7,28 (d, 1H), 4,30 (d, 1H), 3,92 (d, 1H).

Etapas B: Preparación de 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-1-naftalencarboxaldehído

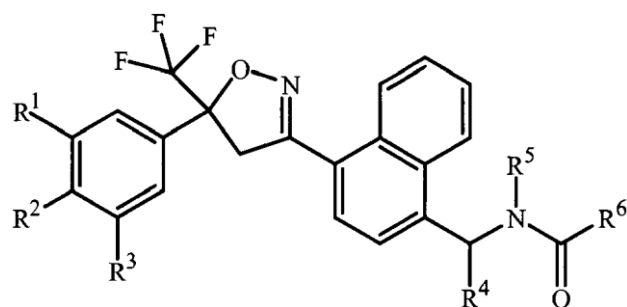
- 35 A una mezcla agitada del compuesto del título de la Etapa A (690 mg, 1,30 mmoles), acetato de paladio (II) (9 mg, 0,04 mmoles) y trifenilfosfina (31 mg, 0,12 mmoles) en DMF (4 mL) se añadió trietilsilano (0,42 mL, 2,60 mmoles). La mezcla resultante se agitó a 60°C durante 5 h. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente, se apagó con agua, y se extrajo con acetato de etilo al 20% en hexano. La fase orgánica se lavó con salmuera, se secó con Na_2SO_4 y se concentró, y el residuo se purificó por cromatografía de columna en gel de sílice usando hexano/EtOAc como eluyente para proporcionar el producto del título como un sólido amarillo (400 mg, 70% de rendimiento). ^1H RMN (CDCl_3) δ 10,50 (s, 1H), 9,27 (d, 1H), 8,82 (d, 1H), 8,01 (d, 1H), 7,71 (m, 2H), 7,66 (d, 1H), 7,56 (d, 2H), 7,43 (dd, 1H), 4,31 (d, 1H), 3,92 (d, 1H).

Etapas C: Preparación de N-[[4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-1-naftalenil]metil]ciclopropanocarboxamida

- 45 Una mezcla del compuesto del título de la Etapa B (127 mg, 0,29 mmoles), ciclopropanocarboxamida (74 mg, 0,87 mmoles), ácido trifluoroacético (0,07 mL, 0,87 mmoles) y trietilsilano (0,14 mL, 0,87 mmoles) en tolueno (2 mL) se puso a reflujo suave toda la noche. La mezcla de reacción se concentró entonces a presión reducida, y el residuo se purificó por cromatografía de columna en gel de sílice usando hexano/EtOAc como eluyente para proporcionar el compuesto del título, un compuesto de esta invención, como un sólido espumoso blanco (113 mg, 77% de rendimiento). ^1H RMN (CDCl_3) δ 8,88 (d, 1H), 8,06 (d, 1H), 7,66 (m, 2H), 7,56 (s, 2H), 7,46 (m, 3H), 5,96 (br s, 1H), 4,92 (d, 2H), 4,26 (d, 1H), 3,89 (d, 1H), 1,36 (m, 1H), 1,04 (m, 2H), 0,78 (m, 2H).

Mediante los procedimientos descritos en este documento, junto con métodos conocidos en la técnica, pueden prepararse los siguientes compuestos de la Tabla 1.

Tabla 1

R⁴ es H y R⁵ es H

R ¹	R ²	R ³	R ⁶	R ¹	R ²	R ³	R ⁶
Cl	H	Cl	isopropilo	Cl	H	Cl	ciclopropilo
Cl	Cl	Cl	isopropilo	Cl	Cl	Cl	ciclopropilo
Cl	F	Cl	isopropilo	Cl	F	Cl	ciclopropilo
Cl	CHF ₂	Cl	isopropilo	Cl	CHF ₂	Cl	ciclopropilo
Br	H	Br	isopropilo	Br	H	Br	ciclopropilo
CF ₃	H	H	isopropilo	CF ₃	H	H	ciclopropilo
CF ₃	H	F	isopropilo	CF ₃	H	F	ciclopropilo
CF ₃	H	Cl	isopropilo	CF ₃	H	Cl	ciclopropilo
CF ₃	H	Br	isopropilo	CF ₃	H	Br	ciclopropilo
CF ₃	H	CF ₃	isopropilo	CF ₃	H	CF ₃	ciclopropilo
OCF ₃	H	Cl	isopropilo	OCF ₃	H	Cl	ciclopropilo
OCH ₂ CF ₃	H	Cl	isopropilo	OCH ₂ CF ₃	H	Cl	ciclopropilo
Cl	H	Cl	CF ₃	Cl	H	Cl	ciclopropilmetilo
Cl	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Cl	Cl	ciclopropilmetilo
Cl	F	Cl	CF ₃	Cl	F	Cl	ciclopropilmetilo
Cl	CHF ₂	Cl	CF ₃	Cl	CHF ₂	Cl	ciclopropilmetilo
Br	H	Br	CF ₃	Br	H	Br	ciclopropilmetilo
CF ₃	H	H	CF ₃	CF ₃	H	H	ciclopropilmetilo
CF ₃	H	F	CF ₃	CF ₃	H	F	ciclopropilmetilo
CF ₃	H	Cl	CF ₃	CF ₃	H	Cl	ciclopropilmetilo
CF ₃	H	Br	CF ₃	CF ₃	H	Br	ciclopropilmetilo
CF ₃	H	CF ₃	CF ₃	CF ₃	H	CF ₃	ciclopropilmetilo
OCF ₃	H	Cl	CF ₃	OCF ₃	H	Cl	ciclopropilmetilo
OCH ₂ CF ₃	H	Cl	CF ₃	OCH ₂ CF ₃	H	Cl	ciclopropilmetilo
Cl	H	Cl	CF ₂ CF ₃	Cl	H	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃
Cl	Cl	Cl	CF ₂ CF ₃	Cl	Cl	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃
Cl	F	Cl	CF ₂ CF ₃	Cl	F	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃

Cl	CHF ₂	Cl	CF ₂ CF ₃	Cl	CHF ₂	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃
Br	H	Br	CF ₂ CF ₃	Br	H	Br	CF ₂ CF ₂ CF ₃
CF ₃	H	H	CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃
CF ₃	H	F	CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃
CF ₃	H	Cl	CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃
CF ₃	H	Br	CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	Br	CF ₂ CF ₂ CF ₃
CF ₃	H	CF ₃	CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	CF ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃
OCF ₃	H	Cl	CF ₂ CF ₃	OCF ₃	H	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃
OCH ₂ CF ₃	H	Cl	CF ₂ CF ₃	OCH ₂ CF ₃	H	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃
Cl	H	Cl	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	Cl	H	Cl	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
Cl	Cl	Cl	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	Cl	Cl	Cl	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
Cl	F	Cl	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	Cl	F	Cl	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
Cl	CHF ₂	Cl	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	Cl	CHF ₂	Cl	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
Br	H	Br	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	Br	H	Br	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
CF ₃	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CF ₃	H	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
CF ₃	H	F	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CF ₃	H	F	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
CF ₃	H	Cl	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CF ₃	H	Cl	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
CF ₃	H	Br	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CF ₃	H	Br	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
CF ₃	H	CF ₃	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CF ₃	H	CF ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
OCF ₃	H	Cl	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	OCF ₃	H	Cl	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
OCH ₂ CF ₃	H	Cl	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	OCH ₂ CF ₃	H	Cl	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
Cl	H	Cl	CH ₂ SCH ₃	Cl	H	Cl	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
Cl	Cl	Cl	CH ₂ SCH ₃	Cl	Cl	Cl	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
Cl	F	Cl	CH ₂ SCH ₃	Cl	F	Cl	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
Cl	CHF ₂	Cl	CH ₂ SCH ₃	Cl	CHF ₂	Cl	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
Br	H	Br	CH ₂ SCH ₃	Br	H	Br	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
CF ₃	H	H	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
CF ₃	H	F	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	H	F	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
CF ₃	H	Cl	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	H	Cl	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
CF ₃	H	Br	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	H	Br	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
CF ₃	H	CF ₃	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	H	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
OCF ₃	H	Cl	CH ₂ SCH ₃	OCF ₃	H	Cl	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
OCH ₂ CF ₃	H	Cl	CH ₂ SCH ₃	OCH ₂ CF ₃	H	Cl	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
Cl	H	Cl	CH ₂ OCH ₃	Cl	H	Cl	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
Cl	Cl	Cl	CH ₂ OCH ₃	Cl	Cl	Cl	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
Cl	F	Cl	CH ₂ OCH ₃	Cl	F	Cl	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
R ¹	R ²	R ³	R ⁶	R ¹	R ²	R ³	R ⁶

Cl	CHF ₂	Cl	CH ₂ OCH ₃	Cl	CHF ₂	Cl	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
Br	H	Br	CH ₂ OCH ₃	Br	H	Br	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
CF ₃	H	H	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
CF ₃	H	F	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	H	F	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
CF ₃	H	Cl	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	H	Cl	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
CF ₃	H	Br	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	H	Br	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
CF ₃	H	CF ₃	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	H	CF ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
OCF ₃	H	Cl	CH ₂ OCH ₃	OCF ₃	H	Cl	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
OCH ₂ CF ₃	H	Cl	CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CF ₃	H	Cl	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
Cl	H	Cl	CH ₂ NC(O)CF ₃	CF ₃	H	F	CH ₂ NC(O)CF ₃
Cl	Cl	Cl	CH ₂ NC(O)CF ₃	CF ₃	H	Cl	CH ₂ NC(O)CF ₃
Cl	F	Cl	CH ₂ NC(O)CF ₃	CF ₃	H	Br	CH ₂ NC(O)CF ₃
Cl	CHF ₂	Cl	CH ₂ NC(O)CF ₃	CF ₃	H	CF ₃	CH ₂ NC(O)CF ₃
Br	H	Br	CH ₂ NC(O)CF ₃	OCF ₃	H	Cl	CH ₂ NC(O)CF ₃
CF ₃	H	H	CH ₂ NC(O)CF ₃	OCH ₂ CF ₃	H	Cl	CH ₂ NC(O)CF ₃
<u>R⁴ es CH₃ y R⁵ es H</u>							
R ¹	R ²	R ³	R ⁶	R ¹	R ²	R ³	R ⁶
Cl	H	Cl	isopropilo	Cl	H	Cl	ciclopropilo
Cl	Cl	Cl	isopropilo	Cl	Cl	Cl	ciclopropilo
Cl	F	Cl	isopropilo	Cl	F	Cl	ciclopropilo
Cl	CHF ₂	Cl	isopropilo	Cl	CHF ₂	Cl	ciclopropilo
Br	H	Br	isopropilo	Br	H	Br	ciclopropilo
CF ₃	H	H	isopropilo	CF ₃	H	H	ciclopropilo
CF ₃	H	F	isopropilo	CF ₃	H	F	ciclopropilo
CF ₃	H	Cl	isopropilo	CF ₃	H	Cl	ciclopropilo
CF ₃	H	Br	isopropilo	CF ₃	H	Br	ciclopropilo
CF ₃	H	CF ₃	isopropilo	CF ₃	H	CF ₃	ciclopropilo
OCF ₃	H	Cl	isopropilo	OCF ₃	H	Cl	ciclopropilo
OCH ₂ CF ₃	H	Cl	isopropilo	OCH ₂ CF ₃	H	Cl	ciclopropilo
Cl	H	Cl	CF ₃	Cl	H	Cl	ciclopropilmetilo
Cl	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Cl	Cl	ciclopropilmetilo
Cl	F	Cl	CF ₃	Cl	F	Cl	ciclopropilmetilo
Cl	CHF ₂	Cl	CF ₃	Cl	CHF ₂	Cl	ciclopropilmetilo
Br	H	Br	CF ₃	Br	H	Br	ciclopropilmetilo
CF ₃	H	H	CF ₃	CF ₃	H	H	ciclopropilmetilo
R ¹	R ²	R ³	R ⁶	R ¹	R ²	R ³	R ⁶
CF ₃	H	F	CF ₃	CF ₃	H	F	ciclopropilmetilo

ES 2 399 572 T3

CF ₃	H	Cl	CF ₃	CF ₃	H	Cl	ciclopropilmetilo
CF ₃	H	Br	CF ₃	CF ₃	H	Br	ciclopropilmetilo
CF ₃	H	CF ₃	CF ₃	CF ₃	H	CF ₃	ciclopropilmetilo
OCF ₃	H	Cl	CF ₃	OCF ₃	H	Cl	ciclopropilmetilo
OCH ₂ CF ₃	H	Cl	CF ₃	OCH ₂ CF ₃	H	Cl	ciclopropilmetilo
Cl	H	Cl	CF ₂ CF ₃	Cl	H	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃
Cl	Cl	Cl	CF ₂ CF ₃	Cl	Cl	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃
Cl	F	Cl	CF ₂ CF ₃	Cl	F	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃
Cl	CHF ₂	Cl	CF ₂ CF ₃	Cl	CHF ₂	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃
Br	H	Br	CF ₂ CF ₃	Br	H	Br	CF ₂ CF ₂ CF ₃
CF ₃	H	H	CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃
CF ₃	H	F	CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃
CF ₃	H	Cl	CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃
CF ₃	H	Br	CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	Br	CF ₂ CF ₂ CF ₃
CF ₃	H	CF ₃	CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	CF ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃
OCF ₃	H	Cl	CF ₂ CF ₃	OCF ₃	H	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃
OCH ₂ CF ₃	H	Cl	CF ₂ CF ₃	OCH ₂ CF ₃	H	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃
Cl	H	Cl	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	Cl	H	Cl	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
Cl	Cl	Cl	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	Cl	Cl	Cl	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
Cl	F	Cl	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	Cl	F	Cl	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
Cl	CHF ₂	Cl	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	Cl	CHF ₂	Cl	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
Br	H	Br	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	Br	H	Br	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
CF ₃	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CF ₃	H	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
CF ₃	H	F	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CF ₃	H	F	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
CF ₃	H	Cl	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CF ₃	H	Cl	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
CF ₃	H	Br	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CF ₃	H	Br	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
CF ₃	H	CF ₃	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CF ₃	H	CF ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
OCF ₃	H	Cl	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	OCF ₃	H	Cl	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
OCH ₂ CF ₃	H	Cl	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	OCH ₂ CF ₃	H	Cl	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
Cl	H	Cl	CH ₂ SCH ₃	Cl	H	Cl	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
Cl	Cl	Cl	CH ₂ SCH ₃	Cl	Cl	Cl	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
Cl	F	Cl	CH ₂ SCH ₃	Cl	F	Cl	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
Cl	CHF ₂	Cl	CH ₂ SCH ₃	Cl	CHF ₂	Cl	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
Br	H	Br	CH ₂ SCH ₃	Br	H	Br	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
CF ₃	H	H	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
CF ₃	H	F	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	H	F	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
CF ₃	H	Cl	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	H	Cl	CH ₂ CH ₂ SCH ₃

CF ₃	H	Br	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	H	Br	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
CF ₃	H	CF ₃	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	H	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
OCF ₃	H	Cl	CH ₂ SCH ₃	OCF ₃	H	Cl	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
OCH ₂ CF ₃	H	Cl	CH ₂ SCH ₃	OCH ₂ CF ₃	H	Cl	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
Cl	H	Cl	CH ₂ OCH ₃	Cl	H	Cl	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
Cl	Cl	Cl	CH ₂ OCH ₃	Cl	Cl	Cl	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
Cl	F	Cl	CH ₂ OCH ₃	Cl	F	Cl	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
Cl	CHF ₂	Cl	CH ₂ OCH ₃	Cl	CHF ₂	Cl	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
Br	H	Br	CH ₂ OCH ₃	Br	H	Br	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
CF ₃	H	H	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
CF ₃	H	F	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	H	F	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
CF ₃	H	Cl	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	H	Cl	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
CF ₃	H	Br	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	H	Br	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
CF ₃	H	CF ₃	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	H	CF ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
OCF ₃	H	Cl	CH ₂ OCH ₃	OCF ₃	H	Cl	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
OCH ₂ CF ₃	H	Cl	CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CF ₃	H	Cl	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
Cl	H	Cl	CH ₂ NC(O)CF ₃	CF ₃	H	F	CH ₂ NC(O)CF ₃
Cl	Cl	Cl	CH ₂ NC(O)CF ₃	CF ₃	H	Cl	CH ₂ NC(O)CF ₃
Cl	F	Cl	CH ₂ NC(O)CF ₃	CF ₃	H	Br	CH ₂ NC(O)CF ₃
Cl	CHF ₂	Cl	CH ₂ NC(O)CF ₃	CF ₃	H	CF ₃	CH ₂ NC(O)CF ₃
Br	H	Br	CH ₂ NC(O)CF ₃	OCF ₃	H	Cl	CH ₂ NC(O)CF ₃
CF ₃	H	H	CH ₂ NC(O)CF ₃	OCH ₂ CF ₃	H	Cl	CH ₂ NC(O)CF ₃

R⁴ es ciano y R⁵ es H

R ¹	R ²	R ³	R ⁶	R ¹	R ²	R ³	R ⁶
Cl	H	Cl	isopropilo	Cl	H	Cl	ciclopropilo
Cl	Cl	Cl	isopropilo	Cl	Cl	Cl	ciclopropilo
Cl	F	Cl	isopropilo	Cl	F	Cl	ciclopropilo
Cl	CHF ₂	Cl	isopropilo	Cl	CHF ₂	Cl	ciclopropilo
Br	H	Br	isopropilo	Br	H	Br	ciclopropilo
CF ₃	H	H	isopropilo	CF ₃	H	H	ciclopropilo
CF ₃	H	F	isopropilo	CF ₃	H	F	ciclopropilo
CF ₃	H	Cl	isopropilo	CF ₃	H	Cl	ciclopropilo
CF ₃	H	Br	isopropilo	CF ₃	H	Br	ciclopropilo
CF ₃	H	CF ₃	isopropilo	CF ₃	H	CF ₃	ciclopropilo
R ¹	R ²	R ³	R ⁶	R ¹	R ²	R ³	R ⁶
OCF ₃	H	Cl	isopropilo	OCF ₃	H	Cl	ciclopropilo
OCH ₂ CF ₃	H	Cl	isopropilo	OCH ₂ CF ₃	H	Cl	ciclopropilo

Cl	H	Cl	CF ₃	Cl	H	Cl	ciclopropilmetilo
Cl	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Cl	Cl	ciclopropilmetilo
Cl	F	Cl	CF ₃	Cl	F	Cl	ciclopropilmetilo
Cl	CHF ₂	Cl	CF ₃	Cl	CHF ₂	Cl	ciclopropilmetilo
Br	H	Br	CF ₃	Br	H	Br	ciclopropilmetilo
CF ₃	H	H	CF ₃	CF ₃	H	H	ciclopropilmetilo
CF ₃	H	F	CF ₃	CF ₃	H	F	ciclopropilmetilo
CF ₃	H	Cl	CF ₃	CF ₃	H	Cl	ciclopropilmetilo
CF ₃	H	Br	CF ₃	CF ₃	H	Br	ciclopropilmetilo
CF ₃	H	CF ₃	CF ₃	CF ₃	H	CF ₃	ciclopropilmetilo
OCF ₃	H	Cl	CF ₃	OCF ₃	H	Cl	ciclopropilmetilo
OCH ₂ CF ₃	H	Cl	CF ₃	OCH ₂ CF ₃	H	Cl	ciclopropilmetilo
Cl	H	Cl	CF ₂ CF ₃	Cl	H	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃
Cl	Cl	Cl	CF ₂ CF ₃	Cl	Cl	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃
Cl	F	Cl	CF ₂ CF ₃	Cl	F	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃
Cl	CHF ₂	Cl	CF ₂ CF ₃	Cl	CHF ₂	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃
Br	H	Br	CF ₂ CF ₃	Br	H	Br	CF ₂ CF ₂ CF ₃
CF ₃	H	H	CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃
CF ₃	H	F	CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	F	CF ₂ CF ₂ CF ₃
CF ₃	H	Cl	CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃
CF ₃	H	Br	CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	Br	CF ₂ CF ₂ CF ₃
CF ₃	H	CF ₃	CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	CF ₃	CF ₂ CF ₂ CF ₃
OCF ₃	H	Cl	CF ₂ CF ₃	OCF ₃	H	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃
OCH ₂ CF ₃	H	Cl	CF ₂ CF ₃	OCH ₂ CF ₃	H	Cl	CF ₂ CF ₂ CF ₃
Cl	H	Cl	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	Cl	H	Cl	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
Cl	Cl	Cl	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	Cl	Cl	Cl	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
Cl	F	Cl	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	Cl	F	Cl	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
Cl	CHF ₂	Cl	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	Cl	CHF ₂	Cl	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
Br	H	Br	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	Br	H	Br	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
CF ₃	H	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CF ₃	H	H	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
CF ₃	Il	F	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CF ₃	H	F	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
CF ₃	H	Cl	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CF ₃	H	Cl	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
CF ₃	H	Br	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CF ₃	H	Br	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
CF ₃	H	CF ₃	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CF ₃	H	CF ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
OCF ₃	H	Cl	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	OCF ₃	H	Cl	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
OCH ₂ CF ₃	H	Cl	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	OCH ₂ CF ₃	H	Cl	CH ₂ CH(CH ₃) ₂

Cl	H	Cl	CH ₂ SCH ₃	Cl	H	Cl	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
Cl	Cl	Cl	CH ₂ SCH ₃	Cl	Cl	Cl	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
Cl	F	Cl	CH ₂ SCH ₃	Cl	F	Cl	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
Cl	CHF ₂	Cl	CH ₂ SCH ₃	Cl	CHF ₂	Cl	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
Br	H	Br	CH ₂ SCH ₃	Br	H	Br	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
CF ₃	H	H	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
CF ₃	H	F	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	H	F	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
CF ₃	H	Cl	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	H	Cl	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
CF ₃	H	Br	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	H	Br	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
CF ₃	H	CF ₃	CH ₂ SCH ₃	CF ₃	H	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
OCF ₃	H	Cl	CH ₂ SCH ₃	OCF ₃	H	Cl	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
OCH ₂ CF ₃	H	Cl	CH ₂ SCH ₃	OCH ₂ CF ₃	H	Cl	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
Cl	H	Cl	CH ₂ OCH ₃	Cl	H	Cl	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
Cl	Cl	Cl	CH ₂ OCH ₃	Cl	Cl	Cl	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
Cl	F	Cl	CH ₂ OCH ₃	Cl	F	Cl	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
Cl	CHF ₂	Cl	CH ₂ OCH ₃	Cl	CHF ₂	Cl	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
Br	H	Br	CH ₂ OCH ₃	Br	H	Br	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
CF ₃	H	H	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
CF ₃	H	F	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	H	F	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
CF ₃	H	Cl	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	H	Cl	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
CF ₃	H	Br	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	H	Br	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
CF ₃	H	CF ₃	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	H	CF ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
OCF ₃	H	Cl	CH ₂ OCH ₃	OCF ₃	H	Cl	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
OCH ₂ CF ₃	H	Cl	CH ₂ OCH ₃	OCH ₂ CF ₃	H	Cl	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
Cl	H	Cl	CH ₂ NC(O)CF ₃	CF ₃	H	F	CH ₂ NC(O)CF ₃
Cl	Cl	Cl	CH ₂ NC(O)CF ₃	CF ₃	H	Cl	CH ₂ NC(O)CF ₃
Cl	F	Cl	CH ₂ NC(O)CF ₃	CF ₃	H	Br	CH ₂ NC(O)CF ₃
Cl	CHF ₂	Cl	CH ₂ NC(O)CF ₃	CF ₃	H	CF ₃	CH ₂ NC(O)CF ₃
Br	H	Br	CH ₂ NC(O)CF ₃	OCF ₃	H	Cl	CH ₂ NC(O)CF ₃
CF ₃	H	H	CH ₂ NC(O)CF ₃	OCH ₂ CF ₃	H	Cl	CH ₂ NC(O)CF ₃

Un compuesto de esta invención se usará generalmente como un 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 tierra, 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 en suspensión, suspensión para cápsulas,

emulsión concentrada, microemulsión y suspo-emulsión. 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, bolitas, perlas, pastillas, comprimidos, películas rellenas (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 películas 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 de 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. Dichas 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 la absorción sistémica.

Las formulaciones contendrán típicamente cantidades eficaces de ingrediente activo, diluyente y tensioactivo, dentro de los siguientes intervalos aproximados que constituyen hasta 100 por ciento 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, Suspensiones, Emulsiones, Disoluciones en aceite (incluyendo Concentrados Emulsionables)	1-50	40-99	0-50
Polvos Finos	1-25	70-99	0-5
Gránulos y Bolitas	0,001-99	5-99,999	0-15
Composiciones de Alta Resistencia	90-99	0-10	0-2

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.

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.

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.

Los tensioactivos pueden clasificarse como no iónicos, aniónicos o catiónicos. Tensioactivos no iónicos útiles para las presentes composiciones incluyen, pero 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 (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*-alquilauratos; sulfonatos de benceno, cumeno, tolueno, xileno y dodecil- y tridecil-bencenos; sulfonatos de naftalenos condensados; sulfonatos de naftaleno y alquilnaftaleno; sulfonatos de petróleo fraccionado; sulfosuccinamatos; 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-hidroxiethyl)-alquilamina.

También son útiles para las presentes composiciones 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 incluyendo 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 de formulación y aditivos, 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 de formulación y aditivos 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 de formulación y aditivos 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 los concentrados emulsionables, pueden prepararse por simple mezcla de los ingredientes. Si el disolvente de una composición líquida destinada al uso como un concentrado emulsificable es inmiscible 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 pueden 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 las bolitas pueden prepararse por pulverización del material activo sobre vehículos granulares preformados o por técnicas de aglomeración. Véase Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, 4 de diciembre de 1967, páginas 147-48, Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4ª Ed., McGraw-Hill, Nueva York, 1963, páginas 8-57 y siguientes, y el documento WO 91/13546. Las bolitas 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 muestra en los documentos U.S. 4.144.050, U.S. 3.920.442 y DE 3.246.493. Los comprimidos pueden prepararse como se muestra 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 muestra en los documentos GB 2.095.558 y U.S. 3.299.566.
- Para información adicional respecto a la técnica de la formulación, véanse 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, 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 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 Ejemplos 1-4; Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., Nueva York, 1961, pp. 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.
- 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 y B. Se cree que el experto en la técnica, usando la descripción anterior, puede utilizar la presente invención sin elaboración adicional en su alcance más completo. Por lo tanto, los siguientes Ejemplos se van a construir como meramente ilustrativos, y no limitantes de la descripción de ningún modo. Los porcentajes están en peso excepto cuando se indique otra cosa.

Ejemplo A

Concentrado de Alta Potencia

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

Ejemplo B

Polvo Humectable

Compuesto 2	65,0%
Dodecilfenol polietilenglicol éter	2,0%
Ligninsulfonato sódico	4,0%
Silicoaluminato sódico	6,0%
Montmorillonita (calcinada)	23,0%

Ejemplo C

Gránulo

Compuesto 5	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 D

Bolita Extruida

Compuesto 6	25,0%
Sulfato sódico anhidro	10,0%
Ligninsulfonato de calcio en bruto	5,0%
Alquilnaftalenosulfonato sódico	1,0%
Bentonita de calcio/magnesio	59,0%

Ejemplo E

Concentrado Emulsionable

Compuesto 1	10,0%
hexoleato de polioxietilensorbitol	20,0%
éster metílico de ácido graso C ₆ -C ₁₀	70,0%

Ejemplo F

Microemulsión

Compuesto 2	5,0%
Copolímero de polivinilpirrolidona-acetato de vinilo	30,0%
Alquilpoliglicósido	30,0%
Monooleato de glicerilo	15,0%
Agua	20,0%

Ejemplo G

Tratamiento de semilla

Compuesto 5	20,00%
Copolímero de polivinilpirrolidona-acetato de vinilo	5,00%
Cera de ácido montan	5,00%
Ligninasulfonato de calcio	1,00%
Copolímeros de bloque de polioxietileno/polioxipropileno	1,00%
Alcohol de estearilo (POE 20)	2,00%
Poliorganosilano	0,20%
Tinte de colorante rojo	0,05%
Agua	65,75%

Ejemplo HBarra de fertilizante

Compuesto 6	2,50%
Copolímero de pirrolidona-estireno	4,80%
16-Etoxilato de triestirilfenilo	2,30%
Talco	0,80%
Almidón de maíz	5,00%
Fertilizante de liberación lenta Nitrophoska® Permanent 15-9-15 (BASF)	36,00%
Caolín	38,00%
Agua	10,60%

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, madera, fibras textiles o sangre o tejidos animales, y que provocan así lesión o daño, por ejemplo, a cultivos agronómicos en crecimiento o almacenados, bosques, cultivos de invernadero, cultivos ornamentales, cultivos de vivero, alimentos almacenados o productos de fibra, o casas u otras estructuras o sus contenidos, o siendo 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.

Estos compuestos y composiciones actuales son útiles por tanto agronómicamente para proteger los cultivos 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 estos rasgos incluyen tolerancia a herbicidas, resistencia a plagas fitófagas (por ejemplo, insectos, ácaros, áfidos, arañas, nematodos, caracoles, hongos fitopatógenos, bacterias y virus), 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 proceso 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 tóxicos naturales para las plagas de invertebrados para proporcionar un control más que aditivo de estas plagas.

Las composiciones de esta invención también pueden comprender opcionalmente nutrientes para plantas, por ejemplo un composición fertilizante que comprende al menos un nutriente para plantas seleccionado entre nitrógeno, fósforo, potasio, azufre, calcio, magnesio, hierro, cobre, boro, manganeso, zinc y molibdeno. Son de interés las composiciones que comprenden al menos una composición fertilizante que comprende al menos un nutriente para plantas seleccionado entre nitrógeno, fósforo, potasio, azufre, calcio y magnesio. Las composiciones de la presente invención que comprenden además al menos un nutriente para plantas pueden estar en forma de líquidos o sólidos. Son de interés las formulaciones sólidas en forma de gránulos, pequeñas barras o comprimidos. Las formulaciones sólidas que comprenden una composición fertilizante pueden prepararse mezclando el compuesto o composición de la presente invención con la composición fertilizante junto con los ingredientes de formulación y luego preparando la formulación por métodos tales como granulación o extrusión. Las formulaciones sólidas pueden prepararse alternativamente pulverizando una disolución o suspensión de un compuesto o composición de la presente invención en un disolvente volátil sobre una composición fertilizante previamente preparada en la forma de mezclas

dimensionalmente estables, por ejemplo, gránulos, pequeñas barras o comprimidos, y luego evaporando el disolvente.

Los usos no agronómicos se refieren al control de plagas de invertebrados en las 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 el control de parásitos externos que son parasitarios para la superficie del cuerpo del animal huésped (por ejemplo, hombros, axilas, abdomen, parte interna de los muslos) y 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 enfermedad 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 enfermedad. Los compuestos y composiciones de la presente invención son apropiados para combatir parásitos que infestan animales de trabajo agrícola tales como vacas, 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 económico y más 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 gemmatilis* 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 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), gusano peludo 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 (*Crocidolomia 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 de la manzana falsa (*Cryptophlebia leucotreta* Meyrick), polilla de los cítricos (*Ecdytophaga aurantiana* Lima), enrollador bandeado rojo (*Argyrotaenia velutinana* Walker), rosquilla de bandas oblicuas (*Choristoneura rosaceana* Harris), polilla de la manzana (*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), oruga rosada del algodón (*Pectinophora gossypiella* Saunders), lagarta peluda (*Lymantria dispar* Linnaeus), barrenador del melocotón (*Carposina niponensis* Walsingham), polilla del melocotonero (*Anarsia lineatella* Zellrer), polilla de la patata (*Phthorimaea operculella* Zeller), minadora (*Lithocolletis blanfordella* Fabricius), minadora del manzano asiática (*Lithocolletis ringoniella* Matsumura), enrollador de las hojas del arroz (*Lerodea eufala* Edwards), minadora

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)), curculiónido Hyperodes (*Listronotus maculicollis* Dietz), escarabajo del pasto (*Sphenophorus parvulus* Gyllenhal), escarabajo cazador (*Sphenophorus venatus vestitus*), gorgojo de Denver (*Sphenophorus cicatristriatus* Fahraeus)); pulgillas, escarabajos del pepino, gusanos de las raíces, escarabajos de las hojas, 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.), ateniú negro del césped (*Ataenius spretulus* Haldeman), escarabajo verde de Junio (*Cotinis nitida* Linnaeus), escarabajo del jardín asiático (*Maladera castanea* Arrow), escarabajo 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 Dermaptera 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 las 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 Fulgoridae 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, cochinillas 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)); falsa arañuela roja en la familia Tenuipalpidae (por ejemplo, ácaro rojo plano (*Brevipalpus lewisi* McGregor)); ácaros de la vid y la grosella en la familia Eriophyidae y otros ácaros que se alimentan de hojas y ácaros importantes en la salud humana y animal, es decir, ácaros del polvo de la familia Epidermoptidae, ácaros foliculares en la familia Demodicidae, ácaros del grano de la familia Glycyphagidae; garrapatas de la familia Ixodidae, conocidas normalmente como garrapatas duras (por ejemplo, garrapata del venado (*Ixodes scapularis* Say), garrapata paralizadora australiana (*Ixodes holocyclus* Neumann), garrapata del perro americana (*Dermacentor variabilis* Say), garrapata de la estrella solitaria (*Amblyomma americanum* Linnaeus)) y garrapatas de la familia Argasidae, conocidas normalmente como garrapatas blandas (por ejemplo, garrapata de la fiebre recurrente (*Ornithodoros turicata*), garrapata de las aves común (*Argas radiatus*)); ácaros de la sarna y picadores de 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), saltamontes americano (por ejemplo, *Schistocerca americana* Drury), langosta del desierto (*Schistocerca gregaria* Forskal), langosta migratoria (*Locusta migratoria* Linnaeus), saltamontes elegante (*Zonocerus* spp.), acheta doméstica (*Acheta domesticus* 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 de la hoja (por ejemplo, *Liriomyza* spp. tal como minadores de vegetales serpentina (*Liriomyza sativae* Blanchard)), mosquitos, moscas de la fruta (Tephritidae), moscas fritas (por ejemplo, *Oscinella frit* Linnaeus), gusanos del suelo, moscas domésticas (por ejemplo, *Musca domestica* 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 de la carne (por ejemplo, *Chrysomya* spp., *Phormia* spp.) y otras plagas de muscoides, moscas del caballo (por ejemplo, *Tabanus* spp.), moscas del cuajo equino (por ejemplo, *Gastrophilus* spp., *Oestrus* spp.), moscas del ganado (por ejemplo, *Hypoderma* spp.), moscas del ciervo (por ejemplo, *Chrysops* spp.), moscas de la oveja (por ejemplo, *Melophagus ovinus* Linnaeus) y otras Brachycera, mosquitos (por ejemplo, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp.), moscas negras (por ejemplo, *Prosimulium* spp., *Simulium* spp.), purrujas, moscas de la arena, moscas del sustrato y otras Nematocera; huevos, adultos e inmaduros del orden Thysanoptera que incluyen tripsos de la cebolla (*Thrips tabaci* Lindeman), tripsos de las flores (*Frankliniella* spp.), y otros tripsos de alimentación foliar; plagas de insectos del orden Hymenoptera que incluyen hormigas de la familia Formicidae

- que incluyen hormiga carpintera de florida (*Camponotus ferrugineus* Fabricius), hormiga carpintera negra (*Camponotus pennsylvanicus* De Geer), hormiga de los pies blancos (*Technomyrmex albipes* fr. Smith), hormigas de cabeza grande (*Pheidole* sp.), hormiga fantasma (*Tapinoma melanocephalum* Fabricius); hormiga faraón (*Monomorium Pharaonis* Linnaeus), hormiguita 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
- 5 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
- 10 (*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 domestica* 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* Nitsch), piojo del perro (*Trichodectes canis* De Geer), piojo del plumón (*Goniocotes gallinae* De Geer), piojo del cuerpo de la oveja (*Bovicola ovis* Schrank), piojo del ganado vacuno (*Haematopinus eurysternus* Nitzsch), piojo de nariz larga del ganado (*Linognathus vituli* Linnaeus) y otros piojos succionadores y mordedores parásitos que atacan a hombres y animales; plagas de insectos del orden Siphonoptera que incluyen la pulga de la rata oriental
- 25 (*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. Plagas de artrópodos adicionales contempladas incluyen: arañas del orden Araneae tales como la araña solitaria marrón (*Loxosceles reclusa* Gertsch & Mulaik) y la viuda negra (*Latrodectus mactans* Fabricius), y centípedos del orden
- 30 Scutigleromorpha tales como ciempiés casero (*Scutigera coleoptrata* Linnaeus). Los compuestos de la presente invención también tienen actividad sobre miembros de las clases Nematoda, Cestoda, Trematoda y Acanthocephala que incluyen miembros económicamente importantes de los órdenes Strongylida, Ascaridida, Oxyurida, Rhabditida, Spirurida y Enoplida tales como, pero no limitadas a, plagas agrícolas importantes desde el punto de vista económico (es decir nematodos de los nudos radicales del género *Meloidogyne*, nematodos de lesiones del género
- 35 *Pratylenchus*, nematodos de las raíces cortas del género *Trichodorus*, etc.) y plagas importantes para la salud animal y humana (es decir, todos los trematodos, tenias y gusanos redondos importantes desde el punto de vista económico, 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.).
- 40 Los compuestos de la invención son activos contra plagas del orden Lepidoptera (por ejemplo, *Alabama argillacea* Hübner (gusano de la hoja del maíz), *Archips argyrospila* Walker (enrollador de las hojas de los frutales), *A. rosana* Linnaeus (enrollador de las hojas europeo) y otras especies del género *Archips*, *Chilo suppressalis* Walker (perforador del tallo del arroz), *Cnaphalocrosis medinalis* Guenée (enrollador de las hojas del arroz), *Crambus caliginosellus* Clemens (oruga de la raíz del maíz), *Crambus teterrellus* Zincken (oruga del césped), *Cydia pomonella* Linnaeus (polilla de la manzana), *Earias insulana* Boisduval (oruga espinosa del algodón), *Earias vittella* Fabricius (gusano moteado), *Helicoverpa armigera* Hübner (oruga americana), *Helicoverpa zea* Boddie (gusano del maíz), *Heliothis virescens* Fabricius (gusano del tabaco), *Herpetogramma licarsisalis* Walker (gusano del césped), *Lobesia botrana* Denis & Schiffermüller (polilla de los racimos de uvas), *Pectinophora gossypiella* Saunders (gusano rosa), *Phyllocnistis citrella* Stainton (minador de las hojas de los cítricos), *Pieris brassicae* Linnaeus (mariposa de la col),
- 50 *Pieris rapae* Linnaeus (blanquita de la col), *Plutella xylostella* Linnaeus (palomilla de dorso de diamante), *Spodoptera exigua* Hübner (gusano soldado), *Spodoptera litura* Fabricius (gusano gris del tabaco, oruga del racimo), *Spodoptera frugiperda* J. E. Smith (gusano cogollero del maíz), *Trichoplusia ni* Hübner (gusano medidor de la col) y *Tuta absoluta* Meyrick (minador de las hojas del tomate)).
- Los compuestos de la invención también tienen una actividad sobre miembros del orden Homoptera que incluyen:
- 55 *Acyrtisiphon pisum* Harris (pulgón del guisante), *Aphis craccivora* Koch (pulgón negro de la alfalfa), *Aphis fabae* Scopoli (pulgón negro de las leguminosas), *Aphis gossypii* Glover (pulgón del algodón, pulgón del melón), *Aphis pomi* De Geer (pulgón de la manzana), *Aphis spiraecola* Patch (pulgón verde del naranjo), *Aulacorthum solani* Kaltenbach (pulgón de la dedalera), *Chaetosiphon fragaefolii* Cockerell (pulgón de la fresa), *Diuraphis noxia* Kurdjumov/Mordvilko (pulgón ruso del trigo), *Dysaphis plantaginea* Paaserini (pulgón rosado del manzano), *Eriosoma lanigerum* Hausmann (pulgón lanífero), *Hyalopterus pruni* Geoffroy (pulgón harinoso del ciruelo), *Lipaphis erysimi* Kaltenbach (pulgón del nabo), *Metopolophium dirrhodum* Walker (pulgón de los cereales), *Macrosiphum euphorbiae* Thomas (pulgón de la patata), *Myzus persicae* Sulzer (pulgón de la patata y el melocotonero, pulgón verde del melocotonero), *Nasonovia ribisnigri* Mosley (pulgón de la lechuga), *Pemphigus* spp. (pulgones de las raíces y pulgones de las agallas), *Rhopalosiphum maidis* Fitch (pulgón de la hoja del maíz), *Rhopalosiphum padi*

Linnaeus (pulgón de la avena), *Schizafis graminum* Rondani (pulgón verde de los cereales), *Sitobion avenae* Fabricius (pulgón inglés del grano), *Therioaphis maculata* Buckton (pulgón moteado de la alfalfa), *Toxoptera aurantii* Boyer de Fonscolombe (pulgón negro de los cítricos) y *Toxoptera citricida* Kirkaldy (pulgón pardo de los cítricos); *Adelges* spp. (adélgidos); *Phylloxera devastatrix* Pergande (filoxera de los pécanos); *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), *Nilaparata 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); *Magiceda 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), *Euschistus 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 pulguilla del algodón). Otros órdenes de insectos controlados por los compuestos de la invención incluyen Thysanoptera (por ejemplo, *Frankliniella occidentalis* Pergande (trips occidental de las flores), *Scirtothrips citri* Moulton (trips de los cítricos), *Sericothrips variabilis* Beach (trips de la soja) y *Thrips tabaci* Lindeman (trips de la cebolla); y el orden Coleoptera (por ejemplo, *Leptinotarsa decemlineata* Say (escarabajo de la patata de colorado), *Epilachna varivestis* Mulsant (escarabajo del frijol) y gusanos alambre del género *Agriotes*, *Athous* o *Limonius*).

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 el saltahojas de la patata (*Empoasca fabae*). Es de interés el uso de compuestos de esta invención para controlar la polilla de dorso de diamante (*Plutella xylostella*). Es de interés el uso de compuestos de esta invención para controlar al cogollero del maíz (*Spodoptera frugiperda*).

Los compuestos de esta invención también pueden mezclarse con uno o más de otros compuestos o agentes biológicamente activos que incluyen insecticidas, fungicidas, nematocidas, bactericidas, acaricidas, herbicidas, protectores de herbicidas, reguladores del crecimiento tales como inhibidores de la muda de los insectos y estimulantes de raíces, esterilizantes químicos, semioquímicos, repelentes, atrayentes, feromonas, estimulantes de la alimentación, otros compuestos biológicamente activos o bacterias virus u hongos entomopatogénicos para formar un pesticida multi-componente que proporciona un espectro incluso más amplio de utilidad agrícola o 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 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 tensioactivos, diluyentes sólidos o diluyentes líquidos. 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.

Otros compuestos o agentes biológicamente activos útiles en las composiciones de la presente invención pueden seleccionarse de agentes de control de plagas de invertebrados que tienen un diferente modo de acción o una clase química diferente que incluye 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 cloruro regulado por GABA (ácido γ -aminobutírico), mímicos de hormona juvenil, inhibidores de la biosíntesis de lípidos y agentes biológicos que incluyen virus nucleopolihedro (NPV), miembros de *Bacillus thuringiensis*, delta-endotoxinas encapsuladas de *Bacillus thuringiensis*, y otros virus insecticidas que se dan de forma natural o modificados genéticamente.

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.

Ejemplos de dichos compuestos o agentes biológicamente activos con los que pueden formularse los compuestos de esta invención son: insecticidas tales como abamectina, acefato, acetamiprida, acetoprol, amidoflumet (S-1955), avermectina, azadiractina, azinfos-metilo, bifentrina, bifenazato, bistriflurona, buprofezina, carbofurano, cartap, clorfenapir, clorfluazurona, cloranttrniliprol (DPX-E2Y45), clorpirifos, clorpirifos-metilo, cromafenozida, clotianidina, ciflumetofeno, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, gamma-cihalotrina, lambda-cihalotrina, cipermetrina, ciromazina, deltametrina, diafenthiurona, diazinona, dieldrina, diflubenzurona, dimeflutrina, dimetoato, dinotefurano, diofenolano, emamectina, endosulfano, esfenvalerato, etiprol, fenotiocarb, fenoxicarb, fenpropatrina, fenvalerato, fipronilo, flonicamida, flubendiamida, flucitrinato, tau-fluvalinato, flufenimer (UR-50701), flufenoxurona, fonofos, halofenozida, hexaflumurona, hidrametilona, imidacloprid, indoxacarb, isofenfos, lufenurona, malationa, metaflumizida, metaldehído, metamidofos, metidationa, metomilo, metopreno, metoxiclor, metoflutrina, monocrotofos, metoxifenozida, monocrotofos, nitenpiram, nitiazina, novalurona, noviflumurona (XDE-007), oxamilo, paratión, paratión-metilo, permectrina, forato, fosadona, fosmet, fosfamidona, pirimicarb, profenofos, proflutrina, protrifenbute, pimetrozina, pirafuprol, piretrina, piridililo, pirifluquinazona, piriprol, piriproxifeno, rotenona, rianodina, espinetoram, espinosad, espiroclorfen, 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, aldimorf, amisulbrom, azaconazol, azoxistrobina, benalaxilo, benomilo, bentiavalicarb, bentiavalicarb-isopropilo, binomial, bifenilo, biteranol, blastidina-S, mezcla de Bordeaux (sulfato tribásico de cobre), boscalida/nicobifeno, bromuconazol, bupirimato, butiobato, carboxina, carpropamid, captafol, captano, carbendazim, cloroneb, clorotalonilo, clozolinato, clotrimazol, oxicloruro 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, dimoxistrobina, diniconazol, diniconazol-M, dinocap, discostrobina, ditianona, dodomorfo, dodina, econazol, etaconazol, edifenfos, epoxiconazol, etaboxam, etirimol, etridiazol, famoxadona, fenamidona, fenarimol, fenbuconazol, fencaramid, fenfuram, fenhexamida, fenoxanilo, fenpiclonilo, fenpropidina, fenpropimorfo, acetato de fentina, hidróxido de fentina, ferbam, ferfurazoato, ferimzona, fluazinam, fludioxonilo, flumetover, fluopicolida, fluoxastrobina, fluquinconazol, fluquinconazol, flusilazol, flusulfamida, flutolanilo, flutriafo, folpet, fosetil-aluminio, fuberidazol, furalaxilo, furametapir, hexaconazol, himexazol, guazatina, imazalilo, imibenconazol, iminocadina, iodicarb, ipconazol, iprobenfos, iprodiona, iprovalicarb, isoconazol, isoprotiolano, kasugamicina, kresoxim-metilo, mancozeb, mandipropamida, maneb, mapanipirina, mefenoxam, mepronilo, metalaxilo, metconazol, metasulfocarb, metiram, metominostrobina/fenominostrobina, mepanipirima, metrafenona, miconazol, miclobutanilo, neo-asozina (metanoarseniato férrico), nuarimol, octilina, ofurace, orisastrobina, oxadixilo, ácido oxolinico, oxpoconazol, oxicarboxina, paclobutrazol, penconazol, penciclorona, pentiopirad, perfurazoato, ácido fosfónico, ftalida, picobenzamida, picoxistrobina, polioxina, probenazol, procloraz, procimidona, propamocarb, propamocarb-hidrocloreto, propiconazol, propineb, proquinazid, protioconazol, piraclostrobina, priazofos, pirifenox, pirimetanilo, pirifenox, pirrolnitrina, piroquilona, quinconazol, quinoxifeno, quintozeno, siltiofam, simeconazol, espiroxamina, estreptomycin, azufre, tebuconazol, tecrazeno, tecloftalam, tecnazeno, tetraconazol, tiabendazol, tifulazamida, tiofanato, tiofanato-metilo, tiram, tiadinilo, tolclofos-metilo, tolifluanid, triadimefona, triadimenol, triarimol, triazóxido, tridemorfo, trimopramida, tricloclazol, trifloxistrobina, triforina, triticonazol, uniconazol, validamicina, vinclozolina, zinab, ziram y zoxamida; nematocidas tales como aldicarb, imiciafos, oxamilo y fenamifos; bactericidas tales como estreptomycin; acaricidas tales como amitraz, quinometionato, clorobencilato, cihexatina, dicofol, dienoclor, etoxazol, fenazaquina, óxido de fenbutatina, fenpropatrina, 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 pueden aplicarse 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 toxinas expresadas.

Referencias generales para 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.

Es de destacar 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, acetamiprid, acetoprol, aldicarb, amidoflumet, amitraz, avermectina, azadiractina, azinfos-metilo, bifentrina, bifenazato, bistriflurona, buprofezina, carbofurano, cartap, quinometionato clorfenapir, clorfluazurona, cloranttrniliprol, clorpirifos, clorpirifos-metilo, clorobencilato, cromafenozida, clotianidina, ciflumetofeno, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, gamma-

cihalotrina, lambda-cihalotrina, cihexatina, cipermetrina, ciromazina, deltametrina, diafentiurona, diazinona, dicofol, dieldrina, dienocloro, diflubenzurona, dimeflutrina, dimetoato, dinotefurano, diofenolano, emamectina, endosulfano, esfenvalerato, etiprol, etoxazol, fenamifos, fenazaquina, óxido de fenbutatina, fenotiocarb, fenoxicarb, fenpropatrina, fenpiroximato, fenvalerato, fipronilo, flonicamida, flubendiamida, flucitrinato, tau-fluvalinato, flufenimer, flufenoxurona, fonofos, halofenozida, hexaflumurona, hexitiazox, hidrametilnona, imiciafos, imidacloprid, indoxacarb, isofenfos, lufenurona, malationa, metaflumizona, metaldehído, metamidofos, metidationa, metomilo, metopreno, metoxicloro, metoxifenozida, metoflutrina, monocrotofos, nitenpiram, nitiazina, novalurona, noviflumurona, oxamilo, parationa, parationa-metilo, permetrina, forato, fosadona, fosmet, fosfamidon, pirimicarb, profenofos, proflutrina, propargita, protrifenbuta, pimetrozina, pirafluprol, piretrina, piridabeno, piridililo, pirifluquinazona, piriprol, piriproxifeno, rotenona, rianodina, espinetoram, espinosad, espiroclorfen, espiromesifeno, espirotetramato, sulprofos, tebufenozida, tebufenpirad, teflubenzurona, teflutrina, terbufos, tetraclorvinfos, tiacloprid, tiametoxam, tiocarb, tiosultap-sodio, tolfenpirad, tralometrina, triazamato, triclorfona, triflumurona, *Bacillus thuringiensis* subesp. *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subesp. *kurstaki*, nucleopolihedrovirus, delta-endotoxinas encapsuladas de *Bacillus thuringiensis*, baculovirus, bacterias entomopatógenas, virus entomopatógenos y hongos entomopatógenos. El compuesto 3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-N-[4-ciano-2-metil-6-[(metilamino)carbonil]fenil]-1H-pirazol-5-carboxamida puede estar incluido en el grupo de insecticidas enumerados anteriormente y es un compuesto a tener en cuenta como un compañero de mezcla.

También es de destacar 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, clorfantraniliprol, clorfenapir, clorpirifos, clotianidina, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, lambda-cihalotrina, cipermetrina, ciromazina, deltametrina, dieldrina, dinotefurano, diofenolano, emamectina, endosulfano, esfenvalerato, etiprol, fenotiocarb, fenoxicarb, fenvalerato, fipronilo, flonicamid, flubendiamida, flufenoxurona, hexaflumurona, hidrametilnona, imidacloprid, indoxacarb, lufenurona, metaflumizona, metomilo, metopreno, metoxifenozida, nitenpiram, nitiazina, novalurona, oxamilo, pimetrozina, piretrina, piridabeno, piridililo, piriproxifeno, rianodina, espinetoram, espinosad, espiroclorfen, espiromesifeno, tebufenozida, tiacloprid, tiametoxam, tiocarb, tiosultap-sodio, tralometrina, triazamato, triflumurona, *Bacillus thuringiensis* subesp. *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subesp. *kurstaki*, nucleopolihedrovirus y delta-endotoxinas encapsuladas de *Bacillus thuringiensis*. El compuesto 3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-N-[4-ciano-2-metil-6-[(metilamino)carbonil]fenil]-1H-pirazol-5-carboxamida puede estar incluido en el grupo de compuestos o agentes biológicamente activos adicionales enumerados anteriormente y es un compuesto a tener en cuenta como un compañero de mezcla.

Para realizaciones donde se usan uno o más de estos compañeros de mezcla diversos, la relación en peso de estos compañeros de mezcla diversos (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. De particular interés es dicha combinación donde el otro ingrediente activo para el control de plagas de invertebrados tiene 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 otro ingrediente activo para el control de plagas de invertebrados que tenga un espectro de control similar aunque un diferente sitio de acción. Así, una composición de la presente invención puede comprender además una cantidad biológicamente eficaz de al menos un ingrediente activo para el control de plagas de invertebrados adicional que tiene un espectro de control similar aunque un sitio de acción diferente. Poner en contacto una planta modificada genéticamente para expresar un compuesto de plagas de invertebrados (por ejemplo, proteína) o el locus 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 las combinaciones específicas de un compuesto de Fórmula 1 con otros agentes para el control de plagas de invertebrados ilustrativas de la mezclas, composiciones y métodos de la presente invención. La primera columna de la Tabla A enumera los agentes para el 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(ciones) de intervalos de relaciones en peso para las relaciones a las que el agente para el control de plagas de invertebrados puede aplicarse respecto a un compuesto de Fórmula 1, un *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.

Tabla A

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

Agente para el Control de Plagas de Invertebrados	Modo de Acción o Clase Química	Relación en Peso Típica
Flonicamida		200:1 a 1:100
Flubendiamida	ligandos del receptor de rianodina	100:1 a 1:120
Flufenoxurona	inhibidores de la síntesis de quitina	200:1 a 1:100
Hexaflumurona	inhibidores de la síntesis de quitina	300:1 a 1:50
Hidrametilnona	inhibidores del transporte de electrones mitocondriales	150:1 a 1:250
Imidacloprid	neonicotinoides	1000:1 a 1:1000
Indoxacarb	moduladores del canal de sodio	200:1 a 1:50
Lambda-cihalotrina	moduladores del canal de sodio	50:1 a 1:250
Lufenurona	inhibidores de la síntesis de quitina	500:1 a 1:250
Metaflumizona		200:1 a 1:200
Metomilo	inhibidores de la colinesterasa	500:1 a 1:100
Metopreno	mímicos de la hormona juvenil	500:1 a 1:100
Metoxifenoazida	agonistas de ecdisona	50:1 a 1:50
Nitenpiram	neonicotinoides	150:1 a 1:200
Nitiazina	neonicotinoides	150:1 a 1:200
Novalurona	inhibidores de la síntesis de quitina	500:1 a 1:150
Oxamilo	inhibidores de la colinesterasa	200:1 a 1:200
Pimetrozina		200:1 a 1:100
Piretrina	moduladores del canal de sodio	100:1 a 1:10
Piridabeno	inhibidores del transporte de electrones mitocondriales	200:1 a 1:100
Piridalilo		200:1 a 1:100
Piriproxifeno	mímicos de la hormona juvenil	500:1 a 1:100
Rianodina	ligandos del receptor de rianodina	100:1 a 1:120
Espinetoram	lactonas macrocíclicas	150:1 a 1:100
Espinosad	lactonas macrocíclicas	500:1 a 1:10
Espirodiclofeno	inhibidores de la biosíntesis de lípidos	200:1 a 1:200
Espiromesifeno	inhibidores de la biosíntesis de lípidos	200:1 a 1:200
Tebufenozida	agonistas de ecdisona	500:1 a 1:250
Tiacloprid	neonicotinoides	100:1 a 1:200
Tiametoxam	neonicotinoides	1250:1 a 1:1000
Tiodicarb	inhibidores de colinesterasa	500:1 a 1:400
Tiosultap-sodio		150:a 1:100
Tralometrina	moduladores del canal de sodio	150:1 a 1:200
Triazamato	inhibidores de colinesterasa	250:1 a 1:100
Triflumurona	inhibidores de síntesis de quitina	200:1 a 1:100
<i>Bacillus thuringiensis</i>	agentes biológicos	50:1 a 1:10
Delta-endotoxina de <i>Bacillus thuringiensis</i>	agentes biológicos	50:1 a 1:10

Agente para el Control de Plagas de Invertebrados	Modo de Acción o Clase Química	Relación en Peso Típica
NPV (por ejemplo, Gemstar)	agentes biológicos	50:1 a 1:10

El compuesto 3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-N-[4-ciano-2-metil-6-[(metilamino)-carbonil]fenil]-1H-pirazol-5-carboxamida puede incluirse como un "Agente de Control de Plagas de Invertebrados" en la Tabla A anterior. El "Modo de Acción o Clase Química" para este compuesto es "ligandos de receptor rianodina" y la "Relación Típica de Peso" de este compuesto es 100:1 a 1:120.

- 5 Una realización de agentes para el 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 quitina tales como buprofezina, ciromazina, flufenoxurona, hexaflumurona, lufenurona, novalurona, noviflumurona y triflumurona; 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, metoxifenoazida 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 espiroclodifeno y espiromesifeno; insecticidas de ciclodieno tales como dieldrina; ciflumetofeno; fenotiocarb; flonicamid; metaflumizona; pirafuprol; piridalilo; piriprol; pimetozina; 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 MPV7; además de insecticidas virales 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.

- 30 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.

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

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
A-1	1	y	Abamectina	B-1	2	y	Abamectina
A-2	1	y	Acetamiprid	B-2	2	y	Acetamiprid
A-3	1	y	Amitraz	B-3	2	y	Amitraz
A-4	1	y	Avermectina	B-4	2	y	Avermectina
A-5	1	y	Azadiractina	B-5	2	y	Azadiractina
A-6	1	y	Beta-ciflutrina	B-6	2	y	Beta-ciflutrina
A-7	1	y	Bifentrina	B-7	2	y	Bifentrina
A-8	1	y	Buprofezina	B-8	2	y	Buprofezina
A-9	1	y	Cartap	B-9	2	y	Cartap
A-10	1	y	Clorantraniliprol	B-10	2	y	Clorantraniliprol
A-11	1	y	Clorfenapir	B-11	2	y	Clorfenapir

Mezcla Núm.	Comp. Núm.	y	Agente de Control de Plagas de Invertebrados	Mezcla Núm.	Comp. Núm.	y	Agente de Control de Plagas de Invertebrados
A-12	1	y	Clorpirifos	B-12	2	y	Clorpirifos
A-13	1	y	Clotianidina	B-13	2	y	Clotianidina
A-14	1	y	Ciflutrina	B-14	2	y	Ciflutrina
A-15	1	y	Cihalotrina	B-15	2	y	Cihalotrina
A-16	1	y	Cipermetrina	B-16	2	y	Cipermetrina
A-17	1	y	Ciromazina	B-17	2	y	Ciromazina
A-18	1	y	Deltametrina	B-18	2	y	Deltametrina
A-19	1	y	Dieldrina	B-19	2	y	Dieldrina
A-20	1	y	Dinotefurano	B-20	2	y	Dinotefurano
A-21	1	y	Diofenolano	B-21	2	y	Diofenolano
A-22	1	y	Emamectina	B-22	2	y	Emamectina
A-23	1	y	Endosulfano	B-23	2	y	Endosulfano
A-24	1	y	Esfenvalerato	B-24	2	y	Esfenvalerato
A-25	1	y	Etiprol	B-25	2	y	Etiprol
A-26	1	y	Fenotiocarb	B-26	2	y	Fenotiocarb
A-27	1	y	Fenoxicarb	B-27	2	y	Fenoxicarb
A-28	1	y	Fenvalerato	B-28	2	y	Fenvalerato
A-29	1	y	Fipronilo	B-29	2	y	Fipronilo
A-30	1	y	Flonicamida	B-30	2	y	Flonicamida
A-31	1	y	Flubendiamida	B-31	2	y	Flubendiamida
A-32	1	y	Flufenoxurona	B-32	2	y	Flufenoxurona
A-33	1	y	Hexaflumurona	B-33	2	y	Hexaflumurona
A-34	1	y	Hidrametilnona	B-34	2	y	Hidrametilnona
A-35	1	y	Imidacloprid	B-35	2	y	Imidacloprid
A-36	1	y	Indoxacarb	B-36	2	y	Indoxacarb
A-37	1	y	Lambda-cihalotrina	B-37	2	y	Lambda-cihalotrina
A-38	1	y	Lufenurona	B-38	2	y	Lufenurona
A-39	1	y	Metaflumizona	B-39	2	y	Metaflumizona
A-40	1	y	Metomilo	B-40	2	y	Metomilo
A-41	1	y	Metopreno	B-41	2	y	Metopreno
A-42	1	y	Metoxifenoazida	B-42	2	y	Metoxifenoazida
A-43	1	y	Nitenpiram	B-43	2	y	Nitenpiram
A-44	1	y	Nitiazina	B-44	2	y	Nitiazina
A-45	1	y	Novalurona	B-45	2	y	Novalurona
A-46	1	y	Oxamilo	B-46	2	y	Oxamilo
A-47	1	y	Pimetrozina	B-47	2	y	Pimetrozina
A-48	1	y	Piretrina	B-48	2	y	Piretrina
A-49	1	y	Piridabeno	B-49	2	y	Piridabeno
A-50	1	y	Piridalilo	B-50	2	y	Piridalilo
A-51	1	y	Piriproxifeno	B-51	2	y	Piriproxifeno

Mezcla Núm.	Comp. Núm.	y	Agente de Control de Plagas de Invertebrados	Mezcla Núm.	Comp. Núm.	y	Agente de Control de Plagas de Invertebrados
A-52	1	y	Rianodina	B-52	2	y	Rianodina
A-53	1	y	Espinetoram	B-53	2	y	Espinetoram
A-54	1	y	Espinosad	B-54	2	y	Espinosad
A-55	1	y	Espiroidiclofeno	B-55	2	y	Espiroidiclofeno
A-56	1	y	Espiromesifeno	B-56	2	y	Espiromesifeno
A-57	1	y	Tebufenozida	B-57	2	y	Tebufenozida
A-58	1	y	Tiacloprid	B-58	2	y	Tiacloprid
A-59	1	y	Tiametoxam	B-59	2	y	Tiametoxam
A-60	1	y	Tiodicarb	B-60	2	y	Tiodicarb
A-61	1	y	Tiosultap-sodio	B-61	2	y	Tiosultap-sodio
A-62	1	y	Tralometrina	B-62	2	y	Tralometrina
A-63	1	y	Triazamato	B-63	2	y	Triazamato
A-64	1	y	Triflumurona	B-64	2	y	Triflumurona
A-65	1	y	<i>Bacillus thuringiensis</i>	B-65	2	y	<i>Bacillus thuringiensis</i>
A-66	1	y	Delta-endotoxina de <i>Bacillus thuringiensis</i>	B-66	2	y	Delta-endotoxina de <i>Bacillus thuringiensis</i>
A-67	1	y	NPV (por ejemplo, Gemstar)	B-67	2	y	NPV (por ejemplo, Gemstar)
C-1	5	y	Abamectina	D-1	6	y	Abamectina
C-2	5	y	Acetamiprid	D-2	6	y	Acetamiprid
C-3	5	y	Amitraz	D-3	6	y	Amitraz
C-4	5	y	Avermectina	D-4	6	y	Avermectina
C-5	5	y	Azadiractina	D-5	6	y	Azadiractina
C-6	5	y	Beta-ciflutrina	D-6	6	y	Beta-ciflutrina
C-7	5	y	Bifentrina	D-7	6	y	Bifentrina
C-8	5	y	Buprofezina	D-8	6	y	Buprofezina
C-9	5	y	Cartap	D-9	6	y	Cartap
C-10	5	y	Clorantraniliprol	D-10	6	y	Clorantraniliprol
C-11	5	y	Clorfenapir	D-11	6	y	Clorfenapir
C-12	5	y	Clorpirifos	D-12	6	y	Clorpirifos
C-13	5	y	Clotianidina	D-13	6	y	Clotianidina
C-14	5	y	Ciflutrina	D-14	6	y	Ciflutrina
C-15	5	y	Cihalotrina	D-15	6	y	Cihalotrina
C-16	5	y	Cipermetrina	D-16	6	y	Cipermetrina
C-17	5	y	Ciromazina	D-17	6	y	Ciromazina
C-18	5	y	Deltametrina	D-18	6	y	Deltametrina
C-19	5	y	Dieldrina	D-19	6	y	Dieldrina
C-20	5	y	Dinotefurano	D-20	6	y	Dinotefurano
C-21	5	y	Diofenolano	D-21	6	y	Diofenolano
C-22	5	y	Emamectina	D-22	6	y	Emamectina

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-23	5	y	Endosulfano	D-23	6	y	Endosulfano
C-24	5	y	Esfenvalerato	D-24	6	y	Esfenvalerato
C-25	5	y	Etiprol	D-25	6	y	Etiprol
C-26	5	y	Fenotiocarb	D-26	6	y	Fenotiocarb
C-27	5	y	Fenoxicarb	D-27	6	y	Fenoxicarb
C-28	5	y	Fenvalerato	D-28	6	y	Fenvalerato
C-29	5	y	Fipronilo	D-29	6	y	Fipronilo
C-30	5	y	Flonicamida	D-30	6	y	Flonicamida
C-31	5	y	Flubendiamida	D-31	6	y	Flubendiamida
C-32	5	y	Flufenoxurona	D-32	6	y	Flufenoxurona
C-33	5	y	Hexaflumurona	D-33	6	y	Hexaflumurona
C-34	5	y	Hidrametilnona	D-34	6	y	Hidrametilnona
C-35	5	y	Imidacloprid	D-35	6	y	Imidacloprid
C-36	5	y	Indoxacarb	D-36	6	y	Indoxacarb
C-37	5	y	Lambda-cihalotrina	D-37	6	y	Lambda-cihalotrina
C-38	5	y	Lufenurona	D-38	6	y	Lufenurona
C-39	5	y	Metaflumizona	D-39	6	y	Metaflumizona
C-40	5	y	Metomilo	D-40	6	y	Metomilo
C-41	5	y	Metopreno	D-41	6	y	Metopreno
C-42	5	y	Metoxifenoazida	D-42	6	y	Metoxifenoazida
C-43	5	y	Nitenpiram	D-43	6	y	Nitenpiram
C-44	5	y	Nitiazina	D-44	6	y	Nitiazina
C-45	5	y	Novalurona	D-45	6	y	Novalurona
C-46	5	y	Oxamilo	D-46	6	y	Oxamilo
C-47	5	y	Pimetrozina	D-47	6	y	Pimetrozina
C-48	5	y	Piretrina	D-48	6	y	Piretrina
C-49	5	y	Piridabeno	D-49	6	y	Piridabeno
C-50	5	y	Piridalilo	D-50	6	y	Piridalilo
C-51	5	y	Piriproxifeno	D-51	6	y	Piriproxifeno
C-52	5	y	Rianodina	D-52	6	y	Rianodina
C-53	5	y	Espinetoram	D-53	6	y	Espinetoram
C-54	5	y	Espinosad	D-54	6	y	Espinosad
C-55	5	y	Espirodiclofeno	D-55	6	y	Espirodiclofeno
C-56	5	y	Espiromesifeno	D-56	6	y	Espiromesifeno
C-57	5	y	Tebufenozida	D-57	6	y	Tebufenozida
C-58	5	y	Tiacloprid	D-58	6	y	Tiacloprid
C-59	5	y	Tiametoxam	D-59	6	y	Tiametoxam
C-60	5	y	Tiodicarb	D-60	6	y	Tiodicarb
C-61	5	y	Tiosultap-sodio	D-61	6	y	Tiosultap-sodio
C-62	5	y	Tralometrina	D-62	6	y	Tralometrina

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-63	5	y	Triazamato	D-63	6	y	Triazamato
C-64	5	y	Triflumurona	D-64	6	y	Triflumurona
C-65	5	y	<i>Bacillus thuringiensis</i>	D-65	6	y	<i>Bacillus thuringiensis</i>
C-66	5	y	Delta-endotoxina de <i>Bacillus thuringiensis</i>	D-66	6	y	Delta-endotoxina de <i>Bacillus thuringiensis</i>
C-67	5	y	NPV (por ejemplo, Gemstar)	D-67	6	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 El compuesto 3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-N-[4-ciano-2-metil-6-[(metilamino)carbonil]fenil]-1H-pirazol-5-carboxamida puede incluirse como un "Agente de Control de Plagas de Invertebrados" en la Tabla B anterior y mezclarse con los Compuestos 1, 2, 5 y 6, como "Mezcla Núm." A-68, B-68, C-68 y D-68 respectivamente. Estas mezclas específicas combinan típicamente el compuesto de Fórmula 1 con este compuesto en la relación de 100:1 a 1:120.

10 Las plagas de invertebrados se controlan en aplicaciones agronómicas y no agronómicas aplicando 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 locus agronómico y/o no agronómico de infestación, al área a proteger o directamente sobre la plaga a controlar.

15 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.

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.

25 Un método de contacto es por pulverización. Como 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 suministrar también de forma eficaz a través de la absorción de la planta, poniendo en contacto la planta con una composición que comprende un compuesto de esta invención aplicado como un empapado de una formulación líquida en el suelo, de 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 digno de mención este método en donde el entorno es el suelo y la composición se aplica al suelo como una formulación de empape del suelo. Es de interés adicional que los compuestos de esta invención también son eficaces por aplicación localizada al locus 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, microencapsulados, absorciones 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 pueden impregnarse en materiales para fabricar dispositivos de control de invertebrados (por ejemplo, redes para insectos).

45 Los compuestos de esta invención también son útiles en tratamiento de semillas para proteger las semillas de plagas de invertebrados. En el contexto de la presente descripción y reivindicaciones, el tratamiento de 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 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 del follaje por translocación del compuesto de esta invención o un segundo ingrediente activo dentro de la planta en desarrollo. Pueden aplicarse tratamientos de semilla 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. Por lo tanto, una composición de recubrimiento de semilla de la presente invención comprende típicamente una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido o una sal del mismo, y un formador de película o un agente adhesivo. La semilla puede recubrirse por pulverización de un concentrado en suspensión fluida directamente en un lecho de volteo de semillas y luego secando las semillas. De forma alternativa, pueden pulverizarse otros tipos de formulación tales como polvos humectados, disoluciones, suspoemulsiones, concentrados emulsificables y emulsiones en agua sobre 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. Kusters 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 pueden incorporarse en una composición cebo que se consume por una plaga de invertebrados o se usa en un dispositivo tales como una trampa, estación 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. Es 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 índices de aplicación muy bajos, particularmente con dosis del ingrediente activo que son letales por 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 otro componente de animales o plantas, feromonas u otros agentes conocidos por atraer a una plaga objetivo de invertebrados. Ejemplos de humectantes, es decir, agentes que retienen la humedad, son glicoles y otros polioles, glicerina y sorbitol. Es de interés una composición cebo (y un método que utiliza dicha composición cebo) usada para controlar al menos una plaga de invertebrados seleccionada del grupo que consiste en hormigas, termitas y cucarachas. Un dispositivo para controlar una plaga de invertebrados puede comprender la presente composición cebo y una carcasa adaptada para alojar 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 potencial o conocida actividad para la plaga de invertebrados.

Los compuestos de esta invención pueden aplicarse sin otros adyuvantes, pero 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 pulverizar una dispersión acuosa o disolución oleosa refinada del 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 pulverización tales como una lata, una botella u otro envase, tanto por medio de una bomba como liberándolo de un envase presurizado, por ejemplo, una lata presurizada de un pulverizador de aerosol. Dichas composiciones de pulverización pueden tomar varias formas, por ejemplo, pulverizaciones, neblinas, espumas, humos o nieblas. Dichas composiciones de pulverización pueden así comprender además propulsores, agentes espumantes, etc. según sea el caso. Es de interés una composición de pulverización que comprende una cantidad

biológicamente efectiva de un compuesto o una composición de la presente invención y un vehículo. Una composición de pulverización tal comprende una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto o una composición de la presente invención y un propulsor. Propulsores representativos incluyen, aunque no se limitan a, metano, etano, propano, butano, isobutano, buteno, pentano, isopentano, neopentano, penteno, hidrof fluorocarbonos, clorofluorocarbonos, dimetiléter, y 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, vespulas, 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 particularmente, un vertebrado homeotérmico (por ejemplo, mamífero o ave) y lo más particularmente un mamífero, de una plaga parasitaria de invertebrados 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 una cantidad parasiticidamente eficaz de un compuesto de la invención para usar en la protección de un animal. Tal como se menciona en la presente descripción y reivindicaciones, los términos "parasitida" y "parasiticidamente" hace referencia a efectos observables en una plaga parasitaria de invertebrados para proporcionar protección a un animal de la plaga. Los efectos parasitidas se refieren típicamente a la reducción de la presencia o la actividad de la plaga parasitaria de invertebrados diana. Estos efectos sobre la plaga incluyen necrosis, muerte, crecimiento retardado, movilidad reducida o menor capacidad de permanecer sobre o dentro del animal huésped, menor alimentación e inhibición de la reproducción. Estos efectos sobre plagas parasitarias de invertebrados proporcionan el control (incluyendo prevención, reducción o eliminación) de la infestación parasitaria o la infección del animal. Ejemplos de plagas parasitarias de invertebrados 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 (helminths, por ejemplo, nematodos, trematodos, cestodos, acantocefalanos, 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 equine*, *Gastrophilus intestinalis*, *Gastrophilus haemorrhoidalis* y *Gastrophilus nasalis*; pulgas tales como *Bovicola (Damalinia) bovis*, *Bovicola equi*, *Haematopinus asini*, *Felicola subrostratus*, *Heterodoxus spiniger*, *Lignonathus setosus* y *Trichodectes canis*; piojos tales como *Melophagus 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, tal como por inyección (incluyendo intramuscular, subcutánea, intravenosa, intraperitoneal) o 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 parasitida según 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 respecto a la ruta pretendida de administración (por ejemplo, administración oral, tópica o parenteral tal como inyección) y de acuerdo con la práctica estándar. Además, un vehículo adecuado se selecciona sobre la base de la compatibilidad con uno o más ingredientes activos en la composición, incluyendo consideraciones tales como estabilidad respecto del 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, puede formularse 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 como se conocen en la técnica de la formulación farmacéutica.

Para la administración oral en forma de 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, puede formularse un compuesto de la presente invención con aglutinantes/rellenos conocidos en la técnica por ser apropiados 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, ceína, gelatina), y polímeros sintéticos (por ejemplo, poli(alcohol de vinilo), 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 parasiticidamente activos, 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 que proporcionan disponibilidad sistémica a partir 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 de invertebrados 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 adecuados para la 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 típicamente 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"), el ingrediente activo migra sobre la superficie del animal para cubrir la mayor parte o toda su área superficial externa. Como resultado, el animal tratado está particularmente protegido de plagas de invertebrados que se alimentan de la epidermis del animal tales como pulgas, garrapatas y piojos. Por lo tanto, 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.

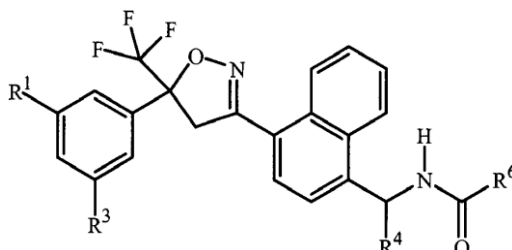
El índice de aplicación necesario para un control eficaz (es decir, "cantidad biológicamente eficaz") dependerá de factores tales como la especie de invertebrado a controlar, el ciclo de vida de la plaga, la fase de la vida, su tamaño, localización, momento del año, cultivo o animal hospedador, comportamiento 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 puede necesitarse 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 invertebrados.

En general, para uso veterinario, un compuesto de Fórmula 1, un N-óxido o una sal del mismo, se administra en una cantidad parasiticidamente efectiva a un animal a proteger de plagas parasitarias de invertebrados. 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 invertebrados diana. Un experto en la técnica apreciará que la dosis parasitariamente eficaz puede variar para los diversos compuestos y composiciones de la presente invención, el efecto parasitario deseado y duración, la especie de plaga de invertebrados 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 homotérmicos, 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 Los Ensayos siguientes se espera que demuestren la eficacia de control de compuestos de esta invención en plagas específicas. La "eficacia del control" representa la inhibición del desarrollo de la plaga de invertebrados (que incluye 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 Índice A y B para descripciones de compuesto. La abreviatura "Ej." representa "Ejemplo" y va seguida de un número que indica en qué Ejemplo de Síntesis se prepara el compuesto.

TABLA DE ÍNDICE A



Comp. Núm.	R ¹	R ³	R ⁴	R ⁶	p.f. (°C)
1 (Ej. 1)	Cl	Cl	H	ciclopropilo	**
2	Cl	Cl	H	isopropilo	*
3	Cl	Cl	ciano	ciclopropilo	*
4	CF ₃	CF ₃	CH ₃	isopropilo	*
5	Cl	CF ₃	H	isopropilo	*
6	Cl	CF ₃	H	ciclopropilo	*
7	CF ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CF ₃	*
8	CF ₃	CF ₃	CH ₃	CH(CF ₃) ₂	*
9	CF ₃	CF ₃	CH ₃	CF ₂ CF ₃	*

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

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

TABLA DE ÍNDICE B

Comp. Núm.	Datos de ¹ H RMN (disolución de CDCl ₃ a menos que se indique otra cosa) ^a
2	δ 8,88 (d, 1H), 8,06 (d, 1H), 7,65 (m, 2H), 7,56 (s, 2H), 7,45 (m, 3H), 5,78 (br s, 1H), 4,89 (d, 2H), 4,26 (d, 1H), 3,88 (d, 1H), 2,40 (m, 1H), 1,18 (d, 6H).
3	δ 8,89 (m, 1H), 7,91 (m, 2H), 7,68 (m, 2H), 7,55 (m, 3H), 7,46 (s, 1H), 6,81 (d, 1H), 6,26 (m, 1H), 4,26 (dd, 1H), 3,91 (dd, 1H), 1,33 (m, 1H), 1,11 (m, 2H), 0,84 (m, 2H).
4	(CD ₃ C(O)CD ₃) δ 9,0 (d, 1H), 8,3 (s, 2H), 8,25-8,3 (m, 2H), 7,85 (m, 2H), 7,6-7,7 (m, 2H), 5,7 (br m, 1H), 4,73 (d, 1H), 4,62 (d, 1H), 4,55 (m, 1H), 2,7 (m, 1H), 1,57 (t, 3H), 1,2 (d, 6H).
5	δ 8,84 (d, 1H), 7,97 (d, 1H), 7,87 (s, 1H), 7,81 (s, 1H), 7,71 (s, 1H), 7,59 (m, 2H), 7,40 (d, 1H), 7,35 (d, 1H), 6,10 (br s, 1H), 4,82 (d, 2H), 4,29 (d, 1H), 3,90 (d, 1H), 2,41 (m, 1H), 1,15 (d, 6H).
6	(CD ₃ C(O)CD ₃) δ 8,95 (d, 1H), 8,18 (d, 1H), 8,08 (s, 1H), 8,03 (s, 1H), 7,94 (s, 1H), 7,84 (br s, 1H), 7,78 (d, 1H), 7,63 (m, 2H), 7,54 (d, 1H), 4,88 (d, 2H), 4,62 (d, 1H), 4,50 (d, 1H), 1,65 (m, 1H), 0,83 (m, 2H), 0,66 (m, 2H).
7	δ 8,9 (d, 1H), 8,15 (s, 2H), 8,1 (m, 1H), 8,0 (s, 1H), 7,55-7,65 (m, 4H), 6,7 (q, 1H), 4,4 (d, 1H), 3,95 (d, 1H), 3,25 (m, 2H), 1,75 (d, 3H). No se observa NH de amida.
8	δ 8,9 (m, 1H), 8,15 (s, 2H), 8,05 (m, 1H), 8,0 (s, 1H), 7,55-7,7 (m, 4H), 6,8 (q, 1H), 4,4 (d, 1H), 4,05 (m, 1H), 3,95 (d, 1H), 1,8 (m, 3H). No se observa NH de amida.
9	δ 8,9 (m, 1H), 8,15 (s, 2H), 8,05 (m, 1H), 8,0 (s, 1H), 7,55-7,7 (m, 4H), 6,85 (q, 1H), 4,4 (d, 1H), 3,95 (d, 1H), 1,85 (m, 3H). No se observa NH de amida.

^a Los datos de ¹H RMN están en ppm campo abajo de tetrametilsilano. Los acoplamiento se designan por (s)-singlete, (d)-doblete, (m)-multiplete y (br s)-singlete ancho.

Ejemplos biológicos de la invención**Ensayo A**

Para evaluar el control de la polilla de dorso de diamante (*Plutella xylostella*), la unidad de ensayo consistió en un pequeño envase abierto con una planta de rábano de 12-14 días en su interior. Ésta se infestó previamente con aproximadamente 50 larvas de neonato que se dispensaron en la unidad de ensayo a través de mazorkas de maíz usando un inoculador de bazooka. Las larvas se movieron a la planta de ensayo después de dispensarse en la unidad de ensayo.

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 alquilarilpolioxietileno, 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 en este ensayo se pulverizaron a 50 ppm, y el ensayo 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 daño de alimentación de la planta se evaluó luego visualmente en base al follaje consumido y también se contó una tasa de mortalidad de la plaga y se calculó para cada unidad de ensayo.

De los compuestos de la fórmula 1 ensayados, los siguientes proporcionaron niveles muy buenos a excelentes de eficacia de control (20% o menos de daño en la alimentación u 80% o más mortalidad): 1, 2, 3, 4, 5 y 6.

Ensayo B

Para evaluar el control del gusano cogollero (*Spodoptera frugiperda*), la unidad de ensayo consistió en un pequeño envase abierto con una planta de maíz de 4-5 días en el 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. Los compuestos de ensayo se formularon y se pulverizaron a 50 ppm como se describe para el Ensayo A, y el ensayo se replicó tres veces. Después de pulverizar, las unidades de ensayo se mantuvieron en una cámara de crecimiento y luego se probó la eficacia de control para cada unidad de ensayo tal como se describe para el ensayo A.

De los compuestos de Fórmula 1 ensayados, los siguientes proporcionaron niveles muy buenos a excelentes de eficacia de control (20% o menos de daño en la alimentación u 80% o más mortalidad): 1, 2, 5 y 6.

Ensayo C

Para evaluar el control del saltahoja de la patata (*Empoasca fabae*) por medios de contacto y/o sistémicos, la unidad de ensayo consistió en un pequeño envase abierto con una planta de judías Soleil de 5-6 días (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. Los compuestos de ensayo se formularon y pulverizaron como se describe para el Ensayo A. Todos los compuestos experimentales en estos ensayos se pulverizaron a 250 ppm, y el ensayo se replicó tres veces. Tras la pulverización, las unidades de ensayo se dejaron secar durante 1 hora antes de que se infestaran posteriormente con 5 saltahoja de la patata (adultos de 18 a 21 días). Se colocó una tapa reticulada negra en la parte superior del cilindro. Se mantuvieron las unidades de ensayo durante 6 días en una cámara de crecimiento a 19-21°C y 50-70% de humedad relativa. La eficacia de control de cada unidad de ensayo se evaluó luego visualmente con la mortalidad de los insectos.

De los compuestos de Fórmula 1 ensayados, los siguientes proporcionaron niveles muy buenos a excelentes de eficacia de control (80% o más mortalidad): 1, 2, 5 y 6.

Ensayo D

Para evaluar el control de la arañuela occidental 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 judía Soleil de 5-7 días en el interior. Los compuestos de ensayo se formularon y pulverizaron como se describe para el Ensayo A. Todos los compuestos experimentales en estos ensayos se pulverizaron a 250 ppm, y el ensayo se replicó tres veces. Después de pulverizar, las unidades de ensayo se dejaron secar durante 1 hora y después se añadieron 22-27 arañuelas adultas a cada unidad y después se colocó en lo alto un tapón reticulado negro. Se mantuvieron las unidades de ensayo durante 6 días a 25°C y 45-55% de humedad relativa. Se evaluó una tasa de mortalidad junto con una tasa de daño en la planta para cada unidad de ensayo.

De los compuestos de Fórmula 1 ensayados, los siguientes proporcionaron niveles muy buenos a excelentes de eficacia de control (20% o menos de daño en la alimentación u 80% o más mortalidad): 3.

Ensayo E

5 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 áfidos en un trozo de hoja extirpada de una planta de cultivo (método del corte de hoja). Las larvas se movieron a la planta cuando el trozo de hoja se secó. Después de la preinfestación, se cubrió el suelo de la unidad de ensayo con una capa de arena.

10 Los compuestos de ensayo se formularon y se pulverizaron como se describe para el Ensayo A. Todos los compuestos experimentales en estos ensayos se pulverizaron a 250 ppm, y el ensayo 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. 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 De los compuestos de Fórmula 1 ensayados, los siguientes proporcionaron niveles muy buenos a excelentes de eficacia de control (80% o más mortalidad): 2 y 5.

Ensayo F

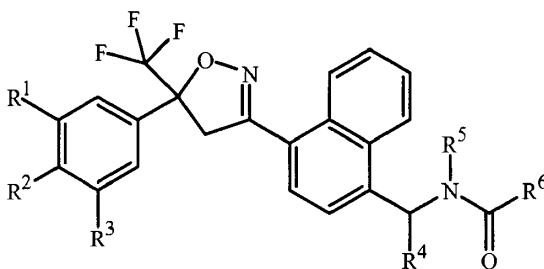
20 Para evaluar el control de la mosca blanca de las hojas plateadas (*Bemisia tabaci*), la unidad de ensayo consistió en una planta de algodón de 14-21 días cultivada en medio Redi-earth® (Scotts Co.) con al menos dos hojas verdaderas infestadas con ninfas de 2ª y 3ª fase en la cara de abajo de las 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 hasta el agotamiento en un pulverizador de mesa giratoria (solicitud de patente europea EP-1110617-A1). Todos los compuestos experimentales en este ensayo se pulverizaron a 250 ppm, y el ensayo se replicó 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.

25 De los compuestos de Fórmula 1 ensayados, los siguientes proporcionaron niveles muy buenos a excelentes de eficacia de control (80% o más mortalidad): 2 y 5.

30 Los compuestos núms. 1 a 9 de la Tabla de Índice A se ensayaron además para el control de saltahojas del maíz (*Peregrinus maidis*) a 250 ppm, aunque ninguno proporcionó el 80% o más de mortalidad.

REIVINDICACIONES

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



1

en la que

- 5 R^1 es halógeno, haloalquilo C_1-C_3 o haloalcoxi C_1-C_3 ;
 R^2 es H, halógeno, ciano, alquilo C_1-C_3 o haloalquilo C_1-C_3 ;
 R^3 es H, halógeno, haloalquilo C_1-C_3 o haloalcoxi C_1-C_3 ;
 R^4 es H, halógeno, ciano, alquilo C_1-C_3 o haloalquilo C_1-C_3 ;
 R^5 es H, CH_3 , alquil C_2-C_7 carbonilo, haloalquil C_2-C_4 carbonilo, alcoxi C_2-C_7 carbonilo o CH_2O (alquilo C_1-C_3);
10 R^6 es grupo alquilo C_1-C_6 sustituido opcionalmente con halógeno, OR^{11} , $S(O)_nR^{12}$ o $NR^{13}C(O)R^{14}$; o
 R^6 es cicloalquilo C_3-C_6 o cicloalquil C_4-C_7 alquilo, cada uno opcionalmente sustituido con 1 a 4 sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, alquilo C_1-C_2 , haloalquilo C_1-C_2 y hasta 1 ciclopropilo; o
 R^6 es $(CH_2)_mQ$; o
 R^6 es OR^8 o $NR^{9a}R^{9b}$;
15 Q es un anillo saturado de 4 a 6 miembros que contiene átomos de carbono y un O o $S(O)_n$ como miembros del anillo y opcionalmente sustituidos con 1 o 2 R^{10} ;
 R^8 es alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 ;
 R^{9a} es alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 o cicloalquilo C_3-C_6 ;
 R^{9b} es H, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 o cicloalquilo C_3-C_6 ;
20 cada R^{10} es independientemente halógeno, ciano o alquilo C_1-C_2 ;
 R^{11} es H, alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 ;
 R^{12} es alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 ;
 R^{13} es H o alquilo C_1-C_4 ;
 R^{14} es alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 o cicloalquilo C_3-C_6 ;
25 m es 0 o 1; y
cada n es independientemente 0, 1 o 2.
2. Un compuesto de la reivindicación 1, en donde:
- R^1 es halógeno o CF_3 ;
 R^2 es H o halógeno; y
30 R^3 es H, halógeno o CF_3 .
3. Un compuesto de la reivindicación 2, en donde:
- R^4 es H, ciano o CH_3 ; y

R⁵ es H.

4. Un compuesto de la reivindicación 3, en donde:

R⁶ es ciclopropilo, isopropilo, CH₂CH₂SCH₃, CF₂CF₃ o CH₂NC(O)CF₃.

5. Una composición que comprende un compuesto de la reivindicación 1 y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos, comprendiendo dicha composición opcionalmente además al menos un compuesto o agente adicional biológicamente activo.

6. Una composición para controlar una plaga de invertebrados que comprende una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto de la reivindicación 1 y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos, comprendiendo también opcionalmente dicha composición una cantidad biológicamente eficaz de al menos un compuesto o agente adicional biológicamente activo.

7. La composición de la Reivindicación 6 en donde al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional se selecciona 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 (GABA), ureas insecticidas y mimicos 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.

8. La composición de la Reivindicación 7 en donde al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional se selecciona del grupo que consiste en abamectina, acefato, acetamiprid, amidoflomet (S-1955), avermectina, azadiractina, azinfos-metilo, bifentrina, bifenazato, 3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-N-[4-ciano-2-metil-6-[(metilamino)-carbonil]fenil]-1H-pirazol-5-carboxamida, buprofezina, carbofurano, cartap, clorfenapir, clorfluazurona, clorpirifos, clorpirifos-metilo, cromafenoazida, clotianidina, ciflometofeno, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, lambda-cihalotrina, cipermetrina, ciromazina, deltametrina, diafentiuirona, 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, metoxifenoazida, nitenpiram, nitiazina, novalurona, noviflumurona (XDE-007), oxamilo, parationa, parationa-metilo, pirimicarb, profenofos, proflutrina, pirimicarb, profenofos, proflutrina, pimetozina, pirafuprol, piretrina, piridialilo, piriprol, piriproxifeno, rotenona, rianodina, espinosad, espiridiclofeno, espiromesifeno (BSN 2060), espirotetramato, sulprofos, tebufenoazida, teflubenzurona, teflutrina, terbufos, tetraclorvinfos, tiacloprid, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap-sodio, tralometrina, triazamato, triclorfona y triflumurona, *Bacillus thuringiensis aizawai*, *Bacillus thuringiensis kurstaki*, delta endotoxina de *Bacillus thuringiensis*, baculovirus, bacteria entomopatogénica, virus entomopatogénico y hongo entomopatogénico.

9. La composición de la Reivindicación 8 en donde el al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional se selecciona del grupo que consiste en cipermetrina, cihalotrina, ciflutrina y beta-ciflutrina, esfenvalerato, fenvalerato, tralometrina, fenotiocarb, metomilo, oxamilo, tiodicarb, acetamiprid, clotianidina, imidacloprid, tiametoxam, tiacloprid, indoxacarb, espinosad, abamectina, avermectina, emamectina, endosulfano, etiprol, fipronilo, flufenoxurona, triflumurona, diofenolano, piriproxifeno, pimetozina, amitraz, *Bacillus thuringiensis* subsp. *Aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subsp. *Kurstaki*, delta-endotoxinas encapsuladas de *Bacillus thuringiensis*, virus entomopatogénico y hongos entomófagos.

10. 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 Reivindicación 1.

11. Un método para controlar una plaga de invertebrados que comprende poner en contacto la plaga de invertebrados o su entorno con una composición de la reivindicación 6.

12. 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 la reivindicación 1.

13. Una semilla tratada que comprende un compuesto de la reivindicación 1 en una cantidad de 0,0001 a 1% en peso de la semilla antes del tratamiento.

14. Una composición para proteger a un animal de una plaga parasitaria de invertebrados que comprende una cantidad parasiticidamente eficaz de un compuesto de la reivindicación 1 y al menos un vehículo.

15. Una cantidad parasiticidamente eficaz de un compuesto de la Reivindicación 1 para el uso en la protección de un animal de una plaga parasitaria de invertebrados.